

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7535532号
(P7535532)

(45)発行日 令和6年8月16日(2024.8.16)

(24)登録日 令和6年8月7日(2024.8.7)

(51)国際特許分類		F I	
C 0 7 D	471/04 (2006.01)	C 0 7 D	471/04 1 0 7 Z
A 0 1 N	53/14 (2006.01)	A 0 1 N	53/14
A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 P	7/02
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04
C 0 7 D	401/04 (2006.01)	C 0 7 D	401/04 C S P
請求項の数 8 (全118頁) 最終頁に続く			
(21)出願番号	特願2021-549662(P2021-549662)	(73)特許権者	313006625
(86)(22)出願日	令和2年2月24日(2020.2.24)		バイエル・アクチエンゲゼルシャフト
(65)公表番号	特表2022-521439(P2022-521439 A)		ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフ
			エルクーゼン、カイザー・ヴイルヘルム
(43)公表日	令和4年4月7日(2022.4.7)		ーアレー・1
(86)国際出願番号	PCT/EP2020/054747	(74)代理人	100114188
(87)国際公開番号	WO2020/173861		弁理士 小野 誠
(87)国際公開日	令和2年9月3日(2020.9.3)	(74)代理人	100119253
審査請求日	令和5年2月20日(2023.2.20)		弁理士 金山 賢教
(31)優先権主張番号	19159323.5	(74)代理人	100124855
(32)優先日	平成31年2月26日(2019.2.26)		弁理士 坪倉 道明
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)	(74)代理人	100129713
			弁理士 重森 一輝
		(74)代理人	100137213
			弁理士 安藤 健司
		最終頁に続く	

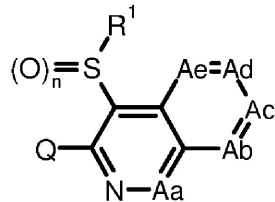
(54)【発明の名称】 有害生物防除剤としての縮合二環式複素環式誘導体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 (I)

【化1】



(I)

〔式中、

A aは、＝C (H)－を表し、

A bは、＝C (H)－を表し、

A cは、＝C (1－シアノシクロプロピル)－を表し、

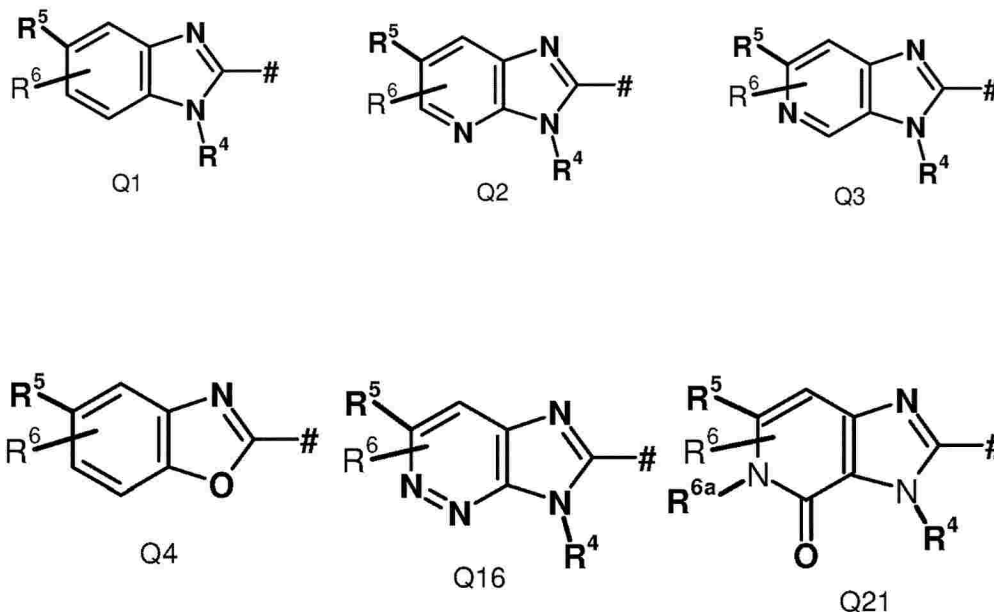
A dは、＝C (H)－を表し、

A eは、＝C (H)－を表し、

R¹は、(C₁－C₆)－アルキルを表し、

Qは、Q1～Q4、Q16およびQ21からなる群からのヘテロ芳香族の9員環の縮合二環式系を表し、

【化2】



R^4 は、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -シアノアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -アルケニルオキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (C_2-C_4) -アルキニルオキシ- (C_1-C_4) -アルキルまたは (C_3-C_6) -シクロアルキルを表し、

R^5 、 R^6 は、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -ハロアルケニル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (C_2-C_4) -ハロアルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルキル- (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルコキシイミノ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -アルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_4) -アルキルカルボニル、 (C_1-C_4) -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_4) -アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_4) -アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_4) -アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノスルホニルまたはジ- (C_1-C_4) -アルキルアミノスルホニルであり、 R^{6a} は、互いに独立して、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -シアノアルキル、 (C_1-C_4) -ヒドロキシアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -ハロアルケニル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (C_2-C_4) -ハロアルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルキル- (C_3-C_6) -シクロアルキルまたはハロ- (C_3-C_6) -シクロアルキルを表し、

n が、0、1または2を表す）、
の化合物。

【請求項 2】

R^1 が、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルを表し、
 R^4 が、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルまたは $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキルを表し、

R^5 が、水素、シアノ、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルカルボニルまたは $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルカルボニルを表し、

R^6 が、水素を表し、

R^{6a} が、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_2 - C_4)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ - ハロアルケニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_2 - C_4)$ - アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ - ハロアルキニルまたは $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキルを表し、

n が、0、1または2を表す、

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

R^1 が、メチル、エチル、 n - プロピル、イソプロピル、 n - ブチル、イソブチルまたは $tert$ - ブチルを表し、

R^4 が、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチルまたはメトキシエチルを表し、

R^5 が、フッ素、塩素、臭素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル (CH_2CFH_2 、 $CHFCH_3$)、ジフルオロエチル (CF_2CH_3 、 CH_2CHF_2 、 $CHFCHF_2$)、トリフルオロエチル (CH_2CF_3 、 $CHFCHF_2$ 、 CF_2CFH_2)、テトラフルオロエチル ($CHF CF_3$ 、 CF_2CHF_2)、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニルを表し、

R^6 が、水素を表し、

R^{6a} が、メチルを表し、

n が、0、1または2を表す、

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、エチルを表し、

R^4 が、メチルを表し、

R^5 が、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシまたはトリフルオロメチルスルホニルを表し、

R^6 が、水素を表し、

R^{6a} が、メチルを表し、

n が、2を表す、

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、ならびに増量剤および／または界面活性剤を含む農薬製剤。

【請求項 6】

さらなる農薬活性化合物をさらに含む、請求項 5 に記載の農薬製剤。

【請求項 7】

害虫を防除する方法であって、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物または請求項 5 または 6 に記載の農薬製剤を、害虫および／またはそれらの生息地に作用させることを特徴と

10

20

30

40

50

する方法であって、

ここで、ヒトの身体の外科的または治療的処置のための方法、およびヒトの身体で実施される診断方法が除外される、方法。

【請求項 8】

害虫を防除するための、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物または請求項 5 または 6 に記載の農薬製剤の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式 (I) の新規な縮合二環式複素環誘導体、害虫 (a n i m a l p e s t s)、特に節足動物、特に昆虫およびクモ類を防除するための殺ダニ剤および／または殺虫剤としてのそれらの使用、ならびにそれらの調製のための方法および中間体に関する。

【背景技術】

【0002】

殺虫特性を有する縮合二環式複素環誘導体は、文献、例えば、WO2010/125985、WO2012/074135、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2013/191113、WO2014/142292、WO2014/148451、WO2015/000715、WO2015/121136、WO2015/198859、WO2015/133603、WO2015/198859、WO2015/002211、WO2015/071180、WO2015/091945、WO2016/005263、WO2015/198817、WO2016/124563、WO2016/124557、WO2016/091731、WO2016/039444、WO2016/041819、WO2016/039441、WO2016/026848、WO2016/023954、WO2016/020286、WO2016/046071、WO2016/091731、WO2016/107742、WO2016/129684、WO2016/142326、2017/072039、WO2017/026384、WO2017/061497、WO2017/146220、WO2017/155103、WO2018/084142、WO2018/105632 に既に記載されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【文献】 WO2010/125985

【文献】 WO2012/074135

【文献】 WO2012/086848

【文献】 WO2013/018928

【文献】 WO2013/191113

【文献】 WO2014/142292

【文献】 WO2014/148451

【文献】 WO2015/000715

【文献】 WO2015/121136

【文献】 WO2015/198859

【文献】 WO2015/133603

【文献】 WO2015/198859

【文献】 WO2015/002211

【文献】 WO2015/071180

【文献】 WO2015/091945

【文献】 WO2016/005263

【文献】 WO2015/198817

【文献】 WO2016/124563

10

20

30

40

50

【文献】WO2016/124557
【文献】WO2016/091731
【文献】WO2016/039444
【文献】WO2016/041819
【文献】WO2016/039441
【文献】WO2016/026848
【文献】WO2016/023954
【文献】WO2016/020286
【文献】WO2016/046071
【文献】WO2016/091731
【文献】WO2016/107742
【文献】WO2016/129684
【文献】WO2016/142326
【文献】2017/072039
【文献】WO2017/026384
【文献】WO2017/061497
【文献】WO2017/146220
【文献】WO2017/155103
【文献】WO2018/084142
【文献】WO2018/105632
【0004】

10

現代の作物保護組成物は、例えば、その作用の程度、持続性および範囲、ならびに可能な使用に関して多くの要求を満たさなければならない。毒性の問題、有益な種および受粉者の節約、環境特性、施用率、他の活性化化合物または製剤補助剤との組み合わせ可能性は、活性化化合物の合成に関与する複雑性の問題と同様に役割を果たし、ほんの少数のパラメータを挙げると耐性もまた起こり得る。これらの全ての理由だけで、新規な作物保護組成物の探索は完全であるとは考えられず、少なくとも個々の態様に関して既知の化合物と比較して改善された特性を有する新規な化合物が絶えず必要とされている。

20

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

30

【0005】

本発明の目的は、種々の局面において殺有害生物剤のスペクトルを広げ、および／またはそれらの活性を改善する化合物を提供することであった。

【課題を解決するための手段】

【0006】

新規の縮合二環式複素環誘導体が現在見出されており、これらは既に知られている化合物を上回る利点を有し、その例としては、より良好な生物学的または環境的特性、より広範囲の適用方法、より良好な殺虫または殺ダニ作用、および有用な植物との良好な適合性が挙げられる。複素環誘導体は、特に防除が困難な昆虫に対する効力を改善するために、さらなる組成物と組み合わせて使用することができる。

40

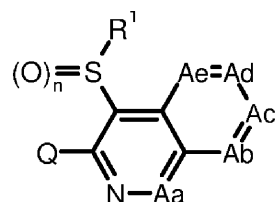
【0007】

したがって、本発明の主題は、式 (I)

【0008】

50

【化 1】



(I)

〔式中（構成 1-1）〕、

A a は、窒素または $=C(R^7)-$ を表し、

A b は、窒素または $=C(R^8)-$ を表し、

A c は、窒素または $=C(R^9)-$ を表し、

A d は、窒素または $=C(R^{10})-$ を表し、

A e は、窒素または $=C(R^{11})-$ を表し、

ここで、A b、A c、A d および A e は、同時に窒素を表すことはできず、

R^1 は、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -ハロアルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、 (C_2-C_6) -ハロアルキニル、 (C_3-C_8) -シクロアルキル、ハロ- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルキル- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_3-C_8) -シクロアルキル- (C_3-C_8) -シクロアルキル、スピロ- (C_3-C_8) -シクロアルキル- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_4-C_{12}) -ビスシクロアルキル、 (C_1-C_6) -シアノアルキル、 (C_1-C_6) -ヒドロキシアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -シアノアルケニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -シアノアルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_2-C_6) -アルキニル、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニルオキシ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルキニルオキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_6) -ハロアルキニルオキシ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキルまたはトリ- (C_1-C_6) -アルキルシリルを表し、

R^7 は、水素、シアノ、ハロゲン、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、 (C_3-C_8) -シクロアルキル、ハロ- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -シアノアルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -ハロアルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、 (C_2-C_6) -ハロアルキニル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_6) -アルキルチオ、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニルまたは (C_1-C_6) -ハロアルキルスルホニルを表し、

R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} は、それぞれ独立に、水素、ハロゲン、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルホニルを表すか、または

【0009】

(C_1-C_6)-ハロアルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキル、モノ-またはポリ-ハロゲン-置換されていてもよい(C_1-C_6)-シアノアルキル、(C_1-C_6)-シアノアルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキル、(C_1-C_6)-ハロアルキル-(C_3-C_8)-シアノシクロアルキル、(C_1-C_6)-ハロアルキル-(C_3-C_8)-ハロシクロアルキル、モノ-またはポリ-(C_1-C_6)アルキル-またはハロゲン-置換されていてもよいシアノ-(C_3-C_6)-シクロアルキル、いずれの場合もモノ-またはポリ-シアノ-または-ハロゲン-置換されていてもよいスピロ(C_3-C_8)-シクロアルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキルまたは(C_4-C_{12})-ビスシクロアルキルを表し、

ここで、基 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} の1つは、(C_1-C_6)-ハロアルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキル、(C_1-C_6)-シアノアルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキル、(C_1-C_6)-ハロアルキル-(C_3-C_8)-シアノシクロアルキル、(C_1-C_6)-ハロアルキル-(C_3-C_8)-ハロシクロアルキル、モノ-またはポリ-(C_1-C_6)アルキル-または-ハロゲン-置換されていてもよいシアノ(C_3-C_6)-シクロアルキル、いずれの場合もモノ-またはポリ-シアノ-または-ハロゲン-置換されていてもよいスピロ-(C_3-C_8)-シクロアルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキルまたは(C_4-C_{12})-ビスシクロアルキルから選択されなければならない、

ここで、基 R^8 、 R^9 、 R^{10} または R^{11} のうちの1個または2個のみが、水素以外の置換基を表し、

Qは、部分的に飽和したまたは飽和した複素環式またはヘテロ芳香族の8、9、10、11または12員の縮合二環式または三環式環系であり、ここで、少なくとも1つのカルボニル基が存在していてもよく、および/または前記環系が同一または異なるようにモノ-またはポリ置換されていてもよく、そしてここで、前記置換基は、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C_1-C_6)-アルキルシリル、(C_3-C_8)-シクロアルキル、(C_3-C_8)-シクロアルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキル、(C_1-C_6)-アルキル-(C_3-C_8)-シクロアルキル、ハロ-(C_3-C_8)-シクロアルキル、(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-ハロアルキル、(C_1-C_6)-シアノアルキル、(C_1-C_6)-ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C_1-C_6)-アルコキシ、(C_1-C_6)-アルコキシカルボニル-(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシ-(C_1-C_6)-アルキル、(C_2-C_6)-アルケニル、(C_2-C_6)-ハロアルケニル、(C_2-C_6)-シアノアルケニル、(C_2-C_6)-アルキニル、(C_2-C_6)-アルキニルオキシ-(C_1-C_4)-アルキル、(C_2-C_6)-ハロアルキニル、(C_2-C_6)-シアノアルキニル、(C_1-C_6)-アルコキシ、(C_1-C_6)-ハロアルコキシ、(C_1-C_6)-ハロアルコキシ-(C_1-C_6)-アルキル、(C_2-C_6)-アルケニルオキシ-(C_1-C_6)-アルキル、(C_2-C_6)-ハロアルケニルオキシ-(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-シアノアルコキシ、(C_1-C_6)-アルコキシカルボニル-(C_1-C_6)-アルコキシ、(C_1-C_6)-アルコキシ-(C_1-C_6)-アルコキシ、(C_1-C_6)-アルキルヒドロキシイミノ、(C_1-C_6)-アルコキシイミノ、(C_1-C_6)-アルキル-(C_1-C_6)-アルコキシイミノ、(C_1-C_6)-ハロアルキル-(C_1-C_6)-アルコキシイミノ、(C_1-C_6)-アルキルチオ、(C_1-C_6)-ハロアルキルチオ、(C_1-C_6)-アルコキシ-(C_1-C_6)-アルキルチオ、(C_1-C_6)-アルキルチオ-(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルキルスルフィニル、(C_1-C_6)-ハロアルキルスルフィニル、(C_1-C_6)-アルコキシ-(C_1-C_6)-アルキルスルフィニル、(C_1-C_6)-アルキルスルフィニル-(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルキルスルホニル、(C_1-C_6)-ハロアルキルスルホニル、(C_1-C_6)-アルコキシ-(C_1-C_6)-アルキルスルホニル、(C_1-C_6)-アルキルスルホニル-(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルキルスルホニルオキシ、(C_1-C_6)-アルキルカルボニル、(C_1-C_6)-アルキルカルボニル-(C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルキルチオカルボニル、(C_1-C_6)-ハロ

10

20

30

40

50

アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C_1-C_6) -アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6) -アルキルアミノチオカルボニル、 (C_2-C_6) -アルケニルアミノカルボニル、ジ- (C_2-C_6) -アルケニルアミノカルボニル、 (C_3-C_8) -シクロアルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_6) -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6) -アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_6) -アルキルアミノスルホニル、ジ- (C_1-C_6) -アルキルアミノスルホニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C_1-C_6) -アルキルアミノチオカルボニル、 (C_3-C_8) -シクロアルキルアミノ、 $NHCO-$ (C_1-C_6) -アルキル ((C_1-C_6) -アルキルカルボニルアミノ) から独立して選択することができるか、

または、前記置換基は、フェニルまたは5員もしくは6員のヘテロ芳香族環から独立して選択することができ、ここで、フェニルまたは前記環は、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシによって同一または異なってモノ-またはポリ置換されていてもよく、

n は、0、1 または 2 を表す)

の新規化合物である。

【0010】

さらに、式(I)の化合物は、殺有害生物剤として、好ましくは殺虫剤および／または殺ダニ剤として非常に良好な効力を有し、さらに、特に作物植物に関して一般に非常に良好な植物適合性を有することが見出された。

【発明を実施するための形態】

【0011】

本発明による化合物は、式(I)によって一般用語で定義される。上記および下記の式で与えられる基の好ましい置換基または範囲を以下に例示する：

構成 2-1

A a は、好ましくは、窒素または $=C(R^7)-$ を表し、

A b は、好ましくは、窒素または $=C(R^8)-$ を表し、

A c は、好ましくは、窒素または $=C(R^9)-$ を表し、

A d は、好ましくは、窒素または $=C(R^{10})-$ を表し、

A e は、好ましくは、窒素または $=C(R^{11})-$ を表し、

ここで、A b、A c、A d および A e は同時に窒素を表すことはできず、

好ましくは、以下の構造単位を生じ：A 1、A 2、A 3、A 4、A 5、A 6、A 7、A 8、A 9、A 10、A 11、A 12、A 13、A 14、A 15、A 16、A 17、

R^1 は、好ましくは (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -ハロアルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、 (C_2-C_6) -ハロアルキニル、 (C_3-C_8) -シクロアルキル、ハロ- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルキル- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル- (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -シアノアルキル、 (C_1-C_6) -ヒドロキシアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -アルキルまたは (C_1-C_6) -アルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキルを表し、

R^7 は、好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、 $(C$

$3-C_6$) - シクロアルキル、ハロ (C_3-C_6) - シクロアルキル、(C_1-C_4) - アルキル、(C_1-C_4) - ハロアルキル、(C_1-C_4) - シアノアルキル、(C_2-C_4) - アルケニル、(C_2-C_4) - ハロアルケニル、(C_2-C_4) - アルキニル、(C_2-C_4) - ハロアルキニル、(C_1-C_4) - アルコキシ、(C_1-C_4) - ハロアルコキシ、(C_1-C_4) - アルキルチオ、(C_1-C_4) - ハロアルキルチオ、(C_1-C_4) - アルキルスルフィニル、(C_1-C_4) - ハロアルキルスルフィニル、(C_1-C_4) - アルキルスルホニルまたは(C_1-C_4) - ハロアルキルスルホニルを表し、

R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} は互いに独立に、好ましくは、水素、ハロゲン、(C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - ハロアルキル、(C_1-C_6) - アルコキシ、(C_1-C_6) - ハロアルコキシ、(C_1-C_6) - ハロアルキルチオ、(C_1-C_6) - ハロアルキルスルフィニル、(C_1-C_6) - ハロアルキルスルホニルを表すか、または

【0012】

(C_1-C_6) - ハロアルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキルを表し、モノーまたはポリーハロゲン置換されていてもよい(C_1-C_6) - シアノアルキル、(C_1-C_6) - シアノアルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキル、(C_1-C_6) - ハロアルキル - (C_3-C_8) - シアノシクロアルキル、(C_1-C_6) - ハロアルキル - (C_3-C_8) - ハロシクロアルキル、モノーまたはポリー(C_1-C_4) - アルキル - または - ハロゲン置換されていてもよいシアノ(C_3-C_6) - シクロアルキル、いずれの場合もモノーまたはポリーシアノ - または - ハロゲン置換されていてもよいスピロ - (C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキルまたは(C_4-C_{12}) - ビシクロアルキルを表し、

ここで、基 R^8 、 R^9 、 R^{10} または R^{11} の一つは、(C_1-C_6) - ハロアルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキル、(C_1-C_6) - シアノアルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキル、(C_1-C_6) - ハロアルキル - (C_3-C_8) - シアノシクロアルキル、(C_1-C_6) - ハロアルキル - (C_3-C_8) - ハロシクロアルキル、モノーまたはポリー(C_1-C_4) - アルキル - または - ハロゲン置換されていてもよいシアノ(C_3-C_6) - シクロアルキル、いずれの場合もモノーまたはポリーシアノ - または - ハロゲン置換されていてもよいスピロ - (C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキルまたは(C_4-C_{12}) - ビシクロアルキルから選択されなければならない、

ここで、基 R^8 、 R^9 、 R^{10} 基または R^{11} のうちの1個または2個のみが、水素以外の置換基を表し、

Qは、好ましくはヘテロ芳香族の8、9、10、11または12員の縮合二環式または三環式環系であり、ここで、前記環系は、同一または異なるようにモノーまたはポリ置換されていてもよく、そしてここで、少なくとも1つのカルボニル基が存在していてもよく、および/または、前記置換基は、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C_1-C_6) - アルキルシリル、(C_3-C_8) - シクロアルキル、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキル、(C_1-C_6) - アルキル - (C_3-C_8) - シクロアルキル、ハロ - (C_3-C_8) - シクロアルキル、(C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - ハロアルキル、(C_1-C_6) - シアノアルキル、(C_1-C_6) - ヒドロキシアルキル、(C_1-C_6) - アルコキシ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_2-C_6) - アルケニル、(C_2-C_6) - ハロアルケニル、(C_2-C_6) - シアノアルケニル、(C_2-C_6) - アルキニル、(C_2-C_6) - アルキニルオキシ - (C_1-C_4) - アルキル、(C_2-C_6) - ハロアルキニル、(C_1-C_6) - アルコキシ、(C_1-C_6) - ハロアルコキシ、(C_1-C_6) - ハロアルコキシ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_2-C_6) - アルケニルオキシ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_2-C_6) - ハロアルケニルオキシ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - シアノアルコキシ、(C_1-C_6) - アルコキシ - (C_1-C_6) - アルコキシ、(C_1-C_6) - アルキルヒドロキシイミノ、(C_1-C_6) - アルコキシイミノ、(C_1-C_6) - アルキル - (C_1-C_6) - アルコキシイミノ、(C_1-C_6) - アルキルチオ、(C_1-C_6) - ハロアルキルチオ、(C_1-C_6) - アルコキシ - (C_1-C_6) - アルキル

チオ、 (C_1-C_6) －アルキルチオ－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) －アルコキシ－ (C_1-C_6) －アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) －アルキルスルフィニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) －アルコキシ－ (C_1-C_6) －アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) －アルキルスルホニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_6) －アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルカルボニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルチオカルボニル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) －アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルアミノチオカルボニル、ジ－ (C_1-C_6) －アルキルアミノカルボニル、ジ－ (C_1-C_6) －アルキルアミノチオカルボニル、 (C_3-C_8) －シクロアルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_6) －アルキルアミノ、ジ－ (C_1-C_6) －アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_6) －アルキルアミノスルホニル、ジ－ (C_1-C_6) －アルキルアミノスルホニル、 (C_1-C_6) －アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルアミノチオカルボニル、ジ－ (C_1-C_6) －アルキルアミノチオカルボニル、 (C_3-C_8) －シクロアルキルアミノ、 $NHCO$ － (C_1-C_6) －アルキル ((C_1-C_6) －アルキルカルボニルアミノ) から独立して選択することができるか、

10

20

または、前記置換基は、フェニルまたは5員もしくは6員のヘテロ芳香族環から独立して選択することができ、ここで、フェニルまたは前記環は、 C_1-C_6 －アルキル、 C_2-C_6 －アルケニル、 C_2-C_6 －アルキニル、 C_3-C_6 －シクロアルキル、 C_1-C_6 －ハロアルキル、 C_2-C_6 －ハロアルケニル、 C_2-C_6 －ハロアルキニル、 C_3-C_6 －ハロシクロアルキル、ハロゲン、 CN 、 C_1-C_4 －アルコキシ、 C_1-C_4 －ハロアルコキシによって同一または異なってモノーまたはポリ置換されていてもよく、

n は、好ましくは0、1または2を表す。

【0013】

構成3－1

Aa は、特に好ましくは、窒素または $=C(R^7)$ －を表し、

30

Ab は、特に好ましくは、窒素または $=C(R^8)$ －を表し、

Ac は、特に好ましくは、窒素または $=C(R^9)$ －を表し、

Ad は、特に好ましくは、窒素または $=C(R^{10})$ －を表し、

Ae は、特に好ましくは、窒素または $=C(R^{11})$ －を表し、

ここで、 Ab 、 Ac 、 Ad および Ae は、同時に窒素を表すことはできず、

特に好ましくは、以下の構造単位を生じ： $A1$ 、 $A2$ 、 $A6$ 、 $A7$ 、 $A9$ 、 $A11$ 、 $A13$ 、 $A16$ 、

R^1 は、特に好ましくは、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルまたは (C_3-C_8) －シクロアルキルを表し、

R^7 は、特に好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、 (C_1-C_4) －アルキルまたは (C_1-C_4) －ハロアルキルを表し、

40

R^8 、 R^{10} 、 R^{11} は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、ハロゲン、 (C_1-C_4) －アルキル、 (C_1-C_4) －ハロアルキル、 (C_1-C_4) －アルコキシ、 (C_1-C_4) －ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) －ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) －ハロアルキルスルフィニルまたは (C_1-C_4) －ハロアルキルスルホニルを表し、

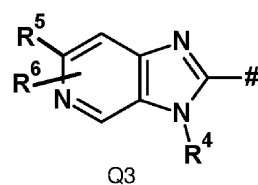
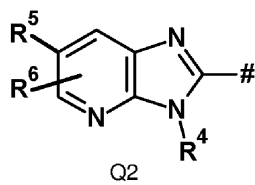
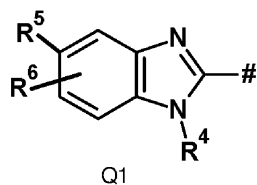
R^9 は、特に好ましくは、 (C_1-C_4) －ハロアルキル－ (C_3-C_8) －シクロアルキル、スピロ－ (C_3-C_8) －シクロアルキル－ (C_3-C_8) －シクロアルキル、 (C_4-C_{12}) －ビスシクロアルキル、または、モノーまたはジ－ (C_1-C_4) －アルキル－または－ハロゲン－置換されていてもよいシアノ－ (C_3-C_6) －シクロアルキルを表し、

50

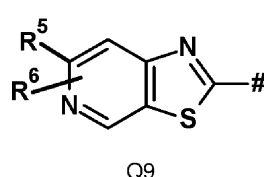
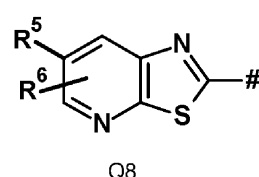
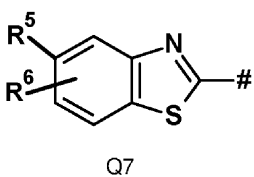
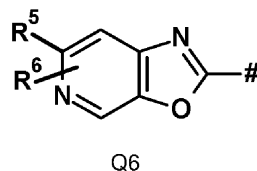
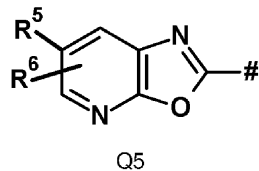
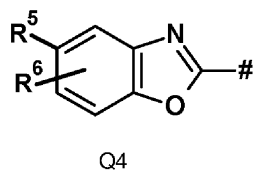
Qは、特に好ましくはQ 1～Q 2 1の群からのヘテロ芳香族の9員環または12員の縮合二環式または三環式環系であり、

