

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第5937199号
(P5937199)

(45) 発行日 平成28年6月22日(2016.6.22)

(24) 登録日 平成28年5月20日(2016.5.20)

(51) Int. Cl.		F I	
C O 7 D 401/12	(2006.01)	C O 7 D 401/12	C S P
C O 7 D 403/12	(2006.01)	C O 7 D 403/12	
C O 7 D 403/14	(2006.01)	C O 7 D 403/14	
C O 7 D 405/14	(2006.01)	C O 7 D 405/14	
C O 7 D 401/14	(2006.01)	C O 7 D 401/14	

請求項の数 15 (全 65 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2014-505581 (P2014-505581)	(73) 特許権者	508020155 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロピア
(86) (22) 出願日	平成24年4月16日 (2012.4.16)		B A S F S E
(65) 公表番号	特表2014-517822 (P2014-517822A)		ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
(43) 公表日	平成26年7月24日 (2014.7.24)		D-67056 Ludwigshafen, Germany
(86) 国際出願番号	PCT/EP2012/056875	(74) 代理人	100091096 弁理士 平木 祐輔
(87) 国際公開番号	W02012/143317	(74) 代理人	100118773 弁理士 藤田 節
(87) 国際公開日	平成24年10月26日 (2012.10.26)	(74) 代理人	100122389 弁理士 新井 栄一
審査請求日	平成27年4月13日 (2015.4.13)		
(31) 優先権主張番号	61/477,620		
(32) 優先日	平成23年4月21日 (2011.4.21)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

最終頁に続く

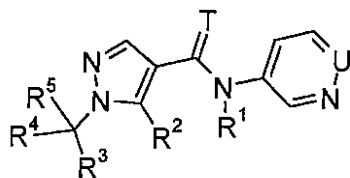
(54) 【発明の名称】 新規殺有害生物ピラゾール化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの新規ピラゾール化合物

【化1】



[式中、

UはN又はCHであり、

TはO又はSであり、

R¹は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、R²はCH₃又はハロメチルであり、R³はC₂-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、CN、NO₂、S(O)_nR^bであり、ここで、C原子は置換されていなくてもよく、又はR^aにより部分的に若しくは完全に置換されていてもよく、R^aはハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₂-ハロアルコキシ又はS(O)_nR^bであり、

10

20

nは0、1又は2であり、

R^bは水素、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₁-C₄-アルコキシであり、

R⁴はC₁-C₄-アルキル又はR³について記載した基であり、

R⁵はH又はR⁴について記載した基であり、

R³及びR⁴は、N-R^c、O及びSから選択される1又は2個のヘテロ原子を含有してもよい3~6員の炭素環又は複素環を一緒に形成してもよく、ここで、Sは酸化されていてもよく、該炭素環又は複素環はR^aにより置換されていてもよく、

R^cは水素、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又はC₁-C₂-アルコキシカルボニルである]

又はその立体異性体、塩、互変異性体若しくはN-オキシド。

【請求項2】

UがCHである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項3】

UがNである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項4】

TがOである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項5】

R¹がH、C₁-C₂-アルキル又はC₁-C₂-アルコキシメチルである請求項1~4のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

【請求項6】

R²がCH₃、CHF₂又はCF₃である請求項1~5のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

【請求項7】

R³がCN、C₂-C₆-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルであり、ここで、C原子が置換されていてもよい請求項1~6のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

【請求項8】

R⁴がC₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルであり、ここで、C原子が置換されていてもよい請求項1~7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

R⁵がH又はCH₃である請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

請求項1~9のいずれか1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種の不活性液体及び/又は固体担体を含む組成物。

【請求項11】

請求項1~9のいずれか1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種の不活性液体及び/又は固体の許容可能な担体、並びに所望の場合には、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組成物。

【請求項12】

無脊椎有害生物を駆除する又は防除するための方法であって、前記有害生物又はその食物供給、生息地若しくは繁殖地を、請求項1~9のいずれか1項に記載の少なくとも1種の化合物の殺有害生物有効量と接触させることを含む、前記方法(ただし、ヒトへの医療行為を除く)。

【請求項13】

成長している植物を無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から保護する方法であって、植物又は植物が成長している土壌若しくは水を請求項1~9のいずれか1項に記載の少なくとも1種の化合物の殺有害生物有効量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1項に記載の化合物又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩を種子100kg当たり0.1g~10kgの量で含む種子。

10

20

30

40

50

【請求項15】

無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から成長している植物を保護するための請求項1~9のいずれか1項に記載の化合物の使用。

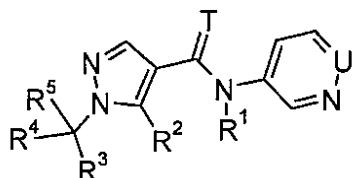
【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式Iの新規ピラゾール類

【化1】



10

【0002】

[式中、

UはN又はCHであり；

TはO又はSであり；

R¹は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；

R²はCH₃又はハロメチルであり；

R³はC₂-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、CN、NO₂、S(O)_nR^bであり、ここで、C原子は置換されていなくてもよく、又はR^aにより部分的に若しくは完全に置換されていてもよく；

R^aはハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₂-ハロアルコキシ又はS(O)_nR^bであり、

nは0、1又は2であり；

R^bは水素、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₁-C₄-アルコキシであり、

R⁴はC₁-C₄-アルキル又はR³について記載した基であり；

R⁵はH又はR⁴について記載した基であり；

R³及びR⁴は、N-R^c、O及びSから選択される1又は2個のヘテロ原子を含有してもよい3~6員の炭素環又は複素環を一緒に形成してもよく、ここで、Sは酸化されていてもよく、該炭素環又は複素環はR^aにより置換されていてもよく；

R^cは水素、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又はC₁-C₂-アルコキシカルボニルである]

並びにそれらの立体異性体、塩、互変異性体及びN-オキシドに関する。

【0003】

さらに、本発明は、式Iのピラゾールを調製するための方法及び中間体、並び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及び無脊椎有害生物を駆除するためのそれらの使用にも関する。さらに、本発明はかかる化合物を施用する方法にも関する。

【0004】

本発明のさらなる実施形態は、特許請求の範囲、明細書及び実施例から明らかである。本発明の主題の前記の及びさらに以下に例証される特徴は、本発明の範囲を離脱することなく、それぞれの特定の場合に示される組合せだけでなく、他の組合せにも適用され得ることが理解されるべきである。

【背景技術】

【0005】

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。

50

【 0 0 0 6 】

無脊椎有害生物、特に節足動物及び線虫は、成長している作物及び収穫された作物を破壊し、木造住居及び商業構造物を攻撃し、それによって食物供給及び不動産に対して大きな経済的損失を引き起こす。昆虫、蜘蛛類及び線虫などの無脊椎有害生物を駆除するための新たな薬剤が継続して必要である。

【 先行技術文献 】

【 特許文献 】

【 0 0 0 7 】

【 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

【 発明の概要 】

【 発明が解決しようとする課題 】

【 0 0 0 8 】

したがって、本発明の目的は、良好な殺有害生物活性を有し、多数の異なる無脊椎有害生物に対する、特に防除が困難な昆虫などの有害生物に対する広域活性スペクトルを示す化合物を提供することである。

【 課題を解決するための手段 】

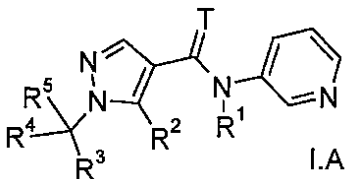
【 0 0 0 9 】

これらの目的は、冒頭に記載した式Iの化合物により、及び、それらの立体異性体、塩、互変異性体及びN-オキシド、特にそれらの農業的に許容可能な塩により達成することができる。

【 0 0 1 0 】

本発明の1つの実施形態は、式Iの化合物(式中、UはCHである)に関する。これらの化合物は式I.Aに対応する。

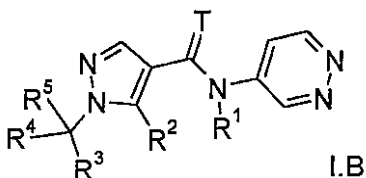
【 化 2 】



【 0 0 1 1 】

本発明の別の実施形態は式Iの化合物(式中、UはNである)に関する。これらの化合物は式I.Bに対応する。

【 化 3 】



【 0 0 1 2 】

本発明による化合物は、有機化学の標準的方法によって、例えば以下の合成ルートによって、WO 2009/027393及びWO 2010/034737に記載される合成ルートと同様に調製することができる。

【 0 0 1 3 】

TがOである式Iの化合物(式I.1)は、例えば、活性化されたピラゾールカルボン酸誘導体II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.

10

20

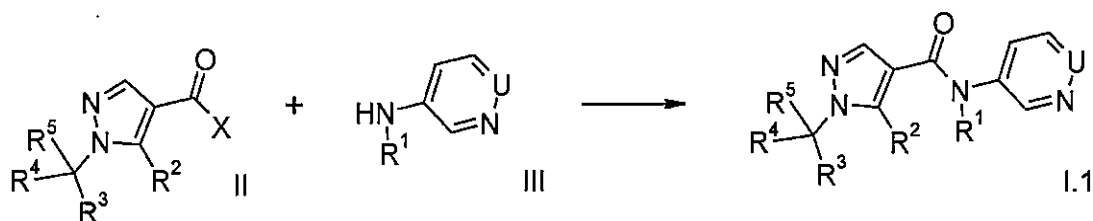
30

40

50

941-1045)。

【化4】



【0014】

活性化されたピラゾールカルボン酸誘導体IIは、好ましくは、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-イルエステルである。

10

【0015】

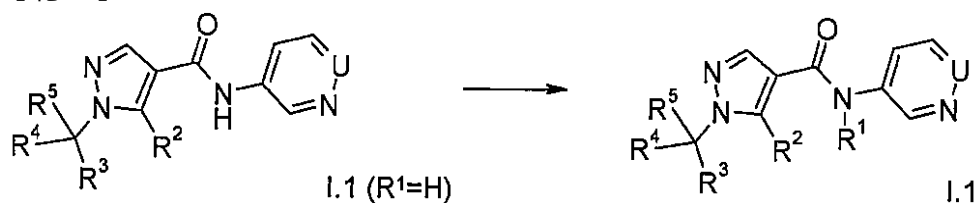
式II及びIIIにおいて、基は、式Iについて前記の意味、特に、好ましいと記載された意味を有し、Xは、ハロゲン、N₃、p-ニトロフェノキシ又はペンタフルオロフェノキシなどの適切な脱離基である。

【0016】

R¹が水素ではない式I.1の化合物は、また、塩基の存在下で適切なアルキル化剤を用いるアミドI.1(式中、R¹は水素である)のアルキル化によって調製することができる。このアルキル化は、文献から公知の標準の条件下で行うことができる。

20

【化5】

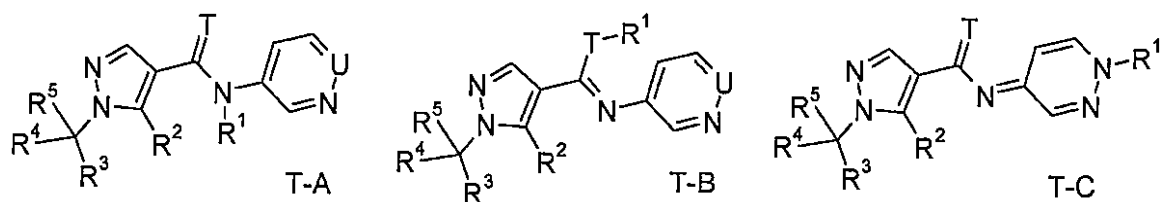


【0017】

式Iの化合物は2つの異性体の形態で存在することができ、式I.Bの化合物は3つの異性体の形態で存在することができるので、式Iは、互変異性体T-A及びT-Bの両方を包含し、式I.BはさらにT-Cも包含する：

30

【化6】



【0018】

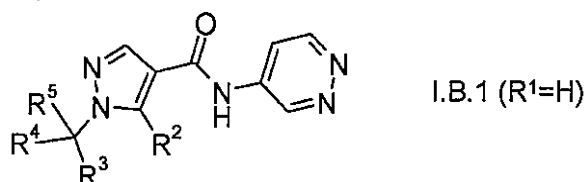
明確にするために、本明細書を通して異性体T-Aを指すが、その記載は他の異性体の開示も同様に包含する。

40

【0019】

異性体T-Cは、化合物I.B.1(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。この反応は、公知のピリダジンのN-アルキル化と同様に行うことができる。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)に見出すことができる。

【化7】



【0020】

TがSである式Iの化合物(式I.2)は、例えば、Synthesis 2003、p.1929に記載されている方法に従って、式I.1の化合物を2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン-2,4-ジスルフィド又はPS₅と反応させることによって得ることができる。

10

【0021】

化合物II及びIIIは、当該分野で知られており、市販されているか、又は文献から公知の方法(WO 05/040169;WO 08/074824;Journal of Fluorine chemistry 132(11)、p.995(2011)参照)によって調製することができる。

【0022】

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の方法に従う化合物Iの酸化により、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。

【0023】

個々の化合物が前記のルートで調製できない場合、他の化合物Iの誘導体化により、又は前記の合成ルートの通常の変更により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。

20

【0024】

反応混合物は、通常の方式で、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、クロマトグラフィーによって、例えばアルミナ上又はシリカゲル上で粗生成物を精製することによって後処理される。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、減圧下及び穏やかな昇温で揮発性成分から除去又は精製される。中間体及び最終生成物が固体として得られるならば、それらは、再結晶化又は倍散によって精製することができる。

30

【0025】

「本発明による化合物」又は「式Iの化合物」の語は、本明細書に定義される化合物及びそれらの立体異性体、塩、互変異性体又はN-オキシドを含む。「本発明の化合物」の語は「本発明による化合物」と同等であるとして理解され、従って、同様にそれらの立体異性体、塩、互変異性体又はN-オキシドを含む。

式Iの主鎖に結合する基は1以上のキラル中心を有し得る。この場合、式Iは、その置換基によって、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、単独のエナンチオマー又は純粋なジアステレオマー及びそれらの混合物に関する。

【0026】

式Iの化合物は、非結晶であってよいが、又は安定性などの異なる巨視的特性を有することができる、又は活性などの異なる生物学的特性を示すことができる1種以上の異なる結晶状態(多形体)で存在してよい。本発明は、非結晶及び結晶性の式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、並びにそれらの非結晶塩又は結晶塩に関する。

40

【0027】

式Iの化合物の塩は、好ましくは農業的に許容可能な塩である。それらは、通常の方法において、例えば、式Iの化合物が塩基性官能基を有するならば、該化合物を当該アニオンの酸と反応させることによって形成することができる。

【0028】

式Iの化合物の農業的に有用な塩は、特に、カチオン及びアニオンがそれぞれ式Iの化合

50

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。

有用な酸付加塩のアニオンは、主に塩化物、臭化物、フッ化物、硫酸水素塩、硫酸塩、リン酸二水素塩、リン酸水素塩、リン酸塩、硝酸塩、重炭酸塩、炭酸塩、ヘキサフルオロケイ酸塩、ヘキサフルオロリン酸塩、安息香酸塩、及び C_1 - C_4 -アルカン酸のアニオン、好ましくはギ酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩及び酪酸塩である。それらは、式Iの化合物と、対応するアニオンの酸、好ましくは塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸又は硝酸とを反応させることによって形成することができる。

「N-オキシド」という語には、N-オキシド部分へと酸化される少なくとも1つの第三級窒素原子を有する式Iの化合物が含まれる。

【0029】

可変基の前記定義に記述されている有機部分は、ハロゲンという語のように、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、いずれの場合にも、該基の炭素原子の可能な数を指し示す。

【0030】

「ハロゲン」という語は、いずれの場合にも、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。

【0031】

本明細書において、並びにアルコキシ、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キシアルキルのアルキル部分において使用される「アルキル」という語は、いずれの場合にも、通常1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子、及び特に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。

【0032】

本明細書において、並びにハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルカルボニル、ハロアルキルスルホニル及びハロアルキルスルフィニルのハロアルキル部分で使用される「ハロアルキル」という語は、いずれの場合にも、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1~6個の炭素原子、しばしば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_2 -ハロアルキルから、特にフルオロメチル、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及びペンタフルオロエチルなどの C_1 - C_2 -フルオロアルキルから選択される。

【0033】

本明細書において使用される「アルコキシ」という語は、いずれの場合にも、酸素原子を介して結合している、通常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-ブチルオキシ及びtert-ブチルオキシなどである。

【0034】

本明細書において、並びに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「シクロアルキル」という語は、いずれの場合にも、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など、通常3~6個の炭素原子を有する単環式脂環式基を示す。

【0035】

10

20

30

40

50

本明細書において使用される「アルケニル」という語は、いずれの場合にも、通常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-イル及び2-エチルプロパ-2-エン-1-イルなどを示す。

【0036】

本明細書において使用される「アルキニル」という語は、通常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-イル、4-ペンチン-1-イル、1-メチルブタ-2-イン-1-イル及び1-エチルプロパ-2-イン-1-イルなどを指す。

10

【0037】

本明細書において使用される「アルコキシアルキル」という語は、1個の炭素原子が前記で定義されている通常1又は2個の炭素原子を含むアルコキシ基を有する、通常1~2個の炭素原子を含むアルキルを指す。例は、 CH_2OCH_3 、 $\text{CH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$ 、n-プロポキシメチル、 $\text{CH}_2\text{-OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、2-(メトキシ)エチル及び2-(エトキシ)エチルである。

【0038】

「ヘテロシクリル」という語には、一般に5員又は6員、特に6員の単環式非芳香族複素環基が含まれる。非芳香族複素環基は、通常、環員としてN、O及びSから選択される1個、2個又は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 SO_2 として存在することができる。

20

【0039】

5員又は6員の複素環基の例は、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-オキソチエタニル)、チエタニル-S-ジオキシド(S-ジオキソチエタニル)、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-ジオキサラニル、チオラニル、S-オキソチオラニル、S-ジオキソチオラニル、ジヒドロチエニル、S-オキソジヒドロチエニル、S-ジオキソジヒドロチエニル、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、ピペリジニル、ピペラジニル、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-オキソチオピラニル、S-ジオキソチオピラニル、ジヒドロチオピラニル、S-オキソジヒドロチオピラニル、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-オキソ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-オキソチオモルホリニル、S-ジオキソチオモルホリニル及びチアジニルなどの飽和又は不飽和の非芳香族複素環を含む。環員として1個又は2個のカルボニル基も含む複素環の例は、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-オニル及びチアゾリジン-2-オニルなどを含む。

