

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4146836号
(P4146836)

(45) 発行日 平成20年9月10日 (2008. 9. 10)

(24) 登録日 平成20年6月27日 (2008. 6. 27)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 C 255/30 (2006. 01)

A O 1 N 47/02 (2006. 01)

A 6 1 K 31/275 (2006. 01)

A 6 1 P 33/00 (2006. 01)

A 6 1 P 33/10 (2006. 01)

C O 7 C 255/30 C S P

A O 1 N 47/02

A 6 1 K 31/275

A 6 1 P 33/00 1 7 1

A 6 1 P 33/10

請求項の数 7 (全 41 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2004-505318 (P2004-505318)
 (86) (22) 出願日 平成15年5月21日 (2003. 5. 21)
 (65) 公表番号 特表2005-526136 (P2005-526136A)
 (43) 公表日 平成17年9月2日 (2005. 9. 2)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2003/005331
 (87) 国際公開番号 W02003/097585
 (87) 国際公開日 平成15年11月27日 (2003. 11. 27)
 審査請求日 平成16年12月27日 (2004. 12. 27)
 (31) 優先権主張番号 0856/02
 (32) 優先日 平成14年5月22日 (2002. 5. 22)
 (33) 優先権主張国 スイス (CH)

(73) 特許権者 597011463
 ノバルティス アクチエンゲゼルシャフト
 スイス国、4056 バーゼル、リヒトシ
 ユトラーセ 35
 (74) 代理人 100062007
 弁理士 川口 義雄
 (74) 代理人 100113332
 弁理士 一入 章夫
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100103920
 弁理士 大崎 勝真
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

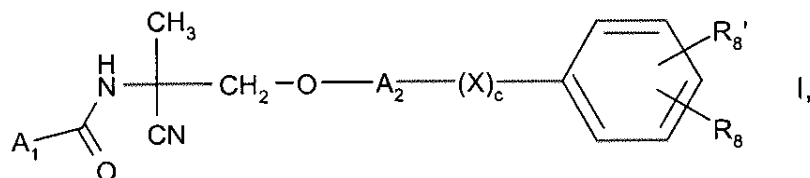
(54) 【発明の名称】 有機化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 I :

【化 1】



〔式中、

A₁ は、ハロゲン、ハロ-C₁-C₂-アルキル、ハロ-C₁-C₂-アルコキシ、又はフェニルカルボニルによって置換されたフェニルであり；

A₂ は、ハロゲンによって置換されたフェニレンであり；

Xは、Oであり、かつcは0又は1であり；

R₈ は、C₃-C₅-シクロアルキル、C₃-C₅-シクロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルアミノ又はジ-C₁-C₄-アルキルアミノを表わし、かつR₈′ は、水素を表わすか；

又は、

R₈ とR₈′ は、一緒になって、-OCH₂O-を表わす]

で表される化合物の遊離形態又は塩形態にある化合物。

【請求項 2】

R_8 が、 $C_1 - C_4$ -アルキルアミノ又はジ- $C_1 - C_4$ -アルキルアミノであり、かつ $R_{8'}$ が、水素である請求項 1 に記載されている、式 I の化合物。

【請求項 3】

A_1 が、ハロ- $C_1 - C_2$ -アルコキシによって置換されたフェニルである請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

c が 0 である、請求項 1 又は 2 に記載されている化合物。

【請求項 5】

R_8 が、ジ- $C_1 - C_2$ -アルキルアミノを表わし、かつ $R_{8'}$ が、水素を表わすか、又は、 R_8 と $R_{8'}$ は、一緒になって、 $-OCH_2O-$ を表し；

c は 0 を表し；

A_1 は、ハロ- $C_1 - C_2$ -アルコキシによって置換されたフェニルであり；

A_2 は、ハロゲンによって置換されたフェニレンである請求項 1 に記載の式 I で表される化合物。

【請求項 6】

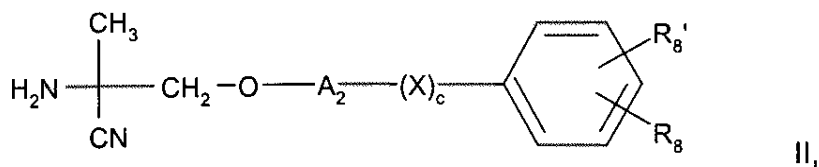
$N-[2\text{-シアノ}-1-(4, 5\text{-ジフルオロ}-4'\text{-ジメチルアミノ}-2\text{-ビフェノキシ})-2\text{-プロピル}]-4\text{-トリフルオロメトキシベンズアミド}$ である請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載されている式 I の化合物の、遊離形態又は塩形態にある化合物を調製する方法であって、

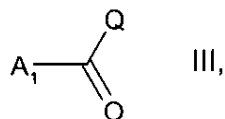
下記式 I I：

【化 2】



[式中、 A_2 、 R_8 、 $R_{8'}$ 、 X 、及び c は、式 I に関して定義されたとおりである]
で表される化合物を、場合により塩基性触媒の存在下で、下記式 I I I：

【化 3】



[式中、 A_1 は、式 I に関して定義されたとおりであり、 Q は脱離基である]
で表される化合物と反応させる方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、それぞれ遊離形態又は塩形態にある、式 (I)：

【0002】

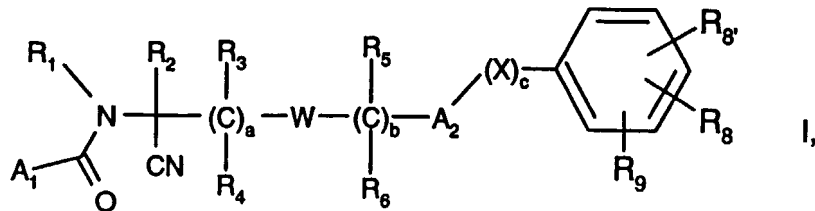
10

20

30

40

【化5】



[式中、

A_1 及び A_2 は、互いに独立して、非置換アリール若しくは1回以上置換されているアリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、ハロ- C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルオキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_2-C_6 -アルケニルチオ、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルチオ、 C_2-C_6 -アルケニルスルフィニル、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルスルフィニル、 C_2-C_6 -アルケニルスルホニル、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルアミノ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノカルボニル、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノカルボニル、非置換フェニルアミノ又は1回以上置換されているフェニルアミノ、非置換フェニルカルボニル又は1回以上置換されているフェニルカルボニル、非置換フェニルメトキシイミノ又は1回以上置換されているフェニルメトキシイミノ、非置換フェニルヒドロキシメチル又は1回以上置換されているフェニルヒドロキシメチル、非置換1-フェニル-1-ヒドロキシエチル又は1回以上置換されている1-フェニル-1-ヒドロキシエチル、非置換フェニルクロロメチル又は1回以上置換されているフェニルクロロメチル、非置換フェニルシアノメチル又は1回以上置換されているフェニルシアノメチル、非置換フェニル又は1回以上置換されているフェニル、非置換フェノキシ又は1回以上置換されているフェノキシ、非置換フェニルアセチレニル又は1回以上置換されているフェニルアセチレニル、及び、非置換ピリジルオキシ又は1回以上置換されているピリジルオキシからなる群から選択され、その際、該置換基は、それぞれ、互いに独立していることが可能であり、そして、 R_9 から選択される）を表すか；又は、非置換ヘタリール若しくは1回以上置換されていて環炭素原子で結合しているヘタリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、 R_9 から選択される）を表し；

R_1 は、水素、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、アリール又は C_1-C_6 -アルコキシメチルを表し；

R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、互いに独立して、水素、ハロゲン；非置換 C_1-C_6 -アルキル若しくは1回以上置換されている C_1-C_6 -アルキル、非置換 C_2-C_6 -アルケニル若しくは1回以上置換されている C_2-C_6 -アルケニル、非置換 C_2-C_6 -アルキニル若しくは1回以上置換されている C_2-C_6 -アルキニル、非置換 C_1-C_6 -アルコキシ若しくは1回以上置換されている C_1-C_6 -アルコキシ（ここで、該置換基は、それぞれ、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシ及びハロ- C_1-C_6 -アルコキシからなる群から選択される）；非置換 C_3-C_6 -シクロアルキル若しくは1回以上置換されている C_3-C_6 -シクロアルキル（ここで、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン

及び C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択される) ; 又は、非置換フェニル若しくは 1 回以上置換されているフェニル (ここで、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ又はジ- C_1-C_6 -アルキルアミノからなる群から選択される) であるか ;

又は、

R_2 と R_3 は、一緒に、 C_2-C_6 -アルキレンを表し ;

10

R_7 は、水素又は C_1-C_6 -アルキルを表し ;

R_8 は、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_3-C_8 -シクロアルキル、ハロ- C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキルアミノ、ハロ- C_3-C_8 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ、ハロ- C_3-C_8 -シクロアルコキシ又は C_3-C_8 -シクロアルキルチオを表し ; 且つ、 $R_{8'}$ は、水素又は R_9 を表すか ;

又は、

R_8 と $R_{8'}$ は、一緒に、非置換 C_3-C_5 -アルキレンを表すか又は R_9 で置換されている C_3-C_5 -アルキレンを表し、その際、1 又は 2 個の炭素原子は O、N 又は S で置き換えることが可能であり ;

20

R_9 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、ハロ- C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルオキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_2-C_6 -アルケニルチオ、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルチオ、 C_2-C_6 -アルケニルスルフィニル、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルスルフィニル、 C_2-C_6 -アルケニルスルホニル、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルアミノ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノカルボニル又はジ- C_1-C_6 -アルキルアミノカルボニルを表し ;

30

W は、O、S、S (O_2) 又は N (R_7) を表し ;

X は、O 又は N (R_7) を表し ;

a は、1、2、3 又は 4 を表し ;

b は、0、1、2、3 又は 4 を表し ;

40

及び、

c は、0 又は 1 を表す]

で表される新規アミドアセトニトリル化合物、場合により、ジアステレオ異性体、E/Z 異性体、E/Z 異性体混合物及び/又は互変異性体に関し、また、それらの調製、並びに、それらの、植物の表面及び温血動物 (特に、生産性家畜 (productive livestock) 及び飼育動物 (domestic animal)) の体内又は体表面に寄生する内部寄生生物及び外部寄生生物 (特に、蠕虫類) の防除における使用に関し、さらに、上記化合物の少なくとも 1 種を含有している殺有害生物剤 (pesticide) にも関する。

【背景技術】

【0003】

50

殺有害生物活性 (pesticidal activity) を有する置換アミドアセトニトリル化合物は、例えば、EP-0,953,565 A2に記載されている。しかしながら、その中に具体的に開示されている活性成分は、必ずしも、効果及び活性スペクトルに関する要件を満たすわけではない。従って、改善された殺有害生物特性を有する活性成分が求められている。

【発明の開示】

【0004】

式(I)で表されるアミドアセトニトリル化合物が、優れた殺有害生物活性、特に、植物及び温血動物の体内及び体表面上に寄生する内部寄生物及び外部寄生物に対する優れた殺有害生物活性を有することが見いだされた。

10

【0005】

アルキルは、基自体として、並びに、別の基及び化合物（例えば、ハロゲン-アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル及びアルキルスルホニルなど）の構造的要素として、いずれの場合も、当該化合物又は基内の炭素原子の特定されている数を考慮して、直鎖、即ち、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル若しくはヘキシル、又は、分枝鎖、例えば、イソプロピル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、イソペンチル、ネオペンチル若しくはイソヘキシルである。

【0006】

アルケニルは、基自体として、並びに、別の基及び化合物の構造的要素として、いずれの場合も、当該化合物又は基内の炭素原子の特定されている数と共役二重結合又は孤立二重結合を考慮して、直鎖、例えば、アリル、2-ブテニル、3-ペンテニル、1-ヘキセニル若しくは1,3-ヘキサジエニル、又は、分枝鎖、例えば、イソプロペニル、イソブテニル、イソプレニル、t-ペンテニル若しくはイソヘキセニルである。

20

【0007】

アルキニルは、基自体として、並びに、別の基及び化合物の構造的要素として、いずれの場合も、当該化合物又は基内の炭素原子の特定されている数と共役二重結合又は孤立二重結合を考慮して、直鎖、例えば、プロパルギル、2-ブチニル、3-ペンチニル、1-ヘキシニル、1-ヘプチニル若しくは3-ヘキセン-1-イニル、又は、分枝鎖、例えば、3-メチルブト-1-イニル、4-エチルペント-1-イニル若しくは4-メチルヘクス-2-イニルである。

30

【0008】

シクロアルキルは、基自体として、並びに、別の基及び化合物（例えば、ハロシクロアルキル、シクロアルコキシ又はシクロアルキルチオなど）の構造的要素として、いずれの場合も、当該化合物又は基内の炭素原子の特定されている数を考慮して、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルである。

【0009】

アリールは、フェニル又はナフチルである。

【0010】

ヘタリール (Hetaryl) は、ピリジル、ピリミジル、s-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、チエニル、フラニル、ピリル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリル、インドリル、インダゾリル又はキノリルである。