【0014】

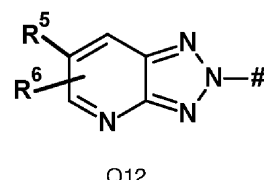
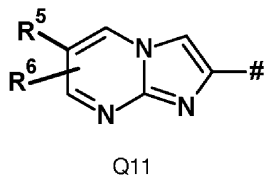
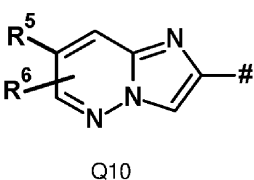
【化2】



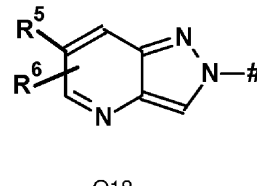
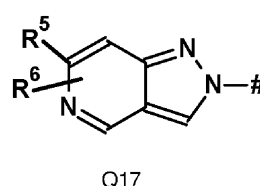
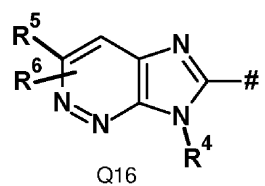
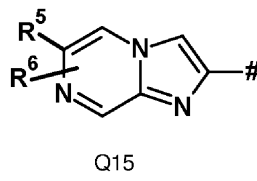
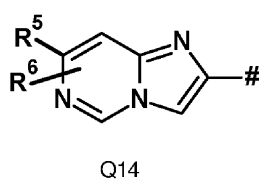
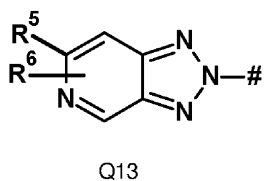
10



20

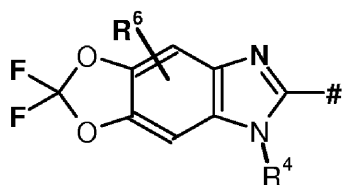


30

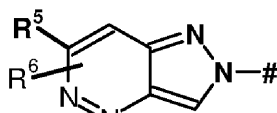


40

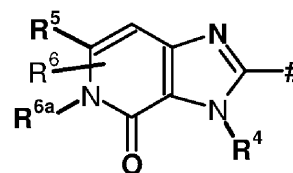
50



Q19



Q20



Q21

R^4 は、特に好ましくは、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -シアノアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -アルケニルオキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (C_2-C_4) -アルキニルオキシ- (C_1-C_4) -アルキルまたは (C_3-C_6) -シクロアルキルを表し、

R^5 、 R^6 は、特に好ましくは、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -ハロアルケニル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (C_2-C_4) -ハロアルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル- (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルキル- (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) -アルコキシイミノ、 (C_1-C_4) -アルキルチオ、 (C_1-C_4) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) -アルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_4) -アルキルカルボニル、 (C_1-C_4) -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_4) -アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_4) -アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_4) -アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノスルホニルまたはジ- (C_1-C_4) -アルキルアミノスルホニルを表し、

R^{6a} は、特に好ましくは、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -シアノアルキル、 (C_1-C_4) -ヒドロキシアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -ハロアルケニル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (C_2-C_4) -ハロアルキニル、 (C_3-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_4) -アルキル- (C_3-C_6) -シクロアルキルまたはハロ- (C_3-C_6) -シクロアルキルを表し、

n は、特に好ましくは0、1または2を表す。

【0015】

構成4-1

Aaは、非常に特に好ましくは、窒素または $=C(R^7)-$ を表し、

Abは、非常に特に好ましくは、窒素または $=C(R^8)-$ を表し、

Acは、非常に特に好ましくは、窒素または $=C(R^9)-$ を表し、

Adは、非常に特に好ましくは、窒素または $=C(R^{10})-$ を表し、

Aeは、非常に特に好ましくは、窒素または $=C(R^{11})-$ を表し、

ここで、Ab、Ac、AdおよびAeは同時に窒素を表すことはできず、

非常に特に好ましくは、以下の構造単位を生じ：A1、A2、A6、A11、A16、

R^1 は、非常に特に好ましくは、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキルまたは (C_3-C_6) -シクロアルキルを表し、

R^7 は、非常に特に好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、 (C_1-C_4) -アルキルまたは (C_1-C_4) -ハロアルキルを表し、

10

20

30

40

50

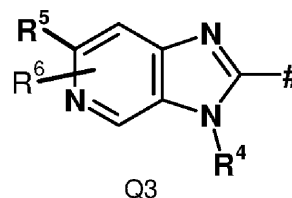
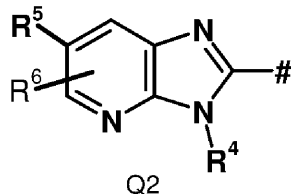
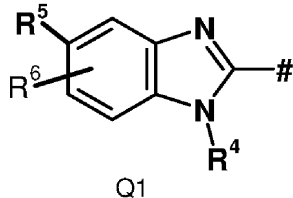
R^8 、 R^{10} 、 R^{11} は、互いに独立して、非常に特に好ましくは、水素、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルまたはハロゲンを表し、

R^9 は、非常に特に好ましくは、シアノー $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキルを表し、

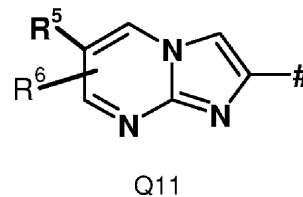
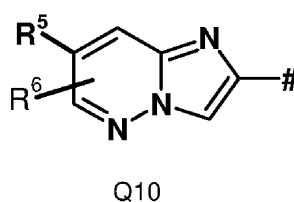
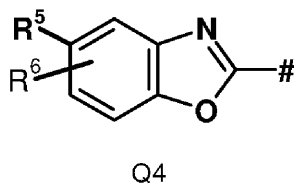
Qは、非常に特に好ましくは、Q1、Q2、Q3、Q4、Q10、Q11、Q14、Q15、Q16、Q19、Q20またはQ21の群からのヘテロ芳香族の9員環または12員環の縮合二環式または三環式環系を表し、

【0016】

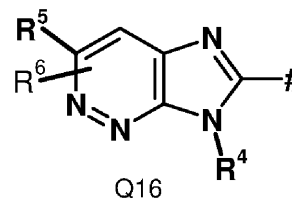
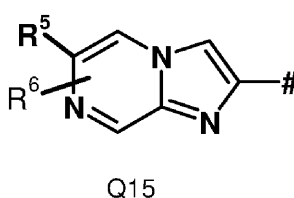
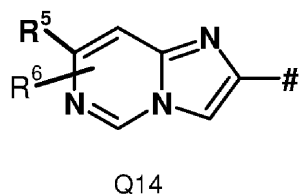
【化3】



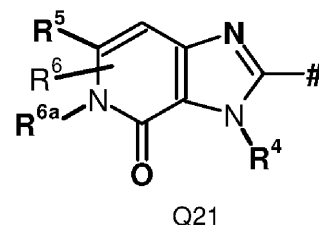
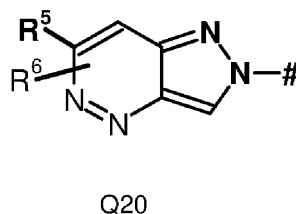
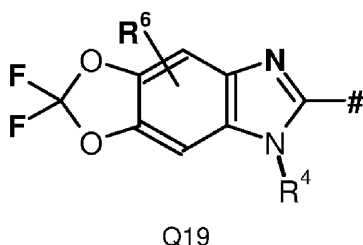
10



20



30



40

R^4 は、非常に特に好ましくは、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルまたは $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ $(C_1 - C_4)$ - アルキルを表し、

R^5 は、非常に特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルカルボニルまたは $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルカルボニルを表し、

R^6 は、非常に特に好ましくは、水素を表し、

50

R^{6a} は、非常に特に好ましくは、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_2-C_4) -アルケニル、 (C_2-C_4) -ハロアルケニル、 (C_1-C_4) -アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -アルキニル、 (C_2-C_4) -ハロアルキニルまたは (C_3-C_6) -シクロアルキルを表し、

n は、非常に特に好ましくは0、1または2を表す。

【0017】

構成5-1

Aa は、特に $=C(R^7)-$ を表し、

Ab は、特に $=C(R^8)-$ を表し、

Ac は、特に $=C(R^9)-$ を表し、

Ad は、特に $=C(R^{10})-$ を表し、

Ae は、特に $=C(R^{11})-$ を表し、

R^1 は、特に、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、 n -ブチル、 i -ブチルまたは $tert$ -ブチルを表し、

R^7 は、特に水素を表し、

R^8 は、特に水素を表し、

R^9 は、特に、シアノシクロプロピルまたはシアノシクロブチルを表し、

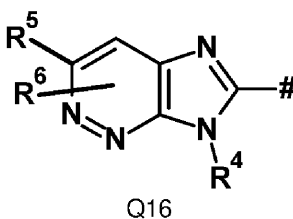
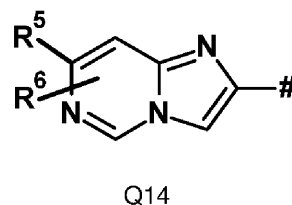
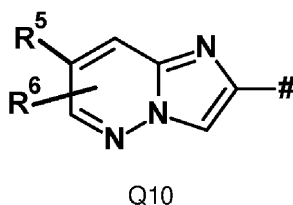
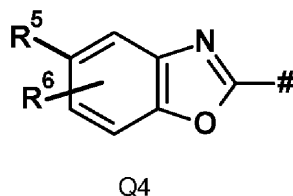
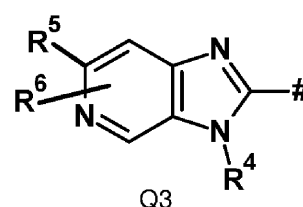
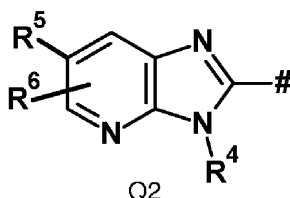
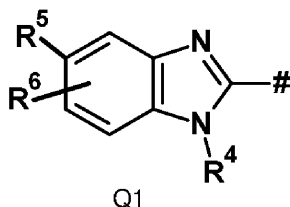
R^{10} は、特に水素を表し、

R^{11} は、特に水素を表し、

Q は、特に、 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、 $Q4$ 、 $Q10$ 、 $Q14$ または $Q16$ の群からのヘテロ芳香族の9員の縮合二環式環系を表し、

【0018】

【化4】



R^4 は、特に、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチルまたはメトキシエチルを表し、

R^5 は、特に、フッ素、塩素、臭素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル (CH_2CFH_2 、 $CHFCH_3$)、ジフルオロエチル (CF_2CH_3 、 CH_2CHF_2 、 $CHFCHF_2$)、トリフルオロエチル (CH_2CF_3 、 C

10

20

30

40

50

H F C H F₂、C F₂ C F H₂）、テトラフルオロエチル（C H F C F₃、C F₂ C H F₂）、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニルを表し、

R⁶は、特に水素を表し、

nは、特に、0、1または2を表す。

【0019】

構成5-2

A aは、特に=C(R⁷)-を表し、

A bは、特に=C(R⁸)-を表し、

A cは、特に=C(R⁹)-を表し、

A dは、特に=C(R¹⁰)-を表し、

A eは、特に=C(R¹¹)-を表し、

R¹は、特に、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチルまたはtert-ブチルを表し、

R⁷は、特に水素を表し、

R⁸は、特に水素を表し、

R⁹は、特に、シアノシクロプロピルまたはシアノシクロブチルを表し、

R¹⁰は、特に水素を表し、

R¹¹は、特に水素を表し、

Qは、特に、Q1、Q2、Q3、Q4、Q16またはQ21の群からのヘテロ芳香族の9員の縮合二環式環系を表し、

R⁴は、特にメチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチルまたはメトキシエチルを表し、

R⁵は、特に、フッ素、塩素、臭素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル（CH₂CFH₂、CHFCH₃）、ジフルオロエチル（CF₂CH₃、CH₂CHF₂、CHFCHF₂）、トリフルオロエチル（CH₂CF₃、CHFCHF₂、CF₂CFH₂）、テトラフルオロエチル（CHF CF₃、CF₂CHF₂）、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニルを表し、

R⁶は、特に水素を表し、

R^{6a}は、特にメチルを表し、

nは、特に0、1または2を表す。

【0020】

構成6-1

A aは、特に=C(R⁷)-を表し、

A bは、特に=C(R⁸)-を表し、

A cは、特に=C(R⁹)-を表し、

A dは、特に=C(R¹⁰)-を表し、

A eは、特に=C(R¹¹)-を表し、

R¹は、特にエチルを表し、

R⁷は、特に水素を表し、

R⁸は、特に水素を表し、

R⁹は、特に1-シアノシクロプロピルを表し、

R¹⁰は、特に水素を表し、

R¹¹は、特に水素を表し、

Qは、特に、Q2の群からのヘテロ芳香族の9員の縮合二環式環系であり、

【0021】

10

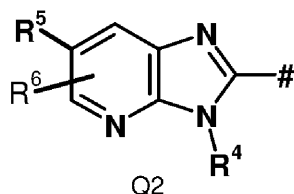
20

30

40

50

【化 5】



R⁴は、特にメチルを表し、
 R⁵は、特にトリフルオロメチルを表し、
 R⁶は、特に水素を表し、
 nは、特に2を表す。

10

【0022】

構成6-2

A_aは、特に=C(R⁷)-を表し、
 A_bは、特に=C(R⁸)-を表し、
 A_cは、特に=C(R⁹)-を表し、
 A_dは、特に=C(R¹⁰)-を表し、
 A_eは、特に=C(R¹¹)-を表し、
 R¹は、特にエチルを表し、
 R⁷は、特に水素を表し、
 R⁸は、特に水素を表し、
 R⁹は、特に1-シアノシクロプロピルを表し、
 R¹⁰は、特に水素を表し、
 R¹¹は、特に水素を表し、

20

Qは、特に、Q1、Q2、Q3、Q4、Q16、Q21からなる群からのヘテロ芳香族の9員の縮合二環式環系を表し、

R⁴は、特にメチルを表し、

R⁵は、特に、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシまたはトリフルオロメチルスルホニルを表し、

30

R⁶は、特に水素を表し、

R^{6a}は、特にメチルを表し、

nは、特に2を表す。

【0023】

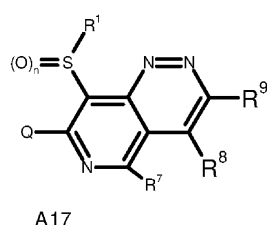
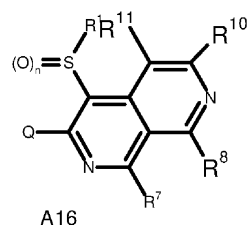
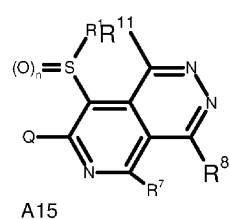
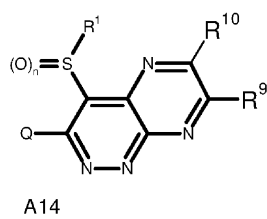
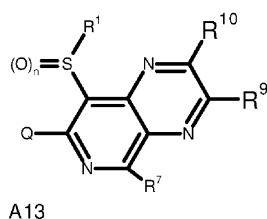
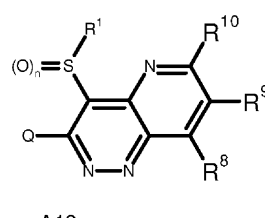
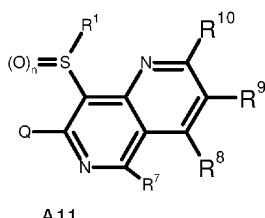
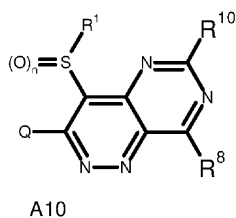
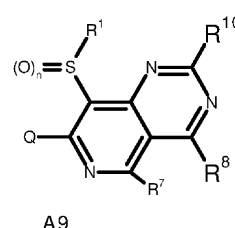
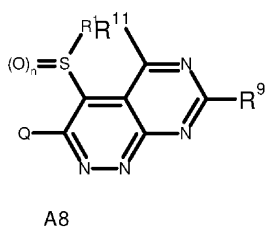
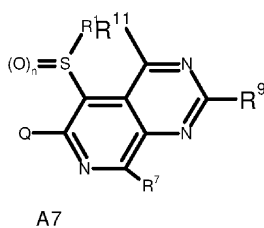
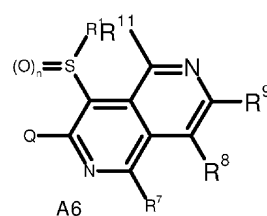
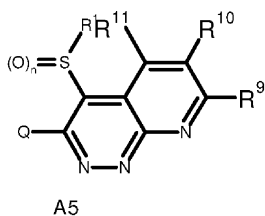
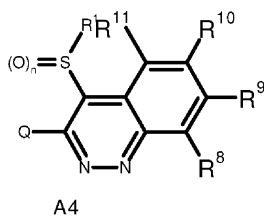
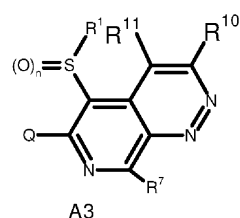
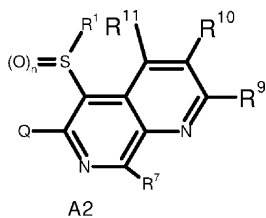
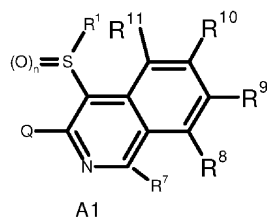
構造単位A1～A17を含めると、これは、以下の式(I)の主な構造をもたらす：

【0024】

40

50

【化 6】



好ましい実施形態では、本発明は、 R^1 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成（１）または構成（２）で与えられる定義を有する式（Ⅰ）の化合物に関する。

【００２５】

好ましい実施形態では、本発明は、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{6a} 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成（３－１）または構成（４－１）または構成（５－１）または構成（５－２）または構成（６－１）または構成（６－２）で与えられる定義を有する式（Ⅰ）の化合物に関する。

【００２６】

10

20

30

40

50

好ましい実施形態において、本発明は、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{6a} 、 R^7 、 R^8 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(1-1)または構成(2-1)または構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有し、そして

R^9 が、1-シアノシクロプロピルを表す、式(I)の化合物に関する。

【0027】

好ましい実施形態において、本発明は、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{6a} 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Q 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad および Ae が、構成(1-1)または構成(2-1)または構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有し、そして

n が、2を表す、式(I)の化合物に関する。

【0028】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q1$ を表し、そして、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0029】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q2$ を表し、そして、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0030】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q3$ を表し、そして、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0031】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q4$ を表し、そして、 R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0032】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q5$ を表し、そして、 R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0033】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q6$ を表し、そして、 R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0034】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q7$ を表し、そして、 R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0035】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q8$ を表し、そして、 R^1 、 R^5 、 R^6 、 R

10

20

30

40

50

【 0 0 3 6 】

【 0 0 3 7 】

10

【 0 0 3 8 】

【 0 0 3 9 】

20

【 0 0 4 0 】

【 0 0 4 1 】

30

【 0 0 4 2 】

【 0 0 4 3 】

40

【 0 0 4 4 】

【 0 0 4 5 】

50

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0046】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q19$ を表し、そして、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)に与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0047】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q20$ を表し、そして、 R^1 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0048】

好ましい実施形態において、本発明は、 Q が $Q21$ を表し、そして、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{6a} 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae および n が、構成(3-1)または構成(4-1)または構成(5-1)または構成(5-2)または構成(6-1)または構成(6-2)で与えられる定義を有する式(I)の化合物に関する。

【0049】

一般的または好ましい定義において、特に明記しない限り、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素からなる群から選択され、好ましくはフッ素、塩素および臭素からなる群から選択される。

【0050】

アリール(より大きな単位、例えばアリールアルキルの一部として、を含む)は、別に定義されない限り、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの系列から選択され、好ましくはフェニルである。

【0051】

本発明の文脈において、他の場所で異なるように定義されない限り、用語「アルキル」は、それ自体でまたは他の用語との組み合わせ、例えばハロアルキルで、1~12個の炭素原子を有し、分岐していても分岐していなくてもよい飽和脂肪族炭化水素基の基を意味すると理解される。 C_1 - C_{12} -アルキル基の例は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、 n -ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、*tert*-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、1-エチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、 n -ヘプチル、 n -オクチル、 n -ノニル、 n -デシル、 n -ウンデシルおよび n -ドデシルである。これらのアルキル基の中で、 C_1 - C_6 -アルキル基が特に好ましい。特に好ましくは、 C_1 - C_4 -アルキル基である。

【0052】

本発明によれば、別に定義されない限り、用語「アルケニル」は、それ自体でまたはさらなる用語との組合せで、少なくとも1つの二重結合を有する直鎖または分岐 C_2 - C_{12} -アルケニル基を意味すると理解され、例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ペンタジエニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニルおよび1,4-ヘキサジエニルである。これらの中で、 C_2 - C_6 -アルケニル基が好ましく、 C_2 - C_4 -アルケニル基が特に好ましい。

【0053】

本発明によれば、別に定義されない限り、用語「アルキニル」は、それ自体でまたは他の用語との組合せで、少なくとも1つの三重結合を有する直鎖または分岐 C_2 - C_{12} -ア

ルキニル基を意味すると理解され、例えば、エチニル、1-プロピニルおよびプロパルギルである。これらの中で、 C_3-C_6 -アルキニル基が好ましく、 C_3-C_4 -アルキニル基が特に好ましい。アルキニル基はまた、少なくとも1つの二重結合を含有する可能性がある。

【0054】

本発明によれば、別に定義されない限り、用語「シクロアルキル」は、それ自体でまたはさらなる用語との組合せで、 C_3-C_8 -シクロアルキル基を意味すると理解され、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルおよびシクロオクチルである。これらの中で、 C_3-C_6 -シクロアルキル基が好ましい。

10

【0055】

用語「アルコキシ」は、それ自体でまたはさらなる用語、例えばハロアルコキシとの組み合わせで、本発明の場合、 O -アルキル基を意味すると理解され、ここで、用語「アルキル」は上記で定義したとおりである。

【0056】

ハロゲン-置換された基、例えばハロアルキルは、モノ-ハロゲン化または可能な置換の最大数までポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化の場合、ハロゲン原子は同一であっても異なってもよい。この場合、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素、特にフッ素、塩素または臭素を表す。

【0057】

特に明記しない限り、置換されていてもよい基は、モノ-またはポリ置換されていてもよく、ここで、ポリ置換の場合の置換基は、同じであっても異なってもよい。

20

【0058】

一般的な用語で上に与えられたまたは好ましい範囲内で列挙された基の定義または例示は、最終生成物、ならびに、出発物質および中間体に対応して適用される。これらの基の定義は、所望に応じて、すなわち、それぞれの好ましい範囲の間の組み合わせを含めて互いに組み合わせることができる。

【0059】

本発明による好ましいのは、好ましいものとして上に列挙した意味の組み合わせを含む式(I)の化合物を使用することである。

30

【0060】

本発明による特に好ましいのは、特に好ましいものとして上に列挙した意味の組合せを含む式(I)の化合物を使用することである。

【0061】

本発明による非常に特に好ましいのは、非常に特に好ましいものとして上に列挙した定義の組み合わせを含む式(I)の化合物を使用することである。

【0062】

本発明による強調されるものは、強調されるものとして上に列挙された意味の組み合わせを含む式(I)の化合物を使用することである。

【0063】

本発明による特に使用されるのは、特に強調されるものとして上に列挙した意味の組み合わせを含む式(I)の化合物である。

40

【0064】

置換基の性質に依存して、式(I)の化合物は、幾何学および／または光学的に活性な異性体、または異なる組成の対応する異性体混合物の形態であり得る。これらの立体異性体は、例えば、鏡像異性体、ジアステレオマー、アトロプ異性体または幾何異性体である。したがって、本発明は、純粋な立体異性体およびこれらの異性体の任意の所望の混合物の両方を包含する。

【0065】

本発明による式(I)の化合物は、以下のスキームに示す方法によって得ることができ

50

る：

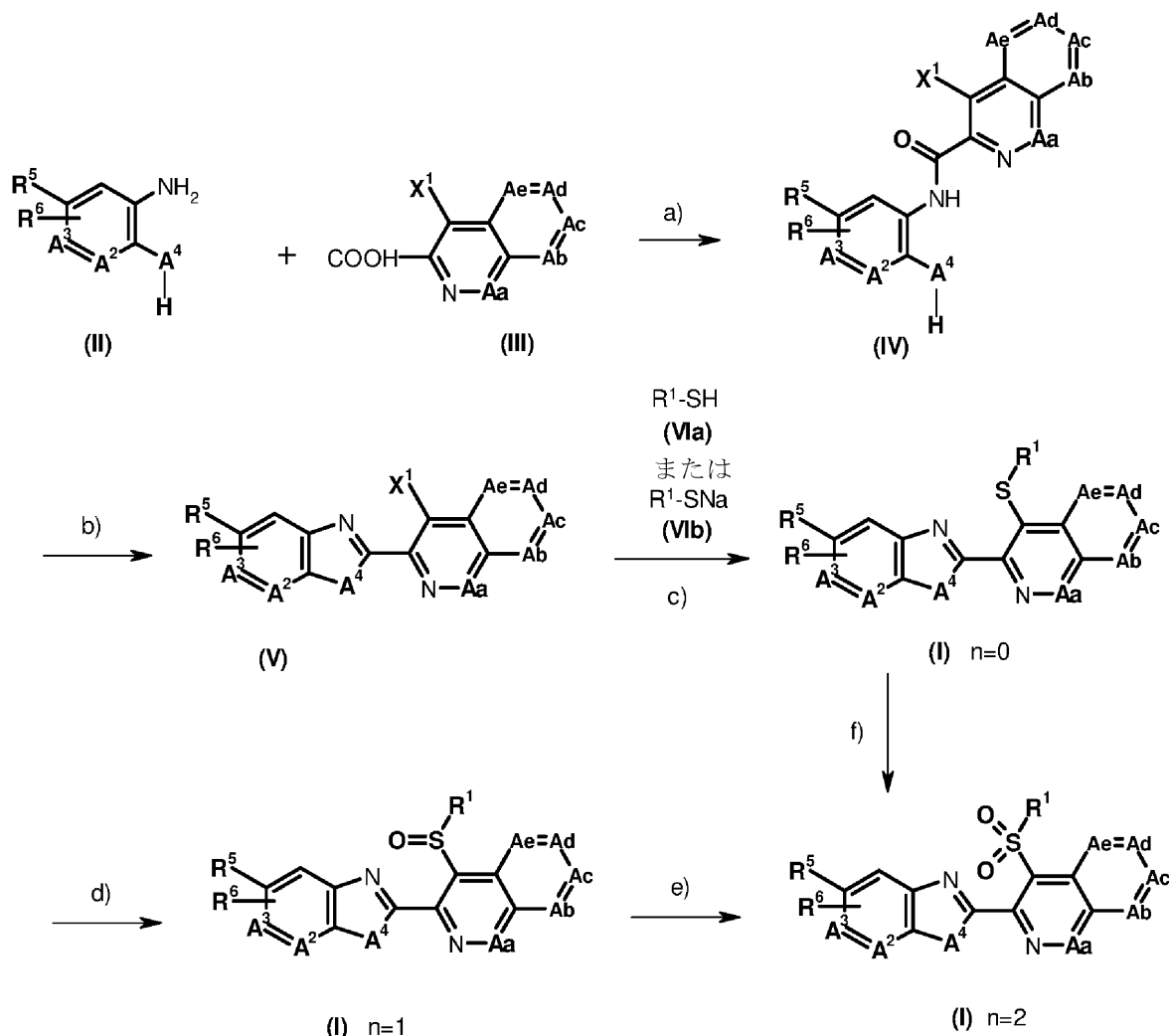
【0066】

プロセスA

QがQ1～Q9、Q16、Q19、またはQ21を表す式(I)の化合物は公知の方法、例えば、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715、WO2015/198859、WO2016/039444、WO2016/039441、WO2016/116338およびWO2015/121136に記載されている方法と同様に調製することができる。

【0067】

【化7】



基Aa、Ab、Ac、Ad、Ae、R¹、R⁵、R⁶およびnは、上述の定義を有し、A²およびA³は、CHまたはNを表し、A⁴は、O、Sまたは-NR⁴を表し、X¹はハロゲンを表す。

【0068】

QがQ21を表す式(I)の化合物については、A²はカルボニルを表し、そして、A³はN-R^{6a}を表す。

【0069】

ステップa)

式(IV)の化合物は、縮合剤または塩基の存在下、式(II)の化合物と式(III)のカルボン酸との反応によって、US5576335に記載された方法と類似して調製することができる。

【0070】

式(II)の化合物は、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えば、US 2003/69257、WO2006/65703、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928またはWO2015/000715に記載される方法と類似の方法によって調製され得る。