30

【0040】

可変基について、特に好ましい中間体の実施形態は式Iの群のものに対応する。

40

【0041】

特定の実施形態において、式Iの化合物の可変基は下記の意味を有し、これらの意味は、そのままでも、互いに組み合わせても式Iの化合物の特定の実施形態である：

式Iの化合物の1つの好ましい実施形態において、UはCHである。これらの化合物は式I.Aに対応する。

【0042】

式Iの化合物の別の実施形態において、UはNである。これらの化合物は式I.B.に対応する。

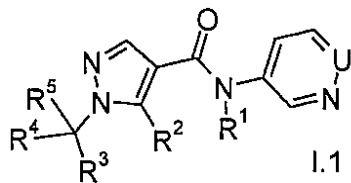
【0043】

式Iの第1の好ましい実施形態において、TはOである。これらの化合物は式I.1.に対応す

50

る。

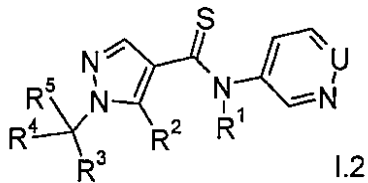
【化 8】



【 0 0 4 4 】

式1の別の実施形態において、TはSである。これらの化合物は式1.2に対応する。

【化 9】



【 0 0 4 5 】

第1の実施形態において、R¹はHである。

【 0 0 4 6 】

別の実施形態において、R¹はC₁-C₂-アルキルであり、好ましくはCH₃である。

【 0 0 4 7 】

別の実施形態において、R¹はCH₂CH₃である。

【 0 0 4 8 】

別の実施形態において、R¹はC₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキルであり、好ましくはC₁-C₂-アルコキシ-メチルであり、特にCH₂OCH₃である。

【 0 0 4 9 】

第1の実施形態において、R²はCH₃である。

【 0 0 5 0 】

別の実施形態において、R²はハロメチルであり、好ましくはフルオロメチルであり、特にCHF₂又はCF₃である。

【 0 0 5 1 】

第1の好ましい実施形態において、R³はC₂-C₆-アルキルであり、好ましくはC₂-C₄-アルキルであり、特にCH₂CH₃又はC(CH₃)₃である。

【 0 0 5 2 】

別の好ましい実施形態において、R³はC₁-C₆-ハロアルキルであり、好ましくはC₁-C₂-アルキルであり、より好ましくはハロメチルであり、例えばCHF₂又はCF₃であり、特にCF₃である。

【 0 0 5 3 】

別の好ましい実施形態において、R³はC₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキルであり、好ましくはC₁-C₂-アルコキシ-メチルであり、特にCH₂OCH₃である。

【 0 0 5 4 】

別の好ましい実施形態において、R³はC₃-C₆-シクロアルキルであり、好ましくはシクロプロピルであり、これらは置換されていないか、又は好ましくはハロゲン若しくはシアノにより置換されている。好ましくは1-又は2,2-位で置換されている。

【 0 0 5 5 】

第1の好ましい実施形態において、R⁴はC₁-C₄-アルキルであり、好ましくはC₁-C₂-アルキルであり、特にCH₃である。

【 0 0 5 6 】

別の好ましい実施形態において、R⁴はC₁-C₆-ハロアルキルであり、好ましくはC₁-C₂-アルキルであり、特にCF₃などのハロメチルである。

【 0 0 5 7 】

10

20

30

40

50

別の実施形態において、 R^4 は C_3 - C_6 -シクロアルキルであり、好ましくはシクロプロピルであり、それらは、好ましくは、ハロゲン又はシアノにより置換されていてもよい。好ましくは1-又は2,2-位で置換されている。

【0058】

第1の好ましい実施形態において、 R^5 は水素である。

【0059】

別の好ましい実施形態において、 R^5 はCN又は NO_2 であり、好ましくはCNである。

【0060】

別の好ましい実施形態において、 R^5 は C_1 - C_4 -アルキルであり、好ましくは C_1 - C_2 -アルキルであり、特に CH_3 である。

【0061】

別の好ましい実施形態において、 R^3 及び R^4 は、シクロペンチル又はシクロヘキシルなどの5員又は6員飽和炭素環を形成し、該環は置換されていないか、又は1個以上の基 R^a により置換されている。かかる R^a 基は、好ましくはハロゲン、シアノ又はハロメチルである。

【0062】

別の実施形態において、 R^3 及び R^4 は、N- R^c 、O、及びS(Sは酸化されていてもよい)から選択される1又は2個、好ましくは1個のヘテロ原子を含有する5員又は6員飽和複素環を形成し、該環は置換されていないか、又は1個以上の基 R^d により置換されている。

【0063】

R^c は、好ましくは C_1 - C_2 -アルキルを示し、特に CH_3 又は C_1 - C_2 -アルキルカルボニルを示し、特にアセチルを示す。

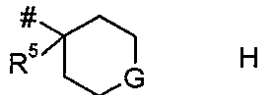
【0064】

該複素環は、好ましくは置換されていない。

【0065】

1つの実施形態において、 R^3 及び R^4 により形成される複素環は基Hを示す：

【化10】



【0066】

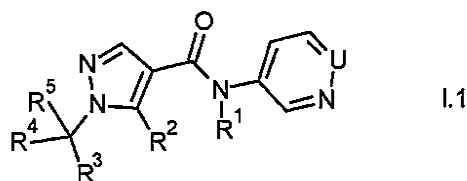
(式中、GはN- R^c 、O、S、S(=O)又は SO_2 を示し、#はピラゾール部分への結合を示す)。

別の実施形態は、TがOであり、 R^1 がH、 C_1 - C_2 -アルキル又は CH_2OCH_3 であり、 R^2 が CH_3 、 CHF_2 又は CF_3 であり、 R^3 が CF_3 又はシクロプロピルであり、 R^4 が CH_3 であり、 R^5 がHであるラセミ化合物を除いた式Iの化合物に関する。

【0067】

特に、それらの使用について、以下の表にまとめられている式Iの化合物が好ましく、該化合物は式I.1に対応する。表中の置換基について記載した基は、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。

【化11】



【0068】

表1

UがCHであり、 R^1 がHであり、 R^2 が CH_3 であり、化合物についての R^3 、 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

表2

表19

UがCHであり、R¹がCH₂OCH₃であり、R²がCH₃であり、化合物についてのR³、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

表20

UがNであり、R¹がCH₂OCH₃であり、R²がCH₃であり、化合物についてのR³、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

表21

UがCHであり、R¹がCH₂OCH₃であり、R²がCHF₂であり、化合物についてのR³、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

表22

UがNであり、R¹がCH₂OCH₃であり、R²がCHF₂であり、化合物についてのR³、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

表23

UがCHであり、R¹がCH₂OCH₃であり、R²がCF₃であり、化合物についてのR³、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

表24

UがNであり、R¹がCH₂OCH₃であり、R²がCF₃であり、化合物についてのR³、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

表25

UがCHであり、R¹がCH₂OCH₂CH₃であり、R²がCH₃であり、化合物についてのR³、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

表26

UがNであり、R¹がCH₂OCH₂CH₃であり、R²がCH₃であり、化合物についてのR³、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

表27

UがCHであり、R¹がCH₂OCH₂CH₃であり、R²がCHF₂であり、化合物についてのR³、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

表28

UがNであり、R¹がCH₂OCH₂CH₃であり、R²がCHF₂であり、化合物についてのR³、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

表29

UがCHであり、R¹がCH₂OCH₂CH₃であり、R²がCF₃であり、化合物についてのR³、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

表30

UがNであり、R¹がCH₂OCH₂CH₃であり、R²がCF₃であり、化合物についてのR³、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

【表1】

No.	R ³	R ⁴	R ⁵	No.	R ³	R ⁴	R ⁵
A-1	CN	CH ₃	H	A-7	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H
A-2	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	A-8	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H
A-3	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	A-9	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H
A-4	CHF ₂	CH ₃	H	A-10	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H
A-5	CF ₃	CH ₃	H	A-11	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H
A-6	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	A-12	c-C ₄ H ₇	CH ₃	H

10

20

30

40

No.	R ³	R ⁴	R ⁵	No.	R ³	R ⁴	R ⁵
A-13	c-C ₅ H ₉	CH ₃	H	A-53	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃
A-14	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	H	A-54	C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃
A-15	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	H	A-55	CHF ₂	CH ₃	CH ₃
A-16	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	H	A-56	CF ₃	CH ₃	CH ₃
A-17	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	H	A-57	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃
A-18	CN	CH ₂ CH ₃	H	A-58	c-C ₃ H ₅	CH ₃	CH ₃
A-19	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-59	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CH ₃
A-20	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-60	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CH ₃
A-21	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	H	A-61	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CH ₃
A-22	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-62	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CH ₃
A-23	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-63	c-C ₄ H ₇	CH ₃	CH ₃
A-24	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	H	A-64	c-C ₅ H ₉	CH ₃	CH ₃
A-25	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	H	A-65	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	CH ₃
A-26	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	H	A-66	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CH ₃
A-27	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-67	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CH ₃
A-28	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-68	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CH ₃
A-29	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	H	A-69	CN	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-30	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	H	A-70	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-31	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	H	A-71	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-32	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	H	A-72	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-33	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	H	A-73	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-34	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	H	A-74	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-35	CN	CF ₃	H	A-75	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-36	CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	A-76	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-37	C(CH ₃) ₃	CF ₃	H	A-77	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-38	CHF ₂	CF ₃	H	A-78	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-39	CF ₃	CF ₃	H	A-79	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-40	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	A-80	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-41	c-C ₃ H ₅	CF ₃	H	A-81	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-42	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	H	A-82	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-43	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	H	A-83	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-44	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	H	A-84	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-45	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	H	A-85	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-46	c-C ₄ H ₇	CF ₃	H	A-86	CN	CF ₃	CH ₃
A-47	c-C ₅ H ₉	CF ₃	H	A-87	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃
A-48	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	H	A-88	C(CH ₃) ₃	CF ₃	CH ₃
A-49	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	H	A-89	CHF ₂	CF ₃	CH ₃
A-50	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	H	A-90	CF ₃	CF ₃	CH ₃
A-51	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	H	A-91	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CH ₃
A-52	CN	CH ₃	CH ₃	A-92	c-C ₃ H ₅	CF ₃	CH ₃

10

20

30

40

No.	R ³	R ⁴	R ⁵	No.	R ³	R ⁴	R ⁵
A-93	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CH ₃	A-133	C(CH ₃) ₃	CH ₃	CN
A-94	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CH ₃	A-134	CHF ₂	CH ₃	CN
A-95	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CH ₃	A-135	CF ₃	CH ₃	CN
A-96	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CH ₃	A-136	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CN
A-97	c-C ₄ H ₇	CF ₃	CH ₃	A-137	c-C ₃ H ₅	CH ₃	CN
A-98	c-C ₅ H ₉	CF ₃	CH ₃	A-138	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CN
A-99	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	CH ₃	A-139	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	CN
A-100	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CH ₃	A-140	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CN
A-101	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CH ₃	A-141	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	CN
A-102	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CH ₃	A-142	c-C ₄ H ₇	CH ₃	CN
A-103	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-143	c-C ₅ H ₉	CH ₃	CN
A-104	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-144	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	CN
A-105	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-145	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CN
A-106	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-146	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CN
A-107	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-147	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	CN
A-108	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-148	CN	CH ₂ CH ₃	CN
A-109	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-149	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-110	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-150	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-111	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-151	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	CN
A-112	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-152	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-113	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CF ₃	A-153	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-114	CN	CF ₃	CF ₃	A-154	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CH ₃	CN
A-115	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CF ₃	A-155	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CN
A-116	C(CH ₃) ₃	CF ₃	CF ₃	A-156	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₂ CH ₃	CN
A-117	CHF ₂	CF ₃	CF ₃	A-157	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-118	CF ₃	CF ₃	CF ₃	A-158	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₂ CH ₃	CN
A-119	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CF ₃	A-159	c-C ₄ H ₇	CH ₂ CH ₃	CN
A-120	c-C ₃ H ₅	CF ₃	CF ₃	A-160	c-C ₅ H ₉	CH ₂ CH ₃	CN
A-121	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CF ₃	A-161	c-C ₆ H ₁₁	CH ₂ CH ₃	CN
A-122	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CF ₃	A-162	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CN
A-123	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CF ₃	A-163	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CN
A-124	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CF ₃	A-164	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CH ₂ CH ₃	CN
A-125	c-C ₄ H ₇	CF ₃	CF ₃	A-165	CN	CF ₃	CN
A-126	c-C ₅ H ₉	CF ₃	CF ₃	A-166	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CN
A-127	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	CF ₃	A-167	C(CH ₃) ₃	CF ₃	CN
A-128	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CF ₃	A-168	CHF ₂	CF ₃	CN
A-129	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CF ₃	A-169	CF ₃	CF ₃	CN
A-130	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CF ₃	A-170	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CN
A-131	CN	CH ₃	CN	A-171	c-C ₃ H ₅	CF ₃	CN
A-132	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	A-172	1-F-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CN

10

20

30

40

No.	R ³	R ⁴	R ⁵	No.	R ³	R ⁴	R ⁵
A-173	1-CN-c-C ₃ H ₄	CF ₃	CN	A-192	-CH ₂ CF ₂ -		CF ₃
A-174	2,2-F ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CN	A-193	-CH ₂ CCl ₂ -		CF ₃
A-175	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CF ₃	CN	A-194	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -		CF ₃
A-176	c-C ₄ H ₇	CF ₃	CN	A-195	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		CF ₃
A-177	c-C ₅ H ₉	CF ₃	CN	A-196	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-178	c-C ₆ H ₁₁	CF ₃	CN	A-197	-CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-179	1-CN-c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CN	A-198	-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-180	1-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CN	A-199	-CH ₂ CH ₂ N(COCH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CF ₃
A-181	1-CF ₃ -c-C ₆ H ₁₀	CF ₃	CN	A-200	-CH ₂ CH ₂ -		CN
A-182			H	A-201	-CH ₂ CF ₂ -		CN
A-183			H	A-202	-CH ₂ CCl ₂ -		CN
A-184			H	A-203	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -		CN
A-185			H	A-204	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		CN
A-186			H	A-205	-CH ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ CH ₂ -		CN
A-187			H	A-206	-CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ -		CN
A-188			H	A-207	-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -		CN
A-189			H	A-208	-CH ₂ CH ₂ N(COCH ₃)CH ₂ CH ₂ -		CN
A-190			H				
A-191			CF ₃				

【 0 0 6 9 】

その優れた活性により、本発明の化合物は無脊椎有害生物を防除するために用いることができる。

【 0 0 7 0 】

したがって、本発明は、さらに、有害生物、その食物供給、その生息地若しくはその繁殖地、又は有害生物が成長している若しくは成長し得る栽培植物、植物繁殖材料(種子など)、土壌、領域、材料若しくは環境、又は有害生物の攻撃若しくは寄生から保護される材料、栽培植物、植物繁殖材料(種子など)、土壌、表面若しくは空間を、前記の本発明の化合物又は組成物の殺有害生物有効量で処理することを含む、無脊椎有害生物を防除する方法も提供する。

【 0 0 7 1 】

本発明は、さらに、植物、植物が成長している若しくは成長し得る土壌又は水を、本発明による少なくとも1種の化合物(その立体異性体、塩、互変異性体若しくはN-オキsidを含む)又は本発明による組成物の殺有害生物有効量と接触させることを含む、無脊椎有害生物、好ましくは昆虫の群の無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から成長している植物を保護する方法にも関する。

【 0 0 7 2 】

好ましくは、本発明の方法は、植物繁殖材料(種子など)及び該植物繁殖材料から成長する植物を無脊椎有害生物の攻撃又は寄生から保護するのに役立つ、植物繁殖材料(種子など)を、前記の本発明の化合物の殺有害生物有効量又は前記及び下記に定義される農業組成物の殺有害生物有効量で処理することを含む。本発明の方法は、本発明に従って処理された「物質」(植物、植物繁殖材料、土壌材料など)の保護に限定されず、例えば、処理された植物繁殖材料(種子など)から成長するが、植物それ自体は処理されていない植物に対する保護による、予防的効果も有する。

【 0 0 7 3 】

本発明において、「無脊椎有害生物」は、好ましくは節足動物及び線虫から、より好ましくは害虫、蜘蛛類及び線虫から、いっそう好ましくは昆虫、コナダニ及び線虫から選択される。本発明において、「無脊椎有害生物」は、最も好ましくは昆虫である。

【 0 0 7 4 】

本発明の化合物(それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含む)は、特に、蜘蛛類、ヤスデ類及び昆虫などの節足有害生物並びに線虫、特に昆虫を効果的に防除するのに適切である。それらは以下の有害生物を効果的に駆除又は防除するのに特に適切である：

鱗翅目(Lepidoptera)に由来する昆虫、例えば、アグロティス・イプシロン(*Agrotis ypsilon*)、アグロティス・セゲタム(*Agrotis segetum*)、アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillacea*)、アンチカルシア・ゲマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、アルギレスチア・コンジュゲラ(*Argyresthia conjugella*)、オートグラファ・ガンマ(*Autographa gamma*)、ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、カコエキア・ムリナナ(*Cacoecia murinana*)、カプア・レチキュラナ(*Capua reticulana*)、ケイマトピア・ブルマタ(*Cheimatobia brumata*)、コリストネウラ・フミフェラナ(*Choristoneura fumiferana*)、コリストネウラ・オシデンタリス(*Choristoneura occidentalis*)、キルフィス・ユニバンクタ(*Cirphis unipuncta*)、シディア・ポモネラ(*Cydia pomonella*)、デンドロリマス・ピニ(*Dendrolimus pini*)、ジアファニア・ニチダリス(*Diaphania nitidalis*)、ジストラエア・グランジオセラ(*Diatraea grandiosella*)、エアリアス・インストラナ(*Earias insulana*)、エラスモバルパス・リグノセラス(*Elasmopalpus lignosellus*)、エウポエキリア・アンビゲラ(*Eupoecilia ambiguella*)、エベトリア・ボーリアナ(*Evetria bouliana*)、フェルチア・サブテラネア(*Feltia subterranea*)、ガレリア・メロネラ(*Galleria mellonella*)、グラホリタ・フネブラナ(*Grapholitha funebrana*)、グラホリタ・モレストタ(*Grapholitha molesta*)、ヘリオチス・アルミゲラ(*Heliothis armigera*)、ヘリオチス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)、ヘリオチス・ゼア(*Heliothis zea*)、ヘルラ・ウンダリス(*Hellula undalis*)、ヒベルニア・デフォリアリア(*Hibernia defoliaria*)、ヒファントリア・クネア(*Hyphantria cunea*)、ヒポノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコベルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、ラムジナ・フィスセラリア(*Lambdina fiscellaria*)、ラフィグマ・エキシグア(*Laphygma exigua*)、ロイコプテラ・コフェーラ(*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、リトコレティス・ブランカルデルラ(*Lithocolletis blancardella*)、ロベシア・ボトラナ(*Lobesia botrana*)、ロキソステジ・スティクティカリス(*Loxostege sticticalis*)、リマントリア・ジスパー(*Lymantaria dispar*)、リマントリア・モナカ(*Lymantria monacha*)、リオネチア・クレルケラ(*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ニューストリア(*Malacosoma neustria*)、マメストラ・ブラシカエ(*Mamestra brassicae*)、オルギア・シュードツガタ(*Orgyia pseudotsugata*)、オストリニア・ヌビラリス(*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フラメア(*Panolis flammea*)、ペクチノフォラ・ゴシピエラ(*Pectinophora gossypiella*)、ペリドロマ・サウキア(*Pelidroma saucia*)、ファレラ・ブセファラ(*Phalera bucephala*)、フトリマエア・オペルクレラ(*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスティス・キトレラ(*Phyllocnistis citrella*)、ピエリス・ブラシカエ(*Pieris brassicae*)、ブラチペナ・スカブラ(*Plathypena scabra*)、プルテラ・キシロステラ(*Plutella xylostella*)、シュードブルシア・インクルデンス(*Pseudoplusia includens*)、リアキオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、スクロビバルプラ・アブソルタ(*Scrobipalpus absoluta*)、シトトラガ・セラレラ(*Sitotroga cerealella*)、スパルガノティス・ピレリアナ(*Sparganothis pilleriana*)、スポドプテラ・フルギベルダ(*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・リトラリス(*Spodoptera littoralis*)、スポドプテラ・リツラ(*Spodoptera litura*)、タウマトポエア・ピチオカンパ(*Thaumatopoea pityocampa*)、トルトリックス・ビリダナ(*Tortrix viridana*)、トリコプルシアニ(*Trichoplusiani*)及びゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)；

