

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2023-513005

(P2023-513005A)

(43)公表日 令和5年3月30日(2023.3.30)

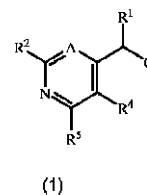
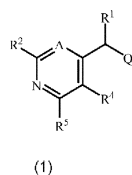
(51)国際特許分類		F I	テーマコード (参考)	
C 0 7 D	401/04 (2006.01)	C 0 7 D	401/04	C S P 4 C 0 6 3
A 6 1 P	33/00 (2006.01)	A 6 1 P	33/00	4 C 0 8 6
A 6 1 K	31/4439(2006.01)	A 6 1 K	31/4439	4 H 0 1 1
C 0 7 D	413/04 (2006.01)	C 0 7 D	413/04	
C 0 7 D	417/04 (2006.01)	C 0 7 D	417/04	
		審査請求 未請求	予備審査請求 未請求	(全144頁) 最終頁に続く
(21)出願番号	特願2022-545977(P2022-545977)	(71)出願人	391022452	
(86)(22)出願日	令和3年1月29日(2021.1.29)		エフ エム シー コーポレーション	
(85)翻訳文提出日	令和4年9月16日(2022.9.16)		FMC CORPORATION	
(86)国際出願番号	PCT/US2021/015643		アメリカ合衆国 1 9 1 0 4 ペンシルベ	
(87)国際公開番号	WO2021/155106		ニア州 フィラデルフィア ウォールナッ	
(87)国際公開日	令和3年8月5日(2021.8.5)		トストリート 2 9 2 9	
(31)優先権主張番号	62/967,838	(74)代理人	100127926	
(32)優先日	令和2年1月30日(2020.1.30)		弁理士 結田 純次	
(33)優先権主張国・地域又は機関	米国(US)	(74)代理人	100140132	
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA, RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く	(72)発明者	オマール・カレド・アマド	
			アメリカ合衆国ペンシルベニア州1 9 1 0 4 . フィラデルフィア. ウォールナッ ト・ストリート 2 9 2 9 . エフエムシー ・コーポレーションーパテント・デパー 最終頁に続く	

(54)【発明の名称】 無脊椎有害生物を防除するためのピリジン化合物

(57)【要約】

開示されているのは、全ての幾何異性体及び立体異性体を含めた式(1)の化合物、そのN-オキシド及び塩であり、式中、R¹、A、R²、R⁴、R⁵及びQは、本開示で定義された通りである。また開示されているのは、式(1)の化合物を含有する組成物、及び無脊椎有害生物又はその環境と生物学的有効量の本開示の化合物又は組成物とを接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法である。

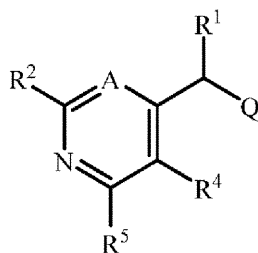
【化1】



【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1 から選択される化合物、その N-オキシド又は塩
【化 1】



1

10

〔式中、

R^1 は、F、OR⁶又はS(O)_nR⁶であり；

A は、N又はCR³であり；

R^2 は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₃～C₄ハロシクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ又はC₁～C₄ハロアルコキシであり；

20

R^3 は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₃～C₄ハロシクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ又はC₁～C₄ハロアルコキシであり；

R^4 は、5～6員の複素環式環であり、各環は、炭素原子、並びに2個までのO原子、2個までのS原子及び4個までのN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2個までの環員は、C(=O)、C(=S)、S(=O)及びS(=O)₂から独立して選択され、各環は、R^vから独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されており、rは、置換基の数であり、

各R^vは、独立して、H、シアノ、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₂～C₆シアノアルキル、C₁～C₆ヒドロキシアルキル、C₄～C₁₀アルキルシクロアルキル、C₄～C₁₀シクロアルキルアルキル、C₃～C₆シクロアルケニル、C₃～C₆ハロシクロアルケニル、C₂～C₆アルコキシアルキル、C₄～C₁₀シクロアルコキシアルキル、C₃～C₁₀アルコキシアルコキシアルキル、C₂～C₆アルキルチオアルキル、C₂～C₆アルキルスルフィニルアルキル、C₃～C₆シクロアルコキシ、C₃～C₆ハロシクロアルコキシ、C₄～C₁₀シクロアルキルアルコキシ、C₂～C₆アルケニルオキシ、C₂～C₆ハロアルケニルオキシ、C₂～C₆アルコキシアルコキシ、C₂～C₆アルキルカルボニルオキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₃～C₆シクロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₃～C₆シクロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルアミノ、C₂～C₆ジアルキルアミノ、C₁～C₆ハロアルキルアミノ、C₂～C₆ハロジアルキルアミノ又はC₃～C₆シクロアルキルアミノであり；

30

40

r は、1、2、3、4又は5であり；

R^5 は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₃～C₄ハロシクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ又はC₁～C₄ハロアルコキシであり；

50

R^6 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキルであり；

Q は、炭素原子及び 2 個までの窒素原子から選択される環員を含有する 6 員の芳香族環であり、各環は、炭素原子環員上で 1 個若しくは複数の R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；s は、置換基の数であり；

R^w は、独立して、H、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ハロジアルキルアミノ又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノであるか；或いは隣接する炭素原子上の 2 個の R^w は一緒に、 $-OCF_2O-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-OCF_2S-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 OCF_2CF_2O- 環状エーテル環を形成することができ；

s は、1、2、3、4 又は 5 であり；

n は、0、1 又は 2 であり；

ただし、

1) R^1 が F であり、 R^2 が H であり、A が CR^3 (式中、 R^3 は、F である) であり、 R^4 が 1-ピラゾールであり、 R^5 が H であるとき、Q は、4-OCF₃-フェニル以外であり；

2) R^4 は、ピリジニル以外である]。

【請求項 2】

式 1 の化合物である、請求項 1 に記載の化合物

[式中、

R^1 は、F であり；

A は、 CR^3 であり；

R^2 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^3 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 は、5～6 員の複素環式環であり、各環は、炭素原子、並びに 2 個までの O 原子、2 個までの S 原子及び 4 個までの N 原子から独立して選択される 1～4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個までの環員は、C(=O)、C(=S)、S(=O) 及び S(=O)₂ から独立に選択され、各環又は環系は、 R^v から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており、r は、置換基の数であり、各 R^v は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシであり；

r は、1、2、3、4又は5であり；

R^5 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

Q は、環上で0～2個のNを有する6員の芳香族環であり、各環は、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^w は、独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり；

s は、1、2、3、4又は5であり；

n は、0、1又は2である]。

【請求項3】

R^2 が、H、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 が、例示1において示すようなU-2～U-49又はU52～U61から選択され；

r が、1又は2であり；

R^5 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^w が、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり、

s が、1又は2である、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R^2 が、Hであり；

R^3 が、H又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2～U-49から選択され；

R^v が、Hであり；

R^5 が、H又はハロゲンであり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^w が、 OCF_3 、 SCF_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R^2 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 が、H又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2～U-49から選択され；

R^v が、Hであり；

r が、2であり；

R^5 が、Hであり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^w が、 OCF_3 、 SCF_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である、請求項3に記載の化合物。

【請求項6】

式 1 の化合物

〔式中、

R¹ は、OR⁶ であり；A は、CR³ であり；R² は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；R³ は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

10

R⁴ は、5～6 員の複素環式環であり、各環は、炭素原子、並びに 2 個までの O 原子、2 個までの S 原子及び 4 個までの N 原子から独立して選択される 1～4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個までの環員は、C (=O)、C (=S)、S (=O) 及び S (=O)₂ から独立に選択され、各環又は環系は、R^v から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており、r は、置換基の数であり、各 R^v は、独立して、H、ハロゲン、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ ハロアルキル、C₁～C₆ アルコキシ又は C₁～C₆ ハロアルコキシであり；

r は、1、2、3、4 又は 5 であり；

R⁵ は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

20

R⁶ は、C₁～C₄ アルキルであり；Q は、環上で 0～2 個の N を有する 6 員の芳香族環であり、各環は、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；R^w は、独立して、シアノ、ハロゲン、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ アルコキシ、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ ハロアルキル、C₂～C₆ アルケニル、C₂～C₆ ハロアルケニル、C₂～C₆ アルキニル、C₂～C₆ ハロアルキニル、C₁～C₆ アルキルチオ、C₁～C₆ ハロアルキルチオ、C₁～C₆ アルキルスルフィニル、C₁～C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ アルキルスルホニル又は C₁～C₆ ハロアルキルスルホニルであり；

30

s は、1、2、3、4 又は 5 であり；

n は、0、1 又は 2 である〕。

【請求項 7】

R² が、H、ハロゲン又は C₁～C₄ アルキルであり；R³ が、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；R⁴ が、例示 1 において示すような U-2～U-49 又は U52～U61 から選択され；

r が、1 又は 2 であり；

R⁵ が、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

40

R⁶ が、Me であり；R^w が、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ ハロアルキル、C₂～C₆ ハロアルケニル、C₂～C₆ ハロアルキニル、C₁～C₆ ハロアルキルチオ、C₁～C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ ハロアルキルスルホニルであり、

s が、1 又は 2 である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R² が、H であり；R³ が、H 又はハロゲンであり；R⁴ が、U-2～U-49 から選択され；R^v が、H であり；

50

r が、2 であり；

R^5 が、H 又はハロゲンであり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^W から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^W が、 OCF_3 、 SCF_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

式 1 の化合物

[式中、

10

R^1 は、 SR^6 であり；

A は、 CR^3 であり；

R^2 は、H、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^3 は、H、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 は、5～6 員の複素環式環であり、各環は、炭素原子、並びに 2 個までの O 原子、2 個までの S 原子及び 4 個までの N 原子から独立して選択される 1～4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個までの環員は、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(=O)$ 及び $S(=O)_2$ から独立に選択され、各環又は環系は、 R^V から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており、 r は、置換基の数であり、

20

各 R^V は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシであり；

r は、1、2、3、4 又は 5 であり；

R^5 は、H、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^6 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

30

Q は、環上で 0～2 個の N を有する 6 員の芳香族環であり、各環は、炭素原子環員上で R^W から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^W は、独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり；

s は、1、2、3、4 又は 5 であり；

n は、0、1 又は 2 である】。

40

【請求項 10】

R^2 が、H、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 が、例示 1 において示すような $U-2 \sim U-49$ 又は $U52 \sim U61$ から選択され；

R^V が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり、

r が、1 又は 2 であり；

R^5 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

50

R⁶ が、Me であり；

R^w が、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ ハロアルキル、C₂～C₆ ハロアルケニル、C₂～C₆ ハロアルキニル、C₁～C₆ ハロアルキルチオ、C₁～C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ ハロアルキルスルホニルであり、

s が、1 又は 2 である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R² が、H であり；

R³ が、H 又はハロゲンであり；

R⁴ が、U-2～U-49 から選択され；

R^v が、H であり；

r が、2 であり；

R⁵ が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^w が、OCF₃、SCF₃、CF₃、CF₂CF₃、SOCF₃ 又は SO₂CF₃ である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-クロロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]-5-(2-オキサゾリル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-クロロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2-オキサゾリル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(5-オキサゾリル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-クロロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-ブromo-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；及び

3-フルオロ-4-[メトキシ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]-5-(1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)ピリジン

からなる群から選択される、式 1 の化合物。

【請求項 13】

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-
 5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-クロロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 (2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-クロロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]-
 5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 (2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
]-5-(2-オキサゾリル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
]-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-ブromo-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]-
 5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン
 からなる群から選択される、請求項12に記載の化合物。

10

【請求項14】

式1又は請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物、並びに界面活性剤、固体賦形
 剤及び液体賦形剤からなる群から選択される少なくとも1種のさらなる構成要素を含む組
 成物であって、少なくとも1種のさらなる生物活性化合物又は薬剤を場合によってはさら
 に含む、組成物。

20

【請求項15】

前記少なくとも1種のさらなる生物活性化合物又は薬剤が、アバメクチン、アセフェー
 ト、アセキノシル、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロペン、アミドフルメ
 ト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホスメチル、ベンフラカルブ
 、ベンスルタップ、ピフェントリン、ピフェナゼート、ピストリフルロン、ボレート、ブ
 ロマントラニリプロール、ブプロフェジン、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、カル
 ソール、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロル
 ピリホス、クロルピリホスメチル、クロマフェノジド、クロフェンテジン、クロチアニジ
 ン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリン、シクロキサプリ
 ド、シフルメトフェン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロジアミド、シハロ
 トリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シベルメトリン、アルファシペ
 ルメトリン、ゼーターシベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロ
 ン、ダイアジノン、ジクロラントラニリプロール、ジエルドリン、ジフルベンズロン、ジ
 メフルトリン、ジメヒポ、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン
 、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エ
 トキサゾール、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノ
 キシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン、フ
 ロニカミド、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロ
 ン、フルフェノキシストロビン、フルエンシルホン、フルオピラム、フルピラジフロン、
 フルバリネート、タウフルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホスチアゼート、
 ハロフェノジド、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ハイドラ
 メチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、殺虫性石鹸、イソフェンホス、ルフ
 ェヌロン、マラチオン、メベルフルトリン、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミド
 ホス、メチダチオン、メチオカルブ、メソミル、メトプレン、メトキシクロール、メトキ
 シフェノジド、メトフルトリン、モノクロトホス、モノフルオロトリン、ニコチン、N-
 [1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1,1-ジメチル-2-(メチ
 ルスルフィニル)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1,1-ジメチル-2-(メチル
 スルホニル)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、

30

40

50

N－（１－メチルシクロプロピル）－２－（３－ピリジニル）－２H－インダゾール－４－カルボキサミド、N－〔１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル〕－２－（３－ピリジニル）－２H－インダゾール－４－カルボキサミド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオンメチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメト、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルギット、プロトリフェンブト、ピフルブミド、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフエン、スピネトラム、スピノサド、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、スルプロホス、スルホキサフロル、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テトラクロラントラニリプロール、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタプーナトリウム、チオキサザフェン、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）デルター内毒素、昆虫病原菌、昆虫病原性ウイルス及び昆虫病原性真菌からなる群から選択される、請求項１４に記載の組成物。

10

【請求項１６】

殺寄生生物有効量の式１又は請求項１～１３のいずれか一項に記載の化合物、及び少なくとも１種の担体を含む、無脊椎動物寄生性有害生物から動物を保護するための組成物。

20

【請求項１７】

無脊椎有害生物を防除するための方法であって、前記無脊椎有害生物又はその環境と、生物学的有効量の請求項１～１６のいずれか１項に記載の化合物、組成物、又は配合物とを接触させることを含む、方法。

【請求項１８】

無脊椎有害生物が、カメムシ科（*Pentatomidae*）からのカメムシを含む、請求項１７に記載の方法。

【請求項１９】

式１又は請求項１～１３のいずれか一項に記載の化合物を処理前の種子の約０．０００１～１重量％の量で含む、処理された種子。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

関連出願の相互参照

本出願は、２０２０年１月３０日に出願された米国仮特許出願第６２／９６７，８３８号明細書の利益を主張するものである。

【０００２】

本開示は、農業的及び非農業的な用途に好適な、ある種のピリジン化合物、それらのN－オキシド、塩、及び組成物、並びに、無脊椎有害生物、例えば農業的及び非農業的両方の環境に存在する節足動物を防除するためのそれらの使用方法に関する。

40

【背景技術】

【０００３】

無脊椎有害生物の駆除は、高い作物効率を達成するのに極めて重要である。成長中の及び貯蔵される農作物への無脊椎有害生物による損害は、生産性の著しい低下を引き起こし、それによって消費者へのコストの増加をもたらす得る。林業、温室作物、観賞植物、苗床作物、貯蔵食品及び繊維製品、家畜、家族、芝生、木材製品、並びに公衆衛生及び動物の健康における無脊椎有害生物の駆除もまた重要である。多くの製品が、これらの目的のために商業的に入手可能であるが、より効果的であり、費用がかからず、毒性が少なく、環境上より安全であるか、又は異なる作用部位を有する新規化合物が引き続き必要とされている。

50

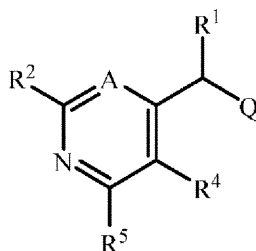
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0004】

本開示は、式1の化合物（全ての幾何異性体及び立体異性体を含む）、そのN-オキシド及び塩、並びにそれらを含む組成物、並びに無脊椎有害生物を防除するためのそれらの使用を対象とし、

【化1】



1

10

式中、

R^1 は、F、 OR^6 又は $S(O)_nR^6$ であり；

A は、N 又は CR^3 であり；

R^2 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^3 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 は、5～6員の複素環式環であり、各環は、炭素原子、並びに2個までのO原子、2個までのS原子及び4個までのN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2個までの環員は、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(=O)$ 及び $S(=O)_2$ から独立に選択され、各環は、 R^v から独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されており、 r は、置換基の数であり、

各 R^v は、独立して、H、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ハロジアルキルアミノ又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノであり；

r は、1、2、3、4又は5であり；

R^5 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$

20

30

40

50

シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^6 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキルであり；

Q は、炭素原子及び 2 個までの窒素原子から選択される環員を含有する 6 員の芳香族環であり、各環は、炭素原子環員上で 1 個若しくは複数の R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；s は、置換基の数であり；

R^w は、独立して、H、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ハロジアルキルアミノ又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノであるか；或いは隣接する炭素原子上の 2 個の R^w は一緒に、 $-OCF_2O-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-OCF_2S-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 OCF_2CF_2O- 環状エーテル環を形成することができ；

s は、1、2、3、4 又は 5 であり；

n は、0、1 又は 2 であり；

ただし、

1) R^1 が F であり、 R^2 が H であり、A が CR^3 (式中、 R^3 は、F である) であり、 R^4 がピラゾール-1-イルであり、 R^5 が H であるとき、Q は、4- OCF_3 -フェニル以外であり；

2) R^4 は、ピリジニル以外である。

【0005】

本開示はさらに、式 1 の化合物、それらの N-オキシド又は塩、並びに界面活性剤、固体希釈剤、及び液状希釈剤からなる群より選択される少なくとも 1 種の追加成分を含む、組成物も提供する。一つの実施形態においては、本開示はさらに、式 1 の化合物、それらの N-オキシド又は塩、並びに、界面活性剤、固体希釈剤、及び液状希釈剤からなる群より選択される少なくとも 1 種の追加成分を含む、無脊椎有害生物を防除するための組成物も提供するが、前記組成物には、場合によっては、少なくとも 1 種の追加の生物活性化合物又は薬剤がさらに含まれる。

【0006】

本開示はさらに、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的有効量の式 1 の化合物、それらの N-オキシド又は塩 (例えば、本明細書記載の組成物として) と接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法を提供する。本開示はさらに、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的有効量の式 1 の化合物、それらの N-オキシド又は塩、並びに界面活性剤、固体希釈剤、及び液体希釈剤からなる群より選択される少なくとも 1 種の追加の成分を含む組成物と接触させるような方法にも関するが、前記組成物には、場合によっては、生物学的有効量の、少なくとも 1 種の追加の生物活性化合物又は生物活性薬剤

をさらに含む。

【0007】

本開示はまた、無脊椎有害生物又はその環境と生物学的有効量の前述の組成物のいずれかとを接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法を提供し、ここで、環境は、植物である。

【0008】

本開示はまた、無脊椎有害生物又はその環境と生物学的有効量の前述の組成物のいずれかとを接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法を提供し、ここで、環境は、動物である。

【0009】

本開示はまた、無脊椎有害生物又はその環境と生物学的有効量の前述の組成物のいずれかとを接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法を提供し、ここで、環境は、種子である。

【0010】

本開示はまた、種子と生物学的有効量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩（例えば、本明細書に記載されている組成物として）とを接触させることを含む、種子を無脊椎有害生物から保護するための方法を提供する。本開示はまた、処理された種子（すなわち、式1の化合物と接触した種子）に関する。

【0011】

本開示はまた、作物植物、そこから作物植物が成長する種子又は作物植物の生息地（例えば、成長培地）と生物学的有効量の式1の化合物（例えば、本明細書に記載されている組成物として）とを接触させることを含む、作物植物の勢いを増加させるための方法を提供する。

【0012】

本開示はさらに、動物に対して、駆虫的有效量の式1の化合物、それらのN-オキシド又は塩を（例えば、本明細書記載の組成物として）投与することを含む、無脊椎の寄生有害生物から動物を保護するための方法も提供する。本開示はさらに、無脊椎有害生物からの動物の保護における、式1の化合物、それらのN-オキシド又は塩（例えば、本明細書記載の組成物としての）の使用も提供する。

【発明を実施するための形態】

【0013】

本明細書で用いるところでは、用語「含む（comprises）」、「含む（comprising）」、「含む（includes）」、「含む（including）」、「有する（has）」、「有する（having）」、「含有する（contains）」、「含有する（containing）」、「で特徴付けられる（characterized by）」、又はそれらの任意の他の変形は、明確に示される任意の制限を受けて、非排他的な包含をカバーすることを意図する。例えば、要素のリストを含む組成物、混合物、プロセス、又は方法は、それらの要素のみに必ずしも限定されず、明確にリストされないか、又はそのような組成物、混合物、プロセス、又は方法に固有の他の要素を含んでもよい。

【0014】

移行句「からなる（consisting of）」は、明記されないいかなる要素、工程、又は原料をも排除する。特許請求の範囲における場合、そのようなものは、それらと通常関係がある不純物を除いて列挙されるもの以外の材料の包含をクレームから締め出す。語句「からなる」が、前文の直後よりもむしろ、クレームの本体の条項に現れる場合、それは、当該条項に記述される要素のみを限定し；他の要素は、全体としてクレームから排除されない。

【0015】

移行句「から本質的になる（consisting essentially of）」は、文字通り開示されるものに加えて、材料、工程、特徴、成分、又は要素を含む組成

10

20

30

40

50

物、又は方法を定義するために用いられ、ただし、これらの追加の材料、工程、特徴、成分、又は要素は、特許請求される開示の基本的な及び新規な特性に実質的に影響を及ぼさない。用語「から本質的になる」は、「含む (comprising)」と、「からなる (consisting of)」との中間領域を占める。

【0016】

出願人らが、実施形態又はその一部を、「含む (comprising)」などの開放端用語を使って定義している場合、(特に明記しない限り) この記載が、用語「から本質的になる」又は「からなる」を用いてそのような実施形態をまた記載していると解釈されるべきであることが容易に理解されるはずである。

【0017】

さらに、明確にそれとは反対を述べられない限り、「又は (or)」は、包括的な「又は」を意味し、排他的な「又は」を意味しない。例えば、条件 A 又は B は、以下のいずれか 1 つによって満たされる: A が真であり (又は存在し) 且つ B が偽である (又は存在しない)、A が偽であり (又は存在せず) 且つ B が真である (又は存在する)、並びに A 及び B の両方ともが真である (又は存在する)。

【0018】

また、本開示の要素又は成分に先行する不定冠詞「a」及び「an」は、要素又は成分の場合 (すなわち、出現) の数に関して非限定的であることを意図する。それ故「a」又は「an」は、1 つ若しくは少なくとも 1 つを含むと読まれるべきであり、要素又は成分の単数語形はまた、特に数が明らかに単数形であることを意図しない限り複数形を含む。

【0019】

本開示に言及されるように、用語「無脊椎有害生物」には、有害生物として経済的に重要な節足動物、腹足類、線形動物及び蠕虫が含まれる。用語「節足動物」には、昆虫、ダニ (mite)、クモ、サソリ、ムカデ類、ヤスデ、ダンゴムシ及びコムカデが含まれる。用語「腹足類」には、カタツムリ、ナメクジ及び他の柄眼目が含まれる。用語「線形動物」には、植食性線形動物及び動物に寄生する蠕虫線形動物などの、線形動物門のメンバーが含まれる。用語「蠕虫」には、回虫 (線形動物門)、犬糸状虫 (線形動物門、双腺綱)、吸虫 (扇形動物門、吸虫綱)、こう頭虫 (こう頭虫門)、及び条虫 (扇形動物門、条虫綱) などの、寄生蠕虫のすべてが含まれる。

【0020】

本開示との関連で、「無脊椎有害生物駆除」は、無脊椎有害生物成長の阻害 (死亡、摂食低下、及び/又は交尾途絶を含む) を意味し、関連表現は、類似して定義される。

【0021】

用語「農学的」は、食品及び繊維のためなどの農作物の生産を言い、トウモロコシ又はコーン、大豆及び他のマメ科植物、米、穀物 (例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦及び米)、葉物野菜 (例えば、レタス、キャベツ、及び他のアブラナ科作物)、結果野菜 (例えば、トマト、コショウ、ナス、十字花植物及びウリ科植物)、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、綿、果樹 (例えば、ナシ状果、核果及び柑橘類)、小果 (例えば、ベリー及びサクランボ) 並びに他のスペシャルティ作物 (例えば、キャノーラ、ヒマワリ及びオリーブ) の成長を含む。

【0022】

用語「非農学的」は、例えば園芸作物 (例えば、田畑で成長させられない温室植物、苗床植物又は観賞植物) 以外の農作物、居住の、農業の、商業の及び工業構造物、芝生 (例えば、芝農場、牧場、ゴルフコース、芝土、スポーツフィールドなど)、木製品、貯蔵製品、農森林管理及び植物管理、公衆衛生 (すなわち、ヒト) 及び動物の健康 (例えば、家畜化された動物、例えばペット、家畜及び家禽など、家畜化されていない動物、例えば野生生物など) 用途を言う。

【0023】

用語「作物成長力」は、作物の成長又はバイオマス蓄積の速度を言う。「成長力の増加」は、未処理対照作物に対して作物の成長又はバイオマス蓄積の増加を言う。用語「作物

10

20

30

40

50

収量」は、作物の収穫後に得られた、量及び品質の両方の観点からの、作物材料リターンを言う。「作物収量の増加」は、未処理対照作物に対して作物収量の増加を言う。

【0024】

「生物学的有効量 (biologically effective amount)」という用語は、無脊椎有害生物の害から植物を保護したり、或いは所望の効果 (例えば、植物の活力の増大) を得たりするために、防除対象の無脊椎有害生物若しくはその環境に対して、又は植物、それから植物が生育する種子、若しくはその植物の領域 (例えば、生育環境) に対して適用 (すなわち、接触) させて、所望の生物学的効果をもたらすのに十分な、生物活性化合物 (例えば、式1の化合物) の量を指している。

【0025】

非農学的適用は、典型的には獣医学における使用のために配合された組成物の形態の殺寄生生物有効 (すなわち、生物学的有効) 量の本開示の化合物を保護される動物に投与することによって、無脊椎動物寄生性有害生物から動物を保護することを含む。本開示及び特許請求の範囲において言及するように、用語「殺寄生生物性」及び「殺寄生生物的に」は、有害生物からの動物の保護を実現する無脊椎寄生性有害生物に対する観察可能な効果を指す。殺寄生生物性効果は典型的には、標的無脊椎動物寄生性有害生物の出現又は活性を減少させることに関連する。有害生物に対するこのような効果は、壊死、死亡、成長の遅延、移動性の減少、又は宿主動物上若しくは中に留まる能力の減少、摂食の低減、及び繁殖の阻害を含む。無脊椎寄生性有害生物に対するこれらの効果は、動物の寄生又は感染の制御 (予防、低減又は除去を含めた) を実現する。

【0026】

上の説明における、単独、又は「アルキルチオ」又は「ハロアルキル」のような化合物用語で使われる、「アルキル」という用語には、直鎖状又は分岐状のアルキル、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、又は各種のブチル、ペンチル若しくはヘキシル異性体が含まれる。「アルケニル」には、直鎖状又は分岐状のアルケン、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、並びに各種のブテニル、ペンテニル、及びヘキセニル異性体が含まれる。「アルケニル」にはさらに、1, 2-プロパジエニル及び2, 4-ヘキサジエニルのような、ポリエンも含まれる。「アルキニル」には、直鎖状又は分岐状のアルキン例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、並びに各種のブチニル、ペンチニル及びヘキシニル異性体が含まれる。「アルキニル」にはさらに、複数の三重結合、例えば2, 5-ヘキサジイニル (2, 5-hexadiynyl) からなる残基を含むことも可能である。「アルキレン」は、直鎖状又は分岐状のアルカンジイルを表す。「アルキレン」の例としては、 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、及び各種のブチレン異性体が挙げられる。「アルケニレン」は、1個のオレフィン結合を含む、直鎖状又は分岐状のアルケンジイルを表す。「アルケニレン」の例としては、 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 、及び各種のブテニレン異性体が挙げられる。「アルキニレン」は、1個の三重結合を含む、直鎖状又は分岐状のアルキンジイルを表す。「アルキニレン」の例としては、 $\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 、及び各種のブチニレン異性体が挙げられる。

【0027】

「アルコキシ」には、例えば、メトキシ、エトキシ、*n*-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ並びに各種のブトキシ、ペントキシ及びヘキシルオキシ異性体が含まれる。「アルコキシアルキル」は、アルキル上のアルコキシ置換を示す。「アルコキシアルキル」の例には、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が含まれる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシ上のアルコキシ置換を示す。「アルケニルオキシ」には、直鎖状若しくは分岐状アルケニルオキシ部分が含まれる。「アルケニルオキシ」の例には、 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ 及び $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ が含まれる。「アルキニルオキシ」には、直鎖状若しくは分岐状アルキニルオキシ部分が含まれる。「アルキニル

オキシ」の例には、 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 及び $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ が含まれる。「アルキルチオ」には、分岐鎖若しくは直鎖アルキルチオ部分、例えば、メチルチオ、エチルチオ、並びに各種のプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオ及びヘキシルチオ異性体が含まれる。「アルキルスルフィニル」は、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーを含む。「アルキルスルフィニル」の例には、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ 並びに各種のブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル及びヘキシルスルフィニル異性体が含まれる。「アルキルスルホニル」の例には、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ 、並びに各種のブチルスルホニル、ペンチルスルホニル及びヘキシルスルホニル異性体が含まれる。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上のアルキルチオ置換を示す。「アルキルチオアルキル」の例には、 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ が含まれる。「アルキルチオアルコキシ」は、アルコキシ上のアルキルチオ置換を示す。「アルキルジチオ」は、分岐鎖若しくは直鎖アルキルジチオ部分を示す。「アルキルジチオ」の例には、 $\text{CH}_3\text{SS}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SS}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SS}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHSS}-$ 並びに各種のブチルジチオ及びペンチルジチオ異性体が含まれる。「シアノアルキル」は、1個のシアノ基で置換されているアルキル基を示す。「シアノアルキル」の例には、 NCCCH_2 、 $\text{NCCCH}_2\text{CH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2$ が含まれる。「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」、「アルケニルチオ」、「アルケニルスルフィニル」、「アルケニルスルホニル」、「アルキニルチオ」、「アルキニルスルフィニル」、「アルキニルスルホニル」などは、上記の例と類似して定義される。

【0028】

「シクロアルキル」には、例えば、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が含まれる。用語「アルキルシクロアルキル」は、シクロアルキル部分上のアルキル置換を示し、例えば、エチルシクロプロピル、 i -プロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチル及び4-メチルシクロヘキシルを含む。用語「シクロアルキルアルキル」は、アルキル部分上のシクロアルキル置換を示す。「シクロアルキルアルキル」の例には、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、及び直鎖状若しくは分岐状アルキル基に結合している他のシクロアルキル部分が含まれる。用語「シクロアルコキシ」は、酸素原子を介して連結しているシクロアルキル、例えば、シクロペンチルオキシ及びシクロヘキシルオキシを示す。「シクロアルキルアルコキシ」は、アルキル鎖に付着している酸素原子を介して連結しているシクロアルキルアルキルを示す。「シクロアルキルアルコキシ」の例には、シクロプロピルメトキシ、シクロペンチルエトキシ、及び直鎖状若しくは分岐状アルコキシ基に結合している他のシクロアルキル部分が含まれる。「シアノシクロアルキル」は、1個のシアノ基で置換されているシクロアルキル基を示す。「シアノシクロアルキル」の例には、4-シアノシクロヘキシル及び3-シアノシクロペンチルが含まれる。「シクロアルケニル」には、シクロペンテニル及びシクロヘキセニルなどの基、並びに複数の二重結合を有する基、例えば、1, 3-及び1, 4-シクロヘキサジエニルが含まれる。

【0029】

「ハロゲン」という用語には、単独又は「ハロアルキル」のような化合物用語の中で、或いは「ハロゲンをういて置換されたアルキル」のような記述で使用されたとき、フッ素、塩素、臭素、又はヨウ素が含まれる。さらに、「ハロアルキル」のような化合物用語の中で使用されたとき、前記アルキルは、部分的又は完全にハロゲン原子（それらは、同一であっても、異なってもよい）で置換されていてもよい。「ハロアルキル」又は「ハロゲンをういて置換されたアルキル」の例としては、 $\text{F}_3\text{C}-$ 、 ClCH_2- 、 CF_3CH_2- 、及び CF_3CCl_2- が挙げられる。「ハロシクロアルキル」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」、「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」などの用語は、「ハロアルキル」の用語と同様にして定義される。「ハロアルコキシ」の例としては、C

F_3O- 、 CCl_3CH_2O- 、 $HCF_2CH_2CH_2O-$ 、及び CF_3CH_2O- が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例には、 CCl_3S- 、 CF_3S- 、 CCl_3CH_2S- 及び $ClCH_2CH_2CH_2S-$ が含まれる。「ハロアルキルスルフィニル」の例には、 $CF_3S(O)-$ 、 $CCl_3S(O)-$ 、 $CF_3CH_2S(O)-$ 及び $CF_3CF_2S(O)-$ が含まれる。「ハロアルキルスルホニル」の例には、 $CF_3S(O)_2-$ 、 $CCl_3S(O)_2-$ 、 $CF_3CH_2S(O)_2-$ 及び $CF_3CF_2S(O)_2-$ が含まれる。「ハロアルケニル」の例には、 $(Cl)_2C=CHCH_2-$ 及び $CF_3CH_2CH=CHCH_2-$ が含まれる。「ハロアルキニル」の例には、 $HC\equiv CCHCl-$ 、 $CF_3C\equiv C-$ 、 $CCl_3C\equiv C-$ 及び $FCH_2C\equiv CCH_2-$ が含まれる。「ハロアルコキシアルコキシ」の例には、 CF_3OCH_2O- 、 $ClCH_2CH_2OCH_2CH_2O-$ 、 $Cl_3CCH_2OCH_2O-$ 及び分岐状アルキル誘導体が含まれる。

10

【0030】

「アルキルカルボニル」は、 $C(=O)$ 部分に結合している直鎖状若しくは分岐状アルキル部分を示す。「アルキルカルボニル」の例には、 $CH_3C(=O)-$ 、 $CH_3CH_2CH_2C(=O)-$ 及び $(CH_3)_2CHC(=O)-$ が含まれる。「アルコキシカルボニル」の例には、 $CH_3OC(=O)-$ 、 $CH_3CH_2OC(=O)-$ 、 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)-$ 、 $(CH_3)_2CHOC(=O)-$ 並びに各種のブトキシー又はペントキシカルボニル異性体が含まれる。

【0031】

化学的略語 $S(O)$ 及び $S(=O)$ は、本明細書において使用するよう、スルフィニル部分を表す。化学的略語 SO_2 、 $S(O)_2$ 及び $S(=O)_2$ は、本明細書において使用するよう、スルホニル部分を表す。化学的略語 $C(O)$ 及び $C(=O)$ は、本明細書において使用するよう、カルボニル部分を表す。化学的略語 CO_2 、 $C(O)O$ 及び $C(=O)O$ は、本明細書において使用するよう、オキシカルボニル部分を表す。「 CHO 」は、ホルミルを意味する。

20

【0032】

R^4 が R^V から独立して選択される 5 個までの置換基で置換されている 5～6 員の複素環式環であるとき、置換基 R^V は、複素環式環の任意の利用可能な環員を介して式 1 の化合物の残部に付着し得る。

【0033】

Q が R^W から独立して選択される 5 個までの置換基で置換されている 6 員の芳香族環であるとき、置換基 R^W は、6 員の芳香族環の任意の利用可能な環員を介して式 1 の化合物の残部に付着し得る。

30

【0034】

置換基の中の炭素原子の合計数は、「 $C_i\sim C_j$ 」の接頭表記によって示されるが、ここで i 及び j は、1～10 の数である。例えば、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからブチルスルホニルまでを表し； C_2 アルコキシアルキルは、 CH_3OCH_2- を表し； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $CH_3CH(OCH_3)-$ 、 $CH_3OCH_2CH_2-$ 、又は $CH_3CH_2OCH_2-$ を表し；そして C_4 アルコキシアルキルは、全部で 4 個の炭素原子を含むアルコキシ基で置換されたアルキル基の各種の異性体を表し、例としては、 $CH_3CH_2CH_2OCH_2-$ 、及び $CH_3CH_2OCH_2CH_2-$ が挙げられる。

40

【0035】

化合物が前記置換基の数が 1 を超えることができることを示す下付き文字を有する置換基で置換されているとき、前記置換基（これらが 1 を超えるとき）は、確定した置換基の群、例えば、 $[(R^V)_r]$ (r は、1、2、3、4 又は 5 である)； $[(R^W)_s]$ (s は、1、2、3、4 又は 5 である) から独立に選択される。ある基が水素であることが可能な、例えば、 R^V 又は R^W を含有していて、次いで、この置換基が水素であるとした場合には、これは、前記基が非置換であると同様であることが認識される。基上の 1 つ若しくは複数の位置が「置換されていない」又は「非置換」とあると言われるとき、水素原

50

子が付着して、自由原子価を占有する。

【0036】

他に示さない限り、「環」は、式1の構成要素（例えば、置換基 R^4 ）として、炭素環式又は複素環式である。用語「環員」は、環の主鎖を形成する原子又は他の部分（例えば、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)$ 又は $S(O)_2$ ）を指す。

【0037】

用語「炭素環式環」又は「炭素環」は、環の主鎖を形成する原子が炭素のみから選択される環を示す。用語「複素環式環」又は「複素環」は、環の主鎖を形成する少なくとも1個の原子が、炭素ではなく、例えば、窒素、酸素又は硫黄である環を示す。典型的には、複素環式環には、4個以下の窒素、2個以下の酸素、及び2個以下の硫黄しか含まない。特に断らない限り、炭素環式環又は複素環式環は、飽和環であっても、或いは不飽和環であってもよい。「飽和している(saturated)」は、単結合によって相互に結合されている原子からなる主鎖を有する環を指すが、特に断らない限り、原子の残りの原子価は、水素原子によって占められている。特に断らない限り、「不飽和な環」は、部分的又は全面的に不飽和であってよい。「完全に不飽和な環」という表現は、その環の中の原子の間の結合が、原子価結合理論に従った単結合又は二重結合であり、そしてさらに、その環の中の原子の間の結合に、累積的な二重結合は除いて（すなわち、 $C=C=C$ や $C=C=N$ は除いて）、可能な限り多くの二重結合が含まれているような、原子の環を意味している。「部分的に不飽和な環」という用語は、二重結合を介して隣接する環メンバーに結合されている少なくとも一つの環メンバーを含み、そして概念的、潜在的に、存在している（すなわち、その部分的に不飽和な形態にある）二重結合の数よりも大きい、隣接する環メンバーとの間の非累積的な（すなわち、その完全に不飽和なカウンターパートの形態にある）二重結合の数を収容している環を表している。

【0038】

特に断らない限り、複素環式の環は、各種利用可能な炭素又は窒素を介し、前記炭素又は窒素の上の水素と置き換えることによって結合させることが可能である。

【0039】

「芳香族」は、環の原子のそれぞれが、本質的に同じ平面上にあり、そしてその環平面に垂直なp-軌道を有し、そしてそこで $(4n+2)$ 個の π 電子（ここで、 n は、正の整数である）が、その環と関わって、ヒュッケル則を満たしていることを示している。完全不飽和炭素環式環がヒュッケル則を満たすとき、前記環はまた、「芳香族環」又は「芳香族炭素環式環」と称される。完全不飽和複素環式環がヒュッケル則を満たすとき、前記環はまた、「ヘテロ芳香族環」又は「芳香族複素環式環」と称される。

【0040】

複素環式環に関連して、「場合によっては置換された」という用語は、非置換であるか、又は非置換の類似体によって保持されている生物学的活性を消失させることがない、少なくとも1種の非水素置換基を有している基であることを示している。本明細書で使用する時、特に断らない限り、以下の定義が適用されるものとする。「場合によっては置換された」という用語は、「置換若しくは非置換の」という文言、又は「(非)置換の」という用語と相互に交換可能に使用される。特に断らない限り、場合によっては置換された基では、その基のそれぞれの交換可能な位置に置換基を有してよく、そしてそれぞれの置換は互いに独立している。

【0041】

R^4 が5員若しくは6員の窒素含有複素環式環であるとき、これは、他に記載しない限り、任意の利用可能な炭素又は窒素環原子を介して式1の残部に付着し得る。

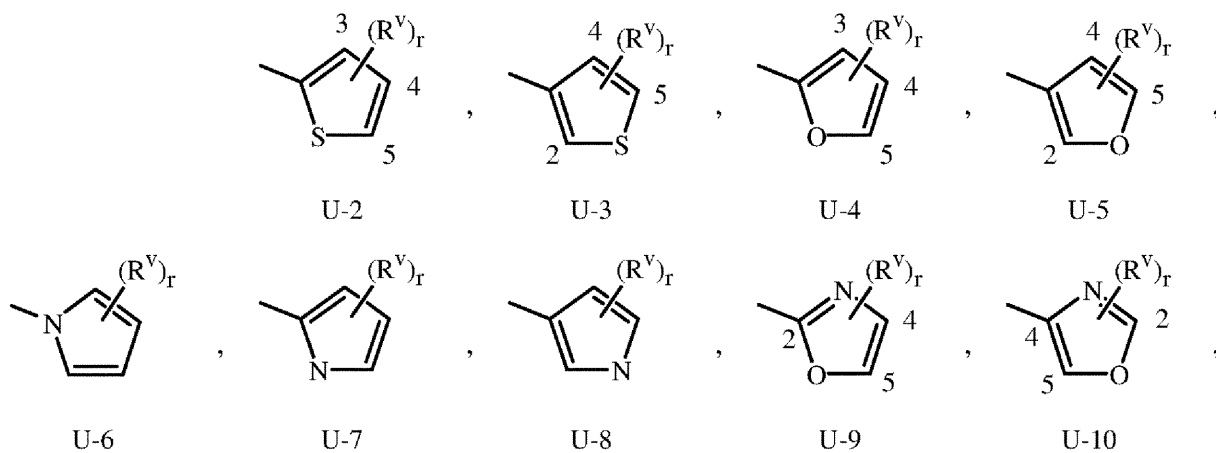
【0042】

上で述べたように、 R^4 は、飽和若しくは不飽和であり得、概要において定義したような置換基の群から選択される1個若しくは複数の置換基で場合によっては置換されている5員若しくは6員の複素環式環でよい。1個若しくは複数の置換基で場合によっては置換されている5員若しくは6員の不飽和芳香族複素環式環の例は、例示1において例示した

環 U-2 ~ U-61 を含み、式中、 R^v は、概要において定義したような任意の置換基であり、 r は、1 ~ 4 の整数であり、各 U 基上の利用可能な位置の数によって限定される。U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42 及び U-43 は、1 つのみの利用可能な位置を有するため、これらの U 基について、 r は、整数 1 に限定され、 R^v が H であり、 r が 1 であるときは、U 基は、非置換であり、水素は、 $(R^v)_r$ によって示される位置において存在することを意味する。

【化 2】

例示 1



10

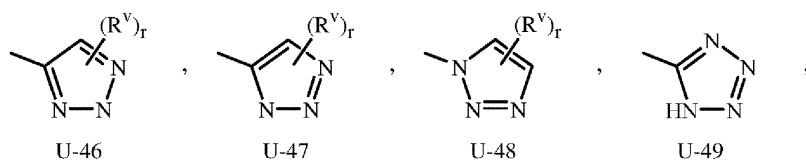
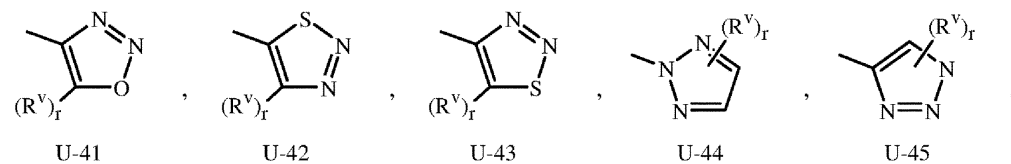
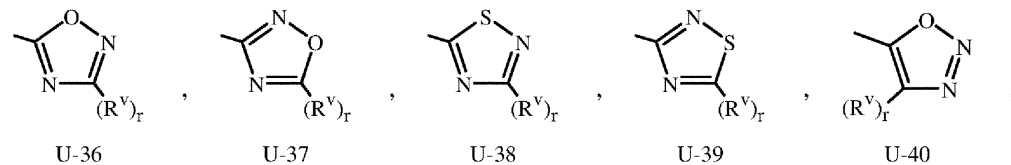
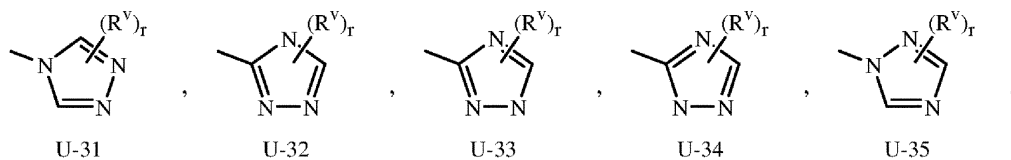
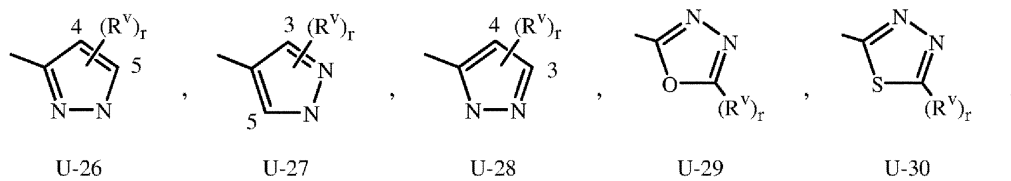
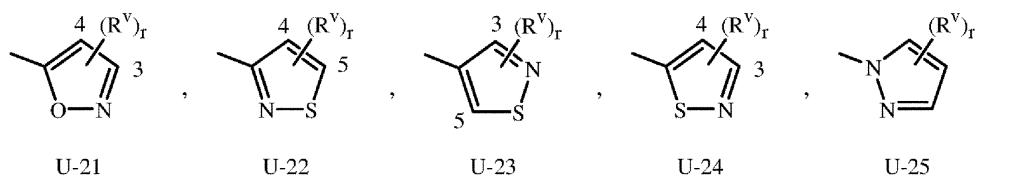
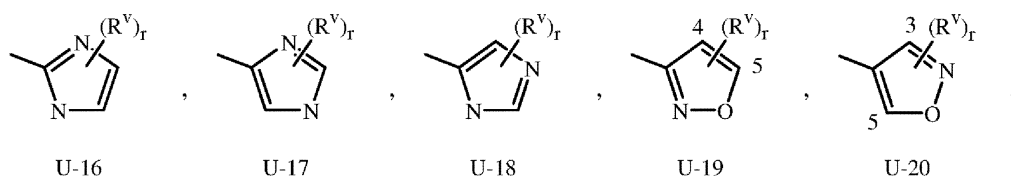
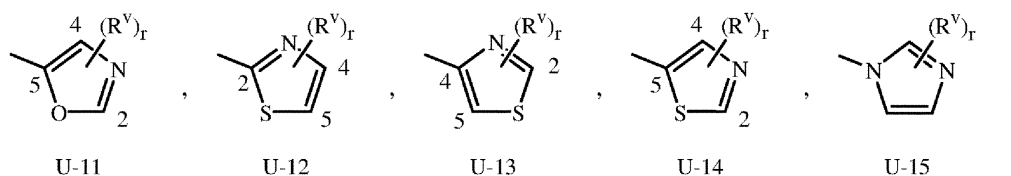
20