【0071】

式(III)のカルボン酸は、商業的に入手可能であるかまたは公知の方法によって調製することができる。可能な調製経路は、プロセスH、IおよびJに記載されている。

【0072】

式(II)の化合物と式(III)のカルボン酸との反応は、ニートでまたは溶媒中で行うことができ、一般的な反応条件下で不活性の慣用の溶媒から選択される溶媒中で反応を行うことが好ましい。エーテル、例えばジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；ニトリル、例えばアセトニトリルまたはプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエンまたはキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミドまたはN-メチルピロリドン、または窒素化合物、例えばピリジンが好ましい。

【0073】

適切な縮合剤は、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)または1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミドのようなカルボジイミドである。

【0074】

適切な塩基は、このような反応に典型的に使用される無機塩基である。アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩および重炭酸塩からなる群から例として選択される塩基を使用することが好ましい。ここで特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムである。

【0075】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および0℃~180℃の温度で実施することができ、好ましくは、反応が大気圧および20~140℃の温度で実施される。

【0076】

ステップb)

式(V)の化合物は、例えばWO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715およびWO2015/121136に記載されている方法と同様に、式(IV)の化合物を縮合することによって調製することができる。

【0077】

式(V)の化合物への変換は、ニートでまたは溶媒中で行うことができ、一般的な反応条件下で不活性な慣用の溶媒から選択される溶媒中で反応を行うことが好ましい。エーテル、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；ニトリル、例えば、アセトニトリルまたはプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエンまたはキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミドまたはN-メチルピロリドン、または窒素化合物、例えば、ピリジンが好ましい。

【0078】

反応は、縮合剤、酸、塩基または塩素化剤の存在下で行うことができる。

【0079】

10

20

30

40

50

適切な縮合剤の例は、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)または1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミドのようなカルボジイミド;無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物のような無水物;トリフェニルホスフィン、塩基および四塩化炭素の混合物、またはトリフェニルホスフィンとアゾジエステル、例えばジエチルアゾジカルボン酸の混合物である。

【0080】

記載された反応において使用され得る適切な酸の例は、パラトルエンスルホン酸のようなスルホン酸;酢酸のようなカルボン酸、またはポリリン酸である。

【0081】

適切な塩基の例は、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)のような窒素複素環;トリエチルアミンおよびN,N-ジイソプロピルエチルアミンのような第3級アミン;リン酸カリウム、炭酸カリウムおよび水素化ナトリウムのような無機塩基である。

【0082】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

【0083】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および0℃~200℃の温度で実施することができる。

【0084】

ステップc)

nが0を表す式(I)の化合物は、式(V)の化合物を塩基の存在下で式(VIa)の化合物と反応させることによって、または式(VIb)の化合物と反応させることによって調製することができる。

【0085】

式(VIa)のメチルメルカプタン誘導体、例えばメチルメルカプタン、エチルメルカプタンまたはイソプロピルメルカプタンは、商業的に入手可能であるか、または公知の方法で、例えばUS2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications, 13(2000), 1163-1164またはJournal of the American Chemical Society, 44(1922), p. 1329に記載されている方法と同様に調製することができる。

【0086】

nが0を表す式(I)の化合物への変換は、ニートでまたは溶媒中で行うことができ、好ましくは、一般的な反応条件下で不活性の慣用の溶媒から選択される溶媒中で反応を行う。エーテル、例えばジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル;ニトリル、例えばアセトニトリルまたはプロピオニトリル;芳香族炭化水素、例えばトルエンまたはキシレン;非プロトン性極性溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドンまたはジメチルスルホキシドが好ましい。

【0087】

適切な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩および炭酸塩からなる群からの無機塩基である。ここでは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムが好ましい。さらに好適な塩基は、アルカリ金属水素化物、例えば水素化ナトリウムである。

【0088】

あるいは、メルカプタン誘導体の塩(式(VIb)の化合物)、例えば、ナトリウムエタンチオレート、ナトリウムメタンチオレートまたはナトリウムイソプロパンチオレートを、さらなる塩基の添加なしに直接使用することが可能である。反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および0℃~200℃の温度で実施することができる。式(VIb)の化合物は市販されている。

10

20

30

40

50

【0089】

記載の反応において、 X^1 は、好ましくはフッ素原子または塩素原子を表す。

【0090】

ステップd)

n が1を表す式(I)の化合物は、 n が0を表す式(I)の化合物を酸化することによって調製することができる。酸化は、一般に一般的な反応条件下で不活性の通常の溶媒から選択される溶媒中で実施される。ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；アルコール、例えばメタノールまたはエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸または水が好ましい。

【0091】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素、メタークロロ過安息香酸または過ヨウ素酸ナトリウムである。

【0092】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および -20°C ~ 120°C の温度で行うことができる。

【0093】

ステップe)

n が2を表す式(I)の化合物は、 n が1を表す式(I)の化合物を酸化することによって調製することができる。酸化は、一般に溶媒中で行われる。ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；アルコール、例えばメタノールまたはエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸または水が好ましい。

【0094】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素およびメタークロロ過安息香酸である。

【0095】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および -20°C ~ 120°C の温度で行うことができる。

【0096】

ステップf)

n が2を表す式(I)の化合物はまた、 n が0を表す式(I)の化合物を酸化することによって1工程プロセス(one-step process)で調製することもできる。酸化は、一般に溶媒中で行われる。ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；アルコール、例えばメタノールまたはエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸または水が好ましい。

【0097】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素およびメタークロロ過安息香酸である。

【0098】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および -20°C ~ 120°C の温度で行うことができる。

【0099】

プロセスB

10

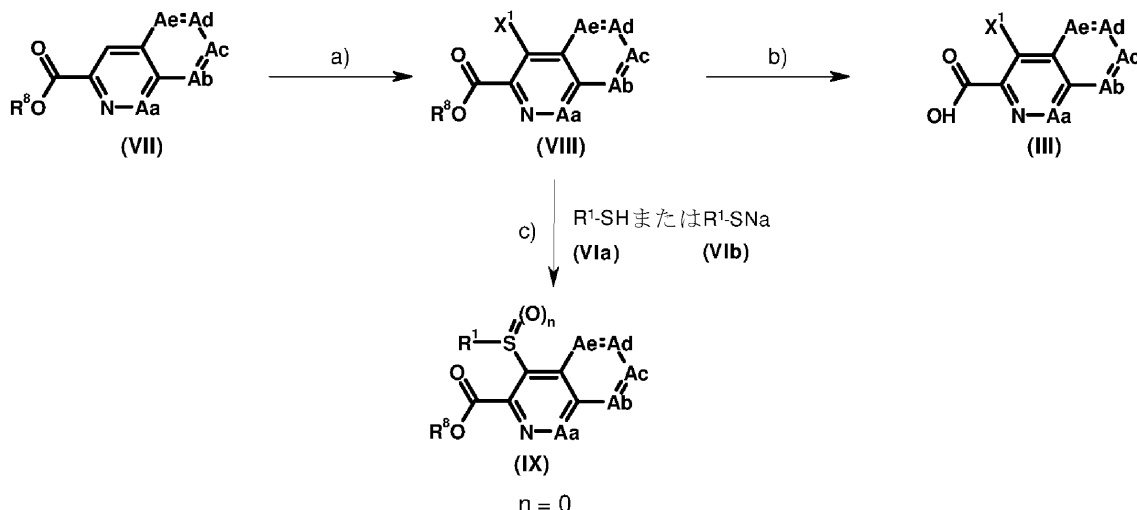
20

30

40

50

【化 8】



10

基 Aa、Ab、Ac、Ad、Ae、R¹ および n は、上述の定義を有し、X¹ はハロゲンを表し、R⁸ は、C₁ - C₄ アルキルを表す。

【0100】

ステップ a)

20

式 (VII) の化合物は、ハロゲン化を介して、式 (V) の化合物から公知の方法によって調製することができる。これは、例えば、指向性オルトリチオ化、続いて、適切な求電子性ハロゲン化試薬によるカルバニオンの捕捉を介して行うことができるか、または *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*、24 (2014)、4236 - 4238; *Tetrahedron*、58 (2002)、6723 - 6728 および WO2003/010146 に記載されているプロセスに類似した求電子性芳香族ハロゲン化を介して行うことができる。式 (V) の化合物は、商業的に入手可能であるかまたは式 (XXV) の化合物からエステル化を介して合成することができる。

【0101】

30

ステップ b)

式 (III) の化合物は、*Synthesis* 1987, 6, 586 - 587、*Tetrahedron Letters* 2006, 47, 565 - 567 または *ChemMedChem* 2010, 5, 65 - 78 に記載されている方法に類似して、式 (VII) の化合物からの加水分解を介して合成することができる。

【0102】

適切な塩基の例は例えば、水酸化リチウムまたは水酸化ナトリウムである。使用される溶媒は、極性非プロトン性およびプロトン性溶媒およびこれらの混合物、例えばエタノール、テトラヒドロフランまたは水であってもよい。

【0103】

40

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および -20°C ~ 120°C の温度で行うことができる。

【0104】

ステップ c)

n が 0 を表す式 (IX) の化合物は、式 (VII) の化合物を、塩基の存在下で式 (VIa) の化合物と反応させることによって、または、式 (VIb) の化合物と反応させることによって調製することができる。

【0105】

式 (VIa) のメルカプタン誘導体、例えばメチルメルカプタン、エチルメルカプタンまたはイソプロピルメルカプタンは、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例

50

例えばUS2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164またはJournal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329に記載されている方法に類似して調製することができる。

【0106】

nが0を表す式(I X)の化合物への変換は、ニートでまたは溶媒中で行うことができ、一般的な反応条件下で不活性の慣用の溶媒から選択される溶媒中で反応を行うことが好ましい。エーテル、例えばジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ニトリル、例えばアセトニトリルまたはプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエンまたはキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドンまたはジメチルスルホキシドが好ましい。

10

【0107】

適切な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩および炭酸塩からなる群からの無機塩基である。ここでは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムが好ましい。さらに好適な塩基は、アルカリ金属水素化物、例えば水素化ナトリウムである。

【0108】

あるいは、メルカプタン誘導体の塩(VI b)、例えば、ナトリウムエタンチオレート、ナトリウムメタンチオレートまたはナトリウムイソプロパンチオレートを、さらなる塩基の添加なしに直接使用することが可能である。反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および0℃~200℃の温度で実施することができる。

20

【0109】

記載された反応において、X¹は、好ましくはフッ素原子または塩素原子を表す。

【0110】

プロセスC

QがQ1~Q9、Q16、Q19またはQ21を表す式(I)の化合物は公知の方法、例えばWO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715、WO2015/198859、WO2016/039444、WO2016/039441、WO2016/116338およびWO2015/121136に記載されている方法に類似して調製することができる。

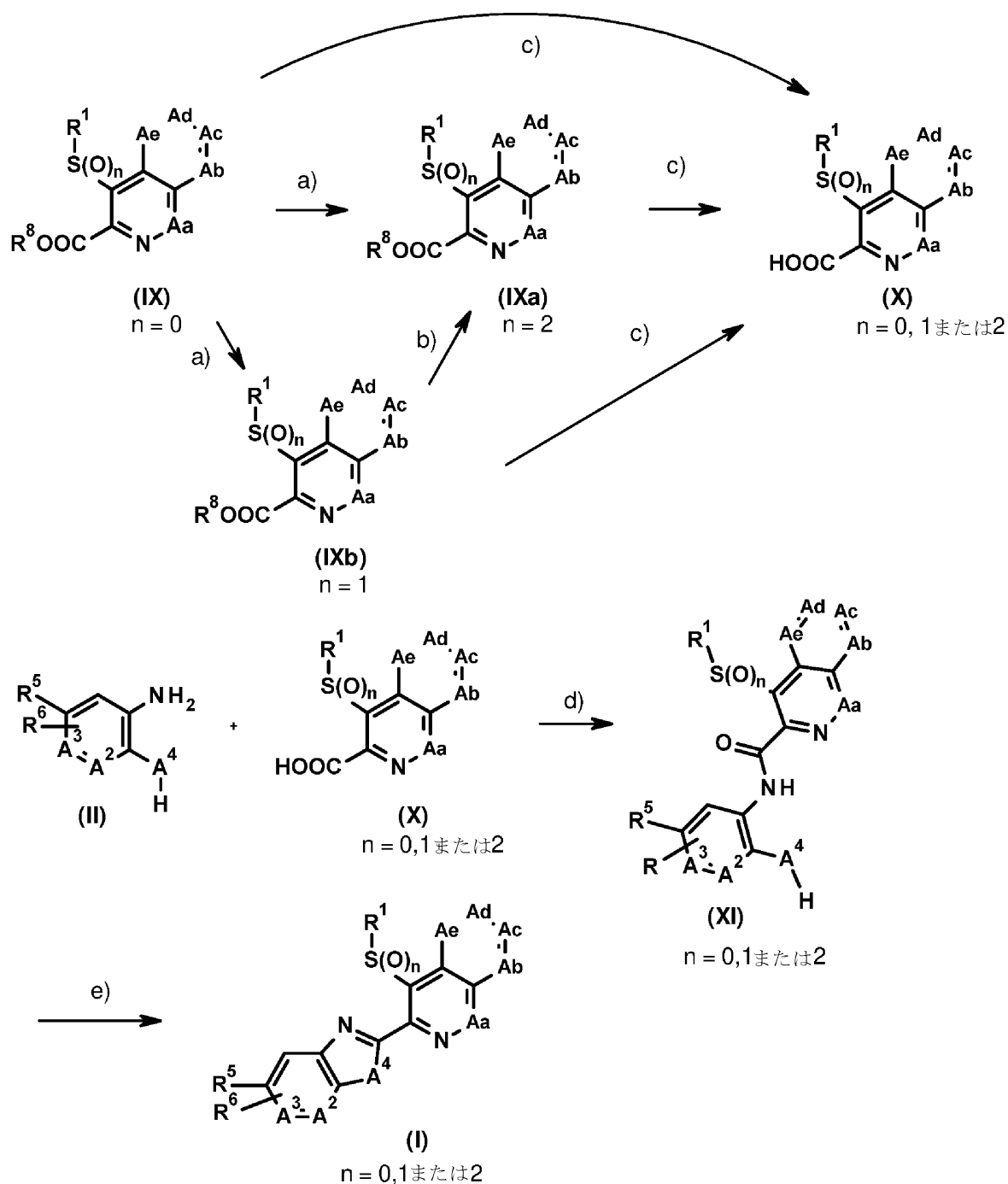
30

【0111】

40

50

【化 9】



基 Aa、Ab、Ac、Ad、Ae、R¹、R⁵、R⁶およびnは、上述の定義を有し、A²およびA³は、CHまたはNを表し、X¹はハロゲンを表し、A⁴は、O、SまたはNR⁴を表し、そして、R⁸は、(C₁–C₄)–アルキルを表す。

【0112】

QがQ21を表す式(I)の化合物については、A²はカルボニルを表し、A³はN–R^{6a}を表す。

【0113】

ステップa)、b)

nが2を表す式(IXa)の化合物は、nが0を表す式(IX)の化合物を酸化することによって調製することができる。酸化は、一般に溶媒中で行われる。ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；アルコール、例えばメタノールまたはエタノール；ギ酸、酢酸、プロピ

オン酸または水が好ましい。

【0114】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素およびメタークロロ過安息香酸である。

【0115】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および -20°C ～ 120°C の温度で行うことができる。

【0116】

n が1を表す式(I X b)の化合物は、 n が0を表す式(I X)の化合物を酸化することによって類似して調製することができる。

【0117】

n が2を表す式(I X a)の化合物は、 n が1を表す式(I X b)の化合物を酸化することによって類似して調製することができる。

【0118】

ステップc)

n が0、1または2を表す式(X)の化合物は、塩基の存在下、式(I X、 $n=0$) (I X a、 $n=2$) または (I X b、 $n=1$) の化合物の加水分解によって調製することができる。加水分解は一般に溶媒中で行われる。アルコール、例えばメタノールまたはエタノール；水；エーテル、例えばジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ニトリル、例えばアセトニトリルまたはプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエンまたはキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えばN, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドンまたはジメチルスルホキシド；または上記溶媒の混合物が好ましい。

【0119】

適切な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩および炭酸塩からなる群からの無機塩基である。ここでは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムが好ましい。

【0120】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および -20°C ～ 200°C の温度で行うことができる。

【0121】

ステップd)

式(X I)の化合物は、縮合剤または塩基の存在下、式(I I)の化合物と式(X)のカルボン酸との反応によって調製することができる。

【0122】

式(I I)の化合物は、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えば、US 2003/069257、US 2012/0319050、WO 2011/107998 またはWO 2010/91310に記載される方法に類似して調製され得る。

【0123】

式(I I)の化合物と式(X) (式中、 n は0、1または2を表す)のカルボン酸との反応は、ニートまたは溶媒中で行うことができ、好ましくは、一般的な反応条件下で不活性の慣用の溶媒から選択される溶媒中で反応を行う。エーテル、例えばジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；ニトリル、例えばアセトニトリルまたはプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエンまたはキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えばN, N-ジメチルホルムアミドまたはN-メチルピロリドン、または窒素化合物、例えばピリジンが好ましい。

【0124】

適切な縮合剤は、例えば1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)、1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミドのようなカルボジイ

10

20

30

40

50

ミド、塩化チオニルまたは塩化オキサリルである。

【0125】

適切な塩基は、このような反応に典型的に使用される無機塩基である。アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩および重炭酸塩からなる群から例として選択される塩基を使用することが好ましい。ここで特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムである。さらに好適な塩基は、アルカリ金属水素化物、例えば水素化ナトリウムである。

【0126】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および0℃～180℃の温度で実施することができ、好ましくは、反応は、大気圧および20～140℃の温度で実施される。

【0127】

ステップe)

nが0、1または2を表す式(I)の化合物は、塩基の存在下、式(XI)の化合物を縮合することによって調製することができる。

【0128】

nが0、1または2である式(I)の化合物への変換は、ニートでまたは溶媒中で行うことができ、好ましくは、一般的な反応条件下で不活性の慣用の溶媒から選択される溶媒中で反応を行う。エーテル、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；ニトリル、例えば、アセトニトリルまたはプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエンまたはキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミドまたはN-メチルピロリドン、または窒素化合物、例えば、ピリジンが好ましい。

【0129】

適切な塩基は、このような反応に典型的に使用される無機塩基である。アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩および重炭酸塩からなる群から例として選択される塩基を使用することが好ましい。ここで特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムである。

【0130】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および0℃～200℃の温度で実施することができる。

【0131】

プロセスD

QがQ10、Q11、Q14およびQ15を表す式(I)の化合物は、公知の方法によって、例えば、US2009/203705、US2012/258951、WO2013/3298、WO2016/071214またはJ. Med. Chem. 31, (1988) 1590-1595に記載されている方法に類似して調製することができる。

【0132】

10

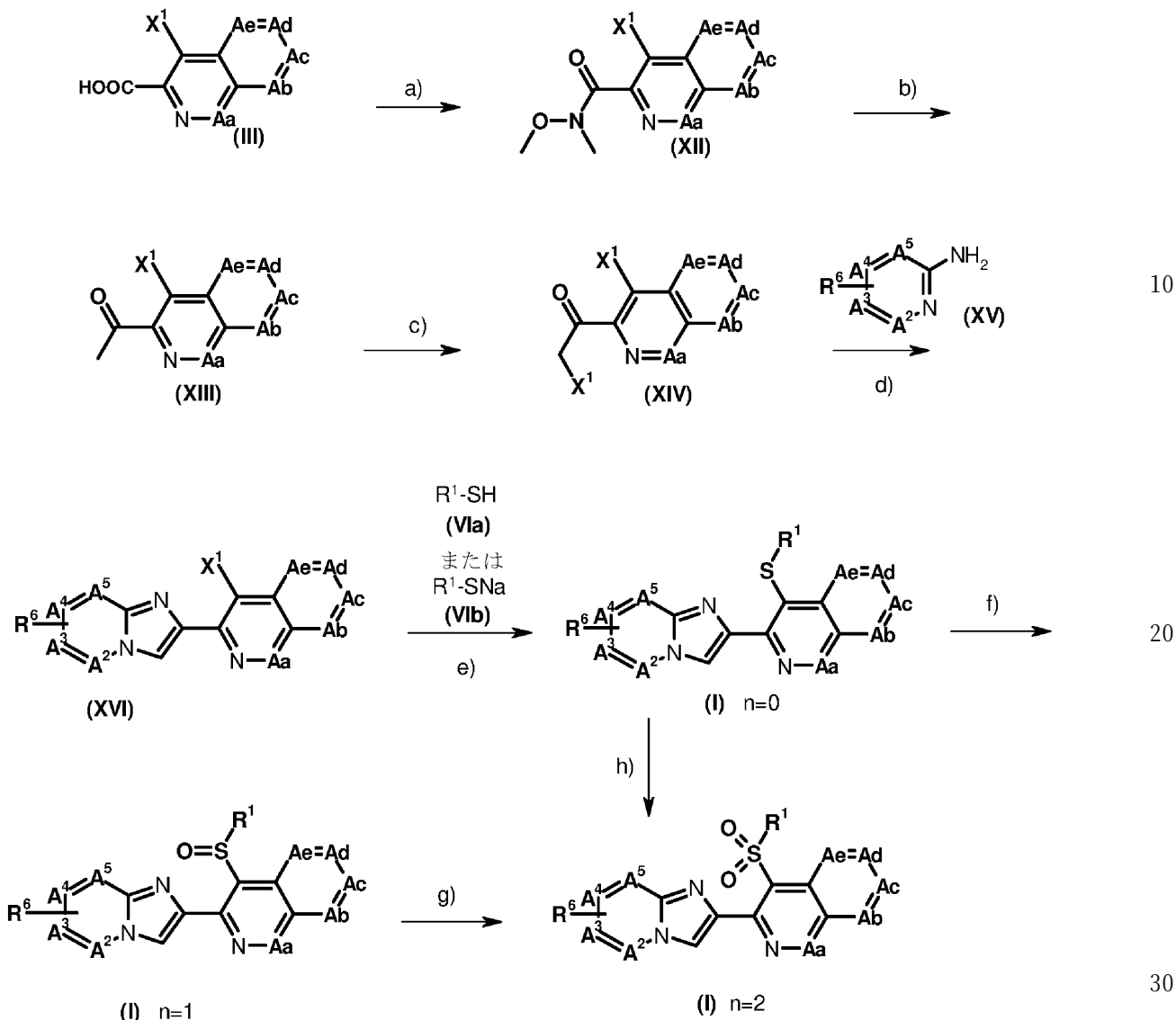
20

30

40

50

【化 10】



基 A^a 、 A^b 、 A^c 、 A^d 、 A^e 、 R^1 、 R^5 、 R^6 および n は、上述の定義を有する。
 A^2 、 A^3 及び A^5 は、 CH または N 、 A^4 は、 CR^5 または N （ここで、 A^2 、 A^3 、 A^4 および A^5 は両方とも N を表すわけではない）、そして、 X^1 はハロゲンを表わす。

【0133】

ステップ a)

式 (III) のカルボン酸は、 O 、 N -ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩の存在下、
 WO 2011/75643 または EP 2671582 に記載されている方法に類似して、
 式 (XII) のワインレブアミド (Weinreb amides) に変換される。

【0134】

式 (III) のカルボン酸は、商業的に入手可能であるかまたは公知の方法によって調製することができる。可能な調製経路は、プロセス H、I および J に記載されている。

【0135】

ステップ b、c)

次いで、式 (XII) の化合物を、公知の方法、例えば WO 2011/75643 に記載されている方法に類似して、グリニャール試薬、例えばメチルマグネシウムブロミドによって、式 (XIII) のケトンに変換することができる。式 (XIV) の化合物は、例えば US 2012/302573 に記載されている公知の方法に類似して、その後のハロゲン化によって得ることができる。

【0136】

ステップd)

式(XVI)の化合物は、式(XIV)の化合物を式(XV)のアミンで環化することによって調製することができる。環化は、例えば、エタノール、アセトニトリルまたはN, N-ジメチルホルムアミド中、例えばWO2005/66177、WO2012/88411、WO2013/3298、US2009/203705、US2012/258951、WO2012/168733、WO2014/187762またはJ. Med. Chem. 31 (1988) 1590-1595に記載されている方法に類似して公知の方法によって行われる。

【0137】

式(XV)の化合物は、商業的に入手可能である。

【0138】

ステップe)

nが0を表す式(I)の化合物は、式(XVI)の化合物を、塩基の存在下で式(VIa)の化合物と反応させることによって調製することができる。式(VIa)のメルカプタン誘導体、例えばメチルメルカプタン、エチルメルカプタンまたはイソプロピルメルカプタンは、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えばUS2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164またはJournal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329に記載されている方法に類似して調製することができる。

【0139】

あるいは、メルカプタン誘導体の塩(VIb)、例えばエタンチオレートナトリウム、メタンチオレートナトリウムまたはイソプロパンチオレートナトリウムを、さらなる塩基を添加することなく直接使用することが可能である。

【0140】

ステップf、g)

nが1を表す式(I)の化合物は、nが0を表す式(I)の化合物を酸化することによって調製することができる。酸化は、適当な酸化剤、例えば過酸化水素、メタークロロ過安息香酸または過ヨウ素酸ナトリウムを使用する公知の方法によって実施される。

【0141】

nが2を表す式(I)の化合物は、nが1を表す式(I)の化合物を酸化することによって調製することができる。

【0142】

酸化は、一般に溶媒中で行われる。ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；アルコール、例えばメタノールまたはエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸または水が好ましい。適切な酸化剤の例は、過酸化水素およびメタークロロ過安息香酸である。

【0143】

ステップh)

nが2を表す式(I)の化合物はまた、nが0を表す式(I)の化合物を酸化することによって、1工程プロセスで調製することもできる。酸化は、一般に溶媒中で行われる。ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン；アルコール、例えばメタノールまたはエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸または水が好ましい。適切な酸化剤の例は、過酸化水素およびメタークロロ過安息香酸である。

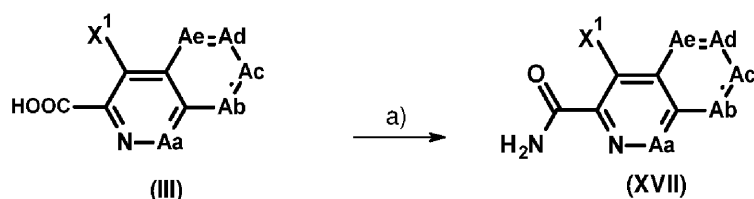
【0144】

プロセスE

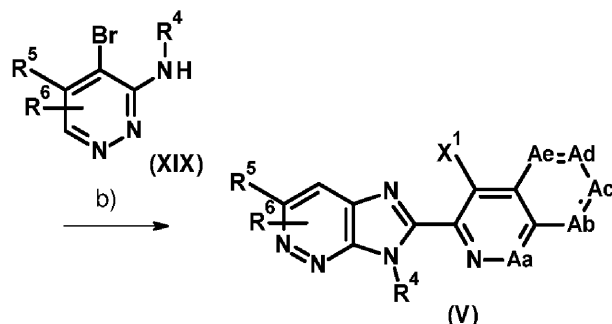
QがQ16を表す式(I)の化合物は、公知の方法、例えば、WO2014/142292に記載されている方法に類似して調製することができる。

【 0 1 4 5 】

【 化 1 1 】



10



20

基 A a、A b、A c、A d、A e、R⁴、R⁵ および R⁶ は、上述の定義を有する。X¹ はハロゲンを表す。

【 0 1 4 6 】

ステップ a)

式 (XVII) の化合物は、縮合剤の存在下、式 (III) の化合物をアンモニア源と反応させることによって、US 5 3 7 4 6 4 6 または Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093-1096 に記載されている方法に類似して調製することができる。

【 0 1 4 7 】

式 (III) のカルボン酸は、商業的に入手可能であるかまたは公知の方法によって調製することができる。可能な調製経路は、プロセス H、I および J に記載されている。

30

【 0 1 4 8 】

式 (III) の化合物とアンモニア源との反応は、一般的な反応条件下で不活性の通常の溶媒から選択される溶媒中で行うことが好ましい。エーテル、例えばジオキサンまたはテトラヒドロフランが好ましい。

【 0 1 4 9 】

適切な縮合剤は、例えばカルボニルジイミダゾールである。

【 0 1 5 0 】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下で行うことができる。好ましくは、反応は、大気圧および 20 ~ 70 °C の温度で実施される。

40

【 0 1 5 1 】

ステップ b)

式 (V) の化合物は、塩基性媒体中、パラジウム触媒の存在下、式 (XVII) の化合物を式 (XIX) の化合物と反応させることにより、WO 2 0 1 4 / 1 4 2 2 9 2 に記載されている方法に類似して製造することができる。

【 0 1 5 2 】

式 (XIX) の化合物は、例えば WO 2 0 1 4 / 1 4 2 2 9 2 に記載されている方法に類似して調製することができる。使用されるパラジウム触媒は、例えば、[1, 1'-ビス-(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)であってもよい。しばしば、使用される塩基は、カリウム *tert*-ブトキシドのような無機塩基である。