甲虫(甲虫目(Coleoptera))、例えば、アグリルス・シヌアツス(*Agrilus sinuatus*)、アグリオテス・リネアツス(*Agriotes lineatus*)、アグリオテス・オブスクルス(*Agriotes obscurus*)、アンヒマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスパー(*Anisandrus dispar*)、アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*)、アントノムス・ポモルム(*Anthonomus pomorum*)、アフトナ・ユーホリダエ(*Aphthona euphor*

idae)、アトウス・ハエモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、ブラストファグス・ピニペルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダータ(*Blitophaga undata*)、ブルクス・ルフィマヌス(*Bruchus rufimanus*)、ブルクス・ピソルム(*Bruchus pisorum*)、ブルクス・レンチス(*Bruchus lentis*)、ビクチスクス・ベツラエ(*Byctiscus betulae*)、カシダ・ネブロサ(*Cassida nebulosa*)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、セトニア・アウラタ(*Cetonia aurata*)、ソートリンクス・アシミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ソートリンクス・ナピ(*Ceuthorrhynchus napi*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、コノデルス・ベスペルチヌス(*Conoderus vespertinus*)、クリオセリス・アスパラギ(*Crioceris asparagi*)、クテニセラ属の種(*Ctenicera* spp.)、ジアブロチカ・ロンギコルニス(*Diabrotica longicornis*)、ジアブロチカ・セミプンクタタ(*Diabrotica semipunctata*)、ジアブロチカ・12-プンクタタ(*Diabrotica 12-punctata*)、ジアブロチカ・スペキオサ(*Diabrotica speciosa*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ(*Diabrotica virgifera*)、エピラクナ・バリベスチス(*Epilachna varivestis*)、エピトリックス・ヒルチペニス(*Epitrix hirtipennis*)、エウチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、ヒロビウス・アビエチス(*Hylobius abietis*)、ヒペラ・ブルネイペニス(*Hypera brunneipennis*)、ヒペラ・ポストカ(*Hypera postica*)、イプス・チポグラフィ(*Ips typographus*)、レマ・ビリネアタ(*Lema bilineata*)、レマ・メラノプス(*Lema melanopus*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リモニウス・カリフォルニクス(*Limonius californicus*)、リソロプトルス・オリゾフィルス(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、メラノツス・コムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、メロロンタ・ヒポカスタニ(*Melolontha hippocastani*)、メロロンタ・メロロンタ(*Melolontha melolontha*)、オウレマ・オリザエ(*Oulema oryzae*)、オチオリンクス・スルカツス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オバツス(*Otiorrhynchus ovatus*)、ファエドン・コクレアリアエ(*Phaedon cochleariae*)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロトレタ・クリソセファラ(*Phyllotreta chrysocephala*)、フィロファガ属の種(*Phyllophaga* spp.)、フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、フィロトレタ・ネモルム(*Phyllotreta nemorum*)、フィロトレタ・ストリオラタ(*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャボニカ(*Popillia japonica*)、シトナ・リネアツス(*Sitona lineatus*)及びシトフィルス・グラナリア(*Sitophilus granaria*) ;

ハエ、蚊(双翅目(Diptera))、例えば、アエデス・アエギプチ(*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス(*Aedes albopictus*)、アエデス・ベキサンス(*Aedes vexans*)、アナストレファ・ルデンス(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリベニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルキアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレエボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・レウコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、アノフェレス・ミニムス(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラトス(*Anopheles quadrimaculatus*)、カリホラ・ビシナ(*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*)、クリソミア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラックス(*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*)、コクリオミア・ホミニボラキス(*Cochliomyia hominivorax*)、コンタリニア・ソルギコラ(*Contarinia sorghicola*)、コルジロピア・アントロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、クレクス・ピピエンス(*Culex pipiens*)、クレクス・ニグリパルプス(*Culex nigripalpus*)、クレクス・クインクエファスキアトス(*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*)、ダクス・ククルビタエ(*Dacus cucurbitae*)、ダクス・オレアエ(*Dacus oleae*)、ダシネウラ・ブラシカエ(*Dasineura brassicae*)、デリア・アンティーク(*Delia antique*)、デリア・コアルクタタ(*De*

lia coarctata)、デリア・プラツラ(*Delia platura*)、デリア・ラジクム(*Delia radicum*)、テルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、ファニア・カニクラリス(*Fannia canicularis*)、ゲオミザ・トリブクタタ(*Geomyza Tripunctata*)、ガステロフィルス・インテスチナリス(*Gasterophilus intestinalis*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロシナ・フシペス(*Glossina fuscipes*)、グロシナ・タキノイデス(*Glossina tachinoides*)、ハエマトビア・イリタンス(*Hematobia 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・プラツラ(*Hylemyia platura*)、ヒポデルマ・リネアタ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノプス・トレンス(*Leptoconops torrens*)、リリオミザ・サチバエ(*Liriomyza sativae*)、リリオミザ・トリフォリイ(*Liriomyza trifolii*)、ルキリア・カプリナ(*Lucilia caprina*)、ルキリア・クプリナ(*Lucilia cuprina*)、ルキリア・セリカタ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・チチラヌス(*Mansonia titillanus*)、マイエチオラ・デストルクトル(*Mayetiola destructor*)、ムスカ・オータムナリス(*Musca autumnalis*)、ムスカ・ドメスチカ(*Musca domestica*)、ムシナ・スタブランズ(*Muscina stabulans*)、オエストルス・オビス(*Oestrus ovis*)、オポミザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒソキアミ(*Pegomya hysocyami*)、フォルビア・アンチクア(*Phorbia antiqua*)、フォルビア・ブラシカエ(*Phorbia brassicae*)、フォルビア・コアルクタタ(*Phorbia coarctata*)、フレボトムス・アルゲンチペス(*Phlebotomus argentipes*)、プソロフォラ・コロンビアエ(*Psorophora columbiae*)、プシラ・ロサエ(*Psila rosae*)、プソロフォラ・ジスコロル(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimulium mixtum*)、ラゴレチス・セラシ(*Rhagoletis cerasi*)、ラゴレチス・ボモネラ(*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ・ハエモロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* spp.)、シムリウム・ビッタツム(*Simulium vittatum*)、ストモキシス・カルキトランス(*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス・ボビヌス(*Tabanus bovinus*)、タバヌス・アトラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)及びタバナス・シミリス(*Tabanus similis*)、チブラ・オレラセア(*Tipula oleracea*)及びチブラ・パルドサ(*Tipula paludosa*);

アザミウマ(総翅目(*Thysanoptera*))、例えば、ジクロモトリプス・コルベッティ(*Dichromothrips corbetti*)、ジクロモトリプス属の種(*Dichromothrips* spp.)、フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・トリチキ(*Frankliniella tritici*)、シルトリプス・キトリ(*Scirtothrips citri*)、トリプス・オリザエ(*Thrips oryzae*)、トリプス・パルミ(*Thrips palmi*)及びトリプス・タバキ(*Thrips tabaci*);

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

ゴキブリ(ゴキブリ目(*Blattaria-Blattodea*))、例えば、ブラテラ・ゲルマニカ(*Blattella germanica*)、ブラテラ・アサヒナエ(*Blattella asahinae*)、ペリプラネタ・アメリカーナ(*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・ジャポニカ(*Periplaneta japonica*)、ペリプラネタ・ブルネア(*Periplaneta brunnea*)、ペリプラネタ・フリギノサ(*Periplaneta fuliginosa*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ(*Periplaneta australasiae*)、及びブラッタ・オリエンタリス(*Blatta orientalis*);

ナンキンムシ、アブラムシ、ヨコバイ、コナジラミ、カイガラムシ、セミ(半翅目(*Hemiptera*))、例えば、アクロステルヌム・ヒラレ(*Acrosternum hilare*)、プリサス・ロイコブ

10

20

30

40

50

テルス(*Blissus leucopterus*)、シルトペルチス・ノタツス(*Cyrtopeltis notatus*)、デイスデルクス・キングラツス(*Dysdercus cingulatus*)、デイスデルクス・インテルメジウス(*Dysdercus intermedius*)、エウリガステル・インテグリセプス(*Eurygaster integriceps*)、エウシスツス・インピクチベントリス(*Euschistus impictiventris*)、レプトグロッシス・フィロプス(*Leptoglossus phyllopus*)、リグス・リネオラリス(*Lygus lineolaris*)、リグス・プラテンシス(*Lygus pratensis*)、ネザラ・ビリデュラ(*Nezara viridula*)、ピエスマ・クアドラタ(*Piesma quadrata*)、ソルベア・インストラリス(*Solubea insularis*)、チアンタ・ペルジトル(*Thyanta perditor*)、アクリトシフォン・オノブリキス(*Acrythosiphon onobrychis*)、アデルゲス・ラリキス(*Adelges laricis*)、アフイズラ・ナスツルチ(*Aphidula nasturtii*)、アフイス・ファバエ(*Aphis fabae*)、アフイス・フォルベシ(*Aphis fabae*)、アフイス・ポミ(*Aphis pomi*)、アフイス・ゴシピ(*Aphis gossypii*)、アフイス・グロスラリアエ(*Aphis grossulariae*)、アフイス・シュネイデリ(*Aphis schneideri*)、アフイス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*)、アフイス・サンブキ(*Aphis sambuci*)、アクリトシフォン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アウラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)、ベミシア・アルゲンチフォリ(*Bemisia argentifolii*)、ブラチカウズス・カルズイ(*Brachycaudus cardui*)、ブラチカウズス・ヘリクリシ(*Brachycaudus helichrysi*)、ブラチカウズス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)、ブラチカウズス・プルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ブレビコリネ・ブラシカエ(*Brevicoryne brassicae*)、カピトフォルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシピ(*Cerosiphia gossypii*)、カエトシフォン・フラガエフォリ(*Chaetosiphon fragaefolii*)、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマニアナエ(*Dreyfusia nordmanniana*)、ドレイフシア・ピセアエ(*Dreyfusia piceae*)、ジサフィス・ラジコラ(*Dysaphis radicola*)、ジサウラコルツム・シュードソラニ(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、ジサフィス・プランタギネア(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、エンポアスカ・ファバエ(*Empoasca fabae*)、ヒアロプテルス・プルニ(*Hyalopterus pruni*)、ヒペロミズス・ラクツカエ(*Hyperomyzus lactucae*)、マクロシフム・アベナエ(*Macrosiphum avenae*)、マクロシフム・エウホルビアエ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフォン・ロサエ(*Macrosiphon rosae*)、メゴウラ・ビキアエ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrarius*)、メトポロフィウム・ジローズム(*Metopolophium dirhodum*)、ミズス・ペルシカエ(*Myzus persicae*)、ミズス・アスカロニクス(*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ(*Myzus cerasi*)、ミズス・バリアンス(*Myzus varians*)、ナソノビア・リビス・ニグリ(*Nasonovia ribis-nigri*)、ニラパルバタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*)、ペムフィグス・ブルサリウス(*Pemphigus bursarius*)、パーキンシエラ・サッカリキダ(*Perkinsiella saccharicida*)、ホロドン・フミリ(*Phorodon humili*)、プシラ・マリ(*Psylla mali*)、プシラ・ピリ(*Psylla piri*)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、ロパロシフム・マイジス(*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・パジ(*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・インセルツム(*Rhopalosiphum insertum*)、サツパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サツパフィス・マリ(*Sappaphis mali*)、シザフィス・グラミンム(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌジノサ(*Schizoneura lanuginosa*)、シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、トリアロイロデス・バポラリオルム(*Trialearodes vaporariorum*)、トキシプテラ・アウランチアンド(*Toxoptera aurantiiand*)、ビテウス・ビチフォリイ(*Viteus vitifolii*)、キメックス・レクツラリウス(*Cimex lectularius*)、キメックス・ヘミプテルス(*Cimex hemipterus*)、レデュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種(*Triatoma* spp.)及びア rilus・クリタツス(*Arilus critatus*);

アリ、ミツバチ、狩蜂、ハバチ(膜翅目(Hymenoptera))、例えば、アタリア・ロサエ(*Athalia rosae*)、アッタ・セファロテス(*Atta cephalotes*)、アッタ・カピグアラ(*Atta capiguara*)、アッタ・ラエピガタ(*Atta laevigata*)、アッタ・ロブスタ(*Atta robusta*)、アッタ・セクスデンス(*Atta sexdens*)、アッタ・テキサナ(*Atta texana*)、クレマトガステル属の種(*Crematogaster* spp.)、ホプロカンパ・ミヌタ(*Hoplocampa minuta*)、ホプロカンパ・テスツジネア(*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス・ニゲル(*Lasius niger*)、モノモ

リウム・ファラオニス(*Monomorium pharaonis*)、ソレノプシス・ゲミナタ(*Solenopsis geminata*)、ソレノプシス・インビクタ(*Solenopsis invicta*)、ソレノプシス・リクテリ(*Solenopsis richteri*)、ソレノプシス・キシロニ(*Solenopsis xyloni*)、ポゴノミルメックス・バルバツス(*Pogonomyrmex barbatus*)、ポゴノミルレックス・カリフォルニクス(*Pogonomyrmex californicus*)、フェイドレ・メガセファラ(*Pheidole megacephala*)、ダシムチラ・オシデンタリス(*Dasymutilla occidentalis*)、ボンブス属の種(*Bombus* spp.)、ベスブラ・スクアモサ(*Vespula squamosa*)、パラベスブラ・ブルガリス(*Paravespula vulgaris*)、パラベスブラ・ペンシルバニカ(*Paravespula pennsylvanica*)、パラベスブラ・ゲルマニカ(*Paravespula germanica*)、ドリコベスブラ・マクラタ(*Dolichovespula maculata*)、ベスパ・クラブロ(*Vespa crabro*)、ポリステス・ルビギノサ(*Polistes rubiginosa*)、カンポノツス・フロリダヌス(*Camponotus floridanus*)及びリネピテマ・フミレ(*Linepithema humile*);

10

コオロギ、バッタ、イナゴ(直翅目(*Orthoptera*))、例えば、アケタ・ドメスティカ(*Achet a domestica*)、グリロタルパ・グリロタルパ(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ロクスタ・ミグラトリア(*Locusta migratoria*)、メラノプラス・ビビタツス(*Melanoplus bivittatus*)、メラノプラス・フムルールブラム(*Melanoplus femurrubrum*)、メラノプラス・メキシカヌス(*Melanoplus mexicanus*)、メラノプラス・サンガイニペス(*Melanoplus sanguinipes*)、メラノプラス・スプレツス(*Melanoplus spretus*)、ノマダクリス・セプテムファシアタ(*Nomadacris septemfasciata*)、シストセルカ・アメリカナ(*Schistocerca americana*)、シストセルカ・グレガリア(*Schistocerca gregaria*)、ドキオスタウルス・マロカヌス(*Doclostaurus maroccanus*)、タキキネス・アシナモルス(*Tachycines asynamorus*)、オエダレウス・セネガレンシス(*Oedaleus senegalensis*)、ゾノゼルス・バリエガツス(*Zonozerus variegatus*)、ヒエログリフス・ダガネンシス(*Hieroglyphus daganensis*)、クラウサリア・アングリフェラ(*Kraussaria angulifera*)、カリプタムス・イタリクス(*Calliptamus italicus*)、コルトイセテス・テルミニフェラ(*Chortoicetes terminifera*)、及びロクスタナ・パルダリナ(*Locustana pardalina*);

20

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

30

セイヨウシミ、マダラシミ(シミ目(*Thysanura*))、例えば、レピスマ・サッカリナ(*Lepisma saccharina*)及びテルモビア・ドメスチカ(*Thermobia domestica*)

ムカデ(ムカデ綱(*Chilopoda*))、例えば、スクチゲラ・コレオプトラタ(*Scutigera coleoptrata*);

ヤスデ(ヤスデ綱(*Diplopoda*))、例えば、ナルセウス属の種(*Narceus* spp.)

ハサミムシ(革翅目(*Dermaptera*))、例えば、フォルフィクラ・アウリクラリア(*forficula auricularia*);

シラミ(フチラプテラ(*Phthiraptera*))、例えば、ペジクルス・フマヌス・カピチス(*Pediculus humanus capitis*)、ペジクルス・フマヌス・コルポリス(*Pediculus humanus corporis*)、プチルス・プピス(*Pthirus pubis*)、ハエマトピヌス・エウリステルヌス(*Haematopinus eurysternus*)、ハエマトピヌス・スイス(*Haematopinus suis*)、リノグナツス・ビツリ(*Linognathus vituli*)、ボビコラ・ボピス(*Bovicola bovis*)、メノポン・ガリナエ(*Menopon gallinae*)、メナカンツス・ストラミネウス(*Menacanthus stramineus*)及びソレノポテス・カピラツス(*Solenopotes capillatus*);

40

トビムシ目(*Collembola*)(トビムシ)、例えばオニキウラス属(*Onychiurus*)の種。

【 0 0 7 5 】

本発明の化合物(それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含む)は、昆虫、好ましくは、総翅目、双翅目及び半翅目の昆虫などの吸汁性又は穿刺性の昆虫、特に以下の種の防除に特に有用である:

総翅目(*Thysanoptera*): フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニ

50

エラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・トリチキ(*Frankliniella tritici*)、シルトリプス・キトリ(*Scirtothrips citri*)、トリプス・オリザエ(*Thrips oryzae*)、トリプス・パルミ(*Thrips palmi*)及びトリプス・タバキ(*Thrips tabaci*);