30

40

50

【化 3】



10

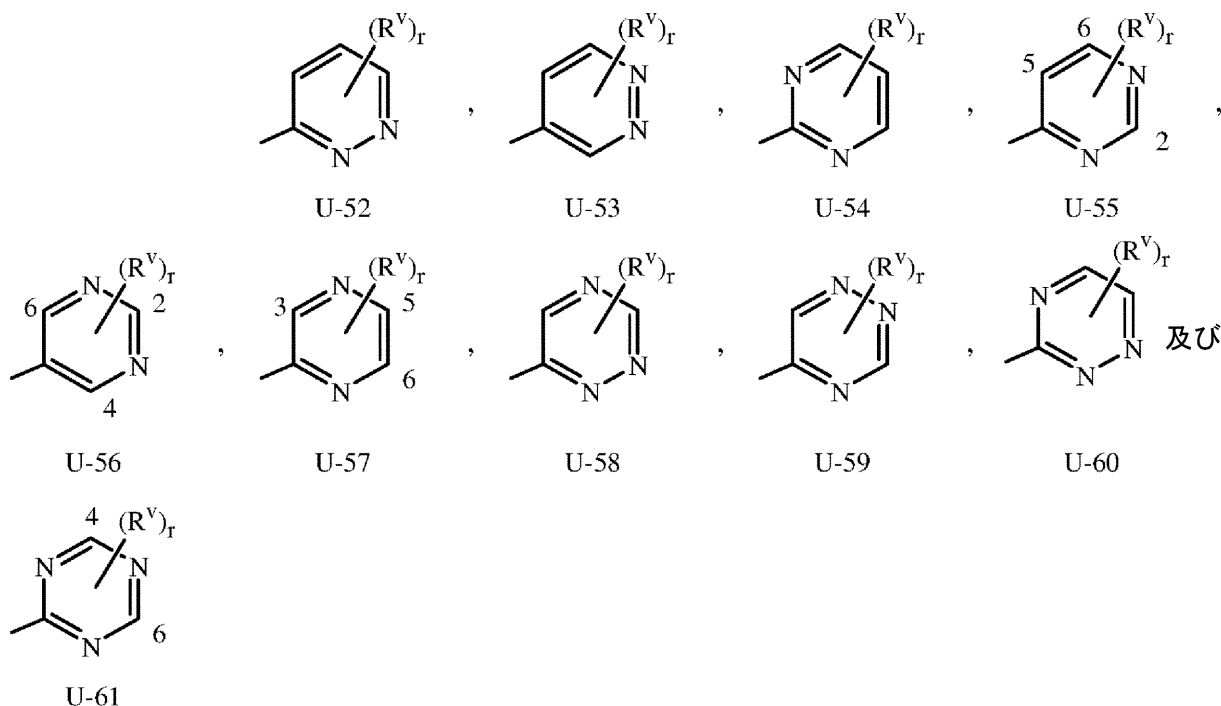
20

30

40

50

【化 4】



10

20

【0043】

R^4 が概要において定義したような置換基の群から選択される1個若しくは複数の置換基で場合によっては置換されている5員若しくは6員の飽和若しくは不飽和の非芳香族複素環式環であるとき、複素環の1個若しくは2個の炭素環員は、場合によってはカルボニル部分の酸化された形態でよいことに留意されたい。

【0044】

5員若しくは6員の飽和若しくは非芳香族不飽和複素環式環の例は、例示2において例示したような環G-1～G-35を含む。G基上の付着点が浮動しているとして例示されるとき、G基は、水素原子の置き換えによってG基の任意の利用可能な炭素又は窒素を介して式1の残部へと付着することができることに留意されたい。 R^V に対応する任意選択の置換基は、水素原子を置き換えることによって任意の利用可能な炭素又は窒素に付着することができる。これらのG環について、sは典型的には、1～5の整数であり、各G基上の利用可能な位置の数によって限定される。

30

【0045】

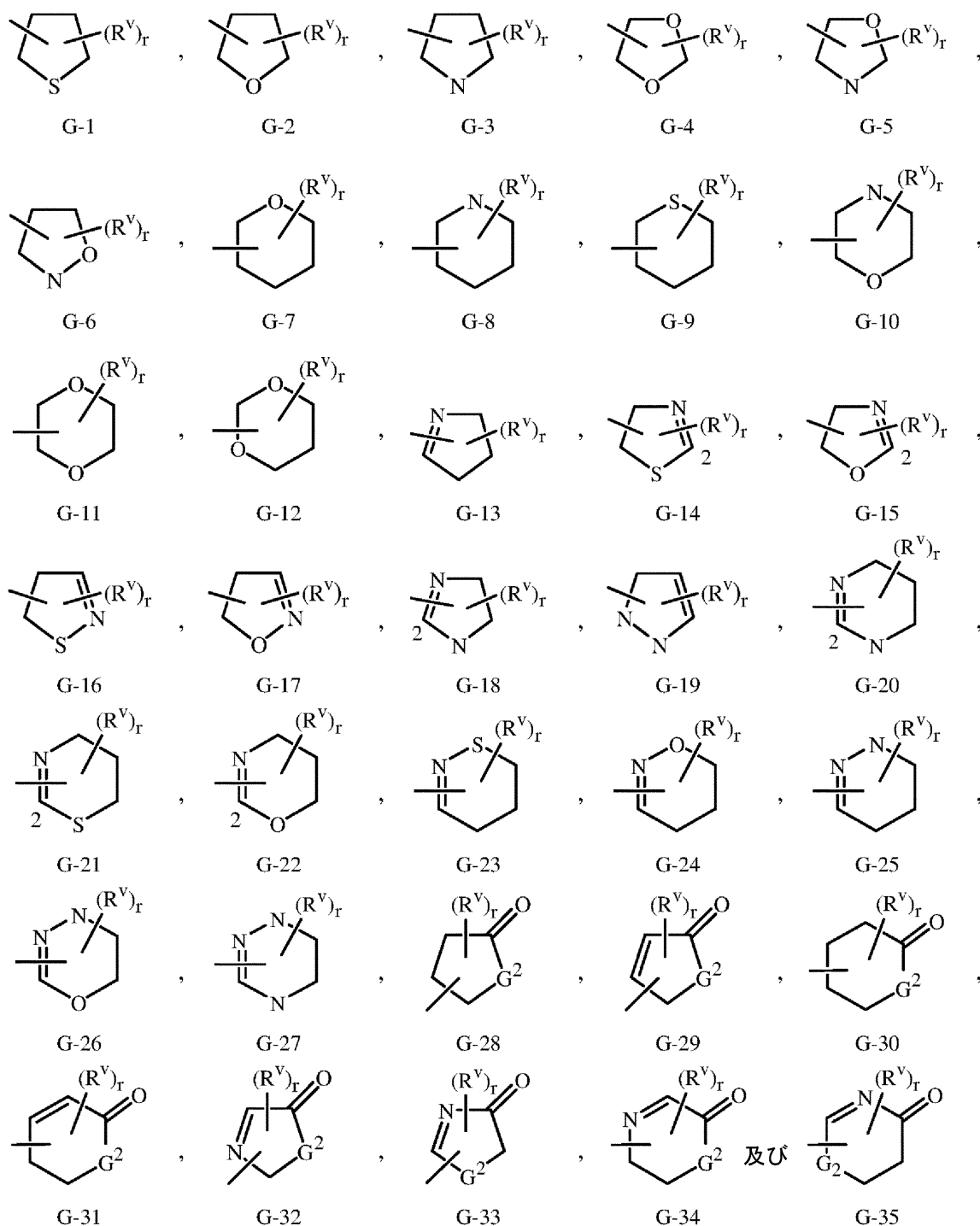
R^4 がG-28～G-35から選択される環を含むとき、 G^2 は、O、S又はNから選択されることに留意されたい。 G^2 がNであるとき、窒素原子は、概要において定義したような R^W に対応する置換基による置換によってその原子価を満たすことができることに留意されたい。

40

50

【化 5】

例示 2



10

20

30

40

【0046】

R^V基は構造U-2～U-61において示すが、これらは任意選択の置換基であるため、存在する必要がないことに留意されたい。R^Vが原子に付着したHであるとき、これは、前記原子が非置換であるのと同じであることに留意されたい。それらの原子価を満たすように置換を必要とする窒素原子は、H又はR^Vで置換されている。(R^V)_r及びU環の間の付着点が浮動しているとして例示されるとき、(R^V)_rは、U環の任意の利用可能な炭素原子又は窒素原子へと付着することができることに留意されたい。U環上の付着点が浮動しているとして例示されるとき、U基は、水素原子の置き換えによってU基の任意の利用可能な炭素又は窒素を介して式1の残部に付着することができることに留意され

50

たい。いくつかのU環は、4個未満のR^V基でのみ置換することができることに留意されたい（例えば、U-2～U-5、U-7～U-49、及びU-52～U-61）。

【0047】

当技術に関しては、芳香族及び非芳香族複素環式環及び環構造の調製を可能とする広く各種の合成方法が公知である。詳しい総説については、以下の文献を参照されたい：Comprehensive Heterocyclic Chemistry (A. R. Katritzky and C. W. Ree, editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984) の8巻セット、並びに、Comprehensive Heterocyclic Chemistry II (A. R. Katritzky, C. W. Rees, and E. F. V. Scriven, editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996) の12巻セット。

10

【0048】

本開示の化合物では、1種又は複数の立体異性体が存在可能である。立体異性体とは、同一の構成を有しているが、それらの原子の空間配置が異なっている異性体であって、鏡像異性体、ジアステレオマー、cis-trans-異性体（幾何異性体とも呼ばれる）、及びアトロプ異性体が含まれる。アトロプ異性体は、単結合の回りでの束縛回転から生じるものであって、その回転の障壁が高いために、それらの異性体種を単離することが可能である。当業者のよく理解するところであろうが、一つの立体異性体が、他の立体異性体よりも高濃度にするか、又は他の立体異性体から分離するときに、反応性がより高くてもよいし、及び／又は有利な効果を示してもよい。それに加えて、当業者であれば、前記立体異性体の分離法、富化法、及び／又は選択的な調製法を知っている。立体異性のすべての態様についての包括的な議論については、次の文献を参照されたい：Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley & Sons, 1994。

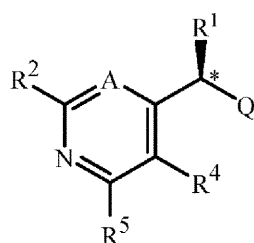
20

【0049】

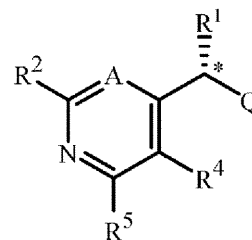
本開示の化合物は、立体異性体の混合物又は個々の立体異性体として存在し得る。例えば、2つの可能な式1のエナンチオマーは、アスタリスク(*)で同定されたキラル炭素中心が関与する式1a及び式1a'として示される。類似して、他のキラル中心は、例えば、R⁴において可能である。

30

【化6】



1a



1a'

40

【0050】

本明細書において描かれた分子の描写は、立体化学を描写するための、標準的な慣例に従っている。立体的な配置を描写するために、図の面から立ち上がって観察者の方に向かっている結合は、実線のくさび形で表現され、そのくさび形の幅広い方の末端は、図の面から立ち上がって観察者の方に向かう原子に結合されている。図の面の下の方に向かい、観察者から離れていく結合は、点線のくさび形で表現され、そのくさび形の幅広い方末端

50

は、原子に結合され、観察者からはさらに遠ざかっていく。

【0051】

本開示の化合物は、式1中に存在する可能なキラル炭素原子によって立体異性体として存在することができる。このように、本開示は、式1の化合物の個々の立体異性体、及び式1の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0052】

式1の化合物は、さらなるキラル中心を含むことができる。例えば、置換基及び他の分子成分、例えば、 R^4 は、それら自体がキラル中心を含有し得る。本開示は、ラセミ混合物、及びこれらのさらなるキラル中心における濃縮され本質的に純粋な立体的な配置を含む。

10

【0053】

本開示の化合物は、式1における任意の結合の周りの束縛回転によって1つ若しくは複数の配座異性体として存在することができる。本開示は、配座異性体の混合物を含む。さらに、本開示は、他の配座異性体に対して1つの配座異性体が濃縮している化合物を含む。

【0054】

より生物活性のあるエナンチオマーは、式1a（式1のR-エナンチオマーであると考えられる。

【0055】

本開示は、等しい量の式1a（式1のR-エナンチオマー）及び1a'（式1のS-エナンチオマー）のエナンチオマーのラセミ混合物を含む。さらに、本開示は、式1a及び1a'のラセミ混合物と比較して、式1aエナンチオマーが濃縮した混合物を含む。本開示はまた、式1aの本質的に純粋なエナンチオマーを含む。

20

【0056】

本開示の一実施形態は、式1a及び式1a'の化合物の立体異性体の混合物を含み、ここで、1aと1a'の比は、少なくとも75:25である（50%鏡像体過剰率）。

【0057】

本開示の一実施形態は、式1a及び式1a'の化合物の立体異性体の混合物を含み、ここで、1aと1a'の比は、少なくとも90:10である（80%鏡像体過剰率の1a）。

【0058】

本開示の一実施形態は、式1a及び式1a'の化合物の立体異性体の混合物を含み、ここで、1aと1a'の比は、少なくとも95:5である（90%鏡像体過剰率の1a）。

30

【0059】

本開示の一実施形態は、式1a及び式1a'の化合物の立体異性体の混合物を含み、ここで、1aと1a'の比は、少なくとも98:2である（96%鏡像体過剰率の1a）。

【0060】

本開示の一実施形態は、式1a及び式1a'の化合物の立体異性体の混合物を含み、ここで、1aと1a'の比は、少なくとも99:1である（98%鏡像体過剰率の1a）。

【0061】

本開示の一実施形態は、式1a及び式1a'の化合物の立体異性体の混合物を含み、ここで、1aと1a'の比は、本質的に100:0である。

40

【0062】

本開示の一実施形態は、式1aの化合物を含む。

【0063】

当業者の認識するところであろうが、全部の窒素含有複素環がN-オキシドを形成できる訳ではないが、その理由は、その窒素が、酸化されてオキシドとなるには、利用可能な孤立電子対を必要とするからである。N-オキシドを形成することが可能なそれらの窒素含有複素環は、当業者のよく知るところであろう。第三級アミンがN-オキシドを形成することが可能であることもまた、当業者のよく知るところであろう。複素環及び第三級アミンのN-オキシドを調製するための合成方法は、ペルオキシ酸例えば過酢酸及び3-ク

50

ロ口過安息香酸 (MCPBA)、過酸化水素、アルキルヒドロペルオキシド例えば、*t*-ブチルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム、並びにジオキシラン例えばジメチルジオキシランを用いて、複素環及び第三級アミンを酸化させることも含めて、当業者の極めてよく知るところである。N-オキシドを調製するためのこれらの方法は、文献に広く記述され、総説が書かれているが、例えば、以下の文献を参照されたい：T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp. 748–750 (S. V. Ley, Ed., Pergamon Press); M. Tisler and B. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp. 18–20 (A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press); M. R. Grimmett and B. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp. 149–161 (A. R. Katritzky, Ed., Academic Press); M. Tisler and B. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp. 285–291 (A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press); 及び G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp. 390–392 (A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press)。

10

20

【0064】

当業者の認識するところであるが、環境内及び生理学的条件下では、化合物の塩は、それらに相当する非塩の形態とは平衡関係にあることが理由で、塩は、その非塩の形態と、生物学的実用性を分け合っている。したがって、式1の化合物の広く各種の塩が、無脊椎有害生物を防除するのに有用である。式1の化合物の塩としては、例えば以下のような無機酸又は有機酸との酸付加塩が挙げられる：臭化水素酸、塩化水素酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸、又は吉草酸。式1の化合物に、カルボン酸又はフェノールのような酸性の残基が含まれているような場合には、塩としてはさらに、例えば以下のような有機又は無機の塩基を用いて形成されたものが含まれる：ピリジン、トリエチルアミン若しくはアンモニア、又はアミド、水素化物、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム、若しくはバリウムの水酸化物又は炭酸塩。したがって、本開示には、式1から選択される化合物、それらのN-オキシド及び好適な塩が含まれる。

30

【0065】

式1から選択される化合物、それらの立体異性体、互変異性体、N-オキシド、及び塩は、典型的には、二つ以上の形態で存在し、そのため、式1には、式1で表される化合物の、すべての結晶性及び非晶性の形態が含まれる。非晶性の形態には、固体である実施形態例えばワックス及びゴム、さらには液体である実施形態例えば溶液及び熔融物が含まれる。結晶性の形態には、実質的に単結晶タイプを表す実施形態、及び多形の混合物（すなわち、複数の結晶性タイプ）を表す実施形態が含まれる。「多形 (polymorph)」という用語は、各種の結晶性の形態で結晶化することが可能な、化合物の特定の結晶性の形態を表しており、これらの形態は、結晶格子の中での、各種の分子の配列及び／又は配座を有している。複数の多形が、同一の化学組成を有することができるが、それらはさらに、その格子の中に弱く、又は強く結合されることが可能な、共結晶された水又は他の分子の存否によって、組成が異なっていることも可能である。多形は、結晶の形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度、及び生物学的アベイラビリティのような、化学的、物理的、及び生物学的性質の面で異なっている可能性がある。当業者が認めるところであろうが、式1で表される化合物の多形が、式1で表される同一の化合物の他の多形、又は複数の多形の混合物に比較して、有利な効果（例えば、有用な

40

50

配合を調製する際の適合性、改良された生物学的性能)を示すことが可能である。式1で表される化合物の特定の多形の調製及び単離は、例えば、選択された溶媒及び温度を使用する結晶化など、当業者には公知の方法によって達成することができる。本開示の化合物は、1つ若しくは複数の結晶性多形として存在し得る。本開示は、個々の多形、及び他の多形に対して1つの多形が濃縮されている混合物を含めた多形の混合物の両方を含む。多形の網羅的な考察について、R. Hilfiker, Ed., Polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006を参照されたい。

【0066】

概要において記載するような本開示の実施形態は、下記に記載するものを含む。下記の実施形態において、式1は、その立体異性体、N-オキシド及び塩を含み、「式1の化合物」への言及は、実施形態においてさらに定義しない限り、概要において特定した置換基の定義を含む。

10

【0067】

実施形態1。R¹が、F、OR⁶又はSR⁶である、式1の化合物。

【0068】

実施形態1a。R¹が、Fである、式1又は実施形態1に記載の化合物。

【0069】

実施形態1b。R¹が、OR⁶である、式1又は実施形態1に記載の化合物。

20

【0070】

実施形態1c。R¹が、SR⁶である、式1又は実施形態1に記載の化合物。

【0071】

実施形態2。Aが、N又はCR³である、式1又は先行する実施形態のいずれか1項に記載の化合物。

【0072】

実施形態2a。Aが、Nである、式1又は先行する実施形態のいずれか1項に記載の化合物。

【0073】

実施形態2b。Aが、CR³である、式1又は先行する実施形態のいずれか1項に記載の化合物。

30

【0074】

実施形態3。R²が、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₃～C₄ハロシクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ又はC₁～C₄ハロアルコキシである、式1又は先行する実施形態のいずれか1項に記載の化合物。

【0075】

実施形態3a。R²が、H、ハロゲン又はC₁～C₄アルキルである、式1又は先行する実施形態のいずれか1項に記載の化合物。

【0076】

実施形態3b。R²が、Hである、実施形態3に記載の化合物。

40

【0077】

実施形態3c。R²が、ハロゲンである、実施形態3に記載の化合物。

【0078】

実施形態3d。R²が、C₁～C₄アルキルである、実施形態3に記載の化合物。

【0079】

実施形態4。R³が、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₃～C₄ハロシクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ又はC₁～C₄ハロアルコキシである、式1又は先行する実施形態のいずれか1項に記載の化合物。

【0080】

50

実施形態 4 a。R³ が、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシである、実施形態 4 に記載の化合物。

【0081】

実施形態 4 b。R³ が、H 又はハロゲンである、実施形態 4 a に記載の化合物。

【0082】

実施形態 4 c。R³ が、H である、実施形態 4 b に記載の化合物。

【0083】

実施形態 4 d。R³ が、ハロゲンである、実施形態 4 a に記載の化合物。

【0084】

実施形態 4 f。R³ が、F である、実施形態 4 d に記載の化合物。

【0085】

実施形態 4 g。R³ が、Cl である、実施形態 4 d に記載の化合物。

【0086】

実施形態 4 h。R³ が、Br である、実施形態 4 d に記載の化合物。

【0087】

実施形態 4 i。R³ が、C₁～C₄ アルキルである、実施形態 4 a に記載の化合物。

【0088】

実施形態 4 j。R³ が、Me である、実施形態 4 i に記載の化合物。

【0089】

実施形態 4 k。R³ が、C₁～C₄ ハロアルキルである、実施形態 4 a に記載の化合物。

【0090】

実施形態 4 l。R³ が、CF₃ である、実施形態 4 k に記載の化合物。

【0091】

実施形態 5。R⁴ が、5～6 員の複素環式環であり、各環が、炭素原子、並びに 2 個までの O 原子、2 個までの S 原子及び 4 個までの N 原子から独立して選択される 1～4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個までの環員が、C(=O)、C(=S)、S(=O) 及び S(=O)₂ から独立に選択され、各環又は環系が、R^v から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており、r が、置換基の数である、式 1 又は先行する実施形態のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0092】

実施形態 5 a。R⁴ が、例示 1

10

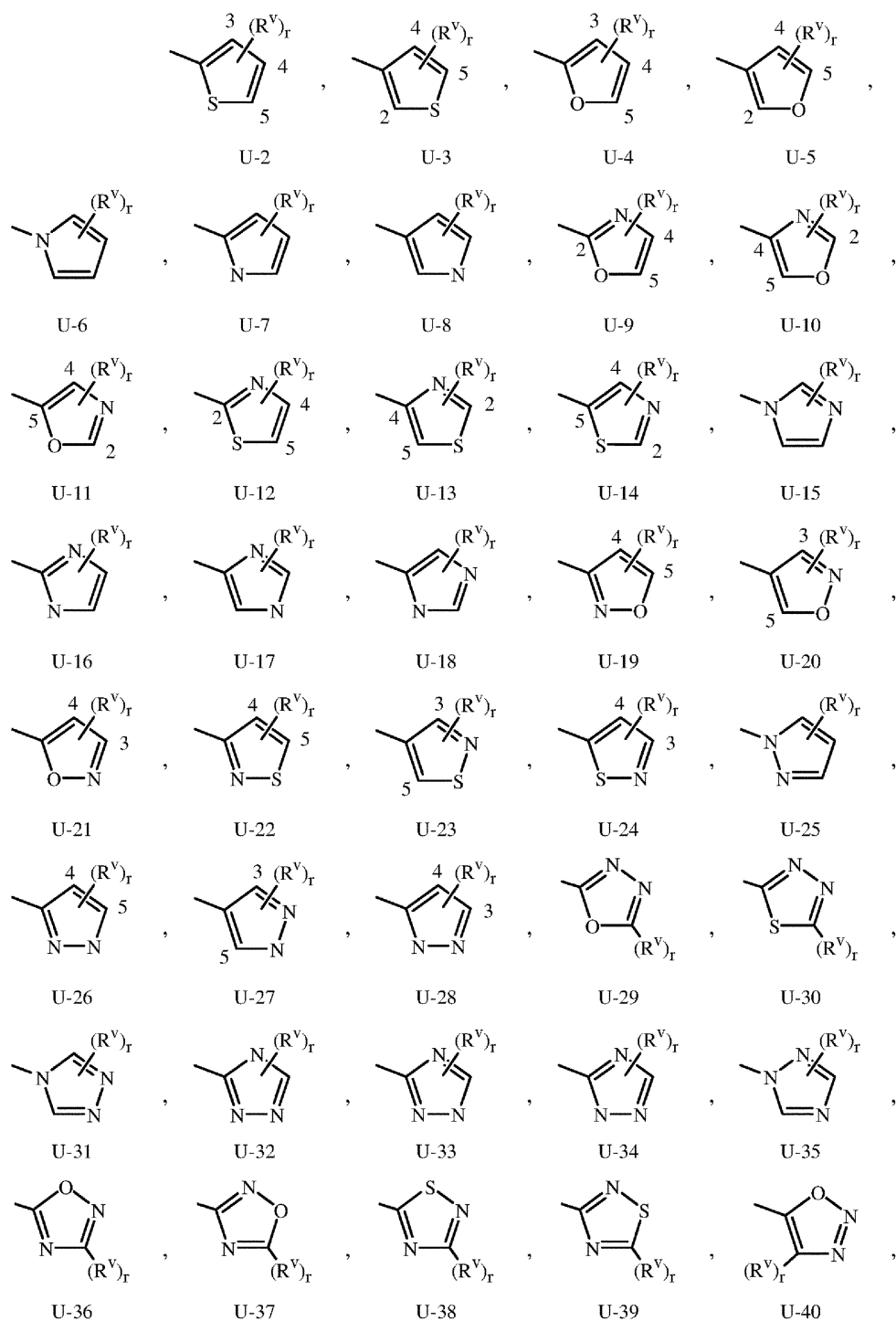
20

30

40

50

【化 7】

例示 1

10

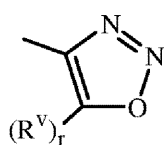
20

30

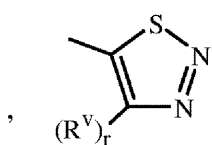
40

50

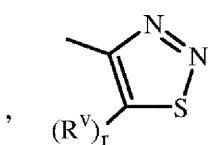
【化 8】



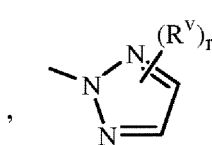
U-41



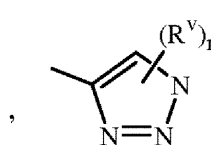
U-42



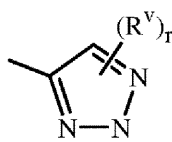
U-43



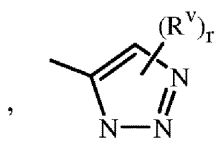
U-44



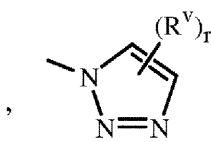
U-45



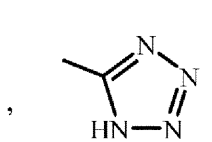
U-46



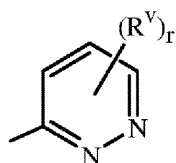
U-47



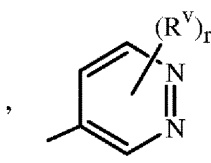
U-48



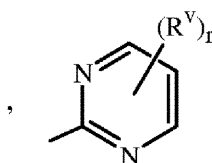
U-49



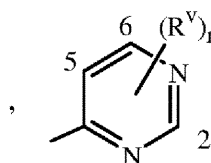
U-52



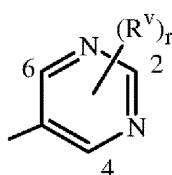
U-53



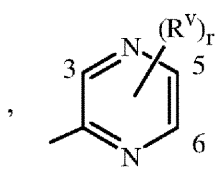
U-54



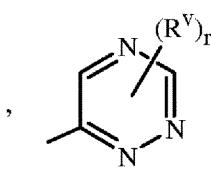
U-55



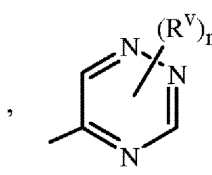
U-56



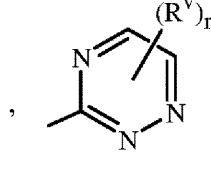
U-57



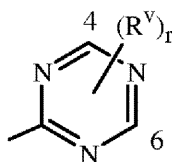
U-58



U-59



U-60



U-61

において示すような U-2 ~ U-49 又は U-52 ~ U-61 から選択される、実施形態 5 に記載の化合物。

【0093】

実施形態 5 b。R⁴ が、U-2 ~ U-49 から選択される、実施形態 5 a に記載の化合物。

【0094】

実施形態 5 c。R⁴ が、U-2、U-3、U-4、U-5、U-7、U-9、U-11、U-12、U-13、U-16、U-21、U-25、U-26、U-27、U-28、U-29、U-31、U-32、U-35、U-36、U-37、U-44、U-48 及び U-49 から選択される、実施形態 5 b に記載の化合物。

【0095】

実施形態 5 d。R⁴ が、U-9、U-11、U-32、U-36 及び U-44 から選択される、実施形態 5 c に記載の化合物。

【0096】

実施形態 5 e。R⁴ が、U-9 及び U-44 から選択される、実施形態 5 d に記載の化合物。

【 0 0 9 7 】

実施形態 5 f。R⁴ が、U - 9 である、実施形態 5 e に記載の化合物。

【 0 0 9 8 】

実施形態 5 g。R⁴ が、U - 1 1 である、実施形態 5 d に記載の化合物。

【 0 0 9 9 】

実施形態 5 h。R⁴ が、U - 3 2 である、実施形態 5 d に記載の化合物。

【 0 1 0 0 】

実施形態 5 i。R⁴ が、U - 3 6 である、実施形態 5 d に記載の化合物。

【 0 1 0 1 】

実施形態 5 j。R⁴ が、U - 4 4 である、実施形態 5 d に記載の化合物。

10

【 0 1 0 2 】

実施形態 5 k。R⁴ が、例示 2

20

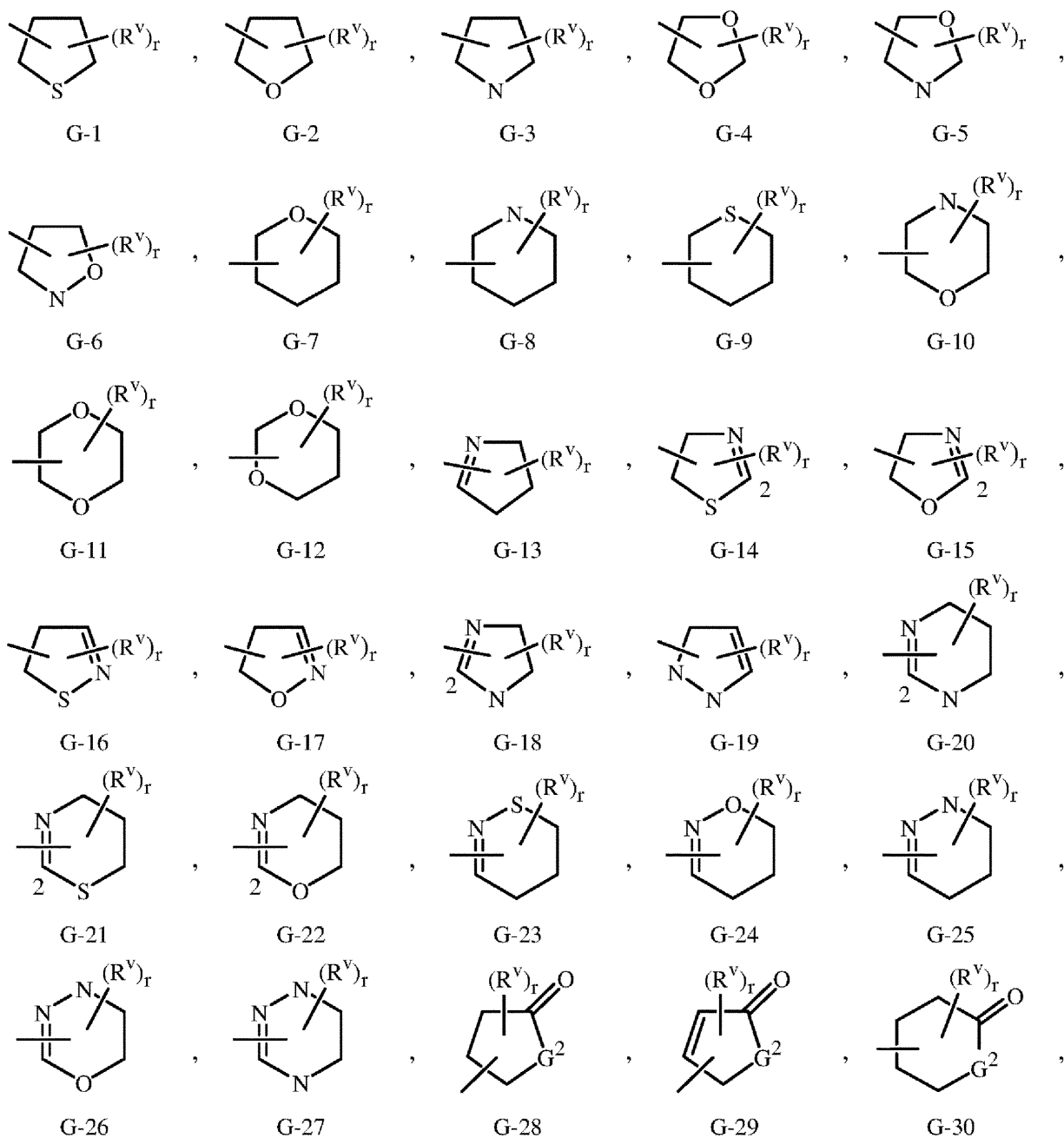
30

40

50

【化 9】

例示 2



10

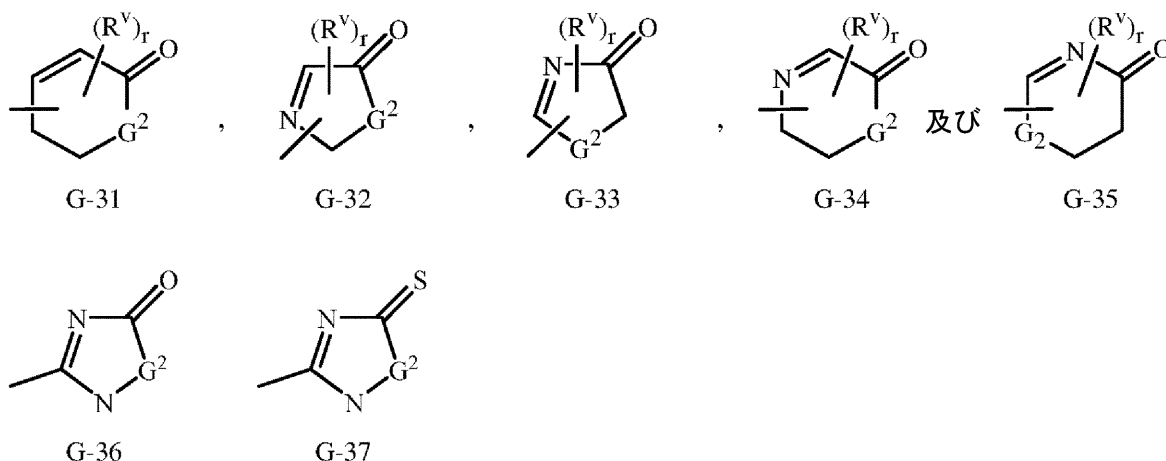
20

30

40

50

【化 10】



10

において示すような G-1 ~ G-37 から選択される、実施形態 5 に記載の化合物。

【0103】

実施形態 5 l。G² が、O、S 又は N である、実施形態 5 k に記載の化合物。

【0104】

実施形態 5 m。G² が、O である、実施形態 5 l に記載の化合物。

20

【0105】

実施形態 5 n。G² が、S である、実施形態 5 l に記載の化合物。

【0106】

実施形態 5 o。G² が、N である、実施形態 5 l に記載の化合物。

【0107】

実施形態 6。R^v が、独立して、H、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ又は C₁ ~ C₆ ハロアルコキシである、式 1 又は先行する実施形態のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0108】

実施形態 6 a。R^v が、H である、実施形態 6 に記載の化合物。

30

【0109】

実施形態 6 b。R^v が、ハロゲンである、実施形態 6 に記載の化合物。

【0110】

実施形態 6 c。R^v が、C₁ ~ C₆ アルキルである、実施形態 6 に記載の化合物。

【0111】

実施形態 6 d。R^v が、Me である、実施形態 6 c に記載の化合物。

【0112】

実施形態 7。r が、1、2、3、4 又は 5 である、式 1 又は実施形態 5 ~ 6 d のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0113】

実施形態 7 a。r が、1 又は 2 である、実施形態 7 に記載の化合物。

40

【0114】

実施形態 7 b。r が、1 である、実施形態 7 に記載の化合物。

【0115】

実施形態 7 c。r が、2 である、実施形態 7 に記載の化合物。

【0116】

実施形態 7 d。r が、3 である、実施形態 7 に記載の化合物。

【0117】

実施形態 7 e。r が、4 である、実施形態 7 に記載の化合物。

【0118】

50

実施形態 7 f。r が、5 である、実施形態 7 に記載の化合物。

【0119】

実施形態 8。R⁵ が、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシである、式 1 又は先行する実施形態のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0120】

実施形態 8 a。R⁵ が、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシである、実施形態 8 に記載の化合物。

10

【0121】

実施形態 8 b。R⁵ が、H 又はハロゲンである、実施形態 8 a に記載の化合物。

【0122】

実施形態 8 c。R⁵ が、H である、実施形態 8 b に記載の化合物。

【0123】

実施形態 8 d。R⁵ が、ハロゲンである、実施形態 8 b に記載の化合物。

【0124】

実施形態 8 e。R⁵ が、F である、実施形態 8 d に記載の化合物。

【0125】

実施形態 8 e。R⁵ が、Cl である、実施形態 8 d に記載の化合物。

20

【0126】

実施形態 8 e。R⁵ が、Br である、実施形態 8 d に記載の化合物。

【0127】

実施形態 8 e。R⁵ が、C₁～C₄ アルキルである、実施形態 8 a に記載の化合物。

【0128】

実施形態 9。R⁶ が、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル又は C₃～C₄ ハロシクロアルキルである、式 1 又は先行する実施形態のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0129】

実施形態 9 a。R⁶ が、C₁～C₄ アルキル又は C₁～C₄ ハロアルキルである、実施形態 9 に記載の化合物。

30

【0130】

実施形態 9 b。R⁶ が、C₁～C₄ アルキルである、実施形態 9 に記載の化合物。

【0131】

実施形態 9 c。R⁶ が、Me である、実施形態 9 b に記載の化合物。

【0132】

実施形態 9 d。R⁶ が、C₁～C₄ ハロアルキルである、実施形態 9 に記載の化合物。

【0133】

実施形態 9 e。R⁶ が、CF₃ である、実施形態 9 b に記載の化合物。

【0134】

実施形態 10。Q が、環上で 0～2 個の N を有する 6 員の芳香族環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている、式 1 又は先行する実施形態のいずれか 1 項に記載の化合物。

40

【0135】

実施形態 10 a。Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている、実施形態 10 に記載の化合物。

【0136】

実施形態 10 b。Q が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されているフェニル環である、実施形態 10 a に記載の化合物。

50

【0137】

実施形態10c。Qが、炭素原子環員上でR^Wから独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されているピリジニル環である、実施形態10aに記載の化合物。

【0138】

実施形態10d。Qが、炭素原子環員上でR^Wから独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されているピリミジニル環である、実施形態10aに記載の化合物。

【0139】

実施形態10e。Qが、炭素原子環員上でR^Wから独立して選択される5個までの置換基で場合によっては置換されているピラジニル環である、実施形態10aに記載の化合物。

10

【0140】

実施形態11。R^Wが、独立して、H、シアノ、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₂～C₆アルコキシアルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₃～C₆シクロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル又はC₃～C₆シクロアルキルスルホニルである、式1又は実施形態9～9eのいずれか1項に記載の化合物。

20

【0141】

実施形態11a。R^Wが、シアノ、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル又はC₁～C₆ハロアルキルスルホニルである、実施形態11に記載の化合物。

【0142】

実施形態11b。R^Wが、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニルである、実施形態11aに記載の化合物。

30

【0143】

実施形態11c。R^Wが、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニルである、実施形態11bに記載の化合物。

【0144】

実施形態11d。R^Wが、OCF₃、SCF₃、CF₃、SOCF₃又はSO₂CF₃である、実施形態11cに記載の化合物。

40

【0145】

実施形態11e。R^Wが、OCF₃である、実施形態11dに記載の化合物。

【0146】

実施形態11f。R^Wが、SCF₃である、実施形態11dに記載の化合物。

【0147】

実施形態11g。R^Wが、CF₃である、実施形態11dに記載の化合物。

【0148】

実施形態11h。R^Wが、SOCF₃又はSO₂CF₃である、実施形態11dに記載の化合物。

【0149】

50

実施形態 1 2。s が、1、2、3、4 又は 5 である、式 1 又は先行する実施形態のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0150】

実施形態 1 2 a。r が、1 又は 2 である、実施形態 1 2 に記載の化合物。

【0151】

実施形態 1 2 b。r が、1 である、実施形態 1 2 に記載の化合物。

【0152】

実施形態 1 2 c。r が、2 である、実施形態 1 2 に記載の化合物。

【0153】

実施形態 1 2 d。r が、3 である、実施形態 1 2 に記載の化合物。

10

【0154】

実施形態 1 2 e。r が、4 である、実施形態 1 2 に記載の化合物。

【0155】

実施形態 1 2 f。r が、5 である、実施形態 1 2 に記載の化合物。

【0156】

実施形態 1 3。n が、0、1 又は 2 である、式 1 又は先行する実施形態のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0157】

実施形態 1 3 a。n が、0 である、実施形態 1 3 に記載の化合物。

【0158】

20

実施形態 1 3 b。n が、1 である、実施形態 1 3 に記載の化合物。

【0159】

実施形態 1 3 c。n が、2 である、実施形態 1 3 に記載の化合物。

【0160】

実施形態 A 1。式 1 の化合物が、式 1 a の化合物である、実施形態 1 ～ 1 3 c のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0161】

実施形態 A 2。式 1 の化合物が、式 1 a ' の化合物である、実施形態 1 ～ 1 3 c のいずれか 1 項に記載の化合物。

【0162】

30

実施形態 A 3。式 1 a の化合物及び式 1 a ' の化合物を含む、組成物。

【0163】

実施形態 A 3 a。式 1 a の化合物と式 1 a ' の化合物の比が、60：40 超である、実施形態 A 3 に記載の化合物。

【0164】

実施形態 A 3 b。式 1 a の化合物と式 1 a ' の化合物の比が、80：20 超である、実施形態 A 3 a に記載の化合物。

【0165】

実施形態 A 3 c。式 1 a の化合物と式 1 a ' の化合物の比が、90：10 超である、実施形態 A 3 a に記載の化合物。

40

【0166】

実施形態 A 3 d。式 1 a の化合物と式 1 a ' の化合物の比が、99：1 超である、実施形態 A 3 a に記載の化合物。

【0167】

実施形態 A 4。式 1 a ' の化合物及び式 1 a の化合物を含む、組成物。

【0168】

実施形態 A 4 a。式 1 a ' の化合物と式 1 a の化合物の比が、60：40 超である、実施形態 A 4 に記載の化合物。

【0169】

実施形態 A 4 b。式 1 a ' の化合物と式 1 a の化合物の比が、80：20 超である、実施

50

形態 A 4 に記載の化合物。

【0170】

実施形態 A 4 c。式 1 a' の化合物と式 1 a の化合物の比が、90 : 10 超である、実施形態 A 4 に記載の化合物。

【0171】

実施形態 A 4 d。式 1 a' の化合物と式 1 a の化合物の比が、99 : 1 超である、実施形態 A 4 に記載の化合物。

【0172】

実施形態 X。無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境と生物学的有効量の式 1 の化合物とを接触させることを含む、方法。

10

【0173】

実施形態 X 1。無脊椎有害生物が、半翅目 (Hemiptera) のメンバーである、実施形態 X に記載の方法。

【0174】

実施形態 X 2。半翅目の昆虫のメンバーが、同翅亜目 (Homoptera) のメンバーである、実施形態 X 1 に記載の方法。

【0175】

実施形態 X 2 a。同翅亜目 (Homoptera) が、オオヨコバイ科 (Cicadellidae) 及びウンカ科 (Delphacidae) からのウンカを含む、実施形態 X 2 に記載の方法。