50

【0153】

反応は、溶媒中で行われる。しばしば、トルエンが使用される。

【0154】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下で行うことができる。好ましくは、反応は、大気圧および20～110℃の温度で実施される。

【0155】

式(V)の化合物の式(I)の化合物へのさらなる変換は、プロセスAに類似して行われる。

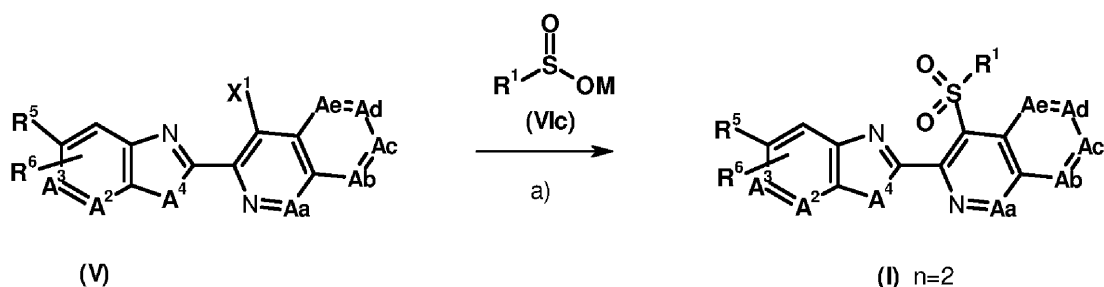
【0156】

プロセスF

nが2を表し、QがQ1～Q9、Q16、Q19またはQ21を表す式(I)の化合物は、公知の方法、例えばWO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715およびWO2015/121136に記載されている方法に類似して調製することができる。

【0157】

【化12】



基Aa、Ab、Ac、Ad、Ae、R¹、R⁵、R⁶、A²およびA³は、上述の定義を有し、A⁴は、O、SまたはN-R⁴を表し、そして、X¹はハロゲンを表し、好ましくは臭素またはヨウ素を表す。

【0158】

ステップa)

あるいは、nが2を表す式(I)の化合物はまた、例えば、Journal of Organic Chemistry 2005, 70, 2696-2700に記載されている方法に類似して、式(V)の化合物から進行する式(VIc)の化合物とのハロゲン-スルホン交換によって、1工程プロセスで調製することもできる。前記交換は一般に溶媒中で行われる。極性非プロトン性溶媒、例えばジメチルスルホキシドおよびN,N-ジメチルホルムアミドを使用することが好ましい。

【0159】

式(VIc)の化合物は、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えばOrganic Synthesis 1977, 57, 88-92; Tetrahedron Letters 1979, 9, 821-824およびBulletin de la Societe Chimique de France 1958, 4, 447-450に記載されている方法に類似して調製することができる。

【0160】

適切な硫黄試薬の例は、スルフィン酸のリチウム、ナトリウムまたはカリウム塩である。

【0161】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および-20℃～120℃の温度で行うことができる。

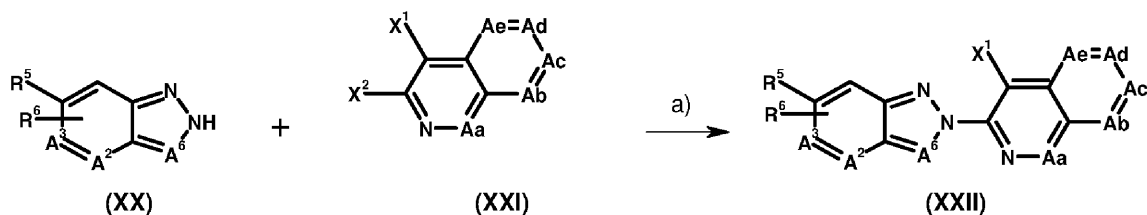
【0162】

プロセスG

QがQ12、Q13、Q17、Q18およびQ20を表す式(I)の化合物は、公知の方法、例えば、WO2010/091310、WO2012/66061またはWO2013/099041に記載されている方法に類似して調製することができる。

【0163】

【化13】



10

基Aa、Ab、Ac、Ad、Ae、R⁵およびR⁶は、上記の定義を有する。A²、A³およびA⁶は、CHまたはNを表し、X¹およびX²は、ハロゲンを表す。

【0164】

ステップa)

式(XXII)の化合物は、例えばWO2010/091310、WO2012/66061、WO2013/099041またはTetrahedron 1993, 49, 10997-11008に記載されている方法に類似して、塩基性条件下、式(XX)の化合物を式(XXI)の化合物と反応させることによって調製することができる。

20

【0165】

式(XX)の化合物は、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えばWO2005/100353、WO2012/66061、またはEuropean Journal of Medicinal Chemistry 2010, 45, 2214-2222に記載されている方法に類似して調製することができる。

【0166】

式(XXI)の化合物は、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えばWO2013/43518、EP2168965またはJournal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 1449-1455に記載されている方法に類似して調製することができる。

30

【0167】

使用される塩基は、通常、水素化ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸セシウムのような無機塩基である。

【0168】

式(XXII)の化合物への変換は、通常、溶媒中で行われ、好ましくは、ニトリル、例えばアセトニトリルまたはプロピオニトリル中、または、非プロトン性極性溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミドまたはN-メチルピロリドン中で行われる。

【0169】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および0℃~200℃の温度で実施することができる。

40

【0170】

あるいは、式(XXII)の化合物を与える式(XX)の化合物と式(XXI)の化合物との反応は、例えばAngewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947に記載されている方法に類似して、パラジウム触媒N-アリアル化によって実施することもできる。

【0171】

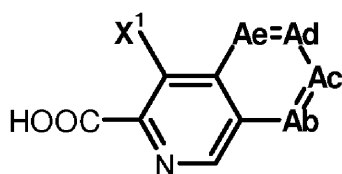
式(XXII)の化合物の式(I)の化合物へのさらなる変換は、プロセスAに類似して行われる。

【0172】

プロセスH

50

【化 14】

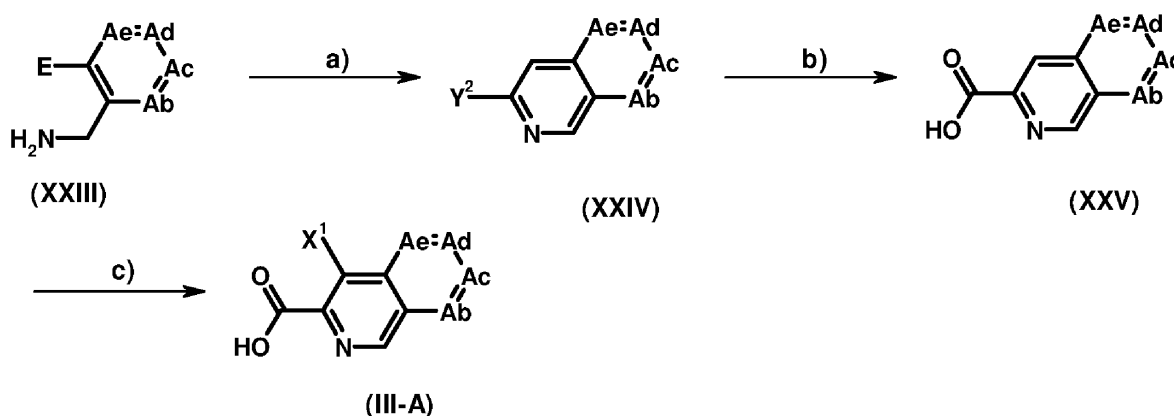


(III-A)

Aaが=C(H)-である式(III-A)のカルボン酸は、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えばTetrahedron, 40 (1984), 311-314、Monatshefte fuer Chemie, 139 (2008), 673-684、Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181、WO2015/071178、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728およびWO2003/010146に記載の方法に類似して、ベンジルアミンまたはヘタリールメタンアミンから調製することができる。

【0173】

【化 15】



基Ab、Ac、AdおよびAeは、上記の意味を有する。Eは、水素またはハロゲンを表し、そして、X¹はハロゲンを表す。Y²は、メチル、C(O)OR⁸、またはシアノを表す。R⁸は、水素またはC₁-C₆-アルキルを表す。

【0174】

ステップa)

式(XXIV)の化合物は、Tetrahedron, 40 (1984), 311-314またはMonatshefte fuer Chemie, 139 (2008), 673-684に記載されている方法に類似して、酸性または塩基性条件下、式(XXIII)のベンジルアミンまたはヘタリールメタンアミンと対応するカルボニル化合物との縮合によって合成することができる。

【0175】

式 (XXIII) の化合物は、商業的に入手可能であるか、または既知の方法、例えば、WO1997/41846; US2011/0105753; Journal of Medicinal Chemistry, 46 (2003), 461-473; WO2010/024430; WO2005/111003; Journal of Heterocyclic Chemistry, 23 (1986), 989-990に記載の方法と類似の方法で調製することができる。

【0176】

ステップb)

式 (XXV) の化合物は、公知の方法によって、例えば、酸性、塩基性または熱条件下での式 (XXIV) ($Y^2 = C(O)OR^8$ またはシアノの場合) の化合物の加水分解によって調製することができる。

10

【0177】

式 (XXV) の化合物は、Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181およびWO2015/071178に記載の方法に類似して、式 (XXIV) ($Y^2 = \text{メチル}$ であれば) の化合物からのベンジル酸化を介して調製することができる。

20

【0178】

ステップc)

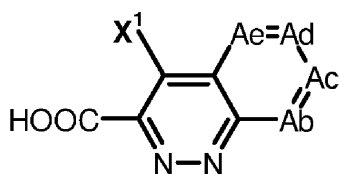
式 (III-A) の化合物は、ハロゲン化を介して式 (XXV) の化合物から公知の方法によって調製することができる。これは、例えば、指向性オルト-リチオ化、次いで、適切な求電子性ハロゲン化試薬によるカルバニオンの捕捉を介して行うか、またはBioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728およびWO2003/010146に記載されている方法に類似して、カルボン酸誘導体指向性ハロゲン化を介して行うことができる。

30

【0179】

プロセスI

【化16】



(III-B)

40

Aaが窒素を表し、Ab、Ac、AdおよびAeが上記の定義を有し、そして、 X^1 がハロゲンを表す式 (III-B) のカルボン酸は、商業的に入手可能であるか、または公知の方法、例えばWO2017/072039からのプロセスHに類似して調製することができる。

【0180】

プロセスJ

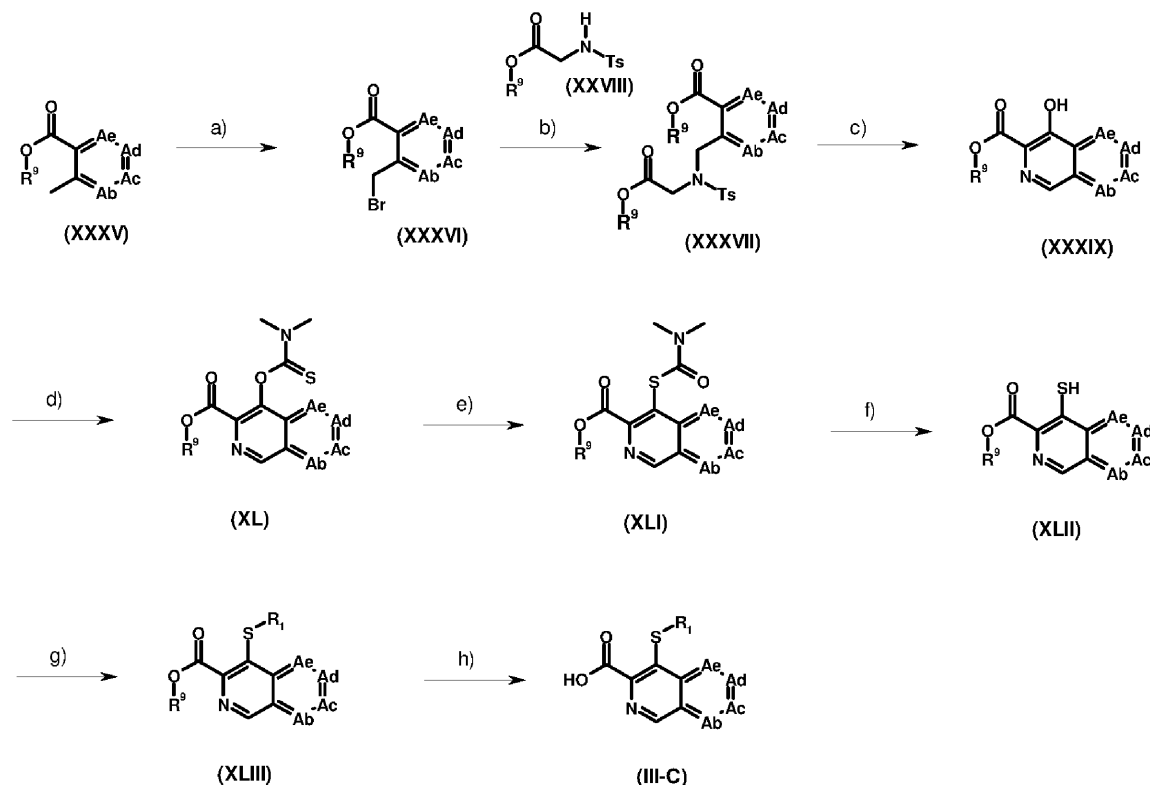
Aaが炭素を表し、Ab、Ac、Ad、Aeおよび R^1 が上記の定義を有し、 R^9 が C_1-C_4 アルキルを表し、そして、Tsがトシル ($CH_3C_6H_4SO_2-$) を表し、そして、置換基 R^8 、 R^9 、 R^{10} または R^{11} の1つがハロゲン (好ましくは臭素またはヨウ素

50

）を表すカルボン酸（III-C）は、例えば、以下に記載するプロセスの1つを介して調製することができる。

【0181】

【化17】



【0182】

ステップ a)

式（XXXVI）の化合物は、商業的に入手可能であるか、または *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* 2016, 26, 2526-2530 または *Tetrahedron Letters* 2012, 53, 3654-3657 に記載の方法に類似して、式（XXXV）の化合物からフリーラジカル臭素化を介して調製することができる。

【0183】

使用される臭素化試薬は、例えば N-ブロモスクシンイミドであり得る。アゾイソブチロニトリル（AIBN）のようなアゾ化合物または例えば過酸化ジベンゾイルのような過酸化物をラジカル開始剤として使用することができる。

【0184】

使用される溶媒は、好ましくは非プロトン性溶媒、例えば四塩化炭素である。

【0185】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、およそ -20 °C ~ 120 °C の温度で行うことができる。

【0186】

式（XXXV）の化合物は、商業的に入手可能である。

【0187】

ステップ b)

式（XXXVII）の化合物は、WO 2007 / 090068 に記載された方法に類似して、塩基の存在下、式（XXXVI）の化合物および式（XXXVII）の化合物を使用するアミノ化を介して調製することができる。

【0188】

式（XXXVII）の化合物は、商業的に入手可能である。

【0189】

適切な塩基は、例えば無機塩基、例えば、炭酸塩基である。使用される溶媒は極性非プロトン性溶媒、例えば、N，N-ジメチルホルムアミドまたはテトラヒドロフランであり得る。

【0190】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および-20℃～120℃の温度で行うことができる。

【0191】

ステップc)

式(XXXIX)の化合物は、WO2007/090068に記載されている方法に類似して、式(XXXVII)の化合物の環化を介して調製することができる。反応は塩基の存在下で行うことができ、例えば、ナトリウムメトキシドまたはカリウムメトキシドまたはナトリウムエトキシドまたはカリウムエトキシドのようなアルコキシド塩基を使用することができる。

10

【0192】

適切な溶媒は、プロトン性溶媒、例えばメタノールまたはエタノールのような短鎖アルコールである。

【0193】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および-20℃～120℃の温度で行うことができる。

20

【0194】

ステップd)

式(XL)の化合物は、Tetrahedron, 2007, 63, 4120-4125またはJournal of the American Chemical Society 2015, 137, 15684-15687に記載されている方法に類似して、式(XXXIX)の化合物から進行する塩基の存在下で、試薬としてジメチルチオカルバモイルクロライドを用いて調製することができる。

【0195】

適切な塩基は、例えば水素化ナトリウムまたは1，4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)である。使用される溶媒は極性非プロトン性溶媒、例えば、N，N-ジメチルホルムアミドまたはテトラヒドロフランであり得る。

30

【0196】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および-20℃～120℃の温度で行うことができる。

【0197】

ステップe)

式(XLII)の化合物は、Tetrahedron, 2007, 63, 4120-4125、WO2001/000206またはWO2008/018427に記載されている方法に類似して、式(XL)の化合物から進行して、いわゆるニューマン・クワート転位(Newman-Kwart rearrangement)によって調製することができる。

40

【0198】

使用される溶媒は、例えば、ジフェニルエーテル、N，N-ジメチルホルムアミドまたはN-メチル-2-ピロリドンであってもよい。

【0199】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および100℃～250℃の温度で行うことができる。

【0200】

ステップf)

式(XLIII)の化合物は、WO2001/000206、Bioorganic &

50

Medicinal Chemistry Letters, 2014, 24, 72-76
またはWO2008/061741に記載されている方法に類似して、塩基の存在下、式
(XLI)の化合物から進行するように調製することができる：例えば、ナトリウムメト
キシド、カリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドまたはカリウムエトキシドのような
アルコキシド塩基を使用することが可能である。

【0201】

適切な溶媒は、プロトン性溶媒、例えばメタノールまたはエタノールのような短鎖アル
コールである。

【0202】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および-20℃~120℃の温度で行うこ
とができる。

【0203】

ステップg)

式(XLIII)の化合物は、Organic Letters, 2016, 18, 2
966-2969、Journal of the American Chemical
Society, 2017, 139, 9605-9614またはSynthesis, 2
017, 49, 917-924に記載されている方法に類似して、塩基の存在下、式(X
LII)の化合物から進行するように調製することができる：例えば、ナトリウムメトキ
シド、カリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドまたはカリウムエトキシドのようなア
ルコキシド塩基を使用することが可能である。

【0204】

使用されるアルキル化剤は、例えばハロゲン化アルキル、例えば塩化アルキル、臭化ア
ルキルまたはヨウ化アルキルである。

【0205】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および-20℃~120℃の温度で行うこ
とができる。

【0206】

ステップh)

式(III-C)の化合物は、Synthesis 1987, 6, 586-587、
Tetrahedron Letters 2006, 47, 565-567またはChe
mMedChem 2010, 5, 65-78に記載されている方法に類似して、式(X
LIII)の化合物からの加水分解を介して合成することができる。

【0207】

適切な塩基の例は、例えば水酸化リチウムまたは水酸化ナトリウムである。使用される
溶媒は、極性非プロトン性およびプロトン性溶媒およびこれらの混合物、例えばエタノー
ル、テトラヒドロフランまたは水であってもよい。

【0208】

反応は、減圧下、標準圧力下または高圧下、および-20℃~120℃の温度で行うこ
とができる。

【0209】

プロセスL

10

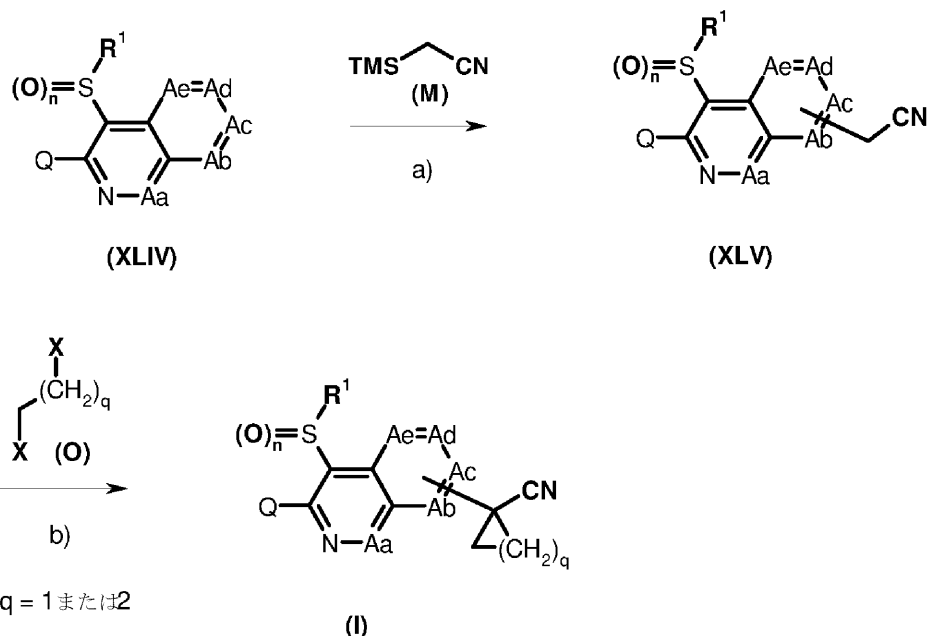
20

30

40

50

【化 18】



基 Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Ae 、 Q 、 R^1 および n は、上記の定義を有し、 q は 1 または 2 を表し、そして、 X はハロゲンを表し、ここで、置換基 R^8 、 R^9 、 R^{10} または R^{11} の 1 つはハロゲン（好ましくは臭素またはヨウ素）を表す。

【0210】

ステップ a)

式 (XLV) の化合物は、例えば、J. Am. Chem. Soc. (2002), 124, 9330、J. Am. Chem. Soc. (2005), 127, 15824 または WO2016/041819 に記載されている方法によって、触媒、リガンドおよび塩基の存在下、式 (M) の化合物とともに式 (XLIV) の化合物をシアノメチル化することによって調製することができる。

【0211】

式 (M) の化合物は、商業的に入手可能である。

【0212】

式 (XLV) の化合物への変換、一般に溶媒中で行われる。N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドンまたはジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒が好ましい。

【0213】

触媒としての使用に適しているのは、パラジウム錯体、例えば、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム (0) または [1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィン）フェロセン] ジクロロパラジウム (II) であり、使用される配位子は、一般に有機ホスファン化合物、例えば、ビス（ジフェニルホスフィン）-9, 9-ジメチルキサンテン（キサントホス）である。

【0214】

適切な塩基は、例えばフッ化亜鉛である。

【0215】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および $0^\circ C \sim 200^\circ C$ の温度で実施することができる。

【0216】

あるいは、シアノメチル化はまた、スズキカップリングによって、例えば J. Am. Chem. Soc. (2011), 133, 6948-6951 に記載されている方法によって実施され得る。

【0217】

ステップb)

nが2を表す式(I)の化合物は、例えば式(XLV)の化合物を、塩基の存在下、式(O)の化合物と反応させることによって、例えば、WO2016/041819に記載の方法によって調製することができる。

【0218】

式(O)の化合物は、商業的に入手可能である。

【0219】

nが2を表す式(I)の化合物への変換は、一般に溶媒中で行われる。ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンまたはクロロベンゼン、非プロトン性極性溶媒、例えばアセトン、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、ニトリル、例えばアセトニトリル、またはエステル、例えば酢酸エチルが好ましい。

10

【0220】

適切な塩基の例は、窒素複素環、例えばピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)；第3級アミン、例えばトリエチルアミンおよびN,N-ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えばリン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸カリウムおよび水素化ナトリウムである。

【0221】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および0℃～200℃の温度で実施することができる。

20

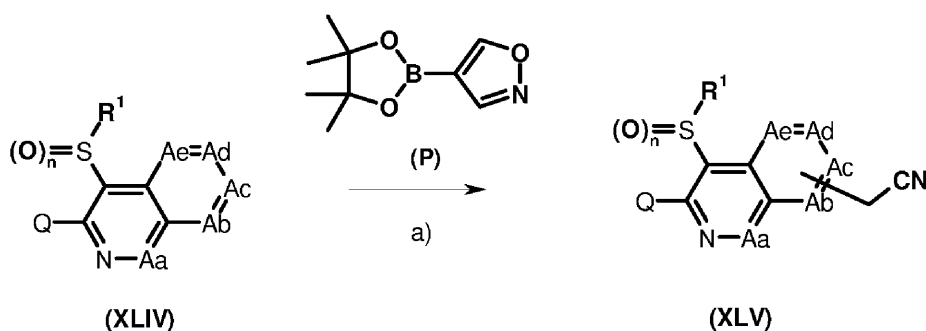
【0222】

n=0またはn=1である対応する化合物は、類似して調製することができる。

【0223】

プロセスM

【化19】



30

基Aa、Ab、Ac、Ad、Ae、Q、R¹およびnは、上記の定義を有し、ここで、置換基R⁸、R⁹、R¹⁰またはR¹¹の1つは、ハロゲン（好ましくは臭素またはヨウ素）を表す。

【0224】

40

ステップa)

式(XLV)の化合物は、例えばJ. Am. Chem. Soc. (2011), 133, 6948に記載されている方法により、触媒、配位子および塩基の存在下、1工程プロセスで式(P)の化合物を用いて式(XLIV)の化合物をシアノメチル化することにより製造することができる。

【0225】

変換は、スズキカップリングとイソオキサゾールのその後の塩基誘導断片化を介して行われる。

【0226】

変換に使用できる触媒は、パラジウム-ホスフィン錯体、例えば1,1-ビス(ジフェ

50

ニルホスフィノ) フェロセンジクロロパラジウム (I I) である。好ましい塩基は、例えばフッ化カリウムまたはフッ化セシウムである。

【0227】

式 (X L V) の化合物への変換は、一般に溶媒中で行われる。非プロトン性極性溶媒、例えば N, N-ジメチルホルムアミドまたはジメチルスルホキシドと水との混合物が好ましい。

【0228】

反応は、減圧下、大気圧下または高圧下、および 20℃~200℃の温度で実施することができる。好ましい温度は 130~140℃である。

【0229】

式 (P) の化合物 (4-イソオキサゾールボロン酸ピナコールエステル) は、商業的に入手可能である。

【0230】

式 (I) の化合物を得るためのさらなる変換は、方法 L に類似して実施される。

【0231】

方法および使用

本発明はまた、式 (I) の化合物が害虫および／またはそれらの生息地に作用することを可能にする、害虫を防除するための方法に関する。害虫は、好ましくは農業および林業、ならびに材料保護において防除される。これは、好ましくはヒトまたは動物の身体の外科的または治療的処置のための方法、およびヒトまたは動物の身体で実施される診断方法を除外する。

【0232】

本発明はさらに、有害生物防除剤 (pesticides)、特に作物保護剤としての式 (I) の化合物の使用に関する。

【0233】

本出願の文脈において、用語「有害生物防除剤」は、それぞれの場合において、用語「作物保護組成物」も常に包含する。

【0234】

良好な植物耐性、好ましい温血毒性および良好な環境適合性を与えられた式 (I) の化合物は、生物学および非生物学的ストレス因子から植物および植物器官を保護するために、収穫量を増加させるために、収穫された材料の品質を改善するために、ならびに農業、園芸、畜産、水産養殖、森林、庭園およびレジャー施設、貯蔵製品および材料の保護、ならびに衛生部門において遭遇する害虫、特に昆虫、クモ類、蠕虫、特に線虫および軟体動物を防除するために適している。

【0235】

本特許出願の文脈において、用語「衛生」は疾病、特に感染症を予防することを目的とし、ヒトおよび動物の健康を保護し、および／または環境を保護し、および／または清潔さを維持するのに役立つ、あらゆる手段、規定および手順を意味すると理解されるべきである。本発明によれば、これは、特に、例えば、織物または硬質表面、特にガラス、木材、セメント、磁器、セラミック、プラスチック、または他の金属 (複数可) で作られた表面が衛生有害生物および／またはそれらの分泌物を含まないことを確実にするための、洗浄、消毒および滅菌のための手段を含む。この点に関する本発明の保護範囲は、好ましくは人体または動物の身体に適用される外科的または治療的処置手順、ならびに人体または動物の身体に対して行われる診断手順を除外する。

【0236】

用語「衛生部門」は、例えば台所、パン屋、空港、浴室、スイミングプール、百貨店、ホテル、病院、厩舎、動物飼育等における衛生に関して、これらの衛生対策、規定および手順が重要である全ての分野、技術分野および産業用途を包含する。

【0237】

したがって、用語「衛生有害生物」は、衛生部門での存在が特に健康の理由で問題とな

10

20

30

40

50

る1つ以上の害虫を意味すると理解されるべきである。したがって、主な目的は、衛生部門における衛生有害生物の存在および／またはこれらへの曝露を回避するか、または最小限に制限することである。これは、特に、寄生の予防および既存の寄生の予防の両方のために使用され得る有害生物防除剤の使用によって達成され得る。有害生物への曝露を防止または低減する製剤を使用することも可能である。衛生有害生物には、例えば、以下に述べる生物が含まれる。

【0238】

従って、用語「衛生保護」は、これらの衛生措置、規定および手続が維持されおよび／または改善されるすべての行為を包含する。

【0239】

式(I)の化合物は、好ましくは有害生物防除剤として使用することができる。それらは、通常感受性および耐性の種に対して、ならびに発達のすべてのまたは特定の段階に対しても活性である。上記有害生物には以下のものが含まれる：