双翅目(Diptera)、例えば、アエデス・アエギブチ(*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス(*Aedes albopictus*)、アエデス・ベキサンス(*Aedes vexans*)、アナストレファ・ルデンス(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルキアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレエボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・レウコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、アノフェレス・ミニムス(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラトス(*Anopheles quadrimaculatus*)、カリホラ・ビシナ(*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*)、クリソミア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラックス(*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*)、コクリオミア・ホミニボラキス(*Cochliomyia hominivorax*)、コンタリニア・ソルギコラ(*Contarinia sorghicola*)、コルジロピア・アントロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、クレクス・ピピエンス(*Culex pipiens*)、クレクス・ニグリパルプス(*Culex nigripalpus*)、クレクス・クインクエファスキアトス(*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*)、ダクス・ククルビタエ(*Dacus cucurbitae*)、ダクス・オレアエ(*Dacus oleae*)、ダシネウラ・ブラシカエ(*Dasineura brassicae*)、デリア・アンティーク(*Delia antique*)、デリア・コアルクタタ(*Delia coarctata*)、デリア・プラツラ(*Delia platura*)、デリア・ラジクム(*Delia radicum*)、テルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、ファニア・カニクラリス(*Fannia canicularis*)、ゲオミザ・トリプンクタタ(*Geomyza tripunctata*)、ガステロフィルス・インテスチナリス(*Gasterophilus intestinalis*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロシナ・フシペス(*Glossina fuscipes*)、グロシナ・タキノイデス(*Glossina tachinoides*)、ハエマトビア・イリタンス(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、ヒレミア・プラツラ(*Hylemyia platura*)、ヒポデルマ・リネアタ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノプス・トレンス(*Leptoconops torrens*)、リリオミザ・サチバエ(*Liriomyza sativae*)、リリオミザ・トリフォリイ(*Liriomyza trifolii*)、ルキリア・カプリナ(*Lucilia caprina*)、ルキリア・クプリナ(*Lucilia cuprina*)、ルキリア・セリカタ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・チチラヌス(*Mansonia titillanus*)、マイエチオラ・デストルクトル(*Mayetiola destructor*)、ムスカ・オータムナリス(*Musca autumnalis*)、ムスカ・ドメスチカ(*Musca domestica*)、ムシナ・スタブランズ(*Muscina stabulans*)、オエストルス・オビス(*Oestrus ovis*)、オボミザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒソキアミ(*Pegomyahysocyami*)、フォルビア・アンチクア(*Phorbia antiqua*)、フォルビア・ブラシカエ(*Phorbia brassicae*)、フォルビア・コアルクタタ(*Phorbia coarctata*)、フレボトムス・アルゲンチペス(*Phlebotomus argentipes*)、プソロフォラ・コロンビアエ(*Psorophora columbiae*)、プシラ・ロサエ(*Psila rosae*)、プソロフォラ・ジスコロル(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimulium mixtum*)、ラゴレチス・セラシ(*Rhagoletis cerasi*)、ラゴレチス・ポモネラ(*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ・ハエモロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* spp.)、シムリウム・ビッタツム(*Simulium vittatum*)、ストモキシス・カルキトランス(*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス・ボビヌス(*Tabanus bovinus*)、タバヌス・アトラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)及びタバナス・

10

20

30

40

50

シミリス(*Tabanus similis*)、チブラ・オレラセア(*Tipula oleracea*)及びチブラ・パルドサ(*Tipula paludosa*);

半翅目(Hemiptera)、特にアブラムシ:アクリトシフォン・オノブリキス(*Acyrtosiphon nobrychis*)、アデルゲス・ラリキス(*Adelges laricis*)、アフィズラ・ナスツルチ(*Aphidula nasturtii*)、アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*)、アフィス・フォルベシ(*Aphis forbesi*)、アフィス・ポミ(*Aphis pomi*)、アフィス・ゴシピ(*Aphis gossypii*)、アフィス・グロストラリアエ(*Aphis grossulariae*)、アフィス・シュネイデリ(*Aphis schneideri*)、アフィス・スピラエコラ(*Aphis spiraecola*)、アフィス・サンブキ(*Aphis sambuci*)、アクリトシフォン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アウラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)、ブラチカウズス・カルズイ(*Brachycaudus cardui*)、ブラチカウズス・ヘリクリシ(*Brachycaudus helichrysi*)、ブラチカウズス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)、ブラチカウズス・プルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ブレビコリネ・ブラシカエ(*Brevicoryne brassicae*)、カピトフォルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシピ(*Cerosiphia gossypii*)、カエトシフォン・フラガエフォリ(*Chaetosiphon fragaefolii*)、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマニアナエ(*Dreyfusia nordmanniana*)、ドレイフシア・ピセアエ(*Dreyfusia piceae*)、ジサフィス・ラジコラ(*Dysaphis radicola*)、ジサウラコルツム・シュードソラニ(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、ジサフィス・プランタギネア(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、エンポアスカ・ファバエ(*Empoasca fabae*)、ヒアロプテルス・ブルニ(*Hyalopterus pruni*)、ヒペロミズス・ラクツカエ(*Hyperomyzus lactucae*)、マクロシフム・アベナエ(*Macrosiphum avenae*)、マクロシフム・エウホルビアエ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフォン・ロサエ(*Macrosiphon rosae*)、メゴウラ・ビキアエ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrae*)、メトポロフィウム・ジローズム(*Metopolophium dirhodum*)、ミズス・ペルシカエ(*Myzus persicae*)、ミズス・アスカロニクス(*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ(*Myzus cerasi*)、ミズス・バリアンス(*Myzus varians*)、ナソノビア・リビス-ニグリ(*Nasonovia ribis-nigri*)、ニラバルバタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*)、ペムフィグス・ブルサリウス(*Pemphigus bursarius*)、パーキンシエラ・サッカリキダ(*Perkinsiella saccharicida*)、ホロドン・フミリ(*Phorodon humili*)、ブシラ・マリ(*Psylla mali*)、ブシラ・ピリ(*Psylla piri*)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、ロパロシフム・マイジス(*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・パジ(*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・インセルツム(*Rhopalosiphum insertum*)、サツパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サツパフィス・マリ(*Sappaphis mali*)、シザフィス・グラミヌム(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌジノサ(*Schizoneura lanuginosa*)、シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、トリアロイロデス・バポラリオルム(*Trialearodes vaporariorum*)、トキシプテラ・アウランチアンド(*Toxoptera aurantii*)、ビテウス・ビチフォリイ(*Viteus vitifolii*)。

【 0 0 7 6 】

本発明の化合物(それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含む)は、半翅目及び総翅目の昆虫を防除するために特に有用である。

【 0 0 7 7 】

本発明は、本発明による少なくとも1種の化合物、並びに殺有害生物作用を有する少なくとも1種の不活性液体及び/若しくは固体の農業的に許容可能な担体、並びに所望であれば、少なくとも1種の界面活性剤を含む無脊椎有害生物を駆除するための農業組成物を提供する。

【 0 0 7 8 】

こうした組成物は、本発明の単一の活性化合物、又は本発明のいくつかの活性化合物の混合物を含むことができる。本発明による組成物は、個々の異性体若しくは異性体の混合物又は塩及び個々の互変異性体若しくは互変異性体の混合物を含むことができる。

【 0 0 7 9 】

本発明の化合物は、そのまま、それらの製剤の形態又はそれらから調製される使用形

10

20

30

40

50

態で、例えば、直接スプレー可能な液剤、粉末、懸濁剤若しくは分散液、エマルジョン製剤、油分散剤、ペースト剤、粉塵性生成物、散布させるための材料、又は粒剤の形態で、スプレー、噴霧、散粉、散布又は注ぐ手段によって使用することができる。使用形態は意図する目的に全面的に依存し、それらは、いずれの場合にも、本発明による活性化化合物の最も微細な可能分布を確実にすることを意図している。

【0080】

製剤は、公知の方式において(例えば検討用に、US 3,060,084、EP-A 707 445(原液に関して)、Browning、「Agglomeration」、Chemical Engineering、1967年12月4日、147~48、Perry's Chemical Engineer's Handbook、第4版、McGraw-Hill、New York、1963、8~57ページ及び以下参照、WO 91/13546、US 4,172,714、US 4,144,050、US 3,920,442、US 5,180,587、US 5,232,701、US 5,208,030、GB 2,095,558、US 3,299,566、Klingman、Weed Control as a Science、John Wiley and Sons、Inc.、New York、1961、Hanceら、Weed Control Handbook、第8版、Blackwell Scientific Publications、Oxford、1989 and Mollet、H.、Grubemann、A.、Formulation technology、Wiley VCH Verlag GmbH、Weinheim (Germany)、2001、2. D. A. Knowles、Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations、Kluwer Academic Publishers、Dordrecht、1998 (ISBN 0-7514-0443-8)参照)、例えば、溶媒及び/又は担体、所望であれば乳化剤、界面活性剤及び分散剤、保存料、消泡剤、凍結防止剤などの農薬の製剤に適切な助剤を用いて、種子処理製剤のために更に任意選択により着色剤及び/又はバインダー及び/又はゲル化剤を用いて、活性化化合物を希釈することによって調製される。

【0081】

適切な溶媒/担体は、例えば:

-溶媒、例えば、水、芳香族の溶媒(例えば、Solvesso製品、キシレンなど)、パラフィン(例えば、鉱油留分)、アルコール(例えば、メタノール、ブタノール、ペンタノール、ベンジルアルコール)、ケトン(例えばシクロヘキサノン、 γ -ブチロラクトン)、ピロリドン(N-メチルピロリドン(NMP)、N-オクチルピロリドン(NOP))、アセテート(グリコールジアセテート)、乳酸アルキル、ラクトン、例えば、 γ -ブチロラクトン、グリコール、脂肪酸ジメチルアミド、脂肪酸及び脂肪酸エステル、トリグリセリド、植物又は動物由来の油及び変性油、例えばアルキル化植物油である。原則として、溶媒混合物も使用することができる。

【0082】

-担体、例えば、シリカゲル、微粉ケイ酸、シリケート、タルク、カオリン、アタクレイ、石灰岩、石灰、チョーク、油粘土、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム及び硫酸マグネシウム、酸化マグネシウムなどの粉碎した天然鉱物及び粉碎した合成鉱物、粉碎した合成物質、例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素などの肥料、並びに穀類粉、樹皮粉、木材粉及び堅果殻粉、セルロース粉末などの植物由来の生成物、並びに他の固体担体。

【0083】

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

【0084】

分散剤の例は、リグニン亜硫酸廃液及びメチルセルロースである。

【0085】

適切な界面活性剤は、リグノスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩及びアンモニウム塩、アルキルアリールスルホネート、アルキルサルフェート、アルキルスルホネート、脂肪アルコールサルフェート、脂肪酸及び硫酸化脂肪アルコールグリコールエーテル、更にスルホン化ナフタレン及びナフタレン誘導体とホルムアルデヒドとの縮合物、ナフタレン又はナフタレンスルホン酸とフェノール及びホルムアルデヒドとの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェノールエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、オクチル

フェノール、ノニルフェノール、アルキルフェノールポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、トリスチアールフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアールポリエーテルアルコール、アルコール及び脂肪アルコール/エチレンオキシド縮合物、エトキシ化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、エトキシ化ポリオキシプロピレン、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタール、ソルビトールエステルである。

【0086】

グリセリン、エチレングリコール、プロピレングリコールなどの凍結防止剤及び殺細菌剤を該製剤に添加することもできる。

【0087】

適切な消泡剤は、例えば、シリコン又はステアリン酸マグネシウムに基づく消泡剤である。

【0088】

適切な保存料は、例えばジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールである。

【0089】

適切な増粘剤は、製剤に擬塑性流動挙動を与える化合物(すなわち、静止状態で高粘度であり、攪拌状態で低粘度である)である。本発明において、例えば、多糖に基づく市販の増粘剤、例えば、キサントガム(登録商標)(KelcoからのKelzan(登録商標)、Rhodopol(登録商標)23(Rhone Poulenc)又はVeegum(登録商標)(R.T. Vanderbilt)、又は有機フィロケイ酸塩、例えばAttaclay(登録商標)(Engelhard)である。本発明の分散液に適切な消泡剤は、例えば、シリコンエマルション(例えば、Silikon(登録商標)SRE(Wacker)又はRhodorsil(登録商標)(Rhodia))、鎖状アルコール、脂肪酸、有機フッ素化合物及びこれらの混合物である。微生物による攻撃に対して本発明による組成物を安定化するために、殺細菌剤を加えることができる。適切な細菌剤は、例えば、Avecia(又はArch)からProxel(登録商標)、又はThor ChemieからActicide(登録商標)RS、及びRohm & HaasからKathon(登録商標)MKの商品名で市販されている化合物などのイソチアゾロンである。適切な凍結防止剤は、有機ポリオール、例えば、エチレングリコール、プロピレングリコール又はグリセリンである。これらは、通常、活性化合物組成物の全重量に基づいて10重量%以下の量で用いられる。適切な場合、本発明による活性化合物組成物は、pHを調節するために、1~5重量%の緩衝液を、調製される製剤の全量に基づいて含んでもよく、使用される緩衝液の量及び種類は、活性化合物の化学的性質によって決まる。緩衝液の例は、弱無機酸又は弱有機酸、例えば、リン酸、ボロン酸、酢酸、プロピオン酸、クエン酸、フマル酸、酒石酸、シュウ酸及びコハク酸などのアルカリ金属塩である。

【0090】

直接スプレー可能な液剤、エマルション剤、ペースト剤又は油分散剤の調製に適切である物質は、灯油又はディーゼル油などの中沸点~高沸点の鉱油留分、更にコールタール油及び植物若しくは動物由来の油、脂肪族、環式及び芳香族の炭化水素、例えばトルエン、キシレン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン又はそれらの誘導体、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール、シクロヘキサノン、イソホロン、高極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドン及び水である。

【0091】

粉末、散布させるための材料、及び粉塵性生成物は、活性物質を固体担体と混合すること又は同時に粉碎することによって調製することができる。

【0092】

粒剤、例えば被覆粒剤、含浸粒剤及び均質粒剤は、活性成分を固体担体に結合させることによって調製することができる。固体担体の例は、シリカゲル、シリケート、タルク、カオリン、アタクレイ、石灰岩、石灰、チョーク、油粘土、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウムなどの鉱物土類、粉碎した

10

20

30

40

50

合成物質、例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素などの肥料、並びに穀類粉、樹皮粉、木材粉及び堅果殻粉、セルロース粉末などの植物由来の生成物、並びに他の固体担体である。

【 0 0 9 3 】

一般に、該製剤(すなわち、本発明による組成物)は、0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%の活性成分を含む。活性成分は、(NMRスペクトルに従って)90%~100%、好ましくは95%~100%の純度で用いられる。

【 0 0 9 4 】

種子処理の目的で、それぞれの製剤は2~10倍に希釈することができ、そのまま使用可能な調製物における0.01%~60重量%、好ましくは0.1~40重量%の活性化合物の濃度をもちます。

10

【 0 0 9 5 】

以下は製剤の例である。

【 0 0 9 6 】

1. 水での希釈用生成物

種子処理の目的で、こうした生成物は、希釈又は未希釈で種子に施用することができる。

【 0 0 9 7 】

A) 液剤(SL、LS)

活性化合物10重量部を、水又は水溶性溶媒90重量部中に溶解させる。別法として、湿潤剤又は他の助剤を添加する。活性化合物は水での希釈により溶解し、それによって活性化合物10%(w/w)の製剤が得られる。

20

【 0 0 9 8 】

B) 分散製剤(DC)

活性化合物20重量部を、シクロヘキサノン70重量部中に、分散剤(例えばポリビニルピロリドン)10重量部の添加とともに溶解させる。水での希釈によって分散液が得られ、それによって活性化合物20%(w/w)の製剤が得られる。

【 0 0 9 9 】

C) 乳剤(EC)

活性化合物15重量部を、キシレン7重量部中に、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート(いずれの場合にも5重量部)の添加とともに溶解させる。水での希釈によってエマルションが得られ、それによって活性化合物15%(w/w)の製剤が得られる。

30

【 0 1 0 0 】

D) エマルション製剤(EW、EO、ES)

活性化合物25重量部を、キシレン35重量部中に、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート(いずれの場合にも5重量部)の添加とともに溶解させる。この混合物を水30重量部中に、乳化機(例えばUltraturrax)によって導入し、均質なエマルションを作製する。水での希釈によってエマルションが得られ、それによって活性化合物25%(w/w)の製剤が得られる。

40

【 0 1 0 1 】

E) 懸濁製剤(SC、OD、FS)

攪拌されたボールミル中で、活性化合物20重量部を、分散剤、湿潤剤10重量部、及び水又は有機溶媒70重量部の添加とともに微粉碎することで、微細な活性化合物の懸濁液が得られる。水での希釈によって活性化合物の安定な懸濁液が得られ、それによって活性化合物20%(w/w)の製剤が得られる。

【 0 1 0 2 】

F) 顆粒水和剤及び顆粒水溶剤(WG、SG)

活性化合物50重量部を、分散剤及び湿潤剤50重量部の添加とともに微細に粉碎し、技術機器(例えば押し出し、スプレー塔、流動床)によって顆粒水和剤又は顆粒水溶剤として作製

50

する。水での希釈によって活性化合物の安定な分散液又は溶液が得られ、それによって活性化合物50%(w/w)の製剤が得られる。

【0103】

G)水和剤及び水溶剤(WP、SP、SS、WS)

活性化合物75重量部を、ローターステーターミル中で、分散剤、湿潤剤及びシリカゲル25重量部の添加とともに粉碎する。水での希釈によって活性化合物の安定な分散液又は溶液が得られ、それによって活性化合物75%(w/w)の製剤が得られる。

【0104】

H)ゲル製剤(GF)

10
 攪拌されたボールミル中で、活性化合物20重量部を、分散剤10重量部、ゲル化剤、湿潤剤1重量部、並びに水又は有機溶媒70重量部の添加とともに微粉碎することで、微細な活性化合物の懸濁液が得られる。水での希釈によって活性化合物の安定な懸濁液が得られ、それによって活性化合物20%(w/w)の製剤が得られる。

【0105】

2.葉の処理のための未希釈で施用される生成物

種子処理の目的で、こうした生成物は、希釈又は未希釈で種子に施用することができる。

【0106】

I)粉剤(DP、DS)

20
 活性化合物5重量部を微細に粉碎し、微粉化カオリン95重量部と密接に混合する。これによって、活性化合物5%(w/w)を有する粉剤生成物が得られる。

【0107】

J)粒剤(GR、FG、GG、MG)

活性化合物0.5重量部を微細に粉碎し、担体95.5重量部と組み合わせ、それによって活性化合物0.5%(w/w)の製剤が得られる。現在の方法は、押出し、スプレー乾燥又は流動床である。これによって、葉への使用のために未希釈で施用される粒剤が得られる。

【0108】

K) ULV液剤(UL)

30
 活性化合物10重量部を、有機溶媒(例えば、キシレン)90重量部中に溶解させる。これによって、葉への使用のために未希釈で施用される活性化合物10%(w/w)を有する生成物が得られる。

【0109】

水性使用形態は、水を添加することによって、エマルジョン製剤、ペースト剤又は湿潤性粉末(スプレー可能な粉末、油分散剤)から調製することができる。エマルジョン製剤、ペースト剤又は油分散剤を調製するために、該物質はそのまま、又は油若しくは溶媒中に溶解させて、湿潤剤、粘着性付与剤、分散剤又は乳化剤を用いて水中で均質化することができる。しかし、活性物質、湿潤剤、粘着性付与剤、分散剤又は乳化剤、及び適切な場合、溶媒又は油で構成される製剤を調製することも可能であり、こうした製剤は水での希釈に適している。

【0110】

40
 そのまま使用可能な製品中の活性化合物濃度は、比較的広い範囲内で変動させることができる。一般に、それらは0.0001~10%、好ましくは0.01~1%である。

【0111】

活性成分は、超低量プロセス(ULV)において首尾よく使用することもでき、95重量%を超える活性成分を含む製剤を施用、又は添加剤を用いない活性成分を施用することさえ可能である。

【0112】

50
 本発明の方法及び使用において、本発明による化合物は、他の活性成分、例えば他の殺有害生物剤、殺虫剤、除草剤、肥料、例えば硝酸アンモニウム、尿素、カリ及びスーパーホスフェート、植物毒性物及び植物成長調節剤、薬害軽減剤及び殺線虫剤とともに施用す

ることできる。これらの追加成分は、前記されている組成物と、順次に又は組み合わせて使用することができ、適切な場合には使用の直前に添加することもできる(タンクミックス)。例えば、植物に、本発明の組成物を、他の活性成分で処理される前又は後のいずれか一方でスプレーすることができる。