40

【0011】

ハロゲンは、基自体として、並びに、別の基及び化合物（例えば、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル及びハロアルキルスルホニルなど）の構造的要素として、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素、特に、フッ素、塩素又は臭素、特に、フッ素又は塩素である。

【0012】

ハロゲンで置換されている炭素を含有する基及び化合物、例えば、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル及びハロアルキルスルホニル

50

は、部分的にハロゲン化されていてもよい、又は、過ハロゲン化されていてもよく、複合的なハロゲン化の場合は、該ハロゲン置換基は、同一であっても異なってもよい。ハロゲン-アルキルの例は、基自体として、並びに、別の基及び化合物（例えば、ハロアルコキシ又はハロアルキルチオなど）の構造的要素として、フッ素、塩素及び／又は臭素により1置換～3置換されているメチル、例えば、 CHF_2 又は CF_3 ；フッ素、塩素及び／又は臭素により1置換～5置換されているエチル、例えば、 CH_2CF_3 、 CF_2CF_3 、 CF_2CCl_3 、 CF_2CHCl_2 、 CF_2CHF_2 、 CF_2CFCl_2 、 CF_2CHBr_2 、 CF_2CHClF 、 CF_2CHBrF 又は CClFCHClF ；フッ素、塩素及び／又は臭素により1置換～7置換されているプロピル又はイソプロピル、例えば、 $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ 、 $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{Br}$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 又は $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ ；フッ素、塩素及び／又は臭素により1置換～9置換されているブチル又はその異性体の内の1種、例えば、 $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCH}_2\text{CF}_3$ 又は $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ ；フッ素、塩素及び／又は臭素により1回～11回置換されているペンチル又はその異性体の内の1種、例えば、 $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ 又は $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ；及び、フッ素、塩素及び／又は臭素により1回～13回置換されているヘキシル又はその異性体の内の1種、例えば、 $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$ 、 $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ 又は $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ などである。

【0013】

アルコキシ基は、好ましくは、1～6個の炭素原子の鎖長を有する。アルコキシは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*s*-ブトキシ及び*t*-ブトキシ、さらに、異性体ペンチルオキシ及びヘキシルオキシ；好ましくは、メトキシ及びエトキシである。ハロアルコキシ基は、好ましくは、1～6個の炭素原子の鎖長を有する。ハロアルコキシは、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ及び2, 2, 2-トリクロロエトキシ；好ましくは、ジフルオロメトキシ、2-クロロエトキシ及びトリフルオロメトキシである。

【0014】

本発明の範囲内の好ましい実施形態は以下のとおりである：

(1) 式中、 A_1 及び A_2 が、互いに独立して、置換されていないか若しくは1回以上置換されているアリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、非置換フェニルアミノ又は1回以上置換されているフェニルアミノ、置換されていないか又は1回以上置換されているフェニルカルボニル、置換されていないか又は1回以上置換されているフェニル、置換されていないか又は1回以上置換されているフェノキシ、及び、置換されていないか又は1回以上置換されているピリジルオキシからなる群から選択され、その際、該置換基は、それぞれ、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル及び C_1-C_6 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される)を表すか；又は、非置換ヘタリール若しく

10

20

30

40

50

は1回以上置換されていて環炭素原子で結合しているヘタリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル及び C_1-C_6 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される）を表す、式（I）の化合物；

10

特に、 A_1 及び A_2 が、互いに独立して、置換されていないか若しくは1回以上置換されているアリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、非置換フェニル又は1回以上置換されているフェニル、置換されていないか又は1回以上置換されているフェノキシ、及び、置換されていないか又は1回以上置換されているピリジルオキシからなる群から選択され、その際、該置換基は、それぞれ、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_3-C_5 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_5 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_4 -アルキルカルボニル及び C_1-C_4 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される）を表すか；又は、非置換ヘタリール若しくは1回以上置換されていて環炭素原子で結合しているヘタリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_3-C_5 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_5 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_4 -アルキルカルボニル及び C_1-C_4 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される）を表す、式（I）の化合物；

20

30

特に、 A_1 及び A_2 が、互いに独立して、置換されていないか又は1回以上置換されているアリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_2 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_1-C_2 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_2 -アルキルチオ、 C_1-C_2 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_2 -アルキルカルボニル、 C_1-C_2 -アルコキシカルボニル、及び、非置換フェニル又は1回以上置換されているフェニルからなる群から選択され、その際、該置換基は、それぞれ、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_2 -アルキル、ハロ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_2 -アルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_4 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_2 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_2 -アルキルチオ、 C_1-C_2 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_2 -アルキルアミノ、 C_1-C_2 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_2 -アルキルカルボニル及び C_1-C_2 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される）を表す、式（I）の化合物；

40

（2）式中、 R_1 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル又は C_1-C_4 -アルコキシメチルである、式（I）の化合物；

50

特に、 R_1 が、水素、 C_1-C_2 -アルキル又はハロー- C_1-C_2 -アルキルである、式 (I) の化合物；

特に、 R_1 が、水素又は C_1-C_2 -アルキルである、式 (I) の化合物；

(3) 式中、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 が、互いに独立して、水素、ハロゲン；非置換 C_1-C_4 -アルキル若しくは 1 回以上置換されている C_1-C_4 -アルキル（ここで、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン及び C_1-C_4 -アルコキシからなる群から選択される）； C_3-C_5 -シクロアルキル又はフェニル（ここで、これは、置換されていないか又は 1 回以上置換されていて、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、ハロー- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ及びハロー- C_1-C_4 -アルコキシからなる群から選択される）を表す、式 (I) の化合物；

10

特に、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 が、互いに独立して、水素；非置換 C_1-C_4 -アルキル若しくは 1 回以上置換されている C_1-C_4 -アルキル（ここで、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン及び C_1-C_2 -アルコキシからなる群から選択される）；又は、 C_3-C_5 -シクロアルキルを表す、式 (I) の化合物；

特に、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 が、互いに独立して、水素、 C_1-C_2 -アルキル又は C_3-C_5 -シクロアルキルを表す、式 (I) の化合物；

(4) 式中、 R_7 が、 C_1-C_6 -アルキルである、式 (I) の化合物；

特に、 R_7 が、 C_1-C_4 -アルキルである、式 (I) の化合物；

20

特に、 R_7 が、 C_1-C_2 -アルキルである、式 (I) の化合物；

(5) 式中、 R_8 が、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル若しくは C_3-C_6 -シクロアルコキシを表し；且つ、 $R_{8'}$ が、水素を表すか、

又は、

R_8 と $R_{8'}$ が一緒に、非置換 C_3-C_4 -アルキレンを表すか又は R_9 で置換されている C_3-C_4 -アルキレンを表し、その際、1 又は 2 個の炭素原子は O 又は N で置き換えることが可能である、式 (I) の化合物；

特に、 R_8 が、 C_1-C_4 -アルキルアミノ又はジ- C_1-C_4 -アルキルアミノを表し、且つ、 $R_{8'}$ が、水素を表すか、

30

又は、

R_8 と $R_{8'}$ が一緒に、非置換 C_3 -アルキレンを表すか又は R_9 で置換されている C_3 -アルキレンを表し、その際、1 又は 2 個の炭素原子は O で置き換えることが可能である、式 (I) の化合物；

特に、 R_8 が、 C_1-C_4 -アルキルアミノ又はジ- C_1-C_4 -アルキルアミノを表し、 $R_{8'}$ が、水素を表す、式 (I) の化合物；

(6) 式中、 R_9 が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロー- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロー- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_2-C_5 -アルケニル、ハロー- C_2-C_5 -アルケニル、 C_2-C_5 -アルキニル、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_3-C_5 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_5 -シクロアルキルチオ、 C_2-C_5 -アルケニルオキシ、ハロー- C_2-C_5 -アルケニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロー- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルオキシ、ハロー- C_1-C_4 -アルキルスルホニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、ハロー- C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロー- C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルキルアミノカルボニル又はジ- C_1-C_4 -アルキルアミノカルボニルを表す、式 (I) の化合物；

40

特に、 R_9 が、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_3 -アルキル、ハロー- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロー- C_1-C_3 -アルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアル

50

キル、 C_3-C_4 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキルアミノ、 C_1-C_3 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_3 -アルキルチオ、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_3 -アルキルスルホニル、 C_1-C_3 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_3 -アルキルアミノ、 C_1-C_3 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_3 -アルキルカルボニル又は C_1-C_3 -アルコキシカルボニルを表す、式 (I) の化合物；

特に、 R_9 が、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_2 -アルキル、ハロ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_2 -アルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_2 -アルキルチオ又はハロ- C_1-C_2 -アルキルチオを表す、式 (I) の化合物；

(7) 式中、Wが、O又はSである、式 (I) の化合物；

10

特に、Wが、Oである、式 (I) の化合物；

(8) 式中、Xが、O又はN (R_7) である、式 (I) の化合物；

特に、Xが、Oである、式 (I) の化合物；

(9) 式中、aが、1、2又は3である、式 (I) の化合物；

特に、aが、1又は2である、式 (I) の化合物；

特に、aが、1である、式 (I) の化合物；

(10) 式中、bが、0、1又は2である、式 (I) の化合物；

特に、bが、0又は1である、式 (I) の化合物；

特に、bが、0である、式 (I) の化合物；

(11) 式中、cが、0である、式 (I) の化合物；

20

(12) 式中、 A_1 及び A_2 が、互いに独立して、置換されていないか若しくは1回以上置換されているアリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、ハロ- C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、非置換フェニルアミノ又は1回以上置換されているフェニルアミノ、置換されていないか又は1回以上置換されているフェニルカルボニル、置換されていないか又は1回以上置換されているフェニル、置換されていないか又は1回以上置換されているフェノキシ、及び、置換されていないか又は1回以上置換されているピリジルオキシからなる群から選択され、その際、該置換基は、それぞれ、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル及び C_1-C_6 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される）を表すか；又は、非置換ヘタリール若しくは1回以上置換されていて環炭素原子で結合しているヘタリール（ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、ハロ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_6 -アルキルカルボニル及び C_1-C_6 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される）を表し

30

40

50

;

R_1 が、水素、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル又は C_1-C_4 -アルコキシメチルを表し;

R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 が、互いに独立して、水素、ハロゲン; 非置換 C_1-C_4 -アルキル若しくは1回以上置換されている C_1-C_4 -アルキル (ここで、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン及び C_1-C_4 -アルコキシからなる群から選択される); C_3-C_5 -シクロアルキル又はフェニル (ここで、これは、置換されていないか又は1回以上置換されていて、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ及びハロ- C_1-C_4 -アルコキシからなる群から選

10

択される) を表し;

R_7 が、 C_1-C_6 -アルキルであり;

R_8 が、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_3-C_6 -シクロアルキル又は C_3-C_6 -シクロアルコキシを表し; 且つ、 $R_{8'}$ が、水素を表すか;

又は、

R_8 と $R_{8'}$ が、一緒に、非置換 C_3-C_4 -アルキレンを表すか又は R_9 で置換されている C_3-C_4 -アルキレンを表し、その際、1又は2個の炭素原子はO又はNで置き換えることが可能であり;

R_9 が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_2-C_5 -アルケニル、ハロ- C_2-C_5 -アルケニル、 C_2-C_5 -アルキニル、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_3-C_5 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_5 -シクロアルキルチオ、 C_2-C_5 -アルケニルオキシ、ハロ- C_2-C_5 -アルケニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニルオキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルスルホニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 -アルキルアミノカルボニル又はジ- C_1-C_4 -アルキルアミノカルボニルを表し;

20

30

Wが、O又はSであり;

Xが、O又はN (R_7) を表し;

aが、1、2又は3を表し;

bが、0、1又は2を表し;

及び、

cが、0を表す、式(I)の化合物;

(13) 式中、 A_1 及び A_2 が、互いに独立して、置換されていないか若しくは1回以上置換されているアリール (ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル、非置換フェニル又は1回以上置換されているフェニル、置換されていないか又は1回以上置換されているフェノキシ、及び、置換されていないか又は1回以上置換されているピリジルオキシからなる群から選択され、その際、該置換基は、それぞれ、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_3-C_5 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_5 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル

40

50

、ハロ- C_1-C_4 -アルキルカルボニル及び C_1-C_4 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される)を表すか;又は、非置換ヘタリール若しくは1回以上置換されている環炭素原子で結合しているヘタリール(ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルキル、ハロ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキル、 C_3-C_5 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_5 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_5 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_4 -アルキルカルボニル及び C_1-C_4 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される)を表し;

10

R_1 が、水素、 C_1-C_2 -アルキル又はハロ- C_1-C_2 -アルキルを表し;

R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 が、互いに独立して、水素;非置換 C_1-C_4 -アルキル若しくは1回以上置換されている C_1-C_4 -アルキル(ここで、該置換基は、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン及び C_1-C_2 -アルコキシからなる群から選択される);又は、 C_3-C_5 -シクロアルキルを表し;

R_7 が、 C_1-C_4 -アルキルを表し;