20

【0176】

実施形態 X 2 b。同翅亜目 (Homoptera) が、アブラムシ科 (Aphididae) からのアブラムシを含む、実施形態 X 2 に記載の方法。

【0177】

実施形態 X 2 c。同翅亜目 (Homoptera) が、コナジラミ科 (Aleyrodidae) からのコナジラミを含む、実施形態 X 2 に記載の方法。

【0178】

実施形態 X 3。同翅亜目 (Homoptera) が、CPH、CMA、GPA 及び WF を含む、実施形態 X 2 に記載の方法。

【0179】

実施形態 X 4。同翅亜目 (Homoptera) が、アフィス・ファバエ (Aphis fabae) Scopolii (黒豆アブラムシ)、ワタアブラムシ (Aphis gossypii) Glover (ワタアブラムシ又はメロンアブラムシ)、タバココナジラミ (Bemisia tabaci) Gennadius (タバココナジラミ、サツマイモコナジラミ)、シルバーリーフコナジラミ (Bemisia argentifolii) Bellows & Perring (シルバーリーフコナジラミ)、ミカンコナジラミ (Dialeurodes citri) Ashmead (ミカンコナジラミ) 及びオンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum) Westwood (オンシツコナジラミ); エンポアスカ・ファバエ (Empoasca fabae) Harris (ポテトリーフホッパー)、ラオデルファックス・ストリアテルス (Laodelphax striatellus) Fallen (スモラーブラウンプラントホッパー)、マクロステス・クアドリリネアツス (Macrostelus quadrilineatus) Forbes (アスターリーフホッパー)、ツماغロヨコバイ (Nephotettix cincticeps) Uhler (グリーンリーフホッパー)、ネフォテティクス・ニグロピクツス (Nephotettix nigropictus) Stal (ライスリーフホッパー)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens) Stal (ブラウンプラントホッパー)、ペレグリヌス・マイディス (Peregrinus maidis) Ashmead (コーンプラントホッパー)、セジロウンカ (Sogatella furcifera) Horvath (ホワイバックドプラントホッパー)、タゴソデス・オリジコルス (Tagosodes orizic

30

40

50

olus) Muir (ライスウンカ類)、ティフロシバ・ポマリア (Typhlocyba pomaria) McAtee (ホワイトアップルリーフホッパー) 又はエリトロネウラ属 (Erythroneura) の種 (ブドウリーフホッパー) を含む、実施形態 X 2 に記載の方法。

【0180】

実施形態 X 5。半翅目の昆虫が、カメムシ亜目 (Heteroptera) のメンバーである、実施形態 X 1 に記載の方法。

【0181】

実施形態 X 5 a。カメムシ亜目 (Heteroptera) が、アクロステルナム・ヒラレ (Acrosternum hilare) Say (アオカメムシ)、アナサ・トリステス (Anasa tristis) De Geer (ヘリカメムシ)、ブリサス・ロイコプテラス・ロイコプテラス (Blissus leucopterus leucopterus) Say (アメリカコバネナガカメムシ)、シメックス・レクチュラリウス (Cimex lectularius) Linnaeus (トコジラミ)、コリツカ・ゴッシピイ (Corythucha gossypii) Fabricius (コットンレースバグ)、シルトペルチス・モDESTA (Cyrtopeltis modesta) Distant (トマトバグ)、ジケロプス・メラカンツス (Dichelops melacanthus) Dallas (グリーンベリーカメムシ)、ディスデルカス・スツレルス (Dysdercus suturellus) Herrich-Schaffner (コットンステイナー)、オイスキスツス・ヘロス (Euschistus heros) Fabricius (新熱帯ブラウンカメムシ)、オイスキスツス・セルプス (Euschistus servus) Say (ブラウンカメムシ)、オイスキスツス・バリオラリウス (Euschistus variolarius) Palisot de Beauvois (ワンスポットドカメムシ)、ヒメマダラカメムシ (Graptostethus) 種 (シードバグの複合体)、クサギカメムシ (Halyomorpha halys) Stal (ブラウン大理石様カメムシ)、レプトグロッシス・コルクウス (Leptoglossus corculus) Say (リーフフーティッドパインシードバグ)、リグス・リネオラリス (Lygus lineolaris) Palisot de Beauvois (ミドリメクラガメ)、ミナミアオカメムシ (Nezara viridula) Linnaeus (ミナミアオカメムシ)、オエバラス・プグナクス (Oebalus pugnax) Fabricius (ライスカメムシ)、オンコベルタス・ファシアタス (Oncopeletus fasciatus) Dallas (ラージミルクウィードバグ)、シューダトモスセリス・セリアツス (Pseudatomoscelis seriatus) Reuter (コットンフリーホッパー) を含む、実施形態 X 5 に記載の方法。

【0182】

実施形態 X 6。カメムシ亜目 (Heteroptera) が、カメムシ科 (Pentatomidae) からのカメムシを含む、実施形態 X 5 に記載の方法。

【0183】

実施形態 X 7。カメムシ亜目 (Heteroptera) が、アクロステルナム・ヒラレ (Acrosternum hilare) Say (アオカメムシ)、ジケロプス・メラカンツス (Dichelops melacanthus) Dallas (グリーンベリーカメムシ)、オイスキスツス・ヘロス (Euschistus heros) Fabricius (新熱帯ブラウンカメムシ)、オイスキスツス・セルプス (Euschistus servus) Say (ブラウンカメムシ)、オイスキスツス・バリオラリウス (Euschistus variolarius) Palisot de Beauvois (ワンスポットドカメムシ)、ハリモルファ・ハリス (Halyomorpha halys) Stal (ブラウン大理石様カメムシ)、ミナミアオカメムシ (Nezara viridula) Linnaeus (ミナミアオカメムシ)、オエバラス・プグナクス (Oebalus pugnax) Fabricius (ライスカメムシ) を含む、実施

10

20

30

40

50

形態 X 6 に記載の方法。

【0184】

実施形態 X 8。カメムシ亜目 (Heteroptera) が、アナサ・トリスチス (Anasa tristis) De Geer (ヘリカメムシ)、ブリサス・ロイコプテルス (Blissus leucopterus) Say (アメリカコバネナガカメムシ)、シメックス・レクチュラリウス (Cimex lectularius) Linnaeus (トコジラミ)、コリツカ・ゴシッピー (Corythuca gossypii) Fabricius (コットンレースバグ)、シルトペルチス・モデスタ (Cyrtopeletis modesta) Distant (トマトバグ)、ディスデルカス・スツレルス (Dysdercus suturellus) Herrich-Schaffer (コットンステイナー)、ヒメマダラカメムシ (Graptosthetus) 種 (シードバグの複合体)、レプトグロッサス・コルクルス (Leptoglossus corculus) Say (リーフフーティッドパインシードバグ)、リグス・リネオラリス (Lygus lineolaris) Palisot de Beauvois (ミドリメクラガメ)、オンコペルタス・ファシアタス (Oncopeltus fasciatus) Dallas (ラージミルクウィードバグ)、又はシューダトモスセリス・セリアツス (Pseudatomoscelis seriatus) Reuter (コットンフリーホッパー) を含む、実施形態 X 5 に記載の方法。

10

【0185】

上述の実施形態 1～X 8、さらには本明細書に記載の各種の他の実施形態も含めて、本開示の実施形態は、どのように組合せてもよく、そしてそれらの実施形態における各種の記述は、式 1 の化合物に関連するだけでなく、出発化合物、及び式 1 の化合物を調製するのに有用な中間体化合物にも関連する。それに加えて、上述の実施形態 1～X 8、さらには本明細書に記載の各種その他の実施形態、及びそれらの各種組合せも含めた、本開示の実施形態は、本開示の組成物及び方法にも関連する。

20

【0186】

実施形態 1～X 8 の組合せを下記によって例示する：

【0187】

実施形態 A。式 1 の化合物

[式中、

30

R^1 は、F であり；

A は、 CR^3 であり；

R^2 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^3 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 は、5～6 員の複素環式環であり、各環は、炭素原子、並びに 2 個までの O 原子、2 個までの S 原子及び 4 個までの N 原子から独立して選択される 1～4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個までの環員は、C(=O)、C(=S)、S(=O) 及び S(=O)₂ から独立して選択され、各環又は環系は、 R^v から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており、r は、置換基の数であり、各 R^v は、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシであり；

40

r は、1、2、3、4 又は 5 であり；

R^5 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

Q は、環上で 0～2 個の N を有する 6 員の芳香族環であり、各環は、炭素原子環員上で R

50

R^W から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；
 R^W は、独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり；

s は、1、2、3、4 又は 5 であり；

n は、0、1 又は 2 である】。

【0188】

実施形態 B。 R^2 が、H、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 が、例示 1 において示すような U-2 ~ U-49 又は U52 ~ U61 から選択され；

r が、1 又は 2 であり；

R^5 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^W が、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり、

s が、1 又は 2 である、実施形態 A に記載の化合物。

【0189】

実施形態 C。 R^2 が、H であり；

R^3 が、H 又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2 ~ U-49 から選択され；

R^V が、H であり；

R^5 が、H 又はハロゲンであり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^W から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^W が、 OCF_3 、 SCF_3 、 CF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である、実施形態 B に記載の化合物。

【0190】

実施形態 D。 R^2 が、H であり；

R^3 が、H 又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2 ~ U-49 から選択され；

R^V が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^5 が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^W から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている、実施形態 B に記載の化合物。

【0191】

実施形態 E。 R^3 が、ハロゲンであり；

R^4 が、U-2、U-3、U-4、U-5、U-7、U-9、U-11、U-12、U-13、U-16、U-21、U-25、U-26、U-27、U-28、U-29、U-31、U-32、U-35、U-36、U-37、U-44、U-48 及び U-49 から選択され；

R^5 が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^W から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている

10

20

30

40

50

、実施形態 C に記載の化合物。

【0192】

実施形態 F。R³ が、F であり；

R⁴ が、U-9、U-11、U-32、U-36 及び U-44 から選択され；

Q が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されているフェニル環である、実施形態 E に記載の化合物。

【0193】

実施形態 G。R⁴ が、U-9 及び U-44 から選択される、実施形態 F に記載の化合物。

【0194】

実施形態 H。R⁴ が、U-9 の基から選択される、実施形態 G に記載の化合物。

10

【0195】

実施形態 I。R⁴ が、U-44 の基から選択される、実施形態 G に記載の化合物。

【0196】

実施形態 J。R² が、C₁～C₄ アルキルであり；

R³ が、H 又はハロゲンであり；

R⁴ が、U-2～U-49 から選択され；

R^v が、H であり；

r が、2 であり；

R⁵ が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

20

R^w が、OCF₃、SCF₃、CF₃、SOCF₃ 又は SO₂CF₃ である、実施形態 B に記載の化合物。

【0197】

実施形態 AA。R¹ が、OR⁶ であり；

A が、CR³ であり；

R² が、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

30

R³ が、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

R⁴ が、5～6 員の複素環式環であり、各環が、炭素原子、並びに 2 個までの O 原子、2 個までの S 原子及び 4 個までの N 原子から独立して選択される 1～4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個までの環員が、C(=O)、C(=S)、S(=O) 及び S(=O)₂ から独立に選択され、各環又は環系が、R^v から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており、r が、置換基の数であり、各 R^v が、独立して、H、ハロゲン、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ ハロアルキル、C₁～C₆ アルコキシ又は C₁～C₆ ハロアルコキシであり；

40

r が、1、2、3、4 又は 5 であり；

R⁵ が、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

R⁶ が、C₁～C₄ アルキルであり；

Q が、環上で 0～2 個の N を有する 6 員の芳香族環であり、各環は、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^w が、独立して、シアノ、ハロゲン、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ アルコキシ、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ ハロアルキル、C₂～C₆ アルケニル、C₂～C₆ ハロアルケニル、C₂～C₆ アルキニル、C₁～C₆ アルキル

50

チオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり；

s が、1、2、3、4 又は 5 であり；

n が、0、1 又は 2 である、式 1 の化合物。

【0198】

実施形態 BB。 R^2 が、H、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^4 が、例示 1 において示すような U-2 ~ U-49 又は U52 ~ U61 から選択され；

r が、1 又は 2 であり；

R^5 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^6 が、Me であり；

R^w が、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり、

s が、1 又は 2 である、実施形態 AA に記載の化合物。

【0199】

実施形態 CC。 R^2 が、H であり；

R^3 が、H 又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2 ~ U-49 から選択され；

R^v が、H であり；

r が、2 であり；

R^5 が、H 又はハロゲンであり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環は、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^w が、 OCF_3 、 SCF_3 、 CF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である、実施形態 B に記載の化合物。

【0200】

実施形態 DD。 R^2 が、H であり；

R^3 が、H 又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2 ~ U-49 から選択され；

R^v が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^5 が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている、実施形態 BB に記載の化合物。

【0201】

実施形態 EE。 R^3 が、ハロゲンであり；

R^4 が、U-2、U-3、U-4、U-5、U-7、U-9、U-11、U-12、U-13、U-16、U-21、U-25、U-26、U-27、U-28、U-29、U-31、U-32、U-35、U-36、U-37、U-44、U-48 及び U-49 から選択され；

R^5 が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている、実施形態 CC に記載の化合物。

【0202】

実施形態 F F。R³ が、F であり；

R⁴ が、U-9 及び U-44 から選択され；

Q が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されているフェニル環である、実施形態 E E に記載の化合物。

【0203】

実施形態 G G。R⁴ が、U-9 の基から選択される、実施形態 F F に記載の化合物。

【0204】

実施形態 H H。R⁴ が、U-44 の基から選択される、実施形態 F F に記載の化合物。

【0205】

実施形態 A A A。R¹ が、S R⁶ であり；

10

A が、C R³ であり；

R² が、H、ハロゲン、C N、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

R³ が、H、ハロゲン、C N、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

R⁴ が、5～6 員の複素環式環であり、各環が、炭素原子、並びに 2 個までの O 原子、2 個までの S 原子及び 4 個までの N 原子から独立して選択される 1～4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個までの環員が、C (=O)、C (=S)、S (=O) 及び S (=O)₂ から独立に選択され、各環又は環系が、R^v から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており、r が、置換基の数であり、各 R^v が、独立して、H、ハロゲン、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ ハロアルキル、C₁～C₆ アルコキシ又は C₁～C₆ ハロアルコキシであり；

20

r が、1、2、3、4 又は 5 であり；

R⁵ が、H、ハロゲン、C N、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₃～C₄ シクロアルキル、C₃～C₄ ハロシクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

R⁶ が、C₁～C₄ アルキルであり；

Q が、環上で 0～2 個の N を有する 6 員の芳香族環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

30

R^w が、独立して、シアノ、ハロゲン、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ アルコキシ、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ ハロアルキル、C₂～C₆ アルケニル、C₂～C₆ ハロアルケニル、C₂～C₆ アルキニル、C₂～C₆ ハロアルキニル、C₁～C₆ アルキルチオ、C₁～C₆ ハロアルキルチオ、C₁～C₆ アルキルスルフィニル、C₁～C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ アルキルスルホニル又は C₁～C₆ ハロアルキルスルホニルであり；

s が、1、2、3、4 又は 5 であり；

n が、0、1 又は 2 である、式 1 の化合物。

【0206】

40

実施形態 B B B。R² が、H、ハロゲン又は C₁～C₄ アルキルであり；

R³ が、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

R⁴ が、例示 1 において示すような U-2～U-49 又は U52～U61 から選択され；

r が、1 又は 2 であり；

R⁵ が、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ又は C₁～C₄ ハロアルコキシであり；

R⁶ が、Me であり；

R^w が、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ ハロアルキル、C₂～C₆ ハロアルケニル、C₂～C₆ ハロアルキニル、C₁～C₆ ハロアルキルチオ、C₁～C₆ ハロアルキル

50

スルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルであり、 s が、1 又は 2 である、実施形態 A A A に記載の化合物。

【0207】

実施形態 C C C。 R^2 が、H であり；

R^3 が、H 又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2 ~ U-49 から選択され；

R^v が、H であり；

r が、2 であり；

R^5 が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されており；

R^w が、 OCF_3 、 SCF_3 、 CF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である、実施形態 B B B に記載の化合物。

【0208】

実施形態 D D D。 R^2 が H であり；

R^3 が、H 又はハロゲンであり；

R^4 が、U-2 ~ U-49 から選択され；

R^v が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^5 が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている、実施形態 B B B に記載の化合物。

【0209】

実施形態 E E E。 R^3 が、ハロゲンであり；

R^4 が、U-2、U-3、U-4、U-5、U-7、U-9、U-11、U-12、U-13、U-16、U-21、U-25、U-26、U-27、U-28、U-29、U-31、U-32、U-35、U-36、U-37、U-44、U-48 及び U-49 から選択され；

R^5 が、H であり；

Q が、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル又はピラジニル環であり、各環が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されている、実施形態 C C C に記載の化合物。

【0210】

実施形態 F F F。 R^3 が、F であり；

R^4 が、U-9 及び U-44 から選択され；

Q が、炭素原子環員上で R^w から独立して選択される 5 個までの置換基で場合によっては置換されているフェニル環である、実施形態 E E E に記載の化合物。

【0211】

実施形態 G G G。 R^4 が、U-9 の基から選択される、実施形態 F F F に記載の化合物。

【0212】

実施形態 H H H。 R^4 が、U-44 の基から選択される、実施形態 F F F に記載の化合物。

【0213】

特定の実施形態は、

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-クロロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン；

3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-

10

20

30

40

50

- (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル) ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
]-5-(2-オキサゾリル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-クロロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-5-
 (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (2-オキサゾリル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]フェニル]
]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (5-オキサゾリル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-クロロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-ブロモ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン; 及び
 3-フルオロ-4-[メトキシ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
]-5-(1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)ピリジン
 からなる群から選択される式1の化合物を含む。

【0214】

より特定の実施形態は、

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン
 3-クロロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン
 3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
]-5-(2-オキサゾリル)ピリジン
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン
 3-ブロモ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン
 からなる群から選択される式1の化合物を含む。

【0215】

より特定の実施形態は、

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5
 - (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-クロロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-クロロ-4-[フルオロ[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5

- (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル) ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(2-オキサゾリル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-ブロモ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン

からなる群から選択される式1の化合物を含む。

【0216】

より特定の実施形態は、

3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-5-(
 (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 -(2-オキサゾリル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメチル)スルフィニル]フェニル]
]メチル]-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 -(5-オキサゾリル)ピリジン;
 3-フルオロ-4-[フルオロ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 -(3-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル)ピリジン;
 3-クロロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 (2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン; 及び
 3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]メチル]
 -5-(1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)ピリジン
 3-フルオロ-4-[メトキシ[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-
 -(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン

からなる群から選択される式1の化合物を含む。

【0217】

実施形態Y1。式1又は先行する実施形態のいずれか1項に記載の化合物、並びに界面活
 性剤、固体賦形剤及び液体賦形剤からなる群から選択される少なくとも1種のさらなる構
 成要素を含む組成物であって、少なくとも1種のさらなる生物活性化合物又は薬剤を場合
 によってはさらに含む、組成物。

【0218】

実施形態Y2。少なくとも1種のさらなる生物活性化合物又は薬剤が、アバメクチン、ア
 セフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロペン、アミ
 ドフルメト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホスメチル、ベンフ
 ラカルブ、ベンスルタップ、ピフェントリン、ピフェナゼート、ピストリフルロン、ボレ
 ート、プロマントラニリプロール、ブプロフェジン、カルバリル、カルボフラン、カルタ
 ップ、カルゾール、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン
 、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クロマフェノジド、クロフェンテジン、クロ
 チアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリン、シクロ
 キサプリド、シフルメトフェン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロジアミド
 、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シベルメトリン、アル
 ファーシベルメトリン、ゼーターシベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフ
 エンチウロン、ダイアジノン、ジクロラントラニリプロール、ジエルドリン、ジフルベン
 ズロン、ジメフルトリン、ジメヒポ、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エ
 マメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンプロ
 ックス、エトキサゾール、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノチオカル
 ブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フィプロニル、フロメ
 トキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフ

10

20

30

40

50

エノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルエンシルホン、フルオピラム、フルピラジフロ、フルバリネート、タウフルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホスチアゼート、ハロフェノジド、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ハイドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、殺虫性石鹼、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メベルフルトリン、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メチオカルブ、メソミル、メトプレ、メトキシクロール、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノクロトホス、モノフルオロトリン、ニコチン、N-[1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1,1-ジメチル-2-(メチルスルフィニル)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1,1-ジメチル-2-(メチルスルホニル)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-(1-メチルシクロプロピル)-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1-(ジフルオロメチル)シクロプロピル]-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオンメチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメト、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルギット、プロトリフェンブト、ピフルブミド、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフェン、スピネトラム、スピノサド、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、スルプロホス、スルホキサフロル、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テトラクロラントラニリプロール、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタプーナトリウム、チオキサザフェン、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルター内毒素、昆虫病原菌、昆虫病原性ウイルス及び昆虫病原性真菌からなる群から選択される、実施形態 Y1 に記載の組成物。

10

20

30

40

50

【0219】

実施形態 Y3。少なくとも1種のさらなる生物活性化合物又は薬剤が、アバメクチン、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロペン、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ビフェントリン、ブプロフェジン、カルバリル、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、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、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シペルメトリン、アルファーシペルメトリン、ゼータシペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジエルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エトキサゾール、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルエンシルホン、フルピプロール、フルピラジフロ、フルバリネート、ホルメタネート、ホスチアゼート、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ハイドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、ルフェヌロン、メベルフルトリン、メタフルミゾン、メチオカルブ、メソミル、メトプレ、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノフルオロトリン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピフルブミド、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリミノストロビン、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、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、スルホキサフロル、テブフェノジド、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、

チオジカルブ、チオスルタプーナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルター内毒素、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) の全ての菌株及び核多角体病ウィルスの全ての菌株からなる群から選択される、実施形態 Y 2 に記載の組成物。

【0220】

実施形態 Y 4。液体肥料をさらに含む、実施形態 Y 1～Y 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【0221】

実施形態 Y 5。液体肥料が、水性である、実施形態 Y 4 に記載の組成物。

【0222】

実施形態 Y 6。実施形態 Y 1～Y 3 のいずれか 1 項に記載の組成物を含む、土壌灌液配合物。

【0223】

実施形態 Y 7。実施形態 Y 1～Y 3 のいずれか 1 項に記載の組成物、及び噴射剤を含む、噴霧組成物。

【0224】

実施形態 Y 8。実施形態 Y 1～Y 3 のいずれか 1 項に記載の組成物、1 種若しくは複数の食材、場合によっては誘引物質、及び場合によっては保湿剤を含む、誘引組成物。

【0225】

実施形態 Y 9。無脊椎有害生物を防除するためのトラップ装置であって、実施形態 Y 8 に記載の誘引組成物、及び前記誘引組成物を受容するように適合されたハウジングを含み、ここで、ハウジングは、無脊椎有害生物がハウジングの外側の場所から前記誘引組成物にアクセスすることができるように、無脊椎有害生物が開口部を通過することを可能とするような大きさの少なくとも 1 つの開口部を有し、ハウジングは、無脊椎有害生物についての潜在的又は既知の活性の生息地中若しくは近くにおいて置かれるようにさらに適合されている、トラップ装置。

【0226】

実施形態 Y 10。微粉、粉末、顆粒、ペレット、小粒、芳香錠、錠剤、及び充填剤入りフィルムから選択される固体組成物である、実施形態 Y 1～Y 3 のいずれか 1 項に記載の組成物を含む組成物。

【0227】

実施形態 Y 11。水分散性又は水溶性である、実施形態 Y 10 に記載の組成物。

【0228】

実施形態 Y 12。点滴灌漑システム、植え付け中の間の畝間、手持ち型の噴霧器、背負い型の噴霧器、ブーム噴霧器、地上噴霧器、空中散布、無人空中輸送手段、又は種子処理において使用するための、実施形態 Y 1～Y 3 のいずれか 1 項に記載の組成物を含む、液体又は乾燥配合物。

【0229】

実施形態 Y 13。超低容量で噴霧される、実施形態 Y 12 に記載の液体又は乾燥配合物。

【0230】

本開示の化合物が有利な代謝パターン及び／又は土壌残留パターンで特徴づけられ、一連の農学的及び非農学的無脊椎有害生物を駆除する活性を示すことに注目すべきである。

【0231】

無脊椎有害生物駆除スペクトル及び経済的重要性の理由から、無脊椎有害生物を駆除することによって無脊椎有害生物により引き起こされる損害若しくは被害からの農作物の保護が本開示の実施形態であることに特に注目すべきである。本開示の化合物は、植物でのそれらの有利な転座特性又は組織性のために、式 1 の化合物又は本化合物を含む組成物と直接接触しない葉面部位又は他の植物部位をも保護する。

【0232】

10

20

30

40

50

本開示の実施形態としてさらに注目すべきは、先行する実施形態のいずれかの化合物、さらには本明細書で記述された各種その他の実施形態及びそれらの各種組み合わせのいずれか、並びに界面活性剤、固体希釈剤、及び液体希釈剤からなる群より選択される少なくとも1種の追加の成分を含む組成物であって、前記組成物が場合によってはさらに、少なくとも1種の追加の生物活性化合物又は薬剤を含む組成物である。

【0233】

本開示の実施形態としてさらに注目すべきは、以下のものである：前述の実施形態のいずれか、さらには本明細書に記載の他の実施形態いずれかの化合物及びそれらの各種組合せ、並びに界面活性剤、固体希釈剤、及び液状希釈剤からなる群より選択される少なくとも1種の追加成分を含む、無脊椎有害生物を防除するための組成物であって、前記組成物には、場合によっては、少なくとも1種の追加の生物活性化合物又は薬剤をさらに含んでいる。本開示の実施形態にはさらに、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的有効量の、先行する実施形態のいずれかに記載の（例えば、本明細書に記載された組成物としての）化合物と接触させること含む、無脊椎有害生物を防除するための方法も含まれる。

【0234】

本開示の実施形態にはさらに、土壌灌液液体配合物の形態にある、先行する実施形態のいずれかの化合物を含む組成物も含まれる。本開示の実施形態にはさらに、生物学的有効量の、先行する実施形態のいずれかの化合物を含む、土壌灌液としての液体組成物と接触させる、無脊椎有害生物を防除するための方法も含まれる。

【0235】

本開示の実施形態にはさらに、生物学的有効量の先行する実施形態のいずれかの化合物と、噴射剤とを含む、無脊椎有害生物を防除するための組成物を噴霧することも含まれる。本開示の実施形態にはさらに、生物学的有効量の、先行する実施形態のいずれかに記載の化合物、1種又は複数の餌物質、場合によっては誘引剤、そして場合によっては湿潤剤を含む、無脊椎有害生物を防除するための誘引組成物も含まれる。本開示の実施形態にはさらに、前記誘引組成物、及び前記誘引組成物を受容するように適応されたハウジングを含む、無脊椎有害生物を防除するためのデバイスも含まれるが、ここで、そのハウジングは、無脊椎有害生物が、ハウジングの外側位置から前記誘引組成物へアクセスできるようにした、前記無脊椎有害生物が通過できるような大きさの少なくとも一つの開口部を有し、そしてそのハウジングがさらに、前記無脊椎有害生物の可能性があるか又は公知の活動領域の内部又は近傍に設置されるように適応される。

【0236】

本開示の実施形態はまた、種子を、生物学的有効量の先行実施形態のいずれかの化合物と接触させる工程を含む、無脊椎有害生物からの種子の保護方法を含む。

【0237】

本開示の実施形態はまた、寄生虫駆除上有効量の先行実施形態のいずれかの化合物を動物に投与する工程を含む、無脊椎寄生性有害生物からの動物の保護方法を含む。

【0238】

本開示の実施形態にはさらに、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的有効量の式1の化合物、それらのN-オキシド又は塩（例えば、本明細書記載の組成物として）と接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法も含まれるが、但し、その方法は、治療によるヒト又は動物の身体の薬物療法とは異なる。

【0239】

本開示はさらに、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的有効量の式1の化合物、それらのN-オキシド又は塩、並びに界面活性剤、固体希釈剤、及び液状希釈剤からなる群より選択される少なくとも1種の追加成分を含む組成物と接触させるような方法にも関し、前記組成物には、場合によっては、生物学的有効量の少なくとも1種の追加の生物活性化合物又は薬剤も含むが、但しその方法は、治療によるヒト又は動物の身体の薬物療法とは異なる。

【0240】

スキーム 1～11 において記載するような下記の方法の 1 つ若しくは複数及びバリエーションを使用して、式 1 の化合物を調製することができる。下記の式 1～18 の化合物における R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、A 及び Q の定義は、他に断りのない限り、本開示の概要において上記に定義されている通りである。式 1a～1d の化合物は、式 1 の化合物の様々なサブセットであり、式 1a～1d についての全ての置換基は、他に示さない限り、式 1 について上記に定義されている通りである。周囲温度又は室温は、約 20～25 °C と定義される。

【0241】

スキーム 1 において示すように、式 1a の化合物（式 1 の化合物、式中、 R^4 は、炭素原子を介して分子の残部に付着している）は、式 2a の化合物（式中、X は、Cl、Br 又は I である）とボロン酸又は式 3 の有機スズ化合物とをパラジウム触媒の存在下で接触させることによって調製することができる。多種多様のパラジウム含有化合物及び錯体は、本方法のための触媒として有用である。スキーム 1 の方法における触媒として有用なパラジウム含有化合物及び錯体の例には、 $Pd(OAc)_2$ （酢酸パラジウム（II））、 $PdCl_2$ （塩化パラジウム（II））、 $PdCl_2(PPh_3)_2$ （ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）ジクロリド）、 $Pd(PPh_3)_4$ （テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0））、 $Pd(C_5H_7O_2)_2$ （アセチルアセトン酸パラジウム（II））及び $Pd_2(dba)_3$ （トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0））が含まれる。またスキーム 1 において示すように、式 1b の化合物（式 1 の化合物、式中、 R^4 は、窒素原子を介して分子の残部に付着している）は、式 2a の化合物（式中、X は、Cl、Br 又は I である）と式 4 の化合物（環員として NH を有する複素環式化合物、式中、H は、化学反応の間に別の官能基で置き換えることができる）とを銅触媒又はパラジウム触媒の存在下で接触させることによって調製することができる。このタイプの官能基変換についての最近のレビュー論文及び書籍について；例えば、F. Bellina et al., *Synthesis* 2004, 15, 2419–2440；P. Espinet and A. M. Echavarren, *Angewandte Chemie, International Edition* 2004, 43, 4704–4734；及び J. J. Li, G. W. Gribble, editors, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, 2000. K. W. Anderson et al., *Angewandte Chemie, International Edition* 2006, 45, 6523–6527 を参照されたい。

10

20

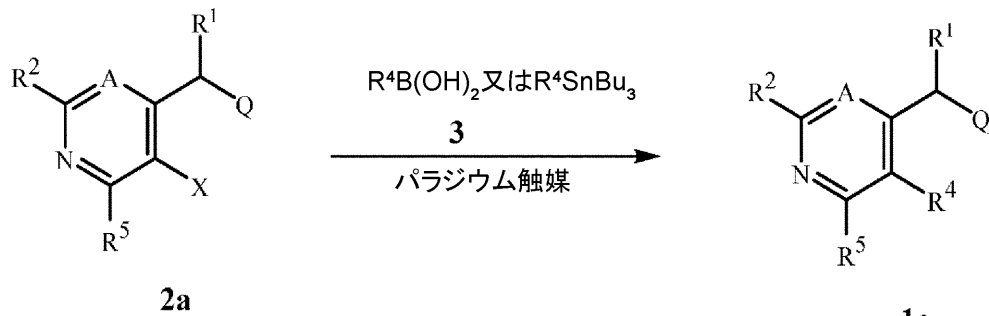
30

40

50

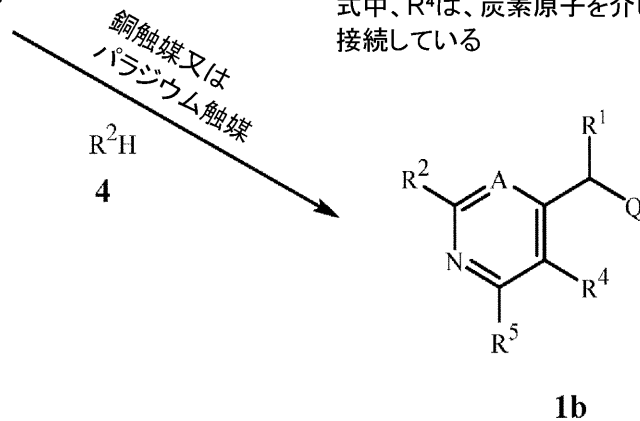
【化 1 1】

スキーム1



式中、XはCl、Br又はIである

式中、R⁴は、炭素原子を介して化合物の残部に接続している



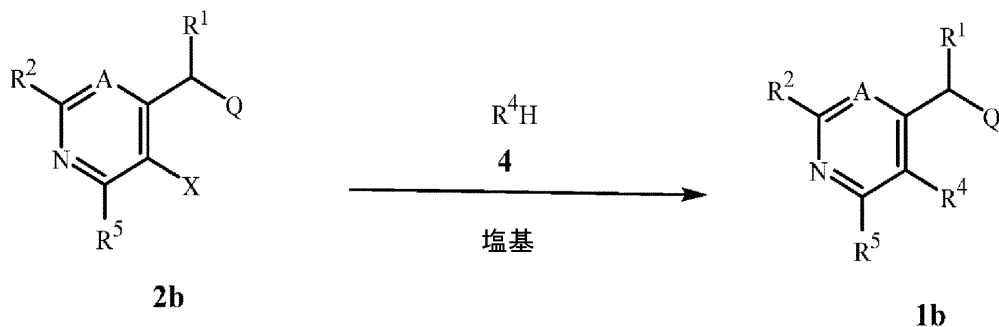
式中、R⁴は、窒素原子を介して化合物の残部に接続している

【0 2 4 2】

スキーム2において示すように、式1bの化合物はまた、式2bの化合物（式中、Xは、F又はClである）と式4の化合物とを塩基、例えば、K₂CO₃又はCs₂CO₃の存在下で接触させることによって調製することができる。多種多様の公知の一般手順は、当業者によってスキーム2の方法に容易に適応可能であると合理的に考えられ、例えば、J. D. Culshaw et al., Synlett 2012, 23, 1816-1820を参照されたい。スキーム2の方法は、合成実施例1、ステップCによって例示される。

【化 1 2】

スキーム2



式中、XはF又はClである

式中、R⁴は、窒素原子を介して化合物の残部に接続している

10

20

30

40

50

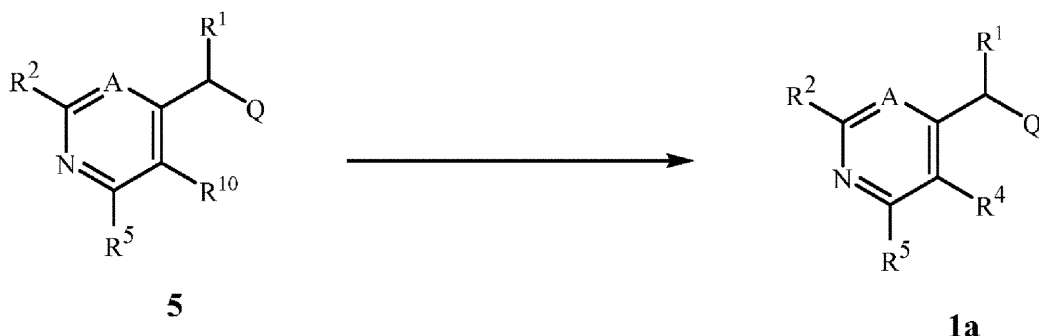
【0243】

代わりに、スキーム3において示すように、式1aの化合物は、式5の化合物（式中、 R^{10} は、CN、 $COCH_3$ 、又はCHOである）を介して複素環式環を構築することによって調製することができる。これらの官能基を介して複素環式環を形成させる方法は、文献において公知である。種々の公知の一般手順は、当業者によってスキーム3の方法に容易に適応可能であると合理的に考えられ、例えば、国際公開第2012/002577号パンフレット；国際公開第2012/087938号パンフレット；M. H. Gezginci et al. ; J. Med. Chem. 2001, 44, 1560-1563 ; K. Gobbi s, J. Heterocyclic Chem. 2009, 46, 1271-1279を参照されたい。スキーム3の方法は、合成実施例2、ステップDによって例示される。

10

【化13】

スキーム3



20

式中、 R^{10} は、CN、 $COCH_3$ 、CHO
又は同様に進展して望ましい
複素環を形成し得る任意の他の
基である

式中、 R^4 は、炭素原子を介して
化合物の残部に接続している

【0244】

スキーム4において示すように、式5の化合物は、官能基変換反応を介して式6の化合物におけるX基を式5の化合物における R^{10} 基へと変換することによって調製することができる。種々の一般手順は、文献において周知である、例えば、M. Hatsuda, M. Seki, Tetrahedron, 2005, 61, 9908-9917 ; D. Xu et al. , Tetrahedron Letters, 2008, 6104-6107 ; A. Brennfuehrer, et al. , Tetrahedron, 2007, 63, 6252-6258を参照されたい。スキーム4の方法は、合成実施例2、ステップCによって例示される。

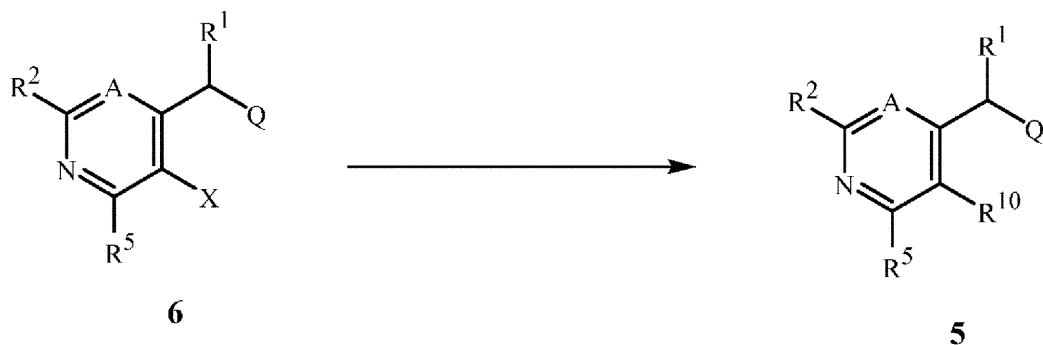
30

40

50

【化 1 4】

スキーム4



式中、XはBr又はIである

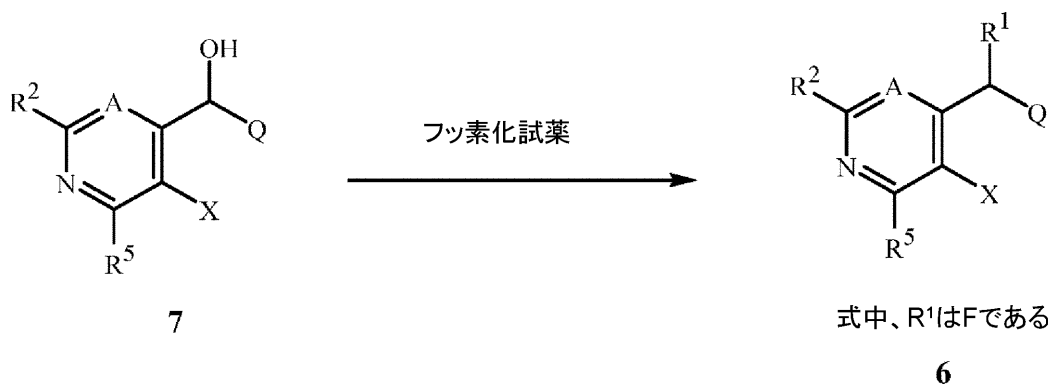
式中、R¹⁰は、CN、COCH₃、CHO
又は同様に進展して望ましい
複素環を形成し得る任意の
他の基である

【0 2 4 5】

スキーム5において示すように、式6の化合物は、式7の対応するアルコールとフッ素化試薬、例えば、三フッ化（ジエチルアミノ）硫黄（DAST）又はビス（2-メトキシエチル）アミノサルファートリフルオリド（Deoxo-Fluor）とをハロアルカン溶媒、例えば、ジクロロメタン又はクロロホルム中で−78℃～室温にて接触させることによって調製することができる。一般手順は当技術分野において公知であり、例えば、Lal, G. S. et al. J. Org. Chem. 1999, 64, 7048を参照されたい。スキーム5の方法は、合成実施例1、ステップBによって例示される。

【化 1 5】

スキーム5



式中、R¹はFである

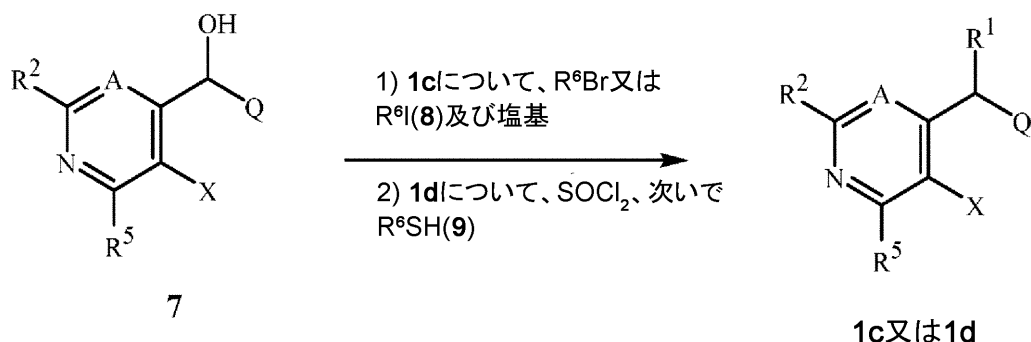
【0 2 4 6】

スキーム6において示すように、式1cの化合物（式中、R¹は、OR⁶である）は、式7の対応するアルコールとR⁶Br又はR⁶Iの式8の化合物とを塩基の存在下で反応させることによって調製することができる。式1dの化合物（式中、R¹は、SR⁶である）は、SOCl₂を使用して式7の対応するアルコールをそれらの対応するクロリド化合物へと変換し、それに続いてクロリド化合物とR⁶SHの式9のチオール化合物とを反応させることによって調製することができる。この方法は、文献において周知であり、例

例えば、Qingzhong Hu et al. J. Med. Chem. 2010, 53, 5749; 国際公開第2009/034976号パンフレットを参照されたい。スキーム6の方法は、合成実施例2、ステップBによって例示される。

【化16】

スキーム6



1c(式中、 R^1 は OR^6 である)

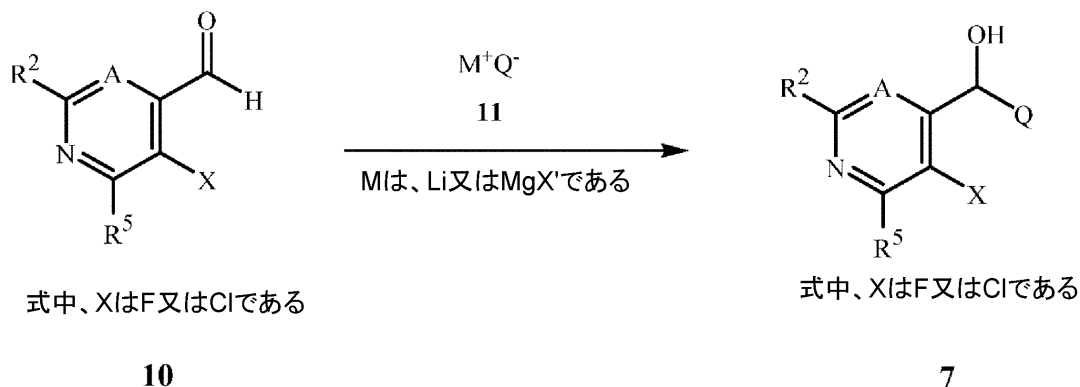
1d(式中、 R^1 は SR^6 である)

【0247】

スキーム7において示すように、式7の化合物は、式10のアルデヒドによる式11の化合物の求核付加から容易に利用可能である。式11の求核試薬は、様々な化学的アプローチによって生じさせることができる。例えば、典型的には、約 $-100^{\circ}C$ ～約 $-20^{\circ}C$ の温度での、*n*-ブチルリチウム又は*i*-プロピルマグネシウムブロミドとのハロ芳香族化合物 QX' （式中、 X' は、 Br 又は I であることが好ましい）の金属-ハロゲン交換反応は、式11の求核試薬を*in situ*で生じさせることができる。金属ハロゲン交換、それに続く求電子試薬との反応を行うための多種多様の一般手順は、当技術分野において公知であり、本方法のために容易に適合させることができる。関連する一般手順について、例えば、M. Schlosser, Angew. Chem. Int. Ed. 2004, 43, 2及びP. Knochel et al., Synthesis, 2002, 565を参照されたい。さらに、式11の求核試薬は、マグネシウムとの対応するブロミド又はヨードである QBr 又は QI のグリニャール反応を介して調製することができる。式11の求核試薬のいくつかは、市販であり、例えば、4-tert-ブチルフェニルマグネシウムブロミド又は4-(トリフルオロメトキシ)フェニルマグネシウムブロミドである。式10のアルデヒドの大部分は市販であるか、又は化学文献において公知の化合物である。

【化 1 7】

スキーム7



10

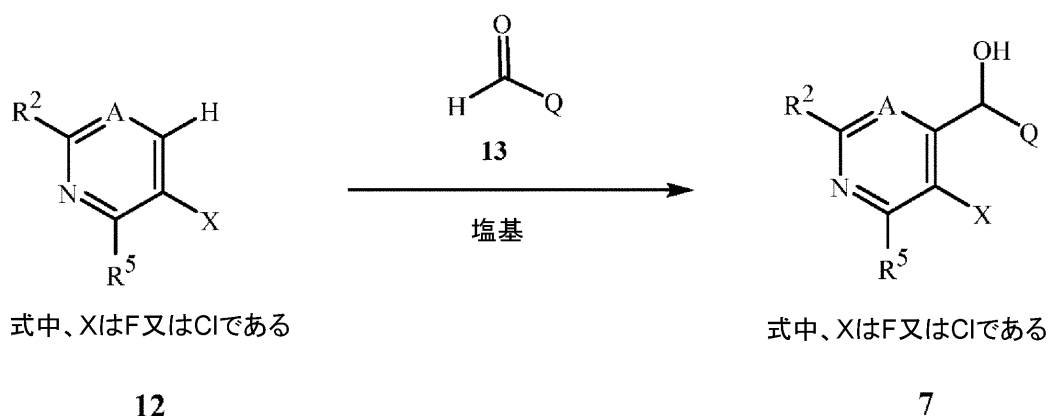
【0248】

スキーム8において示すように、式12の化合物（式中、Xは、F又はClである）を塩基、例えば、リチウムジイソプロピルアミド、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジニルマグネシウムクロリドリチウムクロリド錯体などでエーテル溶媒、例えば、THF、ジエチルエーテル又はジオキサン中で -100°C ～ -10°C の温度にて処理することによって、望ましいアニオンを*in situ*で生じさせる。上記のアニオンを式13のアルデヒドでクエンチすることによって、式7の化合物を調製することができる。この方法は文献において周知であり、例えば、R. J. Mattson, et al. J. Org. Chem., 1990, 55, 3410を参照されたい。スキーム8の方法は、合成実施例1及び2、ステップAによって例示される。