節足動物門からの有害生物、特にクモ綱 (*Arachnida*)、例えば、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、例えば、アカルス・シロ (*Acarus siro*)、アケリア・クコ (*Aceria kuko*)、アケリア・シェルドニ (*Aceria sheldoni*)、アクロプス属種 (*Aculops* spp.)、アクルス属種 (*Aculus* spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ (*Aculus fockeui*)、アクルス・シュレクテンダリ (*Aculus schlechtendali*)、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス (*Amphitetranychus viennensis*)、アルガス属種 (*Argas* spp.)、ボオフィルス属種 (*Boophilus* spp.)、ブレビパルプス属種 (*Brevipalpus* spp.)、例えば、ブレビパルプス・ホエニシス (*Brevipalpus phoenicis*)、ブリオビア・グラミヌム (*Bryobia graminum*)、ブリオビア・プラエチオサ (*Bryobia praetiosa*)、セントロロイデス属種 (*Centruroides* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、デルマニスス・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、デルマトファゴイデス・ファリナエ (*Dermatophagoides farinae*)、デルマセントロ属種 (*Dermacentor* spp.)、エオテトラニクス属種 (*Eotetranychus* spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ (*Eotetranychus hicoriae*)、エピトリメルス・ピリ (*Epitrimerus pyri*)、エウテトラニクス属種 (*Eutetranychus* spp.)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ (*Eutetranychus banksi*)、エリオフィエス属種 (*Eriophyes* spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ (*Eriophyes pyri*)、グリシファグス・ドメスティクス (*Glycyphagus domesticus*)、ハロチデウス・デストルクトル (*Halotydeus destructor*)、ヘミタロソネムス属種 (*Hemitarsonemus* spp.)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス (*Hemitarsonemus latus*) (=ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*))、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、イキソデス属種 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクトゥス属種 (*Latrodectus* spp.)、ロキソスケレス属種 (*Loxosceles* spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コフェアエ (*Oligonychus coffeae*)、オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus m*

10

20

30

40

50

angiferus)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yothersi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニクス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニクス属種 (*Panonychus* spp.)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocopturta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピッキ (*Steneotarsonemus spinki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコペルシシ (*Vasates lycopersici*) ;

ムカデ綱 (*Chilopoda*) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus* spp.)、スクチゲラ属種 (*Scutigera* spp.) ;

[0240]

トビムシ目 (*Collembola*) またはトビムシ綱の、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)、スミンツルス・ビリジス (*Sminthurus viridis*) ;

ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*) ;

昆虫綱 (*Insecta*) の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*) の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、ロボプテラ・デシピエンス (*Loboptera decipiens*)、ネオスチロピガ・ロムビフォリア (*Neostylopyga rhombifolia*)、パンクロラ属種 (*Panchlora* spp.)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta* spp.)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta* spp.)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus surinamensis*)、スペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) ;

甲虫目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種 (*Adoretus* spp.)、アエチ

10

20

30

40

50

ナ・ツミダ (*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリルス属種 (*Agrius spp.*)、例えば、アグリルス・プラニペンニス (*Agrius planipennis*)、アグリルス・コキサリス (*Agrius coxalis*)、アグリルス・ビリネアツス (*Agrius bilineatus*)、アグリルス・アンキシウス (*Agrius anxius*)、アグリオテス属種 (*Agriotes spp.*)、例えば、アグリオテス・リンネアツス (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属種 (*Anoplophora spp.*)、例えば、アノプロホラ・グラブリペンニス (*Anoplophora glabripennis*)、アントノムス属種 (*Anthonomus spp.*)、例えば、アントノムス・グルンジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus spp.*)、アピオン属種 (*Apion spp.*)、アポゴニア属種 (*Apogonia spp.*)、アトマリア属種 (*Atomaria spp.*)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus spp.*)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulescens*)、ブルキジウス・オブテクトゥス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種 (*Bruchus spp.*)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフィマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida spp.*)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorrhynchus spp.*)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema spp.*)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus spp.*)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites spp.*)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアルンジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera spp.*)、クルクリオ属種 (*Curculio spp.*)、例えば、クルクリオ・カリヤエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリヤトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus spp.*)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デンドロクトヌス属種 (*Dendroctonus spp.*)、例えば、デンドロクトヌス・ポンデロサエ (*Dendroctonus ponderosae*)、デルメステス属種 (*Derместes spp.*)、ジアブロチカ属種 (*Diabrotica spp.*)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシム

10

20

30

40

50

プンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジア
 ブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zeae*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis* spp.)、
 ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボデル
 ス属種 (*Diloboderus* spp.)、エピカエルス属種 (*Epicaerus* spp.)、エピラクナ属種 (*Epilachna* spp.)、例えば、エピラクナ・
 ボレアリス (*Epilachna borealis*)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna varivestis*)、エピトリキス属種 (*Epitrix* spp.)、
 10 例、例えば、エピトリキス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エ
 ピトリキス・フスクラ (*Epitrix fuscula*)、エピトリキス・ヒルチペン
 ニス (*Epitrix hirtipennis*)、エピトリキス・スブクリニタ (*Epitrix subcrinita*)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、
 ファウスチヌス属種 (*Faustinus* spp.)、ギビウム・プシロ
 イデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、
 ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテ
 ロニクス属種 (*Heteronyx* spp.)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、
 20 ヒペラ・ポストカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・ス
 クアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、
 ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・プベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、
 ラクノステルナ・コンサングイネア (*Lachnosterna consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricorne*)、
 ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウ
 ス属種 (*Lathridius* spp.)、レマ属種 (*Lema* spp.)、レプチノ
 タルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レ
 ウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフエエ
 ラ (*Leucoptera coffeella*)、リモニウス・エクチプス (*Limonius ectypus*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、
 リストロノツス属種 (*Listronotus* spp.) (=ヒペロデス属種 (*Hyperodes* spp.)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、
 ルペロデス属種 (*Luperodes* spp.)、ルペロモルファ・
 キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、リクツス属種 (*Lyctus* spp.)、メガシレネ属種 (*Megacyllene* spp.)、例えば、
 30 メガシレネ・ロビニアエ (*Megacyllene robiniae*)、メガセリス
 属種 (*Megascelis* spp.)、メラノツス属種 (*Melanotus* spp.)、
 40 例、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、
 メロロンタ属種 (*Melolontha* spp.)、例えば、メロロ
 ンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属種 (*Monochamus* spp.)、
 ナ
 ウパクツス・キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、
 ネクロビア属種 (*Necrobia* spp.)、ネオガレルセラ属種 (*Neogale rucella* spp.)、ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、
 オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエ

10

20

30

40

50

フィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、
 オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス
 属種 (*Otiorthynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス
 (*Otiorthynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグス
 チシ (*Otiorthynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiorthynchus ovatus*)、
 オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiorthynchus rugosostriatus*)、オチオリンクス・スルカツ
 ス (*Otiorthynchus sulcatus*)、オウレマ属種 (*Oulema* spp.)、例えば、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレ
 マ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、オキシセトニア・ジユクンダ (*Oxyetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、
 フィロファガ属種 (*Phyllophaga* spp.)、フィロ
 ファガ・ヘレリ (*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属種 (*Phyllostreta* spp.)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllostreta armoraciae*)、
 フィロトレタ・プシラ (*Phyllostreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllostreta ramosa*)、
 フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllostreta striolata*)、ポピリ
 ア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrypes* spp.)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus truncatus*)、
 プシリオデス属種 (*Psylliodes* spp.)、例えば、プシリオデス・アフィニス (*Psylliodes affinis*)、プ
 シリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、
 プシリオデス・プンクツラタ (*Psylliodes punctulata*)、プチヌ
 ス属種 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、
 リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、
 リンコホルス属種 (*Rhynchophorus* spp.)、リンコホルス・フェルギ
 ネウス (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パル
 マルム (*Rhynchophorus palmarum*)、スコリツス属種 (*Scolytus* spp.)、例えば、スコリツス・ムルチストリアツス (*Scolytus multistriatus*)、
 シノキシロン・ペルホランス (*Sinoxylon perforans*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、例えば、シ
 トフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィル
 ス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、
 スフェノホルス属種 (*Sphenophorus* spp.)、
 ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス
 属種 (*Sternechus* spp.)、例えば、ステルネクス・パルダツス (*Sternechus paludatus*)、シムフィレテス属種 (*Symphyletes* spp.)、
 タニメクス属種 (*Tanymecus* spp.)、例えば、タニメクス・ジ
 ラチコリス (*Tanymecus dilaticollis*)、タニメクス・インジ
 クス (*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パリアツス (*Tanymecus palliatus*)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、
 テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebrio ides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium* spp.)、例えば、トリボリ
 ウム・アウダキス (*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム (*Tribolium confusum*)、
 トロゴデルマ属種 (*Trogoderma* spp.)、チ
 キウス属種 (*Tychius* spp.)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus* spp.)、ザブルス属種 (*Zabrus* spp.)、例えば、ザブルス・テネブリオ

10

20

30

40

50

イデス (*Zabrus tenebrioides*) ;
【0241】

ハサミムシ目 (*Dermaptera*) の、例えば、アニソラビス・マリチメ (*Anisolabis maritime*)、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)、ラビズラ・リパリア (*Labidura riparia*) ;

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes* spp.)、例えば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス (*Aedes albopictus*)、アエデス・ステクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種 (*Agromyza* spp.)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha* spp.)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジア属種 (*Asphondylia* spp.)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera* spp.)、例えば、バクトロセラ・ククルビタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレアエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus* spp.)、クリソミア属種 (*Chrysomya* spp.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya* spp.)、コンタリニア属種 (*Contarinia* spp.)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia privityra*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロビア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex* spp.)、例えば、クレキス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリセタ属種 (*Culiseta* spp.)、クテレブラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura* spp.)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デリア属種 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アントクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロリレガ (*Delia florigata*)、デリア・プラツラ (*Delia platura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、エウレイア・ヘラクレイ (*Euleia heraclei*)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種 (*Glossina* spp.)、

10

20

30

40

50

ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属種 (*Hylemya* spp.)、ヒッポドスカ属種 (*Hippobosc* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フィドブレシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミヤ属種 (*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属種 (*Manson* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルス属種 (*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミアまたはペゴミヤ属種 (*Pegomya* or *Pegomyia* spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒオシヤミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophil* spp.)、プラチパレア・ポエシロプテラ (*Platyparea poeciloptera*)、プロジプロシス属種 (*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラタ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種 (*Tetanops* spp.)、チプラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チプラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チプラ・シムプレキス (*Tipula simplex*)、トキシトリパナ・クルビカウダ (*Toxotrypana curvicauda*) ;

【0242】

カメムシ目 (*Hemiptera*) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシルトシポン属種 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシホン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocanthus* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca de*

10

20

30

40

50

vastans）、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、ア
 オニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、アオニジエラ・アウラン
 チイ (*Aonidiella aurantii*)、アオニジエラ・シトリナ (*Aoni
 diella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella i
 nornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、
 アフィス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフィス・シトリコラ (*Aphis c
 itricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、ア
 フィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ (*Aphis for
 besii*)、アフィス・グリシネス (*Aphis glycines*)、アフィス・ゴシ
 ピイ (*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘデラエ (*Aphis hederae*)、
 アフィス・イリノイセンス (*Aphis illinoisensis*)、アフ
 イス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ (*A
 phis nasturtii*)、アフィス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフィ
 ス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ (*Aphis spirae
 cola*)、アフィス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アル
 ボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種
 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* sp
 p.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオ
 ツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* sp
 p.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア
 ・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Bl
 astopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウ
 カエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘ
 リクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*B
 rachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne
 brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、
 カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マル
 ギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capul
 inia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala fu
 lgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、
 セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplast
 es* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon frag
 aefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegale
 nsis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス
 ・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*Ch
 rysomphalus aonidum*)、クリソムファルス・フィクス (*Chr
 ysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mb
 ila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccoomytilus halli*)、コック
 ス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus h
 esperidum*)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コ
 ックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)
 、コックス・ビリジス (*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa*
 spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス
 属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・キテンデニ (*Dialeuro
 des chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes
 citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジラスピス
 属種 (*Diaspis* spp.)、ジウラフィス属種 (*Diuraphis* spp.)
 、ドラリス属種 (*Doralis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp

10

20

30

40

50

.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホ
 リア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dys
 aphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tu
 lipae*)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムポアス
 カ属種 (*Empoasca* spp.)、例えば、エムポアスカ・アブルブタ (*Empo
 asca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)
 、エムポアスカ・マリグナ (*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラ
 ナ (*Empoasca solana*)、エムポアスカ・ステベンシ (*Empoasca
 stevensi*)、エリオソマ属種 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオ
 ソマ・アメリカヌム (*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲ
 ルム (*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Erioso
 ma pyricola*)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)
 、エウカリプトリマ属種 (*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種
 (*Euphyllura* spp.)、エウセリス・ビロバツス (*Euscelis bi
 lobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、フィオリニア属種
 (*Fiorinia* spp.)、フルカスピス・オセアニカ (*Furcaspis oc
 eanica*)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus coffeae*)、
 グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (*Hete
 ropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsyl
 la spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca co
 agulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arun
 dinis*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、イセ
 リア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・プルカシ (*Icerya pu
 rchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス
 属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Lao
 delphax striatellus*)、レカニウム属種 (*Lecanium* spp
 .)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium corni*) (=パルテノレカ
 ニウム・コルニ (*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス
 属種 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Le
 pidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erys
 imi*)、ロホレウカスピス・ジャポニカ (*Lopholeucaspis japon
 ica*)、リコルマ・デリカツラ (*Lycorma delicatula*)、マクロシ
 フム属種 (*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビア
 エ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Mac
 rosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum ro
 sae*)、マクロステレス・ファシフロンス (*Macrosteles facifro
 ns*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfi
 ella* spp.)、メトカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)
 、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、
 モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカ
 ニス (*Monelliopsis pecan*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.
)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス
 ・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligust
 ri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*M
 yzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotiana
 e*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネオ
 マスケリア属種 (*Neomaskellia* spp.)、ネホテッチキス属種 (*Nep
 hotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクセプス (*Nepho
 tettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nepho*

10

20

30

40

50

50

hizaphis graminum)、セレナスピズス・アルチクラツス (Selenaspis articulatus)、シファ・フラバ (Sipha flava)、シトビオン・アベナエ (Sitobion avenae)、ソガタ属種 (Sogata spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (Sogatella furcifera)、ソガトデス属種 (Sogatodes spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (Stictocephala festina)、シホニヌス・フィリレアエ (Siphoninus phillyreae)、テナラファラ・マライエンシス (Tenalaphara malayensis)、テトラゴノセフェラ属種 (Tetragonocephala spp.)、チノカリス・カリアエホリアエ (Tinocallis caryaefoliae)、トマスビス属種 (Tomaspis spp.)、トキソプテラ属種 (Toxoptera spp.)、例えば、トキソプテラ・アウランチイ (Toxoptera aurantii)、トキソプテラ・シトリシズス (Toxoptera citricidus)、トリアレウロデス・バボラリオルム (Trialeurodes vaporariorum)、トリオザ属種 (Trioza spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (Trioza diospyri)、チフロシバ属種 (Typhlocyba spp.)、ウナスビス属種 (Unaspis spp.)、ビテウス・ビチホリイ (Viteus vitifolii)、ジギナ属種 (Zygina spp.) ;

カメムシ亜目 (Heteroptera) の、例えば、アエリア属種 (Aelia spp.)、アナサ・トリステス (Anasa tristis)、アンテスチオプシス属種 (Antestiopsis spp.)、ボイセア属種 (Boisea spp.)、ブリスス属種 (Blissus spp.)、カロコリス属種 (Calocoris spp.)、カムピロンマ・リビダ (Campylomma livida)、カベレリウス属種 (Cavelerius spp.)、シメキス属種 (Cimex spp.)、例えば、シメキス・アドジュンクツス (Cimex adjunctus)、シメキス・ヘミプテルス (Cimex hemipterus)、シメキス・レクツラリウス (Cimex lectularius)、シメキス・ピロセルス (Cimex pilosellus)、コラリア属種 (Collaria spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (Creontiades dilutus)、ダシヌス・ピペリス (Dasynus piperis)、ジケロプス・フルカツス (Dichelops furcatus)、ジコノコリス・ヘウエッチ (Diconocoris hewetti)、ジスデルクス属種 (Dysdercus spp.)、エウスキスツス属種 (Euschistus spp.)、例えば、エウスキスツス・ヘロス (Euschistus heros)、エウスキスツス・セルブス (Euschistus servus)、エウスキスツス・トリステグムス (Euschistus tristigma)、エウスキスツス・バリオラリウス (Euschistus variolarius)、エウリデマ属種 (Eurymedema spp.)、エウリガステル属種 (Eurygaster spp.)、ハリオモルファ・ハリス (Halyomorpha halys)、ヘリオパルチス属種 (Heliopeltis spp.)、ホルシアス・ノビレルス (Horcias nobilellus)、レプトコリス属種 (Leptocoris spp.)、レプトコリス・バリコルニス (Leptocoris varicornis)、レプトグロスス・オッシデンタリス (Leptoglossus occidentalis)、レプトグロスス・フィロプス (Leptoglossus phyllopus)、リゴコリス属種 (Lygocoris spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (Lygocoris pabulinus)、リグス属種 (Lygus spp.)、例えば、リグス・エリス (Lygus elisus)、リグス・ヘスペルス (Lygus hesperus)、リグス・リネオラリス (Lygus lineolaris)、マクロペス・エキスカバツス (Macropes excavatus)、メガコプタ・クリブラリア (Megacopta cribraria)、ミリダエ (Miridae)、モナロニオン・アトラツム (Monalonion atratum)、ネザラ属種 (Nezara spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (Nezara viridula)、ニシウス

10

20

30

40

50

属種 (*Nysius* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペン
ミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadra*
ta)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス
・グイルジニイ (*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種 (*Psallus*
spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perse*
a)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス
(*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinoph*
ora spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チ
ブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.) ;

10

ハチ目 (*Hymenoptera*) の、例えば、アクロミルメキス属種 (*Acromyrmex* spp.)、アタリア属種 (*Athalia* spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ属種 (*Atta* spp.)、カムポノツス属種 (*Camponotus* spp.)、ドリコベスブラ属種 (*Dolichovespula* spp.)、ジプリオン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジプリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカムパ・テスツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、リネピテマ (イリジオミルメキス) ・フミレ (*Linepithema (Iridomyrmex) humile*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラトレキナ属種 (*Paratrechina* spp.)、パラベスブラ属種 (*Paravespula* spp.)、プラギオレピス属種 (*Plagiolepis* spp.)、シレキス属種 (*Sirex* spp.)、例えば、シレキス・ノクチリオ (*Sirex noctilio*)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属種 (*Tapinoma* spp.)、テクノミルメキス・アルビペス (*Technomyrmex albipes*)、ウロセルス属種 (*Urocerus* spp.)、ベスパ属種 (*Vespa* spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (*Vespa crabro*)、ワスマンニア・アウロブンクタタ (*Wasmannia auropunctata*)、キセリス属種 (*Xeris* spp.) ;

20

30

ワラジムシ目 (*Isopoda*) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*) ;

【0243】

シロアリ目 (*Isoptera*) の、例えば、コプトテルメス属種 (*Coptotermes* spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)、コルニテルメス・クムランス (*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属種 (*Cryptotermes* spp.)、インシシテルメス属種 (*Incisitermes* spp.)、カロテルメス属種 (*Kaloterme*
s spp.)、ミクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、ナスチテルメス属種 (*Nasutitermes* spp.)、オドントテルメス属種 (*Odontotermes* spp.)、ポロテルメス属種 (*Porotermes* spp.)、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes* spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*) ;

40

チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アドキシフィエス属種 (*Adoxophyes* spp.)、例えば、アドキシフィ

50

エス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属種 (*Alabama* spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナルシア属種 (*Anarsia* spp.)、アンチカルシア属種 (*Anticarsia* spp.)、例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルギロプロセ属種 (*Argyroploce* spp.)、アウトグラフィア属種 (*Autographa* spp.)、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブラストデクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブックラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ブッセオラ属種 (*Busseola* spp.)、カコエシア属種 (*Cacoecia* spp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルポシナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトビア・ブルマタ (*Chematobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo* spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプレッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Choreutis pariana*)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura* spp.)、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcites*)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属種 (*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cnephasia* spp.)、コノボモルファ属種 (*Conopomorpha* spp.)、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属種 (*Copitarsia* spp.)、シジア属種 (*Cydia* spp.)、例えば、シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuoides*)、ジアファニア属種 (*Diaphania* spp.)、ジパロプシス属種 (*Diparopsis* spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*)、ジオリクトリア属種 (*Dioryctria* spp.)、例えば、ジオリクトリア・ジメルマニ (*Dioryctria zimmermani*)、エアリアス属種 (*Earias* spp.)、エクジトロファ・アウランチュム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモパルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*Ephestia* spp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア属種 (*Epinotia* spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphyas postvittana*)、エランニス属種 (*Eranthis* spp.)、エルスコビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana*)、エチエラ属種 (*Etiella* spp.)、エウドシマ属種 (*Eudocima* spp.)、エウリア属種 (*Eulia* spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ (*Eupoecilia ambiguella*)、エウプロクチス属種 (*Euproctis* spp.)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、エウキソア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*Feltia* spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラシラリア属種 (*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属

10

20

30

40

50

種 (*Grapholitha* spp.)、例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholitha molesta*)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholitha prunivora*)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ランピデス属種 (*Lampides* spp.)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、ラスペイレシア・モレスタ (*Laspeyresia molesta*)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテンナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketis* spp.)、オンフィサ属種 (*Omphisa* spp.)、オペロフテラ属種 (*Operophtera* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonorycter crataegella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Platynota stultana*)、プロジア・インテルプункテラ (*Plodia interpunctella*)、プルシア属種 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (=プルテラ・マクリペンニス (*Plutella maculipennis*))、ポデシア属種 (*Podesia* spp.)、例えば、ポデシア・シリंगाエ (*Podesia syringae*)、プライス属種 (P

10

20

30

40

50

rays spp.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プロトパルセ属種 (*Protoparce* spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseudaletia* spp.)、例えば、プセウダレチア・ユニブクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、プセウドプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキプルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobius* spp.)、例えば、スコエノビウス・ビブクチフェル (*Schoenobius bipunctifer*)、シルポファガ属種 (*Scirpophaga* spp.)、例えば、シルポファガ・インノタタ (*Scirpophaga innotata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Sesamia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スパルガノチス属種 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・プラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ステノマ属種 (*Stenoma* spp.)、ストモプテリキス・スブセシベラ (*Stomopteryx subsecivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、タウメトポエア属種 (*Thaumetopoea* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)、例えば、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属種 (*Virachola* spp.) ;

バッタ目 (*Orthoptera*) またはサルタトリア目 (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、ジクロプルス属種 (*Dichroplus* spp.)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属種 (*Locusta* spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (*Locusta migratoria*)、メラノプルス属種 (*Melanoplus* spp.)、例えば、メラノプルス・デバスタトル (*Melanoplus devastator*)、パラトランチクス・ウスリエンシス (*Paratlanticus ussuriensis*)、スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) ;

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalini* spp.)、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属種 (*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種 (*Pediculus* spp.)、フィロキセラ・バスタトリキス (*Phylloxera vastatrix*)、フチルス・プビス (*Phthirus pubis*)、トリコデクテス属種 (*Trichodectes* spp.) ;

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) の、例えば、レピノツス属種 (*Lepinotus* spp.)、リポセリス属種 (*Liposcelis* spp.) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalid*

10

20

30

40

50

es spp.)、例えば、クテノセファリデス・カニス (Ctenocephalides canis)、クテノセファリデス・フェリス (Ctenocephalides felis)、プレキス・イリタンス (Pulex irritans)、ツンガ・ペネトランス (Tunga penetrans)、キセノプシラ・ケオピス (Xenopsylla cheopis) ;

アザミウマ目 (Thysanoptera) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (Anaphothrips obscurus)、バリオトリプス・ビホルミス (Baliothrips biformis)、カエタナホトリプス・レエウウェニ (Chaetanaphothrips leeuweni)、ドレパノトリプス・レウテリ (Drepanothrips reuteri)、エンネオトリプス・フラベンス (Enneothrips flavens)、フランクリニエラ属種 (Frankliniella spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ (Frankliniella fusca)、フランクリニエラ・オッシデンタリス (Frankliniella occidentalis)、フランクリニエラ・スクルトゼイ (Frankliniella schultzei)、フランクリニエラ・トリチシ (Frankliniella tritici)、フランクリニエラ・バシニイ (Frankliniella vaccinii)、フランクリニエラ・ウィリアムシ (Frankliniella williamsi)、ハプロトリプス属種 (Haplothrips spp.)、ヘリオトリプス属種 (Heliothrips spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス (Hercinothrips femoralis)、カコトリプス属種 (Kakothrips spp.)、リピホロトリプス・クルエンタツス (Rhipiphorothrips cruentatus)、シルトトリプス属種 (Scirtothrips spp.)、タエニオトリプス・カルダモミ (Taeniothrips cardamomi)、スリプス属種 (Thrips spp.)、例えば、スリプス・パルミ (Thrips palmi)、スリプス・タバシ (Thrips tabaci) ;

シミ目 (Zygentoma (=Thysanura)) の、例えば、クテノレピスマ属種 (Ctenolepisma spp.)、レピスマ・サッカリナ (Lepisma saccharina)、レスピモデス・インクイリヌス (Lepismodes inquilinus)、テルモビア・ドメスチカ (Thermobia domestica) ;

コムカデ綱 (Symphylla) の、例えば、スクチゲレラ属種 (Scutigerella spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ (Scutigerella immaculata) ;

軟体動物門 (Mollusca) の有害生物、例えば、ニマイガイ綱 (Bivalvia) の、例えば、ドレイセナ属種 (Dreissena spp.) ;

【0244】

および腹足綱 (Gastropoda) の、例えば、アリオン属種 (Arion spp.)、例えば、アリオン・アテル・ルフス (Arion ater rufus)、ビオムファラリア属種 (Biomphalaria spp.)、ブリヌス属種 (Bulinus spp.)、デロセラス属種 (Deroceras spp.)、例えば、デロセラス・ラエベ (Deroceras laeve)、ガルバ属種 (Galba spp.)、リムナエア属種 (Lymnaea spp.)、オンコメラニア属種 (Oncomelania spp.)、ポマセア属種 (Pomacea spp.)、スクシネア属種 (Succinea spp.) ;

線形動物門 (Nematoda) の植物有害生物、即ち、植物寄生性線虫、特に、アグレンクス属種 (Aglenchus spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (Aglenchus agricola)、アングイナ属種 (Anguina spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ (Anguina tritici)、アフエレンコイデス属種 (Aphelenchoides spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (Aphelenchoides arachidis)、アフエレンコイ

10

20

30

40

50

デス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライムス属種 (*Belonolaimus* spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属種 (*Cacopaurus* spp.)、例えば、カコパウルス・ベスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノブラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノブラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Criconemoi*des spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemoi*des *ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoi*des *onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoi*des *ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、例えば、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコドルス属種 (*Dolichodorus* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihyssera*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoi*des spp.)、ヘミシクリオホラ属種 (*Hemicycliophora* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycines*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ヒルスクマニエラ属種 (*Hirschmaniella* spp.)、ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longidorus* spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、例えば、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコップス属種 (*Nacobbus* spp.)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus* spp.)、パラロンギドルス属種 (*Paralongidorus* spp.)、パラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus* spp.)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus* spp.)、例えば、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラチレンクス属種 (*Paratylenchus* spp.)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus* spp.)、プシレンクス属種 (*Psilenchus* spp.)、プンクトデラ属種 (*Punctodera* spp.)、クイニスルシウス属種 (*Quinisulcius* spp.)、ラドホルス属種 (

10

20

30

40

50

Radopholus spp.)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus* spp.)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus* spp.)、スクテロネマ属種 (*Scutellonema* spp.)、スバングイナ属種 (*Subanguina* spp.)、トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス (*Trichodorus obtusus*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス (*Tylenchorhynchus annulatus*)、チレンクルス属種 (*Tylenchulus* spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)。 10

【0245】

式 (I) の化合物は場合によっては特定の濃度または施用量で、除草剤、セーフナー、生長調節剤または植物特性を改善する薬剤として、殺微生物剤 (*microbicide*) または殺生殖体剤 (*gametocides*) として、例えば、殺真菌剤 (*fungicides*)、抗真菌剤 (*antimycotics*)、殺細菌剤 (*bactericides*)、殺ウイルス剤 (ウイルスに対する薬剤を含む) として、または MLO (マイコプラズマ様生物) および RLO (リケッチア様生物) に対する薬剤として使用することもできる。それらは、場合によっては他の活性成分の合成のための中間体または前駆体として使用することもできる。 20