【0113】

本発明による化合物と一緒に使用することができ、潜在的な相乗効果が生ずることがある殺有害生物剤の以下一覧Mは、可能な組合せを例示するが、何の制約も課すものではないことを意図している。

【0114】

M.1. オルガノ(チオ)ホスフェート化合物: アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クーマホス、シアノホス、デメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファンフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン-メチル、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロベタンホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテプ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、パミドチオン、

M.2. カルバメート化合物: アルジカルブ、アラニカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メトミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクサー、チオジカルブ、チオファノックス、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、トリアザメエート、

M.3. ピレスロイド化合物: アクリナトリン、アレスリン、d-cis-transアレスリン、d-transアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリンS-シクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、ガンマ-シハロトリン、シベルメトリン、アルファ-シベルメトリン、ベータ-シベルメトリン、シータ-シベルメトリン、ゼータ-シベルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンベントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ-フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、メトフルトリン、ベルメトリン、フェノトリン、ブラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン(除虫菊)、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、

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

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

【0115】

M.6. GABA依存性塩化物チャネルアンタゴニスト化合物: クロルデン、エンドスルファン、ガンマ-HCH (リンダン); エチプロール、フィブロニル、ピラフルプロール、ピリプロール、

M.7. 塩化物チャネル活性化因子: アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、ミルバメク

10

20

30

40

50

チン、レピメクチン、

M.8. MET1 I化合物: フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、フルフェネリム、ロテノン、

M.9. MET1 II及びIII化合物: アセキノシル、フルアシプリム、ヒドラメチルノン、

M.10. 酸化リン酸化の脱共役剤: クロルフェナピル、DNOC、

M.11. 酸化リン酸化の阻害剤: アゾシクロチン、シヘキサチン、ジアフェンチウロン、酸化フェンブタズ、プロバルギット、テトラジホン、

M.12. 脱皮破壊剤: シロマジン、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド、

M.13. 相乗剤: ピペロニルブトキシド、トリブホス、

M.14. ナトリウムチャンネル遮断薬化合物: インドキサカルブ、メタフルミゾン、

M.15. 燻蒸剤: 臭化メチル、クロロピクリンフッ化スルフリル、

M.16. 選択的取込遮断薬: クリロチエ(crylotie)、ピメトロジン、フロニカミド、

M.17. ダニ成長阻害剤: クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、

M.18. キチン合成阻害剤: ブプロフェジン、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、

M.19. 脂質生合成阻害剤: スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、

M.20. オクタパミン作動性アゴニスト: アミトラズ、

M.21. リアノジン受容体調節因子: フルベンジアミド及び(R)-, (S)-3-クロル-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオール-1-(トリフルオルメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド(M21.1)、

M.22. イソオキサゾリン化合物: 4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-ピリジン-2-イルメチル-ベンズアミド(M22.1)、4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-ベンズアミド(M22.2)、4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-ベンズアミド(M22.3)、4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-ナフタレン-1-カルボン酸[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-アミド(M22.4)、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(M22.5)、4-[5-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-ベンズアミド(M22.6)、4-[5-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-ナフタレン-1-カルボン酸[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-アミド(M22.7)及び5-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-2-[1,2,4]トリアゾール-1-イル-ベンゾニトリル(M22.8);

M.23. アントラニルアミド化合物: クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[4-シアノ-2-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-6-メチル-フェニル]-アミド(M23.1)、5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-クロロ-4-シアノ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.2)、5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-プロモ-4-シアノ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.3)、5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-プロモ-4-クロロ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.4)、5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2,4-ジクロロ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.5)、5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カル

10

20

30

40

50

ボン酸[4-クロロ-2-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-6-メチル-フェニル]-アミド(M23.6)、N'-(2-{[5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.7)、N'-(2-{[5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-N'-メチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.8)、N'-(2-{[5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-N,N'-ジメチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.9)、N'-(3,5-ジプロモ-2-{[5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.10)、N'-(3,5-ジプロモ-2-{[5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-N'-メチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.11)及びN'-(3,5-ジプロモ-2-{[5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-N,N'-ジメチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.12);

10

M.24. マロノニトリル化合物:2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)マロノニトリル(CF₂H-CF₂-CF₂-CF₂-CH₂-C(CN)₂-CH₂-CH₂-CF₃)(M24.1)及び2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロプロチル)-マロノジニトリル(CF₂H-CF₂-CF₂-CF₂-CH₂-C(CN)₂-CH₂-CH₂-CF₂-CF₃)(M24.2);

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

20

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

30

M.27. 様々な化合物:リン化アルミニウム、アミドフルメト、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、ホウ砂、プロモプロピレート、シアン化物、シエノピラフェン、シフルメトフェン、キノメチオネート、ジコホール、フルオロアセテート、ホスフィン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、硫黄、有機硫黄化合物、吐酒石、スルホキサフロー、N-R'-2,2-ジハロ-1-R''シクロ-プロパンカルボキシアミド-2-(2,6-ジクロロ- , , -トリフルオロ-p-トリル)ヒドラゾン又はN-R'-2,2-ジ(R''')プロピオンアミド-2-(2,6-ジクロロ- , , -トリフルオロ-p-トリル)-ヒドラゾン(式中、R'はメチル又はエチルであり、ハロはクロロ又はプロモであり、R''は水素又はメチルであり、R'''はメチル又はエチルである)、4-ブタ-2-イニルオキシ-6-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-2-フルオロ-ピリミジン(M27.1)、シクロプロパン酢酸、1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[2-シクロプロピルアセチル]オキシ]メチル]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-デカヒドロ-12-ヒドロキシ-4,6a,12b-トリメチル-11-オキソ-9-(3-ピリジニル)-2H,11H-ナフト[2,1-b]ピラノ[3,4-e]ピラン-3,6-ジイル]エステル(M27.2)及び8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチル-フェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチル-ピリダジン-3-イル)-3-アザ-ピシクロ[3.2.1]オクタン(M27.3)。

40

【 0 1 1 6 】

50

M群の市販されている化合物は、他の出版物の中でもThe Pesticide Manual、第13版、British Crop Protection Council (2003)で見つけることができる。

【 0 1 1 7 】

パラオクソン及びそれらの調製物は、Farm Chemicals Handbook、Volume 88、Meister Publishing Company、2001に記載されている。フルピラゾホスは、Pesticide Science 54、1988、p.237-243及びUS 4,822,779に記載されている。AKD 1022及びその調製物は、US 6,300,348に記載されている。M21.1はWO 2007/101540から知られている。イソオキサゾリンM22.1～M22.8は、例えば、WO2005/085216、WO 2007/079162、WO 2007/026965、WO 2009/126668及びWO2009/051956に記載されている。アントラニルアミドM23.1～M23.6はWO 2008/72743及びWO 200872783に記載されており、アントラニルアミドM23.7～M23.12はWO 2007/043677に記載されている。マロノニトリルM24.1及びM24.2はWO 02/089579、WO 02/090320、WO 02/090321、WO 04/006677、WO 05/068423、WO 05/068432及びWO 05/063694に記載されている。M26.1～M6.10は、例えば、WO 2007/115644に記載されている。M27.1は、例えば、JP 2006131529に記載されている。有機硫黄化合物はWO 2007060839に記載されている。M27.2はWO 2008/66153及びWO 2008/108491に記載されている。M27.3はJP 2008/115155に記載されている。

10

【 0 1 1 8 】

以下の活性物質の一覧Fは、本発明による化合物と組み合わせて使用することができるものであるが、その可能性のある組み合わせを説明することを意図するものであって、それらに限定されるものではない：

20

F. I 呼吸阻害剤

F. I-1) Qo部位での複合体IIIの阻害剤(例えば、ストロビルリン類)

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

30

オキサゾリジンジオン類及びイミダゾリノン類：ファモキサドン、フェンアミドン；

F. I-2) 複合体IIの阻害剤(例えば、カルボキサミド類)：

カルボキサニリド類：ベノダニル、ピキサフェン、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フェンヘキサミド、フルオピラム、フルトラニル、フラメトピル、イソピラザム、イソチアニル、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルザミド、チアジニル、2-アミノ-4メチル-チアゾール-5-カルボキサニリド、N-(3',4',5'-トリフルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4カルボキサミド、N-(4'-トリフルオロメチルチオピフェニル-2-イル)-3ジフルオロメチル-1-メチル-1Hピラゾール-4-カルボキサミド及び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；

40

F. I-3) Qi部位での複合体IIIの阻害剤：シアゾファミド、アミスルプロム；

F. I-4) 他の呼吸阻害剤(複合体I、脱共役剤)

ジフルメトリム；テクナゼン；フェリムゾン；アメトクトラジン；シルチオフラム；
ニトロフェニル誘導体：ピナバクリル、ジノブトン、ジノカップ、フルアジナム、ニトルタール-イソプロピル、
有機金属化合物：フェンチン塩、例えば、酢酸フェンチン、塩化フェンチン又はフェンチンヒドロキシド；

F. II) ステロール生合成阻害剤(SBI殺菌剤)

F. II-1) C14デメチラーゼ阻害剤(DMI殺菌剤、例えば、トリアゾール類、イミダゾール類

50

)

トリアゾール類：アザコナゾール、ピテルタノール、フロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、エボキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、パクロブトラゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ユニコナゾール；

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

10

ピリミジン、ピリジン及びピペラジン類：フェナリモール、ヌアリモール、ピリフェノックス、トリフォリン；

F. II-2) デルタ14-還元酵素阻害剤(アミン類、例えばモルホリン類、ピペリジン類)

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

ピペリジン類：フェンプロピジン、ピペラリン；

スピロケタールアミン類(spiroketalamines)：スピロキサミン；

F. II-3) 3-ケト還元酵素阻害剤：ヒドロキシアニリド類：フェンヘキサミド；

F. III) 核酸合成阻害剤

F. III-1) RNA、DNA合成

20

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

イソオキサゾール及びイソチアゾロン類：ヒメキサゾール、オクチリノン；

F. III-2) DNAトポイソメラーゼ阻害剤：オキソリン酸；

F. III-3) ヌクレオチド代謝(例えば、アデノシン-デアミナーゼ)

ヒドロキシ(2-アミノ)-ピリミジン類：ブピリメート；

F. IV) 細胞分裂及び/又は細胞骨格の阻害剤

F. IV-1) チューブリン阻害剤：ベンゾイミダゾール及びチオファナート：ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファナート-メチル；

トリアゾロピリミジン類：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

30

F. IV-2) 他の細胞分裂阻害剤

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

F. IV-3) アクチン阻害剤：ベンゾフェノン類：メトラフェノン；

F. V) アミノ酸及びタンパク質合成の阻害剤

F. V-1) メチオニン合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン類)

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

F. V-2) タンパク質合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン類)

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

40

F. VI) シグナル伝達阻害剤

F. VI-1) MAP/ヒスチジンキナーゼ阻害剤(例えば、アニリノ-ピリミジン類)

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

フェニルピロール類：フェンピクロニル、フルジオキシニル；

F. VI-2) Gタンパク質阻害剤：キノリン類：キノキシフェン；

F. VII) 脂質及び膜合成阻害剤

F. VII-1) リン脂質生合成阻害剤

有機リン化合物：エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス；

50

ジチオラン類：イソプロチオラン；

F.VII-2) 脂質過酸化反応

芳香族炭化水素類：ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクロホス-メチル、ピフェニル、クロロネブ、エトリジアゾール；

F.VII-3 カルボキシル酸アミド(CAA殺菌剤)

桂皮酸アミド又はマンデル酸アミド類：ジメトモルフ、フルモルフ、マンジプロパミド、ピリモルフ；

バリンアミドカーバメート類：ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、ピリベンカルブ、バリフェナレート(valifenalate)、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；

10

F.VII-4) 細胞膜透過性及び脂肪酸に作用する化合物

カーバメート類：プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩

F.VIII) Multi部位作用を有する阻害剤

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

F.VIII-2) チオ-及びジチオカーバメート類：ファーバム、マンコゼブ、マネブ、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、プロピネブ、チラム、ジネブ、ジラム；

F.VIII-3) 有機塩素化合物(例えば、フタルイミド、スルファミド、クロロニトリル類)：アニラジン、クロロタロニル、カプタホール、カプタン、フォルベット、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、フルスルファミド、ヘキサクロロベンゼン、ペンタクロロフェノール及びその塩、フタリド、トリルフルアニド、N-(4-クロロ-2-ニトロ-フェニル)-N-エチル-4-メチル-ベンゼンスルホンアミド；

20

F.VIII-4) グアニジン類：グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン-アセテート、イミノクタジン、イミノクタジン-トリアセテート、イミノクタジン-トリス(アルベシレート)；

F.VIII-5) アントラキノン類：ジチアノン；

F.IX) 細胞壁合成阻害剤

F.IX-1) グルカン合成阻害剤：バリダマイシン、ポリオキシシンB；

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

30

F.X) 植物防御誘導剤

F.X-1) サリチル酸経路：アシベンゾラル-S-メチル；

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

ホスホネート類：ホセチル、ホセチル-アルミニウム、亜リン酸及びその塩；

F.XI) 未知の作用機序：

プロノポール、キノメチオナート、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコート-硫酸メチル、ジフェニルアミン、フルメトパール、フルスルファミド、フルチアニル、メタスルホカルブ、オキシシン銅、プロキナジド、テブフロキン、テクロフタラム、トリアゾキシド、2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン、N-(シクロプロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロメトキシ-2,3-ジフルオロ-フェニル)-メチル)-2-フェニルアセトアミド、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-

40

50

1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル-チアゾール-4-カルボン酸 メチル-(R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル-アミド、メトキシ酢酸 6-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、及びN-メチル-2-{1-[(5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]-4-チアゾールカルボキサミド、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3 イル]-ピリジン、ピリソキサゾール(pyrisoxazole)、5-アミノ-2-イソプロピル-3-オキソ-4-オルト-トリル-2,3-ジヒドロ-ピラゾール-1 カルボチオ酸 S-アリルエステル、N-(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)シクロプロパン-カルボン酸アミド、5-クロロ-1 (4,6-ジメトキシ-ピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール、2-(4-クロロ-フェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-イソオキサゾール-5-イル]-2-プロパ-2-イニルオキシ-アセトアミド；

10

F.XI) 成長調節剤：

アブシジン酸、アミドクロル、アンシミドール、6-ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、ブトラリン、クロルメコート(塩化クロルメコート)、塩化コリン、シクラニリド、ダミノジド、ジケグラク、ジメチピン、2,6-ジメチルプリジン、エテホン、フルメトラリン、フルルプリミドール、フルチアセト、フォルクロルフエヌロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール-3-酢酸、マレインヒドラジド、メフルイジド、メピコート(塩化メピコート)、ナフタレン酢酸、N 6 ベンジルアデニン、パクロブトラゾール、プロヘキサジオン(プロヘキサジオン-カルシウム)、プロヒドロジャスモン、チジアズロン、トリアペンテノール、トリブチルホスホロチオエート、2,3,5 トリヨード安息香酸、トリネキサパ

20

F.XII) 生物学的防除剤

抗真菌性生物防除剤：NRRL No. B-21661のバチルス・サブチリス株(例えば、RHAPSODY(登録商標)、SERENADE(登録商標) MAX及びSERENADE(登録商標) ASO、AgraQuest, Inc., USA. 製)、NRRL No. B-30087のバチルス・プミルス株(例えば、SONATA(登録商標)及びBALLAD(登録商標) Plus、AgraQuest, Inc., USA製)、ウロクラジウム・オウデマンシイ(Ulocladium oudemansii)(例えば、製品BOTRY-ZEN、BotriZen Ltd., New Zealand製)、キトサン(例えば、ARMOUR-ZEN、BotriZen Ltd., New Zealand製)。

【0119】

無脊椎有害生物(「動物有害生物」とも呼ばれる)、即ち、昆虫、蜘蛛類及び線虫、植物、植物が成長している又は成長し得る土壌又は水は、本発明の化合物又はそれらを含む組成物と、当技術分野において知られている任意の施用方法によって接触させることができる。こうした場合、「接触」には、直接接触(該化合物/組成物を直接、無脊椎有害生物又は植物に、通常は植物の葉、茎又は根に施用すること)及び間接触(該化合物/組成物を、無脊椎有害生物又は植物の居場所に施用すること)の両方が含まれる。

30

【0120】

本発明の化合物、又はそれらを含む殺有害生物組成物は、植物/作物と本発明の殺有害生物有効量とを接触させることによって、成長している植物及び作物を動物有害生物、特に昆虫、コナダニ類又は蜘蛛類による攻撃又は寄生から保護するために使用することができる。「作物」という語は、成長している作物及び収穫された作物の両方を指す。

40

【0121】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、種々の栽培植物、例えば、穀物、根作物、油料作物、野菜、スパイス、観賞植物、例えばデューラム及び他の小麦、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ(飼料トウモロコシ及びサトウキビ/スイートコーン及び畑作トウモロコシ)、大豆、油料作物、アブラナ科植物、綿、ヒマワリ、バナナ、米、アブラナ、カブ、サトウダイコン、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、草、芝生、芝、飼料草、トマト、ニラ、カボチャ/スカッシュ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ属(Brassica)の種、メロン、豆、エンドウ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えばジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ツクバネアサガオ、ゼラニウム/ペラルゴニウム、パンジー及びハウセンカの種子上の多数の昆虫を防除する

50

のに特に重要である。

【0122】

本発明の化合物は、そのまま又は組成物の形態で、昆虫、又は昆虫の攻撃から保護される植物、植物繁殖材料（例えば種子）、土壌、表面、材料若しくは部屋を活性化化合物の殺虫有効量で処理することにより用いられる。施用は、植物、植物繁殖材料（例えば種子）、土壌、表面、材料又は部屋に昆虫が寄生する前と後の両方に行うことができる。

【0123】

更に、無脊椎有害生物は、標的有害生物、その食物供給、生息地、繁殖地又はその居場所と、本発明の化合物の殺有害生物有効量とを接触させることによって防除することができる。こうした場合、施用は、居場所、成長している作物又は収穫された作物に有害生物が寄生する前又は後に実施することができる。

10

【0124】

本発明の化合物はまた、有害生物の発生が予想される場所に予防的に施用することも可能である。

【0125】

本発明の化合物は、植物と本発明の化合物の殺有害生物有効量とを接触させることによって、成長している植物を有害生物による攻撃又は寄生から保護するために使用することもできる。こうした場合、「接触」には、直接接触（該化合物/組成物を直接、有害生物及び/又は植物に、通常、植物の葉、茎又は根に施用すること）及び間接接触（該化合物/組成物を、有害生物及び/又は植物の居場所に施用すること）の両方が含まれる。

20

【0126】

「居場所」は、有害生物又は寄生虫が成長するか又は成長し得る生息地、繁殖地、植物、種子、土壌、領域、材料又は環境を意味する。

【0127】

一般に「殺有害生物有効量」は、壊死、死滅、遅延、予防、及び除去、破壊、又はそれ以外では標的生物の発生及び活性を減少させることの効果を含めて、成長に対して観察可能な効果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/組成物に関して変動し得る。該組成物の殺有害生物有効量は、所望の殺有害生物の効果及び持続期間、天候、標的種、居場所及び施用様式などの一般条件によっても変動する。

30

【0128】

土壌処理、又は有害生物の居場所又は巣に施用する場合、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の範囲である。