20

【化 1 8】

スキーム8



30

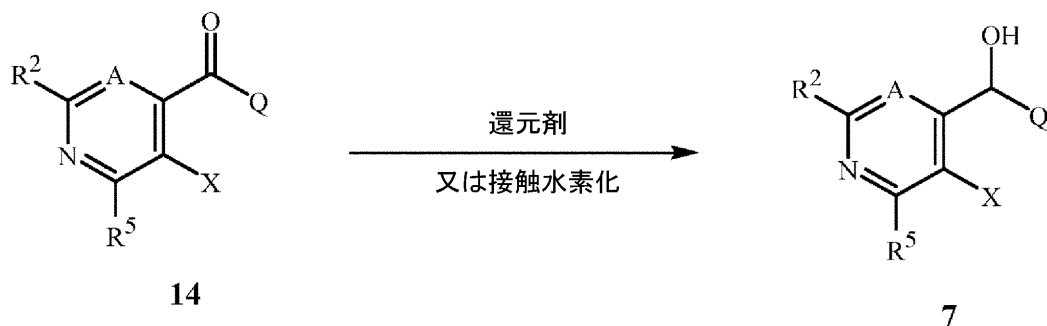
【0249】

スキーム9において示すように、式7の化合物はまた、式14の対応するカルボニル化合物の還元によって調製することができる。式14の化合物を溶媒、例えば、メタノール、エタノール又はエーテル（例えば、テトラヒドロフラン）中で種々の還元剤、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、ボラン-ジメチルスルフィドで処理することによって、式7の化合物を調製することができる。代わりに、式14のカルボニル化合物の還元は、接触水素化によって達成することができる。これらの転換のいくつかの一般手順は当技術分野において公知である；例えば、D. Douglas, et al., J. Med. Chem 2009, 52, 4694；M. Moriyasu, et al., Synlett 1997, 3, 273を参照されたい。

50

【化 19】

スキーム9



10

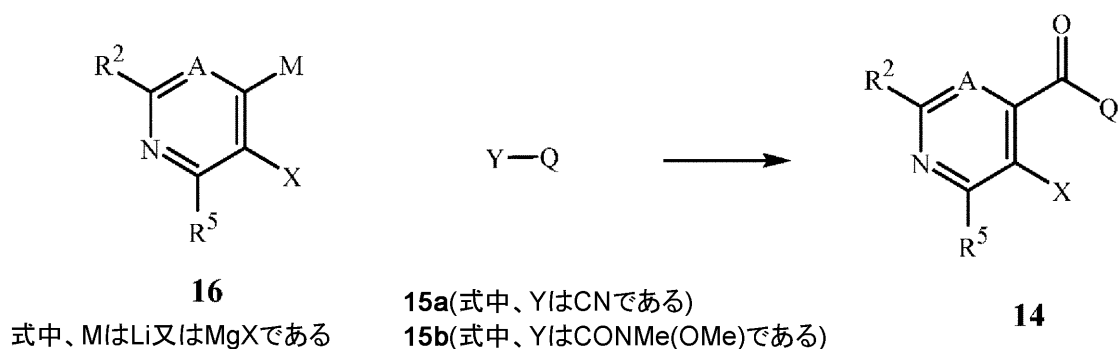
【0250】

スキーム10において示すように、式14の化合物は、式15aのCN置換された芳香族化合物（式中、Yは、CNである）又は式15bのワインレブアミド（式中、Yは、CONMeOMeである）から調製することができる。式15a又は15bの化合物との式16の化合物の反応によって、式14のカルボニル化合物を提供することができる。式16の化合物は、同様の化学反応を使用して調製することができ、これによって、スキーム8において記載したように対応するアニオンを*in situ*で生じさせる。関連する参考文献について、例えば、米国特許出願公開第2008/280891号明細書及びBela. et al. European J. Org. Chem. 2004 17, 3623-3632を参照されたい。式17及び15の化合物の多くは市販であるか、又は文献の合成法から容易に利用可能である。

20

【化20】

スキーム10



30

【0251】

代わりに、スキーム11において示すように、式14の化合物はまた、4-ハロピリジン又は式17のピリジン化合物（式中、Zは、Br又はIであり、Xは、Br又はI以外である）から調製することができる。式17の化合物、一酸化炭素及び式18のボロン酸のパラジウム触媒クロスカップリング反応は、式14の化合物を調製する代替方法を提供することができる。4-ハロピリジン又は式17のピリジン化合物及び式18のボロン酸の混合物を、パラジウム触媒（例えば、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）ジクロリド、又はテトラキス（トリフェニルホスフィン）-パラジウム（0））の存在下で、約80～150℃の温度にてエーテル溶媒（例えば、テトラヒドロフラン又はジオキサン）中、1～50バールの加圧された一酸化炭素雰囲気下で、塩基（例えば、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム又は炭酸セシウム）で処理することは、式14の望ましいカルボニル化合物を生じさせる。詳細な実験手順は、Couve-Bonnair et al., Tetrahedron Lett. 2001, 42, 3689-3691に

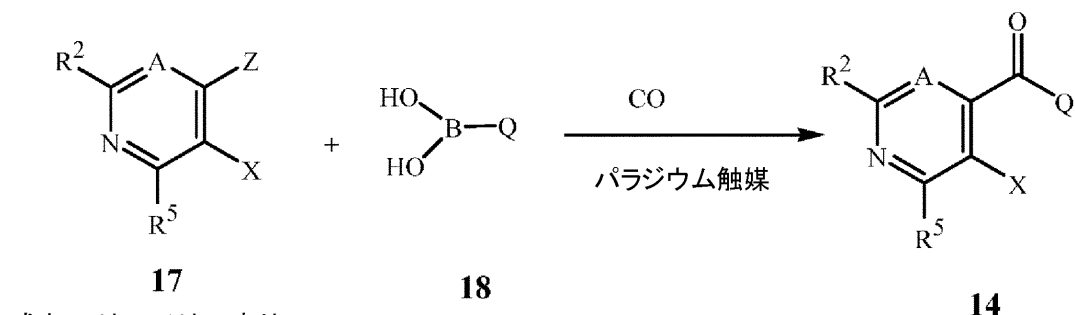
40

50

において提示されている。式 17 の化合物及び式 18 のボロン酸の大部分は市販であるか、又は化学文献から容易に利用可能である。

【化 2 1】

スキーム 11



式中、ZはBr又はIであり;
XはBr又はI以外である

10

【0252】

式 1 の化合物を製造するための上で記載されたいくつかの試薬及び反応条件は、中間体中に存在するある種の官能基と相性がよくない場合があることが認められる。これらの場合には、保護／脱保護シーケンスの組み込み又は合成への官能基相互変換が、所望の生成物を得るのに役立つであろう。保護基の使用及び選択は、化学合成の熟練者に明らかであろう（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991を参照されたい）。場合によって、任意の個々のスキームにおいて示すように所与の試薬の導入の後、式 1 の化合物の合成を完了するために詳細に記載していないさらなる通例の合成ステップを行うことが必要であり得ることを当業者は認識する。当業者はまた、上のスキームに例示されるステップの組み合わせを、式 1 の化合物を製造するために提示された特定のシーケンスで暗示されるもの以外の順番で行うことが必要であり得ることを認めるであろう。

20

【0253】

当業者はまた、本明細書に記載される式 1 の化合物及び中間体が、置換基を追加するために又は存在する置換基を変更するために様々な親電子的な、求核的な、ラジカルの、有機金属の、酸化、及び還元反応にかけられ得ることを認めるであろう。

30

【0254】

さらなる入念な検討なしに、先行記載を用いる当業者は、最大程度に本開示を利用することができると考えられる。以下の合成実施例は、それ故、単に例示的なものであり、何であれ決して本開示を限定するものではないと解釈されるべきである。以下の合成実施例におけるステップは、全合成変換における各ステップの手順を例示し、各ステップ用の出発原料は、その手順が他の実施例又はステップに記載されている特定の製造実験によって必ずしも製造されたわけではない場合がある。周囲温度又は室温は、約 20～25℃と定義される。百分率は、クロマトグラフ溶媒混合物又は特に明記される場合を除いて重量による。クロマトグラフ溶媒混合物についての部及び百分率は、特に明記しない限り容積による。MPLCは、シリカゲル上の中圧液体クロマトグラフィーを指す。¹H NMRスペクトルは、テトラメチルシランからの ppm 低磁場で報告し、「s」は、一重線を意味し、「d」は、二重線を意味し、「dd」は、二重線の二重線を意味し、「ddd」は、二重線の二重線の二重線を意味し、「t」は、三重線を意味し、「m」は、多重項を意味し、「b r s」は、幅広い一重線を意味する。質量スペクトルデータについて、報告された数値は、大気圧化学イオン化 (AP⁺) を使用した質量分析法によって観察される M + 1 ピークを与える、分子への H⁺ (1 の分子量) の添加によって形成される親分子イオン (M) の分子量である

40

50

【0255】

スキーム1～11は、種々の置換基を有する式1の化合物を調製する方法を例示する。スキーム1～11について特に留意されるもの以外の置換基を有する式1の化合物は、スキーム1～11のために記載されたものと類似の方法を含めた有機合成化学の当技術分野において公知の一般方法によって調製することができる。

【実施例】

【0256】

合成実施例1

3-フルオロ-4-[フルオロ-[4-(トリフルオロメチルスルフィニル)フェニル]メチル]-5-(トリアゾール-2-イル)ピリジン(化合物67)の調製

ステップA: (3, 5-ジフルオロ-4-ピリジル)-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メタノールの調製

撹拌した3, 5-ジフルオロ-ピリジン(1.20g、10.4mmol)のTHF(20mL)溶液に、新たに調製したリチウムジイソプロピルアミド溶液(10mLのTHF及びn-ヘキサン中11.4mmol)をゆっくりと-20℃にて加えた。-20～-10℃にて1時間撹拌した後、反応混合物を4-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズアルデヒド(2.15g、10.4mmol)のTHF(10mL)溶液に-20℃にて加えた。-20～-10℃にてさらに1時間撹拌した後、反応混合物を飽和NH₄Cl水溶液でクエンチし、次いで、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を水及び飽和NaCl水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン/酢酸エチルを使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題生成物を淡白色の固体(1.36g、4.2mmol)として得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 8.34 (s, 2H), 7.66 (d, 2H), 7.48 (d, 2H), 6.29 (s, 1H)。

【0257】

ステップB: 3, 5-ジフルオロ-4-[フルオロ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]ピリジンの調製

撹拌した(3, 5-ジフルオロ-4-ピリジル)-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メタノール(すなわち、ステップAの生成物)(650mg、2.02mmol)のジクロロメタン(25mL)溶液に、ビス(2-メトキシエチル)アミノサルファートリフルオリド(0.55mL、2.96mmol)を-78℃にて加えた。2時間撹拌した後、反応混合物を飽和NaHCO₃水溶液でゆっくりと希釈し、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機相を水及び飽和NaCl水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン/酢酸エチル(80:20～40:60)を使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物、本開示の化合物を淡黄色の油(490mg、1.52mmol)として得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 8.41 (d, 2H), 7.70 (d, 2H), 7.49 (d, 2H), 6.88 (d, 1H)。

【0258】

ステップC: 3-フルオロ-4-[フルオロ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]-5-(トリアゾール-2-イル)ピリジンの調製

DMF(4mL)中の3, 5-ジフルオロ-4-[フルオロ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]ピリジン(すなわち、ステップBの生成物)(300mg、0.93mmol)、1, 2, 3-トリアゾール(64mg、0.93mmol)及びK₂CO₃(205mg、1.49mmol)の混合物を、100℃にて2時間撹拌した。次いで、反応混合物を室温に冷却し、水及び酢酸エチルに分配した。有機相を水及び飽和NaCl水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン/酢酸エチルを使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題生成物を白色の固体(80mg、0.22mmol)として得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.96 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.68 (d, 2H), 7.60 (d, 2H), 7.24 (d, 1H).

【0259】

ステップD：3-フルオロ-4-[フルオロ-[4-(トリフルオロメチルスルフィニル)フェニル]メチル]-5-(トリアゾール-2-イル)ピリジンの調製

攪拌した3-フルオロ-4-[フルオロ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]-5-(トリアゾール-2-イル)ピリジン（すなわち、ステップCの生成物）（100mg、0.27mmol）のジクロロメタン（3mL）溶液に、3-クロロ過安息香酸（91mg、77%未満の純度）を0℃にて加えた。反応混合物を室温へとゆっくりと温め、3時間攪拌した。次いで、反応混合物をNaHSO₃の水溶液でクエンチし、水及びジクロロメタンに分配した。有機相を水及び飽和NaCl水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン／酢酸エチルを使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題生成物を無色の粘着性の油（30mg、0.08mmol）として得た。

10

^1H NMR (CDCl_3) δ 9.00 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.98 (s, 2H), 7.83 (s, 4H), 7.30 (d, 1H).

【0260】

合成実施例2

3-[5-フルオロ-4-[メトキシ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]-3-ピリジル]-1,2,4-オキサジアゾール（化合物83）の調製
ステップA：（3-ブロモ-5-フルオロ-4-ピリジル）-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メタノールの調製

20

攪拌した3-ブロモ-5-フルオロ-ピリジン（4.40g、25mmol）のTHF（20mL）溶液に、新たに調製したリチウムジイソプロピルアミド溶液（20mLのTHF及びn-ヘキサン中26mmol）をゆっくりと-20℃にて加えた。-20～-10℃にて1時間攪拌した後、反応混合物を4-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズアルデヒド（4.85g、23.5mmol）のTHF（10mL）溶液に-20℃にて加えた。-20～-10℃にてさらに1時間攪拌した後、反応混合物を飽和NH₄Cl水溶液でクエンチし、次いで、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を水及び飽和NaCl水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン／酢酸エチルを使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題生成物を淡黄色の油（6.95g、18.2mmol）として得た。

30

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.56 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.65 (d, 2H), 7.47 (d, 2H), 6.39 (d, 1H), 3.66 (d, 1H).

【0261】

ステップB：3-ブロモ-5-フルオロ-4-[メトキシ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]ピリジンの調製

攪拌した（3-ブロモ-5-フルオロ-4-ピリジル）-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メタノール（すなわち、ステップAの生成物）（1.26g、3.30mmol）の乾燥THF（10mL）溶液に、水素化ナトリウム（165mg、4.12mmol、鉱油中60%）を0℃にて加えた。このように得られた混合物を、室温にて1時間攪拌し、次いで、ヨウ化メチル（0.24mL、3.96mmol）で処理した。室温にてさらに1.5時間攪拌した後、反応混合物を水で処理し、酢酸エチル／ヘキサン（1：1）で抽出した。合わせた有機相を水及び飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン／酢酸エチル（90：10～60：40）を使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物を淡黄色の油（1.10g、2.80mmol）として得た。

40

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.60 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.6

50

3 (d, 2H), 7.52 (d, 2H), 5.95 (s, 1H), 3.47 (s, 3H).

【0262】

ステップC: 5-フルオロ-4-[メトキシ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボニトリルの調製

バイアルにおけるN, N-ジメチルホルアミド (5 mL) 中の3-ブロモ-5-フルオロ-4-[メトキシ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]-メチル]ピリジン (すなわち、ステップBの生成物) (1.0 g, 2.52 mmol)、Zn(CN)₂ (325 mg, 2.76 mmol)、Pd(PPh₃)₄ (291 mg, 0.25 mmol)の混合物を、窒素雰囲気下にてマイクロ波下で150℃にて10分間反応に供した。次いで、反応混合物を水及び酢酸エチルに分配した。有機層を水及び飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン/酢酸エチル (90:10~60:40) を使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物を黄色の油 (0.80 g, 2.42 mmol) として得た。

10

¹H NMR (CDCl₃) δ 8.72 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 7.67 (d, 2H), 7.59 (d, 2H), 5.79 (s, 1H), 3.50 (s, 3H).

【0263】

ステップD: 3-[5-フルオロ-4-[メトキシ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]-3-ピリジル]-1, 2, 4-オキサジアゾールの調製

20

EtOH (5 mL) 中の5-フルオロ-4-[メトキシ-[4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボニトリル (すなわち、ステップCの生成物) (0.27 g, 0.82 mmol)、ヒドロキシルアミン (0.25 mL, 3.78 mmol, H₂O中50%)の混合物を、室温にて48時間攪拌した。次いで、反応混合物を減圧下で濃縮した。残渣に、オルトギ酸トリメチル (0.5 mL) 及び一滴の濃塩酸を加えた。次いで、混合物を80℃にて1時間攪拌した。反応混合物を室温に冷却し、次いで、水及び酢酸エチルに分配した。有機層を水及び飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。残渣を溶離液としてヘキサン/酢酸エチル (90:10~60:40) を使用したシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物を淡黄色の油 (0.17 g, 0.46 mmol) として得た。

30

¹H NMR (CDCl₃) δ 8.96 (s, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 7.62 (d, 2H), 7.57 (d, 2H), 6.29 (s, 1H), 3.39 (s, 3H).

【0264】

合成実施例3

3-フルオロ-4-[(R)-メトキシ-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-5-(トリアゾール-2-イル)ピリジン (化合物125) の調製

ステップA: (3, 5-ジフルオロ-4-ピリジル)-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メタノールの調製

40

化合物3, 5-ジフルオロ-ピリジン (40 g, 0.347 mol, 1.0当量) のTHF (400 mL) 溶液に、THF中の2MのLDA (191.3 mL, 0.381 mol, 1.1当量) を-78℃にてN₂雰囲気下でゆっくりと加えた。次いで、反応混合物を30分間攪拌し、次いで、化合物4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド (72.4 g, 0.381 mol, 1.1当量) を-78℃にて加え、-78℃にて2時間攪拌した。反応をTLCによってモニターし、反応混合物を飽和NH₄Cl水溶液でクエンチし、EtOAc (3×500 mL) で抽出し、次いで、無水Na₂SO₄上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた粗製物を、40%酢酸エチル/石油エーテルで溶出する100-200シリカゲルを使用したカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題生成物

50

をオフホワイト色の半固体（70 g、66%収率）として得た。

^1H NMR (d6-DMSO) δ 8.49 (s, 2H), 7.51 (d, 2H), 7.35 (d, 2H), 6.59 (d, 1H), 6.16 (d, 1H).

【0265】

ステップB: (3, 5-ジフルオロ-4-ピリジル) - [4-(トリフルオロメトキシ)フェニル] メタノールの調製

化合物(3, 5-ジフルオロ-4-ピリジル) - [4-(トリフルオロメトキシ)フェニル] メタノール（すなわち、ステップAの生成物）（70.0 g、0.229 mol、1.0当量）のジクロロメタン（700 mL）溶液を、活性化 MnO_2 （199 g、2.29 mol、10当量）に室温にて N_2 雰囲気下に加え、次いで、16時間攪拌した。反応をTLCによってモニターし、反応混合物をceliteのベッドを通して濾過し、ジクロロメタン（200 mL）で洗浄した。溶媒を減圧下で濃縮し、粗固体を得た。得られた粗製物を、30%酢酸エチル／石油エーテルで溶出する100-200シリカゲルを使用したカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物をオフホワイト色の固体（65 g、93%収率）として得た。

10

^1H NMR (d6-DMSO) δ 8.80 (s, 2H), 8.07 (d, 2H), 7.60 (d, 2H).

【0266】

ステップC: [3-フルオロ-5-(トリアゾール-2-イル)-4-ピリジル] - [4-(トリフルオロメトキシ)フェニル] メタノールの調製

20

化合物(3, 5-ジフルオロ-4-ピリジル) - [4-(トリフルオロメトキシ)フェニル] メタノン（すなわち、ステップBの生成物）（65 g、0.214 mol、1.0当量）のDMF（650 mL）溶液に、 K_2CO_3 （29.6 g、0.214 mol、1.0当量）及び1, 2, 3-トリアゾール（14.8 g、0.214 mol、1.0当量）を N_2 雰囲気下で室温にて加えた。次いで、反応混合物を48時間攪拌した。反応をTLCによってモニターした。反応混合物を氷冷水（1000 mL）中に注ぎ、EtOAc（3×300 mL）で抽出した。次いで、有機層をブライン（2×200 mL）及び氷冷水（200 mL）で洗浄し、次いで、無水 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた粗製物を、100-200シリカゲルを使用したカラムクロマトグラフィーによって精製し、溶出し、表題生成物をオフホワイト色の固体（19 g、25%収率）として得た。

30

^1H NMR (d6-DMSO) δ 9.29 (s, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.11 (s, 2H), 8.00 (d, 2H), 7.51 (d, 2H).

【0267】

ステップD: (R) - [3-フルオロ-5-(トリアゾール-2-イル)-4-ピリジル] - [4-(トリフルオロメトキシ)フェニル] メタノールの調製

(S) - (-) - a, a-ジフェニル-2-ピロリジンメタノール（2.73 g、0.011 mol、0.2当量）のTHF（190 mL）溶液に、 $\text{B}(\text{OMe})_3$ （12.4 g、0.012 mmol、0.22当量）を室温にて加え、次いで、室温にて N_2 雰囲気下で1時間攪拌した。次いで、ボランジメチルスルフィド（6.16 g、0.081 mol、1.5当量）を0℃にてゆっくりと加え、そうしている間に浮動及び発熱が観察された。次いで、化合物[3-フルオロ-5-(トリアゾール-2-イル)-4-ピリジル] - [4-(トリフルオロメトキシ)フェニル] メタノン（すなわち、ステップCの生成物）（19 g、0.054 mol、1.0当量）（30 mLのTHFに溶解）を0~5℃にて加え、次いで、室温にし、3時間攪拌した。反応をTLCによってモニターした。反応の完了の後、これを0℃に冷却し、次いで、反応混合物を2NのHCl（80 mL）でゆっくりと滴下でクエンチし、そうしている間に活発なガス発生及び発熱が観察され、次いで、酢酸エチル（3×200 mL）で抽出し、有機層を無水 Na_2SO_4 上で乾燥させ、濃縮し、粗製物を得た。得られた粗製物を、30%酢酸エチル／石油エーテルで溶出する100-200シリカゲルを使用したカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題生成

40

50

物を無色の液体（8.2 g、43%収率）として得た。Chiralpak IF（4.6 * 250 mm）5uカラムによるキラルHPLC分析は、生成物がR配置として95% eeを有したことを示した。文献に従ってR絶対配置を割り当てるが、Moriyasu Masui & Takayuki Shioiri, Synlett, 1997, 273-274を参照されたい。

【0268】

ステップE：3-フルオロ-4-[(R)-メトキシ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル-5-(トリアゾール-2-イル)ピリジンの調製

(R)-[3-フルオロ-5-(トリアゾール-2-イル)-4-ピリジル]-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メタノール化合物（8.2 g、0.023 mol、1.0当量）のTHF溶液に、NaH（1.0 g、0.046 mol、2.0当量）を0℃にて少しずつ加え、そうしている間に浮動を観察し、次いで、0℃にて5分間攪拌し、次いで、MeI（4.93 g、0.034 mol、1.5当量）を0℃にて加えた。次いで、室温にて2時間攪拌した。反応をTLCによってモニターした。反応混合物を氷冷水（50 ml）中に注ぎ、酢酸エチル（2 * 100 ml）で抽出した。次いで、有機層を無水Na₂SO₄上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた粗固体を、20%酢酸エチル/石油エーテルで溶出する100-200シリカゲルを使用したカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題生成物を無色の液体（6.0 g、70.5%収率）として得た。キラルHPLC分析は、生成物が93% ee、 $[\alpha]^{25} = -175.6^\circ$ （MeOH、0.4%）を有したことを示した。

¹H NMR（d6-DMSO） δ 8.81（s, 1H）, 8.78（s, 1H）, 8.32（s, 2H）, 7.51（d, 2H）, 7.37（d, 2H）, 5.66（s, 1H）, 3.21（s, 3H）。

【0269】

当技術分野において公知の方法と一緒に本明細書に記載されている手順によって、表1～42Nの下記の化合物を調製することができる。下記略語は、下記の表において使用される。tは、第三級を意味し、sは、第二級を意味し、nは、ノルマルを意味し、iは、イソを意味し、cは、シクロを意味し、Meは、メチルを意味し、Etは、エチルを意味し、Prは、プロピルを意味し、i-Prは、イソプロピルを意味し、Buは、ブチルを意味し、Phは、フェニルを意味し、OMeは、メトキシを意味し、OEtは、エトキシを意味し、SMeは、メチルチオを意味し、SEtは、エチルチオを意味し、-CNは、シアノを意味し、Phは、フェニルを意味し、Pyは、ピリジニルを意味し、-NO₂は、ニトロを意味し、TMSは、トリメチルシリルを意味し、S(O)Meは、メチルスルフィニルを意味し、S(O)₂Meは、メチルスルホニルを意味する。

【0270】

下記で示すフラグメントQ-1～Q-19は、表1A～98Iにおいて言及される。フラグメントQ-1～Q-19の構造は、例示3において例示する。波線は、分子の残部へのフラグメントの付着点を示す。

10

20

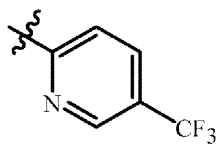
30

40

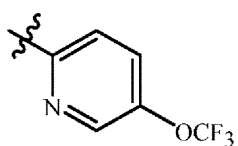
50

【化 2 2】

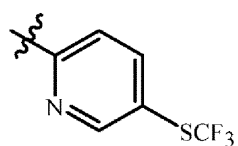
例示 3



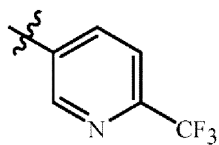
Q-1



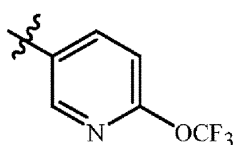
Q-2



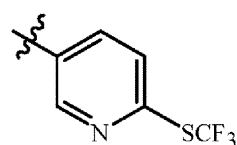
Q-3



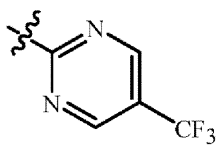
Q-4



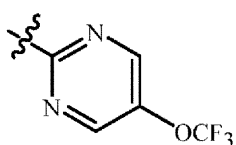
Q-5



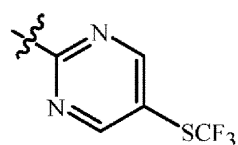
Q-6



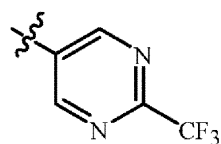
Q-7



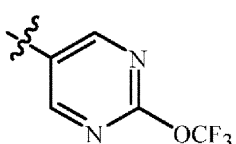
Q-8



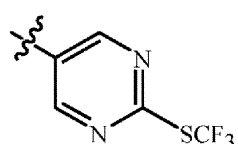
Q-9



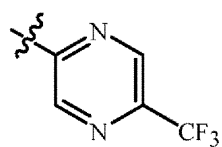
Q-10



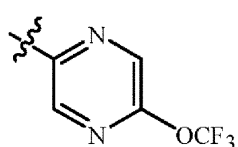
Q-11



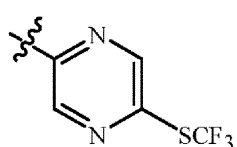
Q-12



Q-13



Q-14



Q-15

10

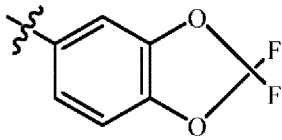
20

30

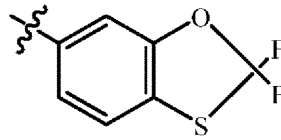
40

50

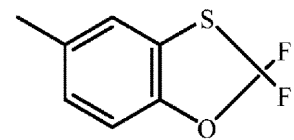
【化 2 3】



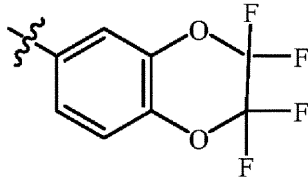
Q-16



Q-17



Q-18



Q-19

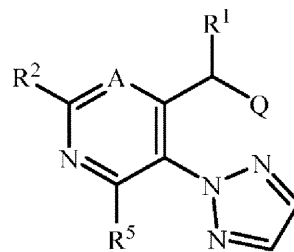
10

【 0 2 7 1】

表 1 A ~ 4 2 A は、下記に示す構造に関する。

【化 2 4】

20



【 0 2 7 2】

30

40

50

【表 1】

表 1A

R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H である。

Q	Q	Q
4-クロロフェニル	3-(CF ₃)フェニル	3-Cl, 4-(CF ₃)フェニル
4-ブロモフェニル	3-(OCF ₃)フェニル	3-Br, 4-(CF ₃)フェニル
4-ヨードフェニル	3-(<i>s</i> -Bu)フェニル	3-Me, 4-(CF ₃)フェニル
4-ニトロフェニル	3-(<i>t</i> -Bu)フェニル	2,6-ジ F, 4-(CF ₃)フェニル
4-シアノフェニル	3-(CMe ₂ CH ₂ CH ₃)フェニル	2,6-ジ Cl, 4-(CF ₃)フェニル
4-(CF ₃)フェニル	3-(S- <i>i</i> -Pr)フェニル	2-F, 4-(OCF ₃)フェニル
4-(OCF ₃)フェニル	3-(SCH ₂ CF ₃)フェニル	2-Cl, 4-(OCF ₃)フェニル
4-(<i>s</i> -Bu)フェニル	3-(CF(CF ₃) ₂)フェニル	2-Me, 4-(OCF ₃)フェニル
4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	2-F, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	3-F, 4-(OCF ₃)フェニル
4-(CMe ₂ CH ₂ CH ₃)フェニル	2-Cl, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	3-Cl, 4-(OCF ₃)フェニル
4-(S- <i>i</i> -Pr)フェニル	2-Me, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	3-Br, 4-(OCF ₃)フェニル
4-(SCH ₂ CF ₃)フェニル	3-F, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	3-Me, 4-(OCF ₃)フェニル
4-(SCHF ₂)フェニル	3-Cl, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	2,6-ジ F, 4-(OCF ₃)フェニル

10

20

【0273】

30

40

50

【表 2】

Q	Q	Q	
4-(S(O)CHF ₂)フェニル	3-Br, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	2,6-ジ Cl, 4-(OCF ₃)フェニル	
4-(SO ₂ CHF ₂)フェニル	3-Me, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	2-F, 4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	
4-(CF(CF ₃) ₂)フェニル	2,6-ジ F, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	2-Cl, 4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	
3-クロロフェニル	2,6-ジ Cl, 4-(<i>t</i> -Bu)フェニル	2-Me, 4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	
3-ブromoフェニル	2-F, 4-(CF ₃)フェニル	3-F, 4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	10
3-ヨードフェニル	2-Cl, 4-(CF ₃)フェニル	3-Cl, 4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	
3-ニトロフェニル	2-Me, 4-(CF ₃)フェニル	3-Br, 4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	
3-シアノフェニル	3-(SCF ₃)フェニル	3-Me, 4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	
4-(SCF ₃)フェニル	3-(S(O)CF ₃)フェニル	Q-1	
4-(S(O)CF ₃)フェニル	3-(SO ₂ CF ₃)フェニル	Q-2	
4-(SO ₂ CF ₃)フェニル	3-(CF ₂ CF ₃)フェニル	Q-3	
4-(CF ₂ CF ₃)フェニル	3-(CF ₂ CF ₂ CF ₃)フェニル	Q-4	
4-(CF ₂ CF ₂ CF ₃)フェニル	3-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-5	
4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	2-F, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-6	20
2-F, 4-(SCF ₃)フェニル	2-Cl, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-7	
2-Cl, 4-(SCF ₃)フェニル	2-Me, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-8	
2-Me, 4-(SCF ₃)フェニル	3-F, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-9	
3-F, 4-(SCF ₃)フェニル	3-Cl, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-10	
3-Cl, 4-(SCF ₃)フェニル	3-Br, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-11	
3-Br, 4-(SCF ₃)フェニル	3-Me, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-12	
3-Me, 4-(SCF ₃)フェニル	2,6-ジ F, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-13	
2,6-ジ F, 4-(SCF ₃)フェニル	2,6-ジ Cl, 4-(OCF ₂ CF ₃)フェニル	Q-14	30
2,6-ジ Cl, 4-(SCF ₃)フェニル	3-F, 4-(CF ₃)フェニル	Q-15	
		Q-16	
		Q-17	
		Q-18	
		Q-19	

【0274】

40

本開示はまた、表 2 A ~ 4 2 A を含み、これらのそれぞれは表 1 A と同じ構図になっているが、ただし、マーカッシュ構造下の表 1 A における列見出し（すなわち、「A は、C H であり、R⁴ は、H であり、R⁵ は、H である。」）は、下記に示すそれぞれの列見出しで置き換えられる。例えば、表 2 A において、列見出しは、「R¹ は、F であり、A は、C F であり、R⁴ は、H であり、R⁵ は、H である」であり、Q は、上記の表 1 A において定義されている通りである。このように、表 2 A における第 1 の記入項目は、4 - [(4 - クロロフェニル) - フルオロ - メチル] - 3 - フルオロ - 5 - (トリアゾール - 2 - イル) ピリジンを特に開示する。

【0275】

50

【表 3】

表	表見出し	表	表見出し
2A	R1 は、F であり、A は、CF である	23A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、C- <i>i</i> -Pr である
3A	R1 は、F であり、A は、CCl である	24A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、C- <i>c</i> -Pr である
4A	R1 は、F であり、A は、CBr である	25A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、C-CF ₃ である
5A	R1 は、F であり、A は、Cl である	26A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、C-OMe である
6A	R1 は、F であり、A は、CMe である	27A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、C-OEt である
7A	R1 は、F であり、A は、CEt である	28A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、N である
8A	R1 は、F であり、A は、C- <i>n</i> -Pr である	29A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、CH である
9A	R1 は、F であり、A は、C- <i>i</i> -Pr である	30A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、CF である
10A	R1 は、F であり、A は、C- <i>c</i> -Pr である	31A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、CCl である
11A	R1 は、F であり、A は、CCF ₃ である	32A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、CBr である
12A	R1 は、F であり、A は、COMe である	33A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、Cl である
13A	R1 は、F であり、A は、C-OEt である	34A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、CMe である
14A	R1 は、F であり、A は、N である	35A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、CEt である
15A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、CH である	36A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、C- <i>n</i> -Pr である
16A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、CF である	37A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、C- <i>i</i> -Pr である
17A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、CCl である	38A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、C- <i>c</i> -Pr である
18A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、CBr である	39A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、C-CF ₃ である
19A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、Cl である	40A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、C-OMe である
20A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、CMe である	41A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、C-OEt である
21A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、CEt である	42A	R1 は、SCH ₃ であり、A は、N である
22A	R1 は、OCH ₃ であり、A は、C- <i>n</i> -Pr である		

10

20

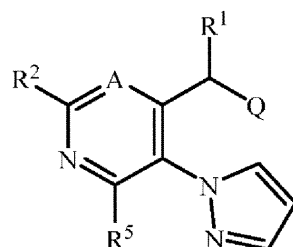
30

【0276】

表 1 B

表 1 B は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 B の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

【化 25】



40

【0277】

例えば、表 1 B における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、R¹ は、F であり、A は、CH であり、R² は、H であり、R⁵ は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0278】

50

表 2 B ~ 4 2 B

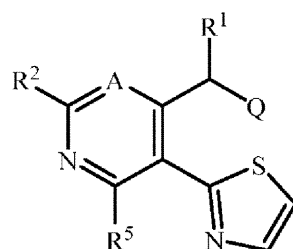
表 2 B ~ 4 2 B は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【 0 2 7 9 】

表 1 C

表 1 C は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 B の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

【 化 2 6 】



10

【 0 2 8 0 】

例えば、表 1 C における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

20

【 0 2 8 1 】

表 2 C ~ 4 2 C

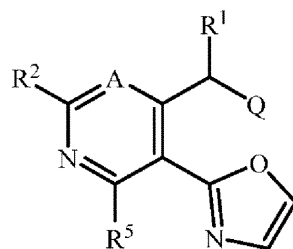
表 2 C ~ 4 2 C は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【 0 2 8 2 】

表 1 D

表 1 D は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 D の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

【 化 2 7 】



30

【 0 2 8 3 】

例えば、表 1 D における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

40

【 0 2 8 4 】

表 2 D ~ 4 2 D

表 2 D ~ 4 2 D は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

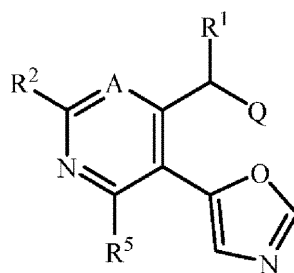
【 0 2 8 5 】

表 1 E

表 1 E は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 E の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

50

【化 2 8】



10

【0 2 8 6】

例えば、表 1 D における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0 2 8 7】

表 2 E ~ 4 2 E

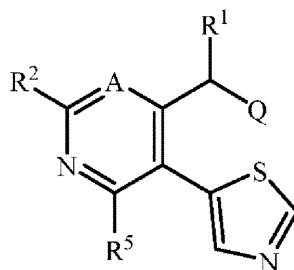
表 2 E ~ 4 2 E は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【0 2 8 8】

表 1 F

表 1 F は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 F の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

【化 2 9】



30

【0 2 8 9】

例えば、表 1 F における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0 2 9 0】

表 2 F ~ 4 2 F

表 2 F ~ 4 2 F は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【0 2 9 1】

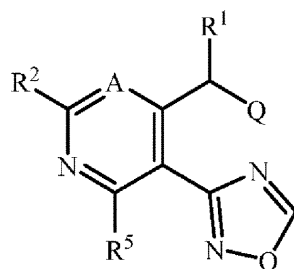
表 1 G

表 1 G は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 G の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

40

50

【化 3 0】



10

【 0 2 9 2 】

例えば、表 1 G における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【 0 2 9 3 】

表 2 G ~ 4 2 G

表 2 G ~ 4 2 G は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

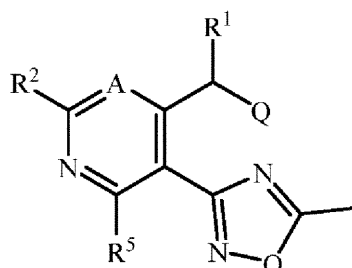
【 0 2 9 4 】

表 1 H

表 1 H は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 H の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

20

【化 3 1】



30

【 0 2 9 5 】

例えば、表 1 H における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【 0 2 9 6 】

表 2 H ~ 4 2 H

表 2 H ~ 4 2 H は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【 0 2 9 7 】

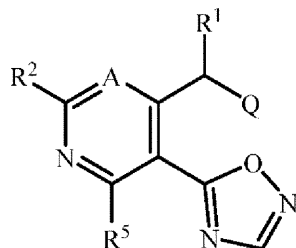
表 1 I

表 1 I は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 H の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

40

50

【化 3 2】



10

【0298】

例えば、表 1 I における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0299】

表 2 I ~ 4 2 I

表 2 I ~ 4 2 I は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

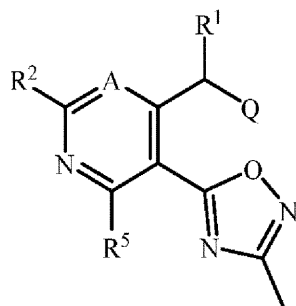
【0300】

表 1 J

表 1 J は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 J の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

20

【化 3 3】



30

【0301】

例えば、表 1 J における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0302】

表 2 J ~ 4 2 J

表 2 J ~ 4 2 J は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【0303】

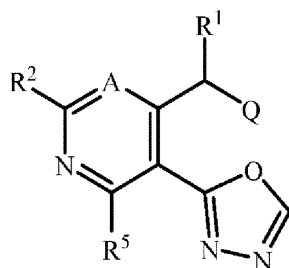
表 1 K

表 1 K は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 K の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

40

50

【化 3 4】



10

【0304】

例えば、表 1 K における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0305】

表 2 K ~ 4 2 K

表 2 K ~ 4 2 K は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

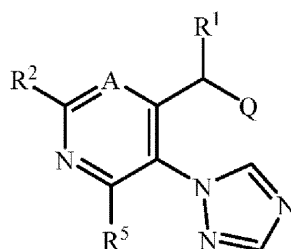
【0306】

表 1 L

表 1 L は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 L の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

20

【化 3 5】



30

【0307】

例えば、表 1 L における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0308】

表 2 L ~ 4 2 L

表 2 L ~ 4 2 L は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【0309】

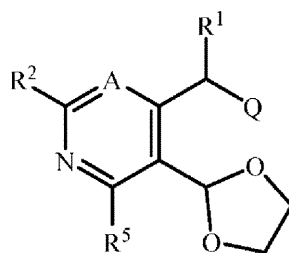
表 1 M

表 1 M は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 M の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

40

50

【化 3 6】



10

【0 3 1 0】

例えば、表 1 M における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0 3 1 1】

表 2 M ~ 4 2 M

表 2 M ~ 4 2 M は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

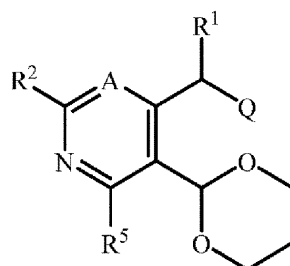
【0 3 1 2】

表 1 N

表 1 N は、表 1 A と同一であるが、ただし、表 1 N の見出しにおける化学構造は、下記の構造で置き換えられる。

20

【化 3 7】



30

【0 3 1 3】

例えば、表 1 N における第 1 の化合物は、直前に示した構造であり、ここで、 R^1 は、F であり、A は、CH であり、 R^2 は、H であり、 R^5 は、H であり、Q は、4-クロロフェニルである。

【0 3 1 4】

表 2 N ~ 4 2 N

表 2 N ~ 4 2 N は、表 2 A ~ 4 2 A と同様の様式の構図になっている。

【0 3 1 5】

本開示の化合物は一般に、キャリアとして働く、界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの追加の成分とともに、組成物、すなわち、調合物中の無脊椎有害生物駆除活性成分として使用されるであろう。調合物又は組成物成分は、活性成分の物理的特性、適用様式並びに土壌タイプ、湿気及び温度などの環境因子と整合するように選択される。

40

【0 3 1 6】

有用な調合物には、液体及び固体組成物が含まれる。液体組成物には、場合によっては増粘してゲルにすることができる、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物及び／又はサスポエマルジョンを含む）などが含まれる。一般的なタイプの水性液体組成物は、可溶性濃縮物、懸濁液濃縮物、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマ

50

ルジョン、流動性濃縮物及びサスポエマルジョンである。一般的なタイプの非水性液体組成物は、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、分散性濃縮物及び油分散系である。

【0317】

一般的なタイプの固体組成物は、水分散性（「濡らすことができる」）又は水溶性であり得る、微粉、粉末、顆粒、ペレット、小粒、芳香錠、錠剤、充填剤入りフィルム（種子コーティングを含む）などである。フィルム形成溶液又は流動性懸濁液から形成されたフィルム及びコーティングは、種子処理用に特に有用である。活性成分は、（マイクロ）カプセル化し、さらに懸濁液又は固体調合物にすることができるか；或いはまた活性成分の全体調合物は、カプセル化する（又は「上塗りする」）ことができる。カプセル化は、活性成分の放出を制御する、又は遅くすることができる。乳化性顆粒は、乳化性濃縮物調合物及び乾燥粒状調合物の両方の利点を兼ね備える。高強度組成物は、さらなる調合物用の中間体として主に使用される。

【0318】

噴霧可能な調合物は典型的には、噴霧前に好適な媒体に希釈される。そのような液体及び固体調合物は、調合されて噴霧媒体、通常水、しかし時々、芳香族又はパラフィン系炭化水素又は植物油のような別の好適な媒体に容易に希釈される。散布量は、1ヘクタール当たり約1～数千リットルの範囲であり得るが、より典型的には1ヘクタール当たり約10～数百リットルの範囲にある。噴霧可能な調合物は、空中若しくは地上散布による茎葉処理のために、又は植物の生育培地への適用のために水又は別の好適な媒体とタンク混合することができる。液体及び乾燥調合物は、植え付け中に、細流かんがいシステムへ直接計量供給するか又は畝間へ計量供給することができる。液体及び固体調合物は、浸透吸収によって成長中の根及び他の地下植物部位並びに／又は群葉を保護するために、植え付け前の種子処理として作物及び他の望ましい植生の種子上へ適用することができる。

【0319】

配合物は典型的には、下記の概ねの範囲内で有効量の活性成分、賦形剤及び界面活性剤を含有するが、合計は100重量パーセントとなる。

【0320】

【表4】

	重量パーセント		
	活性成分	賦形剤	界面活性剤
水分散性及び水溶性の顆粒、錠剤及び粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散体、懸濁液、エマルジョン、溶液 (乳化性濃縮物を含む)	1-50	40-99	0-50
微粉	1-25	70-99	0-5
顆粒及びペレット	0.001-99	5-99.999	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

【0321】

固体希釈剤には、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイト及びカオリンなどの粘土、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖類（例えば、ラクトース、サッカロース）、シリカ、タルク、雲母、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸及び重炭酸ナトリウム、並びに硫酸ナトリウムが含まれる。典型

的な固体希釈剤は、Watkinsら, Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jerseyに記載されている。

【0322】

液体希釈剤には、例えば、水、N，N-ジメチルアルカンアミド（例えば、N，N-ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリドン）、アルキルホスフェート（例えば、トリエチルホスフェート）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、プロピレンカーボネート、ブチレンカーボネート、パラフィン（例えば、白色鉱油、ノルマルパラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱芳香族化脂肪族化合物、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロン及び4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンなどのケトン、イソアミルアセテート、ヘキシルアセテート、ヘプチルアセテート、オクチルアセテート、ノニルアセテート、トリデシルアセテート及びイソボルニルアセテートなどのアセテート、アルキル化乳酸エステル、二塩基性酸エステルアルキル及びアリールベンゾエートなどの他のエステル、γ-ブチロラクトン、並びにメタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾール及びベンジルアルコールなどの、線状、分岐、飽和若しくは不飽和であってもよい、アルコールが含まれる。液体希釈剤にはまた、植物種油及び果実油（例えば、オリーブ油、ヒマシ油、亜麻仁油、ごま油、コーン（トウモロコシ）油、ピーナツ油、ヒマワリ油、グレープシード油、サフラワー油、綿実油、大豆油、菜種油、ココナツ油及びパーム核油）、動物源脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油）、並びにそれらの混合物などの、飽和及び不飽和脂肪酸（典型的にはC₆～C₂₂）のグリセロールエステルが含まれる。液体希釈剤にはまた、アルキル化（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）脂肪酸であって、脂肪酸が植物及び動物源からのグリセロールエステルの加水分解によって得られてもよいし、蒸留によって精製することができる脂肪酸が含まれる。典型的な液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950に記載されている。