【0246】

製剤

本発明は、さらに、式 (I) で表される少なくとも 1 種類の化合物を含んでいる、殺有害生物剤としての製剤およびその製剤から調製される使用形態 (例えば、灌注液、滴下液および散布液) にも関する。前記使用形態は、任意に、さらなる殺有害生物剤、および／または、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油 (例えば、ナタネ油、ヒマワリ油)、鉱油 (例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル (例えば、ナタネ油メチルエステルまたはダイズ油メチルエステル)、または、アルカノールアルコキシレート類、および／または、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類および／または塩、例えば、有機または無機のアンモニウム塩またはホスホニウム塩 (例えば、硫酸アンモニウムまたはリン酸水素二アンモニウム)、および／または、保持促進剤 (*retention promoter*) (例えば、スルホコハク酸ジオクチルまたはヒドロキシプロピルグアールポリマー)、および／または、湿潤剤 (例えば、グリセロール)、および／または、肥料 (例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料またはリン含有肥料) を含有する。 30

【0247】

慣習的な製剤は、例えば、水溶性液剤 (SL)、乳剤 (EC)、水中油型エマルジョン剤 (*emulsions in water*) (EW)、懸濁濃縮剤 (SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤 (WG)、粒剤 (GR)、および、カプセル濃縮剤 (*capsule concentrates*) (CS) であり；これらの製剤および別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている：*Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers-173* (作製元：*the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576*)。該製剤は、式 (I) で表される 1 種類以上の化合物に加えて、任意に、さらなる農薬活性成分を含有する。 40 50

【0248】

補助剤、例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤（spontaneity promoter）、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤（frost protection agent）、殺生物剤、増粘剤および／または他の補助剤、例えば、アジュバントを含有している製剤または使用形態が好ましい。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的効果を高める成分であって、その成分自体は生物学的効果を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡張（spreading）、付着を促進する作用物質または浸透を促進する作用物質である。

【0249】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式（I）で表される化合物を補助剤、例えば、増量剤、溶媒および／若しくは固体担体、並びに／または、別の補助剤、例えば、界面活性剤と混合させることにより製造する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、または、施用前若しくは施用中に製造する。

【0250】

使用する補助剤は、式（I）で表される化合物の製剤またはそのよう製剤から調製された使用形態、例えば、即時使用可能な（ready-to-use）殺有害生物剤、例えば、散布液または種子粉衣製品に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性および／又生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

【0251】

適切な増量剤は、例えば、水、極性および非極性の有機化学的液体、例えば、芳香族および非芳香族の炭化水素類（例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類）、アルコール類およびポリオール類（これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、および／または、エステル化されていてもよい）、ケトン類（例えば、アセトン、シクロヘキサノン）、エステル類（これは、脂肪類および油類を包含する）および（ポリ）エーテル類、単純アミン類および置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類）、および、ラクトン類、スルホン類およびスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）、カルボネート類およびニトリル類である。

【0252】

使用する増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒は、本質的に以下のものである：芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン若しくはアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類若しくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン若しくはパラフィン類、例えば、石油留分、鉱油および植物油、アルコール類、例えば、ブタノール若しくはグリコールとそれらのエーテルおよびエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン若しくはシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド若しくはジメチルスルホキシド、カルボネート類、例えば、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、炭酸ジエチル若しくは炭酸ジブチル、または、ニトリル類、例えば、アセトニトリル若しくはプロパンニトリル。

【0253】

原則として、適切な全ての溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素または塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、石油留分、鉱油および植物油、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノールまたはグリコールとそれらのエーテルおよびエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、カルボネート類、例えば、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、炭酸ジエチル若しくは炭酸ジブチル、ニトリル類、例えば、アセトニトリル若し

10

20

30

40

50

くはプロパンニトリル、および、水である。

【0254】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。適切な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる：例えば、アンモニウム塩、および、微粉碎された天然岩石、例えば、カオリン、アルミナ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたはケイ藻土、および、微粉碎された合成岩石、例えば、高分散シリカ、酸化アルミニウム、および、天然シリケートまたは合成シリケート、樹脂、蠟、および／または、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる：例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機および有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシの穂軸およびタバコの葉柄など）からなる顆粒。

10

【0255】

液化ガスの増量剤または溶媒を使用することも可能である。特に適している増量剤または担体は、標準温度および大気圧下では気体である増量剤または担体、例えば、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、および、さらに、ブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素などである。

【0256】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する、乳化剤および／若しくは泡形成剤、分散剤または湿潤剤の例、または、これらの界面活性物質の混合物の例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノールまたはアリールフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、イセチオネート誘導体、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール脂肪酸エステル、並びに、硫酸塩、スルホン酸塩およびリン酸塩を含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、および、メチルセルロースである。式（I）で表される化合物のうちの1種類および／または該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

20

30

【0257】

該製剤およびその製剤から誘導される使用形態の中に存在させ得るさらなる補助剤としては、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルー（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素および微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩および亜鉛塩などがある。

【0258】

存在させ得るさらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、または、化学的および／若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤である。さらに、泡生成剤または消泡剤も存在させることができる。

40

【0259】

さらにまた、該製剤およびその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末若しくは顆粒若しくはラテックスの形態にある天然ポリマーおよび合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニル、または、天然リン脂質、例えば、セファリンおよびレシチン、および、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる補助剤は、鉱油および植物油であり得る。

50

【0260】

適切な場合には、該製剤およびその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式（I）で表される化合物は、製剤を目的として通常使用される固体または液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

【0261】

有用な保持促進剤には、動的表面張力を低減させる全ての物質、例えば、スルホコハク酸ジオクチルまたは粘弾性を増大させる全ての物質、例えば、ヒドロキシプロピルグアールポリマーが含まれる。

【0262】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬活性化合物の浸透を向上させるために典型的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、（一般には、水性の）施用液から、および／または、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性成分のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。文献（Baur等、1997, *Pesticide Science* 51, 131-152）に記載されている方法が、この特性を確認するために用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナッツ脂肪エトキシレート（*coconut fatty ethoxylate*）（10）若しくはイソトリデシルエトキシレート（12）、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート（15）、または、アンモニウム塩および／若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げることができる。

【0263】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量%～98重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.01重量%～95重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、最も好ましくは、0.5重量%～90重量%の式（I）で表される化合物を含んでいる。

【0264】

該製剤（特に、殺有害生物剤）から調製された使用形態の中の式（I）で表される化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態の中の式（I）で表される化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.00000001重量%～95重量%の式（I）で表される化合物、好ましくは、0.00001重量%～1重量%の式（I）で表される化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行われる。

【0265】

混合物

式（I）で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、または、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺真菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤（*microbiological agent*）、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤（*phytonic*）、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質および／または植物成長調節剤との混合物において使用することもできる。さらに、この種の活性化合物組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、および／または、非生物的要因、例えば、高温または低温に対する耐性、渇水に対する耐性または含水量若しくは土壤塩分濃度の上昇に対する耐性を向上させることが可能である。さらにまた、開花性能および結果性能を改善することも可能であり、発芽能力および根の発達を最適化することも可能であり、収穫を容易にすることも可能であり、収穫量を向上させることも可能であり、成熟に影響を及ぼすことも可能であり、収穫さ

10

20

30

40

50

れた生産物の品質および／若しくは栄養価を向上させることも可能であり、収穫された生産物の貯蔵寿命を長くすることも可能であり、並びに／または、収穫された生産物の加工性を改善することも可能である。

【0266】

さらに、式（I）で表される化合物は、別の活性化合物または情報化学物質、例えば、誘引剤、および／または、鳥忌避剤、および／または、植物活性化剤、および／または、成長調節剤、および／または、肥料との混合物の中に存在することもできる。同様に、式（I）で表される化合物は、植物の特性、例えば、生長、収穫量および収穫物の品質を向上させるために使用することも可能である。

【0267】

本発明による特定の実施形態では、式（I）で表される化合物は、製剤の中に、または、そのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物、好ましくは、以下に記載されている化合物と混合された状態で存在している。

【0268】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基または酸と塩を形成することもできる。

【0269】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「The Pesticide Manual」, 16th ed., British Crop Protection Council 2012に記載されているか、または、インターネット上で検索することができる（例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」）。その分類は、本特許出願の出願時点において適用できるIRAC Mode of Action Classification Schemeに基づいている。

【0270】

（1） アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害薬、好ましくは、カーバメート系、これは、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMCおよびキシリルカルブから選択される；または、有機リン酸エステル系、これは、アセフェート、アザメチホス、アジンホス－エチル、アジンホス－メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス－メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン－S－メチル、ダイアジノン、ジクロロボス／DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、O－（メトキシアミノチオホスホリル）サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン－メチル、パラチオン－メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス－メチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テムホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホンおよびバミドチオンから選択される。

【0271】

（2） GABA制御塩化物チャンネル遮断薬、好ましくは、シクロジエン－有機塩素

10

20

30

40

50

系、これは、クロルダンおよびエンドスルファンから選択される；または、フェニルピラゾール系（フィプロール系）、これは、エチプロールおよびフィプロニルから選択される。

【0272】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター、好ましくは、ピレスロイド系、これは、アクリナトリン、アレスリン、d-シス-トランスアレスリン、d-トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S-シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ベーターシペルメトリン、シーターシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シフェノトリン [(1R)-トランス異性体]、デルタメトリン、エムベントリン [(E Z) - (1R) 異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ-フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1R)-トランス異性体]、プラレトリン、ピレトリン類（除虫菊 (pyrethrum)）、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [(1R) 異性体]、トラロメトリンおよびトランスフルトリンから選択される；または、DDT；または、メトキシクロル。

10

【0273】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) 競合的モジュレーター、好ましくは、ネオニコチノイド系、これは、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、チアクロプリドおよびチアメトキサムから選択され；または、ニコチン；または、スルホキサフルルから選択されるスルホキシイミン系、または、フルピラジフロンから選択されるブテノリド系、またはトリフルメゾピリムから選択されるメソイオン化合物。

20

【0274】

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アロステリックモジュレーター、好ましくは、スピネトラムおよびスピノサドから選択されるスピノシン系。

【0275】

(6) グルタミン酸制御塩化物チャンネル (GluCl) アロステリックモジュレーター、好ましくは、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチンおよびミルベメクチンから選択されるアベルメクチン系／ミルベマイシン系。

30

【0276】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、好ましくは、ハイドロプレン、キノプレンおよびメトプレンから選択される幼若ホルモン類似体、または、フェノキシカルブ、または、ピリプロキシフェン。

【0277】

(8) 種々の特定されていない（多部位）阻害薬、好ましくは、臭化メチルおよび別のハロゲン化アルキルから選択されるハロゲン化アルキル系、または、クロロピクリン；または、フッ化スルフリル；または、ホウ砂；または、吐酒石；または、ダゾメット (diazomet) およびメタムから選択されるイソシアン酸メチル生成物質。

40

【0278】

(9) 弦音器官のTRPVチャンネルモジュレーター、これは、ピメトロジンおよびピリフルキナゾンから選択される。

【0279】

(10) ダニ成長阻害薬、これは、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、ジフロビダジンおよびエトキサゾールから選択される。

【0280】

(11) 昆虫の腸膜の微生物ディスラプター、これは、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*)、バシルス・スファエリクス (*Bacillus*

50

sphaericus)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ (Bacillus thuringiensis subspecies aizawai)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ (Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス (Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis)、および Bt 植物タンパク質 (これは、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、VIP3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb および Cry34Ab1/35Ab1 から選択される) から選択される。

【0281】

(12) ミトコンドリア ATP シンターゼの阻害薬、好ましくは、ジアフェンチウロンから選択される ATP ディスラプター、または、アゾシクロチン、シヘキサチンおよび酸化フェンブタズから選択される有機スズ化合物、または、プロパルギット；または、テトラジホン。

【0282】

(13) プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤、これは、クロルフェナビル、DNOC およびスルフルアミドから選択される。

【0283】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬、これは、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラムおよびチオスルタップーナトリウムから選択される。

【0284】

(15) キチン生合成の阻害薬 (タイプ0)、これは、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロンおよびトリフルムロンから選択される。

【0285】

(16) キチン生合成の阻害薬 (タイプ1)、これは、ブプロフェジンから選択される。

【0286】

(17) 脱皮ディスラプター (特に、双翅目の場合)、これは、シロマジンから選択される。

【0287】

(18) エクジソン受容体作動薬、これは、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジドおよびテブフェノジドから選択される。

【0288】

(19) オクトパミン受容体作動薬、これは、アミトラズから選択される。

【0289】

(20) ミトコンドリア複合体 III 電子伝達阻害薬、これは、ヒドラメチルノン、アセキノシルおよびフルアクリピリムから選択される。

【0290】

(21) ミトコンドリア複合体 I 電子伝達阻害薬、好ましくは、METI 殺ダニ剤、これは、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラドおよびトルフェンピラドから選択される；または、ロテノン (Derris)。

【0291】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、これは、インドキサカルブおよびメタフルミゾンから選択される。

【0292】

(23) アセチル CoA カルボキシラーゼの阻害薬、好ましくは、テトロン酸誘導体およびテトラミン酸誘導体、これは、スピロジクロフェン、スピロメシフェンおよびスピロテトラマトから選択される。

10

20

30

40

50

【0293】

(24) ミトコンドリア複合体Ⅴ電子伝達阻害薬、好ましくは、ホスフィン系、これは、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィンおよびリン化亜鉛から選択される；または、シアン化物、これは、シアン化カルシウム、シアン化カリウムおよびシアン化ナトリウムから選択される。

【0294】

(25) ミトコンドリア複合体Ⅱ電子伝達阻害薬、好ましくは、β-ケトニトリル誘導体、これは、シエノピラフェンおよびシフルメトフェンから選択される；または、カルボキシアニリド系、これは、ピフルブミドから選択される。

【0295】

(28) リアノジン受容体モジュレーター、好ましくは、ジアミド系、これは、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロールおよびフルベンジアミドから選択される。

【0296】

(29) 弦音器官のモジュレーター（標的構造が定義されていない）、これは、フロニカミドから選択される。

【0297】

(30) 以下のものから選択されるさらなる活性化合物：アシノナビル、アフィドピロペン、アフォキソレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ベンズピリモキサン、ピフェナゼート、プロフラニリド、プロモプロピレート、キノメチオナート、クロロプラレトリン、氷晶石 (cryolite)、シクラニリプロール、シクロキサプリド (cycloxaprid)、シハロジアミド (cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ、ジコホル、ε-メトフルトリン、ε-モムフルオロトリン (epsilon momfluthrin)、フロメトキン、フルアザインドリジン、フルエンズルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルヘキサホン、フルオピラム、フルピリミン、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノジド (fufenozide)、グアジビル、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イブロジオン、κ-ビフェントリン、イソシクロセラム (isocycloseram)、κ-テフルトリン、ロチラネル (lotilaner)、メペルフルトリン、オキサゾスルフィル、パイコングジグ、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、スピロブジクロフェン (spirobudiclofen)、スピロピジオン、テトラメチルフルトリン、テトラニリプロール、テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、チゴラネル (tigolaner)、チオキサザフェン、チオフルオキシメート (thiofluoximate) およびヨードメタン；さらに、バシルス・フィルムス (Bacillus firmus) に基づく調製物 (E-1582, BioNeem, Votivo)、および、以下の化合物：1- {2-フルオロ-4-メチル-5- [(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル} -3- (トリフルオロメチル) -1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-アミン (WO 2006/043635 から既知) (CAS 885026-50-6)、{1'- [(2E) -3- (4-クロロフェニル) プロパ-2-エン-1-イル] -5-フルオロスピロ [インドール-3, 4'-ピペリジン] -1 (2H) -イル} (2-クロロピリジン-4-イル) メタノン (WO 2003/106457 から既知) (CAS 637360-23-7)、2-クロロ-N- [2- {1- [(2E) -3- (4-クロロフェニル) プロパ-2-エン-1-イル] ピペリジン-4-イル} -4- (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO 2006/003494 から既知) (CAS 872999-66-1)、3- (4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1, 8-ジアザスピロ [4.5] デカ-3-エン-2-オン (WO 2010052161 から既知) (CAS 1225292-17-0)、3- (4-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル) -8-メトキシ-2-オキソ-1, 8-ジアザスピロ [4.5] デカ-3-エン-4-イル エチルカルボネート (EP 2647626 から既知) (CAS-1440516-42-6)、4- (ブタ-2-イン-1-イルオキシ) -6- (3

10

20

30

40

50

、5-ジメチルピペリジン-1-イル)-5-フルオロピリミジン(WO2004/099160から既知)(CAS 792914-58-0)、PF1364(JP2010/018586から既知)(CAS Reg. No. 1204776-60-2)、(3E)-3-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-オン(WO2013/144213から既知)(CAS 1461743-15-6)、N-[3-(ベンジルカルバモイル)-4-クロロフェニル]-1-メチル-3-(ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2010/051926から既知)(CAS 1226889-14-0)、5-ブromo-4-クロロ-N-[4-クロロ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)ピラゾール-3-カルボキサミド(CN103232431から既知)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-4,5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(シス-1-オキシド-3-チエタニル)ベンズアミド、4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-4,5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(トランス-1-オキシド-3-チエタニル)ベンズアミドおよび4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-4,5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(シス-1-オキシド-3-チエタニル)ベンズアミド(WO2013/050317A1から既知)(CAS 1332628-83-7)、N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド、(+)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミドおよび(-)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド(WO2013/162715A2、WO2013/162716A2、US2014/0213448A1から既知)(CAS 1477923-37-7)、5-[[(2E)-3-クロロ-2-プロペン-1-イル]アミノ]-1-[2,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]-1H-ピラゾール-3-カルボニトリル(CN101337937Aから既知)(CAS 1105672-77-2)、3-ブromo-N-[4-クロロ-2-メチル-6-[(メチルアミノ)チオキソメチル]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、(Liudaibenjiaxuanan、CN103109816Aから既知)(CAS 1232543-85-9); N-[4-クロロ-2-[[(1,1-ジメチルエチル)アミノ]カルボニル]-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2012/034403A1から既知)(CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2011/085575A1から既知)(CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-ジクロロ-4-[(3,3-ジクロロ-2-プロペン-1-イル)オキシ]フェノキシ]プロポキシ]-2-メトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン(CN101337940A)(CAS 1108184-52-6); (2E)-および2(Z)-2-[2-(4-シアノフェニル)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]-N-[4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]ヒドラジンカルボキサミド(CN101715774Aから既知)(CAS 1232543-85-9); シクロプロパンカルボン酸3-(2,2-ジクロロエテニル)-2,2-ジメチル-4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル)フェニルエステル(CN103524422Aから既知)(CAS 1542271-46-4); (4aS)-7-クロロ-2,5-ジヒドロ-2-[[(

10

20

30

40

50

メトキシカルボニル) [4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]アミノ]カルボニル]インデノ[1,2-e][1,3,4]オキサジアジン-4a(3H)-カルボン酸メチルエステル(CN102391261Aから既知)(CAS 1370358-69-2); 6-デオキシ-3-O-エチル-2,4-ジ-オ-メチル-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエトキシ)フェニル]-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート]- α -L-マンノピラノース(US2014/0275503A1から既知)(CAS 1181213-14-8); 8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチルピリダジン-3-イル)-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(CAS 1253850-56-4)、(8-アンチ)-8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチルピリダジン-3-イル)-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(CAS 933798-27-7)、(8-シン)-8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチルピリダジン-3-イル)-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン(WO2007040280A1、WO2007040282A1から既知)(CAS 934001-66-8)、N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)チオ]プロパンアミド(WO2015/058021A1、WO2015/058028A1から既知)(CAS 1477919-27-9)およびN-[4-(アミノチオキソメチル)-2-メチル-6-[(メチルアミノ)カルボニル]フェニル]-3-プロモ-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(CN103265527Aから既知)(CAS 1452877-50-7)、5-(1,3-ジオキサン-2-イル)-4-[[4-(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]ピリミジン(WO2013/115391A1から既知)(CAS 1449021-97-9)、3-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メチル-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカン-2,4-ジオン(WO2014/187846A1から既知)(CAS 1638765-58-8)、3-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカ-3-エン-4-イル-カルボン酸エチル(WO2010/066780A1、WO2011151146A1から既知)(CAS 1229023-00-0)、4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソキサゾリル]-N-[(4R)-2-エチル-3-オキソ-4-イソオキサゾリジニル]-2-メチルベンズアミド(WO2011/067272、WO2013/050302から既知)(CAS 1309959-62-3)。

【0298】

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」(16th Ed., British Crop Protection Council)に記載されているか、または、インターネット上で検索することができる(例えば:「<http://www.alanwood.net/pesticides>」)。

【0299】

クラス(1)~(15)に記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基または酸と塩を形成することができる。クラス(1)~(15)に記載されている全ての殺菌剤混合成分は、場合により、互変異性体形態を包含し得る。

【0300】

1) エルゴステロール生合成阻害薬、例えば、(1.001)シプロコナゾール、(1.002)ジフェノコナゾール、(1.003)エポキシコナゾール、(1.004)

10

20

30

40

50

フェンヘキサミド、(1.005) フェンプロピジン、(1.006) フェンプロピモルフ、(1.007) フェンピラザミン、(1.008) フルキンコナゾール、(1.009) フルトリアホル、(1.010) イマザリル、(1.011) 硫酸イマザリル、(1.012) イブコナゾール、(1.013) メトコナゾール、(1.014) ミクロブタニル、(1.015) パクロブトラゾール、(1.016) プロクロラズ、(1.017) プロピコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.019) ピリソキサゾール、(1.020) スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、(1.022) テトラコナゾール、(1.023) トリアジメノール、(1.024) トリデモルフ、(1.025) トリチコナゾール、(1.026) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4-クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.027) (1S, 2R, 5R) - 5 - (4-クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.028) (2R) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール (1.029) (2R) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.030) (2R) - 2 - [4 - (4-クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.031) (2S) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.032) (2S) - 2 - (1-クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2-ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.033) (2S) - 2 - [4 - (4-クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H-1, 2, 4-トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.034) (R) - [3 - (4-クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.035) (S) - [3 - (4-クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.036) [3 - (4-クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 1, 2-オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.037) 1 - ({(2R, 4S) - 2 - [2-クロロ - 4 - (4-クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3-ジオキサラン - 2 - イル} メチル) - 1H-1, 2, 4-トリアゾール、(1.038) 1 - ({(2S, 4S) - 2 - [2-クロロ - 4 - (4-クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3-ジオキサラン - 2 - イル} メチル) - 1H-1, 2, 4-トリアゾール、(1.039) 1 - {[3 - (2-クロロフェニル) - 2 - (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H-1, 2, 4-トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.040) 1 - {[rel(2R, 3R) - 3 - (2-クロロフェニル) - 2 - (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H-1, 2, 4-トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.041) 1 - {[rel(2R, 3S) - 3 - (2-クロロフェニル) - 2 - (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H-1, 2, 4-トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6-トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4-ジヒドロ - 3H-1, 2, 4-トリアゾール - 3 - チオン、(1.043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6-トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4-ジヒドロ - 3H-1, 2, 4-トリアゾール - 3 - チオン、(1.044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6-トリメチルヘプタン - 4 -

10

20

30

40

50

イル] - 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.045) 2-[(2R, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.046) 2-[(2S, 4R, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.047) 2-[(2S, 4R, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.048) 2-[(2S, 4S, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.049) 2-[(2S, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.050) 2-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.051) 2-[2-クロロ-4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.052) 2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.053) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.054) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ペンタン-2-オール、(1.055) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.056) 2-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.057) 2-{[rel(2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.058) 2-{[rel(2R, 3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1.059) 5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.060) 5-(アリルスルファニル)-1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール、(1.061) 5-(アリルスルファニル)-1-{[rel(2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール、(1.062) 5-(アリルスルファニル)-1-{[rel(2R, 3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール、(1.063) N'-(2, 5-ジメチル-4-{[3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.064) N'-(2, 5-ジメチル-4-{[3-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.065) N'-(2, 5-ジメチル-4-{[3-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.066) N'-(2, 5-ジメチル-4-{[3-(ペンタフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.067) N'-(2, 5-ジメチル-4-{

10

20

30

40

50

3-[(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)
)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.068)N'-(2, 5-ジメチル-4-{3-[(2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.069)N'-(2, 5-ジメチル-4-{3-[(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロピル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.070)N'-(2, 5-ジメチル-4-{3-[(ペンタフルオロエチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.071)N'-(2, 5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.072)N'-(4-{[3-(ジフルオロメトキシ)フェニル]スルファニル}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.073)N'-(4-{3-[(ジフルオロメチル)スルファニル]フェノキシ}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.074)N'-[5-ブromo-6-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.075)N'-{4-[(4, 5-ジクロロ-1, 3-チアゾール-2-イル)オキシ]-2, 5-ジメチルフェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.076)N'-[5-ブromo-6-[(1R)-1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.077)N'-[5-ブromo-6-[(1S)-1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.078)N'-[5-ブromo-6-[(シス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.079)N'-[5-ブromo-6-[(トランス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.080)N'-[5-ブromo-6-[1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.081)イブフェントリフルコナゾール。
 [0301]

10

20

2) 複合体Iまたは複合体IIにおける呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2.001)ベンゾピンジフルピル、(2.002)ピキサフェン、(2.003)ボスカリド、(2.004)カルボキシ、(2.005)フルオピラム、(2.006)フルトラニル、(2.007)フルキサピロキサド、(2.008)フラメトピル、(2.009)イソフエタミド、(2.010)イソピラザム(アンチ-エピマー性エナンチオマー1R, 4S, 9S)、(2.011)イソピラザム(アンチ-エピマー性エナンチオマー1S, 4R, 9R)、(2.012)イソピラザム(アンチ-エピマー性ラセミ化合物1RS, 4SR, 9SR)、(2.013)イソピラザム(シン-エピマー性ラセミ化合物(1RS, 4SR, 9RS)とアンチ-エピマー性ラセミ化合物(1RS, 4SR, 9SR)の混合物)、(2.014)イソピラザム(シン-エピマー性エナンチオマー1R, 4S, 9R)、(2.015)イソピラザム(シン-エピマー性エナンチオマー1S, 4R, 9S)、(2.016)イソピラザム(シン-エピマー性ラセミ化合物1RS, 4SR, 9RS)、(2.017)ペンフルフェン、(2.018)ペンチオピラド、(2.019)ピジフルメトフェン、(2.020)ピラジフルミド、(2.021)セダキサン、(2.022)1, 3-ジメチル-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.023)1, 3-ジメチル-N-[(3R)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.024)1, 3-ジメチル-N-[(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.025)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]

30

40

50

ー1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.026) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、(2.027) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.028) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3R)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.029) 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3S)-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.030) 3-(ジフルオロメチル)-N-(7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.031) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.032) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.033) 5,8-ジフルオロ-N-[2-(2-フルオロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)エチル]キナゾリン-4-アミン、(2.034) N-(2-シクロペンチル-5-フルオロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.035) N-(2-tert-ブチル-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.036) N-(2-tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.037) N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.038) イソフルシプラム、(2.039) N-[(1R,4S)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.040) N-[(1S,4R)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.041) N-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.042) N-[2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.043) N-[3-クロロ-2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.044) N-[5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.045) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-N-[5-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.046) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-フルオロ-6-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.047) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.048) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオアミド、(2.049) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル

10

20

30

40

50

) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール
 - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 0) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル)
 - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H
 - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 1) N - シクロプロピル - 3 - (ジフル
 オロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メ
 チル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 2) N - シクロプロピル - 3
 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ -
 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 3) N - シクロプロピ
 ル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオ
 ロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 4) N - シクロプロ
 ロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル)
) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 5
) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフ
 ルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、
 (2 . 0 5 6) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフ
 ルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、
 (2 . 0 5 7) ピラプロポイン (pyrpropoin) 。