R_8 が、 C_1-C_4 -アルキルアミノ又はジ- C_1-C_4 -アルキルアミノを表し;且つ、 $R_{8'}$ が、水素を表すか;

又は、

R_8 と $R_{8'}$ が、一緒に、非置換 C_3 -アルキレンを表すか又は R_9 で置換されている C_3 -アルキレンを表し、その際、1又は2個の炭素原子はOで置き換えることが可能であり;

20

R_9 が、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_3 -アルキル、ハロ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_3 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_3 -アルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキルアミノ、 C_1-C_3 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_3 -アルキルチオ、 C_1-C_3 -アルキルスルホニル、ハロ- C_1-C_3 -アルキルスルホニル、 C_1-C_3 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_3 -アルキルアミノ、 C_1-C_3 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_3 -アルキルカルボニル又は C_1-C_3 -アルコキシカルボニルを表し;

W及びXが、Oを表し;

30

aが、1又は2を表し;

bが、0又は1を表し;

及び、

cが、0を表す、式(I)の化合物;

(14)式中、 A_1 及び A_2 が、互いに独立して、置換されていないか若しくは1回以上置換されているアリール(ここで、 A_1 及び A_2 の置換基は、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_2 -アルキル、ハロ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_2 -アルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_2 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_2 -アルキルチオ、 C_1-C_2 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_2 -アルキルカルボニル、 C_1-C_2 -アルコキシカルボニル、及び、非置換フェニル又は1回以上置換されているフェニルからなる群から選択され、その際、該置換基は、それぞれ、互いに独立していることが可能であり、そして、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_2 -アルキル、ハロ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_2 -アルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキルアミノ、 C_3-C_4 -シクロアルキルチオ、 C_1-C_2 -アルキルチオ、ハロ- C_1-C_2 -アルキルチオ、 C_1-C_2 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_2 -アルキルアミノ、 C_1-C_2 -アルキルカルボニル、ハロ- C_1-C_2 -アルキルカルボニル及び C_1-C_2 -アルコキシカルボニルからなる群から選択される)を表し;

40

R_1 が、水素又は C_1-C_2 -アルキルを表し;

50

R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 が、互いに独立して、水素、 C_1-C_2 -アルキル又は C_3-C_5 -シクロアルキルを表し；

R_7 が、 C_1-C_2 -アルキルを表し；

R_8 が、 C_1-C_4 -アルキルアミノ又はジ- C_1-C_4 -アルキルアミノを表し；

$R_{8'}$ が、水素を表し；

R_9 が、ハロゲン、シアノ、 C_1-C_2 -アルキル、ハロ- C_1-C_2 -アルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、ハロ- C_1-C_2 -アルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_2 -アルキルチオ又はハロ- C_1-C_2 -アルキルチオを表し；

W 及び X が、O を表し；

a が、1 を表し；

及び、

b 及び c が、0 である、式 (I) の化合物。

【0015】

本発明に関連して、表 1 に挙げられている式 (I) の化合物が特に好ましく、合成実施例で挙げられている化合物が最も好まし。

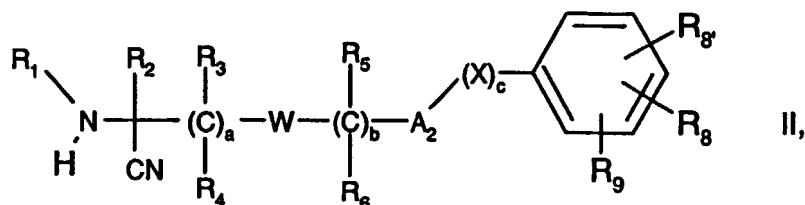
【0016】

本発明のさらに別の目的は、それぞれ遊離形態又は塩形態にある、式 (I) の化合物を調製する方法であって、当該方法は、例えば、

公知化合物であるか又は対応する公知化合物と類似した方法で調製することが可能な、式 (II)：

【0017】

【化 6】

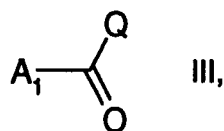


〔式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_8 、 $R_{8'}$ 、 R_9 、W、X、 A_2 、a、b 及び c は、式 (I) に関して定義されているように定義される〕

で表される化合物を、場合により塩基性触媒の存在下で、公知化合物であるか又は対応する公知化合物と類似した方法で調製することが可能な、式 (III)：

【0018】

【化 7】



〔式中、 A_1 は、式 (I) に関して定義されているように定義され、Q は脱離基である〕で表される化合物と反応させ；

及び、必要に応じて、

上記方法又は別の方法で得られる、それぞれ遊離形態又は塩形態にある式 (I) の化合物を、式 (I) の別の化合物に変換し；上記方法で得られる異性体の混合物を分離して、所望の異性体を単離し；及び／又は、上記方法で得られる式 (I) の遊離化合物を塩に変換するか、又は、上記方法で得られる式 (I) の化合物の塩を式 (I) の遊離化合物若しくは別の塩に変換する；

ことを特徴とする。

【0019】

化合物（I）の塩に関して上記で述べたことは、上記及び下記に挙げてある出発物質の塩にも同様に適用される。

【0020】

反応体は、そのまま、即ち、溶媒又は希釈剤を加えずに、例えば、溶融状態で、相互に反応させることができる。しかしながら、殆どの場合には、不活性な溶媒又は希釈剤又はその混合物を加えると有利である。そのような溶媒又は希釈剤の例は：芳香族炭化水素、脂肪族炭化水素及び脂環式炭化水素並びにハロゲン化炭化水素、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、テトラリン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、プロモベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、トリクロロメタン、テトラクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエテン又はテトラクロロエテン；エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジブロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ｔ－ブチルメチルエーテル、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメトキシジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン；ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン又はメチルイソブチルケトン；アミド類、例えば、N，N－ジメチルホルムアミド、N，N－ジエチルホルムアミド、N，N－ジメチルアセトアミド、N－メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；及び、スルホキシド類、例えば、ジメチルスルホキシドなどである。

10

20

【0021】

好ましい脱離基Qは、ハロゲン、トシラート類、メシラート類及びトリフラート類であり、最も好ましくは、ハロゲン、特に、塩素である。

【0022】

上記反応を促進するのに適切な塩基は、例えば、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の水酸化物、水素化物、アミド、アルカノラート、酢酸塩、炭酸塩、ジアルキルアミド又はアルキルシリルアミド；アルキルアミン、アルキレンジアミン、場合によりN－アルキル化されていて、場合により不飽和結合を有するシクロアルキルアミン、塩基性ヘテロ環、水酸化アンモニウム、及び、炭素環式アミンなどである。例としてあげることができるのは、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメタノラート、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムｔ－ブタノラート、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス（トリメチルシリル）アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N－シクロヘキシル－N，N－ジメチルアミン、N，N－ジエチルアニリン、ピリジン、4－（N，N－ジメチルアミノ）ピリジン、キヌクリジン、N－メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム、及び、1，5－ジアザビシクロ〔5．4．0〕ウンデク－5－エン（DBU）などである。ジイソプロピルエチルアミン及び4－（N，N－ジメチルアミノ）ピリジンが好ましい。

30

【0023】

上記反応は、有利には、約0℃～約100℃の温度範囲、好ましくは、約10℃～約40℃の温度範囲で行う。

40

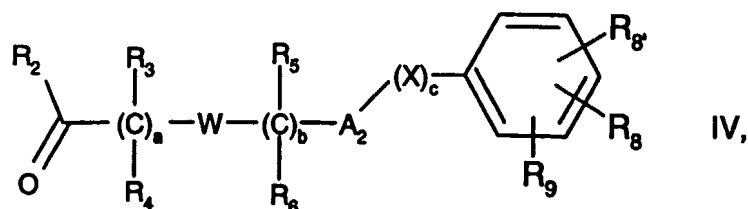
【0024】

本発明のさらに別の目的は、それぞれ遊離形態又は塩形態にある、式（II）の化合物を調製する方法であって、例えば、

公知化合物であるか又は対応する公知化合物と類似した方法で調製することが可能な、式（IV）：

【0025】

【化 8】



〔式中、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_8 、 R_8' 、 R_9 、 W 、 X 、 A_2 、 a 、 b 及び c は、式（I）に関して定義されているように定義される〕

で表される化合物を、無機シアン化物又は有機シアン化物、及び、公知化合物であるか又は対応する公知化合物と類似した方法で調製することが可能な、式： R_1-NH_2 〔式中、 R_1 は、式（I）に関して定義されているように定義される〕で表される化合物と反応させ；

及び、必要に応じて、

上記方法又は別の方法で得られる、それぞれ遊離形態又は塩形態にある式（II）の化合物を、式（II）の別の化合物に変換し；上記方法で得られる異性体の混合物を分離して、所望の異性体を単離し；及び／又は、上記方法で得られる式（II）の遊離化合物を塩に変換するか、又は、上記方法で得られる式（II）の化合物の塩を式（II）の遊離化合物若しくは別の塩に変換する；

ことを特徴とする。

【0026】

適切なシアン化物は、シアン化ナトリウム、シアン化カリウム、シアン化トリメチルシリル及びアセトンシアノヒドリンである。

【0027】

カルボニル化合物（例えば、式（IV）のカルボニル化合物）をシアン化物及びアミン（例えば、式： R_6-NH_2 のアミン）と反応させる一般的な方法は、例えば、Organic Synthesis Coll. Vol. 3, 88 (1973)に記載されているようなStrecker反応である。

【0028】

化合物（I）の塩は、公知方法で調製することができる。例えば、化合物（I）の酸付加塩は、適切な酸又は適切なイオン交換試薬で処理することにより得ることができ、塩基との塩は、適切な塩基又は適切なイオン交換試薬で処理することにより得ることができる。

【0029】

化合物（I）の塩は、慣習的な方法により遊離化合物（I）に変換することができる。酸付加塩は、例えば、適切な塩基性組成物又は適切なイオン交換試薬で処理することにより、塩基との塩は、例えば、適切な酸又は適切なイオン交換試薬で処理することにより、遊離化合物（I）に変換することができる。

【0030】

化合物（I）の塩は、公知方法により、化合物（I）の別の塩に変換することができる。酸付加塩は、例えば、塩酸塩などの無機酸の塩を、適切な溶媒中で、酸のナトリウム塩、酸のバリウム塩又は酸の銀塩などの酸の適切な金属塩（例えば、酢酸銀）で処理することにより、例えば、別の酸付加塩に変換することができ、その際、生じた塩化銀などの無機塩は不溶性であって、反応混合物から沈澱する。

【0031】

方法及び／又は反応条件に応じて、塩を形成する性質を有する化合物（I）を遊離形態又は塩の形態で得ることができる。

【0032】

さらにまた、化合物（I）は、その水和物の形態で得ることもできるし、及び／又は、

別の溶媒、例えば、固体形態にある化合物を結晶化させるのに必要な場合に使用される溶媒を含むことができる。

【0033】

化合物（I）は、場合により、光学異性体及び／又は幾何異性体又はそれらの混合物として存在し得る。本発明は、純粋な異性体と全ての可能な異性体混合物の両方に関し、上記及び下記の記載において、いずれの場合にも、立体化学の詳細について特に記載されていなくともそのように理解される。

【0034】

本発明の調製方法又は別の方法で得られ場合がある化合物（I）のジアステレオマー混合物は、その成分の物理化学的差異に基づいて、例えば、分別結晶、蒸留及び／又はクロマトグラフィーにより、公知方法で純粋なジアステレオマーに分離することができる。

10

【0035】

上記のようにして得られる場合があるエナンチオマー混合物は、例えば、光学活性な溶媒からの再結晶、キラル吸着剤でのクロマトグラフィー（例えば、アセチルセルロースでの高性能液体クロマトグラフィー（HPLC））、適切な微生物の利用、特定の固定化酵素による切断、又は、例えば一方のエナンチオマーしか錯化されないキラルクラウンエーテルの使用による包接化合物の形成などの公知方法により、純粋な異性体に分離することができる。

【0036】

本発明では、対応する異性体混合物の分離とは別に、ジアステレオ選択的合成又はエナンチオ選択的合成のための一般的に知られている方法を適用して、例えば、相応に適切な立体化学を有する遊離体を用いて本発明の方法を実施することにより、純粋なジアステレオマー又はエナンチオマーを得ることもできる。

20

【0037】

個々の異性体成分が異なる生物学的効力を有する場合には、生物学的活性のより高い異性体（例えば、エナンチオマー）を単離又は合成するのが有利である。

【0038】

本発明の方法において、用いる出発物質及び中間体は、好ましくは、特に有用であると冒頭に記載した化合物（I）を生じるものである。

【0039】

本発明は、特に、実施例に記載した調製方法に関する。

30

【0040】

化合物（I）を調製するために本発明で使用する新規な出発物質及び中間体、並びに、それらの使用及びそれらの調製方法は、同様に、本発明の目的を形成する。

【0041】

本発明の化合物（I）が広い活性スペクトルを有することは特筆すべきである。本発明の化合物（I）は、特に、温血動物（特に、生産性家畜及び飼育動物）の体内及び体表面上に寄生する内部寄生生物及び外部寄生生物（特に、蠕虫類）並びに植物の外部寄生生物の防除を包含する害虫の防除において使用するための有用な活性成分であるが、温血動物、魚類及び植物は化合物（I）に対して十分な耐性を示す。