【0323】

本開示の固体及び液体組成物は多くの場合、1つ若しくは複数の界面活性剤を含む。液体に添加される場合、界面活性剤（surfactant）（「界面活性剤（surface-active agent）」としても知られる）は一般に、液体の表面張力を、変性し、ほとんどの場合低下させる。界面活性剤分子中の親水性及び親油性基の性質に依って、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤又は消泡剤として有用であり得る。

【0324】

界面活性剤は、非イオン、アニオン又はカチオン界面活性剤として分類することができる。本組成物に有用な非イオン界面活性剤には、（分岐若しくは線状であってもよい）天然及び合成アルコールをベースとする、そしてアルコールと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド又はそれらの混合物とから製造されるアルコールアルコキシレートなどのアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミド及びエトキシル化アルカノールアミド；エトキシル化大豆油、ヒマシ油及び菜種油などのアルコキシ化トリグリセリド；（フェノール類と、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド又はそれらの混合物とから製造される）オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレート及びドデシルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノールアルコキシレート；エ

チレンオキシド又はプロピレンオキシドと、末端ブロックがプロピレンオキシドから調製されている逆ブロックポリマーとから製造されるブロックポリマー；エトキシ化脂肪酸；エトキシ化脂肪酸エステル及び油；エトキシ化メチルエステル；エトキシ化トリステリルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド又はそれらの混合物から製造されるものを含む）；脂肪酸エステル、グリセロールエステル、ラノリンベースの誘導体、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシ化ソルビトール脂肪酸エステル及びポリエトキシ化グリセロール脂肪酸エステルなどのポリエトキシレートエステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキッド *peg*（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフト若しくは 形ポリマー及び星形ポリマーなどの高分子界面活性剤；ポリエチレングリコール（*peg*）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコンベースの界面活性剤；並びにサッカロースエステル、アルキルポリグリコシド及びアルキル多糖類などの糖誘導体が含まれるが、それらに限定されない。

【0325】

有用なアニオン界面活性剤には、アルキルアリールスルホン酸及びそれらの塩；カルボキシ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホネート誘導体；リグニン及びリグノスルホネートなどのリグニン誘導体；マレイン酸若しくはコハク酸又はそれらの酸無水物；オレフィンスルホネート；アルコールアルコキシレートのホスフェートエステル、アルキルフェノールアルコキシレートのホスフェートエステル及びステリルフェノールエトキシレートのホスフェートエステルなどのホスフェートエステル；タンパクベースの界面活性剤；サルコシン誘導体；ステリルフェノールエーテルスルフェート；油及び脂肪酸のスルフェート及びスルホネート；エトキシ化アルキルフェノールのスルフェート及びスルホネート；アルコールのスルフェート；エトキシ化アルコールのスルフェート；N，N－アルキルタウレートなどのアミン及びアミドのスルホネート；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、並びにドデシル及びトリデシルベンゼンのスルホネート；縮合ナフタレンのスルホネート；ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホネート；分別石油のスルホネート；スルホスクシネート；並びにジアルキルスルホスクシネート塩などのスルホスクシネート及びそれらの誘導体が含まれるが、それらに限定されない。

【0326】

有用なカチオン界面活性剤には、アミド及びエトキシ化アミド；N－アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミン及びジプロピレントトラアミン、並びに（アミンと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド又はそれらの混合物とから製造される）エトキシ化アミン、エトキシ化ジアミン及びプロポキシ化アミンなどのアミン；アミン酢酸塩などのアミン塩及びジアミン塩；第四級塩、エトキシ化第四級塩及びジ四級化塩などの第四級アンモニウム塩；並びにアルキルジメチルアミノオキシド及びビス－（2－ヒドロキシエチル）－アルキルアミノオキシドなどのアミノオキシドが含まれるが、それらに限定されない。

【0327】

非イオン界面活性剤とアニオン界面活性剤との混合物又は非イオン界面活性剤とカチオン界面活性剤との混合物もまた、本組成物に有用である。非イオン、アニオン及びカチオン界面活性剤並びにそれらの推奨される使用は、McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. によって出版された McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; 及び A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons,

New York, 1987を含む様々な出版された参考文献に開示されている。

【0328】

本開示の組成物はまた、調合助剤として当業者に公知の、調合補助剤及び添加剤を含含有してもよい（それらのいくつかは、固体希釈剤、液体希釈剤又は界面活性剤としてもまた機能すると考えられ得る）。そのような調合補助剤及び添加剤は、pH（緩衝剤）、処理中の発泡（ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤）、活性成分の沈降（懸濁剤）、粘度（チキソトロピック増粘剤）、容器中の微生物増殖（抗菌剤）、製品凍結（不凍剤）、色（染料／顔料分散系）、洗脱（フィルム形成剤又はステッカー）、蒸発（蒸発防止剤）、及び他の調合属性を制御し得る。フィルム形成剤には、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマー及びワックスが含まれる。調合補助剤及び添加剤の例としては、McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. によって出版された McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions; 及び PCT 公開国際公開第 03/024222 号パンフレットにリストアップされているものが挙げられる。

10

【0329】

式 1 の化合物及び任意の他の活性成分は典型的には、活性成分を溶媒に溶解させることによって、又は液体若しくは乾燥希釈剤中ですり潰すことによって本組成物中へ組み込まれる。乳化性濃縮物などの、溶液は、成分を単に混合することによって調製することができる。乳化性濃縮物としての使用を意図される液体組成物の溶媒が水混和性である場合、乳化剤が典型的には、水での希釈時に活性含有溶媒を乳化させるために添加される。2, 000 μm 以下の粒子径の、活性成分スラリーは、3 μm よりも下の平均径の粒子を得るために媒体ミルを用いて湿式ミリングすることができる。水性スラリーは、完成懸濁液濃縮物にすることができる（例えば、米国特許第 3, 060, 084 号明細書を参照されたい）か又は噴霧乾燥によってさらに処理して水分散性顆粒を形成することができる。乾燥調合物は通常、2 ~ 10 μm 範囲の平均粒子径を生み出す、乾式ミリング法を必要とする。微粉及び粉末は、ブレンドし、そして通常（ハンマーミル又は流体エネルギーミルを使ってなどで）すり潰すことによって調製することができる。顆粒及びペレットは、あらかじめ形成された粒状キャリア上へ活性材料を噴霧することによって、又は凝集技術によって調製することができる。Browning, 「Agglomeration」, Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 及びそれに続くもの、並びに国際公開第 91/13546 号パンフレットを参照されたい。ペレットは、米国特許第 4, 172, 714 号明細書に記載されているように調製することができる。水分散性及び水溶性顆粒は、米国特許第 4, 144, 050 号明細書、米国特許第 3, 920, 442 号明細書及び独国特許第 3, 246, 493 号明細書に教示されているように調製することができる。錠剤は、米国特許第 5, 180, 587 号明細書、米国特許第 5, 232, 701 号明細書及び米国特許第 5, 208, 030 号明細書に教示されているように調製することができる。フィルムは、英国特許第 2, 095, 558 号明細書及び米国特許第 3, 299, 566 号明細書に教示されているように調製することができる。

20

30

40

【0330】

調合物の技術分野に関するさらなる情報については、T. S. Woods, 「The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture」 in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proc

50

eedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133を参照されたい。また、米国特許第3,235,361号明細書、列6、行16～列7、行19及び実施例10～41；米国特許第3,309,192号明細書、列5、行43～列7、行62並びに実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164, 166, 167及び169～182；米国特許第2,891,855号明細書、列3、行66～列5、行17及び実施例1～4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96；Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；並びにDevelopments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000を参照されたい。

10

【0331】

以下の実施例において、配合物はすべて、慣用される方法で調製される。化合物の番号は、索引表A～Bでの化合物を指している。さらなる入念な検討なしに、先行記載を用いる当業者は、最大程度に本開示を利用することができると考えられる。以下の実施例は、それ故、単に例示的なものであり、何であれ決して本開示を限定するものではないと解釈されるべきである。百分率は、特に示される場合を除いて重量による。

20

【0332】

実施例A

高強度濃縮物

化合物8 98.5%

シリカエーロゲル 0.5%

合成アモルファス微粉シリカ 1.0%

【0333】

実施例B

水和剤

化合物14 65.0%

ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル 2.0%

リグニンスルホン酸ナトリウム 4.0%

シリコアルミン酸ナトリウム 6.0%

モンモリロナイト（焼成品） 23.0%

【0334】

実施例C

顆粒

化合物19 10.0%

アタパールジャイト顆粒（低揮発性物質、0.71／0.30mm；U.S.S.No.25-50篩） 90.0%

40

【0335】

実施例D

押出加工ペレット

化合物78 25.0%

無水硫酸ナトリウム 10.0%

粗リグニンスルホン酸カルシウム 5.0%

アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム 1.0%

カルシウム／マグネシウムベントナイト 59.0%

【0336】

50

実施例 E

乳化性濃縮物

化合物 3 10.0%

ポリオキシエチレンソルビトールヘクスオレエート 20.0%

C₆～C₁₀ 脂肪酸メチルエステル 70.0%

【0337】

実施例 F

マイクロエマルジョン

化合物 86 5.0%

ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー 30.0%

アルキルポリグリコシド 30.0%

モノオレイン酸グリセリル 15.0%

水 20.0%

【0338】

実施例 G

種子処理剤

化合物 20 20.00%

ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー 5.00%

モンタン酸ワックス 5.00%

リグニンスルホン酸カルシウム 1.00%

ポリオキシエチレン/ポリオキシプロピレンブロックコポリマー 1.00%

ステアリルアルコール (POE 20) 2.00%

ポリオルガノシラン 0.20%

着色剤、赤色染料 0.05%

水 65.75%

【0339】

実施例 H

棒状肥料

化合物 32 2.5%

ピロリドン-スチレンコポリマー 4.8%

トリスチリルフェニル 16-エトキシレート 2.3%

タルク 0.8%

トウモロコシデンプン 5.0%

徐放性肥料 36.0%

カオリン 38.0%

水 10.6%

【0340】

実施例 I

懸濁液濃縮物

化合物 67 35%

ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー 4.0%

ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー 1.0%

スチレンアクリルポリマー 1.0%

キサンタンガム 0.1%

プロピレングリコール 5.0%

シリコーンをベースとする消泡剤 0.1%

1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン 0.1%

水 53.7%

【0341】

実施例 J

10

20

30

40

50

水中エマルジョン

化合物 34 10.0%

ブチルポリオキシエチレン／ポリプロピレンブロックコポリマー 4.0%

ステアリン酸／ポリエチレングリコールコポリマー 1.0%

スチレンアクリルポリマー 1.0%

キサンタンガム 0.1%

プロピレングリコール 5.0%

シリコーンをベースとする消泡剤 0.1%

1, 2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン 0.1%

芳香族石油をベースとする炭化水素 20.0%

水 58.7%

10

【0342】

実施例 K

油分散体

化合物 39 25%

ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレエート 15%

有機変性ベントナイトクレイ 2.5%

脂肪酸メチルエステル 57.5%

【0343】

実施例 L

サスポエマルジョン

化合物 16 10.0%

イミダクロプリド 5.0%

ブチルポリオキシエチレン／ポリプロピレンブロックコポリマー 4.0%

ステアリン酸／ポリエチレングリコールコポリマー 1.0%

スチレンアクリルポリマー 1.0%

キサンタンガム 0.1%

プロピレングリコール 5.0%

シリコーンをベースとする消泡剤 0.1%

1, 2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン 0.1%

芳香族石油をベースとする炭化水素 20.0%

水 53.7%

20

30

【0344】

本開示の化合物は、幅広いスペクトルの無脊椎有害生物に対して活性を示す。これらの有害生物には、例えば、植物群葉、根、土壌、収穫済み作物又は他の食料、建造物又は動物外皮などの様々な環境に生息する無脊椎動物が含まれる。これらの有害生物には、例えば、群葉（葉、莖、花及び果実を含む）、種子、木、織物繊維又は動物血液若しくは組織上で摂食し、それによって、例えば、成長中の又は貯蔵される農作物、森林、温室作物、観賞植物、苗床作物、貯蔵される食料若しくは繊維製品、又は家屋若しくは他の構造物若しくはそれらの内容物に被害若しくは損害を引き起こすか、又は動物の健康若しくは公衆衛生に有害である無脊椎動物が含まれる。当業者は、すべての化合物が、すべての成長段階のすべての有害生物に対して等しく有効であるわけではないことを十分理解するであろう。

40

【0345】

これらの本化合物及び組成物はしたがって、農作物を植食性の無脊椎有害生物から保護するために農学的に、そしてまた他の園芸作物及び植物を植食性の無脊椎有害生物から保護するために非農学的に有用である。この有用性には、遺伝子工学（すなわち、遺伝子組み換え）によって導入された、又は有利な形質を提供するために突然変異生成によって変性された遺伝物質を含有する作物及び他の植物（すなわち、農学的及び非農学的の両方の）を保護することが含まれる。そのような形質の例としては、除草剤への耐性、植食性の

50

有害生物（例えば、昆虫、ダニ、アブラムシ、クモ、線形動物、カタツムリ、植物病原性真菌類、細菌及びウイルス）に対する抵抗性、改善された植物成長、高温若しくは低温、低い若しくは高い土壌湿気、及び高い塩分濃度などの不利な生育条件への増加した耐性、増加した開花又は結果、より大きい収穫収量、より速い成熟、収穫産物のより高い品質及び／若しくは栄養価、又は収穫産物の改善された貯蔵若しくは加工特性が挙げられる。遺伝子組み換え植物は、多形質を発現させるように変性することができる。遺伝子工学又は突然変異生成によって提供される形質を含有する植物の例としては、YIELD GARD（登録商標）、KNOCKOUT（登録商標）、STARLINK（登録商標）、BOLLGARD（登録商標）、NuCOTN（登録商標）及びNEWLEAF（登録商標）、INVICTA RR2 PRO^TMなどの殺虫性のバチルス・チューリゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）毒素を発現させるコーン、綿、大豆及びジャガイモの変種、及びROUNDUP READY（登録商標）、LIBERTY LINK（登録商標）、IMI（登録商標）、STS（登録商標）及びCLEARFIELD（登録商標）などのコーン、綿、大豆及び菜種の除草剤耐性垂種、並びにグリホサート除草剤に対する抵抗性を提供するためのN-アセチルトランスフェラーゼ（GAT）を発現させる作物、又はアセト乳酸シンターゼ（ALS）を阻害する除草剤に対する抵抗性を提供するHRA遺伝子を含有する作物が挙げられる。本化合物及び組成物は、遺伝子工学によって導入された、又は突然変異生成によって変性された形質と向上効果を示し、このようにして形質の表現型発現又は有効性を高め得るか、又は本化合物及び組成物の無脊椎有害生物駆除有効性を増加させ得る。具体的には、本発明の化合物及び組成物は、無脊椎有害生物に対して毒性を有するタンパク質又はその他の天然物の表現型発現（phenotypic expression）と向上効果を示して、これらの有害生物に、単に加えた以上の防除を与えることができる。

10

20

30

40

50

【0346】

本開示の組成物はまた、植物栄養物、例えば、窒素、リン、カリ、硫黄、カルシウム、マグネシウム、鉄、銅、ホウ素、マンガン、亜鉛、及びモリブデンから選択される少なくとも1つの植物栄養物を含む肥料組成物の場合によっては含むことができる。窒素、リン、カリ、硫黄、カルシウム及びマグネシウムから選択される少なくとも1つの植物栄養物を含む少なくとも1つの肥料組成物を含む組成物に注目すべきである。少なくとも1つの植物栄養物をさらに含む本開示の組成物は、液体若しくは固体の形態にあり得る。顆粒、小スティック又は錠剤の形態での固体調合物に注目すべきである。肥料組成物を含む固体調合物は、本開示の化合物又は組成物を調合成分と一緒に肥料組成物と混合し、そして次に顆粒化又は押出などの方法によってこの調合物を調製することによって調製することができる。或いはまた、固体調合物は、揮発性溶媒中の本開示の化合物又は組成物の溶液又は懸濁液を、寸法安定性のある混合物、例えば、顆粒、小スティック又は錠剤の形態での事前調製された肥料組成物上へ噴霧し、次に溶媒を蒸発させることによって調製することができる。

【0347】

非農学的使用は、作物の田畑以外のエリアでの無脊椎有害生物駆除を意味する。本化合物及び組成物の非農学的使用には、貯蔵される穀物、豆及び他の食料での、並びに衣類及びカーペットなどの織物での無脊椎有害生物の駆除が含まれる。本化合物及び組成物の非農学的使用にはまた、観賞植物、森林での、道路沿い及び鉄道施設用地に沿った、芝土での、並びに芝土、ゴルフコース及び牧場などの芝生上での無脊椎有害生物駆除が含まれる。本化合物及び組成物の非農学的使用にはまた、ヒト及び／又は連れによって占有されてもよい家屋及び他の建物、農場、大牧場、動物園又は他の動物での無脊椎有害生物駆除が含まれる。本化合物及び組成物の非農学的使用にはまた、建物に使用された木材又は他の構造材料に損害を与え得るシロアリなどの有害生物の駆除が含まれる。

【0348】

本化合物及び組成物の非農学的使用にはまた、寄生性であるか、又は伝染病をうつす無脊椎有害生物を駆除することによるヒト及び動物の健康の保護が含まれる。動物寄生生物

の駆除には、ホスト動物の体の表面（例えば、肩、脇の下、腹部、大腿部の内側部）に寄生する外部寄生生物及びホスト動物の体の内部（例えば、胃、腸、肺、静脈、皮下、リンパ組織）に寄生する内部寄生生物の駆除が含まれる。外部寄生性又は病気媒介有害生物には、例えば、ツツガムシの幼虫、マダニ（tick）、シラミ、蚊、ハエ、ダニ及びノミが含まれる。内部寄生生物には、犬糸状虫、十二指腸虫及び蠕虫が含まれる。本開示の化合物及び組成物は、動物上の寄生生物によるまん延又は感染の全身及び／又は非全身制御に好適である。本開示の化合物及び組成物は、外部寄生性有害生物又は病気媒介有害生物と闘うのに特に好適である。本開示の化合物及び組成物は、畜牛、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、水牛、ウサギ、めんどり、七面鳥、アヒル、ガチョウ及びハチなどの、農作業動物；犬、猫、愛玩鳥及び観賞魚などの愛玩動物及び家畜；並びにハムスター、モルモット、ラットおよびマウスなどの、いわゆる実験動物にはびこる寄生生物と闘うのに好適である。これらの寄生生物と闘うことによって、災難及びパフォーマンス低下（肉、ミルク、羊毛、皮、卵、蜜の観点からの）が低減され、その結果本開示の化合物を含む組成物の適用は、動物のより経済的な、且つ、簡単な畜産を可能にする。

10

20

30

40

50

【0349】

農学的若しくは非農学的な無脊椎有害生物の例には、鱗翅目（Lepidoptera）、ヤガ科（Noctuidae）における、例えば、ヨトウムシ、ネキリムシ、シャクトリムシ、及びタバコガ（例えば、ピンクステムボラー（*Sesamia inferens*）Walker）、コーンスタークボラー（セサミア・ノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioides*）Lefebvre）、南部ヨトウムシ（スポドプテラ・エリダニア（*Spodoptera eridania*）Cramer）、ツマジロクサヨトウ（スポドプテラ・フルギベルダ（*Spodoptera frugiperda*）J. E. Smith）、シロイチモジヨトウガの幼虫（シロイチモジヨトウ（*Spodoptera exigua*）Huebner）、コットンリーフワーム（スポドプテラ・リトラリス（*Spodoptera littoralis*）Boisduval）、イエローストリップトヨトウムシ（スポドプテラ・オルニトガリ（*Spodoptera ornithogalli*）Guenee）、ブラックネキリムシ（タマナヤガ（*Agrotis ipsilon*）Hufnagel）、ベルベットビーンイモムシ（アンチカルシア・ゲムマタリス（*Anticarsia gemmatalis*）Huebner）、グリーンフルーツワーム（リトファン・アンテナタ（*Lithophane antennata*）Walker）、キャベツヨトウムシ（ヨトウガ（バラトラ・ブラシカエ（*Barathra brassicae*）Linnaeus）、ダイズシャクトリムシ（プソイドプルシア・インクルデンス（*Pseudoplusia includens*）Walker）、イラクサギンウワバ（イラクサギンウワバ（*Trichoplusia ni*）Huebner）、タバコバドワーム（ニセアメリカタバコガ（*Heliothis virescens*）Fabricius））における卵、幼虫及び成虫；メイガ科（Pyralidae）からのボラー、繭を作る昆虫、ウェブワーム、コーンワーム、キャベツワーム及び葉を食い荒らす虫（例えば、ヨーロッパコーンボラー（オストリニア・ヌビラリス（*Ostrinia nubilalis*）Huebner）、ネーブルオレンジワーム（アミエロイス・トランシテラ（*Amyelois transitella*）Walker）、コーンルートウェブワーム（クランブス・カリギノセルス（*Crambus caliginosellus*）Clemens）、ソッドウェブワーム（メイガ科（Pyralidae）：蠕ツトガ科（*Crambinae*））、例えば、ソッドワーム（ヘルペトグランマ・リカルシサリス（*Herpetogramma licarsialis*）Walker）、サトウキビステムボラー（チロ・インフスカテルラス（*Chilo infuscatellus*）Snellen）、トマトスモールボラー（ネオロイシノデス・エレガンタリス（*Neoleucinodes elegantalis*）Guenee）、グリーンハマキムシ（コブノメイガ（*Cnaphalocrocis medinalis*）Guenee）、ブドウリーフフォルダー（デスマミア・フネラリス（*Desmia funeralis*）Hue

bner)、メイガ科の幼虫(ディアファニア・ニチダリス(*Diaphania nitidalis*) Stoll)、キャベツセンターグラブ(ヘルラ・ヒドラリス(*Hel-
 lula hydralis*) Guenee)、イエローステムボラー(サンカメイ
 チュウ(*Scirpophaga incertulas*) Walker)、ホワイトス
 テムボラー(スシルポファガ・インノタタ(*Scirpophaga innotat-
 a*) Walker)、トップシュートボラー(スシルポファガ・ニベラ(*Scirpo-
 phaga nivella*) Fabricius)、ダークヘッドのライスボラー(チロ・ポリクリスス(*Chilo polychrysus*) Meyrick)、ストライ
 プドライスボラー(ニカメイガ(*Chilo suppressalis*) Walk- 10
 er)、キャベツクラスターイモムシ(クロシドロミア・ビノタリス(*Crocidol-
 omia binotalis*) Zeller)) ; ハマキガ科(*Tortricida-
 e*)におけるハマキムシ、ブッドワーム、シードワーム、及びフルーツワーム(例えば、
 コドリング(コドリング(*Cydia pomonella*) Linnaeus)、グレー
 プベリーガ(パラロベシア・ビテアナ(*Paralobesia viteana*) C-
 lemens)、ナシヒメシンクイ(ナシヒメシンクイ(*Grapholita mol-
 esta*) Busck)、ミカンニセコドリング(クリプトフレビア・ロイコトレタ(*C-
 ryptophlebia leucotreta*) Meyrick)、シトラスボラー
 (ギムナンドロソマ・アウランチアヌム(*Gymnandrosoma aurant-
 ianum*) Lima)、赤色縞ハマキムシ(アルギロテニア・ベルチナナ(*Argyr-
 otaenia velutinana*) Walker)、斜め縞ハマキムシ(コリスト 20
 ネウラ・ロサセアナ(*Choristoneura rosaceana*) Harris)
 、薄茶リンゴガ(エピフィアス・ポスティフィッタナ(*Epiphyas postv-
 ittana*) Walker)、ヨーロップグレープベリーガ(エウポエシリア・アムビ
 グエラ(*Eupoecilia ambiguella*) Huebner)、リンゴ芽ガ
 (パンデミス・ピルサナ(*Pandemis pyrusana*) Kearfott)、
 雑食性ハマキムシ(プラチノタ・スツルタナ(*Platynota stultana*)
 Walsingham)、縞のある果樹ハマキガ(パンデミス・セラサナ(*Pandem-
 is cerasana*) Huebner)、リンゴブラウンハマキガ(パンデミス・ヘ
 パラナ(*Pandemis heparana*) Denis & Schiffermuel- 30
 ler)) ; 並びに多くの他の経済的に重要な鱗翅目(*lepidoptera*) (例
 えば、コナガ(コナガ(*Plutella xylostella*) Linnaeus)、
 ワタキバガの幼虫(ペクチノホラ・ゴッシピエラ(*Pectinophora goss-
 ypiella*) Saunders)、マイマイガ(マイマイガ(*Lymantria-
 dispar*) Linnaeus)、モモ果実ボラー(カルポシナ・ニポネンシス(*C-
 arposina niponensis*) Walsingham)、モモ小枝ボラー
 (アナルシア・リネアテラ(*Anarsia lineatella*) Zeller)、
 ジャガイモキバガの幼虫(ジャガイモガ(*Phthorimaea operculel-
 la*) Zeller)、スポテッドテニフォームハモグリムシ(フィロノリクテル・ブラ
 ンカルデラ(*Phyllonorycter blancardella*) Fabric- 40
 ius)、アジアリンゴハモグリムシ(リソコレティス・リンゴニエラ(*Lithoco-
 lletis ringoniella*) Matsumura)、ライスリーフフォルダ
 ー(レロデア・エウファラ(*Lerodea eufala*) Edwards)、リンゴ
 ハモグリムシ(ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*) Ze-
 ller)) ; チャバネゴキブリ科(*Blattellidae*)及びゴキブリ科(*Bl-
 attidae*)からのゴキブリを含めたゴキブリ目(*Blattodea*) (例えば、
 トウヨウゴキブリ(トウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*) Linn-
 aeus)、アジアゴキブリ(ブラッテラ・アサヒナイ(*Blatella asahi-
 nai*) Mizukubo)、ドイツゴキブリ(ブラッテラ・ゲルマニカ(*Blatte-
 lla germanica*) Linnaeus)、褐色縞ゴキブリ(スペラ・ロンギパ
 ルパ(*Supella longipalpa*) Fabricius)、ワモンゴキブリ 50

(ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*) Linnaeus)、
 ブラウンゴキブリ (ペリプラネタ・ブルネア (*Periplaneta brunnea*) Burmeister)、マデイラゴキブリ (ロイコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*) Fabricius)、スモーキーブラウンゴキブリ
 (ペリプラネタ・フリギノサ (*Periplaneta fuliginosa*) Serville)、オーストラリアゴキブリ (ペリプラネタ・オーストララシアエ (*Periplaneta australasiae*) Fabr.)、ロブスターゴキブリ (ナウ
 ホエタ・シネレア (*Nauphoeta cinerea*) Olivier) 及びスー
 スゴキブリ (シンプロセ・パレンス (*Symploce pallens*) Stephens) の卵、若虫及び成虫；ヒゲナガゾウムシ科 (*Anthribidae*)、マメゾ
 ウムシ科 (*Bruchidae*)、及びゾウムシ科 (*Curculionida*) からの
 ゾウムシを含めた甲虫目 (*Coleoptera*) の卵、

10

葉面摂食、果物摂食、根摂食、種子摂食並びに小胞状組織摂食幼虫及び成虫 (例えば、ワ
 タミハナゾウムシ (アントノムス・グランディス (*Anthonomus grandis*) Boheman)、イネミズゾウムシ (リソルホプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptus oryzophilus*) Kuschel)、穀物倉ゾウムシ (シ
 トフィラス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*) Linnaeus)、ライスゾウムシ (シトフィラス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*) Linnaeus))、スズメノカラビラゾウムシ (リストロノツス・マキュリコ
 リス (*Listronotus maculicollis*) Dietz)、ブルーグラ
 スゾウムシ (スフェノフォルス・パルウルス (*Sphenophorus parvulus*) Gyllenhal)、シバオサゾウムシ (スフェノフォルス・ベナタス・ベスチ
 タス (*Sphenophorus venatus vestitus*) Chittenden)、ロッキーマウンテンゾウムシ (スフェノフォルス・シカトリストリツス (*Sphenophorus cicatristriatus*) Fahraeus))；ハム
 シ科 (*Chrysomelida*) におけるノミハムシ、ウリハムシ、ルートワーム、ハ
 ムシ、コロラドハムシ、及びハモグリムシ (例えば、コロラドハムシ (コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) Say)、ウェスタンコーンル
 ートワーム (ジアブロチカ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera*) LeConte))；コガネムシ科 (*Scarabaeidae*) からのコガネムシ及
 び他の甲虫 (例えば、マメコガネ (マメコガネ (*Popillia japonica*) Newman)、セマダラコガネ (アノマラ・オリエンタリス (*Anomala orientalis*) Waterhouse、北部コガネカブト (シクロセファラ・ボレアリス (*Cyclocephala borealis*) Arrow)、南部コガネカブト (シ
 クロセファラ・イマキュラタ (*Cyclocephala immaculata*) Olivier又はC. *lurida* Bland)、フンコロガシ及び地虫 (マグソコガ
 ネ属 (*Aphodius*) の種)、クソコガネの1種 (アタエニウス・スプレツルス (*Ataenius spretulus*) Haldeman)、アオコフキコガネ (コチニ
 ス・ニチダ (*Cotinis nitida*) Linnaeus)、アカビロウドコガネ (アカビロウドコガネ (*Maladera castanea*) Arrow)、コフキコ
 ガネ (フィロファガ (*Phyllophaga*) 種) 及びヨーロッパコガネムシ (リオト
 ウス・マジャリス (*Riotous majalis*) Razoumowsky))；カ
 ツオブシムシ科 (*Dermestidae*) からのカツオブシムシ；コメツキムシ科 (*Elateridae*) からのコメツキムシ幼虫；クイムシ科 (*Scolytidae*)
 からのクイムシ、及びゴミムシダマシ科 (*Tenebrionidae*) からのコクヌ
 ストモドキが含まれる。

20

30

40

【0350】

さらに、農学的及び非農学的有害生物には、クギヌキハサミムシ科 (*Forficulidae*) からのハサミムシ (例えば、ヨーロッパハサミムシ (フォルフィキュラ・オー
 リキュラリア (*Forficula auricularia*) Linnaeus)、ブ

50

ラックハサミムシ（チェリソチェス・モリオ（*Chelisothes morio*）Fabricius）を含めた革翅目（Dermaptera）の卵、成虫及び幼虫；半翅目（Hemiptera）、例えば、メクラカメムシ科（Miridae）からのカシミカメムシ、セミ科（Cicadidae）からのセミ、オオヨコバイ科（Cicadellidae）からのリーフホッパー（例えば、ミドリヒメヨコバイ属（*Empoasca*）の種）、トコジラミ科（Cimicidae）からのトコジラミ（例えば、シメックス・レクチュラリウス（*Cimex lectularius*）Linnaeus）、ピワハゴロモ科（Fulgoridae）及びウンカ科（Delphacidae）からのウンカ、ツノゼミ科（Membracidae）からのツノゼミ、ヒラズキジラミ科（Liviidae）、キジラミ科（Psyllidae）及びトガリキジラミ科（Triozidae）からのキジラミ、コナジラミ科（Aleyrodidae）からのコナジラミ、アブラムシ科（Aphididae）からのアブラムシ、ネアブラムシ科（Phylloxeridae）からのネアブラムシ、コナカイガラムシ科（Pseudococcidae）からのコナカイガラムシ、カタカイガラムシ科（Coccidae）、マルカイガラムシ科（Diaspididae）及びワタフキカイガラムシ科（Margarodidae）からのカイガラムシ、グンバイムシ科（Tingidae）からのグンバイムシ、カメムシ科（Pentatomidae）からのカメムシ、アメリカコバネナガカメムシ（例えば、毛深いアメリカコバネナガカメムシ（ブリサス・ロイコプテルス・ヒルツス（*Blissus leucopterus hirtus*）Montandon）及び南部アメリカコバネナガカメムシ（ブリサス・インスラリス（*Blissus insularis*）Barber））並びにナガカメムシ科（Lygaeidae）からの他のシードバグ、アワフキムシ科（Cercopidae）からのアワフキムシ、ヘリカメムシ科（Coreidae）からのヘリカメムシ、並びにホシカメムシ科（Pyrrhocoridae）からのアカホシカメムシ及びコットンステイナーの卵、幼体、成虫及び若虫が含まれる。

10

20

30

40

50

【0351】

農学的及び非農学的有害生物にはまた、ダニ目（Acarari）（ダニ）、例えば、ハダニ科（Tetranychidae）におけるハダニ及びアカダニ（例えば、ヨーロッパアカダニ（リングハダニ（*Panonychus ulmi*）Koch）、ナミハダニ（ナミハダニ（*Tetranychus urticae*）Koch）、McDanielハダニ（テトラニクス・マクダニエリ（*Tetranychus mcdanieli*）McGregor））；ヒメハダニ科（Tenuipalpidae）におけるフラットダニ（例えば、シトラスフラットダニ（ブドウヒメハダニ（*Brevipalpus lewisii*）McGregor））；フシダニ科（Eriophyidae）におけるサビダニ及び芽ダニ、及び他の葉面摂食ダニ、及びヒト及び動物の健康において重要なダニ、すなわち、トリハダダニ科（Epidermoptidae）におけるチリダニ、ニキビダニ科におけるニキビダニ、ニクダニ科（Glycyphagidae）におけるコナダニ；カタダニとして一般に知られるマダニ科（Ixodidae）におけるダニ（例えば、シカダニ（イクソデス・スカブラリス（*Ixodes scapularis*）Say）、オーストラリアまひダニ（イクソデス・ホロシクルス（*Ixodes holocyclus*）Neumann）、アメリカイヌダニ（デルマセクター・バリアビリス（*Dermacentor variabilis*）Say）、ローンスターダニ（アンブリオマ・アメリカナム（*Amblyomma americanum*）Linnaeus））、及びヒメダニとして一般に知られるヒメダニ科（Argasidae）におけるダニ（例えば、回帰熱ダニ（オルニトドロス・ツリカタ（*Ornithodoros turicata*）Duges）、一般家禽ダニ（アルガス・ラジアツス（*Argas radiatus*）Railliet））；キュウセンダニ科（Psoroptidae）、シラミダニ科（Pyemotidae）、及びヒゼンダニ科（Sarcoptidae）におけるヒゼンダニ及び疥癬虫の卵、幼虫、若虫及び成虫；バッタ、ワタリバッタ及びコオロギ（例えば、移住性バッタ（例えば、メラノプラス・サングイニペス（*Melanopl*

us sanguinipes) Fabricius、M. ディファレンシャルリス (M. differentialis) Thomas)、アメリカバッタ (例えば、シストセルカ・アメリカナ (Schistocerca americana) Drury)、砂漠ワタリバッタ (サバクトビバッタ (Schistocerca gregaria) Forsskal)、移住性ワタリバッタ (ロクスタ・ミグラトリア (Locusta migratoria) Linnaeus)、ブッシュワタリバッタ (ゾノセラス (Zonocerus) 種)、イエコオロギ (アセタ・ドメスチクス (Acheta domesticus) Linnaeus)、ケラ (例えば、黄褐色ケラ (スカプテリスクス・ビシナス (Scapteriscus vicinus) Scudder) 及び南部ケラ (スカプテリスクス・ボレリイ (Scapteriscus borellii) Giglioli-Tos)) を含めた直翅目 (Orthoptera) の卵、成虫及び幼体；

ハモグリムシ (例えば、リリオミザ属 (Liriomyza) の種、例えば、マメ野菜ハモグリムシ (トマトモグリバエ (Liriomyza sativae) Blanchard))、ミジ、ショウジョウバエ (ミバエ科 (Tephritidae))、キモグリ (例えば、オスシネラ・フリット (Oscinella frit) Linnaeus)、ソイルマゴット、イエバエ (例えば、イエバエ (Musca domestica) Linnaeus)、小イエバエ (例えば、ファンニア・カニクラリス (Fannia canicularis) Linnaeus、F. フェモラリス (F. femoralis) Stein)、サシバエ (例えば、サシバエ (Stomoxys calcitrans) Linnaeus)、フェースフライ、ノサシバエ、クロバエ (例えば、オビキンバエ属 (Chrysomya) の種、ホルミア (Phormia) 種)、及び他のキンバエ有害生物、ウマバエ (例えば、アブ属 (Tabanus) の種)、ウマバエ (例えば、ウマバエ属 (Gasterophilus) の種、オエストルス (Oestrus) 種)、ウシバエ (例えば、ヒフバエ属 (Hypoderma))、メクラアブ (例えば、クリソップス (Chrysops) 種)、ヒツジシラミバエ (例えば、メロファグス・オビヌス (Melophagus ovinus) Linnaeus) 及び他の短角類、カ (例えば、ヤブカ属 (Aedes) の種、ハマダラカ属 (Anopheles) の種、イエカ属 (Culex) の種)、ブヨ (例えば、プロシムリウム (Prosimulium) 種、シムリウム属 (Simulium) の種)、ヌカカ、スナバエ、クロバネキノコバエ、並びにネギアザミウマ (ネギアザミウマ (Thrips tabaci) Lindeman)、ヒラズハナアザミウマ (フランクリニエラ属 (Frankliniella) の種)、及び他の葉面摂食アザミウマを含めた他の糸角類を含めた双翅目 (Diptera) の卵、成虫及び幼体；アザミウマ目 (Thysanoptera) の卵、成虫及び幼体；フロリダオオアリ (カムポノツス・フロリダヌス (Camponotus floridanus) Buckley)、アカオオアリ (カムポノツス・フェルギネウス (Camponotus ferrugineus) Fabricius)、クロオオアリ (カムポノツス・ペンシルバニクス (Camponotus pennsylvanicus) De Geer)、シロアシアリ (テクノミルメックス・アルビペス (Technomyrmex albipes) F. Smith)、オオアタマアリ (フェイドール (Pheidole) 種)、ゴーストアリ (タピノマ・メラノセファラム (Tapinoma melanocepalum) Fabricius) を含めたアリ科 (Formicidae) のアリを含めた膜翅目 (Hymenoptera) の害虫；イエヒメアリ (モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis) Linnaeus)、チビヒアリ (ワスマニア・アウロプンクタータ (Wasmannia auropunctata) Roger)、ヒアリ (ソレノプシス・ゲミナタ (Solenopsis geminata) Fabricius)、アカヒアリ (ソレノプシス・インビクタ (Solenopsis invicta) Buren)、アルゼンチンアリ (イリドミルメックス・フミリス (Iridomyrmex humilis) Mayr)、クレイジーアリ (パラトレキナ・ロングコルニス (Paratrechina longicornis) Latreille)、ペイブメントアリ (テトラモリウム・カエスピツム (Tet

10

20

30

40

50

ramorium caespitum) Linnaeus)、トウモロコシ畑アリ (ラシウス・アリエヌス (Lasius alienus) Forster) 及び臭いのあるイエアリ (タビノマ・セシル (Tapinoma sessile) Say) が含まれる。ハチ (クマバチを含めた)、スズメバチ、イエロー・ジャケット、カリバチ、及びハバチ (ネオジプリオン属 (Neodiprion) の種を含めた他の膜翅目 (Hymenoptera) ; セフス属 (Cephus) の種) ; シロアリ科 (Termitidae) におけるシロアリ (例えば、マクロテルメス属 (Macrotermes) の種、オドントテルメス・オベサス (Odontotermes obesus) Rambur)、レイビシロアリ科 (Kalotermitidae) (例えば、クリプトテルメス属 (Cryptotermes) の種)、及びミゾガシラシロアリ科 (Rhinotermitidae) (例えば、レチクリテルメス属 (Reticulitermes) の種、コプトテルメス属 (Coptotermes) の種、ヘテロテルメス・テヌイス (Heterotermes tenuis) Hagen)、東部地下シロアリシロアリ (レチクリテルメス・フラビペス (Reticulitermes flavipes) Kollar)、西部地下シロアリ (レチクリテルメス・ヘスペルス (Reticulitermes hesperus) Banks)、イエシロアリ (コプトテルメス・ホルモサヌス (Coptotermes formosanus) Shiraki)、ウエストインディアンドライウッドシロアリ (インシシテルメス・イミグランス (Incisitermes immigrans) Snyder)、パウダーポストシロアリ (クリプトテルメス・ブレビス (Cryptotermes brevis) Walker)、ドライウッドシロアリ (インシシテルメス・スナイデリ (Incisitermes snyderi) Light)、南東部地下シロアリ (レチクリテルメス・バージニカス (Reticulitermes virginicus) Banks)、西部ドライウッドシロアリ (インシシテルメス・ミノル (Incisitermes minor) Hagen)、樹上シロアリ、例えば、ナスティテルメス属 (Nasutitermes) の種及び経済的に重要な他のシロアリを含めた等翅目 (Isoptera) の害虫 ; 総尾目 (Thysanura) の害虫、例えば、シミ (レピスマ・サッカリナ (Lepisma saccharina) Linnaeus) 及びマダラシミ (テルモビア・ドメスチカ (Thermobia domestica) Packard) ; アタマジラミ (ペジクルス・フマヌス・カピチス (Pediculus humanus capitis) De Geer)、コロモジラミ (ペジクルス・フマヌス (Pediculus humanus) Linnaeus)、ニワトリジラミ (メナカンタス・ストラミネウス (Menacanthus stramineus) Nitzsch)、犬刺咬シラミ (トリコデクテス・カニス (Trichodectes canis) De Geer)、綿毛状シラミ (ゴニオコテス・ガリナエ (Goniocotes gallinae) De Geer)、ヒツジジラミ (ボビコラ・オビス (Bovicola ovis) Schrank)、ウシジラミ (ウシジラミ (Haematopinus eurysternus) Nitzsch)、ハナナガウシジラミ (リノグナツス・ビツリ (Linognathus vituli) Linnaeus) 並びにヒト及び動物を攻撃する他の吸血及び刺咬寄生性シラミを含めたハジラミ目 (Mallophaga) 及びシラミ目 (Phthiraptera) の害虫 ; オリエンタルラットノミ (ケオピスネズミノミ (Xenopsylla cheopis) Rothschild)、ネコノミ (シテノセファリデス・フェリス (Ctenocephalides felis) Bouche)、イヌノミ (シテノセファリデス・カニス (Ctenocephalides canis) Curtis)、ニワトリノミ (セラトフィラス・ガリナエ (Ceratophyllus gallinae) Schrank)、吸着ノミ (エキドノファガ・ガリナセア (Echidnophaga gallinacea) Westwood)、ヒトノミ (プレックス・イリタンス (Pulex irritans) Linnaeus) 及び哺乳動物及び鳥に影響を及ぼす他のノミを含めたノミ目 (Siphonoptera) の害虫。カバーされるさらなる節足動物有害生物には、真正クモ目 (Araneae) におけるクモ、例え

10

20

30

40

50

ば、ドクイトグモ（ロクススセレス・レクルーサ（*Loxosceles reclusa*）Gertsch & Mulaik）及びクロゴケグモ（ラトロデクツス・マクタン（*Latrodectus mactans*）Fabricius）、並びにゲジ目（*Scutigera*）におけるムカデ、例えば、イエムカデ（スクチゲラ・コレオプトラタ（*Scutigera coleoptrata*）Linnaeus）が含まれる。

【0352】

貯蔵した穀物の無脊椎有害生物の例には、ナガシンクイムシ（プロステファヌス・トルンカツス（*Prostephanus truncatus*）Horn）、コナナガシンクイムシ（リゾペルタ・ドミニカ（*Rhyzopertha dominica*）Fabricius）、ライスゾウムシ（シトフィラス・オリザエ（*Sitophilus oryzae*）Linnaeus）、トウモロコシゾウムシ（シトフィラス・ゼアマイス（*Sitophilus zeamais*）Motschulsky）、ヨツモンマメゾウムシ（カロソブルーカス・マキュラタス（*Callosobruchus maculatus*）Fabricius）、コクヌストモドキ（トリボリウム・カスターネウム（*Tribolium castaneum*）Herbst）、穀物倉ゾウムシ（シトフィラス・グラナリウス（*Sitophilus granarius*）Linnaeus）、ノシメダラメイガ（プロディア・インタープンクテラ（*Plodia interpunctella*）Huebner）、地中海コクヌストモドキ（エフェスチア・クエーニエラ（*Ephestia kuehniella*）Zeller）及びクムネコクヌスト又はサビカクムネヒラタムシ（クリプトレストス・フェルギノイス（*Cryptolestes ferrugineus*）Stephens）が含まれる。

【0353】

本開示の化合物は、経済的に重要な農業有害生物（すなわち、メロイドギネ属（*Meloidogyne*）の根瘤線形動物、プラチレンクス属（*Pratylenchus*）のネグサレセンチュウ（*lesion nematodes*）、トリコドルス属（*Trichodorus*）のユミハリセンチュウ（*stubby root nematodes*）など）並びに動物及びヒト健康有害生物（すなわち、馬における普通円虫（*Strongylus vulgaris*）、犬におけるイヌ回虫（*Toxocara canis*）、羊における捻転胃虫（*Haemonchus contortus*）、犬における犬糸状虫（*Dirofilaria immitis* Leidy）、馬における寄生蠕虫類（*Anoplocephala perfoliata*）、反すう動物における肝テツ（*Fasciola hepatica* Linnaeus）などの、すべての経済的に重要な吸虫、条虫、及び回虫など）などの、しかしそれらに限定されない円虫目、カイチュウ目、蟯虫、桿線虫目、旋尾線虫目、及びエノプルス目の商業的に重要なメンバーを含む線虫綱、条虫綱、吸虫綱、及びこう頭虫綱のメンバーへの活性を有する可能性がある。