【0129】

材料の保護における通常の施用量は、例えば、処理される材料1m²当たり活性化化合物が0.01g～1000g、望ましくは1m²当たり0.1g～50gである。

【0130】

材料の含浸に使用するための殺虫組成物は、通常、少なくとも1種の忌避剤及び/又は殺虫剤を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%含有する。

【0131】

作物植物を処理する際に使用するために、本発明の活性成分の施用量は、1ヘクタール当たり0.1g～4000g、望ましくは1ヘクタール当たり25g～600g、より望ましくは1ヘクタール当たり50g～500gの範囲であってよい。

40

【0132】

本発明の化合物は、接触（土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物部分又は動物部分を介する）、及び摂取（餌又は植物部分）の両方を介して有効である。

【0133】

本発明の化合物は、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギ又はゴキブリなどの非作物害虫に対して施用することもできる。前記非作物害虫に対する使用のため、本発明の化合物は、好ましくは餌組成物中に使用される。

50

【0134】

該餌は、液体、固体又は半固体の調製物(例えばゲル)であってよい。固体餌は、それぞれの施用に適した様々な形及び形態、例えば粒剤、ブロック、スティック、ディスクに形成することができる。液体餌は、適正な施用を確実にするための様々な装置、例えば開口容器、スプレー装置、液滴供給源、又は蒸発供給源に充填することができる。ゲルは水性又は油性のマトリクスに基づくことができ、粘着性、水分保持又はエージング特性の点から特別な必需品に製剤化することができる。

【0135】

該組成物に用いられる餌は、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギなど、又はゴキブリなどの昆虫にそれを食べるよう煽るのに十分誘引性のある生成物である。誘引性は、摂食刺激物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。食物の刺激物は、例えば、これらに限られているわけではないが、動物及び/若しく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/若しくは植物由来の脂肪及び油、又はモノ、オリゴ若しくはポリ有機糖類から、特にスクロース、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さえからも選択される。果実、作物、植物、動物、昆虫、又はそれらの特異的部分の新鮮部分若しくは腐敗部分も、摂食刺激物として役に立ち得る。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に記載されており、当業者に知られている。

【0136】

餌組成物中に使用するために、活性成分の通常の含有量は、0.001~15重量%、望ましくは0.001~5重量%の活性成分である。

【0137】

エアゾル(例えばスプレー缶中)、油スプレー剤又はポンプスプレーとしての本発明の化合物の製剤は、非専門家利用者にとってハエ、ノミ、マダニ、蚊又はゴキブリなどの有害生物を防除するのに非常に適している。エアゾル処方は、好ましくは、該活性化合物、溶媒、例えば低級アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール)、ケトン(例えばアセトン、メチルエチルケトン)、およそ50~250の沸点範囲を有するパラフィン炭化水素(例えば灯油)、ジメチル-ホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素、例えばトルエン、キシレン、水、更に助剤、例えば乳化剤、例えばソルビトールモノオレエート、エチレンオキシド3mol~7molを有するオレイルエトキシレート、脂肪アルコールエトキシレート、香油、例えば芳香油、低級アルコールとの中脂肪酸のエステル、芳香族カルボニル化合物、適切な場合、安息香酸ナトリウムなどの安定剤、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチル、並びに必要であれば噴霧剤、例えばプロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素又はこれらのガスの混合物から構成される。

【0138】

油スプレー製剤は、噴霧剤が使用されない点でエアゾール処方と異なる。

【0139】

スプレー組成物中に使用するために、活性成分の含有量は、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。

【0140】

本発明の化合物及びそれらのそれぞれの組成物は、蚊及び燻蒸コイル、スモークカートリッジ、気化器プレート又は長時間気化器に、及びモスペーパー、モスパッド又は他の熱非依存性気化器システムにも使用することもできる。

【0141】

昆虫によって伝染した感染症(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、並びにリーシュマニア症)を、本発明の化合物及びそのそれぞれの組成物で防除する方法は、小屋及び家屋の表面の処理、カーテン、テント、衣料品、蚊帳又はツェツェエトラップなどのエアースプレー及び含浸も含む。線維、織物、メリヤス、不織布、網材

10

20

30

40

50

料又はホイル、及びターポリンに施用するための殺虫組成物は、好ましくは、殺虫剤、任意選択により忌避剤及び少なくとも1種のバインダーを含める混合物を含む。適切な忌避剤は、例えば、N,N-ジエチル-メタ-トルアミド(DEET)、N,N-ジエチルフェニルアセトアミド(DEPA)、1-(3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル)-2-メチルピペリン、(2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)酢酸ラクトン、2-エチル-1,3-ヘキサンジオール、インダロン(indalone)、メチルネオデカンアミド(MNDA)、{(+/-)-3-アリル-2-メチル-4-オキソシクロペンタ-2-(+)-エニル-(+)-trans-クリサンテメート(Esbiothrin)など昆虫防除のために使用されないピレスロイド、リモネン、オイゲノール、(+)-ユーカマロール(Eucamamol)(1)、(-)-1-epi-ユーカマロールのような植物抽出物由来の若しくは同一の忌避剤、又はユーカリプツス・マクラータ(*Eucalyptus maculata*)、ビテックス・ロツンジフォリア(*Vitex rotundifolia*)、シンボポガン・マルチニ(*Cymbopogon martinii*)、シンボポガン・シトラツス(*Cymbopogon citratus*) (レモングラス)、シモポガン・ナルツズス(*Cymbopogon nardus*) (シトロネラ)のような植物由来の粗製植物抽出物である。適切なバインダーは、例えば、脂肪酸のビニルエステルのポリマー及びコポリマー(酢酸ビニル及びビニルベルサテート(versatate)など)、ブチルアクリレート、2-エチルヘキシルアクリレート及びアクリル酸メチルなどアルコールのアクリル及びメタクリル酸エステル、スチレンなどのモノ及びジエチレン性不飽和炭化水素、並びにブタジエンなどの脂肪族ジエンから選択される。

【0142】

カーテン及び蚊帳の含浸は、一般に、織物材料を殺虫剤のエマルジョン又は分散液中に浸すこと、又はそれらを網の上にスプレーすることによって行われる。

【0143】

本発明の化合物及びそれらの組成物は、樹木、板塀、枕木などの木製材料、及び家屋、納屋、工場などの建物、更に構成材料、家具、なめし革、繊維、ビニル物品、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に、並びにアリ及びシロアリが作物又はヒトに害を与えること(例えば、有害生物が家屋及び公共施設に侵入する場合)を防止するために使用することができる。本発明の化合物は、木製材料を保護するために周囲の土壌表層又は床下土壌中に施用されるだけでなく、床下コンクリート、床柱、梁、合板、家具などの表面などの製材品、パーティクルボード、ハーフボードなどの木製物品、及び被覆電線、ビニルシートなどのビニル物品、スチレンフォームなどの熱絶縁材料にも施用することができる。作物又はヒトに害を与えるアリに対して施用する場合、本発明のアリ制御器は、作物又は周囲の土壌に施用されるか、又はアリの巣などに直接施用される。

【0144】

本発明の化合物は、それらを害虫から、特に土壌の害虫から保護し、生じる植物の根及びシュートを土壌の有害生物や葉の昆虫から保護するための植物繁殖材料、特に種子の処理にも適する。

【0145】

本発明の化合物は種子を土壌の有害生物から保護し、生じる植物の根及びシュートを土壌の害虫や葉に付く虫から保護するために特に有用である。生じる植物の根及びシュートの保護が好ましい。生じる植物のシュートを穿刺性又は吸汁性昆虫から保護することがより好ましく、アブラムシからの保護が最も好ましい。

【0146】

従って、本発明は、種子を昆虫、特に土壌の昆虫から、及び苗木の根及びシュートを昆虫、特に土壌及び葉の昆虫から保護する方法を含み、該方法は、播種前及び/若しくは予備発芽(pregermination)後の種子を本発明の化合物(その塩を含む)と接触させることを含む。特に好ましいのは、植物の根及びシュートを保護する方法であり、より好ましいのは、植物のシュートを穿刺性又は吸汁性昆虫から保護する方法であり、最も好ましいのは、植物のシュートをアブラムシから保護する方法である。

【0147】

「種子」という語は全ての種類の植物の種子及び繁殖体を包含し、そのような物としては、限定はされないが、真の種子、種子片、吸根、球茎、球根、果実、塊茎、穀粒、挿し

10

20

30

40

50

苗、切断されたシュートなどが含まれ、好ましい実施形態においては、真の種子を意味する。

【0148】

「種子の処理」という語は当業界で既知の適切な種子処理技法を全てを含んでおり、例えば、種子粉衣、種子コーティング、種子散粉、種子浸漬及び種子ペレット化が挙げられる。

【0149】

本発明はまた、活性化化合物でコーティングされた、又は活性化化合物を含有する種子も含む。

【0150】

「でコーティングされた、及び/又はそれを含有する」の語は、一般に、施用時に活性成分が繁殖生成物の表面の大部分にあることを示すが、施用方法によっては、成分のより大きいか又はより少ない部分が繁殖生成物中に浸透してもよい。繁殖生成物が(再び)植えられるときに、それは活性成分を吸収することができる。

【0151】

適する種子は、穀物、根作物、油料作物、野菜、スパイス、観賞植物の種子、例えばデュラム及び他の小麦、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ(飼料トウモロコシ及びサトウキビ/スイートコーン及び畑作トウモロコシ)、大豆、油料作物、アブラナ科植物、綿、ヒマワリ、バナナ、米、アブラナ、カブ、サトウダイコン、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、草、芝生、芝、飼料草、トマト、ニラ、カボチャ/スカッシュ、キャベツ、アイ

【0152】

さらに、活性化化合物は、遺伝子操作方法を含む育種のために除草剤又は殺菌剤又は殺虫剤の作用に耐える植物からの種子の処理のために用いることもできる。

【0153】

例えば、活性化化合物は、スルホニル尿素、イミダゾリノン、グルホシネート-アンモニウム又はグリホサート-イソプロピルアンモニウム及び類似した活性物質からなる群の除草剤に抵抗性である植物からの種子の処理(例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246、WO 92 00377、EP-A-0257993、US 5,013,659号を参照)、又は、植物を特定の害虫に抵抗性にするバシルス・ツリングエンシス毒素(Bt毒素)を生成する能力を有する、遺伝子導入作物植物、例えば綿(EP-A-0142924、EP-A-0193259)で用いることができる。

【0154】

さらに、活性化化合物は、例えば従来の育種方法及び/又は突然変異体の生成によって、又は組換え手法によって生成することができる、既存の植物構成と比較して改変された特性を有する植物からの種子の処理のために用いることもできる。例えば、植物で合成されるデンプンを改変する目的で、作物植物の組換え改変(例えばWO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)、又は改変脂肪酸組成を有する遺伝子導入作物植物(WO 91/13972)のいくつかの例が記載されている。

【0155】

活性化化合物の種子処理の適用は、植物の播種前、及び植物の出芽前に種子にスプレーするか又は散粉することによって行われる。

【0156】

種子処理に特に有用な組成物は、例えば以下のものである：

A 液剤(SL、LS)

D エマルション製剤(EW、EO、ES)

E 懸濁製剤(SC、OD、FS)

F 顆粒水和剤及び顆粒水溶剤(WG、SG)

10

20

30

40

50

G 水和剤及び水溶剤(WP、SP、WS)

H ゲル製剤(GF)

I 粉剤(DP、DS)

通常の種子処理用の製剤には、例えば、フロアブル剤FS、液剤LS、乾式処理用粉剤DS、スラリー処理用水和剤WS、水溶剤SS、エマルジョン製剤ES及びEC、ゲル製剤GFが挙げられる。これらの製剤は希釈して又は希釈しないで種子に施用することができる。種子への施用は、播種前に、種子に直接行うか、又は予備発芽した後に行う。

【0157】

好ましい実施形態において、FS製剤は種子処理のために使用される。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のバインダー、0~200g/Lの顔料、及び溶媒、好ましくは最大で1リットルまでの水を含むことができる。

10

【0158】

特に好ましい種子処理のための本発明の化合物の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、20重量%以下、例えば5~20重量%の凍結防止剤、0~15重量%、例えば、1~15重量%の含量及び/又は染料、0~40重量%、例えば、1~40重量%のバインダー(粘着剤/接着剤)、場合によって5重量%以下、例えば0.1~5重量%の増粘剤、場合によって0.1~2重量%の消泡剤、及び場合によって、殺生物剤、酸化防止剤などの保存料(例えば、0.01~1重量%の量)、並びに最大100重量%までの充填剤/媒体を含有する。

20

【0159】

種子処理製剤は、さらに、バインダー及び場合によって着色剤を含むこともできる。

【0160】

バインダーを添加することで、処理後に種子上の活性材料の付着を改善することができる。適切なバインダーは、エチレンオキシド又はプロピレンオキシドのようなアルキレンオキシド由来のホモ-及びコポリマー、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン及びそれらのコポリマー、エチレン酢酸ビニルコポリマー、アクリル酸ホモ-及びコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミド及びポリエチレンジイミン、セルロース、チロース及びデンプンのような多糖類、オレフィン/無水マレイン酸コポリマーのようなポリオレフィンホモ-及びコポリマー、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンホモ及びコポリマーである。

30

【0161】

場合によって、着色剤も製剤に含めることができる。種子処理製剤のための適切な着色剤又は染料は、ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112、C.I.ソルベントレッド1、ピグメントブルー15:4、ピグメントブルー15:3、ピグメントブルー15:2、ピグメントブルー15:1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48:2、ピグメントレッド48:1、ピグメントレッド57:1、ピグメントレッド53:1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108である。

40

【0162】

ゲル化剤の例は、カラギーン(carrageen)(Satiagel(登録商標))である。

【0163】

種子処理において、本発明の化合物の施用量は、一般に種子100kg当たり0.1g~10kg、好ましくは種子100kg当たり1g~5kg、より好ましくは種子100kg当たり1g~1000g、特に種子100kg当たり1g~200gである。

【0164】

50

従って、本発明は、さらに、本発明の化合物(本明細書に定義されるその農業的に有用な塩を含む)を含む種子に関する。本発明の化合物(その農業的に有用な塩を含む)の量は、一般に、種子100kg当たり0.1g~10kg、好ましくは種子100kg当たり1g~5kg、特に種子100kg当たり1g~1000gで変化する。レタスなどの特定の作物について、その量はより高くすることができる。

【0165】

種子を処理するために使用し得る方法は、原則として、あらゆる適切な種子処理であり、特に当技術分野で公知の種子粉衣技術、例えば種子コーティング(例えば種子ペレット化)、種子散粉及び種子吸水(例えば種子浸漬)などである。本明細書において、「種子処理」とは、種子と本発明の化合物とを互いに接触させるあらゆる方法を指し、また「種子粉衣」とは、種子に規定量の本発明の化合物を提供する(すなわち、本発明の化合物を含む種子を生じさせる)種子処理の方法を指す。原則的に、この処理は、種子の収穫から種子の播種までいつでも種子に適用することができる。種子は、例えば「プランターボックス(planter's box)」法を用いて、種子の栽植直前に、又は栽植時に処理することができる。しかし、この処理は、実質的な有効性の低下を認めることなく、種子の栽植の数週間又は数か月前(例えば12か月前まで)に、例えば種子粉衣処理の形態で行ってもよい。

10

【0166】

便宜的には、未播種の種子に対して処理を適用する。本明細書中で用いられる「未播種の種子」という語は、種子の収穫時から、植物を発芽させて成長させるために種子を地中に播種するまでの任意の時期の種子を包含することを意味する。

20

【0167】

具体的には、適切な装置(例えば固体又は固体/液体混合パートナー用の混合装置)中で、種子を、所望量のそのままの、又は予め水で希釈した後の種子処理製剤と、組成物が種子上に均一に分配されるまで混合するという処理で手順が行われる。適切な場合、その後乾燥ステップを行う。

【実施例】

【0168】

A. 調製例

出発原料の適切な修飾について、以下の合成例に記載されている手順を更なる化合物Iを調製するために使用した。この方法で得られる化合物は、物理データと一緒に以下の表において列挙されている。

30

【0169】

生成物は、融点測定により、NMRスペクトル法により、又はHPLC-MS又はHPLC分光法により測定される質量($[m/z]$)又は保持時間(RT; [分])によって特徴づけた。

【0170】

HPLC-MS =高速液体クロマトグラフィー質量分析

HPLC法:

方法1:

RP-18カラム(Merck KgaA、ドイツからのChromolith(登録商標)Speed ROD)、50×4.6 mm; 移動相: アセトニトリル+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)/水+0.1% TFA(5:95~100:0の勾配を1.8ml/分の流量で40 で5分間用いた)

40

方法2:

Phenomenex Kinetex 1.7 μm XB-C18 100A; 50×2.1mm; 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%のBを1.50分; 100%のBを0.20分; 流量:0.8~1.0ml/分で60 で1.50分; MS:四重極エレクトロスプレーイオン化、80V(ポジティブモード)

方法3:

カラム:CHIRALPAK(登録商標)IA 5 μm-250×4.6mm; 移動相:ヘプタン/ジクロロメタン/エタノール/ジエチルアミン 50/50/1/0.1; 流量:1ml/分; 検出:UV280nm; 25

方法4:

50

カラム:CHIRALPAK(登録商標)IC 5 μ m-250 \times 4.6mm;移動相:エタノール/メタノール 50/50;流量:0.7ml/分;検出:UV280nm;25

実施例1: 5-メチル-1-(2,2,2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチル-エチル)-1H-ピラゾール-4-カルボン酸ピリダジン-4-イルアミド[I-34]の調製

10mlのCH₂Cl₂中の398mgの5-メチル-1-[2,2,2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ピラゾール-4-カルボニルクロリドの溶液を、30mlのCH₂Cl₂中の185mgのピリダジン-4-アミン及び750mgのトリエチルアミンの溶液に0 で滴下して加えた。混合物を20~25 で約68時間攪拌し、25mlの酢酸エチルで希釈し、3 \times 15mlの飽和NH₄Cl水溶液で洗浄し、Mg SO₄で乾燥し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィー(CH₂Cl₂/MeOH)により精製すると、160mgの表題化合物が得られた(90%純度)。HPLC-MS(方法1):RT 2.278分、m/z [MH]⁺ 354 .1。

10

【 0 1 7 1 】

実施例2: 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-(トリフルオロメチル)エチル]ピラゾール-4-カルボキサミド[I-38]の調製

30mlのTHF中の300mgの5-メチル-1-[2,2,2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]ピラゾール-4-カルボン酸、127mgのN-メチルピリダジン-4-アミン、710mgのO-(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[HATU]及び220mgのトリエチルアミンの混合物を20~25 で約24時間攪拌した後、濃縮した。残渣を21mlのCH₂Cl₂に溶解し、3 \times 14mlの水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥した後、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィー(CH₂Cl₂/MeOH)により精製すると、130mgの表題化合物が得られた(90%純度)。HPLC-MS(方法1): RT 2.271分、m/z[MH]⁺ 368.1。

20

【 0 1 7 2 】

実施例3: エナンチオマーI-381及びI-382の分離を以下の条件下:カラム:CHIRALPAK(登録商標)AD-H 5 μ m-250 \times 30mm;移動相:二酸化炭素/エタノール90/10;流量:120ml/分;検出:UV 280nm;背圧:150バール;温度:25 で分取クロマトグラフィーにより行った。