40

【0042】

本発明に関連して、外部寄生生物は、特に、昆虫、ダニ（mite）及びマダニ（tick）であると理解される。そのようなものには、鱗翅目、甲虫目、同翅目、異翅目、双翅目、アザミウマ目、直翅目、シラミ目、ノミ目、ハジラミ目、シミ目、シロアリ目、チャタテムシ目及び膜翅目の昆虫が包含される。しかしながら、特に挙げることができる外部寄生生物は、ヒト又は動物に有害であり、病原体を伝搬するもの、例えば、ハエ類（例えば、*Musca domestica*、*Musca vetustissima*、*Musca autumnalis*、*Fannia canicularis*、*Sarcophaga camaria*、*Lucilia cuprina*、*Hypoderma bovis*、*Hypoderma lineatum*、*Chrysomya chloropyg*

50

a、*Dermatobia hominis*、*Cochliomyia hominiv*
orax、*Gasterophilus intestinalis*、*Oestrus*
ovis、*Stomoxys calcitrans*、*Haematobia irri*
tans) 及びユスリカ類 (長角亜目) (例えば、*Culicidae*、*Simuli*
idae、*Psychodidae*)、さらに、吸血性寄生物、例えば、ノミ類 (例えば
、*Ctenocephalides felis* (ネコノミ)、*Ctenocephal*
ides canis (イヌノミ)、*Xenopsylla cheopis*、*Pule*
x irritans、*Dermatophilus penetrans*)、シラミ類
(例えば、*Damalina ovis*、*Pediculus humanis*)、サシ
バエ類 (biting flies) 及びアブ類 (*Tabanidae*)、*Haematopota*
spp. (例えば、*Haematopota pluvialis*)、*Tabanide*
a spp. (例えば、*Tabanus nigrovittatus*)、*Chryso*
psinae spp. (例えば、*Chrysops caecutiens*)、ツェツ
ェバエ類 (例えば、*Glossinia* の種)、刺咬昆虫、特に、ゴキブリ類 (例えば、
Blatella germanica、*Blatta orientalis*、*Per*
iplaneta americana)、ダニ類 (例えば、*Dermanyssus*
gallinae、*Sarcoptes scabiei*、*Psoroptes ovi*
s) 及び *Psorergates spp.* などであり、最後に、さらに、マダニ類を挙
げることができる。マダニ類は、ダニ目に属する。公知マダニの例は、例えば、*Boop*
hilus、*Amblyomma*、*Anocentor*、*Dermacentor*、*Ha*
emaphysalis、*Hyalomma*、*Ixodes*、*Rhipicentor*、
Margaropus、*Rhipicephalus*、*Argas*、*Otobius* 及び
Ornithodoros などであり、これらは、好ましくは、ウシ、ブタ、ヒツジ及び
ヤギなどの家畜類、ニワトリ、シチメンチョウ及びガチョウなどの家禽類、ミンク、キツ
ネ、チンチラ及びウサギなどの毛皮動物、ネコ及びイヌなどの飼育動物、さらには、ヒト
をも包含する温血動物に寄生する。

【0043】

本発明の化合物 (I) は、さらにまた、通常感受性を示す動物寄生性害虫 (animal p
est) 及び抵抗性を示す動物寄生性害虫 (例えば、昆虫及びダニ目の害虫など) の全ての
発育段階又は特定の発育段階に対して活性を有する。本発明の活性物質の殺虫作用、殺卵
作用及び／又は殺ダニ作用は、直接的に現れ得る (即ち、即座に害虫を殺すか若しくはし
ばらく時間が経過した後、例えば、脱皮が起こった時に、害虫を殺す) か、又は、上記害
虫の卵を殺すことにより明らかになり得るか、又は、間接的に、例えば、産卵される卵の
数及び／又は孵化率を低下させることにより明らかになり得る。ここで、良好な殺虫効力
は、少なくとも 50～60% の殺虫率 (死亡率) に相当する。

【0044】

化合物 (I) は、衛生害虫、特に、双翅目の *Sarcophagidae* 科、*Anop*
hilidae 科及び *Culicidae* 科；直翅目、網翅目 (例えば、*Blattid*
ae 科) 及び膜翅目 (例えば、*Formicidae* 科) の衛生害虫に対しても使用す
ることができる。

【0045】

化合物 (I) は、植物に寄生するダニ及び昆虫に対して持続的な効力も有する。ダニ目
のハダニの場合、化合物 (I) は、*Tetranychidae* (*Tetranychu*
s spp.、及び、*Panonychus spp.*) の卵、若虫及び成虫に対して有
効である。

【0046】

化合物 (I) は、同翅目の吸汁性昆虫、特に、*Aphididae* 科、*Delphac*
idae 科、*Cicadellidae* 科、*Psyllidae* 科、*Loccidae* 科
、*Diaspididae* 科及び *Eriophyidae* 科の害虫 (例えば、柑橘類果
実のサビダニ)、半翅目、異翅目及びアザミウマ目、並びに、鱗翅目、甲虫目、双翅目及

10

20

30

40

50

び直翅目の草食性昆虫に対して高い活性を有する。

【0047】

化合物（I）は、同様に、土壤中の害虫に対する土壌殺虫剤としても適している。

【0048】

従って、式（I）の化合物は、穀類、ワタ、イネ、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、野菜類、果実、タバコ、ホップ、柑橘類、アボガド及び他の作物類のような作物の吸汁性昆虫及び草食性昆虫の全生育段階に対して有効である。

【0049】

式（I）の化合物は、*Meloidogyne*種、*Heterodera*種、*Pratylenchus*種、*Ditylenchus*種、*Radopholus*種、*Rizoglyphus*種などの植物線虫に対しても有効である。

10

【0050】

特に、本発明の化合物は、蠕虫に対して有効である。蠕虫の中で、内部寄生性の線虫及び吸虫は、哺乳動物及び家禽類（例えば、ヒツジ、ブタ、ヤギ、ウシ、ウマ、ロバ、イヌ、ネコ、モルモット及び外来種の鳥類など）の重篤な疾患の原因となり得る。この適用の典型的な線虫は、*Haemonchus*、*Trichostrongylus*、*Ostertagia*、*Nematodirus*、*Cooperia*、*Ascaris*、*Bunostomum*、*Oesophagostomum*、*Charbertia*、*Trichuris*、*Strongylus*、*Trichonema*、*Dictyocaulus*、*Capillaria*、*Heterakis*、*Toxocara*、*Ascaridia*、*Oxyuris*、*Ancylostoma*、*Uncinaria*、*Toxascaris*及び*Parascaris*である。上記吸虫としては、特に、*Fasciolidae*科、特に、*Fasciola hepatica*などを挙げることができる。驚くべきことに、また、予想外に、式（I）の化合物が、多くの活性物質に対して抵抗性を有する線虫に対して特に高い効力を有することを示すことができた。これは、インビトロにおけるLD₅₀テストにより立証することが可能であるし、また、インビボで、例えば、スナネズミ及びヒツジにおいて立証することができる。*Haemonchus contortus*又は*Trichostrongylus colubrifomis*の感受性系統を殺す量の該活性物質が、ベンゾイミダゾール系、レバミゾール及び大環状ラクトン系（例えば、イベルメクチン）に対して抵抗性を示す上記系統を防除するのにも十分に有効であることが示された。

20

30

【0051】

*Nematodirus*種、*Cooperia*種及び*Oesophagostomum*種の特定の害虫は、宿主動物の腸管に寄生するが、*Haemonchus*種及び*Ostertagia*種の別の害虫は宿主動物の胃に寄生し、*Dictyocaulus*種の害虫は肺組織に寄生する。*Filariidae*科及び*Setariidae*科の寄生虫は、体内細胞組織及び器官、例えば、心臓、血管、リンパ管及び皮下組織の中に見いだすことができる。特に重要な寄生虫は、犬糸状虫（*Dirofilaria immitis*）である。式（I）の化合物は、この寄生虫に対して高い効果を示す。

【0052】

40

式（I）の化合物によって防除し得る害虫としては、さらに、以下のものなどがある：*Cestoda*綱（条虫類）、例えば、*Mesocestoidae*科、特に、*Mesocestoides*属、特に、*M. lineatus*；*Dilepididae*、特に、*Dipylidium caninum*、*Joyeuxiella* spp.、特に、*Joyeuxiella pasquali*及び*Diplopylidium* spp.、並びに、*Taeniidae*、特に、*Taenia pisiformis*、*Taenia cervi*、*Taenia ovis*、*Taenia hydatigena*、*Taenia multiceps*、*Taenia taeniaeformis*、*Taenia serialis*及び*Echinococcus* spp.、最も好ましくは、*Taenia hydatigena*、*Taenia ovis*、*Taenia mult*

50

iceps、Taenia serialis; Echinococcus granulosus及びEchinococcus multilocularis、並びに、Multiceps multiceps。

【0053】

特に、Taenia hydatigena、T. pisiformis、T. ovis、T. taeniaeformis、Multiceps multiceps、Joyeuxiella pasquali、Dipylidium caninum、Mesocystoides spp.、Echinococcus granulosus及びE. multilocularisは、イヌ及びネコの体外及び体内で、Dirofilaria immitis、Ancylostoma ssp.、Toxocara ssp. 及び／又はTrichuris vulpisと同時に防除される。同様に好ましくは、Ctenocephalides felis及び／又はC. canisは、上記線虫類及び条虫類と同時に防除される。

10

【0054】

さらにまた、式(I)の化合物は、ヒトの病原性寄生虫を防除するのに適している。ヒトの病原性寄生虫の中で、消化管内に発生する典型的な例は、Ancylostoma種、Necator種、Ascaris種、Strongyloides種、Trichinella種、Capillaria種、Trichuris種及びEnterobius種の寄生虫である。本発明の化合物は、血液、組織及び種々の器官内で発生するFilariidae科のWuchereria種、Brugia種、Onchocerca種及びLoa種の寄生虫や、さらには、Dracunculusや、特に胃腸管に感染するStrongyloides種及びTrichinella種の寄生虫に対しても効果がある。

20

【0055】

さらに、式(I)の化合物は、植物やヒト及び動物の有害な病原性菌類に対しても有効である。

【0056】

本発明の式(I)の化合物の良好な殺有害生物活性は、上記害虫の少なくとも50～60%の死亡率に相当する。特に、式(I)の化合物が、非常に長期間にわたって効力を持続することは注目すべきである。

30

【0057】

式(I)の化合物は、好ましくは、そのままの形態で用いるか、又は、好ましくは、製剤の技術分野で慣習的に使用されるアジュバントと一緒に使用する。従って、式(I)の化合物は、公知方法により、例えば、乳剤、直接希釈可能な溶液、希釈エマルジョン、可溶性粉剤、粒剤又はポリマー物質中のマイクロカプセルに調製することができる。組成物と同様に、施用方法も、意図されている目的とそのときの状況に応じて選択する。

【0058】

製剤、即ち、式(I)の活性成分又は当該活性成分と別の活性成分の組合せを含有し、さらに、場合により、固体又は液体のアジュバントを含有する薬剤、調製物又は組成物は、自体公知の方法で、例えば、当該活性成分を、拡散性組成物(spreading composition)、例えば、溶媒、固体担体及び場合により表面活性化合物(界面活性剤)と十分に混合し粉碎することにより調製する。

40

【0059】

上記溶媒は、アルコール類、例えば、エタノール、プロパノール若しくはブタノール、及び、グリコール類とそのエーテル及びエステル、例えば、プロピレングリコール、ジプロピレングリコールエーテル、エチレングリコール、エチレングリコールモノメチルエーテル若しくはエチレングリコールモノエチルエーテル、ケトン類、例えば、シクロヘキサノン、イソホロン若しくはジアセタノールアルコール、強極性溶媒、例えば、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド若しくはジメチルホルムアミド、又は、水、植物油、例えば、ナタネ油、ヒマシ油、ヤシ油若しくはダイズ油などであり得るが、さらに

50

、適切な場合には、シリコン油であってもよい。

【0060】

蠕虫の防除において温血動物に対して使用するための好ましい施用形態には、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤（水薬剤）、飼料添加物、粉末剤、発泡錠剤などの錠剤、大型丸薬剤（boli）、カプセル剤、マイクロカプセル剤及びポアオン剤などがあるが、そのような施用形態では、製剤用賦形剤の生理学的な適合性は考慮されなければならない。

【0061】

錠剤及び大型丸薬剤用の結合剤は、水又はアルコールに可溶性である化学的に修飾されている天然ポリマー物質、例えば、デンプン、セルロース若しくはタンパク質誘導体（例えば、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、エチルヒドロキシエチルセルロース、タンパク質、例えば、ゼイン、及び、ゼラチンなど）、並びに、合成ポリマー、例えば、ポリビニルアルコール、及び、ポリビニルピロリドンなどであり得る。上記錠剤は、さらに、増量剤（例えば、デンプン、微晶質セルロース、糖及びラクトースなど）、流動促進剤（glidant）及び崩壊剤も含有する。