【0354】

本開示の化合物は、鱗翅目の有害生物（例えば、アラバマ・アルギラセア（*Alabama argillacea*）Huebner（コットンリーフワーム）、アルキプス・アルギロスピラ（*Archips argyrospila*）Walker（フルーツツリーリーフローラー）、*A. rosana*（*A. rosana*）Linnaeus（ヨーロッパリーフローラー）及び他のアルキプス種、チロ・スプレッサリス（*Chilo suppressalis*）Walker（ライスステムボラー）、クナファロクロシス・メジナリス（*Cnaphalocrosis medinalis*）Guenee（ライスリーフローラー）、クランブス・カリギノセルラス（*Crambus caliginosellus*）Clemens（コーンルートウェブワーム）、クランブス・テテレルス（*Crambus teterellus*）Zincken（ブルーグラスウェブワーム）、シディア・ポモネラ（*Cydia pomonella*）Linnaeus（コドリンガ）、エアリアス・インスラナ（*Earias insulana*）Boisduval（スパイニーボウルワーム）、エアリアス・ビッテラ（*Earias vittella*

) Fabricius (スポテッドボウルワーム)、ヘリコヴェルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*) Huebner (オールドワールド・ボウルワーム)、ヘリコヴェルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*) Boddie (アメリカタバコガの幼虫)、ヘリオティス・ビレスセンス (*Heliothis virescens*) Fabricius (ニセアメリカタバコガ)、ヘルペトグランマ・リカルシサリス (*Herpetogramma licarsialis*) Walker (ソッドウェブワーム)、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*) Denis & Schiffermüller (グレープベリー蛾)、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*) Saunders (ワタアカミムシガの幼虫)、フィロクニスティス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*) Stainton (ミカンハモグリバエ)、ピエリス・ブラシカエ (*Pieris brassicae*) Linnaeus (ラージホワイタバタフライ)、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*) Linnaeus (スモールホワイタバタフライ)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) Linnaeus (コナガ)、スポドプテラ・エグジグア (*Spodoptera exigua*) Huebner (シロイチモンジョトウ)、スポドプテラ・リツラ (*Spodoptera litura*) Fabricius (ハスモンヨトウ、クラストーいも虫)、スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) J. E. Smith (ツマジロクサヨトウ)、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*) Huebner (キャベツシャクトリムシ) 及びツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*) Meyrick (トマトハモグリバエ) に対して活性を有する可能性がある。

10

20

【0355】

本開示の化合物は、エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum*) Harris (エンドウヒゲナガアブラムシ)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*) Koch (ササゲアブラムシ)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*) Scopolii (クロマメアブラムシ)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) Glover (ワタアブラムシ、メロンアブラムシ)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*) De Geer (リンゴアブラムシ)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*) Patch (スピレアアブラムシ)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*) Kaltenbach (フォックスグローブアブラムシ)、イチゴケナガアブラムシ (*Chaetosiphon fragaefolii*) Cockerell (イチゴアブラムシ)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*) Kurdjumov/Mordvilko (ロシアコムギアブラムシ)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*) Passerini (バラ色リンゴアブラムシ)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*) Hausmann (リンゴワタムシ)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*) Geoffroy (ミーリーアブラムシ)、リパフィス・プソイドブラシカ (*Lipaphis pseudobrassicae*) Davis (ニセダイコンアブラムシ)、メトポロフィウム・ジルホズム (*Metopolophium dirrhodum*) Walker (穀物アブラムシ)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*) Thomas (ジャガイモアブラムシ)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) Sulzer (モモジャガイモアブラムシ、モモアカアブラムシ)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*) Mosley (レタスアブラムシ)、天疱瘡 (*Pemphigus*) 種 (根アブラムシ及びコブアブラムシ)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis*) Fitch (トウモロコシアブラムシ)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*) Linnaeus (バードチェリーオートアブラムシ)、シザフィス・グラミナム (*Schizaphis graminum*) Rondani (ムギミドリアブラ

30

40

50

ムシ)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) Fabricius (イングリッシュグレインアブラムシ)、テリオアフィス・マクラタ (*Therioaphis maculata*) Buckton (スポテッドアルファルファアブラムシ)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*) Boyer de Fonscolombe (黒ミカンアブラムシ)、及びトキソプテラ・シトリシズス (*Toxoptera citricidus*) Kirkaldy (茶ミカンアブラムシ); アデルゲス属 (*Adelges*) の種 (カサアブラムシ); フィロキセラ・デバスタトリクス (*Phylloxera devastatrix*) Pergande (ペカンフィロキセラ); タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*) Gennadius (タバココナジラミ、サツマイモコナジラミ)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*) Bellows & Perring (シルバーリーフコナジラミ)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*) Ashmead (ミカンコナジラミ) 及びオンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*) Westwood (オンシツコナジラミ); エンポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*) Harris (ポテトリーフホッパー)、ラオデルファックス・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*) Fallen (スモラーブラウンプラントホッパー)、マクロレステス・クアドリリネアツス (*Macrostelus quadrilineatus*) Forbes (アスターリーフホッパー)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) Uhler (グリーンリーフホッパー)、ネフォテティクス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*) Stal (ライスリーフホッパー)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) Stal (ブラウンプラントホッパー)、ペレグリヌス・マイディス (*Peregrinus maidis*) Ashmead (コーンプラントホッパー)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) Horvath (ホワイバックドプラントホッパー)、タゴソデス・オリジコルス (*Togodes orizicolus*) Muir (ライスデルファシッド)、ティフロシバ・ポマリア (*Typhlocyba pomaria*) McAtee (ホワイアップルリーフホッパー)、エリトロネウラ属 (*Erythroneura*) の種 (ブドウリーフホッパー); マギシダダ・セプテンデシム (*Magicidada septendecim*) Linnaeus (周期ゼミ); イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi*) Maskell (ワタフキカイガラムシ)、クアドラスピディオツス・ペルニシオサス (*Quadraspidiotus perniciosus*) Comstock (サンホセカイガラムシ); ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*) Risso (ミカンコナカイガラムシ); シュードコッカス属 (*Pseudococcus*) の種 (他のコナカイガラムシ複合体); カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*) Foerster (セイヨウナシキジラミ)、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza diospyri*) Ashmead (カキキジラミ) を含めた半翅目 (*Hemiptera*) からのメンバーに対してかなりの活性を有する。

【0356】

本開示の化合物はまた、アクロステルナム・ヒラレ (*Acrosternum hilare*) Say (アオカメムシ)、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*) De Geer (ヘリカメムシ)、ブリサス・ロイコプテラス・ロイコプテラス (*Bliissus leucopterus leucopterus*) Say (アメリカコバネナガカメムシ)、シメックス・レクチュラリウス (*Cimex lectularius*) Linnaeus (トコジラミ) コリツカ・ゴッシピイ (*Corythucha gossypii*) Fabricius (コットンレースバグ)、シルトペルチス・モデスタ (*Cyrtopeltis modesta*) Distant (トマトバグ)、ディスデルカス・スツレルス (*Dysdercus suturellus*) Herrich-Schaffer (コットンステイナー)、オイスキスツス・セルブス (*Euschistus servus*) Say (ブラウンカメムシ)、オイスキスツス・バリオラリウス (

10

20

30

40

50

Euschistus variolarius) Palisot de Beauvois (ワンスポットドカメムシ)、ヒメマダラナガカメムシ属 (*Graptostethus*) の種 (シードバグの複合体)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*) Stal (ブラウン大理石様カメムシ)、レプトグロッサス・コルクルス (*Leptoglossus corculus*) Say (リーフフーティッドパインシードバグ)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*) Palisot de Beauvois (ミドリメクラガメ)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*) Linnaeus (ミナミアオカメムシ)、オエバラス・プグナクス (*Oebalus pugnax*) Fabricius (ライスカメムシ)、オンコペルタス・ファシアタス (*Oncopeltus fasciatus*) Dallas (ラージミルクウィードバグ)、シューダトモスセリス・セリアツス (*Pseudatomoscelis seriatus*) Reuter (コットンフリーホッパー) を含めた半翅目 (Hemiptera) からのメンバーに対して活性を有する。本開示の化合物によって防除される他の昆虫目には、アザミウマ目 (Thysanoptera) (例えば、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) Pergande (ミカンキイロアザミウマ)、シルトトリプス・シトリ (*Scirtothrips citri*) Moulton (ミカンアザミウマ)、シルトトリプス・バリアビリス (*Scirtothrips variabilis*) Beach (ダイズアザミウマ)、及びネギアザミウマ (*Thrips tabaci*) Lindeman (ネギアザミウマ)) ; 並びに甲虫目 (Coleoptera) (例えば、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) Say (コロラドハムシ)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna varivestis*) Mulsant (インゲンテントウ)、及びアグリオテス属 (*Agriotes*)、アトウス属 (*Athous*) 又はリモニウス属 (*Limonius*) のコメツキムシ幼虫) が含まれる。

10

20

30

40

50

【0357】

注目すべきは、ミカンキイロアザミウマ (フランクリニエラ・オクシデンタリス (*Frankliniella occidentalis*)) を防除するための、本開示の化合物の使用である。注目すべきは、ポテトリーフホッパー (エンポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)) を防除するための、本開示の化合物の使用である。注目すべきは、ワタアブラムシ (アフィス・ゴシピイ (*Aphis gossypii*)) を防除するための、本開示の化合物の使用である。注目すべきは、モモアカアブラムシ (グリーンピーチアフィド (*Myzus persicae*)) を防除するための、本開示の化合物の使用である。注目すべきは、タバココナジラミ (sweet potato whitefly) (ベミシア・タバチ (*Bemisia tabaci*)) を防除するための、本開示の化合物の使用である。

【0358】

本開示の化合物はまた、作物の成長力を高めるのに有用であり得る。本方法は、作物 (例えば、群葉、花、果実若しくは根) 又は作物がそれから成長する種子を、所望の植物成長力効果を達成するのに十分な量 (すなわち、生物学的有効量) の式 1 の化合物と接触させる工程を含む。典型的には式 1 の化合物は、調合組成物で適用される。式 1 の化合物は多くの場合作物又はその種子に直接適用されるが、それはまた、作物の場所、すなわち、作物の環境、特に式 1 の化合物を作物に移動させるのに十分に接近した環境の部分に適用される。本方法にとって適切な場所は、最も一般的には成長培地 (すなわち、植物に栄養物を提供する媒体)、典型的には植物がそこで成長する土壌を含む。作物の成長力を高めるための作物の処理はしたがって、作物、作物がそれから成長する種子又は作物の場所を、生物学的有効量の式 1 の化合物と接触させる工程を含む。

【0359】

高められた作物成長力は、以下の観察される効果の 1 つ若しくは複数をもたらすことができる: (a) 優れた種子発芽、作物出現及び作物群生によって実証されるような最適作物体系; (b) 速い及び頑丈な葉成長 (例えば、葉面積指数によって測定される)、植物

高さ、ひこばえの数（例えば、イネについて）、根塊及び作物の植物塊の全体乾燥重量によって実証されるような高められた作物成長；（c）開花までの時間、開花の継続時間、花の数、総バイオマス蓄積（すなわち、収穫高）及び／又は農産物の果実若しくは穀物品位市場性（すなわち、収穫品質）によって実証されるような、改善された作物収量；（d）植物病気感染及び節足動物、線形動物又は軟体動物有害生物まん延に耐える又はそれらを防ぐ作物の高められた能力；並びに（e）極端な熱、準最適な湿気又は植物毒素化学薬品への暴露などの環境ストレスに耐える作物の高められた能力。

【0360】

本開示の化合物は、殺すか又は別のやり方で植物の環境での植食性の無脊椎有害生物の摂食を防ぐことによって未処理植物と比べて処理植物の成長力を高め得る。植食性の無脊椎有害生物のそのような駆除の不在下で、有害生物は、植物組織若しくは樹液を消費するか、又はウィルスなどの植物病原菌をうつすことによって植物成長力を低下させる。植食性の無脊椎有害生物の不在下でさえも、本開示の化合物は、植物の代謝を修正することによって植物成長力を高め得る。一般に、作物の成長力は、非理想的な環境、すなわち、それが理想的な環境で示すであろう最大限の遺伝子的ポテンシャルを達成する植物に不利な1つ若しくは複数の態様を含む環境で植物が成長させられる場合に、植物を本開示の化合物で処理することによって最も顕著に高められるであろう。

【0361】

作物が植食性の無脊椎有害生物を含む環境中で成長させられる作物の成長力を高める方法に注目すべきである。作物が植食性の無脊椎有害生物を含まない環境中で成長させられる作物の成長力を高める方法にも注目すべきである。作物が作物の成長を支えるのに理想的なものよりも少ない水分量を含む環境中で成長させられる作物の成長力を高める方法にも注目すべきである。作物がイネである作物の成長力を高める方法に注目すべきである。作物がトウモロコシ（コーン）である作物の成長力を高める方法にも注目すべきである。作物が大豆である作物の成長力を高める方法にも注目すべきである。

【0362】

本開示の化合物はまた、殺虫剤、殺真菌剤、抗線虫剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、除草剤、除草剤解毒剤、成長調整物質、例えば昆虫脱皮阻害剤及び発根刺激剤など、不妊化剤、情報物質、忌避剤、誘引物質、フェロモン、摂食刺激剤、他の生物学的に活性な化合物若しくは昆虫病原性細菌、さらにより幅広いスペクトルの農学的及び農学的有用性を与える多成分殺有害生物剤を形成するためのウィルス若しくは真菌類を含む1つ若しくは複数の他の生物学的に活性な化合物若しくは試剤と混合することができる。したがって、本開示はさらに、生物学的有効量の式1の化合物、界面活性剤、固体希釈剤、及び液体希釈剤からなる群より選択される少なくとも1種の追加の成分、並びに少なくとも1種の追加の生物活性化合物又は生物活性薬剤を含む、組成物にも関する。本開示の混合物では、他の生物活性化合物又は薬剤を、本発明の化合物（式1の化合物）とともに配合して、プレミックスを形成させることが可能であるか、又は、他の生物活性化合物又は薬剤を、本発明の化合物（式1の化合物を含む）とは別途に配合して、その2種の配合物を共に（例えば、噴霧タンク中で）組み合わせた後で施用するか、又は別な方法として、順次に施用することも可能である。

【0363】

本開示の化合物とともに配合することが可能なそのような生物活性化合物又は薬剤の例は、例えば、以下の殺虫剤である：アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロペン（〔（3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS）-3-〔（シクロプロピルカルボニル）オキシ〕-1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b-デカヒドロ-6, 12-ジヒドロキシ-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-4-イル〕メチルシクロプロパンカルボキシレート）、アミドフルメット、アミトラズ、エバーメクチン、アザジラクチン、アジンホスメチル、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ピフェントリン、ピフェ

ナゼート、ビストリフルロン、ホウ酸塩、ブプロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、カルゾル、クロルアントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クロマフェノジド、クロフェンテジン、クロチアニジン、シアントラニリプロール（3-ブプロモ-1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-N-[4-シアノ-2-メチル-6-[(メチルアミノ)カルボニル]フェニル]-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド）、シクラニリプロール（3-ブプロモ-N-[2-ブプロモ-4-クロロ-6-[[（1-シクロプロピルエチル）アミノ]カルボニル]フェニル]-1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド）、シクロプロトリン、シクロキサプリド（（5S, 8R）-1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-9-ニトロ-5, 8-エポキシ-1H-イミダゾ[1, 2-a]アゼピン）、シフルメトフェン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ガンマー-シハロトリン、ラムダシハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ゼータ-シペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ジエルドリン、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメヒボ、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンブロックス、エトキサゾール、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン（2-エチル-3, 7-ジメチル-6-[4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル]- α -(メトキシメチレン)ベンゼンアセテート）、フルフェンスルホン（5-クロロ-2-[(3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテン-1-イル)スルホニル]チアゾール）、フルヘキサフォン、フルオピラム、フルピプロール（1-[2, 6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-[(2-メチル-2-プロペン-1-イル)アミノ]-4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]-1H-ピラゾール-3-カルボニトリル）、フルピラジフロ（4-[[（6-クロロ-3-ピリジニル）メチル]（2, 2-ジフルオロエチル）アミノ]-2（5H）-フラノン）、フルバリネート、タウフルバリネート、フォノホス、ホルメタネート、フォスチアゼート、ハロフェノジド、ヘプタフルトリン（[2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)フェニル]メチル 2, 2-ジメチル-3-[(1Z)-3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロペン-1-イル]シクロプロパンカルボキシレート）、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、殺虫性石鹸、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メペルフルトリン（[2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)フェニル]メチル（1R, 3S）-3-（2, 2-ジクロロエチル）-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート）、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メチオディカルブ、メソミル、メトプレ、メトキシクロル、メトフルトリン、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノクロトホス、モノフルオロトリン（[2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)フェニル]メチル 3-（2-シアノ-1-プロペン-1-イル）-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート）、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオンメチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルガイト、プロトリフェンブテ、ピフルブミド（1, 3, 5-トリメチル-N-（2-メチル-1-オキソプロピル）-N-[3-（2-メチルプロピル）-4-[[2, 2, 2-トリフルオロ-1-メトキシ-1-（トリフルオロメチル）エチル]フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド）、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン（メチル（ α E）-2-[[[2-[(2, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-（トリフル

オロメチル) - 4 - ピリミジニル] オキシ] メチル] - α - (メトキシメチレン) ベンゼンアセテート)、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフェン、スピネトラム、スピノサド、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、スルプロホス、スルホキサフロール (N - [メチルオキシド [1 - [6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジニル] エチル] - λ^4 - スルファニリデン] シアナミド)、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、ターブホス、テトラクロロビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン ([2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ - 4 - (メトキシメチル) フェニル] メチル 2, 2, 3, 3 - テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート)、テトラニリプロル、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ - ナトリウム、チオキサザフェン (3 - フェニル - 5 - (2 - チエニル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール)、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロロホン、トリフルメゾピリム (2, 4 - ジオキソ - 1 - (5 - ピリミジニルメチル) - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2 H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジニウム分子内塩)、トリフルムロン、バチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルターエンドトキシン、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウイルス、及び昆虫病原性真菌。

10

【0364】

注目すべきは、例えば以下の殺虫剤である：アバメクチン、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロベン、アミトラズ、エパーメクチン、アザジラクチン、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ピフェントリン、ブプロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルタップ、クロルアントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロル、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダシハロトリン、シベルメトリン、アルファシベルメトリン、ゼーターシベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジエルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エトキサゾール、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルフェノクスロン、フルフェンオキシストロビン、フルフェンスルホン、フルピプロル、フルピラジフロン、フルバリネート、ホルメタネート、フォスチアゼート、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、ルフェヌロン、メベルフルトリン、メタフルミゾン、メチオジカルブ、メソミル、メトプレン、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノフルオロトリン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピフルブミド、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリミノストロビン、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、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、スルホキサフロール、テブフェノジド、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ - ナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルターエンドトキシン、バチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) のすべての菌株、及び核多角体病ウイルスのすべての菌株。

20

30

40

【0365】

本開示の化合物と混合するための生物学的作用物質の一実施形態には、バチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*)、及び CellCap (登録商標) プロセスによって製造される MVP (登録商標) 及び MVP II (登録商標) バイオ殺虫剤 (CellCap (登録商標)、MVP (登録商標) 及び MVP II (登録商標) は、Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA の商標である) などのバチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) のカプセル化デルターエンドトキシンなどの昆

50

虫病原性細菌；黒きょう病菌などの昆虫病原性真菌類；及びバキュロウィルス、核多核体病ウィルス（NPV）、例えばアメリカタバコガ（*Helicoverpa zea*）多核体病ウィルス（HzNPV）、アナグラファ・ファルシフェラ（*Anagrapha falcifera*）多核体病ウィルス（AfNPV）などを含む昆虫病原性（天然に存在する及び遺伝子操作されたの両方の）ウィルス；並びにシディア・ポモネラ（*Cydia pomonella*）グラニュロシスウィルス（CpGV）などのグラニュロシスウィルス（GV）が含まれる。

【0366】

本開示の化合物と混合するための生物学的作用物質の一実施形態は、（i）アクチノマイセス属（*Actinomycetes*）、アグロバクテリウム属（*Agrobacterium*）、アルスロバクター属（*Arthrobacter*）、アルカリゲネス属（*Alcaligenes*）、オーレオバクテリウム属（*Aureobacterium*）、アゾバクター属（*Azobacter*）、バチルス属（*Bacillus*）、ベイエリンクシア属（*Beijerinckia*）、ブラディリゾビウム属（*Bradyrhizobium*）、ブレビバチルス属（*Brevibacillus*）、バークホルデリア属（*Burkholderia*）、クロモバクテリウム属（*Chromobacterium*）、クロストリジウム属（*Clostridium*）、クラビバクター属（*Clavibacter*）、コマモナス属（*Comamonas*）、コリネバクテリウム属（*Corynebacterium*）、クルトバクテリウム属（*Curtobacterium*）、エンテロバクター属（*Enterobacter*）、フラボバクテリウム属（*Flavobacterium*）、グルコノバクター属（*Gluconobacter*）、ハイドロゲノファーガ属（*Hydrogenophaga*）、クレブシエラ属（*Klebsiella*）、メチロバクテリウム属（*Methylobacterium*）、パエニバチルス属（*Paenibacillus*）、パストリア属（*Pasteuria*）、フォトラブダス属（*Photorhabdus*）、フィロバクテリウム属（*Phyllobacterium*）、シュードモナス属（*Pseudomonas*）、リゾビウム属（*Rhizobium*）、セラチア属（*Serratia*）、スフィンゴバクテリウム属（*Sphingobacterium*）、ステノトロホモナス属（*Stenotrophomonas*）、ストレプトマイセス属（*Streptomyces*）、バリオボラックス属（*Variovorax*）、又はゼノラブダス属（*Xenorhabdus*）の細菌、例えば、バチルス・アミロリケファシエンズ（*Bacillus amyloliquefaciens*）、バチルス・セレウス（*Bacillus cereus*）、バチルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）、バチルス・リケニホルミス（*Bacillus licheniformis*）、バチルス・プミルス（*Bacillus pumilus*）、バチルス・スファエリクス（*Bacillus sphaericus*）、枯草菌（*Bacillus subtilis*）、バチルス・チューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）、ブラディリゾビウム・ジャポニクム（*Bradyrhizobium japonicum*）、クロモバクテリウム・スブツガ（*Chromobacterium subtsugae*）、パストリア・ニシザワエ（*Pasteuria nishizawae*）、パストリア・ペネトランス（*Pasteuria penetrans*）、パストリア・ユーセジ（*Pasteuria usage*）、シュードモナス・フルオレッセンズ（*Pseudomonas fluorescens*）、及びストレプトマイセス・リジクス（*Streptomyces lydicus*）の細菌；（ii）真菌、例えば、黒きょう病菌；（iii）バキュロウィルス、核多角体病ウィルス、例えば、アメリカタバコガ（*Helicoverpa zea*）核多角体病ウィルス、アナグラファ・ファルシフェラ（*Anagrapha falcifera*）核多角体病ウィルス；顆粒病ウィルス、例えば、コドリング（*Cydia pomonella*）顆粒病ウィルスを含めたウィルスの1つ又は組合せを含む。

【0367】

他の無脊椎有害生物駆除活性成分が、異なる化学的分類に属するか、又は式1の化合物

とは異なる作用部位を有するそのような組み合わせに特に注目すべきである。ある種の場合には、類似の駆除スペクトルを有するが、異なる作用部位を有する少なくとも1つの他の無脊椎有害生物駆除活性成分との組み合わせは、耐性管理のために特に有利であろう。したがって、本開示の組成物は、類似の駆除スペクトルを有するが、異なる化学的分類に属するか又は異なる作用部位を有する生物学的有効量の少なくとも1つの追加の無脊椎有害生物駆除活性成分をさらに含むことができる。これらのさらなる生物活性化合物又は薬剤には、これらに限定されないが、アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害剤、例えば、カルバメートであるメソミル、オキサミル、チオジカルブ、トリアザメート、及び有機ホスフェートであるクロルピリホス；GABA作動性クロライドチャンネルアンタゴニスト、例えば、シクロジエンであるジエルドリン及びエンドスルファン、並びにフェニルピラゾールであるエチプロール及びフィプロニル；ナトリウムチャンネルモジュレーター、例えば、ピレスロイドであるピフェントリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、シベルメトリン、デルタメトリン、ジメフルトリン、エスフェンバレート、メトフルトリン及びプロフルトリン；ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）アゴニスト、例えば、ネオニコチノイドであるアセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ニチアジン、チアクロプリド、及びチアメトキサム、スルホキシミンであるスルホキサフル、ブテノリドであるフルピラジフロ、及びメソイオンであるトリフルメゾピリム；ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリック活性化剤、例えば、スピノシンであるスピネトラム及びスピノサド；クロライドチャンネル活性化剤、例えば、アベルメクチンであるアバメクチン及びエマメクチン；幼若ホルモン模倣物、例えば、ジオフェノラン、メトプレ、フェノキシカルブ及びピリプロキシフェン；弦音器官モジュレーター、例えば、ピメトロジン、ピリフルキナゾン及びフロニカミド；ダニ成長抑制剤、例えば、エトキサゾール；ミトコンドリアATPシンターゼの阻害剤、例えば、プロパルギット；プロトン勾配の途絶による酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナピル；ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）チャンネル遮断薬、例えば、ネライストキシシン類似体であるカルタップ；キチン生合成の阻害剤、例えば、ベンゾイル尿素であるフルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン及びトリフルムロン、及びブプロフェジン；双翅類脱皮攪乱物質、例えば、シロマジン；エクジソン受容体アゴニスト、例えば、ジアシルヒドラジンであるメトキシフェノジド及びテブフェノジド；オクトパミン受容体アゴニスト、例えば、アミトラズ；ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害剤、例えば、ハイドラメチルノン及びピフェナゼート；ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害剤、例えば、ピリダベン；電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロン酸及びテトラミン酸であるスピロジクロフェン、スピロメシフェン及びスピロテトラマト；ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害剤、例えば、β-ケトニトリルであるシエノピラフェン及びシフルメトフェン；リアノジン受容体モジュレーター、例えば、アントラニル酸ジアミドであるクロラントラニリプロール及びシアントラニリプロール、ジアミド、例えば、フルベンジアミド、及びリアノジン受容体配位子、例えば、リアノジン；生物活性に関与している標的部位が未知であるか若しくは特性決定されていない化合物、例えば、アザジラクチン及びピリダリル；昆虫中腸膜の微生物攪乱物質、例えば、バチルス・チューリングシス（*Bacillus thuringiensis*）及びこれらが産生するデルター内毒素及びバチルス・スファエリクス（*Bacillus sphaericus*）；並びに核多核体病（NPV）及び他の天然又は遺伝子改変された殺虫性ウィルスを含めた生物学的作用物質が含まれる。

【0368】

本開示の化合物をそれとともに配合することができる生物活性化合物又は薬剤のさらなる例は、殺真菌剤、例えば、アシベンゾラルーS-メチル、アルジモルフ、アメトクトラジン、アミノピリフェン、アミスルプロム、アリラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、ベナラキシル（ベナラキシル-Mを含めた）、ベンダニル、ベノミル、ベンチア

10

20

30

40

50

バリカルブ（ベンチアバリカルブーイソプロピルを含めた）、ベンゾビンジフルピル、ベ
 トキサジン、ビナブアクリル、ビフェニル、ビテルタノール、ビキサフェン、ブラストサ
 イジン－S、ボスカリド、ブロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、カルボキシ
 ン、カルプロパミド、カプタホール、キャプタン、カルベンダジム、クロロネブ、クロロ
 タロニル、クロゾリネート、水酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、クモキシストロビン、シ
 アゾファミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ジ
 クロベンチアゾクス、ジクロフルアニド、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、
 ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフルメトリム、ジメチリモール、ジメトモ
 ルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール（ジニコナゾール－Mを含めた）、ジノカッ
 プ、ジビメチトロン、ジチアノン、ジチオラン、ドデモルフ、ドジン、エコナゾール、エ
 タコナゾール、エディフェンホス、エノクサストロビン（エネストロブリンとしてまた公
 知である）、エポキシコナゾール、エタボキサム、エチリモール、エトリジアゾール、フ
 アモキサドン、フェナミドン、フェナミンストロビン、フェナリモル、フェンブコナゾ
 ール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンピコ
 キサミド、フェンプロピディン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、フェンチンア
 セタート、フェンチンヒドロキシド、ファーバム、フェリムゾン、フロメトキン、フロリ
 ルピコキサミド、フルオピモミド、フルアジナム、フルジオキソニル、フルフェノキシス
 トロビン、フルインダビル、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、フルオキサピ
 プロリン、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファ
 ミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルペッ
 ト、フサライド（フタリドとしてまた公知である）、フベリダゾール、フララキシル、フ
 ラメトビル、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、グアザチン、イマザリル、イミベンコ
 ナゾール、イミノクタジンアルベシル酸塩、イミノクタジン三酢酸塩、インピルフルキサ
 ム、イオジカルブ、イブコナゾール、イベントリフルコナゾール、イブフルフェノキン、
 イソフェタミド、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソフルシプラム
 、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、クレソキシムメチ
 ル、ランコトリオン、マンコゼブ、マンジプロパミド、マンデストロビン、マネブ、マパ
 ニピリン、メフェントリフルコナゾール、メプロニル、メプチルジノカプ、メタラキシ
 ル（メタラキシール－M／メフェノキサムを含めた）、メトコナゾール、メタスルホカルブ、
 メチラム、メトミノストロビン、メチルテトラプロール、メトラフェノン、ミクロブタニ
 ル、ナフチチン、ネオ－アソジン（メタンアルソン酸鉄）、ヌアリモール、オクチリノン
 、オフレース、オリサストロビン、オキサジキシル、オキサチアピプロリン、オキシリン
 酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシ、オキシテトラサイクリン、ペンコナゾ
 ール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ベンチオピラド、ペルフラゾエート、亜リン酸（そ
 の塩、例えば、ホセチル－アルミニウムを含めた）、ピコキシストロビン、ピペラリン、
 ポリオキシ、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロピ
 コナゾール、プロビネブ、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフ
 ルメトフェン（A d e p i d y n（登録商標））、ピラクロストロビン、ピラメトストロ
 ビン、ピラプロポイン、ピラオキシストロビン、ピラジフルミド、ピラゾホス、ピリベン
 カルブ、ピリブタカルブ、ピリダクロメチル、ピリフェノックス、ピリオフェノン、ペリ
 ソオキサゾール、ピリメタニル、ピリフェノックス、ピロールニトリン、ピロキロン、キ
 ンコナゾール、キノメチオネート、キノフメリン、キノキシフェン、キントゼン、シルチ
 オファミン、セダキサン、シメコナゾール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、
 テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクロフタラム、テクナゼン、テルビ
 ナフィン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオフアネート、チオ
 ファネート－メチル、チラム、チアジニル、トルクロホスメチル、トルプロカルブ、トリ
 フルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアリモール、トリアゾキシド、三
 塩基性硫酸銅、トリクロピリカルブ、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフル
 ミゾール、トリモブルアミドトリシクラゾール、トリフロキシストロビン、トリフォリン
 、トリチコナゾール、ウニコナゾール、バリダマイシン、バリフェナレート（バリフェナ

10

20

30

40

50

ールとしてまた公知である)、ピクロゾリン、ジネブ、ザイラム、ゾキサミド及び1-[4-[4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル]-2-チアゾリル]-1-ピペリジニル]-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン;殺線虫剤、例えば、フルオピラム、スピロテトラマト、チオジカルブ、ホスチアゼート、アバメクチン、イプロジオン、フルエンシルホン、二硫化ジメチル、チオキサザフェン、1,3-ジクロロプロペン(1,3-D)、メタム(ナトリウム及びカリウム)、ダゾメット、クロロピクリン、フェナミホス、エトプロホス、カズサホス、テルブホス、イミシアホス、オキサミル、カルボフラン、チオキサザフェン、バチルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)及びバストリア・ニシザワエ(*Pasteuria nishizawae*);殺菌剤、例えば、ストレプトマイシン;殺ダニ剤、例えば、アミトラズ、チノメチオナート、クロロベンジレート、シヘキサチン、ジコホール、ジエノクロール、エトキサゾール、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾックス、プロパルギット、ピリダベン及びテブフェンピラドである。

10

【0369】

ある特定の場において、本開示の化合物の組み合わせ ある特定の場において、本開示の化合物と他の生物活性のある(特に、無脊椎有害生物防除)化合物又は薬剤(すなわち、活性成分)との組み合わせは、増進された効果をもたらすことができる。有効な有害生物防除を確実にする一方で、環境中に放出される活性成分量を低減させることは常に望ましい。増進された無脊椎有害生物防除が農学的に満足なレベルの無脊椎有害生物防除を生じさせる散布量で起こるとき、このような組合せは、作物の生産コストを低減し、環境への負荷を減少させるのに有利であり得る。

20

【0370】

本開示の化合物及びその組成物は、無脊椎有害生物に対して毒性を持つタンパク質(例えば、バチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)デルター内毒素)を発現するように遺伝学的に形質転換された植物に適用することができる。このような適用は、より幅広いスペクトルの植物保護を実現し、且つ抵抗性制御のために有利であり得る。発現された毒素タンパク質と組み合わせた外部から適用された本開示の無脊椎有害生物防除化合物は、増進された効果を実現し得る。

【0371】

これらの農業用保護剤(すなわち、殺虫剤、殺真菌剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、除草剤及び生物学的作用物質)についての一般的参照文献には、The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2003及びThe BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2001が含まれる。

30

【0372】

本開示の化合物は、これらに限定されないが、DNA、RNA、及び/又は化学修飾されたヌクレオチドを含めたポリヌクレオチドとともに合わせるか、又は配合し、殺虫性効果を与える遺伝的に由来する転写物のダウンレギュレーション、干渉、抑制又はサイレンシングを介して特定の標的の量に影響を与えることができる。

40

【0373】

これら各種の混合パートナーの1種又は複数を使用するような実施形態においては、これら各種の混合パートナー(合計したもの)の、式1の化合物に対する重量比は、典型的には、約(1:3000)~約(3000:1)の間である。注目すべきは、約(1:300)~約(300:1)の間の重量比(例えば、約(1:30)~約(30:1)の間の比率)である。当業者ならば、所望の生物学的活性スペクトルを得るのに必要な、有効成分の生物学的有効量を、単純な実験で容易に決めることができる。これら追加の成分を

50

含むことによって、無脊椎有害生物の防除スペクトルを、式 1 の化合物単独で防除されるスペクトルよりも、拡張することが可能であることは、明らかであろう。

【 0 3 7 4 】

表 A は、式 1 の化合物と本開示の混合物、組成物及び方法を例示する他の無脊椎有害生物防除剤との特定の組合せを列挙する。表 A の第 1 の欄は、特定の無脊椎有害生物防除剤を列挙する（例えば、第 1 行における「アバメクチン」）。表 A の第 2 の欄は、作用機序（公知の場合）又は無脊椎有害生物防除剤の化学的分類を列挙する。表 A の第 3 の欄は、式 1 の化合物に対して無脊椎有害生物防除剤を適用することができる割合についての一連の重量比の実施形態を列挙する（例えば、重量によって式 1 の化合物に対して「50 : 1 ~ 1 : 50」のアバメクチン）。このように、例えば、表 A の第 1 行は、式 1 の化合物とアバメクチンの組合せが 50 : 1 ~ 1 : 50 の重量比で適用することができることを特に開示する。表 A の残りの行は、同様に解釈される。さらに注目すべきは、表 A は、式 1 の化合物と本開示の混合物、組成物及び方法を例示する他の無脊椎有害生物防除剤との特定の組合せを列挙し、散布量についての重量比範囲のさらなる実施形態を含む。

10

【 0 3 7 5 】

【表 5】

表 A

無脊椎有害生物 防除剤	作用機序又は化学的分類	典型的な重量比
アバメクチン	クロライドチャネル活性化剤	50:1-1:50
アセタミプリド	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	150:1-1:200
アミトラズ	オクトパミン受容体アゴニスト	200:1-1:100
アベルメクチン	大環状ラクトン	50:1-1:50
アザジラクチン	未知の作用部位	100:1-1:120
ベータ-シフルトリン	ナトリウムチャネルモジュレーター	150:1-1:200
ビフェントリン	ナトリウムチャネルモジュレーター	100:1-1:10
ブプロフェジン	キチン生合成阻害剤	500:1-1:50
カルタップ	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)チャネル遮断薬	100:1-1:200
クロラントラニリプロール	リアノジン受容体モジュレーター	100:1-1:120
クロルフェナピル	酸化的リン酸化の脱共役剤	300:1-1:200
クロルピリホス	アセチルコリンエステラーゼ阻害剤	500:1-1:200
クロチアニジン	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	100:1-1:400

20

30

40

【 0 3 7 6 】

50

【表 6】

シアントラニリプロール	リアノジン受容体モジュレーター	100:1-1:120
シフルトリン	ナトリウムチャンネルモジュレーター	150:1-1:200
シハロトリン	ナトリウムチャンネルモジュレーター	150:1-1:200
シベルメトリン	ナトリウムチャンネルモジュレーター	150:1-1:200
シロマジン	双翅類脱皮攪乱物質	400:1-1:50
デルタメトリン	ナトリウムチャンネルモジュレーター	50:1-1:400
ジェルドリ	GABA 作動性クロライドチャンネル アンタゴニスト	200:1-1:100
ジノテフラン	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	150:1-1:200
ジオフェノラン	幼若ホルモン類縁体	150:1-1:200
エマメクチン	クロライドチャンネル活性化剤	50:1-1:10
エンドスルファン	GABA 作動性クロライドチャンネル アンタゴニスト	200:1-1:100
エスフェンバレレート	ナトリウムチャンネルモジュレーター	100:1-1:400
エチプロール	GABA 制御クロライドチャンネル アンタゴニスト	200:1-1:100
フェノチオカルブ		150:1-1:200
フェノキシカルブ	幼若ホルモン類縁体	500:1-1:100
フェンバレレート	ナトリウムチャンネルモジュレーター	150:1-1:200
フィプロニル	GABA 制御クロライドチャンネル アンタゴニスト	150:1-1:100
フロニカミド	選択的半翅目昆虫摂食遮断薬	200:1-1:100
フルベンジアミド	リアノジン受容体モジュレーター	100:1-1:120
フルフェノクスロン	キチン生合成阻害剤	200:1-1:100
ヘキサフルムロン	キチン生合成阻害剤	300:1-1:50
ハイドラメチルノン	ミトコンドリア複合体 III 電子伝達 阻害剤	150:1-1:250
イミダクロプリド	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	1000:1-1:1000
インドキサカルブ	電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬	200:1-1:50
ラムダ-シハロトリン	ナトリウムチャンネルモジュレーター	50:1-1:250
ルフェヌロン	キチン生合成阻害剤	500:1-1:250

【 0 3 7 7 】

10

20

30

40

50

【表 7】

メタフルミゾン	電位依存性ナトリウムチャネル遮断薬	200:1-1:200
メソミル	アセチルコリンエステラーゼ阻害剤	500:1-1:100
メトプレン	幼若ホルモン類縁体	500:1-1:100
メトキシフェノジド	エクジソン受容体アゴニスト	50:1-1:50
ニテンピラム	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	150:1-1:200
ニチアジン	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	150:1-1:200
ノバルロン	キチン生合成阻害剤	500:1-1:150
オキサミル	アセチルコリンエステラーゼ阻害剤	200:1-1:200
ピメトロジン	選択的半翅目昆虫摂食遮断薬	200:1-1:100
ピレトリン	ナトリウムチャネルモジュレーター	100:1-1:10
ピリダベン	ミトコンドリア複合体 I 電子伝達阻害剤	200:1-1:100
ピリダリル	未知の作用部位	200:1-1:100
ピリプロキシフェン	幼若ホルモン類縁体	500:1-1:100
リアノジン	リアノジン受容体配位子	100:1-1:120
スピネトラム	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アロステリック活性化剤	150:1-1:100
スピノサド	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アロステリック活性化剤	500:1-1:10
スピロジクロフェン	アセチル CoA カルボキシラーゼ阻害剤	200:1-1:200
スピロメシフェン	アセチル CoA カルボキシラーゼ阻害剤	200:1-1:200
テブフェノジド	エクジソン受容体アゴニスト	500:1-1:250
チアクロプリド	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	100:1-1:200
チアメトキサム	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)アゴニスト	1250:1-1:1000
チオジカルブ	アセチルコリンエステラーゼ阻害剤	500:1-1:400
チオスルタップ-ナトリウム	ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR)チャネル遮断薬	150:1-1:100
トラロメトリン	ナトリウムチャネルモジュレーター	150:1-1:200
トリアザメート	アセチルコリンエステラーゼ阻害剤	250:1-1:100
トリフルメゾピリム		

10

20

30

40

【 0 3 7 8 】

50

【表 8】

トリフルムロン	キチン合成阻害剤	200:1-1:100
バチルス・ チューリンゲンシス (<i>Bacillus thuringiensis</i>)	生物学的作用物質	50:1-1:10
バチルス・ チューリンゲンシス (<i>Bacillus thuringiensis</i>)デルタ- 内毒素	生物学的作用物質	50:1-1:10
NPV(例えば、Gemstar)	生物学的作用物質	50:1-1:10

10

【0379】

注目すべきは、本開示の組成物であり、ここで、少なくとも1種のさらなる生物活性化合物又は薬剤は、上記の表Aにおいて列挙された無脊椎有害生物防除剤から選択される。

20

【0380】

式1の化合物、そのN-オキシド又は塩を含めた化合物とさらなる無脊椎有害生物防除剤の重量比は典型的には、1000:1~1:1000であり、一実施形態では、500:1~1:500であり、別の実施形態では、250:1~1:200であり、別の実施形態では、100:1~1:50である。

【0381】

表B1~B6において下記で列挙したのは、式1の化合物（化合物番号（Compd. No.）は、索引表Aにおける化合物を指す）及びさらなる無脊椎有害生物防除剤を含む特定の組成物の実施形態である。

【0382】

30

40

50

【表 9】

表 B1

混合物 番号	化合物 番号	及び	無脊椎有害生物 防除剤	混合物 番号	化合物 番号	及び	無脊椎有害生物 防除剤
B1-1	8	及び	アバメクチン	B1-38	8	及び	インドキサカルブ
B1-2	8	及び	アセタミプリド	B1-39	8	及び	ラムダ-シハロトリン
B1-3	8	及び	アミトラズ	B1-40	8	及び	ルフェヌロン
B1-4	8	及び	アベルメクチン	B1-41	8	及び	メタフルミゾン
B1-5	8	及び	アザジラクチン	B1-42	8	及び	メソミル
B1-6	8	及び	ベンスルタップ	B1-43	8	及び	メトプレン
B1-7	8	及び	ベータ-シフルトリン	B1-44	8	及び	メトキシフェノジド
B1-8	8	及び	ビフェントリン	B1-45	8	及び	ニテンピラム
B1-9	8	及び	ブプロフェジン	B1-46	8	及び	ニチアジン
B1-10	8	及び	カルタップ	B1-47	8	及び	ノバルロン
B1-11	8	及び	クロラントラニリプロール	B1-48	8	及び	オキサミル
B1-12	8	及び	クロルフェナピル	B1-49	8	及び	ホスメト
B1-13	8	及び	クロルピリホス	B1-50	8	及び	ピメトロジン
B1-14	8	及び	クロチアニジン	B1-51	8	及び	ピレトリン
B1-15	8	及び	シアントラニリプロール	B1-52	8	及び	ピリダベン
B1-16	8	及び	シフルトリン	B1-53	8	及び	ピリダリル
B1-17	8	及び	シハロトリン	B1-54	8	及び	ピリプロキシフェン
B1-18	8	及び	シペルメトリン	B1-55	8	及び	リアノジン

【 0 3 8 3 】

30

40

50

【表 10】

混合物 番号	化合物 番号	及び	無脊椎有害生物 防除剤	混合物 番号	化合物 番号	及び	無脊椎有害生物 防除剤
B1-19	8	及び	シロマジン	B1-56	8	及び	スピネトラム
B1-20	8	及び	デルタメトリン	B1-57	8	及び	スピノサド
B1-21	8	及び	ジエルドリン	B1-58	8	及び	スピロジクロフェン
B1-22	8	及び	ジノテフラン	B1-59	8	及び	スピロメシフェン
B1-23	8	及び	ジオフェノラン	B1-60	8	及び	スピロテトラマト
B1-24	8	及び	エマメクチン	B1-61	8	及び	スルホキサフロル
B1-25	8	及び	エンドスルファン	B1-62	8	及び	テブフェノジド
B1-26	8	及び	エスフェンバレレート	B1-63	8	及び	テフルトリン
B1-27	8	及び	エチプロール	B1-64	8	及び	チアクロプリド
B1-28	8	及び	フェノチオカルブ	B1-65	8	及び	チアメトキサム
B1-29	8	及び	フェノキシカルブ	B1-66	8	及び	チオジカルブ
B1-30	8	及び	フェンバレレート	B1-67	8	及び	チオスルタップ- ナトリウム
B1-31	8	及び	フィプロニル	B1-68	8	及び	トルフェンピラド
B1-32	8	及び	フロニカミド	B1-69	8	及び	トラロメトリン
B1-33	8	及び	フルベンジアミド	B1-70	8	及び	トリアザメート
B1-34	8	及び	フルフェノクスロン	B1-71	8	及び	トリフルメゾピリム
B1-35	8	及び	ヘキサフルムロン	B1-72	8	及び	トリフルムロン
B1-36	8	及び	ハイドラメチルノン	B1-73	8	及び	バチルス・ チューリンゲンシス (<i>Bacillus thuringiensis</i>)
B1-37	8	及び	イミダクロプリド	B1-74	8	及び	バチルス・ チューリンゲンシス (<i>Bacillus thuringiensis</i>)デルタ- 内毒素
				B1-75	8	及び	NPV(例えば、 Gemstar)

10

20

30

40

【0384】

表 B 2

表 B 2 は、表 B 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 14 への参照によって置き換えられる。例えば、表 B 2 における第 1 の混合物は、B 2-1 と指定され、化合物 14 及びさらなる無脊椎有害生物防除剤であるアバメクチンの混合物である。

【0385】

表 B 3

表 B 3 は、表 B 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における

50

化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 19 への参照によって置き換えられる。例えば、表 B 3 における第 1 の混合物は、B 3-1 と指定され、化合物 19 及びさらなる無脊椎有害生物防除剤であるアバメクチンの混合物である。