【 0 3 0 2 】

3) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、 (3 . 0 0 1) アメトクトラジ
 ン、 (3 . 0 0 2) アミスルブロム、 (3 . 0 0 3) アゾキシストロビン、 (3 . 0 0 4
) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、 (3 . 0 0 5) クモ
 キキシストロビン、 (3 . 0 0 6) シアゾファミド、 (3 . 0 0 7) ジモキシストロビン、
 (3 . 0 0 8) エノキサストロビン、 (3 . 0 0 9) ファモキサドン、 (3 . 0 1 0) フ
 ェンアミドン、 (3 . 0 1 1) フルフェノキシストロビン (flufenoxystro
 bin)、 (3 . 0 1 2) フルオキサストロビン、 (3 . 0 1 3) クレソキシム - メチル
 、 (3 . 0 1 4) メトミノストロビン、 (3 . 0 1 5) オリサストロビン、 (3 . 0 1 6
) ピコキシストロビン、 (3 . 0 1 7) ピラクロストロビン、 (3 . 0 1 8) ピラメトス
 トロビン、 (3 . 0 1 9) ピラオキシストロビン、 (3 . 0 2 0) トリフロキシストロビ
 ン、 (3 . 0 2 1) (2 E) - 2 - { 2 - [({ [(1 E) - 1 - (3 - { [(E) - 1
 - フルオロ - 2 - フェニルビニル] オキシ } フェニル) エチリデン] アミノ } オキシ } メ
 チル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、 (3 . 0 2 2)
 (2 E , 3 Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル]
 オキシ } - 2 - (メトキシイミノ) - N , 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド、 (3 .
 0 2 3) (2 R) - 2 - { 2 - [(2 , 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル } -
 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、 (3 . 0 2 4) (2 S) - 2 - { 2 - [(2 ,
 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド
 、 (3 . 0 2 5) (3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [({ 3 - [(イソ
 ブチリルオキシ) メトキシ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル) アミノ]
 - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパ
 ノエート、 (3 . 0 2 6) マンデストロビン、 (3 . 0 2 7) N - (3 - エチル - 3 , 5
 , 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミド、
 (3 . 0 2 8) (2 E , 3 Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) -
 1 H - ピラゾール - 3 - イル] オキシ } - 2 - (メトキシイミノ) - N , 3 - ジメチルペ
 ンタ - 3 - エンアミド、 (3 . 0 2 9) { 5 - [3 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - 1
 H - ピラゾール - 1 - イル] - 2 - メチルベンジル } カルバミン酸メチル、 (3 . 0 3 0
) メチルテトラプロール、 (3 . 0 3 1) フロリルピコキサミド。

【 0 3 0 3 】

4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害薬、例えば、 (4 . 0 0 1) カルベンダジム、 (4 .
 0 0 2) ジエトフェンカルブ、 (4 . 0 0 3) エタボキサム、 (4 . 0 0 4) フルオ
 ピコリド、 (4 . 0 0 5) ペンシクロン、 (4 . 0 0 6) チアベンダゾール、 (4 . 0 0

10

20

30

40

50

7) チオファネートーメチル、(4.008) ゾキサミド、(4.009) 3-クロロ-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-5-フェニルピリダジン、(4.010) 3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(4.011) 3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリダジン、(4.012) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.013) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.014) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-ブロモフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.015) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.016) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.017) 4-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.018) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.019) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.020) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.021) 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.022) 4-(4-クロロフェニル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-3,6-ジメチルピリダジン、(4.023) N-(2-ブロモ-6-フルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.024) N-(2-ブロモフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.025) N-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン。

【0304】

5) 多部位に活性を示し得る化合物、例えば、(5.001) ボルドー液、(5.002) カプタホール、(5.003) キャプタン、(5.004) クロロタロニル (chlorothalonil)、(5.005) 水酸化銅、(5.006) ナフテン酸銅、(5.007) 酸化銅、(5.008) オキシ塩化銅、(5.009) 硫酸銅 (2+)、(5.010) ジチアノン、(5.011) ドジン、(5.012) ホルベット、(5.013) マンゼブ、(5.014) マンネブ、(5.015) メチラム、(5.016) メチラム亜鉛 (zinc metiram)、(5.017) オキシ銅 (copper oxine)、(5.018) プロピネブ、(5.019) 硫黄および硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.020) チウラム、(5.021) ジネブ、(5.022) ジラム、(5.023) 6-エチル-5,7-ジオキソ-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ [3',4':5,6] [1,4] ジチイノ [2,3-c] [1,2] チアゾール-3-カルボニトリル。

【0305】

6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6.001) アシベンゾラル-S-メチル、(6.002) イソチアニル、(6.003) プロベナゾール、(6.004) チアジニル。

【0306】

7) アミノ酸および／またはタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.001) シプロジニル、(7.002) カスガマイシン、(7.003) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.004) オキシテトラサイクリン、(7.005) ピリメタニル、(7.0

10

20

30

40

50

06) 3-(5-フルオロ-3, 3, 4, 4-テトラメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン。

【0307】

8) ATP産生阻害薬、例えば、(8.001)シルチオフアム。

【0308】

9) 細胞壁合成阻害薬、例えば、(9.001)ベンチアバリカルブ、(9.002)ベンチアバリカルブ-イソプロピル、(9.003)ジメトモルフ、(9.004)フルモルフ、(9.005)イプロバリカルブ、(9.006)マンジプロパミド、(9.007)ピリモルフ、(9.008)バリフェナレート、(9.009)(2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン、(9.010)(2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン。

【0309】

10) 脂質および膜の合成の阻害薬、例えば、(10.001)プロパモカルブ、(10.002)プロパモカルブ塩酸塩、(10.003)トルクロホス-メチル。

【0310】

11) メラニン生合成阻害薬、例えば、(11.001)トリシクラゾール、(11.002)2, 2, 2-トリフルオロエチル{3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]ブタン-2-イル}カルバメート。

【0311】

12) 核酸合成阻害薬、例えば、(12.001)ベナラキシル、(12.002)ベナラキシル-M(キララキシル)、(12.003)メタラキシル、(12.004)メタラキシル-M(メフェノキサム)。

【0312】

13) シグナル伝達阻害薬、例えば、(13.001)フルジオキソニル、(13.002)イブロジオン、(13.003)プロシミドン、(13.004)プロキナジド、(13.005)キノキシフェン、(13.006)ピンクロゾリン。

【0313】

14) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.001)フルアジナム、(14.002)メプチルジノカップ。

【0314】

15) さらなる化合物、例えば、(15.001)アブシジン酸、(15.002)ベンチアゾール、(15.003)ベトキサジン、(15.004)カプシマイシン(capsimycin)、(15.005)カルボン、(15.006)キノメチオネート、(15.007)クフラネブ、(15.008)シフルフェナミド、(15.009)シモキサニル、(15.010)シプロスルファミド、(15.011)フルチアニル、(15.012)ホセチル-アルミニウム、(15.013)ホセチル-カルシウム、(15.014)ホセチル-ナトリウム、(15.015)イソチオシアン酸メチル、(15.016)メトラフェノン、(15.017)ミルディオマイシン、(15.018)ナタマイシン、(15.019)ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.020)ニトロタル-イソプロピル、(15.021)オキサモカルブ(oxamocarb)、(15.022)オキサチアピプロリン、(15.023)オキシフェンチン(oxylfenthin)、(15.024)ペンタクロロフェノールおよび塩、(15.025)ホスホン酸およびその塩、(15.026)プロパモカルブ-ホセチレート(propamocarb-fosetyl ate)、(15.027)ピリオフェノン(クラザフェノン(chlaza fenone))、(15.028)テブフロキン、(15.029)テクロフタラム、(15.030)トルニファニド、(15.031)1-(4-{4-[(5R)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)

-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、(15.032)1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-ジフルオロフェニ
 ル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2
 -イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1
 H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.033)2-(6-ベンジルピリジン-
 2-イル)キナゾリン、(15.034)ジピメチトロン(dipymetitrone
)、(15.035)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1
 -イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニ
 ル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2
 -イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.036)2-[3,5-ビス(ジフ
 ルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ
 -6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-
 オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エ
 タノン、(15.037)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール
 -1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパー-2-イン-1-
 イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,
 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.038)2-[
 6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾ
 リン、(15.039)2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオ
 ロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3
 -チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3
 -クロロフェニルメタンスルホネート、(15.040)2-{(5S)-3-[2-
 (1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル
 }ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,
 2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.0
 41)イブフルフェノキン、(15.042)2-{2-フルオロ-6-[(8-フルオ
 ロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]フェニル}プロパン-2-オール、(15
 .043)2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラ
 ザール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル
]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタ
 ンスルホネート、(15.044)2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオ
 ロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3
 -チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェ
 ニルメタンスルホネート、(15.045)2-フェニルフェノールおよびその塩、(
 15.046)3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロ
 イソキノリン-1-イル)キノリン、(15.047)キノフメリン、(15.048)
 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性形態:4-アミノ-5-フ
 ルオロピリミジン-2(1H)-オン)、(15.049)4-オキソ-4-[(2-フ
 ェニルエチル)アミノ]酪酸、(15.050)5-アミノ-1,3,4-チアジアゾー
 ル-2-チオール、(15.051)5-クロロ-N'-フェニル-N'-(プロパー-2-
 イン-1-イル)チオフェン2-スルホノヒドラジド、(15.052)5-フルオロ
 -2-[(4-フルオロベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.053)
 5-フルオロ-2-[(4-メチルベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15
 .054)9-フルオロ-2,2-ジメチル-5-(キノリン-3-イル)-2,3-ジ
 ヒドロ-1,4-ベンゾオキサゼピン、(15.055)ブタ-3-イン-1-イル{6
 -[(Z)-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレ
 ン]アミノ}オキシメチルピリジン-2-イル}カルバメート、(15.056)(
 2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチル、(15.057)フ
 ェナジン-1-カルボン酸、(15.058)3,4,5-トリヒドロキシ安息香酸プロ
 ピル、(15.059)キノリン-8-オール、(15.060)キノリン-8-オール

10

20

30

40

50

スルフェート（２：１）、（１５．０６１）{６－[（{[(１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）（フェニル）メチレン]アミノ}オキシ）メチル]ピリジン－２－イル}カルバミン酸tert-ブチル、（１５．０６２）５－フルオロ－４－イミノ－３－メチル－１－[(４－メチルフェニル)スルホニル]－３，４－ジヒドロピリミジン－２（１Ｈ）－オン、（１５．０６３）アミノピリフェン（aminopyrifen）。

【０３１５】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

式（Ⅰ）で表される化合物は、生物学的殺有害生物剤と組み合わせることができる。

【０３１６】

生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物および微生物によって形成される生成物（例えば、タンパク質および二次代謝産物）などがある。

【０３１７】

生物学的殺有害生物剤としては、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌、および生物学的殺虫剤、殺菌剤または殺線虫剤として作用する細菌などがある。

【０３１８】

生物学的殺有害生物剤として使用されているかまたは使用することが可能な上記細菌類の例は、以下のものである：

バシルス・アミロリクエファシエンス（*Bacillus amyloliquefaciens*）株FZB42（DSM 231179）、または、バシルス・セレウス（*Bacillus cereus*）、特に、バシルス・セレウス（*B. cereus*）株CN CM I-1562、または、バシルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）株I-1582（受託番号 CNCM I-1582）、または、バシルス・プミルス（*Bacillus pumilus*）、特に、株GB34（受託番号 ATCC 700814）および株QST2808（受託番号 NRRL B-30087）、または、バシルス・スブチリス（*Bacillus subtilis*）、特に、株GB03（受託番号 ATCC SD-1397）、または、バシルス・スブチリス（*Bacillus subtilis*）株QST713（受託番号 NRRL B-21661）、または、バシルス・スブチリス（*Bacillus subtilis*）株OST 30002（受託番号 NRRL B-50421）、バシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）、特に、バシルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス（*B. thuringiensis subspecies israelensis*）（抗原型 H-14）株AM65-52（受託番号 ATCC 1276）、または、バシルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ（*B. thuringiensis subsp. aizawai*）、特に、株ABTS-1857（SD-1372）、または、バシルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ（*B. thuringiensis subsp. kurstaki*）株HD-1、または、バシルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス（*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*）株NB 176（SD-5428）、パステウリア・ペネトランス（*Pasteuria penetrans*）、パステウリア属種（*Pasteuria spp.*）（ロチレンクルス・レニホルミス（*Rotylenchulus reniformis*）線虫）-PR3（受託番号 ATCC SD-5834）、ストレプトミセス・ミクロフラブス（*Streptomyces microflavus*）株AQ6121（= QRD 31.013、NRRL B-50550）、ストレプトミセス・ガルブス（*Streptomyces galbus*）株AQ 6047（受託番号 NRRL 30232）。

【０３１９】

生物学的殺有害生物剤として使用されているかまたは使用することが可能な菌類および酵母類の例は、以下のものである：

ベアウベリア・バシアナ（*Beauveria bassiana*）、特に、株ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス（*Coniothyrium minitans*

10

20

30

40

50

s)、特に、株CON/M/91-8(受託番号 DSM-9660)、レカニシリウム属種(*Lecanicillium* spp.)、特に、株HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ(*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ(*Verticillium lecanii*)として知られていた)、特に、株KV01、メタリジウム・アノソプリアエ(*Metarhizium anisopliae*)、特に、株F52(DSM3884/ ATCC 90448)、メトスクニコウィア・フルクチコラ(*Metschnikowia fructicola*)、特に、株NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*) (新規：イサリア・フモソロセア(*Isaria fumosorosea*))、特に、株IFPC 200613または株Apopka 97(受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス(*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス(*P. lilacinus*)株251(AGAL 89/030550)、タラロミセス・フラブス(*Talaromyces flavus*)、特に、株V117b、トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)、特に、株SC1(受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム(*Trichoderma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ(*T. harzianum rifai*) T39(受託番号 CNCM I-952)。

【0320】

生物学的殺有害生物剤として使用されているかまたは使用することが可能なウイルス類の例は、以下のものである：

リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)顆粒病ウイルス(GV)、コドリング(*Cydia pomonella*)顆粒病ウイルス(GV)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)核多角体病ウイルス(NPV)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua* (beet armyworm)) mNPV、ツマジロクサヨトウ(*Spodoptera frugiperda* (fall armyworm)) mNPV、エジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis* (African cotton leafworm)) NPV。

【0321】

植物または植物の部分または植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定の特性によって植物の成長および植物の健康を増進する細菌類および菌類も、同様に包含される。例としては、以下のものを挙げることができる：

アグロバクテリウム属種(*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス(*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種(*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種(*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種(*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種(*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア(*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セパシア(*Pseudomonas cepacia*)として知られていた)、ギガスポラ属種(*Gigaspora* spp.)またはギガスポラ・モノスポルム(*Gigaspora monosporum*)、グロムス属種(*Glomus* spp.)、ラッカリア属種(*Laccaria* spp.)、ラクトバシルス・ブクネリ(*Lactobacillus buchneri*)、パラグロムス属種(*Paraglomus* spp.)、ピソリthus・チンクトルス(*Pisolithus tinctorius*)、プセウドモナス属種(*Pseudomonas* spp.)、リゾビウム属種(*Rhizobium* spp.)、特に、リゾビウム・トリホリイ(*Rhizobium trifolii*)、リゾポゴン属種(*Rhizopogon* spp.)、スクレロデルマ属種(*Sclerotoderma* spp.)、スイルス属種(*Suillus* spp.)、ストレプトミセス属種(*Streptomyces* spp.)。

【0322】

生物学的殺有害生物剤として使用されているかまたは使用することが可能な、植物抽出物および微生物によって形成される生成物（これは、タンパク質および二次代謝産物を包含する）の例は、以下のものである：

ニンニク (*Allium sativum*)、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン (*azadirachtin*)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*)、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*)、アメリカアリタソウ (*Chenopodium anthelminticum*)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*)、スギナ (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (キノア (*Chenopodium quinoa*) サポニン抽出物)、除虫菊 (*pyrethrum/pyrethrins*)、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、Regalia、(「RequiemTM Insecticide」)、ロテノン、リアニア/リアノジン、ヒレハリソウ (*Symphytum officinale*)、ヨモギギク (*Tanacetum vulgare*)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ (*Tropaeolum majus*)、セイヨウイラクサ (*Urtica dioica*)、Veratrin、セイヨウヤドリギ (*Viscum album*)、アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特に、ナタネ粉末またはカラシナ粉末。

【0323】

混合成分としての薬害軽減剤

式 (I) で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセツト (ーメキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール (ーエチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン (ーエチル)、メフェンビル (ージエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N- ({ 4- [(メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド (CAS 129531-12-0)、4- (ジクロロアセチル) -1-オキサ-4-アザスピロ [4.5] デカン (CAS 71526-07-3)、2, 2, 5-トリメチル-3- (ジクロロアセチル) -1, 3-オキサゾリジン (CAS 52836-31-4) などと組み合わせることができる。

【0324】

植物および植物の部分

本発明に従って、全ての植物および植物の部分进行处理することができる。ここで、植物は、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物植物（天然に発生している作物植物を包含する）のような全ての植物および植物個体群、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、ピーマン、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、ホウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物 (*Brassica oleracea*) (例えば、キャベツ) および他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（ここで、果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実およびブドウである）などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、または、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、または、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができ、そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種または保護され得ない植物品種も包含される。植物は、全ての成育段階、例えば、種子、実生、および、幼植物（未成熟植物）から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花および根などの、植物の地上部および地下部の全ての部分および器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実および種子、並びに、さらに、根、塊茎および根茎などである。収穫さ

れた植物または収穫された植物の部分、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) および生殖繁殖器官 (generative propagation material)、例えば、挿穂 (cutting)、塊茎、根茎、かき苗 (slip) および種子なども、植物の部分に包含される。

【0325】

式 (I) で表される化合物を用いた植物および植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、煙霧 (fogging)、ばらまき、塗布、注入などによって、直接的に行うか、または、該化合物を植物および植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

10

【0326】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物およびそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種および植物品種、または、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種および植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的的方法により得られたトランスジェニック植物および植物品種 (遺伝子組換え生物) およびそれらの部分を処理する。用語「部分 (parts)」または「植物の部分 (parts of plants)」または「植物の部分 (plant parts)」については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な植物品種または使用されている慣習的な植物品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種または突然変異誘発または組換え DNA 技術によって得られた、新しい特性 (「形質」) を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型および遺伝子型であることができる。

20

【0327】

トランスジェニック植物、種子処理、および、統合イベント (integration events)

特に有利で有益な特性 (「形質」) を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物または植物品種 (遺伝子工学により得られたもの) に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温または低温に対する向上した耐性、渇水または水中若しくは土壌中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開花能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質および／または向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵性能および／または改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫および有害微生物 (例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類およびカタツムリ類) に対する植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する遺伝物質 (例えば、遺伝子 Cry I A (a)、Cry I A (b)、Cry I A (c)、Cry I I A、Cry I I I A、Cry I I I B 2、Cry 9 c、Cry 2 A b、Cry 3 B b および Cry I F 並びにそれらの組合せ) によって植物体内で形成された毒素による、害虫および有害微生物 (例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類およびカタツムリ類) に対する植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類および／またはウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性 (SAR)、システミン (systemin)、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質および毒素による、植物病原性の菌類、細菌類および／またはウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、および、さらに、特定の除草活性化合物 (例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセートまたはホスフィノトリシン) に対する植物の向上した耐性である (例えば、「PAT」遺伝子)。望まれる当該特性 (「形質」) を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。上記トランスジェニック植物の例としては、重

30

40

50

要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメおよび他の種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（ここで、該果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実およびブドウである）などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコおよびナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類およびカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

【0328】

作物保護—処理の種類

植物および植物の部分、は、式（I）で表される化合物で、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散（*spreading-on*）、注入、灌水（灌注（*drenching*））、点滴灌漑などによって、直接的に処理するか、または、該化合物を植物および植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることによって処理し、また、繁殖器官の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理、液体種子処理、スラリー処理によって、被覆によって、1以上の被膜によるコーティングなどによっても処理する。さらに、式（I）で表される化合物を微量散布法（*ultra-low volume method*）によって施用することも可能であり、または、該施用形態または式（I）で表される化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

【0329】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用であり、このことは、式（I）で表される化合物を茎葉部に施用することを意味し、その場合、その処理頻度および施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

【0330】

浸透移行性活性化合物の場合、式（I）で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。その場合、該植物は、その植物の生息環境に対して式（I）で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注（*drenching*）によって、または、土壌若しくは栄養溶液に混合させること（即ち、植物の生育場所（例えば、土壌、または、水耕系）に式（I）で表される化合物の液体形態を含浸させること）によって、または、土壌施用（即ち、本発明による式（I）で表される化合物を固体形態で（例えば、顆粒形態で）植物の生育場所に導入すること）によって、または、滴下施用（多くの場合、「化学溶液灌水（*chemigation*）」とも称される）（即ち、植物の生育場所内の定められた位置に変動する量の水と一緒に一定期間にわたって地表面または地下の滴下ラインを介して式（I）で表される本発明の化合物を導入すること）によって、達成することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式（I）で表される化合物（例えば、粒剤として）を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

【0331】

種子処理

植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。それにもかかわらず、種子の処理には、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が伴っている。かくして、植物の貯蔵中、播種後または出芽後に殺有害生物剤を追加で施用することを不要とするかまたは少なくとも著しく低減させるような、種子および発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性化合物によって植物自体に損傷を引き起こすことなく、害虫による攻撃から種子および発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する活性化合物の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の殺有害生物剤を使用して種子の最適な保護を達成し、および、さらに、発芽中の植物の最適な保護も達成するために、害虫抵抗性トランスジェニック植物または害虫耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性または殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

【0332】

従って、本発明は、特に、害虫による攻撃から種子および発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を式（I）で表される化合物のうちの1種類で処理することによる。種子および発芽中の植物を害虫による攻撃から保護するための本発明の方法は、さらに、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、1回の操作で同時にまたは順次に処理するような方法も包含する。それは、さらにまた、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、異なった時点で処理するような方法も包含する。

【0333】

本発明は、さらに、種子およびその種子から生じた植物を害虫に対して保護するために種子を処理するための、式（I）で表される化合物の使用にも関する。

10

【0334】

本発明は、さらに、害虫に対して保護されるように、本発明による式（I）で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式（I）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式（I）で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式（I）で表される化合物と混合成分が被膜の一部としてまたは被膜に加えられたさらなる1つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

20

【0335】

本発明は、さらに、式（I）で表される化合物で処理された後で、埃による種子の摩耗を防止するために、フィルムコーティングプロセスに付される種子にも関する。

【0336】

式（I）で表される化合物が浸透移行的に作用する場合に生じる有利な点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時または播種後間もなくに作物を直接処理する手間を省くことができる。

【0337】

さらなる有利な点は、式（I）で表される化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽および出芽が増進され得るということである。

30

【0338】

式（I）で表される化合物を、特に、トランスジェニック種子に対しても使用することが可能であるということも、有利であると考えられる。

【0339】

さらに、式（I）で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することも可能であり、それによって、共生生物（例えば、根粒菌、菌根菌および／または内部寄生性の細菌若しくは菌類）によるコロニー形成が良好になり、および／または、窒素固定が最適化される。

40

【0340】

式（I）で表される化合物は、農業において、温室内で、森林でまたは園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワおよびエンバク）、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、カノラ、ナタネ、ビート（例えば、テンサイおよび飼料用ビート）、ラッカセイ、野菜（例えば、トマト、キュウリ、インゲンマメ、アブラナ科野菜、タマネギおよびレタス）、果実植物、芝生および観賞植物の種子である。穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギおよびエンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネ、野菜類およびイネの種子を処理することは、特に重要である。

50

【0341】

既に上記で記載したように、式（I）で表される化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、特に、殺虫特性および／または殺線虫特性を有するポリペプチドの発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子を包含する。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は、バシルス（*Bacillus*）種、リゾビウム（*Rhizobium*）種、プセウドモナス（*Pseudomonas*）種、セラチア（*Serratia*）種、トリコデルマ（*Trichoderma*）種、クラビバクテル（*Clavibacter*）種、グロムス（*Glomus*）種またはグリオクラジウム（*Gliocladium*）種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種（*Bacillus* sp.）に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する。

10

【0342】

本発明に関連して、式（I）で表される化合物は、種子に対して施用する。該種子は、好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛または果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、および、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子（例えば、プライミング）を使用することもできる。イネの種子の場合、イネ胚の特定の段階（鳩胸段階）に達するまで、例えば水中に、浸漬させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が刺激され、および、出芽がより均一になる。

20

【0343】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、または、生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式（I）で表される化合物の量および／またはさらなる添加剤の量を選択することに対して、一般的に注意しなくてはならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性化合物の場合に、確実に実施しなければならない。

30

【0344】

一般に、式（I）で表される化合物は、適切な製剤の形態で種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤および方法は、当業者には知られている。

【0345】

式（I）で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤または種子用の別のコーティング組成物などに変換させることが可能であり、および、さらに、ULV製剤に変換させることも可能である。

【0346】

これらの製剤は、既知方法で、式（I）で表される化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、および、溶媒または希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、および、さらに、水と混合させることによって、調製する。

40

【0347】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中であまり溶解しない顔料または水中で溶解する染料を使用することができる。その例としては、「Rhodamin B」、「C. I. Pigment Red 112」および「C. I. Solvent Red 1」の名称で知られている着色剤などを挙げることができる。

【0348】

50

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な湿潤剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネートまたはジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用することができる。

【0349】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる適切な分散剤および／または乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性およびカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤または非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用することができる。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類およびトリステリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体または硫酸化誘導体などがある。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類およびアリアルスルホネート－ホルムアルデヒド縮合物である。

【0350】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを使用することができる。

【0351】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げるることができる。

【0352】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレーおよび微粉化シリカなどを挙げるることができる。

【0353】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースなどを挙げるることができる。

【0354】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくは、ジベレリンA1、ジベレリンA3（＝ジベレリン酸）、ジベレリンA4およびジベレリンA7であり；特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている（cf. R. Wegler “Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel”, vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401–412）。

【0355】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、または、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚製剤（concentrate）または水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバクおよびライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することが可能であり、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズおよびビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、または、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することが可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤またはそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。

【0356】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤またはその種子粉衣製剤から水を添加することによって調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機（これは、バッチ式または連続的に作動される）の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのままで添加するかまたは予め水で希釈したあとで添加すること、および、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

【0357】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該製剤中の式（I）で表される化合物の特定の含有量および当該種子に左右される。式（I）で表される化合物の施用量は、一般に、種子1kg当たり0.001～50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01～15gである。

【0358】

動物衛生

動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式（I）で表される化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物または内部寄生生物に対して、活性を示す。用語「内部寄生生物」は、特に、蠕虫類および原生動物（例えば、コクシジウム）を包含する。外部寄生生物は、典型的には、および、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類またはダニ類である。

【0359】

獣医学の分野において、内温動物に対する毒性が好ましい程度である式（I）で表される化合物は、動物育種および畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物および家庭内動物（domestic animal）において発生する寄生生物を防除するのに適している。それらは、該寄生生物の全ての発育段階または特定の発育段階に対して活性を示す。

【0360】

農業用家畜としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、並びに、特に、ウシおよびブタ；または、家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、および、特に、ニワトリ；または、魚類若しくは甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類若しくは甲殻類の動物；または、場合により、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0361】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ハムスター、テンジクネズミ、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、および、特に、イヌ、ネコ、籠の鳥、爬虫類、両生類、または、水槽の魚。

【0362】

特定の実施形態では、式（I）で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0363】

特定の別の実施形態では、式（I）で表される化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、または、特に、家禽類に対して、投与される。

【0364】

動物寄生生物を防除するために式（I）で表される化合物を使用することは、上記動物の病気、死亡事例を低減または予防すること、および、生産性（performance）（肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）の低下を低減または予防することが意図され、その結果、より経済的で且つより容易な畜産業が可能となり、および、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

【0365】

動物衛生の分野に関連して、用語「防除する（control）」または「防除する（controlling）」は、本発明に関連しては、式（I）で表される化合物が、寄

10

20

30

40

50

生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がない程度にまで低減させることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明に関連して、式（I）で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すこと、その成長を阻害すること、または、その増殖を阻害することを意味する。

【0366】

節足動物としては、限定するものではないが、例えば、以下のものを挙げることができる：

アノプルリダ目（Anoplurida）の、例えば、ハエマトピヌス属種（Haematopinus spp.）、リノグナツス属種（Linognathus spp.）、ペジクルス属種（Pediculus spp.）、プチルス属種（Phtirus spp.）、および、ソレノポテス属種（Solenopotes spp.）；

10

マロファギダ目（Mallophagida）並びにアムブリセリナ亜目（Amblycerina）およびイスクノセリナ亜目（Ischnocerina）の、例えば、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ダマリナ属種（Damalina spp.）、フェリコラ属種（Felicola spp.）；レピケントロン属種（Lepikentron spp.）、メノポン属種（Menopon spp.）、トリコデクテス属種（Trichodectes spp.）、トリメノポン属種（Trimenopon spp.）、トリノトン属種（Trinoton spp.）、ウェルネキエラ属種（Werneckiella spp.）；