【0062】

上記駆虫薬が飼料濃厚物の形態で存在する場合、用いられる担体は、例えば、高性能飼料（performance feed）、飼料穀物又はタンパク質濃厚物である。このような飼料濃厚物又は組成物は、活性成分以外に、添加剤、ビタミン類、抗生物質、化学療法薬又は他の殺有害生物剤、主に静菌薬、殺菌剤、コクシジウム抑制剤若しくはホルモン調製物、タンパク同化作用がある物質若しくは成長を促進する物質をも含むことができ、これらは屠殺動物の肉の品質に影響するか、又は、これらは別の仕方で生物にとって有益である。上記組成物又はそれに含まれる式（I）の活性成分が飼料又は水桶に直接加えられる場合、配合された飼料又は飲料水は、上記活性成分を、好ましくは、約0.0005～0.02重量%（5～200ppm）の濃度で含有する。

【0063】

本発明の式（I）の化合物は、単独で使用してもよいし、又は、別の殺生物剤と併用してもよい。本発明の式（I）の化合物は、例えば活性を高めるために、同じ活性範囲を有する殺有害生物剤と組合せてもよいし、又は、例えば活性範囲を広げるために、別の活性範囲を有する物質と組合せてもよい。いわゆる忌避剤を加えることも可能である。活性範囲を内部寄生生物（例えば、蠕虫類（wormers））にまで広げる場合は、式（I）の化合物を、適切には、殺内部寄生生物特性（endoparasitic property）を有する物質と組み合わせる。式（I）の化合物を抗細菌組成物と併用することも、もちろん可能である。式（I）の化合物は殺成虫剤（adulticide）であるので、即ち、式（I）の化合物は標的寄生虫の特に成虫段階に対して効果を有するので、標的寄生虫の成虫段階ではなく幼虫段階を攻撃する殺有害生物剤を添加するのが極めて有利であり得る。このようにして、大きな経済的損失を引き起こす寄生虫の殆どが防除対象範囲に入る。さらに、この作用は、抵抗性の形成を避けるのに実質的な貢献をする。さらにまた、多くの組合せにおいて相乗作用が得られる場合があり、即ち、活性成分の総量を低減することができ、このことは、生態学の観点から望ましい。組合せ相手の好ましい群及び特に好ましい組合せ相手を以下に挙げるが、その際、当該組合せは、式（I）の化合物の他にこれら組合せ相手の1種以上を含有し得る。

【0064】

上記組合せからなる混合物中の適切な混合相手は、殺生物剤、例えば、以下に挙げてある様々な作用機序を有する殺虫剤及び殺ダニ剤などである。そのような殺虫剤及び殺ダニ剤は、当業者には以前から知られており、例えば、キチン合成阻害剤、生長調節剤、幼若ホルモンとして作用する活性成分、殺成虫剤として作用する活性成分、広いスペクトルを有する（broad-band）殺虫剤、広いスペクトルを有する（broad-band）殺ダニ剤及び殺線虫剤などであり、さらに、よく知られている駆虫薬、並びに、昆虫及び／又はダニ抑制物質、前記忌避剤又は分離剤（detacher）などである。

【0065】

適切な殺虫剤及び殺ダニ剤の非限定的な例は以下のとおりである。

【0066】

【表1】

1. アバメクチン	28. カズサホス	56. シメチルピンホス
2. AC 303 630	29. カルバリル	57. シオキサチオン
3. アセフェート	30. カルボフラン	58. DPX-MP062
4. アクリナトリン	31. カルボフェノチオン	59. エシフェンホス
5. アラニカルブ	32. カルタップ	60. エマメクチン
6. アルジカルブ	33. クロエトカルブ	61. エントスルファン
7. α -シフルメトリン	34. クロルエトキシホス	62. エスフェンバレレート
8. アルファメトリン	35. クロルフェナピル	63. エチオフェンカルブ
9. アミトラス	36. クロルフルアズロン	64. エチオン
10. アベルメクチン B ₁	37. クロルメホス	65. エトフェンプロックス
11. AZ 60541	38. クロルピリホス	66. エトプロホス
12. アジンホス A	39. シス-レスメトリン	67. エトリムホス
13. アジンホス M	40. クロシトリン	68. フェナミホス
14. アゾシクロチン	41. クロフェンテジン	69. フェナザキン
15. Bacillus subtil. 毒素	42. シアノホス	70. フェンブタチノキシト
16. ヘンタイオカルブ	43. シクロプロトリン	71. フェントロチオン
17. ヘンフラカルブ	44. シフルトリン	72. フェノブカルブ
18. ヘンスルタップ	45. シヘキサチン	73. フェノチオカルブ
19. β -シフルトリン	46. D 2341	74. フェノキシカルブ
20. ヒフェントリン	47. テルタメトリン	75. フェンプロパトリン
21. BPMC	48. ジメトン M	76. フェンピラト
22. プロフェンプロックス	49. ジメトン S	77. フェンピロキシメート
23. プロモホス A	50. ジメトン-S-メチル	78. フェンチオン
24. プロフェンカルブ	51. ジクロロフェンチオン	79. フェンバレレート
25. プロプロフェジン	52. ジクリホス	80. フィプロニル
26. プロカルボキシ	53. ジエチオン	81. フルアジナム
27. プロチルピリダベン	54. ジフルベンスロン	82. フルアズロン
	55. ジメトエート	83. フルシクロクロスロン

10

20

30

40

84. フルシトリネート	116. メビンホス	149. ヒ°リブ°ロキシフェン
85. フルフェノクスロン	117. ミルベ°メクチン	150. RH 5992
86. フルフェンブ°ロックス	118. モキシテ°クチン	151. RH-2485
87. ホノホス	119. ナレット°	152. サリチオン
88. ホルモチオン	120. NC 184	153. セブ°ホス
89. ホスチアセ°ート	121. NI-25, アセタミブ°リト°	154. シラフルオフェン
90. フブ°フェンブ°ロックス	122. ニテンヒ°ラム	155. スビ°ノサト°
91. HCH	123. オメトエート	156. スルホテッブ°
92. ヘブ°テノホス	124. オキサミル	157. スルブ°ロホス
93. ヘキサフルムロン	125. オキシシ°メトン M	158. テブ°フェノシ°ト°
94. ヘキシチアゾ°ックス	126. オキシテ°ブ°ロホス	159. テブ°フェンビ°ラト°
95. ヒト°ロブ°レン	127. バ°ラチオン	160. テブ°ビ°リムホス
96. イミタ°クロブ°リト°	128. パ°ラチオン-メチル	161. テフルベ°ンス°ロン
97. 昆虫活性菌類	129. ペ°ルメトリン	162. テフルトリン
98. 昆虫活性線虫類	130. フェントエート	163. テメホス
99. 昆虫活性ウイルス類	131. ホレート	164. テルハ°ム
100. イブ°ロベンホス	132. ホサロン	165. テルブ°ホス
101. イソフェンホス	133. ホスメット	166. テトラクロルビ°ンホス
102. イソブ°ロカルブ°	134. ホキシム	167. チアフェノックス
103. イソキサチオン	135. ヒ°リミカルブ°	168. チオシ°カルブ°
104. イベルメクチン	136. ヒ°リミホス A	169. チオファノックス
105. エ°シハロトリン	137. ヒ°リミホス M	170. チオナジ°ン
106. ルフェヌロン	138. プ°ロメカルブ°	171. ツリンキ°エンシン
107. マラチオン	139. プ°ロバ°ホス	172. トラロメトリン
108. メカルハ°ム	140. プ°ロボ°クスル	173. トリアラセン
109. メスルフェンホス	141. プ°ロチオホス	174. トリアザ°メート
110. メタルテ°ヒト°	142. プ°ロトエート	175. トリアゾ°ホス
111. メタミト°ホス	143. ヒ°ラクロホス	176. トリアズ°ロン
112. メチオカルブ°	144. ヒ°ラダ°フェンチオン	177. トリクロルホン
113. メソミル	145. ヒ°レスメトリン	178. トリフルムロン
114. メトブ°レン	146. ヒ°レスラム	179. トリメタカルブ°
115. メトルカルブ°	147. ヒ°リダ°ベン	180. ハ°ミト°チオン
	148. ヒ°リミジ°フェン	181. XMC (3, 5-キシリルメチル カーハ°メート)

10

20

30

40

182. キシリルカルブ°

183. YI 5301/5302

185. ゼ°ータメトリン

184. ズ°シハ°ルメトリン

【0067】

適切な駆虫薬の非限定的な例を以下に挙げる。幾つかの例は、駆虫活性に加えて、殺虫活性及び殺ダニ活性を有し、一部、上記リストに既に記載されている。

【0068】

(A1) プラジカンテル = 2-シクロヘキシルカルボニル-4-オキソ-1, 2, 3, 6, 7, 11b-ヘキサヒドロ-4H-ピラジノ [2, 1- α] イソキノリン;

(A2) クロサンテル = 3, 5-ジヨード-N- [5-クロロ-2-メチル-4-(α -シアノ-4-クロロベンジル) フェニル] サリチルアミド;

(A3) トリクラベンダゾール = 5-クロロ-6-(2, 3-ジクロロフェノキシ)-2-メチルチオ-1H-ベンゾイミダゾール;

(A4) レバミゾール = L-(-)-2, 3, 5, 6-テトラヒドロ-6-フェニルイミダゾ [2, 1b] チアゾール;

(A5) メベンダゾール = (5-ベンゾイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル) カルバミン酸メチルエステル;

(A6) オムファロチン = WO 97 / 20857 に記載されている真菌 Omphalotus olearius の大環状発酵産物;

(A7) アバメクチン = アベルメクチン B1;

(A8) イベルメクチン = 22, 23-ジヒドロアベルメクチン B1;

(A9) モキシデクチン = 5-O-デメチル-28-デオキシ-25-(1, 3-ジメチル-1-ブテニル)-6, 28-エポキシ-23-(メトキシイミノ)-ミルベマイシン B;

(A10) ドラメクチン = 25-シクロヘキシル-5-O-デメチル-25-デ(1-メチルプロピル)-アベルメクチン A1a;

(A11) ミルベメクチン = ミルベマイシン A3 と ミルベマイシン A4 の混合物;

(A12) ミルベマイシンオキシム = ミルベマイシンの 5-オキシム。

【0069】

適切な忌避剤と分離剤の非限定的な例は以下のとおりである。

【0070】

(R1) DEET (N, N-ジエチル-m-トルアミド);

(R2) KBR 3023 N-ブチル-2-オキシカルボニル-(2-ヒドロキシ)-ピペリジン;

(R3) シミアゾール = N, -2, 3-ジヒドロ-3-メチル-1, 3-チアゾール-2-イリデン-2, 4-キシリデン。

【0071】

上記混合相手剤は、当該技術分野の専門家に最もよく知られているものである。大半のものは、「The Pesticide Manual」(The British Crop Protection Council, London) の多くの版に記載されており、他のものは、「The Merck Index」(Merck & Co., Inc., Rahway, New Jersey, USA) の多くの版又は特許文献に記載されている。従って、例示として少数の出典のみを以下に挙げる。

【0072】

(I) 2-メチル-2-(メチルチオ)プロピオンアルデヒド-O-メチルカルバモイルオキシム (アルジカルブ)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第26頁;

(II) S-(3, 4-ジヒドロ-4-オキソベンゾ [d] -[1, 2, 3]-トリアジン-3-イルメチル) O, O-ジメチル-ホスホロジチオエート (アジンホス-メチル)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br

10

20

30

40

50

itish Crop Protection Council, London, 第
67頁;

(III) エチル-N-[2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチルベンゾフラン-7-
イルオキシカルボニル-(メチル)アミノチオ]-N-イソプロピル-β-アラニネート
(ベンフラカルブ)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
96頁;

(IV) 2-メチルピフェニル-3-イルメチル-(Z)-(1RS)-シス-3-
(2-クロロ-3,3,3-トリフルオロプロプ-1-エニル)-2,2-ジメチルシク
ロプロパンカルボキシレート(ピフェントリン)

10

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
118頁;

(V) 2-tert-ブチルイミノ-3-イソプロピル-5-フェニル-1,3,5-チア
ジアジアン-4-オン(ブプロフェジン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
157頁;

(VI) 2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチルベンゾフラン-7-イル-メチルカル
バメート(カルボフラン)

20

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
186頁;

(VII) 2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチルベンゾフラン-7-イル-(ジブチ
ルアミノチオ)メチルカルバメート(カルボスルファン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
188頁;

(VIII) S,S-(2-ジメチルアミノトリメチレン)-ビス(チオカルバメー
ト)(カルタップ)

30

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
193頁;

(IX) 1-[3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-
ピリジルオキシ)フェニル]-3-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-尿素(クロル
フルアズロン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
213頁;

40

(X) O,O-ジエチル-O-3,5,6-トリクロロ-2-ピリジル-ホスホルチ
オエート(クロルピリホス)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第
235頁;