【0386】

表 B 4

表 B 4 は、表 B 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 78 への参照によって置き換えられる。例えば、表 B 4 における第 1 の混合物は、B 4-1 と指定され、化合物 78 及びさらなる無脊椎有害生物防除剤であるアバメクチンの混合物である。

【0387】

表 B 5

表 B 5 は、表 B 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 3 への参照によって置き換えられる。例えば、表 B 5 における第 1 の混合物は、B 5-1 と指定され、化合物 3 及びさらなる無脊椎有害生物防除剤であるアバメクチンの混合物である。

【0388】

表 B 6

表 B 6 は、表 B 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 86 への参照によって置き換えられる。例えば、表 B 6 における第 1 の混合物は、B 6-1 と指定され、化合物 86 及びさらなる無脊椎有害生物防除剤であるアバメクチンの混合物である。

【0389】

表 B 1 ～ B 6 において列挙される特定の混合物は典型的には、表 A において特定した比で式 1 の化合物と他の無脊椎有害生物剤とを合わせる。

【0390】

表 C 1 ～ C 6 において下記で列挙するのは、式 1 の化合物（化合物番号（Cmpd. No.）は、索引表 A における化合物を指す）及びさらなる無脊椎有害生物防除剤を含む特定の混合物である。表 C 1 ～ C 19 は、表 C 1 ～ C 19 の混合物の特色をよく示している特定の重量比をさらに列挙する。例えば、表 C 1 の第 1 行の第 1 の重量比の記入項目は、100 部の化合物 1 と 1 部のアバメクチンの重量比で適用された索引表 A の化合物 1 とアバメクチンとの混合物を特に開示する。

【0391】

10

20

30

40

50

【表 1 1】

表 C1

混合物 番号	化合物 番号	及び	無脊椎有害生物 防除剤	典型的な混合物比(重量による)								
C1-1	8	及び	アバメクチン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-2	8	及び	アセタミプリド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-3	8	及び	アミトラズ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-4	8	及び	アベルメクチン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-5	8	及び	アザジラクチン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-6	8	及び	ペンスルタップ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-7	8	及び	ペータ-シフルトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-8	8	及び	ピフェントリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-9	8	及び	ブプロフェジン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-10	8	及び	カルタップ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-11	8	及び	クロラントラニリプロール	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-12	8	及び	クロルフェナビル	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-13	8	及び	クロルピリホス	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-14	8	及び	クロチアニジン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-15	8	及び	シアントラニリプロール	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-16	8	及び	シフルトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-17	8	及び	シハロトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-18	8	及び	シベルメトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-19	8	及び	シロマジン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-20	8	及び	デルタメトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-21	8	及び	ジェルドリ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-22	8	及び	ジノテフラン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-23	8	及び	ジオフェノラン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	8	及び	エマメクチン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	8	及び	エンドスルファン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	8	及び	エスフェンバレレート	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	8	及び	エチプロール	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	8	及び	フェノチオカルブ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	8	及び	フェノキシカルブ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	8	及び	フェンバレレート	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	8	及び	フィプロニル	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	8	及び	フロニカミド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	8	及び	フルベンジアミド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	8	及び	フルフェノクスロン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	8	及び	ヘキサフルムロン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

【 0 3 9 2 】

10

20

30

40

50

【表 1 2】

C1-36	8	及び	ハイドラメチルノン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	8	及び	イミダクロブリド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	8	及び	インドキサカルブ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	8	及び	ラムダ-シハロトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	8	及び	ルフェヌロン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	8	及び	メタフルミゾン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	8	及び	メソミル	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	8	及び	メトブレン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	8	及び	メトキシフェノジド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	8	及び	ニテンピラム	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	8	及び	ニチアジン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	8	及び	ノバルロン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	8	及び	オキサミル	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	8	及び	ホススト	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	8	及び	ビメトロジン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	8	及び	ビレトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	8	及び	ピリダベン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	8	及び	ピリダリル	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	8	及び	ピリプロキシフェン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	8	及び	リアノジン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	8	及び	スピネトラム	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	8	及び	スピノサド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	8	及び	スピロジクロフェン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	8	及び	スピロメシフェン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	8	及び	スピロテトラマト	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	8	及び	スルホキサフロル	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	8	及び	テプフェノジド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	8	及び	テフルトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	8	及び	チアクロブリド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	8	及び	チアメトキサム	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-66	8	及び	チオジカルブ	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	8	及び	チオスルタップ- ナトリウム	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	8	及び	トルフェンピラド	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	8	及び	トラロメトリン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	8	及び	トリアザメート	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	8	及び	トリフルメゾピリム	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

【 0 3 9 3 】

10

20

30

40

50

【表 1 3】

C1-72	8	及び	トリフルムロン	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	8	及び	バチルス・チューリン ゲンシス (<i>Bacillus</i> <i>thuringiensis</i>)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-74	8	及び	バチルス・ チューリンゲンシス (<i>Bacillus</i> <i>thuringiensis</i>)デルタ- 内毒素	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-75	8	及び	NPV(例えば、 Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

10

【0394】

表 C 2

表 C 2 は、表 C 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 1 4 への参照によって置き換えられる。例えば、表 C 2 の第 1 行の第 1 の重量比の記入項目は、100 部の化合物 1 と 1 部のアバメクチンの重量比で適用された化合物 1 4 とアバメクチンとの混合物を特に開示する。

20

【0395】

表 C 3

表 C 3 は、表 C 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 1 9 への参照によって置き換えられる。例えば、表 C 3 の第 1 行の第 1 の重量比の記入項目は、100 部の化合物 1 と 1 部のアバメクチンの重量比で適用された化合物 1 9 とアバメクチンとの混合物を特に開示する。

【0396】

表 C 4

表 C 4 は、表 C 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 7 8 への参照によって置き換えられる。例えば、表 C 4 の第 1 行の第 1 の重量比の記入項目は、100 部の化合物 1 と 1 部のアバメクチンの重量比で適用された化合物 7 8 とアバメクチンとの混合物を特に開示する。

30

【0397】

表 C 5

表 C 5 は、表 C 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 3 への参照によって置き換えられる。例えば、表 C 5 の第 1 行の第 1 の重量比の記入項目は、100 部の化合物 1 と 1 部のアバメクチンの重量比で適用された化合物 3 とアバメクチンとの混合物を特に開示する。

40

【0398】

表 C 6

表 C 6 は、表 C 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 8 6 への参照によって置き換えられる。例えば、表 C 6 の第 1 行の第 1 の重量比の記入項目は、100 部の化合物 1 と 1 部のアバメクチンの重量比で適用された化合物 8 6 とアバメクチンとの混合物を特に開示する。

【0399】

表 D 1 ～ D 6 において下記で列挙するのは、式 1 の化合物（化合物番号（C m p d . N o .）は、索引表 A における化合物を指す）及びさらなる殺真菌剤を含む特定の組成物の実施形態である。

50

【 0 4 0 0 】

【 表 1 4 】

表 D1

混合物 番号	化合物 番号	及び	殺真菌剤	混合物 番号	化合物 番号	及び	殺真菌剤
D1-1	8	及び	プロベナゾール	D1-17	8	及び	ジフェノコナゾール
D1-2	8	及び	チアジニル	D1-18	8	及び	シプロコナゾール
D1-3	8	及び	イソチアニル	D1-19	8	及び	プロピコナゾール
D1-4	8	及び	ピロキロン	D1-20	8	及び	フェノキサニル
D1-5	8	及び	メミノストロビン	D1-21	8	及び	フェリムゾン
D1-6	8	及び	フルトラニル	D1-22	8	及び	フサライド
D1-7	8	及び	パリダマイシン	D1-23	8	及び	カスガマイシン
D1-8	8	及び	フラメトピル	D1-24	8	及び	ピコキシストロビン
D1-9	8	及び	ペンシクロン	D1-25	8	及び	ベンチオピラド
D1-10	8	及び	シメコナゾール	D1-26	8	及び	ファモキサドン
D1-11	8	及び	オリサストロビン	D1-27	8	及び	シモキサニル
D1-12	8	及び	トリフロキシストロビン	D1-28	8	及び	プロキナジド
D1-13	8	及び	イソプロチオラン	D1-29	8	及び	フルシラゾール
D1-14	8	及び	アゾキシストロビン	D1-30	8	及び	マンコゼブ
D1-15	8	及び	トリシクラゾール	D1-31	8	及び	水酸化銅
D1-16	8	及び	ヘキサコナゾール	D1-32	8	及び	オキサチアピプロリン

10

20

【 0 4 0 1 】

表 D 2

表 D 2 は、表 D 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 1 4 への参照によって置き換えられる。例えば、表 D 2 における第 1 の混合物は、D 2 - 1 と指定され、化合物 1 4 及びさらなる殺真菌剤であるプロベナゾールの混合物である。

30

【 0 4 0 2 】

表 D 3

表 D 3 は、表 D 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 1 9 への参照によって置き換えられる。例えば、表 D 3 における第 1 の混合物は、D 3 - 1 と指定され、化合物 1 9 及びさらなる殺真菌剤であるプロベナゾールの混合物である。

40

【 0 4 0 3 】

表 D 4

表 D 4 は、表 D 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 7 8 への参照によって置き換えられる。例えば、表 D 4 における第 1 の混合物は、D 4 - 1 と指定され、化合物 7 8 及びさらなる殺真菌剤であるプロベナゾールの混合物である。

【 0 4 0 4 】

表 D 5

表 D 5 は、表 D 1 と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物 8 へのそれぞれの参照は、化合物 3 への参照によって置き換えられる。例えば、表 D 5 における第 1 の混合物は、D 5 - 1 と指定され、化合物 3 及びさらなる殺真菌剤であ

50

るプロベナゾールの混合物である。

【0405】

表D6

表D6は、表D1と同一であるが、ただし、「化合物番号」と見出しのある欄における化合物8へのそれぞれの参照は、化合物86への参照によって置き換えられる。例えば、表D6における第1の混合物は、D6-1と指定され、化合物86及びさらなる殺真菌剤であるプロベナゾールの混合物である。

【0406】

典型的には組成物の形態にあり、生物学的有効量の、1種又は複数の開示の化合物を、農業的領域及び／又は非農業的領域も含めた有害生物の発生環境に対して、保護すべき領域に対して、或いは防除対象の有害生物に対して、直接施用することにより、無脊椎有害生物が、農業的用途及び非農業的用途において防除される。

【0407】

したがって、本開示には、農業的用途及び／又は非農業的用途において無脊椎有害生物を防除するための方法が含まれるが、それに含まれるのは、無脊椎有害生物又はその環境を、本開示の化合物の1種又は複数の生物学的有効量と、又は少なくとも1種のそのような化合物を含む少なくとも1種のそのような化合物又は組成物及び少なくとも1種の追加の生物活性化合物又は生物活性薬剤の生物学的有効量を含む組成物と、接触させることである。本開示の化合物及び少なくとも1種の追加の生物活性化合物又は生物活性薬剤の生物学的有効量を含む適切な組成物の例としては、その追加の活性化合物が、本開示の化合物と同じ顆粒の上に、又は本開示の化合物のものとは別の顆粒の上に存在している、粒状の組成物が挙げられる。

【0408】

農作物を無脊椎有害生物から保護するために、本開示の化合物又は組成物との接触を達成するためには、その化合物又は組成物を、典型的には植え付け前の作物の種子に対して、作物の茎葉（例えば、葉、茎、花、果実）に対して、又は作物を植え付ける前又は後の土壌又はその他の生育環境に対して、施用する。

【0409】

接触させる方法の一つの実施形態が、噴霧によるものである。別な方法として、本開示の化合物を含む顆粒状組成物を、植物の茎葉又は土壌に施用することもできる。本開示の化合物はさらに、液体配合物の土壌灌液、土壌への顆粒状配合物、育苗箱処理、又は移植の際の浸液（*a dip of transplant*）として施用された本開示の化合物を含む組成物と接触させることによって、植物による吸収を介して、効果的に送達することもできる。注目すべきは、土壌灌液の液体配合物の形態にある本開示の組成物である。注目すべきはさらに、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的有効量の本開示の化合物、又は生物学的有効量の本開示の化合物を含む組成物と接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法である。さらに注目すべきは、その環境が土壌であり、そして組成物が、土壌灌液配合物としてその土壌に施用されるような、この方法である。さらに注目すべきは、発生の領域に対して局所的に施用しても、本開示の化合物がやはり効果的であるということである。接触させるためのその他の方法としては、直接噴霧及び残存性噴霧、空中散布、ゲル、種子コーティング、マイクロカプセル化、浸透性吸収、誘引剤、耳標、ポーラス（*bolus*）、噴霧塗（*fogger*）、くん蒸剤、エアロゾル、粉剤、その他によって本開示の化合物又は組成物を施用することが挙げられる。接触させる方法の一つの実施形態は、本開示の化合物又は組成物を含む、寸法的に安定な肥料の顆粒、棒、又は錠剤である。本開示の化合物はさらに、無脊椎動物を防除するための道具（例えば、虫除けネット）を作製するための材料の中に含浸させることもできる。

【0410】

本開示の化合物は、植物全体、植物の各部分、及び種子を処理するのに有用である。植物及び種子の変種、並びに栽培品種は、慣用される繁殖方法及び育種方法によるか、或いは遺伝工学的的方法によって得ることができる。遺伝子組換え（*genetically*

10

20

30

40

50

modified、又はtransgenic) 植物又は種子とは、異種起源の遺伝子(導入遺伝子)が、植物のゲノム又は種子のゲノムの中に安定的に組み入れられたものである。植物のゲノムの中の特定の位置によって規定される導入遺伝子は、形質転換又は遺伝子組換え事象と呼ばれる。

【0411】

本開示において扱うことが可能な遺伝子組換え植物及び種子栽培品種としては、1種又は複数の生物的ストレス(有害生物例えば、線虫、昆虫、ダニ、真菌など)若しくは非生物的ストレス(干ばつ、低温、土壌塩分など)に対する抵抗性があるもの、又はその他の望ましい特性を有するものが挙げられる。植物及び種子は、遺伝子組換えによって、例えば、除草剤耐性、昆虫抵抗性、改良されたオイル特性、又は干ばつ耐性などの特性を示すことができる。単一の遺伝子形質転換事象又は形質転換事象の組合せを含有する有用な遺伝子改変された植物及び種子を、表Zにおいて列挙する。表Zにおいて列挙した遺伝子組換えについてのさらなる情報は、下記のデータベースから得ることができる：

10

<http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx>

<http://www.aphis.usda.gov>

<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>

【0412】

下記の略語を下記の表Zにおいて使用する。tol. は、耐性であり、res. は、抵抗性であり、SUは、スルホニル尿素であり、ALSは、アセト乳酸シンターゼであり、HPPDは、4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼであり、NAは、利用不可能である。

20

【0413】

30

40

50

【表 15】

表 Z

作物	事象名	事象コード	形質	遺伝子
アルファルファ	J101	MON-00101-8	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)
アルファルファ	J163	MON-00163-7	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)
キャノーラ*	23-18-17(事象 18)	CGN-89465-2	高ラウリン酸油	te
キャノーラ*	23-198(事象 23)	CGN-89465-2	高ラウリン酸油	te
キャノーラ*	61061	DP-061061-7	グリホサート耐性	gat4621
キャノーラ*	73496	DP-073496-4	グリホサート耐性	gat4621
キャノーラ*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キャノーラ*	GT73 (RT73)	MON-00073-7	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キャノーラ*	HCN10 (Topas 19/2)	NA	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	HCN28 (T45)	ACS-BN008-2	グルホシネート耐性	pat (syn)
キャノーラ*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BN007-1	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	MON88302	MON-88302-9	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)
キャノーラ*	MPS961	NA	フィチン酸分解	phyA
キャノーラ*	MPS962	NA	フィチン酸分解	phyA
キャノーラ*	MPS963	NA	フィチン酸分解	phyA
キャノーラ*	MPS964	NA	フィチン酸分解	phyA
キャノーラ*	MPS965	NA	フィチン酸分解	phyA
キャノーラ*	MS1 (B91-4)	ACS-BN004-7	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	MS8	ACS-BN005-8	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	OXY-235	ACS-BN011-5	オキシニル耐性	bxn
キャノーラ*	PHY14	NA	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	PHY23	NA	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	PHY35	NA	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	PHY36	NA	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	RF1 (B93-101)	ACS-BN001-4	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	グルホシネート耐性	bar
キャノーラ*	RF3	ACS-BN003-6	グルホシネート耐性	bar
マメ	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	病害抵抗性	ac1(センス及びアンチセン ス)
ナス(ナス)	EE-1		昆虫抵抗性	cry 1Ac
カーネーション	11 (7442)	FLO-07442-4	SU 耐性;改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
カーネーション	11363 (1363A)	FLO-11363-1	SU 耐性;改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	1226A (11226)	FLO-11226-8	SU 耐性;改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	123.2.2 (40619)	FLO-40619-7	SU 耐性;改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)

10

20

30

40

【0414】

【表 16】

カーネーション	123.2.38 (40644)	FLO-40644-4	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
カーネーション	123.8.12	FLO-40689-6	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	123.8.8 (40685)	FLO-40685-1	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	1351A (11351)	FLO-11351-7	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	1400A (11400)	FLO-11400-2	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	15	FLO-00015-2	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
カーネーション	16	FLO-00016-3	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
カーネーション	4	FLO-00004-9	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
カーネーション	66	FLO-00066-8	SU 耐性; 老化の遅延	surB; acc
カーネーション	959A (11959)	FLO-11959-3	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	988A (11988)	FLO-11988-7	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	26407	IFD-26497-2	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
カーネーション	25958	IFD-25958-3	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
チコリ	RM3-3	NA	グルホシネート耐性	bar
チコリ	RM3-4	NA	グルホシネート耐性	bar
チコリ	RM3-6	NA	グルホシネート耐性	bar
ワタ	19-51a	DD-01951A-7	ALS 除草剤耐性	S4-HrA
ワタ	281-24-236	DAS-24236-5	グルホシネート耐性; 昆虫抵抗性	pat (syn); cry1F
ワタ	3006-210-23	DAS-21023-5	グルホシネート耐性; 昆虫抵抗性	pat (syn); cry1Ac
ワタ	31707	NA	オキシニル耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac
ワタ	31803	NA	オキシニル耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac
ワタ	31807	NA	オキシニル耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac
ワタ	31808	NA	オキシニル耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac
ワタ	42317	NA	オキシニル耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac
ワタ	BNLA-601	NA	昆虫抵抗性	cry1Ac
ワタ	BXN10211	BXN10211-9	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac
ワタ	BXN10215	BXN10215-4	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac
ワタ	BXN10222	BXN10222-2	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac
ワタ	BXN10224	BXN10224-4	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac
ワタ	COT102	SYN-IR102-7	昆虫抵抗性	vip3A(a)
ワタ	COT67B	SYN-IR67B-1	昆虫抵抗性	cry1Ab
ワタ	COT202		昆虫抵抗性	vip3A
ワタ	事象 1	NA	昆虫抵抗性	cry1Ac
ワタ	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	昆虫抵抗性	cry1Ab-Ac
ワタ	GHB119	BCS-GH005-8	昆虫抵抗性	cry2Ac
ワタ	GHB614	BCS-GH002-5	グリホサート耐性	2mepsps

10

20

30

40

【0415】

【表 17】

ワタ	GK12	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab-Ac	
ワタ	LLCotton25	ACS-GH001-3	グルホシネート耐性	bar	
ワタ	MLS 9124	NA	昆虫抵抗性	cry1C	
ワタ	MON1076	MON-89924-2	昆虫抵抗性	cry1Ac	
ワタ	MON1445	MON-01445-2	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ワタ	MON15985	MON-15985-7	昆虫抵抗性	cry1Ac; cry2Ab2	
ワタ	MON1698	MON-89383-1	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ワタ	MON531	MON-00531-6	昆虫抵抗性	cry1Ac	10
ワタ	MON757	MON-00757-7	昆虫抵抗性	cry1Ac	
ワタ	MON88913	MON-88913-8	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ワタ	Nqwe Chi 6 Bt	NA	昆虫抵抗性	NA?	
ワタ	SKG321	NA	昆虫抵抗性	cry1A; CpTI	
ワタ	T303-3	BCS-GH003-6	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1Ab; bar	
ワタ	T304-40	BCS-GH004-7	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1Ab; bar	
ワタ	CE43-67B		昆虫抵抗性	cry1Ab	
ワタ	CE46-02A		昆虫抵抗性	cry1Ab	
ワタ	CE44-69D		昆虫抵抗性	cry1Ab	
ワタ	1143-14A		昆虫抵抗性	cry1Ab	
ワタ	1143-51B		昆虫抵抗性	cry1Ab	20
ワタ	T342-142		昆虫抵抗性	cry1Ab	
ワタ	PV-GHGT07 (1445)		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ワタ	EE-GH3		グリホサート耐性	mepsps	
ワタ	EE-GH5		昆虫抵抗性	cry1Ab	
ワタ	MON88701	MON-88701-3	ジカンバ及びグルホシネート耐性	改変された dmo; bar	
ワタ	OsCr11		抗アレルギー	改変された Cry j	
ハイコヌカグサ	ASR368	SMG-36800-2	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ユーカリ	20-C		耐塩性	codA	
ユーカリ	12-5C		耐塩性	codA	
ユーカリ	12-5B		耐塩性	codA	30
ユーカリ	107-1		耐塩性	codA	
ユーカリ		1/9/2001	耐塩性	codA	
ユーカリ		2/1/2001	耐塩性	codA	
ユーカリ			耐寒性	des9	
アマ	FP967	CDC-FL001-2	ALS 除草剤耐性	als	
レンチル	RH44		イミダゾリノン耐性	als	
トウモロコシ	3272	SYN-E3272-5	改変されたアルファ-アミラーゼ	amy797E	
トウモロコシ	5307	SYN-05307-1	昆虫抵抗性	ecry3.1Ab	
トウモロコシ	59122	DAS-59122-7	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	676	PH-000676-7	グルホシネート耐性;受粉制御	pat; dam	40

【0416】

【表 18】

トウモロコシ	678	PH-000678-9	グルホシネート耐性;受粉制御	pat; dam	
トウモロコシ	680	PH-000680-2	グルホシネート耐性;受粉制御	pat; dam	
トウモロコシ	98140	DP-098140-6	グリホサート耐性; ALS 除草剤耐性	gat4621; zm-hra	
トウモロコシ	Bt10	NA	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1Ab; pat	
トウモロコシ	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1Ab; bar	
トウモロコシ	BVLA430101	NA	フィチン酸分解	phyA2	
トウモロコシ	CBH-351	ACS-ZM004-3	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry9C; bar	
トウモロコシ	DAS40278-9	DAS40278-9	2,4-D 耐性	aad-1	10
トウモロコシ	DBT418	DKB-89614-9	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1Ac; pinII; bar	
トウモロコシ	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	グルホシネート耐性	bar	
トウモロコシ	GA21	MON-00021-9	グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	GG25		グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	GJ11		グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	FI117		グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	GAT-ZM1		グルホシネート耐性	pat	
トウモロコシ	LY038	REN-00038-3	リシンの増加	cordapA	
トウモロコシ	MIR162	SYN-IR162-4	昆虫抵抗性	vip3Aa20	
トウモロコシ	MIR604	SYN-IR604-5	昆虫抵抗性	mcry3A	20
トウモロコシ	MON801 (MON80100)	MON801	昆虫抵抗性;グリホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON802	MON-80200-7	昆虫抵抗性;グリホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON809	PH-MON-809-2	昆虫抵抗性;グリホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON810	MON-00810-6	昆虫抵抗性;グリホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON832	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON863	MON-00863-5	昆虫抵抗性	cry3Bb1	
トウモロコシ	MON87427	MON-87427-7	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON87460	MON-87460-4	干ばつ耐性	cspB	
トウモロコシ	MON88017	MON-88017-3	昆虫抵抗性;グリホサート耐性	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)	30
トウモロコシ	MON89034	MON-89034-3	昆虫抵抗性	cry2Ab2; cry1A.105	
トウモロコシ	MS3	ACS-ZM001-9	グルホシネート耐性;受粉制御	bar;バルナーゼ	
トウモロコシ	MS6	ACS-ZM005-4	グルホシネート耐性;受粉制御	bar;バルナーゼ	
トウモロコシ	NK603	MON-00603-6	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	T14	ACS-ZM002-1	グルホシネート耐性	pat (syn)	
トウモロコシ	T25	ACS-ZM003-2	グルホシネート耐性	pat (syn)	
トウモロコシ	TC1507	DAS-01507-1	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1Fa2; pat	
トウモロコシ	TC6275	DAS-06275-8	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	mocry1F; bar	
トウモロコシ	VIP1034		昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	vip3A; pat	40

【0417】

【表 19】

トウモロコシ	43A47	DP-043A47-3	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
トウモロコシ	40416	DP-040416-8	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
トウモロコシ	32316	DP-032316-8	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
トウモロコシ	4114	DP-004114-3	昆虫抵抗性;グルホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
メロン	メロン A	NA	成熟/老化の遅延	sam-k
メロン	メロン B	NA	成熟/老化の遅延	sam-k
パパイヤ	55-1	CUH-CP551-8	病害抵抗性	prsv cp
パパイヤ	63-1	CUH-CP631-7	病害抵抗性	prsv cp
パパイヤ	Huanong No. 1	NA	病害抵抗性	prsv rep
パパイヤ	X17-2	UFL-X17CP-6	病害抵抗性	prsv cp
ペチュニア	ペチュニア-CHS	NA	改変された製品品質	CHS 抑制
セイヨウソモモ	C-5	ARS-PLMC5-6	病害抵抗性	ppv cp
キャノーラ**	ZSR500	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キャノーラ**	ZSR502	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キャノーラ**	ZSR503	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
ポプラ	Bt ポプラ	NA	昆虫抵抗性	cry1Ac; API
ポプラ	ハイブリッドポプラ クローン 741	NA	昆虫抵抗性	cry1Ac; API
ポプラ	trg300-1		高セルロース	AaXEG2
ポプラ	trg300-2		高セルロース	AaXEG2
ジャガイモ	1210 amk	NA	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	2904/1 kgs	NA	昆虫抵抗性	cry3A
キャノーラ**	ZSR500	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キャノーラ**	ZSR502	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
ジャガイモ	ATBT04-27	NMK-89367-8	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	ATBT04-30	NMK-89613-2	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	ATBT04-31	NMK-89170-9	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	ATBT04-36	NMK-89279-1	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	ATBT04-6	NMK-89761-6	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	BT06	NMK-89812-3	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	BT10	NMK-89175-5	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	BT12	NMK-89601-8	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	BT16	NMK-89167-6	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	BT17	NMK-89593-9	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	BT18	NMK-89906-7	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	BT23	NMK-89675-1	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	EH92-527-1	BPS-25271-9	加工デンプン/炭水化物	gbss (アンチセンス)
ジャガイモ	HLMT15-15	NA	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp

10

20

30

40

【0418】

【表 20】

ジャガイモ	HLMT15-3	NA	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp
ジャガイモ	HLMT15-46	NA	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp
ジャガイモ	RBMT15-101	NMK-89653-6	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp
ジャガイモ	RBMT21-129	NMK-89684-1	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
ジャガイモ	RBMT21-152	NA	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
ジャガイモ	RBMT21-350	NMK-89185-6	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
ジャガイモ	RBMT22-082	NMK-89896-6	昆虫及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
ジャガイモ	RBMT22-186	NA	昆虫及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
ジャガイモ	RBMT22-238	NA	昆虫及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
ジャガイモ	RBMT22-262	NA	昆虫及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
ジャガイモ	SEMT15-02	NMK-89935-9	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp
ジャガイモ	SEMT15-07	NA	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp
ジャガイモ	SEMT15-15	NMK-89930-4	昆虫及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp
ジャガイモ	SPBT02-5	NMK-89576-1	昆虫抵抗性	cry3A
ジャガイモ	SPBT02-7	NMK-89724-5	昆虫抵抗性	cry3A
イネ	7Crp#242-95-7		抗アレルギー	7crp
イネ	7Crp#10	NA	抗アレルギー	7crp
イネ	GM Shanyou 63	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab; cry1Ac
イネ	Huahui-1/TT51-1	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab; cry1Ac
イネ	LLRICE06	ACS-OS001-4	グルホシネート耐性	bar
イネ	LLRICE601	BCS-OS003-7	グルホシネート耐性	bar
イネ	LLRICE62	ACS-OS002-5	グルホシネート耐性	bar
イネ	Tarom molaii + cry1Ab	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab(切断型)
イネ	GAT-OS2		グルホシネート耐性	bar
イネ	GAT-OS3		グルホシネート耐性	bar
イネ	PE-7		昆虫抵抗性	Cry1Ac
イネ	7Crp#10	NA	抗アレルギー	7crp
イネ	KPD627-8		高トリプトファン	OASA1D
イネ	KPD722-4		高トリプトファン	OASA1D
イネ	KA317		高トリプトファン	OASA1D
イネ	HW5		高トリプトファン	OASA1D
イネ	HW1		高トリプトファン	OASA1D
イネ	B-4-1-18		直立葉、半矮性	Δ OsBRI1
イネ	G-3-3-22		半矮性	OSGA2ox1
イネ	AD77		病害抵抗性	DEF

10

20

30

40

【0419】

【表 2 1】

イネ	AD51		病害抵抗性	DEF	
イネ	AD48		病害抵抗性	DEF	
イネ	AD41		病害抵抗性	DEF	
イネ	13pNasNaatAprt1		低鉄耐性	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT	
イネ	13pAprt1		低鉄耐性	APRT	
イネ	gHvNAS1-gHvNAAT- I		低鉄耐性	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B	
イネ	gHvIDS3-1		低鉄耐性	HvIDS3	
イネ	gHvNAAT1		低鉄耐性	HvNAAT-A; HvNAAT-B	10
イネ	gHvNAS1-1		低鉄耐性	HvNAS1	
イネ	NIA-OS006-4		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS005-3		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS004-2		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS003-1		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS002-9		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS001-8		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	OsCr11		抗アレルギー	改変された Cry j	
イネ	17053		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
イネ	17314		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	20
バラ	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	改変された花色	5AT; bp40 (f3'5'h)	
バラ	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	改変された花色	5AT; bp40 (f3'5'h)	
ダイズ	260-05 (G94-1, G94- 19, G168)	NA	変性油/脂肪酸	gm-fad2-1(サイレンシング 遺伝子座)	
ダイズ	A2704-12	ACS-GM005-3	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	A2704-21	ACS-GM004-2	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	A5547-127	ACS-GM006-4	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	A5547-35	ACS-GM008-6	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	CV127	BPS-CV127-9	イミダゾリノン耐性	csr1-2	
ダイズ	DAS68416-4	DAS68416-4	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	DP305423	DP-305423-1	変性油/脂肪酸;ALS 除草剤耐性	gm-fad2-1(サイレンシング 遺伝子座); gm-hra	30
ダイズ	DP356043	DP-356043-5	変性油/脂肪酸;グリホサート耐性	gm-fad2-1(サイレンシング 遺伝子座); gat4601	
ダイズ	FG72	MST-FG072-3	グリホサート及び HPPD 耐性	2mepsps; hppdPF W336	
ダイズ	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	GU262	ACS-GM003-1	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	MON87701	MON-87701-2	昆虫抵抗性	cry1Ac	
ダイズ	MON87705	MON-87705-6	変性油/脂肪酸;グリホサート 耐性	fatb1-A(センス及びアンチ センス); fad2-1A(センス 及びアンチセンス); cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON87708	MON-87708-9	ジカンバ及びグリホサート耐性	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)	40

【 0 4 2 0 】

【表 2 2】

ダイズ	MON87769	MON-87769-7	改変された油/脂肪酸; グリホサート耐性	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
ダイズ	MON89788	MON-89788-1	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)
ダイズ	W62	ACS-GM002-9	グルホシネート耐性	bar
ダイズ	W98	ACS-GM001-8	グルホシネート耐性	bar
ダイズ	MON87754	MON-87754-1	高油	dgat2A
ダイズ	DAS21606	DAS-21606	アリールオキシアルカノエート及び グルホシネート耐性	改変された aad-12; pat
ダイズ	DAS44406	DAS-44406-6	アリールオキシアルカノエート、 グリホサート及びグルホシネート 耐性	改変された aad-12; 2mepsps; pat
ダイズ	SYHT04R	SYN-0004R-8	メトリオン耐性	改変された avhppd
ダイズ	9582.814.19.1		昆虫抵抗性及びグルホシネート 耐性	cry IAc, cry IF, PAT
カボチャ	CZW3	SEM-0CZW3-2	病害抵抗性	cmv cp, zymv cp, wmv cp
カボチャ	ZW20	SEM-0ZW20-7	病害抵抗性	zymv cp, wmv cp
サトウダイコン	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
サトウダイコン	H7-1	KM-000H71-4	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)
サトウダイコン	T120-7	ACS-BV001-3	グルホシネート耐性	pat
サトウダイコン	T227-1		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)
サトウキビ	NXI-1T		干ばつ耐性	EcbetA
ヒマワリ	X81359		イミダゾリノン耐性	als
パブリカ	PK-SP01	NA	病害抵抗性	cmv cp
タバコ	C/F/93/08-02	NA	オキシニル耐性	bxn
タバコ	ベクター-21-41	NA	ニコチンの低減	NtQPT1(アンチセンス)
トマト	1345-4	NA	成熟/老化の遅延	acc(切断型)
トマト	35-1-N	NA	成熟/老化の遅延	sam-k
トマト	5345	NA	昆虫抵抗性	cry IAc
トマト	8338	CGN-89322-3	成熟/老化の遅延	accd
トマト	B	SYN-0000B-6	成熟/老化の遅延	pg(センス又はアンチセン ス)
トマト	Da	SYN-0000DA-9	成熟/老化の遅延	pg(センス又はアンチセン ス)
ヒマワリ	X81359		イミダゾリノン耐性	als
トマト	Da Dong No 9	NA	改変された製品	NA
トマト	F (1401F, h38F, 11013F,7913F)	SYN-0000F-1	成熟/老化の遅延	pg(センス又はアンチセン ス)
トマト	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	成熟/老化の遅延	pg(センス又はアンチセン ス)
トマト	Huafan No 1	NA	成熟/老化の遅延	抗 efe
トマト	PK-TM8805R (8805R)	NA	病害抵抗性	cmv cp
コムギ	MON71800	MON-71800-3	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)

*アルゼンチン、**ポーランド、#ナス

【0 4 2 1】

本開示の化合物を用いて遺伝子組換え植物及び種子を処理すると、向上効果が得られる可能性がある。例えば、散布量の減少、活性スペクトルの拡大、生物的／非生物的ストレスに対する耐性の向上、又は貯蔵安定性の向上が、遺伝子組換え植物及び種子への本開示の化合物の施用の単なる相加作用から予想されるよりは、大きくなる可能性がある。

【0 4 2 2】

本開示の化合物は、無脊椎有害生物から種子を保護するための種子処理剤においても有用である。本発明の開示及び特許請求の文脈においては、種子を処理するということは、種子を、生物学的有効量の本開示の化合物（典型的には本開示の組成物として配合されて

いる)と接触させることを意味している。この種子処理によって、その種子が、無脊椎土壌有害生物から保護され、そして一般的には、発芽中の種子から生長している幼苗の、土壌と接触状態にある根及び植物の他の部分もまた保護することができる。その種子処理はさらに、本開示の化合物の転流によるか、又は生長しつつある植物の内部の第二の有効成分によって、茎葉の保護を与えることもできる。種子処理剤は、特殊化された特性を発現させる目的で遺伝子形質転換された植物が、それから生長させられるようなものも含めて、あらゆるタイプの種子に適用することができる。代表例としては、以下のものが挙げられる：無脊椎有害生物に対して有毒なタンパク質、例えばバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) トキシンを発現するもの、又は、例えば、グリホサートに対する抵抗性を付与するグリホサートアセチルトランスフェラーゼのような除草剤耐性を発現するもの。本開示の化合物を用いた種子処理剤は、処理種子から生長している植物の活力を向上させることもできる。

10

【0423】

種子処理の一つの方法は、播種する前に、本開示の化合物(すなわち、配合された組成物として)を用いて、種子を噴霧又は散粉(*spraying or dusting*)することによる。種子処理のために配合された組成物には、一般的には、塗膜形成剤又は接着剤が含まれる。したがって、典型的には、本開示の種子コーティング組成物には、生物学的有効量の式1の化合物、それらのN-オキシド、又は塩、及び塗膜形成剤又は接着剤が含まれる。種子は、種子の転動ベッドの中に流動性の懸濁液濃縮物を直接噴霧し、次いでそれらの種子を乾燥させることにより、コーティングすることができる。別な方法として、他のタイプの配合物、例えば濡らした粉体、溶液、サスポエマルジョン、乳剤(*emulsifiable concentrate*)、及び水中エマルジョンを種子の上に噴霧することも可能である。このプロセスは、種子の上にフィルムコーティングを適用する場合に、特に有用である。当業者であれば、各種のコーティング機械及びプロセスが利用可能である。適切なプロセスとしては、P. Koster et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994, BCPC Monograph No. 57、及びその中に記されている参考文献に記載されたものが挙げられる。

20

【0424】

式1の化合物及びそれらの組成物は、単独、或いは他の殺虫剤及び殺真菌剤との組み合わせのいずれにおいても、以下のような作物のための種子処理には、特に有用である：例えばトウモロコシ(*maze*又は*corn*)、ダイズ、ワタ、穀物(例えば、コムギ、オートムギ、オオムギ、ライムギ、及びイネ)、ジャガイモ、野菜類、及びアブラナ(これらに限定される訳ではない)。

30

【0425】

式1の化合物とともに配合して、種子処理において有用な混合物を与える、その他の殺虫剤としては、以下のものが挙げられる：アバメクチン、アセタミプリド、アクリナトリン、アミトラズ、エバーメクチン、アザジラクチン、ベンスルタップ、ピフェントリン、ブプロフェジン、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、クロルアントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダシハロトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジエルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エトキザゾール、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルベンジアミド、フルフェノクスロン、フルバリネート、ホルメタネート、フォスチアゼート、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、ルフエヌロン、メタフルミゾン、メチオカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシフェノジド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネト

40

50

ラム、スピノサド、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、スルホキサフロール、テブフェノジド、テトラメトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタプーナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルターエンドトキシン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) のすべての菌株、及び核多角体病ウィルスのすべての菌株。

【0426】

式1の化合物とともに配合して、種子処理において有用な混合物を与える、殺真菌剤としては、以下のものが挙げられる：アミスルプロム、アゾキシストロビン、ボスカリド、カルベンダジム、カルボキシニル、シモキサニル、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジメトモルフ、フルアジナム、フルジオキサニル、フルキンコナゾール、フルオピコリド、フルオキサストロビン、フルトリアホール、フルキサピロキサド、イプロコナゾール、イプロジオン、メタラキシル、メフェノキサム、メトコナゾール、ミクロブタニル、パクロブトラゾール、ペンフルフェン、ピコキシストロビン、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、セダキサン、シルチオフアム、テブコナゾール、チアベンダゾール、チオファネートメチル、サイラム、トリフロキシストロビン、及びトリチコナゾール。

【0427】

種子処理剤のために有用な式1の化合物を含む組成物は、細菌、例えば、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*) (例えば、菌株GB34) 及びバチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) (例えば、分離株1582)、根粒菌接種材料／エキステンダー、イソフラボノイド及びリポキトオリゴ糖をさらに含むことができる。

【0428】

処理種子は典型的には、種子の100kg当たり約0.1g～1kg (すなわち、処理前の種子の約0.0001～1重量%) の量で本開示の化合物を含む。種子処理のために調合される流動性懸濁液は典型的には、約0.5～約70%の活性成分と、約0.5～約30%のフィルム形成付着剤と、約0.5～約20%の分散剤と、0～約5%の増粘剤と、0～約5%の顔料及び／又は染料と、0～約2%の消泡剤と、0～約1%の保存剤と、0～約75%の揮発性液体希釈剤とを含む。

【0429】

本開示の化合物は、無脊椎有害生物によって消費されるか、又はトラップ、餌ステーションなどのデバイス内で使用される餌組成物中へ組み込むことができる。そのような餌組成物は、(a) 活性成分、すなわち生物学的有効量の式1の化合物、それらのN-オキシド、又は塩と；(b) 1つ若しくは複数の食品材料と；場合によっては(c) 誘引物質と、場合によっては(d) 1つ若しくは複数の保湿剤とを含む顆粒の形態にあり得る。約0.001～5%活性成分と、約40～99%食品材料及び／又は誘引物質と；場合によっては約0.05～10%保湿剤とを含む顆粒又は餌組成物であって、非常に低い散布率で、特に直接接触によってよりもむしろ摂食によって致死である活性成分の用量で土壌無脊椎有害生物を駆除するのに有効である顆粒又は餌組成物に注目すべきである。いくつかの食品材料は、食品源及び誘引物質の両方として機能することができる。食品材料は、炭水化物、タンパク質及び脂肪を含む。食品材料の例は、野菜粉、砂糖、デンプン、動物脂、植物油、酵母エキス及び乳固形分である。誘引物質の例は、果実若しくは植物エキス、香料、又は他の動物若しくは植物成分などの、付香剤及び香味剤、フェロモン又は標的無脊椎有害生物を誘引することが知られている他の試剤である。保湿剤、すなわち、湿気保持剤の例は、グリコール及び他のポリオール、グリセリン及びソルビトールである。アリ、シロアリ及びゴキブリからなる群から選択される少なくとも1つの無脊椎有害生物を駆除するために用いられる餌組成物(及びそのような餌組成物を利用する方法)に注目すべきである。無脊椎有害生物を駆除するためのデバイスは、本餌組成物と、餌組成物を受け入れるのに適合したハウジングとを含むことができ、ここで、ハウジングは、無脊椎有害生物が開口部を通過することを可能にするためのサイズの少なくとも1つの開口部を有し、

だから無脊椎有害生物はハウジングの外側の場所から餌組成物にアクセスすることができ、そしてここで、ハウジングは、無脊椎有害生物についての潜在的な又は既知の活動の場所に又はその近くに置かれるようにさらに適合させられている。

【0430】

本開示の化合物は、他の補助剤を伴わずに適用することができるが、殆どの場合、適用は、適切な担体、賦形剤、及び界面活性剤とともに、そして場合により、意図する最終用途によって食物と組み合わせた1種若しくは複数の活性成分を含む配合物の適用である。適用の1つの方法は、本開示の化合物の水分散液又は精製油溶液を噴霧することが関与する。噴霧油、噴霧油濃縮、散布機ステッカー、補助剤、他の溶媒、及びピペロニルブトキシドとの組合せは、化合物の有効性を増進させることが多い。非農学的使用のために、このような噴霧は、ポンプを用いて、又は加圧された容器、例えば、加圧されたエアゾールスプレー缶からそれを放出することによって、噴霧容器、例えば、缶、ボトル又は他の容器から適用することができる。このような噴霧組成物は、様々な形態、例えば、噴霧、ミスト、泡、煙又は霧をとることができる。このように、このような噴霧組成物は、場合によっては、噴射剤、発泡剤などをさらに含むことができる。注目すべきは、生物学的有効量の本開示の化合物又は組成物及び担体を含む噴霧組成物である。このような噴霧組成物の一実施形態は、生物学的有効量の本開示の化合物又は組成物及び噴射剤を含む。代表的な噴射剤には、これらに限定されないが、メタン、エタン、プロパン、ブタン、イソブタン、ブテン、ペンタン、イソペンタン、ネオペンタン、ペンテン、ハイドロフルオロカーボン、クロロフルオロカーボン、ジメチルエーテル、及び上記の混合物が含まれる。注目すべきは、個々に又は組み合わせたものを含めた、カ、ブヨ、サシバエ、メクラアブ、ウマバエ、カリバチ、イエロー・ジャケット、スズメバチ、ダニ、クモ、アリ、ブヨなどからなる群から選択される少なくとも1種の無脊椎有害生物を防除するために使用される、噴霧組成物（及び噴霧容器から分配されるそのような噴霧組成物を利用した方法）である。

10

20

【0431】

本開示の一実施形態は、本開示の殺有害生物組成物（界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤と調合された式1の化合物、又は式1の化合物と少なくとも1つの他の殺有害生物剤との調合混合物）を水で希釈する工程と、補助剤を場合によっては添加して希釈組成物を形成する工程と、無脊椎有害生物又はその環境を、有効量の前記希釈組成物と接触させる工程とを含む、無脊椎有害生物の駆除方法に関する。

30

【0432】

十分な濃度の本殺有害生物組成物を水で希釈することによって形成された噴霧組成物は、無脊椎有害生物を駆除するのに十分な効能を提供することができるが、別々に調合された補助剤生成物をまた、空気圧縮タンク混合物に添加することができる。これらの追加の補助剤は、「噴霧補助剤」又は「タンクミックス補助剤」として一般に知られ、殺有害生物剤の性能を向上させる、又は噴霧混合物の物理的特性を変えるために空気圧縮タンクで混合される任意の物質を含む。補助剤は、界面活性剤、乳化剤、石油ベースの作物油、作物由来種油、酸性化剤、緩衝剤、増粘剤又は消泡剤であり得る。補助剤は、効能（例えば、生物学的利用率、付着性、浸透性、カバレッジの一樣性及び保護の耐久性）を高めるために、又は不適合性、発泡、ドリフト、蒸発、気化及び分解に関連した噴霧適用問題を最小限にするか若しくは排除するために使用される。最適性能を得るために、補助剤は、活性成分、調合物及び標的（例えば、作物、害虫）の特性に関して選択される。

40

【0433】

噴霧補助剤の中で、作物油を含む油、作物油濃縮物、植物油濃縮物及びメチル化種油濃縮物が、場合によりより均一な及び一樣な噴霧沈着物を促進することによって、殺有害生物剤の効能を向上させるために最も一般的に使用される。油又は他の水と混ざらない液体によって潜在的に引き起こされる植物毒性が懸念される状況では、本開示の組成物から調製される噴霧組成物は一般に、油ベースの噴霧補助剤を含有しないであろう。しかしながら、油ベースの噴霧補助剤によって引き起こされる植物毒性が商業的に重要でない状況で

50

は、本発明の組成物から調製される噴霧組成物は、無脊椎有害生物の駆除、並びに雨堅牢性を潜在的にさらに高めることができる、油ベースの噴霧補助剤をまた含有することができる。