2gの粗な材料I-377が、978mgの(+)-エナンチオマーI-381及び972mgの(-)-エナンチオマーI-382(それぞれ>99%ee)で得られた。

【 0 1 7 3 】

実施例4: エナンチオマーI-383及びI-384の分離を以下の条件下:CHIRALPAK(登録商標)IC 5 μ m-250 \times 30mm;移動相:二酸化炭素/エタノール70/30;流量:120ml/分;検出:UV 280nm;背圧:150バール;温度:25 で分取クロマトグラフィーにより行った。

30

2gの粗な材料I-373が、864mgの(+)-エナンチオマーI-383(98.4% ee)及び898mgの(-)-エナンチオマーI-384(98.0%ee)で得られた。

【表 2】

表 1-式 1 の化合物 (異性体 T-A)

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-1	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		H	1.599	1	244.1
I-2	O	N	H	CH ₃	CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1.553	1	338.1
I-3	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1.520	1	352.1
I-4	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.714	1	276.1
I-5	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.638	1	290.2
I-6	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	2.289	1	300.2
I-7	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	2.114	1	286.2
I-8	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	2.169	1	272.1
I-9	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	2.014	1	260.1
I-10	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	2.119	1	288.2
I-11	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1.941	1	274.2
I-12	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	2.383	1	286.2
I-13	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	2.306	1	300.2
I-14	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	2.459	1	314.2
I-15	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	2.105	1	286.2
I-16	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	1.876	1	272.1
I-17	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	CH ₃	H	2.098	1	332.2
I-18	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	CH ₃	H	2.229	1	346.2
I-19	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	1.984	1	258.1
I-20	O	N	H	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃	CH ₃	H	2.118	1	318.2
I-21	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H	1.643	1	288.1
I-22	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H	1.634	1	316.1

10

20

30

40

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)	
								RT [分]	方法 m/z [MH] ⁺
I-23	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		H	1.562	302.2
I-24	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.416	330.2
I-25	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1.965	290.2
I-26	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1.908	304.2
I-27	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.463	358.1
I-28	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	2.562	396.1
I-29	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	2.106	346.1
I-30	O	N	H	CH ₃	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	2.552	382.1
I-31	O	N	H	CH ₃	CF ₂ CHF ₂	CH ₃	H	2.144	332.1
I-32	O	N	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	1.817	271.1
I-33	O	N	CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	1.762	285.0
I-34	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CF ₃	H	2.278	354.1
I-35	O	N	H	CH ₃	CN	CH ₃	H	1.423	257.1
I-36	O	N	CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	H	1.401	271.1
I-37	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CF ₃	H	2.519	382.1
I-38	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CF ₃	H	2.271	368.1
I-39	O	N	H	CH ₃	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.910	290.1
I-40	O	N	CH ₃	CH ₃	1-F-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.838	304.1
I-41	O	N	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.436	288.2
I-42	O	N	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.398	302.2
I-43	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.509	332.2
I-44	O	C	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.282	287.2
I-45	O	C	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.139	301.2
I-46	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.532	316.2

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)	
								RT [分]	m/z [MH] ⁺
I-47	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.129	274.2
I-48	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.071	288.2
I-49	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.231	318.2
I-50	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.110	273.2
I-51	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	1.946	287.2
I-52	O	N	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.734	328.1
I-53	O	N	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.788	342.1
I-54	O	N	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.955	372.2
I-55	O	C	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.523	327.1
I-56	O	N	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.936	342.1
I-57	O	N	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	3.049	356.2
I-58	O	N	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	3.278	386.2
I-59	O	C	H	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.781	341.2
I-60	O	C	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.134	329.1
I-61	S	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.351	329.0
I-62	S	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.569	315.2
I-63	S	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.246	315.1
I-64	S	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.524	343.0
I-65	O	N	H	CH ₃	-CCl ₂ CH ₂ -		H	2.143	312.0
I-66	O	N	CH ₃	CH ₃	-CCl ₂ CH ₂ -		H	2.073	326.0
I-67	O	C	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.868	357.2
I-68	O	N	H	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.716	258.0
I-69	O	N	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.708	272.0
I-70	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.761	286.1

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理子一タ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-71	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	0.776	2	302.1
I-72	O	C	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.597	1	341.1
I-73	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H	0.727	2	315.1
I-74	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.525	1	271.1
I-75	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.466	1	285.1
I-76	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.647	1	299.2
I-77	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.669	1	315.1
I-78	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	0.613	2	298.2
I-79	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.866	2	342.2
I-80	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.797	2	314
I-81	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.767	2	327.2
I-82	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	0.831	2	311.1
I-83	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.783	2	313.2
I-84	O	C	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	0.809	2	324.1
I-85	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.806	2	328.1
I-86	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.833	2	341.1
I-87	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.944	2	372.2
I-88	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.884	2	358.2
I-89	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H	0.502	2	301.2
I-90	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H	0.497	2	300.1
I-91	O	C	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.848	2	357.2
I-92	O	N	CH ₃	CH ₃	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.584	1	311.1
I-93	O	N	H	CH ₃	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	1.739	1	297.1
I-94	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.504	1	270.1

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-95	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.108	1	274.1
I-96	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.063	1	288.1
I-97	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.946	2	318.1
I-98	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.838	2	302.4
I-99	O	C	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.030	1	273.1
I-100	O	C	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1.859	1	287.1
I-101	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	2.000	1	301.1
I-102	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	0.795	2	314.2
I-103	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.011	1	328.1
I-104	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.172	1	342.1
I-105	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.210	1	358.1
I-106	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.128	1	313.1
I-107	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	1.956	1	327.1
I-108	O	C	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	2.146	1	357.0
I-109	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃	H	1.307	1	284.0
I-110	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	2.596	1	368.1
I-111	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	2.719	1	382.1
I-112	O	N	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	1.075	2	412.2
I-113	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	2.775	1	398.1
I-114	O	N	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.948	2	354.2
I-115	O	C	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	0.812	2	371.4
I-116	O	C	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.842	2	321.1
I-117	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.842	2	335.2
I-118	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.899	2	349.2

10

20

30

40

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-119	O	N	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.866	2	322.1
I-120	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.874	2	336.2
I-121	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.923	2	350.3
I-122	O	C	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.917	2	353.2
I-123	O	C	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.917	2	367.1
I-124	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CF ₃	0.975	2	381.1
I-125	O	N	H	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.198	1	309.1
I-126	O	N	H	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.217	1	309.1
I-127	O	N	CH ₃	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.159	1	323.1
I-128	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.841	2	384.1
I-129	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.791	2	370.1
I-130	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.778	2	356.1
I-131	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	1.865	1	369.1
I-132	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.761	2	355.1
I-133	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.717	1	290.1
I-134	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.667	1	304.1
I-135	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	0.666	2	289.5
I-136	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	1.538	1	303.1
I-137	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	0.717	2	317.6
I-138	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	0.747	2	318.5
I-139	O	N	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	2.226	1	325.1
I-140	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	2.343	1	338.2
I-141	O	N	H	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.654	2	264.0
I-142	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.645	2	278.3

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-143	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.719	2	292.3
I-144	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	0.684	2	291.2
I-145	O	C	H	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	1.443	1	263.1
I-146	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃	H	1.008	1	277.1
I-147	O	N	CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.034	1	323.1
I-148	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.300	1	337.1
I-149	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.243	1	336.1
I-150	O	C	CH ₃	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.056	1	322.1
I-151	O	C	H	CH ₃	3-<PY>	CH ₃	H	1.124	1	308.1
I-152	O	C	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	2.275	1	310.1
I-153	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		CN	0.906	2	339.5
I-154	O	N	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.708 (A)	2	278.2
I-155	O	N	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.708 (A)	2	292.5
I-156	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.765 (A)	2	306.1
I-157	O	C	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.686 (A)	2	277.3
I-158	O	C	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.677 (A)	2	291.2
I-159	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.731 (A)	2	305.5
I-160	O	C	H	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	0.504	2	308.1
I-161	O	N	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.698 (B)	2	278.1
I-162	O	N	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.692 (B)	2	292.3
I-163	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.743 (B)	2	306.1
I-164	O	C	H	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.675 (B)	2	277.1
I-165	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	0.756 (S)	2	369.1
I-166	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		CF ₃	2.010 (S)	1	383.1

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-167	O	N	H	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.837	2	308.3
I-168	O	N	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.842	2	322.3
I-169	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.884	2	336.3
I-170	O	C	H	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.792	2	307.4
I-171	O	C	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.792	2	321.1
I-172	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	H	0.845	2	335.5
I-173	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.747	2	299.3
I-174	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0.773	2	332.3
I-175	O	N	H	CH ₃	<TP>-4	CH ₃	H	0.695	2	316.4
I-176	O	N	CH ₃	CH ₃	<TP>-4	CH ₃	H	0.690	2	330.5
I-177	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>-4	CH ₃	H	0.740	2	344.6
I-178	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>-4	CH ₃	H	0.721	2	343.3
I-179	O	C	H	CH ₃	<TP>-4	CH ₃	H	1.682	1	315.1
I-180	O	C	CH ₃	CH ₃	<TP>-4	CH ₃	H	0.664	2	329.3
I-181	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CN	0.625	2	283.0
I-182	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CN	0.634	2	269.1
I-183	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CN	0.679	2	297.0
I-184	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.656 (B)	2	305.4
I-185	O	C	CH ₃	CH ₃	CHFCH ₃	CH ₃	H	0.656 (B)	2	291.3
I-186	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.293	1	336.1
I-187	O	C	CH ₃	CH ₃	4-<PY>	CH ₃	H	1.088	1	322.1
I-188	O	N	H	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.611	2	309.3
I-189	O	N	CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.601	2	323.3
I-190	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.653	2	337.3

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-191	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.633	2	336.5
I-192	O	C	CH ₃	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.581	2	322.3
I-193	O	C	H	CH ₃	2-<PY>	CH ₃	H	0.592	2	308.3
I-194	O	N	CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	0.778	2	371.1
I-195	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	0.818	2	385.1
I-196	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.720	2	298.0
I-197	O	C	CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	0.761	2	370.1
I-198	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CN-c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.717	2	325.1
I-199	O	N	H	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.687	2	282.2
I-200	O	N	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.680	2	296.3
I-201	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.737	2	310.4
I-202	O	C	H	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.666	2	281.3
I-203	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.706	2	309.3
I-204	O	C	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	0.639	2	295.3
I-205	O	N	H	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.801	2	336.2
I-206	O	N	CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.800	2	350.2
I-207	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.845	2	364.4
I-208	O	C	H	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.787	2	335.3
I-209	O	C	CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.782	2	349.3
I-210	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.838	2	363.3
I-211	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.488	2	321.2
I-212	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.545	2	335.2
I-213	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ [C(O)CH ₃]CH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.605	2	343.2
I-214	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.603	2	336.2

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-215	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.511	2	307.2
I-216	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.523	2	308.2
I-217	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ -		H	0.511	2	322.2
I-218	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.686	2	290.1
I-219	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.693	2	276.1
I-220	O	N	H	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	1.961	1	357.1
I-221	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.677	2	275.1
I-222	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	(6-Cl-3-<PY>)CH ₂	CH ₃	H	1.986 (S)	1	384.2
I-223	O	C	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.666	2	289.1
I-224	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.676	2	303.1
I-225	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.914	2	316.4
I-226	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.909	2	302.3
I-227	O	C	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.873	2	301.5
I-228	O	C	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.881	2	315.5
I-229	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.953	2	329.4
I-230	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.716	2	317.2
I-231	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.731	2	318.1
I-232	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.785	2	346.2
I-233	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.736	2	332.2
I-234	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	0.962	2	330.5
I-235	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ SCH ₂ -		H	0.741	2	304.1
I-236	O	N	H	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.780	2	334.3
I-237	O	N	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.784	2	348.4
I-238	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.827	2	362.5

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-239	O	C	H	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.762	2	333.3
I-240	O	C	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.750	2	347.3
I-241	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -1,3-<OTL>-2	CH ₃	H	0.779	2	361.3
I-242	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.507	2	292.2
I-243	O	N	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.487	2	306.2
I-244	O	C	CH ₃	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.668	2	284.0
I-245	O	C	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₃	0.663	2	270.3
I-246	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.790	2	346.2
I-247	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.834	2	360.2
I-248	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₃)CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.777	2	332.1
I-249	O	N	H	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.815	2	330.4
I-250	O	N	CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.823	2	344.4
I-251	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.870	2	368.5
I-252	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.849	2	357.4
I-253	O	C	H	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.801	2	329.4
I-254	O	C	CH ₃	CH ₃	<TP>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.788	2	343.4
I-255	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.573	2	320.2
I-256	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ S(O)CH ₂ -		H	0.488	2	291.2
I-257	O	N	H	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	0.535	2	289.0
I-258	O	N	H	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.987	2	316.5
I-259	O	N	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.987	2	330.4
I-260	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1.035	2	344.6
I-261	O	C	H	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.946	2	315.4
I-262	O	C	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.959	2	329.5

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)	
								RT [分]	m/z [MH] ⁺
I-263	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH(CH ₂ CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1.024	343.6
I-264	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.875	288.3
I-265	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.868	302.3
I-266	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.915	316.2
I-267	O	C	H	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.841	287.4
I-268	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.835	301.4
I-269	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	0.899	315.4
I-270	O	N	CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.706	318.1
I-271	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.758	332.2
I-272	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.707	331.2
I-273	O	C	CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.680	317.2
I-274	O	N	H	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.708	304.1
I-275	O	C	H	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.693	303.1
I-276	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.850	328.1
I-277	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.859	342.0
I-278	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.917	356.1
I-279	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.834	327.3
I-280	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.842	341.2
I-281	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	0.903	355.3
I-282	O	N	H	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.740	314.4
I-283	O	N	CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.791	328.1
I-284	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.847	342.1
I-285	O	C	H	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.783	313.4
I-286	O	C	CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.768	327.3

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-287	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-<TN>	CH ₃	H	0.830	2	341.3
I-288	O	N	CH ₃	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	0.529	2	303.3
I-289	O	C	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N[C(O)CH ₃]CH ₂ CH ₂ -		H	0.610	2	328.3
I-290	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.838	2	353.4
I-291	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.893	2	352.4
I-292	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.885	2	338.3
I-293	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.931	2	366.6
I-294	O	C	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.863	2	351.3
I-295	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.912	2	365.4
I-296	O	C	H	CH ₃	CH ₂ OC ₆ H ₅	CH ₃	H	0.859	2	337.4
I-297	O	N	H	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.826	2	326.2
I-298	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.827	2	340.3
I-299	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.873	2	354.3
I-300	O	C	H	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.796	2	325.2
I-301	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	0.781	2	339.0
I-302	O	C	H	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	1.197	1	288.1
I-303	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(O)NHCH ₃	CH ₃	H	0.601	2	317.1
I-304	O	N	H	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.661	2	350.1
I-305	O	N	CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.665	2	364.1
I-306	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.719	2	378.1
I-307	O	C	H	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.653	2	349.1
I-308	O	C	CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.651	2	363.0
I-309	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-S(O) ₂ CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.706	2	377.2
I-310	O	C	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	2.877	1	355.1

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-311	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.730	2	331.2
I-312	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.764	2	345.2
I-313	O	N	H	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.603	2	336.0
I-314	O	N	CH ₃	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.574	2	350.0
I-315	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.666	2	364.0
I-316	O	C	H	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.584	2	335.0
I-317	O	C	CH ₃	CH ₃	1,1-<DOT>-3	CH ₃	H	0.544	2	349.0
I-318	O	N	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.816	2	286.2
I-319	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.870	2	314.2
I-320	O	C	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.790	2	285.2
I-321	O	C	CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.768	2	299.2
I-322	O	N	CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.827	2	354.1
I-323	O	N	H	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.840	2	364.3
I-324	O	N	CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.837	2	378.4
I-325	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.889	2	392.3
I-326	O	C	H	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.817	2	363.3
I-327	O	C	CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.812	2	377.4
I-328	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1,3-<DT>-2-CH ₂	CH ₃	H	0.873	2	391.4
I-329	O	N	H	CH ₃	CH ₂ OH	CH ₃	H	0.522	2	262.0
I-330	O	N	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N[C(O)CH ₃]CH ₂ CH ₂ -	CH ₃	H	0.624	2	329.1
I-331	O	N	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.849	2	346.1
I-332	O	N	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.854	2	360.5
I-333	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	0.908	2	374.4
I-334	O	N	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	H	0.695	2	299.0

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)	
								RT [分]	m/z [MH] ⁺
I-335	O	N	H	CH ₃	<TT>-3	CH ₃	H	0.745	304.0
I-336	O	N	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	H	0.698	313.1
I-337	O	N	CH ₃	CH ₃	<TT>-3	CH ₃	H	0.751	318.0
I-338	O	C	CH ₃	CH ₃	<TT>-3	CH ₃	H	0.724	317.0
I-339	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CN	CH ₃	H	0.754	327.2
I-340	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-<OTT>-3	CH ₃	H	0.635	348.0
I-341	O	N	H	CH ₃	<TZ>-2	CH ₃	H	0.680	315.0
I-342	O	N	CH ₃	CH ₃	<TZ>-2	CH ₃	H	0.678	329.0
I-343	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	<TZ>-2	CH ₃	H	0.726	343.1
I-344	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	0.808	342.1
I-345	O	N	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	0.760	314.1
I-346	O	N	CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.817	300.2
I-347	O	C	CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.795 (S)	353.1
I-348	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.883 (S)	368.1
I-349	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.848 (S)	367.1
I-350	O	N	H	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.831	340.1
I-351	O	N	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	H	0.752	328.1
I-352	O	N	H	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.820	318.0
I-353	O	N	CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.816	332.0
I-354	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.873	346.0
I-355	O	C	H	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.785	317.0
I-356	O	C	CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.793	331.0
I-357	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-SCH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.849	345.2
I-358	O	C	H	CH ₃	2,2-Cl ₂ -c-C ₃ H ₃	CH ₃	H	0.801	339.1

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)		
								RT [分]	方法	m/z [MH] ⁺
I-359	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.828 (S)	2	313.2
I-360	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	H	0.986	2	370.3
I-361	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	H	0.926	2	356.5
I-362	O	N	H	CH ₃	CF ₃	C(CH ₃) ₃	H	0.909	2	342.4
I-363	O	N	H	CH ₃	1-CF ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	2.417	1	340.1
I-364	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1-CF ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	2.535	1	368.2
I-365	O	N	CH ₃	CH ₃	1-CF ₃ -c-C ₃ H ₄	CH ₃	H	0.865	2	354.1
I-366	O	N	H	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.047	1	272.1
I-367	O	N	CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.028	1	286.2
I-368	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.728	2	314.1
I-369	O	N	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.025	1	300.1
I-370	O	N	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.798	2	328.1
I-371	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	2.133	1	316.2
I-372	O	N	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	2.483	1	344.1
I-373	O	C	CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.801	1	285.1
I-374	O	C	H	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.965	1	271.1
I-375	O	C	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.954	1	315.1
I-376	O	C	H	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	1.889	1	299.0
I-377	O	C	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	1.768	1	313.1
I-378	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	1.976	1	299.2
I-379	O	C	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	1.927	1	327.1
I-380	O	C	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	0.776	2	343.0
I-381	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	9.0 (E+)	3	
I-382	O	N	CH ₃	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	10.7 (E-)	3	

10

20

30

40

No.	T	U	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	物理データ (HPLC / MS)	
								RT [分]	方法
I-383	O	N	CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	12.1 (E-)	4
I-384	O	N	CH ₃	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	H	13.5 (E+)	4