(XI) (RS)-α-シアノ-4-フルオロ-3-フェノキシベンジル-(1RS
,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-ジクロロビニル)-2,2-ジメチルシク
ロプロパンカルボキシレート(シフルトリン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The Br
itish Crop Protection Council, London, 第

50

293頁；

(XII) (S) - α -シアノ-3-フェノキシベンジル - (Z) - (1R, 3R) - 3 - (2-クロロ-3, 3, 3-トリフルオロプロペニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートと (R) - α -シアノ-3-フェノキシベンジル - (Z) - (1R, 3R) - 3 - (2-クロロ-3, 3, 3-トリフルオロプロペニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートの混合物 (ラムダーシハロトリン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第300頁；

(XIII) (S) - α -シアノ-3-フェノキシベンジル - (Z) - (1R, 3R) - 3 - (2, 2-ジクロロビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートと (R) - α -シアノ-3-フェノキシベンジル (1S, 3S) - 3 - (2, 2-ジクロロビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートのラセミ化合物 (アルファーシペルメトリン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第308頁；

(XIV) (S) - α -シアノ-3-フェノキシベンジル (1RS, 3RS, 1RS, 3RS) - 3 - (2, 2-ジクロロビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレートの立体異性体混合物 (ゼーターシペルメトリン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第314頁；

(XV) (S) - α -シアノ-3-フェノキシベンジル - (1R, 3R) - 3 - (2, 2-ジブromoビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (デルタメトリン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第344頁；

(XVI) (4-クロロフェニル) - 3 - (2, 6-ジフルオロベンゾイル) 尿素 (ジフルベンズロン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第395頁；

(XVII) (1, 4, 5, 6, 7, 7-ヘキサクロロ-8, 9, 10-トリノルボルン-5-エン-2, 3-イルエンビスメチレン) - スルファイト (エンドスルファン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第459頁；

(XVIII) α -エチルチオ- α -トリル-メチルカルバメート (エチオフェンカルブ)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第479頁；

(XIX) O, O-ジメチル-O-4-ニトロ-m-トリル-ホスホロチオエート (フェニトチオン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第514頁；

(XX) 2-s-ブチルフェニル-メチルカルバメート (フェノブカルブ)

10

20

30

40

50

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第516頁;

(XXI) (RS)- α -シアノ-3-フェノキシベンジル-(RS)-2-(4-クロロフェニル)-3-メチルブチレート(フェンバレレート)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第539頁;

(XXII) S-[ホルミル(メチル)カルバモイルメチル]-O, O-ジメチル-ホスホロチオエート(ホルモチオン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第625頁;

(XXIII) 4-メチルチオ-3, 5-キシリル-メチルカルバメート(メチオカルブ)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第813頁;

(XXIV) 7-クロロビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2, 6-ジエン-6-イル-ジメチルホスフェート(ヘプテノホス)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第670頁;

(XXV) 1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-イリデンアミン(イミダクロプリド)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第706頁;

(XXVI) 2-イソプロピルフェニル-メチルカルバメート(イソプロカルブ)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第729頁;

(XXVII) O, S-ジメチル-ホスホルアミドチオエート(メタミドホス)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第808頁;

(XXVIII) S-メチル-N-(メチルカルバモイルオキシ)チオアセトイミデート(メソミル)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第815頁;

(XXIX) メチル-3-(ジメトキシホスフィノイルオキシ)ブト-2-エノエート(メビンホス)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第844頁;

(XXX) O, O-ジエチル-O-4-ニトロフェニル-ホスホロチオエート(パラチオン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第

10

20

30

40

50

926頁；

(XXXXI) O, O-ジメチル-O-4-ニトロフェニル-ホスホロチオエート (パラチオン-メチル)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第928頁；

(XXXXII) S-6-クロロ-2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-1, 3-ベンゾオキサゾール-3-イルメチル-O, O-ジエチル-ホスホルジチオエート (ホサロン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第963頁；

10

(XXXXIII) 2-ジメチルアミノ-5, 6-ジメチルピリミジン-4-イル-ジメチルカルバメート (ピリミカルブ)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第985頁；

(XXXXIV) 2-イソプロポキシフェニル-メチルカルバメート (プロポクスル)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1036頁；

20

(XXXXV) 1-(3, 5-ジクロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-3-(2, 6-ジフルオロベンゾイル) 尿素 (テフルベンズロン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1158頁；

(XXXXVI) S-tert-ブチルチオメチル-O, O-ジメチル-ホスホロジチオエート (テルブホス)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1165頁；

30

(XXXXVII) エチル-(3-tert-ブチル-1-ジメチルカルバモイル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル-チオ)-アセテート (トリアザメート)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1224頁；

(XXXXVIII) アバメクチン

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第3頁；

(XXXXIX) 2-s-ブチルフェニル-メチルカルバメート (フェノブカルブ)

40

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第516頁；

(XL) N-tert-ブチル-N-(4-エチルベンゾイル)-3, 5-ジメチルベンゾヒドラジド (テブフェノジド)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1147頁；

(XLI) (±)-5-アミノ-1-(2, 6-ジクロロ-α, α, α-トリフルオロ-p-トリル)-4-トリフルオロメチル-スルフィニルピラゾール-3-カルボニト

50

リル (フィプロニル)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第545頁;

(XLI I) (RS) - α -シアノ-4-フルオロ-3-フェノキシベンジル (1RS, 3RS; 1RS, 3RS) - 3- (2, 2-ジクロロビニル) - 2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (ベータ-シフルトリン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第295頁;

(XLI I I) (4-エトキシフェニル) - [3- (4-フルオロ-3-フェノキシフェニル) プロピル] (ジメチル) シラン (シラフルオフエン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1105頁;

(XLIV) t-ブチル (E) - α - (1, 3-ジメチル-5-フェノキシピラゾール-4-イルメチレンアミノ-オキシ) - p-トルエート (フェンピロキシメート)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第530頁;

(XLV) 2-t-ブチル-5- (4-t-ブチルベンジルチオ) - 4-クロロピリダジン-3 (2H) - オン (ピリダベン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1161頁;

(XLVI) 4- [[4- (1, 1-ジメチルフェニル) フェニル] エトキシ] - キナゾリン (フェナザキン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第507頁;

(XLVII) 4-フェノキシフェニル- (RS) - 2- (ピリジルオキシ) プロピル-エーテル (ピリプロキシフェン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1073頁;

(XLVIII) 5-クロロ-N- {2- [4- (2-エトキシエチル) - 2, 3-ジメチルフェノキシ] エチル} - 6-エチルピリミジン-4-アミン (ピリミジフェン)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1070頁;

(XLI X) (E) - N- (6-クロロ-3-ピリジルメチル) - N-エチル-N-メチル-2-ニトロビニリデンジアミン (ニテンピラム)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第880頁;

(L) (E) - N¹ - [(6-クロロ-3-ピリジル) メチル] - N² - シアノ-N¹ - メチルアセトアミジン (NI-25, アセタミプリド)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第9頁;

10

20

30

40

50

(L I) アベルメクチン B₁
The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第3頁;

(L I I) 植物から得た昆虫活性抽出物、特に、(2 R, 6 a S, 1 2 a S) - 1, 2, 6, 6 a, 1 2, 1 2 a - ヘキサヒドロ - 2 - イソプロペニル - 8, 9 - ジメトキシ - クロメノ [3, 4 - b] フロ [2, 3 - h] クロメン - 6 - オン (ロテノン)
The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1097頁; 及び、

Azadirachta indica から得た抽出物、特に、アザジラクチン
The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第59頁;

(L I I I) 昆虫活性線虫を含有する調製物、好ましくは、Heterorhabditis bacteriophora を含有する調製物、及び、Heterorhabditis megidis を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第671頁; 及び、

Steinernema feltiae を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1115頁; 及び、

Steinernema scapterisci を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1116頁;

(L I V) Bacillus subtilis から得られる調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第72頁; 又は、

Bacillus thuringiensis の株から得られる調製物 (但し、GC 91 及び NCTC 11821 から単離される化合物は除く)

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第73頁;

(L V) 昆虫活性菌類を含有する調製物、好ましくは、Verticillium lecanii を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1266頁; 及び、

Beauveria brogniartii を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第85頁; 及び、

Beauveria bassiana を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第83頁;

10

20

30

40

50

(LVI) 昆虫活性ウイルスを含有する調製物、好ましくは、Neodiprion sertifer NPV を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1342頁; 及び、

Mamestra brassicae NPV を含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第759頁; 及び、

Cydia pomonella granulosus ウイルスを含有する調製物

The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第291頁;

10

(CLXXXI) 7-クロロ-2, 3, 4a, 5-テトラヒドロ-2-[メトキシカルボニル(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバモイル]インドール[1, 2e]オキサゾリン-4a-カルボキシレート(DPX-MP062, インドキシカルブ)
The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第453頁;

(CLXXXII) N-tert-ブチル-N'-(3, 5-ジメチルベンゾイル)-3-メトキシ-2-メチルベンゾヒドラジド(RH-2485, メトキシフェノジド)
The Pesticide Manual, 第11版(1997), The British Crop Protection Council, London, 第1094頁;

20

(CLXXXIII) (N'-[4-メトキシ-ビフェニル-3-イル]-ヒドラジンカルボン酸イソプロピルエステル(D 2341)
Brighton Crop Protection Conference, 1996, 487-493;

(R2) 要約集, 212th ACS National Meeting Orlando, FL, August 25-29 (1996), AGRO-020.
発行者: American Chemical Society, Washington, D. C. CONEN: 63BFAF.

30

【0073】

上記で詳述した結果として、本発明の別の本質的な態様は、温血動物の寄生虫を防除するための組合せ調製物に関し、当該調製物は、式(I)の化合物の他に、同一又は異なる範囲の活性をもつ少なくとも1種の別の活性成分と、少なくとも1種の生理学的に許容される担体を含有することを特徴とする。本発明は、2成分の組合せに限定されない。

【0074】

一般に、本発明の駆虫剤組成物は、0.1~99重量%、特に、0.1~95重量%の式(I)の活性成分、式(Ia)の活性成分又はその混合物、及び、99.9~1重量%、特に、99.8~5重量%の固体又は液体の添加剤(ここで、添加剤は、0~25重量%、特に、0.1~25重量%の界面活性剤を含む)を含有する。

40

【0075】

本発明の組成物は、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、(水薬剤)、粉末剤、錠剤、大型丸薬剤(boli)、カプセル剤又はポアオン製剤の形態で、処置すべき動物に対して、局所的に、経口的に、非経口的に又は皮下に施用し得る。

【0076】

ポアオン又はスポットオン法では、式(I)の化合物を、動物の皮膚又は毛皮の特定の部位に施用し、有利には、動物の頸又は背に施用する。ポアオン又はスポットオン法による施用は、例えば、ポアオン又はスポットオン製剤を含んだ綿棒又は噴霧を動物の毛皮の

50

比較的狭い領域に適用することにより行うが、その際、活性物質は、当該製剤に含まれる成分のもつ拡散性と当該動物の運動により、適用された領域から殆ど自動的に毛皮の広い領域にまで分散される。

【0077】

ポアオン又はスポットオン製剤は、適切には、宿主動物の皮膚表面上又は毛皮内での急速な分散を促進する担体を含有する。そのような担体は、一般に、拡散性油と見なされる。適する担体は、例えば、油性溶液；アルコール溶液及びイソプロパノール溶液、例えば、2-オクチルドデカノール又はオレイルアルコールの溶液；モノカルボン酸エステルの溶液、例えば、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、ラウリン酸オキサレート、オレイン酸オレイルエステル、オレイン酸デシルエステル、ラウリン酸ヘキシル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル若しくは $C_{12} \sim C_{18}$ の鎖長を有する飽和脂肪アルコールのカプリン酸エステルの溶液；ジカルボン酸エステルの溶液、例えば、フタル酸ジブチル、イソフタル酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソプロピルエステル若しくはアジピン酸ジ-n-ブチルの溶液、あるいはまた、脂肪族酸のエステルの溶液、例えば、グリコール類の溶液などである。分散剤、例えば、製薬産業又は化粧品産業で知られている分散剤を加えると有利であり得る。その例には、2-ピロリドン、2-(N-アルキル)ピロリドン、アセトン、ポリエチレングリコール及びそのエーテル及びエステル、プロピレングリコール、又は、合成トリグリセリド類などがある。

10

【0078】

油性溶液としては、例えば、植物油、例えば、オリーブ油、ラッカセイ油、ゴマ油、マツ油、アマニ油又はヒマシ油などを挙げることができる。前記植物油は、エポキシ化された形態で存在させてもよい。パラフィン油やシリコン油も使用し得る。

20

【0079】

ポアオン又はスポットオン製剤は、一般に、1~20重量%の式(I)の化合物、0.1~50重量%の分散剤及び45~98.9重量%の溶媒を含有する。

【0080】

ポアオン又はスポットオン法は、全ての動物に経口的に処理するか又は注射により処理するのが困難であるか又は多大な時間を必要とする、ウシ、ウマ、ヒツジ又はブタなどの動物の群れに対して用いるのが特に有利である。ポアオン又はスポットオン法は容易であるので、この方法は、当然のことながら、個々の飼育動物又はペットなどを包含する他の全ての動物に対しても用いることができ、専門の獣医がいなくともしばしば実施することができるので、そのような動物の飼育者に非常に好まれている。