【0434】

「作物油」と特定される製品は典型的には、95～98%パラフィン又はナフサベースの石油と、乳化剤として機能する1～2%の1つ若しくは複数の界面活性剤とを含有する。「作物油濃縮物」と特定される製品は典型的には、80～85%の乳化性石油ベースの油と、15～20%の非イオン界面活性剤とからなる。「植物油濃縮物」と正しく特定される製品は典型的には、80～85%の植物油（すなわち、最も一般的には綿、亜麻仁、大豆又はヒマワリからの、種油又は果実油）と、15～20%の非イオン界面活性剤とからなる。補助剤性能は、植物油を、植物油に典型的には誘導される脂肪酸のメチルエステルで置き換えることによって向上させることができる。メチル化種油濃縮物の例としては、MSO（登録商標）Concentrate（UAP-Loveland Products, Inc.）及びPremium MSO Methylated Spray Oil（Helena Chemical Company）が挙げられる。

10

【0435】

噴霧混合物に添加される補助剤の量は一般に、約2.5容積%を越えず、より典型的にはその量は、約0.1～約1容積%である。噴霧混合物に添加される補助剤の散布率は典型的には、1ヘクタール当たり約1～5Lである。噴霧補助剤の代表例としては、Adigor（登録商標）（Syngenta）液体炭化水素中の47%メチル化菜種油、Silwet（登録商標）（Helena Chemical Company）ポリアルキレンオキシド変性ヘプタメチルトリシロキサン及びAssist（登録商標）（BASF）83%パラフィンベースの鉱油中の17%界面活性剤ブレンドが挙げられる。

20

【0436】

非農学的適用は、典型的には、獣医学における使用のために配合された組成物の形態での殺寄生生物有効（すなわち、生物学的有効）量の本開示の化合物を、保護される動物に投与することによって、動物、特に、脊椎動物、より特定すると、恒温脊椎動物（例えば、哺乳動物又は鳥）、及び最も特に、哺乳動物を無脊椎動物寄生性有害生物から保護することを含む。したがって、注目すべきは、動物に殺寄生生物有効量の本開示の化合物を投与することを含む、動物を保護するための方法である。本開示及び特許請求の範囲において言及するように、用語「殺寄生生物性」及び「殺寄生生物的に」は、有害生物からの動物の保護を実現する無脊椎寄生性有害生物に対する観察可能な効果を指す。殺寄生生物性効果は典型的には、標的無脊椎動物寄生性有害生物の出現又は活性を減少させることと関連している。有害生物に対するこのような効果は、壊死、死亡、成長の遅延、移動性の減少、又は宿主動物上若しくは中に留まる能力の減少、摂食の低減、及び繁殖の阻害を含む。無脊椎寄生性有害生物に対するこれらの効果は、動物の寄生又は感染の制御（予防、低減又は除去を含めた）を実現する。殺寄生生物有効量の本開示の化合物を保護される動物に投与することによって防除される無脊椎動物寄生性有害生物の例には、外部寄生生物（節足動物、ダニ目など）及び内部寄生生物（蠕虫、例えば、線虫、吸虫、条虫、鉤頭虫など）が含まれる。特に、本開示の化合物は、ハエ、例えば、ノサシバエ（*Haematobia*（*Lyperosia*）*irritans*）（ノサシバエ）、サシバエ（*Stomoxys calcitrans*）（サシバエ）、シムリウム属（*Simulium*）の種（ブヨ）、ツェツェバエ属（*Glossina*）の種（ツェツェバエ）、ヒドロタエア・イリタンス（*Hydrotaea irritans*）（ヘッドフライ）、ムスカ・アウツムナリス（*Musca autumnalis*）（フェースフライ）、イエバエ（*Musca domestica*）（イエバエ）、モレリア・シンプレックス（*Morellia simplex*）（スウィートフライ）、アブ属（*Tabanus*）の種（ウマバエ）、ヒポデルマ・ボビス（*Hypoderma bovis*）、ヒポデルマ・リネアツム（*Hypoderma lineatum*）、ヒロズキンバエ（*Lucilia sericata*）、ヒツジキンバエ（*Lucilia cuprina*）（グリーンブ

30

40

50

ローフライ)、オオクロバエ属 (*Calliphora*) の種 (ブローフライ)、プロトフォルミア属 (*Protophormia*) の種、オエストルス・オビス (*Oestrus ovis*) (ネイサルボットフライ)、サシバエ属 (*Culicoides*) の種 (ミジ)、ヒッポボスカ・エキン (*Hippobosca equine*)、ガストロフィルス・インステスチナリス (*Gastrophilus instestinalis*)、ガストロフィルス・ハエモロイダリス (*Gastrophilus haemorrhoidalis*) 及びガストロフィルス・ナスリス (*Gastrophilus nasalis*) ; シラミ、例えば、ボビコラ (ダマリニア) ボビス (*Bovicola (Dama) linia*) *bovis*)、ボビコラ・エキ (*Bovicola equi*)、ハエマトピヌス・アシニ (*Haematopinus asini*)、フェリコラ・スブロストラツス (*Felicola subrostratus*)、ヘテロドキシス・スピニゲル (*Heterodoxus spiniger*)、リグノナツス・セトス (*Lignonathus setosus*) 及びトリコデクテス・カニス (*Trichodectes canis*) ; ヒツジシラミバエ、例えば、メロファグス・オビヌス (*Melophagus ovinus*) ; ダニ、例えば、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes*) の種、サルコプテス・スカベイ (*Sarcoptes scabiei*)、コリオプテス・ボビス (*Chorioptes bovis*)、デモデクス・エキ (*Demodex equi*)、ケイルエチエラ属 (*Cheyletiella*) の種、ノトエドレス・カチ (*Notoedres cati*)、ツツガムシ属 (*Trombicula*) の種及びオトデクテス・シアノチス (*Otodectes cyanotis*) (ミミダニ) ; ダニ、例えば、マダニ属 (*Ixodes*) の種、ウシマダニ属 (*Boophilus*) の種、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus*) の種、キラマダニ属 (*Amblyomma*) の種、カクマダニ属 (*Dermacentor*) の種、イボマダニ属 (*Hyalomma*) の種及びチマダニ属 (*Haemaphysalis*) の種 ; 並びにノミ、例えば、シテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*) (ネコノミ) 及びシテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*) (イヌノミ) を含めた外部寄生生物に対して有効である。

10

20

30

40

50

【0437】

獣医学セクターにおける非農学的適用は、通常的手段により、例えば、錠剤、カプセル剤、ドリンク、ドレンチ調製物、粒質物、ペースト、ボーラス、フィードスルー手順、若しくは坐剤の形態での経腸投与により ; 又は非経口投与、例えば、注射 (筋内、皮下、静脈内、腹腔内を含めた) 若しくは埋込物により ; 経鼻投与により ; 例えば、浸漬若しくは液浸、噴霧、洗浄、粉末によるコーティング、又は動物の小領域への適用の形態における、及び本開示の化合物若しくは組成物を含む物品、例えば、首輪、耳標、テイルバンド、肢バンド若しくは端綱を介した局所投与による。

【0438】

典型的には、本開示による殺寄生生物性組成物は、式1の化合物、そのN-オキシド又は塩と、意図する投与経路 (例えば、経口、局所又は非経口投与、例えば、注射) に関して、且つ標準的な実務に従って選択される添加剤及び助剤を含む1種若しくは複数の薬学的又は獣医学的に許容される担体との混合物を含む。さらに、適切な担体は、pH及び水分含有量に対する安定性などの考慮を含めた組成物中の1種若しくは複数の活性成分との適合性に基づいて選択される。したがって、注目すべきは、寄生性有効量の本開示の化合物及び少なくとも1種の担体を含む、無脊椎動物寄生性有害生物から動物を保護するための組成物である。

【0439】

静脈内、筋内及び皮下注射を含めた非経口投与のために、本開示の化合物は、油性又は水性ビヒクル中の懸濁液、溶液又はエマルジョン中で配合することができ、補助剤、例えば、懸濁化剤、安定化剤及び／又は分散化剤を含有し得る。注射のための医薬組成物は、好ましくは、医薬製剤の当技術分野において公知のような他の添加剤又は助剤を含有する生理学的に適合性の緩衝液中の、活性成分 (例えば、活性化合物の塩) の水溶性形態の水

溶液を含む。

【0440】

溶液（吸収のために最も容易に利用可能な形態）、エマルジョン、懸濁液、ペースト、ゲル、カプセル剤、錠剤、ボラス、粉末、顆粒、ルーメンーリテンション及び飼料／水／リックブロックの形態での経口投与のために、本開示の化合物は、経口投与組成物に適した当技術分野において公知の結合剤／充填剤、例えば、糖（例えば、ラクトース、スクロース、マンニトール、ソルビトール）、デンプン（例えば、トウモロコシデンプン、コムギデンプン、米デンプン、バレイショデンプン）、セルロース及び誘導体（例えば、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、エチルヒドロキシセルロース）、タンパク質誘導体（例えば、ゼイン、ゼラチン）、及び合成ポリマー（例えば、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン）とともに配合することができる。必要に応じて、滑沢剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム）、崩壊剤（例えば、架橋ポリビニルピロリジノン、寒天、アルギン酸）及び染料又は顔料を加えることができる。ペースト及びゲルはまた、組成物が口腔と接触を続け、且つ容易に排出されないことにおいて補助する接着剤（例えば、アカシア、アルギン酸、ベントナイト、セルロース、キサンタンガム、コロイド状ケイ酸アルミニウムマグネシウム）を含有することが多い。

10

【0441】

殺寄生生物性組成物が飼料濃縮物の形態である場合、担体は典型的には、高性能飼料、穀類飼料又はタンパク質濃縮物から選択される。このような飼料濃縮物含有組成物は、殺寄生生物性活性成分に加えて、動物の健康若しくは成長を促進し、殺のために動物からの肉の質を改善させる添加物、又は他に畜産にとって有益である添加物を含むことができる。これらの添加物は、例えば、ビタミン、抗生物質、化学療法剤、制菌剤、制真菌薬、抗コクシジウム剤及びホルモンを含むことができる。

20

【0442】

本開示の化合物は、経口投与及び摂取からの全体的利用可能性を実現する都合よい薬物動態学的及び薬力学的特性を有することが発見されてきた。したがって、保護される動物による摂取の後、血流中の殺寄生生物有効濃度の本開示の化合物は、処置された動物を吸血有害生物、例えば、ノミ、ダニ及びシラミから保護する。したがって、注目すべきは、経口投与（すなわち、殺寄生生物有効量の本開示の化合物に加えて、経口投与に適した結合剤及び充填剤、並びに飼料濃縮物担体から選択される1種若しくは複数の担体を含む）のための形態の、動物を無脊椎寄生性有害生物から保護するための組成物である。

30

【0443】

局所投与のための配合物は典型的には、粉末、クリーム、懸濁液、スプレー、エマルジョン、泡、ペースト、エアゾール、軟膏剤、軟膏又はゲルの形態である。より典型的には、局所配合物は、使用前に希釈される濃縮物の形態でよい水溶性溶液である。局所投与に適した殺寄生生物性組成物は典型的には、本開示の化合物及び1種若しくは複数の局所的に適切な担体を含む。ライン又はスポットとしての動物の外表面への局所的な殺寄生生物性組成物の適用（すなわち、「スポットオン」処理）において、活性成分は、動物の表面に亘り移動し、その外部表面積の大部分又は全てカバーする。その結果、処置された動物は、動物の表皮に寄生する無脊椎有害生物、例えば、ダニ、ノミ及びシラミから特に保護される。したがって、局所局所的投与のための配合物は、皮膚を亘る活性成分の輸送及び／又は動物の表皮への浸透を促進する少なくとも1種の有機溶媒を含むことが多い。このような配合物中で担体として一般に使用される溶媒には、プロピレングリコール、パラフィン、芳香族化合物、エステル、例えば、ミリスチン酸イソプロピル、グリコールエーテル、並びにアルコール、例えば、エタノール及びn-プロパノールが含まれる。

40

【0444】

有効な防除のために必要とされる適用の割合（すなわち、「生物学的有効量」）は、防除される無脊椎動物の種、有害生物の生活環、ライフステージ、そのサイズ、場所、時節、宿主作物又は動物、摂食行動、交尾行動、周囲水分、温度などなどの要因によって決まる。通常の場合で、1ヘクタール当たり約0.01～2kgの活性成分の散布量は、農

50

学的生態系において有害生物を防除するのに十分であるが、せいぜい $0.0001 \text{ kg} / \text{ヘクタール}$ は十分であり得るか、又は $8 \text{ kg} / \text{ヘクタール}$ と同量を必要とし得る。非農学的適用のために、有効な使用割合は、約 $1.0 \sim 50 \text{ mg} / \text{平方メートル}$ の範囲であるが、せいぜい $0.1 \text{ mg} / \text{平方メートル}$ は十分であり得るか、又は $150 \text{ mg} / \text{平方メートル}$ と同量を必要とし得る。当業者は、望ましいレベルの無脊椎有害生物防除にとって必要である生物学的有効量を容易に決定することができる。

【0445】

一般に、獣医学における使用のために、式1の化合物、そのN-オキシド又は塩は、無脊椎寄生性有害生物から保護される動物に殺寄生生物有効量で投与される。殺寄生生物有効量は、観察可能な効果を達成して、標的無脊椎寄生性有害生物の出現又は活性を減少させるのに必要とされる活性成分の量である。寄生性有効用量は、本開示の様々な化合物及び組成物、望ましい寄生性効果及び期間、標的無脊椎有害生物種、保護される動物、適用のモードなどのために変化することができ、特定の結果を達成するのに必要とされる量は、単純な実験法によって決定することができることを当業者は認識する。

10

【0446】

恒温動物への経口投与のために、本開示の化合物の1日投与量は典型的には、約 $0.01 \text{ mg} / \text{kg} \sim 100 \text{ mg} / \text{kg}$ 、より典型的には、約 $0.5 \text{ mg} / \text{kg} \sim 100 \text{ mg} / \text{kg}$ （動物体の体重）の範囲である。局所（例えば、皮膚）投与のために、ディップ及びスプレーは典型的には、約 $0.5 \text{ ppm} \sim 5000 \text{ ppm}$ 、より典型的には、約 $1 \text{ ppm} \sim 3000 \text{ ppm}$ の本開示の化合物を含有する。

20

【0447】

先行するスキーム1～11及び合成実施例1～2において記載したような方法及びバリエーションによって調製される式1の特定の化合物を、下記の索引表A及びBにおいて示す。 ^1H NMRデータについて索引表Cを参照されたい。質量スペクトル(MS)データについて、報告された数値は、大気圧化学イオン化(AP⁺)を使用した質量分析法によって観察される、分子へのH⁺（1の分子量）の添加によって形成される最も高い同位体存在度親イオン(M+1)の分子量である。下記の略語を下記の索引表において使用する。Cmpdは、化合物を意味し、tは、第3級を意味し、cは、シクロを意味し、Meは、メチルを意味し、Etは、エチルを意味し、Prは、プロピルを意味し、i-Prは、イソプロピルを意味し、Buは、ブチルを意味し、c-Prはシクロプロピルを意味し、c-Pnは、シクロペンチルを意味し、c-Hxは、シクロヘキシルを意味し、t-Buは、第三級ブチルを意味し、Phは、フェニルを意味し、OMeは、メトキシを意味し、SMeは、メチルチオを意味し、SO₂Meは、メチルスルホニルを意味する。構造フラグメントにおける波線は、分子の残部へのフラグメントの付着点を示す。略語「Ex.」は、「実施例」を表し、その後に続く番号は、どの合成実施例において化合物が調製されるかを示している。

30

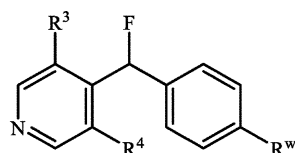
【0448】

40

50

【表 2 3】

索引表 A



化合物 番号	R ³	R ⁴	R ^W	MS データ
1	F	ピラゾール-1-イル	-SCF ₃	372
2	F	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	-SCF ₃	373
3	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SCF ₃	373
4	F	3-(トリフルオロメチル)-1 <i>H</i> - ピラゾール-1-イル	-SCF ₃	440
5	F	3-メチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	-SCF ₃	386
6	F	4-メチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-1-イル	-SCF ₃	386
7	F	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	-SCF ₃	357
8	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	357
9	H	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	339
10	H	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル	-OCF ₃	339
11	H	ピラゾール-1-イル	-OCF ₃	338
12	H	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	-OCF ₃	339
13	H	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₂ CHF ₂	389
14	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	373
15	Cl	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	-OCF ₃	373
17	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	417
18	F	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	-CF ₃	341
19	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	369
20	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-CF ₃	341
21	F	ピラゾール-1-イル	-CF ₃	340
22	F	フラン-2-イル	-OCF ₃	356
23	F	フラン-3-イル	-OCF ₃	356
24	Cl	2λ ² -テトラゾール-5-イル	-OCF ₃	374
25	F	1-メチル-1 <i>H</i> -イミダゾール-2-イル	-OCF ₃	370

【 0 4 4 9 】

10

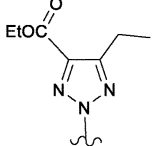
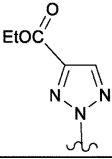
20

30

40

50

【表 2 4】

26	F	1 <i>H</i> -ピロール-2-イル	-OCF ₃	355
27	Br		-OCF ₃	517
28	Br		-OCF ₃	489
29	Br	4,5-ジブロモ-2 <i>H</i> -1,2,3- トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	*
30	F	1,3,4-オキサジアゾール-2-イル	-OCF ₃	358
31	F	5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール -2-イル	-OCF ₃	372
32	F	オキサゾール-2-イル	-OCF ₃	357
33	F	チアゾール-2-イル	-OCF ₃	373
34	F	オキサゾール-5-イル	-OCF ₃	357
35	-OMe	オキサゾール-5-イル	-OCF ₃	369
36	F	チアゾール-2-イル	-OCF ₃	*
38	Me	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	353
39	F	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール -5-イル	-OCF ₃	*
40	F	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-3-イル	-OCF ₃	357
41	F	イソオキサゾール-5-イル	-OCF ₃	357
42	F	1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル	-OCF ₃	357
43	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-C(OMe)(CF ₃) ₂	453
44	F	1-エチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	-OCF ₃	384
45	F	チオフェン-2-イル	-OCF ₃	372
46	F	チオフェン-3-イル	-OCF ₃	372
47	Me	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル	-OCF ₃	353
48	CN	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	*
49	F	チアゾール-4-イル	-OCF ₃	373
50	Cl	チアゾール-2-イル	-OCF ₃	389
51	Cl	オキサゾール-2-イル	-OCF ₃	373

【 0 4 5 0 】

10

20

30

40

50

【表 2 5】

53	^c - プロピル	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	379
54	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SO ₂ CF ₃	405
55	F	1-エチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-5-イル	-OCF ₃	384
56	F	1-イソプロピル-1 <i>H</i> -ピラゾール-4- イル	-OCF ₃	398
57	F	1-エチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	-OCF ₃	384
58	F	1-(2,2,2-トリフルオロエチル)- 1 <i>H</i> -ピラゾール-4-イル	-OCF ₃	438
59	F	1-メチル-1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	-OCF ₃	370
60	Cl	オキサゾール-5-イル	-OCF ₃	373
61	F	4 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-4-イル	-SCF ₃	372
62	F	1- <i>i</i> -プロピル-1 <i>H</i> -ピラゾール-3- イル	-OCF ₃	398
63	F	1-(2,2,2-トリフルオロエチル)- 1 <i>H</i> -ピラゾール-3-イル	-OCF ₃	438
64	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SO ₂ CF ₃	465
67	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SOCF ₃	389
68	H	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル	-SCF ₃	355
69	H	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SCF ₃	355
73	F	ピラゾール-1-イル	-SOCF ₃	388
77	F	チアゾール-2-イル	-SCF ₃	389
78	F	オキサゾール-2-イル	-SCF ₃	373
85	Br	ピラゾール-1-イル	-SCF ₃	432
86	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SCF ₃	433
87	Br	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル	-SCF ₃	433
88	Cl	ピラゾール-1-イル	-OCF ₃	372
89	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SCF ₃	389
90	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SOCF ₃	405
91	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-SO ₂ CF ₃	421
92	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	Br	351
93	F	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール -5-イル	SCF ₃	388
94	F	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール -5-イル	SOCF ₃	404
95	I	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	481

10

20

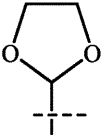
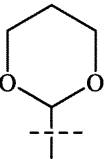
30

40

【 0 4 5 1】

50

【表 2 6】

96	F		SCF3	378
97	I	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	SOCF3	497
98	F		SCF3	392
99	I	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	CF2H	431
100	F	オキサゾール-5-イル	SCF3	373
101	F	オキサゾール-5-イル	SOCF3	389
102	Cl	ピラゾール-1-イル	SCF3	388
103	Cl	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	SCF3	404
104	Cl	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	SOCF3	420
105	Cl	オキサゾール-5-イル	SCF3	389
106	Cl	1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	SCF3	390
107	Cl	オキサゾール-5-イル	SOCF3	405
108	Br	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	t-Bu	389
109	Cl	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	Br	367
110	Cl	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	t-Bu	345
111	F	チオフェン-2-イル	SCF3	388
112	F	チオフェン-2-イル	SCF3	388
113	F	2-メチル-チオフェン-3-イル	SCF3	402
114	F	3-メチル-チオフェン-4-イル	SCF3	402
115	F	4-メチル-2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF3	387
116	F	4-メチル-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル	SCF3	387

【 0 4 5 2 】

10

20

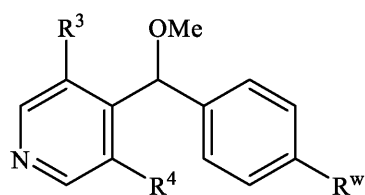
30

40

50

【表 2 7】

索引表 B



化合物 番号	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ^ʷ	<u>MS データ</u>
16	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	385
37	F	ピラゾール-1-イル	-OCF ₃	368

10

【 0 4 5 3 】

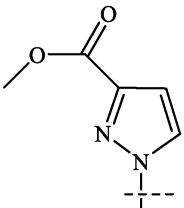
20

30

40

50

【表 2 8】

52	Cl	ピラゾール-1-イル	-OCF ₃	384
65	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	-OCF ₃	429
66	Br	ピラゾール-1-イル	-OCF ₃	428
70	F	ピラゾール-1-イル	-SCF ₃	384
71	F	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	-SCF ₃	385
72	F	ピラゾール-1-イル	-SOCF ₃	400
74	F	1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	-SOCF ₃	401
75	F	チアゾール-2-イル	-SCF ₃	401
76	F	オキサゾール-2-イル	-SCF ₃	385
79	F	5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	-SCF ₃	400
80	F	2,5-ジヒドロ-5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	-SCF ₃	402
81	F	5-トリフルオロメチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	-SCF ₃	454
82	F	3-メチル-5-イソオキサゾリル	-SCF ₃	399
83	F	1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	-SCF ₃	386
84	F	2,5-ジヒドロ-5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	-SCF ₃	418
117	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	Br	363
118	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₂ H	367
119	I	ピラゾール-1-イル	SCF ₃	492
120	I	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	493
121	F	3-ニトリル-ピラゾール-1-イル	SCF ₃	409
122	F		SCF ₃	442
123	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	385
124	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	OCF ₃	369/S-エナンチオマー**

【 0 4 5 4 】

10

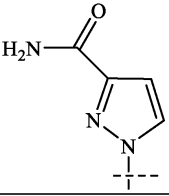
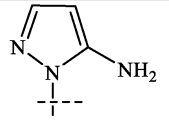
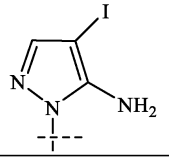
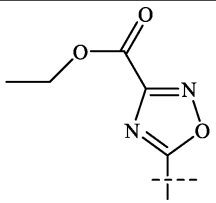
20

30

40

50

【表 2 9】

125	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	OCF ₃	369/R-エナンチオマー
126	Cl	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル	OCF ₃	385
127	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	401
128	Cl	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル	SCF ₃	401
129	I	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	OCF ₃	477
130	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	401/R-エナンチオマー
131	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	401/S-エナンチオマー
132	F		SCF ₃	
133	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	445
134	Br	1 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-1-イル	SCF ₃	445
135	F	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	SCF ₃	400
136	F		SCF ₃	399
137	F	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	OCF ₃	384
138	F	1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	OCF ₃	370
139	F	1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	t-Bu	342
140	F		SCF ₃	525
141	F	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	OCH ₃	315
142	Cl	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	OCF ₃	400
143	F	4-メチル-2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	SCF ₃	399
144	Cl		OCF ₃	458

【 0 4 5 5 】

【表 3 0】

145	H	2 <i>H</i> -1,2,3-トリアゾール-2-イル	OCF ₃	351
146	Cl	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	SCF ₃	416

**[α]₂₅ = +153.54° [C=0.30%, MeOH]

10

20

30

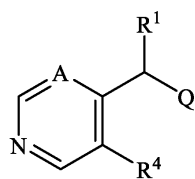
40

50

【 0 4 5 6 】

【 表 3 1 】

索引表 C



化合物 番号	A	R4	R1	Q	MS データ
147	C-Br	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		414
148	C-Br	1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル	F		414
149	C-Cl	1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル	F		369
150	C-Cl	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		369
151	C-F	ピラゾール-1-イル	F		352
152	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		353
153	C-Cl	ピラゾール-1-イル	F		367
154	C-F	ピラゾール-1-イル	OEt	p-C6H4OCF3	*
155	C-F	ピラゾール-1-イル	OMe		*
156	C-F	ピラゾール-1-イル	F		341
157	C-F	ピラゾール-1-イル	OMe		353
158	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	OMe		354

【 0 4 5 7 】

10

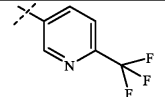
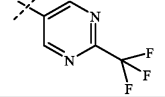
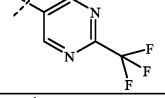
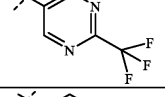
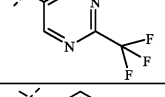
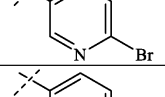
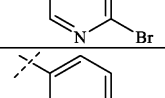
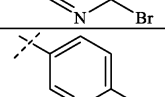
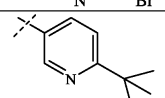
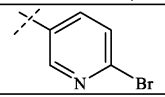
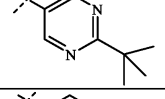
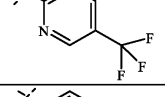
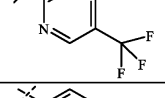
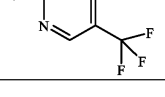
20

30

40

50

【表 3 2】

159	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	OMe		342
160	C-F	ピラゾール-1-イル	OMe		354
161	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	OMe		355
162	C-F	ピラゾール-1-イル	F		342
163	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		343
164	C-F	ピラゾール-1-イル	OMe		363
165	C-F	ピラゾール-1-イル	F		351
166	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		352
167	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	OMe		364
168	C-Cl	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		346
169	C-Cl	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		368
170	C-Cl	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		347
171	C-F	ピラゾール-1-イル	F		341
172	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	F		342
173	C-F	ピラゾール-1-イル	OMe		353

【 0 4 5 8 】

10

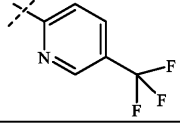
20

30

40

50

【表 3 3】

174	C-F	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	OMe		354
175	N	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	OMe	p-C6H4OCF3	352
176	N	ピラゾール-1-イル	OMe	p-C6H4OCF3	353
177	N	ピラゾール-1-イル	OMe	p-C6H4CF3	335

10

*¹H NMR データについては索引表 D を参照されたい。

【0 4 5 9】

【表 3 4】

索引表 D

化合物番号	¹ H NMR データ(他に示さない限り、CDCl ₃ 溶液) ^a
29	δ 8.62 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.25 (d, 2H), 6.95 (d, 1H).
36	δ 8.80 (s, br. 1H), 8.55 (s, br. 1H), 8.01 (d, 1H), 7.63 (d, 2H), 7.56 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.22 (d, 1H).
39	δ 9.13 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 2.52 (s, 3H).
48	δ 9.29 (s, 1H), 8.99 (s, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.44 (d, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.23 (d, 1H).
154	δ 8.50 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.44 (d, 2H), 7.14 (d, 2H), 6.51 (s, 1H), 5.69 (s, 1H), 3.47 (q, 2H), 1.19 (t, 3H).
155	δ ppm 3.32 (s, 3 H), 5.55 (s, 1 H), 6.55 (s, 1 H), 6.97 (d, J=8.35 Hz, 1 H), 7.10 (d, J=8.05 Hz, 1H), 7.25 - 7.28 (m, 1 H), 7.70 (d, J=2.57 Hz, 1 H), 7.82 (s, 1 H), 8.47 (s, 1 H), 8.51 (s, 1 H).

20

30

^a ¹H NMR データは、テトラメチルシランからの ppm 低磁場にある。カップリングは、(s)-一重線、(d)-二重線、(t)-三重線、(m)-多重項、(dd)-二重線の二重線、(dt)-三重線の二重線、(br s)-幅広い一重線、(br t)-幅広い三重線と指定される。

【0 4 6 0】

下記の試験は、特定の有害生物に対する本開示の化合物の防除有効性を示す。「防除有効性」は、相当に低減された摂食をもたらす無脊椎有害生物発生の阻害（死亡率を含めた）を表す。しかし、化合物によってもたらされる有害生物防除保護は、これらの種に限定されない。化合物の説明について索引表 A 及び B を参照されたい。

40

【0 4 6 1】

生物学的実施例

試験 A～H のための配合及び噴霧方法

試験コンパウンド物は、10%のアセトン、90%の水、及び300ppmのActivator 90（登録商標）ノニオン性界面活性剤（Loveland Products, Loveland, Colorado, USA）を含む溶液を使用して配合した。その配合したコンパウンド物を、それぞれの試験ユニットの上1.27cm（0.5イン

50

チ)に位置させたアトマイザーノズルを通して1mLの液体の中で適用した。所定の速度で試験コンパウンド物を噴霧し、それぞれの試験を3回繰り返した。

【0462】

試験A

コナガ(diamondback moth)(ブルテラ・キシロステラ・(L.)(Plutella xylostella (L.))の防除を評価するための試験ユニットが、12~14日齢のカラシ植物(mustard plant)を内側に入れた小型の開放容器で構成されていた。これには、約50匹の生まれたての幼虫を用い、イノキュレーターを使用し、トウモロコシの穂軸の粗粒を介してその試験ユニットの中に分配することにより、予備的に寄生させた。試験ユニットの中に分配させた後、それらの幼虫は、試験植物の上へ移動した。

10

【0463】

試験コンパウンド物を配合し、250ppmで噴霧した。配合された試験コンパウンド物を噴霧した後で、試験ユニットを1時間放置して乾燥させ、次いでその上に黒色の網蓋を置いた。それらの試験ユニットを、グロースチャンバーの中、25℃、70%相対湿度で6日間保持した。次いで、消費された茎葉を基準にして、植物の摂食ダメージを肉眼で調べ、評価して、幼虫の死亡率を評価した。

【0464】

250ppmで試験した式1の化合物の内では、以下のものが、極めて良好ないしは優れたレベルの防除有効性(40%以下の摂食ダメージ、及び/又は100%の死亡率)を与えた:1、3、18、19、20、21、22、23、29、30、32、33、34、36、39、45、48、50、51、53、55、59、60、78、89、92、100、103、104、105、118、120、123、125、130、133、147、155、162、166、171、172、175。

20

【0465】

試験B

接触性及び/又は浸透性手段を介しての、コーンプラントホッパー(ペレグリヌス・マイディス(Peregrinus maidis)(アシュミード(ashmead))の防除を評価するために、その試験ユニットが、3~4日齢のトウモロコシ(corn、maize)植物を入れた小型の開放容器で構成されていた。土壌の上に白砂を加えてから、試験化合物を施用した。

30

【0466】

試験コンパウンド物を配合し、250及び/又は50ppm及び/又は10ppmで噴霧した。その配合された試験コンパウンド物を噴霧した後で、それらの試験ユニットを、1時間放置して乾燥させてから、それらに、約15~20匹の幼虫(18~21日齢)を、後寄生させた。それぞれの試験ユニットの上に黒色の網蓋を置き、試験ユニットを、グロースチャンバー中で、22~24℃、50~70%相対湿度で6日間保持した。次いでそれぞれの試験ユニットについて、昆虫の死亡率を肉眼で評価した。

【0467】

250ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも80%の死亡率をもたらした:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、25、26、30、31、32、33、34、36、37、38、39、49、67、69、70、75、76、77、78、79、81、82、83、85、86、88、89、90、92、93、94、95、96、98、103、104、105、106、108、109、110、111、112、113、114、120、123、125、127、130、138、139、147、156、157、158、159、161、163、166、168、169、170、172、173、174、175。

40

【0468】

50ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも80%の死亡率をもたら

50

した：1、2、3、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、25、26、29、30、31、32、33、34、36、37、38、39、40、41、43、45、46、48、49、50、51、55、56、57、62、63、64、65、67、69、70、76、77、78、79、83、85、86、88、89、90、92、93、94、95、96、98、103、104、105、106、108、109、110、111、112、113、114、120、123、125、127、130、138、139、147、156、157、158、159、161、163、166、168、169、170、172、173、174、175。

【0469】

10ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも80%の死亡率をもたらした：22、30、32、33、38、41、43、45、46、48、49、50、51、62、69、70、78、89、92、93、94、95、96、98、103、106、109、110、111、112、113、114、123、125、127、130、147、156、159、163、169、172、173、174。

【0470】

試験C

接触性及び／又は浸透性手段を介しての、ポテト・リーフホッパー（potato leafhopper）（エンポアスカ・ファバエ・（ハリス））（Empoasca fabae（Harris））の防除を評価するために、その試験ユニットが、5～6日齢のソレイユ（Solleil）マメ植物（初生葉が発芽したもの）を内側に入れた小型の開放容器で構成されていた。土壌の上に白砂を加え、初生葉の一方を切除してから、試験コンパウンド物を施用した。

【0471】

試験コンパウンド物を配合し、250ppmで噴霧した。その配合された試験コンパウンド物を噴霧した後で、それらの試験ユニットを、1時間放置して乾燥させてから、それらに、5匹のポテト・リーフホッパー（18～21日齢の成虫）を、後寄生させた。その試験ユニットの上に黒色の網蓋を置き、その試験ユニットを、20℃、70%相対湿度のグロースチャンバーの中で、6日間保持した。次いで、それぞれの試験ユニットについて、肉眼で調べて、昆虫の死亡率を評価した。

【0472】

250ppmで試験した式1の化合物の内では、以下のもので、少なくとも80%の死亡率が得られた：4、8、9、11、14、21、32、33、36、37、69。

【0473】

試験D

接触性及び／又は浸透性手段を介しての、モモアカアブラムシ（Green Peach Aphid）（ミズス・ペルシカエ・（スルザー））（Myzus persicae（Sulzer））の防除を評価するために、その試験ユニットが、12～15日齢のラディッシュ植物を内側に入れた小型の開放容器で構成されていた。これを試験植物の葉の上に置くことにより、栽培植物から切除した葉片の上に、30～40匹のアブラムシをあらかじめ寄生させた（切葉法（cut-leaf method））。葉片が乾燥するにつれて、アブラムシは、試験植物の上へ移動した。あらかじめ侵食させた後で、その試験ユニットの土壌を、砂の層で覆った。

【0474】

コンパウンド物を250及び／又は50ppmで配合し、噴霧した。配合された試験コンパウンド物を噴霧した後で、試験ユニットを1時間放置して乾燥させ、次いでその上に黒色の網蓋を置いた。それらの試験ユニットを、グロースチャンバーの中、19～21℃、50～70%相対湿度で6日間保持した。次いでそれぞれの試験ユニットについて、昆虫の死亡率を肉眼で評価した。

【0475】

10

20

30

40

50

250ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも80%の死亡率をもたらした：1、2、3、5、7、8、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、25、29、30、34、36、37、38、39、48、54、67、68、69、70、71、72、74、77、78、79、81、83、86、87。1、2、3、5、7、8、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、25、29、30、34、36、37、38、39、48、54、67、68、69、70、71、72、74、77、78、79、81、83、86、87、88、89、90、91、93、94、95、96、97、103、104、118、123、125、127、130、147、159、163。

【0476】

10

50ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも80%の死亡率をもたらした：2、3、7、8、13、14、15、16、17、18、19、20、21、29、34、39、48、54、67、69、71、74、78、86、89、90、91、93、94、95、103、104、118、123、125、127、130、147、159。

【0477】

試験E

接触性及び／又は浸透性手段を介しての、ワタアブラムシ (cotton melon aphid) (アフィス・ゴシピイ・(グロバー) (Aphis gossypii (Glover))) の防除を評価するために、その試験ユニットが、5日齢のオクラ植物を内側に入れた小型の開放容器で構成されていた。これに、切葉法によって、葉片の上に30～40匹の昆虫を予め寄生させ、そしてその試験ユニットの土壌を、砂の層で覆った。

20

【0478】

試験コンパウンド物を配合し、250及び／又は50ppmで噴霧した。噴霧した後で、その試験ユニットを、グロースチャンバーの中、19℃、70%相対湿度で6日間保持した。次いで、それぞれの試験ユニットについて、肉眼で調べて、昆虫の死亡率を評価した。

【0479】

250ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも80%の死亡率をもたらした：1、2、3、7、8、9、11、12、14、16、17、19、20、21、22、29、32、33、34、36、37、38、39、41、45、49、50、51、52、54、56、57、59、60、62、64、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、83、84、85、86、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、100、102、103、104、105、106、109、111、112、113、118、123、125、127、130、133、147、148、154、156、157、158、159、160、161、163、166、169、171、172、174、175、176。

30

【0480】

50ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも80%の死亡率をもたらした：1、3、8、9、11、12、14、16、17、19、20、21、22、29、32、33、34、36、37、38、39、45、50、51、54、67、68、69、70、71、73、74、76、78、83、85、86、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、100、102、103、104、105、106、109、111、112、113、118、123、125、127、130、133、147、148、154、156、157、158、159、160、161、163、166、169、171、172、174、175、176。

40

【0481】

試験F

接触性及び／又は浸透性手段を介しての、タバココナジラミ (sweet potato white fly) (ベミシア・タバチ・(ゲンナディウス) (Bemisia tab

50

a c i (G e n n a d i u s)) の防除を評価するために、その試験ユニットが、12～14日齢のワタ植物を内側に入れた小型の開放容器で構成されていた。噴霧施用に先だって、その植物から両方の子葉 (b o t h c o t y l e d o n) を除き、試験のための1枚の本葉を残した。成虫のコナジラミにその葉の上に産卵させてから、試験ユニットから除いた。少なくとも15個の卵を生み付けたワタ植物を、噴霧のための試験に供した。

【0482】

試験コンパウンド物を配合し、250及び／又は50ppmで噴霧した。噴霧の後、1時間放置して、その試験ユニットを乾燥させた。次いでシリンダーを取り除き、そのユニットを、グロースチャンバーに入れ、28℃、50～70%相対湿度で13日間保持した。次いで、それぞれの試験ユニットについて、肉眼で調べて、昆虫の死亡率を評価した。

10

【0483】

250ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも70%の死亡率をもたらした：1、3、12、13、14、15、17、19、29、36、37、39、67、69、71、78、88、89、90、91、92、93、94、95、108、109、117、118、120、123、125、127、133、134、147、155、156、168、172。

【0484】

50ppmで試験した式1の化合物の内、下記は、少なくとも70%の死亡率をもたらした：1、13、14、19、69、71、78、88、89、90、91、92、93、94、95、108、109、117、118、120、123、125、127、133、134、147、155、156、168、172。

20

【0485】

試験G

接触性及び／又は浸透性手段を介しての、ミカンキイロアザミウマ (W e s t e r n F l o w e r T h r i p s) (フ ラ ン ク リ ニ エ ラ ・ オ ク シ デ ン タ リ ス ・ (ペ ル ガ ン デ) (F r a n k l i n i e l l a o c c i d e n t a l i s (P e r g a n d e)) の防除を評価するために、その試験ユニットが、5～7日齢のソレイユマメ植物を内側に入れた小型の開放容器で構成されていた。

【0486】

試験コンパウンド物を配合し、250ppmで噴霧した。噴霧の後、1時間放置して、その試験ユニットを乾燥させてから、それぞれのユニットに、約60匹のアザミウマ（成虫及び幼虫）を加えた。試験ユニットの上に黒色の網蓋を置き、25℃、45～55%相対湿度で6日間保持した。次いで、それぞれの試験ユニットについて、植物のダメージと昆虫死亡率を、肉眼で評価した。

30

【0487】

250ppmで試験した式1の化合物の内では、以下のものが、極めて良好ないしは優れたレベルの防除有効性（30%以下の植物のダメージ、及び／又は100%の死亡率）を与えた：1、19、29、32、33、36、41、50。

【0488】

さらなる実施例

40

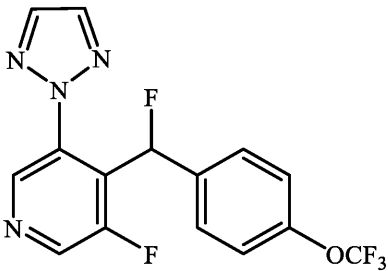
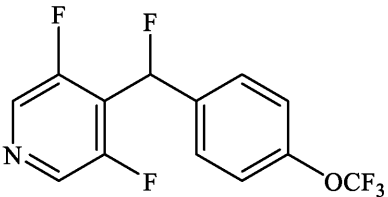
防除有効性及び蒸気圧

化合物8及びAについての防除有効性及び蒸気圧の値を、追加の表1において示す。

【0489】

【表 3 5】

追加の表 1

化合物		8				A			
構造									
防除 有効性		CMA	GPA	CPH	PLH	CMA	GPA	CPH	PLH
	250ppm	80	100	100	93	72	L	92	L
	50ppm	96	100	100	0	67	L	100	L
	10ppm	88	94	95				53	
	2ppm	79	100	89				4	
蒸気圧		6.04E-06				1.45E-03			

10

20

【0490】

CMAは、ワタメロンアブラムシを表し；GPAは、モモアカアブラムシを表し；CPHは、コーンプラントホッパーを表し；PLHは、ポテトリーフホッパーを表す。

【0491】

両方の化合物の防除有効性についての試験プロトコルは、生物学的実施例セクションにおいて記載する通りである。

【0492】

両方の化合物についての蒸気圧値を得るための手順は下記の通りである。

試験化合物の溶液は、50 μg/mLの濃度でのアセトニトリル中で調製し、次いで、ガスクロマトグラフィー／質量分析法（GC／MS）によって分析した。標準化合物の既知の蒸気圧値に対する保持時間の線形相関を使用して、内挿を使用することによって試験化合物の蒸気圧の推定値を得る。対象化合物の検出及び保持時間は、質量スペクトルの解釈によって確認される。

30

【0493】

驚いたことに、本開示の化合物8が、CMA、GPA及びCPHの種に対して2 ppmに至るまで、並びにPLHに対して250 ppmにて、化合物Aよりも有意により高い防除有効性を示すことを結果は示す。結果はまた、化合物8の蒸気圧が化合物Aのそれより有意により低く、殆ど1000分の1低いことを示す。化合物8及びAの間の唯一の構造の差異は、式1の化合物8が、5員複素環式環トリアゾール-1-イルとしてR⁴を有し、一方、化合物Aが、FとしてR⁴を有することであり、それは本開示の範囲から化合物Aを除外することが留意される。この理論に束縛されるものではないが、化合物の揮発性が低くさせる複素環式環としてのR⁴は、少なくとも部分的により高い防除有効性の原因となり得ることが意図されている。

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/US2021/015643

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D401/04 C07D401/14 C07D405/04 C07D405/14 C07D409/04
 C07D413/04 A01N43/40 A01N43/50 A01N43/54 A01N43/56
 A01N43/647 A01N43/76 A01N43/78 A01N43/80 A01N43/82

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2012/087630 A1 (DU PONT [US]; XU MING [US]) 28 June 2012 (2012-06-28) compounds of tables 46A, 47A, 94A, 95A and 96A and compound 171 on page 112; claim 1 -----	1-5, 12-19

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

16 April 2021

Date of mailing of the international search report

17/06/2021

Name and mailing address of the ISA/

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

Authorized officer

Bérillon, Laurent

Information on patent family members

PCT/US2021/015643

.....

International Application No. PCT/ US2021/ 015643

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. claims: 2-5(completely); 1, 12-19(partially)

Compounds of formula 1 wherein R1 is F

2. claims: 6-11(completely); 1, 12-19(partially)

Compounds of formula 1 wherein R1 is OR6 or S(0)mR6

10

20

30

40

50

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2021/015643

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

10

20

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

see additional sheet

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

30

40

2-5(completely); 1, 12-19(partially)

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

C O 7 D	405/04 (2006.01)	C O 7 D	405/04	
A 6 1 K	31/443 (2006.01)	A 6 1 K	31/443	
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04	
A 0 1 N	43/647 (2006.01)	A 0 1 N	43/647	
A 0 1 N	43/56 (2006.01)	A 0 1 N	43/56	A
A 0 1 N	43/78 (2006.01)	A 0 1 N	43/78	B
A 0 1 N	43/76 (2006.01)	A 0 1 N	43/76	
A 0 1 N	43/836 (2006.01)	A 0 1 N	43/78	A
		A 0 1 N	43/836	

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

トメント

- (72)発明者 トウワイラ・エー・ブリデル
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 ドミニク・ミングータク・チャン
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 ユージョン・チェン
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 ジェyson・チャールズ・ハム
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 モウミタ・カー
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 トーマス・フランシス・パウツキー・ジュニア
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 トーマス・マーティン・スティーヴンソン
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 ミン・シュウ
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント
- (72)発明者 レイチェル・スラック
アメリカ合衆国ペンシルベニア州 1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナット・ストリート 2
9 2 9 . エフエムシー・コーポレーション・パテント・デパートメント

F ターム (参考) 4C063 AA01 BB01 BB02 CC41 CC42 CC58 CC62 CC81 DD12 EE01
EE03
4C086 AA01 AA02 AA03 BC17 BC60 BC69 BC71 BC82 GA02 GA07
GA08 GA09 MA01 MA04 NA14 ZB39 ZC61
4H011 AC01 BB09 BB10 DA02 DA03 DA14 DA15 DA16