略語:

<DOT>: ジオキソチエタニル
 <DT>: ジチアニル
 <OTL>: オキサチオラニル

<OTT>: オキソチエタニル
 <PY>: ピリジル
 <TN>: チエニル

<TP>: テトラヒドロピラニル
 <TT>: チエタニル
 <TZ>: チアゾリル

(A), (B): それぞれジアステレオマー A 及び B
 (S): トリフルオロ酢酸塩
 (E+): (+)-エナンチオマー
 (E-): (-)-エナンチオマー

B. 生物学的実施例

本発明の式Iの化合物の活性は、下記の生物試験において実証及び評価できた。

【0175】

特記しない限り、試験溶液は以下の通りに調製した：

活性化化合物を所望の濃度の1:1(vol:vol)の蒸留水:アセトンの混合物に溶解した。試験溶液は、一般にppm(wt/vol)の濃度で使用する日に調製した。

【0176】

B.1 ササゲアブラムシ(アフィス・クラシボラ(*Aphis craccivora*))

様々な段階の100~150匹のアブラムシでコロニー形成された鉢植えのササゲ植物に、有害生物集団を記録した後でスプレーした。集団減少を24時間後、72時間後及び120時間後に評価した。

10

【0177】

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-40、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-50、I-51、I-52、I-53、I-54、I-55、I-56、I-57、I-58、I-59、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-65、I-66、I-67、I-68、I-69、I-70、I-71、I-72、I-74、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-82、I-83、I-84、I-85、I-86、I-87、I-88、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-108、I-109、I-110、I-111、I-112、I-113、I-114、I-115、I-116、I-117、I-118、I-119、I-120、I-121、I-122、I-123、I-124、I-125、I-126、I-127、I-128、I-129、I-130、I-131、I-132、I-133、I-134、I-135、I-136、I-137、I-138、I-139、I-140、I-141、I-142、I-143、I-144、I-145、I-146、I-147、I-148、I-149、I-150、I-151、I-152、I-153、I-154、I-155、I-156、I-157、I-158、I-159、I-160、I-161、I-162、I-163、I-164、I-166、I-167、I-168、I-169、I-170、I-171、I-172、I-173、I-174、I-175、I-176、I-177、I-178、I-179、I-180、I-181、I-182、I-183、I-184、I-185、I-186、I-187、I-188、I-189、I-190、I-191、I-192、I-193、I-194、I-195、I-196、I-197、I-198、I-199、I-200、I-201、I-202、I-203、I-204、I-205、I-211、I-212、I-214、I-215、I-216、I-218、I-219、I-220、I-221、I-222、I-223、I-224、I-230、I-231、I-232、I-233、I-235、I-236、I-237、I-238、I-239、I-240、I-241、I-244、I-245、I-246、I-247、I-249、I-250、I-251、I-252、I-253、I-254、I-255、I-256、I-257、I-258、I-259、I-260、I-261、I-262、I-263、I-264、I-265、I-266、I-267、I-268、I-269、I-270、I-271、I-272、I-273、I-274、I-275、I-276、I-277、I-278、I-279、I-280、I-281、I-282、I-283、I-284、I-285、I-286、I-287、I-288、I-289、I-290、I-291、I-292、I-293、I-294、I-295、I-296、I-297、I-298、I-299、I-300、I-301、I-302、I-303、I-304、I-305、I-306、I-307、I-308、I-309、I-310、I-311、I-312、I-313、I-314、I-315、I-316、I-317、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及びI-384は、500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

20

30

40

【0178】

B.2 ワタアブラムシ(アフィス・ゴシピ(*Aphis gossypii*))、混合生命段階)

活性化化合物を、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、それらを、原液とし、より低い希釈液を1:1(vol/vol)の水:アセトンで作製した。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。

【0179】

子葉段階における綿植物に、アブラムシの主コロニーからの酷く寄生された葉を各子葉の上部に置くことによって処理前に寄生させた。アブラムシを終夜移動させることで、1

50

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、スプレーヤーから除去し、次いで成長室内で蛍光灯下、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死亡率に対する処理された植物上のアブラムシの死亡率を5日後に決定した。

【0180】

この試験において、化合物I-1、I-4、I-5、I-6、I-7、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-35、I-36、I-38、I-39、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-51、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-66、I-67、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-83、I-85、I-87、I-88、I-90、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-109、I-112、I-114、I-115、I-116、I-117、I-118、I-119、I-120、I-121、I-125、I-129、I-131、I-133、I-134、I-135、I-136、I-137、I-138、I-140、I-141、I-142、I-143、I-144、I-145、I-147、I-148、I-149、I-150、I-151、I-152、I-155、I-157、I-166、I-167、I-168、I-169、I-170、I-173、I-174、I-181、I-182、I-183、I-184、I-185、I-186、I-188、I-189、I-190、I-191、I-192、I-193、I-195、I-196、I-197、I-198、I-199、I-200、I-201、I-202、I-203、I-204、I-205、I-211、I-212、I-232、I-233、I-238、I-265、I-271、I-277、I-290、I-300、I-302、I-307、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及びI-384は、10ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0181】

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

活性化化合物を、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、それらを、原液とし、より低い希釈液を1:1(vol/vol)の水:アセトンで作製した。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。

【0182】

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取り付けた自動静電植物噴霧器で噴霧した。植物をスプレーヤードラフトチャンバー内で乾燥させ、スプレーヤーから除去した。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)を入れた。これらの虫は、アスピレータと、バリエーピ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壌に穏やかに挿入し、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%の成長室中で3日間保持した。死亡率は、処理の3日後に未処理の対照植物と比較して、評価した。

【0183】

この試験において、化合物I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-18、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-35、I-39、I-43、I-46、I-61、I-63、I-67、I-68、I-76、I-79、I-85、I-87、I-88、I-90、I-91、I-92、I-93、I-94、I-96、I-97、I-98、I-102、I-103、I-104、I-105、I-109、I-113、I-115、I-128、I-129、I-133、I-135、I-137、I-138、I-139、I-142、I-143、I-144、I-145、I-146、I-148、I-149、I-153、I-155、I-157、I-167、I-168、I-169、I

-173、I-177、I-181、I-182、I-183、I-184、I-188、I-190、I-198、I-201、I-202、I-204、I-238、I-260、I-266、I-277、I-292、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-376、I-377、I-379及びI-380は、10ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0184】

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

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

【0185】

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。死亡率を元気な増殖アブラムシに基づいて評価した。アブラムシの死亡率及び繁殖力を次いで視覚的に評価した。

10

【0186】

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-38、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-51、I-52、I-53、I-54、I-55、I-57、I-58、I-59、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-65、I-66、I-67、I-68、I-69、I-70、I-71、I-72、I-74、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-82、I-83、I-84、I-85、I-86、I-87、I-88、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-108、I-109、I-112、I-113、I-114、I-115、I-116、I-117、I-118、I-119、I-120、I-121、I-122、I-123、I-124、I-125、I-126、I-127、I-128、I-129、I-130、I-131、I-132、I-133、I-134、I-135、I-136、I-137、I-138、I-140、I-141、I-142、I-143、I-144、I-145、I-146、I-152、I-154、I-155、I-156、I-157、I-158、I-159、I-161、I-162、I-163、I-164、I-165、I-166、I-173、I-174、I-181、I-182、I-183、I-184、I-185、I-194、I-195、I-196、I-197、I-218、I-219、I-220、I-221、I-222、I-223、I-224、I-225、I-226、I-227、I-228、I-229、I-230、I-231、I-232、I-233、I-234、I-242、I-244、I-245、I-246、I-247、I-248、I-256、I-270、I-271、I-272、I-273、I-274、I-275、I-289、I-304、I-305、I-306、I-307、I-308、I-309、I-311、I-312、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及びI-384は、2500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

20

30

【0187】

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

活性化化合物を、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、それらを、原液とし、より低い希釈液を1:1(vol/vol)の水:アセトンで作製した。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。

40

【0188】

第1本葉段階におけるピーマン植物に、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、処理前に寄生させた。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、除去し、次いで成長室内で蛍光灯下、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死亡率に対する、処理された植物上のアブラムシの死亡率を、5日後に決定した。

50

この試験において、化合物I-1、I-2、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-50、I-60、I-61、I-62、I-63、I-64、I-66、I-67、I-69、I-71、I-74、I-75、I-76、I-77、I-78、I-79、I-80、I-81、I-82、I-83、I-84、I-85、I-86、I-87、I-88、I-89、I-90、I-91、I-92、I-93、I-94、I-95、I-96、I-97、I-98、I-99、I-100、I-101、I-102、I-103、I-104、I-105、I-106、I-107、I-108、I-109、I-110、I-111、I-112、I-114、I-115、I-116、I-117、I-118、I-120、I-121、I-124、I-125、I-126、I-127、I-128、I-129、I-130、I-131、I-132、I-133、I-134、I-135、I-136、I-137、I-138、I-140、I-141、I-142、I-143、I-144、I-145、I-146、I-147、I-148、I-149、I-150、I-151、I-152、I-153、I-155、I-157、I-167、I-168、I-169、I-170、I-173、I-174、I-176、I-177、I-181、I-183、I-184、I-185、I-186、I-188、I-189、I-190、I-191、I-192、I-193、I-194、I-195、I-196、I-197、I-198、I-199、I-200、I-201、I-202、I-203、I-204、I-205、I-211、I-212、I-232、I-238、I-251、I-265、I-266、I-271、I-277、I-284、I-288、I-290、I-291、I-292、I-293、I-300、I-302、I-303、I-307、I-366、I-367、I-368、I-369、I-370、I-371、I-372、I-373、I-374、I-375、I-376、I-377、I-378、I-379、I-380、I-381、I-382、I-383及びI-384は、10ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

10

【0189】

B.6 ワタミゾウムシ(アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*))

20

活性化化合物を、3:1(vol/vol)の水:DMSO中に製剤化した。

【0190】

ワタミゾウムシ(アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*))の防除を評価するために、試験ユニットを、昆虫飼料及び20~30個のA.グランジスの卵を含有する24ウェルマイクロタイタープレートで構成した。異なる濃度の製剤化合物を、昆虫飼料上に20 μ lで、特注の微小噴霧器を使用して、2つの複製でスプレーした。施用後、マイクロタイタープレートを23 \pm 1及び50 \pm 5%の相対湿度で5日間インキュベートした。次いで、卵及び幼虫の死亡率を視覚的に評価した

この試験において、化合物I-67、I-85、I-92、I-94、I-95、I-96、I-98、I-102、I-104、I-113、I-127、I-132、I-137、I-143、I-182、I-374、I-377及びI-380は、2500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

30

【0191】

B.7 トビイロウンカ(ニラパルバタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*))

イネ苗を、スプレーの24時間前にきれいにし、洗浄した。活性化化合物を1:1(vol:vol)の水:アセトン中に製剤化し、0.1% vol/volの界面活性剤(EL 620)を加えた。鉢植えのイネ苗に、5mlの試験溶液をスプレーし、空気乾燥し、ケージ内に置き、10匹の成虫を接種した。処理されたイネ植物を28~29及び50~60%の相対湿度で保持した。パーセント死亡率を72時間後に記録した。

【0192】

この試験において、化合物I-8、I-9、I-10、I-11、I-25、I-29、I-35、I-62、I-63、I-68、I-113、I-141、I-143、I-199、I-204、I-245、I-312及びI-371は、500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

40

【0193】

B.8 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*))

活性化化合物を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死亡率を記録した。

50

【 0 1 9 4 】

この試験において、化合物I-4、I-35、I-39、I-43、I-78、I-83、I-86、I-94、I-95、I-96、I-107、I-109、I-115、I-132、I-133、I-142、I-143、I-146、I-154、I-158、I-168、I-184、I-186、I-187、I-189、I-191、I-193、I-198、I-201、I-202、I-203、I-204、I-205、I-278、I-279、I-280、I-281、I-297、I-298、I-299、I-300、I-305、I-306、I-308、I-310、I-370及びI-373は、500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【 0 1 9 5 】

B.9 ツマグロヨコバイ(ネフォテティックス・ビレセンス (Nephotettix virescens))

スプレーの24時間前に、イネ苗をきれいにし、洗浄した。活性化合物を1:1(vol:vol)の水:アセトン中に製剤化し、0.1% vol/volの界面活性剤(EL 620)を加えた。鉢植えのイネ苗に5mlの試験溶液をスプレーし、空気乾燥させ、ケージに入れて10匹の成虫を接種した。処理したイネ植物を28~29 及び相対湿度50~60%に保った。72時間後に死亡率を記録した。

10

【 0 1 9 6 】

この試験において、化合物I-7、I-8、I-10、I-11、I-32、I-33、I-63、I-79、I-113及びI-199は、500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【 0 1 9 7 】

B.10 コナガ(プルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella))

活性化合物を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の葉ディスクを試験溶液に3秒間浸漬し、湿った濾紙を敷いたペトリ皿の中で空気乾燥させた。この葉ディスクに10匹の第3齢幼虫を接種し、25~27 及び湿度50~60%に3日間保持した。処理の72時間後に死亡率を評価した。

20

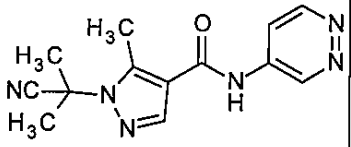
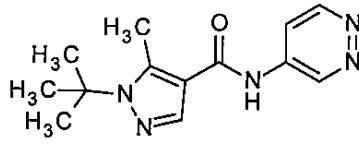
【 0 1 9 8 】

先行技術から知られている構造上類似した化合物に対する本発明による化合物の有利な活性を、以下の比較例により実証した。

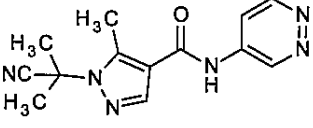
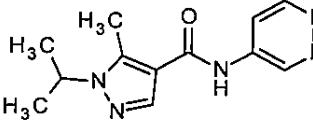
【 0 1 9 9 】

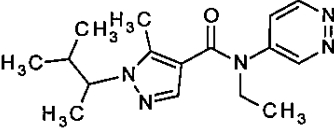
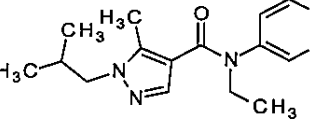
以下の表は、未処理の対照と比較した死亡率%を示す。

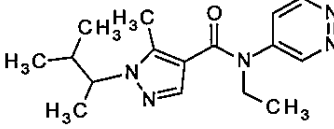
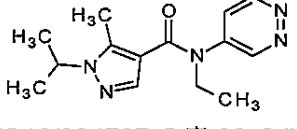
【表 3】

化合物		
試験/濃度	# I-32	WO10/034737 の表 14 の# 7
B.1 / 0.3 ppm	100%	0%
B.2 / 3 ppm	90%	25%

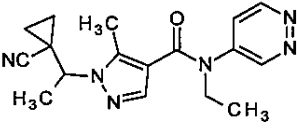
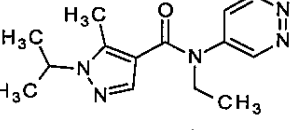
30

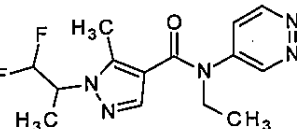
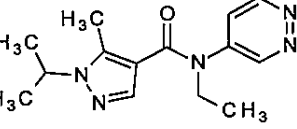
化合物		
試験/濃度	# I-32	WO10/034737 の表 14 の# 5
B.3 / 1 ppm	100%	0%
B.9 / 500 ppm	75%	0%

化合物		
試験/濃度	# I-98	WO10/034737 の# 175
B.1 / 0.3 ppm	75%	0%
B.2 / 0.1 ppm	95%	0%
B.5 / 0.1 ppm	95%	0%

化合物		
試験/濃度	# I-98	WO10/034737 の表 98 の# 5
B.3 / 3 ppm	75%	0%
B.10 / 500 ppm	25% FD*)	100% FD*)

*) FD = 食害

化合物		
試験/濃度	# I-198	WO10/034737 の表 98 の# 5
B.3 / 1 ppm	100%	0%
B.8 / 500 ppm	75%	0%

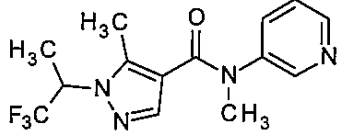
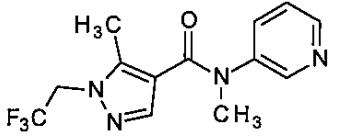
化合物		
試験/濃度	# I-201	WO10/034737 の表 98 の# 5
B.3 / 1 ppm	100%	0%
B.8 / 500 ppm	63%	0%

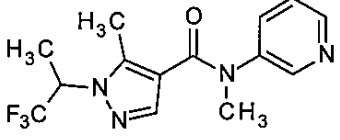
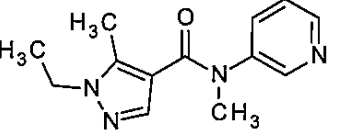
10

20

30

40

化合物		
試験/濃度	#1-377	WO9/027393 の# 173
B.3 / 10 ppm	75%	25%
B.5 / 10 ppm	100%	50%

化合物		
試験/濃度	#1-377	WO9/027393 の# 180
B.3 / 100 ppm	100%	0%

フロントページの続き

- | | | | |
|-----------------------|------------------|---------|--------|
| (51)Int.Cl. | | F I | |
| <i>C 0 7 D 409/14</i> | <i>(2006.01)</i> | C 0 7 D | 409/14 |
| <i>A 0 1 P 7/04</i> | <i>(2006.01)</i> | A 0 1 P | 7/04 |
| <i>A 0 1 N 43/58</i> | <i>(2006.01)</i> | A 0 1 N | 43/58 |
| <i>A 0 1 N 43/56</i> | <i>(2006.01)</i> | A 0 1 N | 43/56 |
| | | A 0 1 N | 43/56 |
| | | A 0 1 N | 43/56 |
| | | | A |
| | | | C |
| | | | B |
| | | | D |
- (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 100125508
弁理士 藤井 愛
- (74)代理人 100176197
弁理士 平松 千春
- (72)発明者 ディフィーバー, クリスティアン
ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 5 マンハイム, トウラシュトラーセ 1 3
- (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ーセ 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 5 9 ルートヴィヒスハーフェン, ルートヴィヒシュトラーセ 4 9
- (72)発明者 ル ヴェゾウエ, ロナン
ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, ネッカープロメナーデ 2 0
- (72)発明者 ケルバー, カルステン
ドイツ連邦共和国 6 9 2 1 4 エッペルハイム, ヒンテレ リスゲヴァン 2 6
- (72)発明者 グロス, シュテッフェン
ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 7 ルートヴィヒスハーフェン, マリー - ユハッチ アレー 2 0 1
- (72)発明者 カルバートソン, デボラ エル.
アメリカ合衆国 2 7 5 2 6 ノースカロライナ州, フクエイ バリナ, ピンテージ リッジ レーン 6 4 0 0
- (72)発明者 郡嶋 浩志
アメリカ合衆国 2 7 5 1 9 ノースカロライナ州, ケーリー, ルーク メドレーン 3 2 2

審査官 三上 晶子

- (56)参考文献 国際公開第2010/034737(WO, A1)
特表2010-536926(JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D 4 0 1 / 0 0 - 4 2 1 / 1 4
A 0 1 N 1 / 0 0 - 6 5 / 4 8
A 0 1 P 1 / 0 0 - 2 3 / 0 0
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)