30

【0081】

市販製品は濃厚物として製剤するのが好ましいが、最終使用者は、通常、希釈製剤を使用する。

【0082】

そのような組成物は、安定剤、消泡剤、粘度調節剤、結合剤又は粘着付与剤などの別の添加剤も含有し得るし、さらにまた、特定の効果を得るために別の活性成分も含有し得る。

【0083】

このタイプの駆虫性組成物は最終使用者により使用されるが、そのような組成物も同様に、本発明の一部を形成する。

40

【0084】

本発明の害虫防除方法の各々又は本発明の害虫防除用組成物の各々において、式(I)の活性成分は、その全ての立体配置において、又は、それらの混合物として使用することができる。

【0085】

本発明は、さらに、温血動物、特に、生産性家畜、飼育動物及びペットを寄生性蠕虫から予防的に保護する方法も包含し、当該方法は、式(I)の活性成分又は式(I)の活性成分から調製した活性成分含有製剤を、飼料若しくは飲料への添加物として、又は、固体

50

若しくは液体の形態で、経口的に又は注射により又は非経口的に前記動物に投与することを特徴とする。本発明は、さらに、上記方法の1つで使用するための本発明の式(I)の化合物を包含する。

【0086】

以下に示す実施例は、本発明を制限することなく、本発明を単に例証するためのものである。「活性成分」という用語は、表1中に挙げられている物質を表す。

【実施例】

【0087】

好ましい製剤は、特に、以下のように調製する。(％＝重量％)

製剤実施例

1. 粒剤

	(a)	(b)
活性成分	5％	10％
カオリン	94％	—
高分散ケイ酸	1％	—
アタパルジャイト	—	90％

活性成分を塩化メチレンに溶解させ、担体に噴霧した後、減圧下に蒸発させて溶媒を濃縮する。このような粒剤は、動物飼料に混合することができる。

【0088】

2. 粒剤

活性成分	3％
ポリエチレングリコール (mw 200)	3％
カオリン	94％
(mw＝分子量)	

微粉碎した活性成分を、ポリエチレングリコールで湿らせておいたカオリンにミキサー内で均一に適用する。このようにして、粉塵のない被覆粒剤を得る。

【0089】

3. 錠剤又は大型丸薬剤

(I)	活性成分	33.00％
	メチルセルロース	0.80％
	高分散ケイ酸	0.80％
	トウモロコシデンプン	8.40％
(II)	結晶質ラクトース	22.50％
	トウモロコシデンプン	17.00％
	微晶質セルロース	16.50％
	ステアリン酸マグネシウム	1.00％

(I) メチルセルロースを水中で攪拌する。メチルセルロースが膨潤した後、ケイ酸を攪拌し、得られた混合物を均質に懸濁させる。活性成分とトウモロコシデンプンを混合する。この混合物に上記で得られた水性懸濁液を加え、混練して練り粉状にする。得られた塊状物を12Mの篩を通すことにより造粒し、乾燥する。

(II) 4種類の全ての賦形剤を十分に混合する。

(III) (I)及び(II)で得られた予備混合物を混合し、圧縮して、錠剤又は大型丸薬剤とする。

【0090】

4. 注射用製剤

A. 油性ビヒクル (徐放性)

1.	活性成分	0.1～1.0g
	ラッカセイ油	100mLまで
2.	活性成分	0.1～1.0g
	ゴマ油	100mLまで

10

20

30

40

50

調製： 油の一部を攪拌しながら、それに、活性成分を溶解させ、その際、必要な場合には、適度に加熱する。次いで、冷却した後、所望の容積とし、 $0.22\text{ }\mu\text{m}$ の細孔径を有する適切な濾過膜を通して無菌濾過する。

【0091】

B. 水混和性溶媒（平均的な放出速度）

- | | | | |
|----|-----------------------|-----------|----|
| 1. | 活性成分 | 0.1～1.0 g | |
| | 4-ヒドロキシメチル-1,3-ジオキソラン | 40 g | |
| | (Glycerol Formal) | | |
| | 1,2-プロパンジオール | 100 mLまで | |
| 2. | 活性成分 | 0.1～1.0 g | 10 |
| | グリセロールジメチルケタール | 40 g | |
| | 1,2-プロパンジオール | 100 mLまで | |

調製： 溶媒の一部を攪拌しながら、それに、活性成分を溶解させ、所望の容積とし、次いで、 $0.22\text{ }\mu\text{m}$ の細孔径を有する適切な濾過膜を通して無菌濾過する。

【0092】

C. 水溶液（急速放出）

- | | | | |
|----|-----------------------|-----------|----|
| 1. | 活性成分 | 0.1～1.0 g | |
| | ポリエトキシ化ヒマシ油 | 10 g | |
| | (40エチレンオキシド単位) | | |
| | 1,2-プロパンジオール | 20 g | 20 |
| | ベンジルアルコール | 1 g | |
| | 注射用水 | 100 mLまで | |
| 2. | 活性成分 | 0.1～1.0 g | |
| | ポリエトキシ化ソルビタンモノオレエート | 8 g | |
| | (20エチレンオキシド単位) | | |
| | 4-ヒドロキシメチル-1,3-ジオキソラン | 20 g | |
| | (Glycerol Formal) | | |
| | ベンジルアルコール | 1 g | |
| | 注射用水 | 100 mLまで | |

調製： 溶媒と界面活性剤に活性成分を溶解させ、水を用いて所望の容積とする。次いで、 $0.22\text{ }\mu\text{m}$ の細孔径を有する適切な濾過膜を通して無菌濾過する。

【0093】

5. ポアオン

- | | | | |
|----|--------------|-----------|----|
| A. | 活性成分 | 5 g | |
| | ミリスチン酸イソプロピル | 10 g | |
| | イソプロパノール | 100 mLまで | |
| B. | 活性成分 | 2 g | |
| | ラウリン酸ヘキシル | 5 g | |
| | 中鎖長トリグリセリド | 15 g | |
| | エタノール | 100 mLまで | 40 |
| C. | 活性成分 | 2 g | |
| | オレイン酸オレイル | 5 g | |
| | N-メチル-ピロリドン | 40 g | |
| | イソプロパノール | 100 mLまで。 | |

【0094】

上記水性系を、好ましくは、経口投与及び／又は第1胃内投与に用いることもできる。

【0095】

上記組成物は、さらなる添加剤、例えば、安定剤、例えば、適切な場合には、エポキシ化植物油（エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又はダイズ油）、消泡剤、例えば、シリコーン油、保存剤、粘度調節剤、結合剤及び粘着付与剤などを含有し得るし、さらに、肥料や、特

定の効果を得るための別の活性成分も含有し得る。

【0096】

式(I)の化合物に対して中性であり且つ処理しようとする動物に対して有害な作用を示さない別の生物活性物質又は添加剤や、無機塩又はビタミン類も、上記組成物に添加することができる。

【0097】

以下に示す実施例は、本発明を例証するためのものであり、本発明を限定するものではない。文字「h」は、時間を表す。

【0098】

調製実施例

実施例1：N-[2-シアノ-1-(4, 5-ジフルオロ-4'-ジメチルアミノ-2-ビフェノキシ)-2-プロピル]-4-トリフルオロメトキシベンズアミド

(a) 40 mLのアセトン中の4 gの2-ブロモ-4, 5-ジフルオロフェノールに、2.5 gのクロロアセトン、3 gの炭酸カリウム及び0.3 gのヨウ化カリウムを添加し、室温で3時間攪拌する。濾過後、得られた溶液を蒸発させることにより濃縮して、1-(2-ブロモ-4, 5-ジフルオロフェノキシ)-プロパ-2-オンを粗生成物として得る。これは、精製することなくさらに処理する。

【0099】

(b) 19 mLの25%アンモニア含有水溶液に、5.1 gの1-(2-ブロモ-4, 5-ジフルオロフェノキシ)-プロパン-2-オン、1.1 gのシアン化ナトリウム及び1.5 gの塩化アンモニウムを添加し、室温で一晩攪拌する。その後、反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機相を水及びブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで脱水する。濾過し、減圧下に蒸発させることにより濃縮した後、2-アミノ-3-(2-ブロモ-4, 5-ジフルオロフェノキシ)-2-メチルプロピオニトリルを粗生成物として得る。これは、精製することなくさらに処理する。

【0100】

(c) 300 mgの2-アミノ-3-(2-ブロモ-4, 5-ジフルオロフェノキシ)-2-メチルプロピオニトリル、129 mgのヒューニツヒ塩基、270 mgの4-トリフルオロメトキシベンゾイルクロリド及び12 mgの4-ジメチルアミノピリジンの混合物を、10 mLのジクロロメタン中で、室温で12時間攪拌する。その後、酢酸エチルを加えて反応混合物を希釈し、飽和重炭酸ナトリウム溶液で2回洗浄し、1 N塩酸水溶液で2回洗浄し、最後に、ブラインで2回洗浄し、次いで、濾過した後、蒸発させることにより有機相を濃縮する。残渣をフラッシュクロマトグラフィーで精製することにより、N-[2-シアノ-1-(2-ブロモ-4, 5-ジフルオロフェノキシ)-2-プロピル]-4-トリフルオロメトキシベンズアミドを得る。

【0101】

(d) 200 mgのN-[2-シアノ-1-(2-ブロモ-4, 5-ジフルオロフェノキシ)-2-プロピル]-4-トリフルオロメトキシベンズアミド、309 mgの4-ジメチルアミノフェニルホウ酸及び6 mLの飽和重炭酸ナトリウム溶液を8 mLのトルエン中で混合し、窒素を用いて15分間すすぎ洗いし、次いで、66 mgのテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムを添加した後、2日間還流下に沸騰させる。その後、有機相を分離し、水相を酢酸エチルで3回抽出する。有機相を合し、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に蒸発させることにより濃縮する。残渣をフラッシュクロマトグラフィーによって精製した後、60~61℃の融点を有する標題化合物を得る。

【0102】

下記表に記載されている物質は、上記方法と類似した方法で調製することができる。融点の値は、℃で与えられている。

【0103】

10

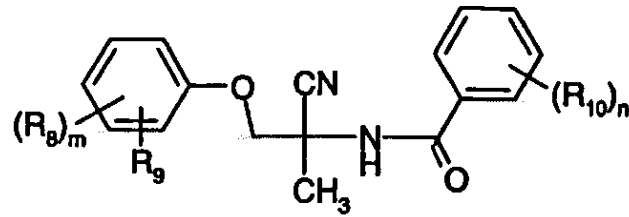
20

30

40

【表 2】

表 1



No.	(R ₈) _m	R ₉	(R ₁₀) _n	物理データ
1. 1	4-F	2-(3-シクロプロピルフェニル)	4-F	10
1. 2	4-F	2-(3-シクロプロピルフェニル)	4-CF ₃	
1. 3	4-F	2-(3-シクロプロピルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 4	4-F	2-(3-シクロプロピルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 5	4-F	2-(3-シクロプロピルフェノキシ)	4-F	
1. 6	4-F	2-(3-シクロプロピルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 7	4-F	2-(3-シクロプロピルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 8	4-F	2-(3-シクロプロピルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 9	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-F	
1. 10	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-CF ₃	20
1. 11	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 12	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 13	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-F	
1. 14	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 15	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 16	4-F	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 17	4-F	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-F	
1. 18	4-F	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-CF ₃	
1. 19	4-F	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-OCF ₃	30
1. 20	4-F	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 21	4-F	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-F	
1. 22	4-F	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 23	4-F	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 24	4-F	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 25	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-F	
1. 26	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 27	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 28	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	40
1. 29	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-F	
1. 30	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 31	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 32	4-F	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 33	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-F	
1. 34	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-CF ₃	
1. 35	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 36	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 37	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-F	
1. 38	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 39	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 40	4-F	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	

1. 41	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェニル)	4-F	
1. 42	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 43	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 44	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 45	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェノキシ)	4-F	
1. 46	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 47	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 48	4-F	2-(3-シクロプロポキシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 49	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェニル)	4-F	
1. 50	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェニル)	4-CF ₃	10
1. 51	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 52	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 53	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェノキシ)	4-F	
1. 54	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 55	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 56	4-F	2-(4-シクロプロポチルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 57	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェニル)	4-F	
1. 58	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 59	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 60	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 61	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェノキシ)	4-F	20
1. 62	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 63	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 64	4-F	2-(4-シクロプロポキシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 65	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-F	
1. 66	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-CF ₃	
1. 67	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-OCF ₃	
1. 68	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 69	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F	
1. 70	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃	
1. 71	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 72	4-F	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 73	4-F	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F	30
1. 74	4-F	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃	
1. 75	4-F	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 76	4-F	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 77	4-F	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F	
1. 78	4-F	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃	
1. 79	4-F	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 80	4-F	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 81	4-F	2-((3,4-OCH ₂ O)フェニル)	4-F	
1. 82	4-F	2-((3,4-OCH ₂ O)フェニル)	4-CF ₃	
1. 83	4-F	2-((3,4-OCH ₂ O)フェニル)	4-OCF ₃	
1. 84	4-F	2-((3,4-OCH ₂ O)フェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	40
1. 85	5-Cl	2-(3-シクロプロポヒポルフェニル)	4-F	
1. 86	5-Cl	2-(3-シクロプロポヒポルフェニル)	4-CF ₃	
1. 87	5-Cl	2-(3-シクロプロポヒポルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 88	5-Cl	2-(3-シクロプロポヒポルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 89	5-Cl	2-(3-シクロプロポヒポルフェノキシ)	4-F	
1. 90	5-Cl	2-(3-シクロプロポヒポルフェノキシ)	4-CF ₃	

1. 91	5-Cl	2-(3-シクロプロピルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 92	5-Cl	2-(3-シクロプロピルフェノキシ)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 93	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-F	
1. 94	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 95	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 96	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェニル)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 97	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-F	
1. 98	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 99	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 100	5-Cl	2-(3-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-C(0)C ₆ H ₅	10
1. 101	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-F	
1. 102	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-CF ₃	
1. 103	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 104	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェニル)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 105	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-F	
1. 106	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 107	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 108	5-Cl	2-(4-シクロプロピルフェノキシ)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 109	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-F	
1. 110	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 111	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-OCF ₃	20
1. 112	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェニル)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 113	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-F	
1. 114	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 115	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 116	5-Cl	2-(4-シクロプロピルキシフェノキシ)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 117	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-F	
1. 118	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-CF ₃	
1. 119	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 120	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェニル)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 121	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-F	
1. 122	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 123	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-OCF ₃	30
1. 124	5-Cl	2-(3-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 125	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェニル)	4-F	
1. 126	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 127	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 128	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェニル)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 129	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェノキシ)	4-F	
1. 130	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 131	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 132	5-Cl	2-(3-シクロプロピルトリキシフェノキシ)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 133	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェニル)	4-F	
1. 134	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェニル)	4-CF ₃	40
1. 135	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 136	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェニル)	4-C(0)C ₆ H ₅	
1. 137	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-F	
1. 138	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 139	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 140	5-Cl	2-(4-シクロプロピルチルフェノキシ)	4-C(0)C ₆ H ₅	

1. 141	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェニル)	4-F	
1. 142	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 143	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 144	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 145	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェノキシ)	4-F	
1. 146	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 147	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 148	5-Cl	2-(4-シクロプロ [*] トキシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 149	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-F	
1. 150	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-CF ₃	10
1. 151	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-OCF ₃	
1. 152	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 153	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F	
1. 154	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃	
1. 155	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 156	5-Cl	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 157	5-Cl	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F	
1. 158	5-Cl	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃	
1. 159	5-Cl	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 160	5-Cl	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 161	5-Cl	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F	20
1. 162	5-Cl	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃	
1. 163	5-Cl	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 164	5-Cl	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 165	5-Cl	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-F	
1. 166	5-Cl	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-CF ₃	
1. 167	5-Cl	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-OCF ₃	
1. 168	5-Cl	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 169	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-F	
1. 170	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-CF ₃	
1. 171	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 172	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	30
1. 173	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-F	
1. 174	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 175	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 176	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 177	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェニル)	4-F	
1. 178	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェニル)	4-CF ₃	
1. 179	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 180	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 181	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-F	
1. 182	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 183	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 184	4, 5-F ₂	2-(3-シクロプロ [*] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	40
1. 185	4, 5-F ₂	2-(4-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-F	
1. 186	4, 5-F ₂	2-(4-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-CF ₃	
1. 187	4, 5-F ₂	2-(4-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 188	4, 5-F ₂	2-(4-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 189	4, 5-F ₂	2-(4-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-F	
1. 190	4, 5-F ₂	2-(4-シクロプロ [*] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-CF ₃	

1. 191	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 192	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロヒ [°] ルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 193	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェニル)	4-F	
1. 194	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェニル)	4-CF ₃	
1. 195	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 196	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 197	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-F	
1. 198	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 199	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 200.	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] ロホ [°] キシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	10
1. 201	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェニル)	4-F	
1. 202	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェニル)	4-CF ₃	
1. 203	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 204	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 205	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-F	
1. 206	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 207	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 208	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 209	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-F	
1. 210	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 211	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-OCF ₃	20
1. 212	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 213	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-F	
1. 214	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 215	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 216	4, 5-F ₂	2-(3-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 217	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェニル)	4-F	
1. 218	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェニル)	4-CF ₃	
1. 219	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェニル)	4-OCF ₃	
1. 220	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 221	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-F	
1. 222	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 223	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-OCF ₃	30
1. 224	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] チルフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 225	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-F	
1. 226	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-CF ₃	
1. 227	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-OCF ₃	
1. 228	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 229	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-F	
1. 230	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-CF ₃	
1. 231	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 232	4, 5-F ₂	2-(4-シクロフ [°] トキシフェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	
1. 233	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-F	
1. 234	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-CF ₃	
1. 235	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-OCF ₃	m. p. 60-1°
1. 236	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅	40
1. 237	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F	
1. 238	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃	
1. 239	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃	
1. 240	4, 5-F ₂	2-(4-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅	

1. 241	4, 5-F ₂	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F
1. 242	4, 5-F ₂	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃
1. 243	4, 5-F ₂	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃
1. 244	4, 5-F ₂	2-(3-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅
1. 245	4, 5-F ₂	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-F
1. 246	4, 5-F ₂	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-CF ₃
1. 247	4, 5-F ₂	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-OCF ₃
1. 248	4, 5-F ₂	2-(2-N(CH ₃) ₂ -フェノキシ)	4-C(O)C ₆ H ₅
1. 249	4, 5-F ₂	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-F
1. 250	4, 5-F ₂	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-CF ₃
1. 251	4, 5-F ₂	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-OCF ₃ m. p. 172-3°
1. 252	4, 5-F ₂	2-((3, 4-OCH ₂ O)フェニル)	4-C(O)C ₆ H ₅

10

【0104】

生物学の実施例

1. スナネズミ (*Meriones unguiculatus*) に寄生している *Trichostrongylus colubriformis* 及び *Haemonchus contortus* に対する、経口投与によるインビボ試験

人工飼料により、*T. colubriformis* 及び *H. contortus* の各々の3齢幼虫約2000匹を6～8週齢のスナネズミに感染させる。感染の6日後、N₂Oを用いてスナネズミに軽く麻酔をかけ、経口投与により、2部のDMSOと1部のポリエチレングリコール (PEG300) の混合物に溶解させた100、32及び10～0.1 mg/kgの量の被検化合物で処理する。9日目(処理3日後)、まだ存在している *H. contortus* の大半が4齢幼虫の後期であり、*T. colubriformis* の大半が未成熟成虫であるときに、虫の数を計数するためにスナネズミを殺す。被検化合物の効力を、感染させたが処理していない8匹のスナネズミから得た虫の数の幾何平均との比較における各スナネズミ内の虫の数の減少%として計算する。

20

【0105】

この試験において、式(I)の化合物により線虫の寄生が著しく減少する。

30

【0106】

動物及び植物に対する式(I)の化合物の殺虫活性及び／又は殺ダニ活性を調べるために、以下の試験方法を用いることができる。

【0107】

2. *Lucilia sericata* のL₁幼虫に対する活性

被検活性物質の水性懸濁液1mLを、約50℃で、3mLの特定幼虫用成長培地と混合し、250ppm又は125ppmのいずれかの活性成分を含有するホモジェネートを得る。各試験管サンプル内で、約30匹の *Lucilia* 幼虫 (L₁) を用いる。4日後、死亡率を決定する。

【0108】

3. *Boophilus microplus* (Biarra系統) に対する殺ダニ活性

40

一片の粘着テープをPVCシートに水平に接着して、血を吸って完全に充血した10匹の雌マダニ *Boophilus microplus* (Biarra系統) を当該粘着テープに一列に並べてその背中で付着できるようにする。注射針を用いて、各マダニに1μLの液体を注射する。当該液体は、ポリエチレングリコールとアセトンの1:1混合物であり、マダニ1匹当たり1μg、0.1μg又は0.01μgから選択された特定量の活性成分を前記混合物に溶解した状態で含有する。対照動物には、活性成分を含まない注射を与える。処理後、産卵が起こり、対照マダニの卵から幼虫が孵化するまで、マダニを約28℃で相対湿度80%の昆虫飼育室内の正常な条件下に維持する。被検物質の活性をI

50

R₉₀によって決定する。即ち、10匹の雌マダニのなかの9匹(=90%)が30日後でも繁殖能力のない卵を産むような活性成分の投与量により評価する。

【0109】

4. 充血している雌Boophilus microplus (BIAARRA) に対するインビトロでの効力

4×10匹の血を吸って充血しているOP-抵抗性BIAARRA系統の雌マダニを粘着ストリップに付着させ、それぞれ500ppm、125ppm、31ppm及び8ppmの濃度の被検化合物のエマルジョン又は懸濁液に浸漬した脱脂綿のボールで1時間覆う。28日後に、死亡率、産卵及び孵化幼虫に基づいて評価する。

【0110】

被検化合物の活性の目安は、以下の状態にある雌の数によって示す：

- 産卵する前に直ぐに死亡する；
- 産卵せずにしばらく生存している；
- 産卵するが、胚は形成されない；
- 産卵し、胚は形成されるが、幼虫は孵化しない；

及び、

- 産卵し、胚が形成され、幼虫は、26～27日以内に正常に孵化する。

【0111】

5. Amblyomma hebraeumの若虫に対するインビトロでの効力

絶食させた約5匹の若虫を、溶液、懸濁液又はエマルジョンの状態にある2mLの被検化合物が入っているポリスチレン製試験管内に入れる。

【0112】

10分間浸漬し、ボルテックスミキサー上で2×10秒間振盪した後、脱脂綿を丸めたものをきつく詰めて試験管を塞ぎ、回転させる。全ての液体が脱脂綿のボールに染み込んだら、直ぐに、試験管を回転させたまま脱脂綿のボールを試験管の中程まで押し込み、当該液体の大半が脱脂綿のボールから絞り出されて、下のペトリ皿に流れ込むようにする。

【0113】

次いで、評価する時点まで、試験管を日光の当たる室内に室温で維持する。14日後、試験管をビーカー内の沸騰水に浸す。熱に反応してマダニが動き出した場合、被検物質は試験に用いた濃度で不活性であり、マダニが動き出さない場合は、マダニは死亡していると見なし、被検物質は試験に用いた濃度で活性を有すると見なす。全ての物質は、0.1～100ppmの範囲の濃度で試験する。

【0114】

6. Dermanyssus gallinaeに対する活性

10ppmの活性成分を含んでいる2～3mLの溶液と、種々の発育段階にある約200匹のダニ(Dermanyssus gallinae)を、頂部が空いているガラス製容器に入れる。次いで、脱脂綿を丸めたもので容器を閉じ、ダニが完全に濡れるまでガラス容器を10分間振盪した後、少しの間逆さにして、脱脂綿が残った被検溶液を吸収できるようにする。3日後、死亡しているダニの個体数を数えることにより死亡率を求めて、百分率で示す。

【0115】

7. Musca domesticaに対する活性

一晚乾燥させた後に角砂糖中の被検化合物の濃度が250ppmとなるように、被検化合物の溶液で角砂糖を処理する。このように処理した角砂糖を、湿らせた脱脂綿及び10匹のOP-抵抗性系統のMusca domesticaの成虫と一緒にアルミニウム製の皿の上に置き、ビーカーで覆い、25℃でインキュベーションする。24時間後に死亡率を求める。

10

20

30

40

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I
<i>C 0 7 C 253/00</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 C 253/00
<i>C 0 7 C 253/30</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 C 253/30
<i>C 0 7 C 255/26</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 C 255/26
<i>C 0 7 B 61/00</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 B 61/00 3 0 0

(72)発明者 ドユクレイ, ピエール
フランス国、エフー６８１２８・ビラージュヌフ、リュ・デ・ザリエ、 8

(72)発明者 ゲーベル, トーマス
ドイツ国、７９５３９・レーラツハ、レッテンベーク・２８・ベー

(72)発明者 ブービエ, ジヤツク
スイス国、ツエー・ハー－２０００・ヌーシヤテル、リュ・デ・パルク、 2

(72)発明者 ドュラノ, コリヌ
フランス国、エフー６８６８０・カーン、リュ・サフラン、 2 0

審査官 前田 憲彦

(56)参考文献 特開２０００－０２６３９２（ＪＰ，Ａ）
特開平０６－１９９７５５（ＪＰ，Ａ）
特開平０３－０８６８５５（ＪＰ，Ａ）
特開昭６２－１０３０５６（ＪＰ，Ａ）

(58)調査した分野(Int.Cl., D B名)

C07C 255/00
A01N 47/00
A61K 31/00
C07C 253/00
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)