20

双翅目（Diptera）並びにネマトセリナ亜目（Nematocerina）およびブラキセリナ亜目（Brachycerina）の、例えば、アエデス属種（Aedes spp.）、アノフェレス属種（Anopheles spp.）、アチロツス属種（Atylotus spp.）、ブラウラ属種（Braula spp.）、カリホラ属種（Calliphora spp.）、クリソミイア属種（Chrysomyia spp.）、クリソプス属種（Chrysops spp.）、クレキス属種（Culex spp.）、クリコイデス属種（Culicoides spp.）、エウシムリウム属種（Eusimulium spp.）、ファンニア属種（Fannia spp.）、ガステロフィルス属種（Gasterophilus spp.）、グロシナ属種（Glossina spp.）、ハエマトビア属種（Haematobia spp.）、ハエマトポタ属種（Haematopota spp.）、ヒポボスカ属種（Hippobosca spp.）、ヒボミトラ属種（Hybomitra spp.）、ヒドロタエア属種（Hydrotaea spp.）、ヒポデルマ属種（Hypoderma spp.）、リポプテナ属種（Lipoptena spp.）、ルシリア属種（Lucilia spp.）、ルトゾミイア属種（Lutzomyia spp.）、メロファグス属種（Melophagus spp.）、モレリア属種（Morellia spp.）、ムスカ属種（Musca spp.）、オダグミア属種（Odagmia spp.）、オエストルス属種（Oestrus spp.）、フィリポミイア属種（Philipomyia spp.）、フレボトムス属種（Phlebotomus spp.）、リノエストルス属種（Rhinoestrus spp.）、サルコファガ属種（Sarcophaga spp.）、シムリウム属種（Simulium spp.）、ストモキス属種（Stomoxys spp.）、タバヌス属種（Tabanus spp.）、チブラ属種（Tipula spp.）、ウィルヘルミア属種（Wilhelmia spp.）、ウォールファー

30

40

ルチア属種（Wohlfahrtia spp.）；
ノミ目（Siphonapterida）の、例えば、セラトフィルス属種（Ceratophyllus spp.）、クテノセファリデス属種（Ctenocephalides spp.）、ブレキス属種（Pulex spp.）、ツンガ属種（Tunga spp.）、キセノプシラ属種（Xenopsylla spp.）；

ヘテロプテリダ目（Heteropterida）の、例えば、シメキス属種（Cimex spp.）、パンストロンギルス属種（Panstrongylus spp.）、ロドニウス属種（Rhodnius spp.）、トリアトマ属種（Triatoma s

50

pp.) ; および、さらに、ゴキブリ目 (Blattarida) の害虫および衛生害虫。
【0367】

さらに、節足動物の場合、限定するものではないが、例として以下のダニ類も挙げるべきである：

ダニ亜綱 (Acarari (Acarina)) およびメタスチグマタ目 (Metastigmata) の、例えば、ヒメダニ科 (Argasidae) の、例えば、アルガス属種 (Argas spp.)、オルニトドルス属種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属種 (Otobius spp.)、マダニ科 (Ixodidae) の、例えば、デルマセントル属種 (Dermacentor spp.)、ハエマフィサリス属種 (Haemaphysalis spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、イキシデス属種 (Ixodes spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (Rhipicephalus (Boophilus) spp.)、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp. (多宿主ダニの原属))；メソスチグマタ目 (Mesostigmata) の、例えば、オルニトニسس属種 (Ornithonyssus spp.)、プネウモニسس属種 (Pneumonyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、ステルノストマ属種 (Sternostoma spp.)、トロピラエラプス属種 (Tropilaelaps spp.)、バロア属種 (Varroa spp.)；アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) の、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、デモデクス属種 (Demodex spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、ネオトロムビクラ属種 (Neotrombicula spp.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、トロムビクラ属種 (Trombicula spp.)；および、アカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、シトジテス属種 (Cyrtodites spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、クネミドコプテス属種 (Knemidocoptes spp.)、ラミノシオプテス属種 (Laminosioptes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、トリキサカルス属種 (Trixacarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)。

【0368】

寄生性原生動物の例としては、限定するものではないが、以下のものを挙げる事ができる：

鞭毛虫亜門 (Mastigophora) (鞭毛虫類 (Flagellata))、例えば：

メタモナーダ (Metamonada)：ヒゲハラムシ目 (Diplomonadida) の、例えば、ギアルジア属種 (Giardia spp.)、スピロヌクレウス属種 (Spirotrichomonas spp.)；

パラバサラ (Parabasala)：トリコモナス目 (Trichomonadida) の、例えば、ヒストモナス属種 (Histomonas spp.)、ペンタトリコモナス属種 (Pentatrichomonas spp.)、テトラトリコモナス属種 (Tetratrichomonas spp.)、トリコモナス属種 (Trichomonas spp.)、トリトリコモナス属種 (Tritrichomonas spp.)；

ユーグレノゾア (Euglenozoa)：トリパノソーマ目 (Trypanosomatida) の、例えば、レイスマニア属種 (Leishmania spp.)、トリパノソーマ属種 (Trypanosoma spp.)；

有毛根足虫亜門 (*Sarcomastigophora*) (根足虫類 (*Rhizopoda*))、例えば、エントアメーバ科 (*Entamoebidae*)、例えば、エンタモエバ属種 (*Entamoeba* spp.)、セントロアメーバ科 (*Centramoebidae*)、例えば、アカンタモエバ属種 (*Acanthamoeba* spp.)、ユーアメーバ科 (*Euamoebidae*)、例えば、ハルトマネラ属種 (*Hartmannella* spp.) ;

アルベオラータ (*Alveolata*)、例えば、アピコンプレックス門 (*Apicomplexa*) (孢子虫類 (*Sporozoa*))、例えば、クリプトスポリジウム属種 (*Cryptosporidium* spp.) ; エイメリア目 (*Eimeriida*) の、例えば、ベスノイチア属種 (*Besnoitia* spp.)、シストイソスポラ属種 (*Cystoisospora* spp.)、エイメリア属種 (*Eimeria* spp.)、ハモンジア属種 (*Hammondia* spp.)、イソスポラ属種 (*Isospora* spp.)、ネオスポラ属種 (*Neospora* spp.)、サルコシスチス属種 (*Sarcocystis* spp.)、トキソプラズマ属種 (*Toxoplasma* spp.) ; アデレイダ目 (*Adeleida*) の、例えば、ヘパトゾオン属種 (*Hepatozoon* spp.)、クロシエラ属不 (*Klossiella* spp.) ; ハエモスポリダ目 (*Haemosporida*) の、例えば、レウコシトゾオン属種 (*Leucocytozoon* spp.)、プラスモジウム属種 (*Plasmodium* spp.) ; ピロプラスミダ目 (*Piroplasmida*) の、例えば、バベシア属種 (*Babesia* spp.)、シリオホラ属種 (*Ciliophora* spp.)、エキノゾオン属種 (*Echinozoon* spp.)、テイレリア属種 (*Theileria* spp.) ; ベシブリフェリダ目 (*Vesiculiferida*) の、例えば、バランチジウム属種 (*Balantidium* spp.)、ブキストネラ属種 (*Buxtonella* spp.) ;

微孢子虫亜門 (*Microspora*)、例えば、エンセファリトゾオン属種 (*Encephalitozoon* spp.)、エンテロシトゾオン属種 (*Enterocytozoon* spp.)、グロビジウム属種 (*Globidium* spp.)、ノセマ属種 (*Nosema* spp.)、および、さらに、例えば、ミキソゾア属種 (*Myxozoa* spp.)。

【0369】

ヒトまたは動物に対して病原性を示す蠕虫類としては、例えば、鉤頭動物門 (*Acanthocephala*)、線形動物、舌形動物門 (*Pentastoma*) および扁形動物門 (*Platyhelminths*) (例えば、単生類 (*Monogenea*)、条虫類 (*cestodes*) および吸虫類 (*trematodes*)) などがある。

【0370】

例示的な蠕虫類としては、限定するものではないが、以下のものを挙げるができる：

単生綱 (*Monogenea*) : 例えば：ダクチロギルス属種 (*Dactylogyrus* spp.)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ミクロボトリウム属種 (*Microbothrium* spp.)、ポリストマ属種 (*Polystoma* spp.)、トログレセファルス属種 (*Troglecephalus* spp.) ;

条虫類 (*Cestodes*) : ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllidea*) の、例えば：ボトリジウム属種 (*Bothridium* spp.)、ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、ジフロゴノポルス属種 (*Diplogonoporus* spp.)、イクチオボトリウム属種 (*Ichthyobothrium* spp.)、リグラ属種 (*Ligula* spp.)、シストセファルス属種 (*Schistocephalus* spp.)、スピロメトラ属種 (*Spirometra* spp.) ;

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllida*) の、例えば：アンジラ属種 (*Andyra* spp.)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala* spp.)

.)、アビテリナ属種 (*Avitellina* spp.)、ベルチエラ属種 (*Bertiella* spp.)、シトタエニア属種 (*Cittotaenia* spp.)、ダバ
イネア属種 (*Davainea* spp.)、ジオルキス属種 (*Diorchis* spp.)、ジプロピリジウム属種 (*Diplopylidium* spp.)、ジピリジウム
属種 (*Dipylidium* spp.)、エキノコックス属種 (*Echinococcus* spp.)、エキノコチレ属種 (*Echinocotyle* spp.)、エキノレ
ピス属種 (*Echinolepis* spp.)、ヒダチゲラ属種 (*Hydatigera* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、ジョイエウキシ
エラ属種 (*Joyeuxiella* spp.)、メソセストイデス属種 (*Mesocetoides* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* spp.)、パラノプ
ロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、ライリエチナ属種 (*Raillietina* spp.)、ステレシア属種 (*Stilesia* spp.)、
タエニア属種 (*Taenia* spp.)、チサニエジア属種 (*Thysaniezia* spp.)、チサノソマ属種 (*Thysanosoma* spp.)；

吸虫類 (*Trematodes*)：二生亜綱 (*Digenea*) の、例えば：アウスト
ロビルハルジア属種 (*Austrobilharzia* spp.)、ブラキライマ属種
(*Brachylaima* spp.)、カリコホロン属種 (*Calicophoron* spp.)、カタトロピス属種 (*Catatropis* spp.)、クロノルキス属種
(*Clonorchis* spp.)、コリリクルム属種 (*Collyriclum* spp.)、コチロホロン属種 (*Cotylphoron* spp.)、シクロコエルム属
種 (*Cyclocoelum* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジプロストムム属種 (*Diplostomum* spp.)、エキノ
カスムス属種 (*Echinochasmus* spp.)、エキノパリフィウム属種 (*Echinoparyphium* spp.)、エキノストマ属種 (*Echinostoma* spp.)、
エウリトレマ属種 (*Eurytrema* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス属種 (*Fasciolides* spp.)、
ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、フィスコエデリウ
ス属種 (*Fischoederius* spp.)、ガストロチラクス属種 (*Gastrothylacus* spp.)、ギガントビルハルジア属種 (*Gigantobilharzia* spp.)、
ギガントコチレ属種 (*Gigantocotyle* spp.)、ヘテロフィエス属種 (*Heterophyes* spp.)、ヒポデラエウム属種 (*Hypoderaeum* spp.)、
レウコクロリジウム属種 (*Leucochloridium* spp.)、メタゴニムス属種 (*Metagonimus* spp.)、メトル
キス属種 (*Metorchis* spp.)、ナノフィエツス属種 (*Nanophyetus* spp.)、ノトコチルス属種 (*Notocotylus* spp.)、オピストル
キス属種 (*Opisthorchis* spp.)、オルニトビルハルジア属種 (*Ornithobilharzia* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、
パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、プ
ラギオルキス属種 (*Plagiorchis* spp.)、ポストジプロストムム属種 (*Posthodiplostomum* spp.)、プロストゴニムス属種 (*Prosthogonimus* spp.)、
シストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、トログロト
レマ属種 (*Troglootrema* spp.)、チフロコエルム属種 (*Typhloc*
oelum spp.)；

線虫類 (*Nematodes*)：ベンチュウ目 (*Trichinellida*) の、例
えば：カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)、トリコモソイデス属種 (*Trichomosoides* spp.)、
トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)；

クキセンチュウ目 (*Tylenchida*) の、例えば：マイクロネマ属種 (*Micronema* spp.)、パラストラングロイデス属種 (*Parastrangyloid*

10

20

30

40

50

es spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.) ;

カンセンチュウ目 (*Rhabditina*) の、例えば：アエルロストロンギルス属種 (*Aelurostrongylus* spp.)、アミドストムム属種 (*Amidos tomum* spp.)、アンシロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、アンギオストロンギルス属種 (*Angiostrongylus* spp.)、ブロンコネマ属種 (*Bronchonema* spp.)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、コオペリア属種 (*Cooperia* spp.)、コオペリオイデス属種 (*Cooperioides* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、シアトストムム属種 (*Cyathostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cyclococercus* spp.)、シクロドントストムム属種 (*Cyclodontostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cylicocyclus* spp.)、シリコステファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、シリンドロファリンキス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、エラホストロンギルス属種 (*Elaphostrongylus* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globocephalus* spp.)、グラフィジウム属種 (*Graphidium* spp.)、ギアロセファルス属種 (*Gyallocephalus* spp.)、ハエモンクス属種 (*Hemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyoststrongylus* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marshallagia* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ムエレリウス属種 (*Muellerius* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ネオストロンギルス属種 (*Neoststrongylus* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、オベリスコイデス属種 (*Obeliscoides* spp.)、オエソファゴドンツス属種 (*Oesophagodontus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.) ; オルニトストロンギルス属種 (*Ornithostrongylus* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、パラコオペリア属種 (*Paracooperia* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Parelaphostrongylus* spp.)、プネウモカウルス属種 (*Pneumocaulus* spp.)、プネウモストロンギルス属種 (*Pneumoststrongylus* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、トログロストロンギルス属種 (*Trogloststrongylus* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.) ;

センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：アカントケイロネマ属種 (*Acanthocheilonema* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属種 (*Ascaridia* spp.) ; アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、アスカロプス属種 (*Ascarops* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylis*

10

20

30

40

50

ascaris spp.)、ブルギア属種 (Brugia spp.)、セルコピチフィ
ラリア属種 (Cercopithifilaria spp.)、クラシカウダ属種 (C
rassicauda spp.)、ジペタロネマ属種 (Dipetalonema sp
p.)、ジロフィラリア属種 (Dirofilaria spp.)、ドラクンクルス属
種 (Dracunculus spp.)；ドラスキア属種 (Draschia spp.
)、エンテロビウス属種 (Enterobius spp.)、フィラリア属種 (Fil
aria spp.)、グナトストマ属種 (Gnathostoma spp.)、ゴンギ
ロネマ属種 (Gongylonema spp.)、ハプロネマ属種 (Habronema
spp.)、ヘテラキス属種 (Heterakis spp.)；リトモソイデス属種 (L
itomosooides spp.)、ロア属種 (Loa spp.)、オンコセルカ属
種 (Onchocerca spp.)、オキシウリス属種 (Oxyuris spp.)
、パラプロネマ属種 (Parabronema spp.)、パラフィラリア属種 (Pa
rafilaria spp.)、パラスカリス属種 (Parascaris spp.)
、パスルルス属種 (Passalurus spp.)、フィサロプテラ属種 (Phys
aloptera spp.)、プロブストマイリア属種 (Probstmayria s
pp.)、プセウドフィラリア属種 (Pseudofilaria spp.)、セタリ
ア属種 (Setaria spp.)、スクジュラビネマ属種 (Skjrabinema
spp.)、スピロセルカ属種 (Spirocerca spp.)、ステファノフィラ
リア属種 (Stephanofilaria spp.)、ストロンギルリス (Stro
ngyluris spp.)、シファシア属種 (Syphacia spp.)、テラジ
ア属種 (Thelazia spp.)、トキサスカリス属種 (Toxascaris s
pp.)、トキソカラ属種 (Toxocara spp.)、ウケレリア属種 (Wuch
ereria spp.)；

鉤頭動物門 (Acanthocephala)：ダイコウトウチュウ目 (Oligac
anthorhynchida) の、例えば：マクラカントリンクス属種 (Macrac
anthorhynchus spp.)、プロステノルキス属種 (Prosthenor
chis spp.)；サジョウコウトウチュウ目 (Moniliiformida) の
、例えば：モニリホルミス属種 (Moniliiformis spp.)；

ポリモルフス目 (Polymorphida) の、例えば：フィリコリス属種 (Fil
icollis spp.)；コウトウチュウ目 (Echinorhynchida) の
、例えば、アカントセファルス属種 (Acanthocephalus spp.)、エ
キノリンクス属種 (Echinorhynchus spp.)、レプトリンコイデス属
種 (Leptorhynchooides spp.)；

舌形動物門 (Pentastoma)：ポロケファルス目 (Porocephalid
a) の、例えば、リングアツラ属種 (Linguatula spp.)。

【0371】

獣医学の分野においておよび畜産業において、式 (I) で表される化合物は、当技術分
野において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸経
路、非経口的経路、経皮的経路または経鼻的経路を介して投与する。投与は、予防的、感
染後防御的 (metaphylactic) または治療的であり得る。

【0372】

それ故に、本発明の1実施形態は、薬物として使用するための式 (I) で表される化合
物に関する。

【0373】

さらなる態様は、抗内部寄生生物剤として使用するための式 (I) で表される化合物に
関する。

【0374】

本発明のさらなる特定の態様は、抗蠕虫剤 (anthelmintic agent) として使用するための、特に、殺線虫剤、殺扁形動物剤 (platyhelminth
icide)、殺鉤頭動物剤 (acanthocephalicide) または殺舌形

10

20

30

40

50

動物剤 (pentastomicide) として使用するための、式 (I) で表される化合物に関する。

【0375】

本発明のさらなる特定の態様は、抗原生動物剤 (antiprotozoic agent) として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

【0376】

さらなる態様は、抗外部寄生生物剤として使用するための、特に、殺節足動物剤 (arthropodicide) として使用するための、極めて特定のには、殺虫剤または殺ダニ剤として使用するための、式 (I) で表される化合物に関する。

【0377】

本発明のさらなる態様は、有効量の式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物および以下のもののうちの少なくとも1種類を含んでいる獣医薬製剤である：薬学的に許容され得る賦形剤（例えば、固体希釈剤または液体希釈剤）、薬学的に許容され得る補助剤（例えば、界面活性剤）、特に、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、および／または、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤。

【0378】

本発明の関連する態様は、本明細書中に記載されている獣医薬製剤を製造する方法であって、ここで、該方法は、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物を、薬学的に許容され得る賦形剤および／または補助剤（特に、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、および／または、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤）と混合させる段階を含んでいる。

【0379】

本発明の別の特定の態様は、上記態様による殺外部寄生生物薬製剤 (ectoparasitocidal formulations) および殺内部寄生生物薬製剤 (endoparasitocidal formulations) の群から選択される獣医薬製剤、特に、駆虫薬製剤、抗原生動物薬製剤 (antiprotozoic formulations) および殺節足動物薬製剤 (arthropodicidal formulations) の群から選択される獣医薬製剤、極めて特に、殺線虫薬製剤、殺扁形動物薬製剤 (platyhelminthocidal formulations)、殺鉤頭動物薬製剤 (acanthocephalicidal formulations)、殺舌形動物薬製剤 (pentastomocidal formulations)、殺虫薬製剤および殺ダニ薬製剤の群から選択される獣医薬製剤、並びに、それらを製造する方法である。

【0380】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物および内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物（特に、非ヒト動物）において有効量の式 (I) で表される化合物を使用することによる。

【0381】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物および内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物（特に、非ヒト動物）において本明細書中で定義されている獣医薬製剤を使用することによる。

【0382】

別の態様は、動物（特に、非ヒト動物）における寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物および内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症の治療における、式 (I) で表される化合物の使用に関する。

【0383】

動物衛生または獣医学に関連して、用語「処置 (treatment)」は、予防的処

10

20

30

40

50

置、感染後防御的処置または治療的処置を包含する。

【0384】

特定の実施形態においては、このようにして、獣医学の分野に対して、式（I）で表される少なくとも1種類の化合物と別の活性化合物（特に、殺内部寄生生物薬および殺外部寄生生物薬）の混合物が提供される。

【0385】

動物衛生の分野においては、「混合物」は、2種類の（または、それより多い）異なる活性化合物が共有の製剤に製剤され、それによって一緒に使用されることを意味するのみではなく、それぞれの活性化合物に対して独立した製剤を含んでいる製品にも関する。従って、3種類以上の活性化合物を使用する場合、全ての活性化合物を共有の製剤に製剤することができるか、または、全ての活性化合物を別々の製剤に製剤することが可能である；同様に、活性化合物のうちの一部と一緒に製剤し且つ活性化合物のうちの一部を別々に製剤するという混合形態も考えることができる。別々の製剤では、当該複数の活性化合物を別々に施用することが可能であるか、または、連続して施用することが可能である。

【0386】

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」（上記を参照されたい）に記載されているか、または、インターネット上で検索することができる（例えば、<http://www.alanwood.net/pesticides>）。

【0387】

混合成分として該殺外部寄生生物薬の群から選択される例示的な活性化合物としては、決して限定することを意図するものではないが、上記において詳細に記載されている殺虫剤および殺ダニ剤などを挙げることができる。使用することが可能なさらなる活性化合物について、現在の「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいた上記分類に従って、以下に記載する：（1）アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害薬；（2）GABA制御塩化物チャンネル遮断薬；（3）ナトリウムチャンネルモジュレーター；（4）ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）競合的モジュレーター；（5）ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリックモジュレーター；（6）グルタミン酸制御塩化物チャンネル（GluCl）アロステリックモジュレーター；（7）幼若ホルモン模倣物質；（8）種々の特定されていない（多部位）阻害薬；（9）弦音器官モジュレーター；（10）ダニ成長阻害薬；（11）ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター；（12）プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤；（13）ニコチン作動性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬；（14）キチン生合成の阻害薬（タイプ0）；（15）キチン生合成の阻害薬（タイプ1）；（16）脱皮ディスラプター（特に、双翅目において）；（17）エクジソン受容体作動薬；（18）オクトパミン受容体作動薬；（19）ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬；（20）ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬；（21）ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬；（22）ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害薬；（23）アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬；（24）リアノジン受容体モジュレーター；

作用機序が知られていないかまたは特定されていない活性化合物、例えば、フェントリファニル、フェノキサクリム、シクロブレン、クロロベンジレート、クロルジメホルム、フルベンジミン、ジシクラニル、アミドフルメト、キノメチオネート、トリアラテン、クロチアゾベン、テトラスル、オレイン酸カリウム、石油、メトキサジアゾン、ゴシブルレ、フルテンジン、ブロモプロピレート、氷晶石；

別のクラスの化合物、例えば、ブタカルブ、ジメチラン、クロエトカルブ、ホスホカルブ、ピリミホス（-エチル）、パラチオン（-エチル）、メタクリホス、o-サリチル酸イソプロピル、トリクロルホン、チゴラネル、スルプロホス、プロパホス、セブホス、ピリダチオン、プロトエート、ジクロフェンチオン、ジメトーン-S-メチルスルホン、イサゾホス、シアノフェンホス、ジアリホス、カルボフェノチオン、アウタチオホス、アロム

フェンピンホス（－メチル）、アジンホス（－エチル）、クロルピリホス（－エチル）、ホスメチラン、ヨードフェンホス、ジオキサベンゾホス、ホルモチオン、ホノホス、フルピラゾホス、フェンスルホチオン、エトリムホス；

有機塩素化合物、例えば、カンフェクロル、リンダン、ヘプタクロル；または、フェニルピラゾール系、例えば、アセトプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、バニリプロール、シサプロニル；または、イソオキサゾリン系、例えば、サロラネル、アフォキシラネル、ロチラネル、フルララネル；

ピレスロイド系、例えば、（シス－、トランス－）メトフルトリン、プロフルトリン、フルフェンプロックス、フルプロシトリネート、フブフェンプロックス、フェンフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、RU15525、テラレトリン、シス－レスメトリン、ヘプタフルトリン、ビオエタノメトリン、ビオペルメトリン、フェンピリトリン、シス－シベルメトリン、シス－ペルメトリン、クロシトリン、シハロトリン（ラムダー）、クロバポルトリン、または、ハロゲン化炭化水素化合物（HCHs）；

ネオニコチノイド系、例えば、ニチアジン；

ジクロロメゾチアズ（dicloromezotiaz）、トリフルメゾピリム；

大環状ラクトン系、例えば、ネマデクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、モキシデクチン、セラメクチン、エプリノメクチン、ドラメクチン、エマメクチン安息香酸塩；ミルベマイシンオキシム；

トリプレン、エポフェノナン、ジオフェノラン；

生物学的薬剤、ホルモン類、または、フェロモン類、例えば、天然産物類、例えば、ツリンギエンシン（thuringiensin）、コドレモン、または、ニーム成分；

ジニトロフェノール系、例えば、ジノカップ、ジノブトン、ビナパクリル；

ベンゾイル尿素系、例えば、フルアズロン、ペンフルロン；

アミジン誘導体、例えば、クロロメブホルム（chlormebulfom）、シミアゾール、デミジトラズ；

蜜蜂巣箱ミツバチヘギイタダニ殺ダニ剤（beehive varroa acaricides）、例えば、有機酸、例えば、ギ酸、シュウ酸。

【0388】

混合成分として該殺内部寄生生物薬の群から選択される例示的な活性化合物としては、限定するものではないが、駆虫活性成分および抗原生動物活性成分などを挙げることができる。

【0389】

該活性駆虫成分としては、限定するものではないが、以下の活性殺線虫成分、活性殺吸虫成分および／または活性殺条虫成分などを挙げることができる；

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：エプリノメクチン、アバメクチン、ネマデクチン、モキシデクチン、ドラメクチン、セラメクチン、レピメクチン、ラチデクチン、ミルベメクチン、イベルメクチン、エマメクチン、ミルベマイシン；

ベンゾイミダゾール類およびプロベンゾイミダゾール類のクラスの、例えば：オキシベンダゾール（oxibendazole）、メベンダゾール、トリクラベンダゾール（triclabendazole）、チオファネート（thiophanate）、パルベンダゾール（parbendazole）、オキシフェンダゾール（oxfendazole）、ネトビミン（netobimin）、フェンベンダゾール、フェバンテル、チアベンダゾール（thiabendazole）、シクロベンダゾール、カムベンダゾール、アルベンダゾールスルホキシド、アルベンダゾール、フルベンダゾール；

デブシペプチド類のクラスの、好ましくは、環状デブシペプチド類のクラスの、特に、24員の環状デブシペプチド類のクラスの、例えば：エモデプシド（emodepside）、PF1022A；

テトラヒドロピリミジン類のクラスの、例えば：モランテル、ピランテル、オキサントール；

イミダゾチアゾール類のクラスの、例えば：ブタミソール、レバミソール、テトラミソ

10

20

30

40

50

ール；

アミノフェニルアミジン類のクラスの、例えば：アミダンテル、デアシル化アミダンテル（dAMD）、トリベンジミジン；

アミノアセトニトリル類のクラスの、例えば：モネパンテル（monepantel）；

パラヘルクアミド類のクラスの、例えば：パラヘルクアミド、デルクアンテル；

サリチルアニリド類のクラスの、例えば：トリブロムサラン、ブロモキサニド、ブロチアニド、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、ラフォキサニド；

置換フェノール類のクラスの、例えば：ニトロキシニル、ピチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン（meniclopholan）；

有機リン酸エステル類のクラスの、例えば：トリクロロホン、ナフタロホス（naphthalofos）、ジクロロボス／DDVP、クルホメート、クマホス、ハロキソン；

ピペラジノン類／キノリン類のクラスの、例えば：プラジクアンテル（praziquantel）、エプシプランテル；

ピペラジン類のクラスの、例えば：ピペラジン、ヒドロキシジン；

テトラサイクリン類のクラスの、例えば：テトラサイクリン、クロロテトラサイクリン、ドキシサイクリン、オキシテトラサイクリン、ロリテトラサイクリン；

さまざまな別のクラスの、例えば：ブナミジン、ニリダゾール、レソランテル、オムファロチン、オルチプラズ、ニトロスカネート、ニトロキシニル、オキサムニキン、ミラサン（mirasan）、ミラシル（miracil）、ルカントン、ヒカントン、ヘトリン（hetolin）、エメチン、ジエチルカルバマジン、ジクロロフェン、ジアンフェネチド、クロナゼパム、ベフェニウム、アモスカネート（amoscanate）、クロルスロン。

【0390】

活性抗原生動物化合物としては、限定するものではないが、以下の活性化合物を挙げることができる：

トリアジン類のクラスの、例えば：ジクラズリル、ポナズリル、レトラズリル、トルトラズリル；

ポリエーテルイオノホア類のクラスの、例えば：モネンシン、サリノマイシン、マデュラマイシン、ナラシン；

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：ミルベマイシン、エリスロマイシン；

キノロン類のクラスの、例えば：エンロフロキサシン、プラドフロキサシン；

キニーネ類のクラスの、例えば：クロロキン；

ピリミジン類のクラスの、例えば：ピリメタミン；

スルホンアミド類のクラスの、例えば：スルファキノキサリン、トリメトプリム、スルファクロジン；

チアミン類のクラスの、例えば：アンプロリウム；

リンコサミド類のクラスの、例えば：クリンダマイシン；

カルバニリド類のクラスの、例えば：イミドカルブ；

ニトロフラン類のクラスの、例えば：ニフルチモクス；

キナゾリノンアルカロイド類のクラスの、例えば：ハロフギノン；

さまざまな別のクラスの、例えば：オキサムニキン、パロモマイシン；

ワクチンまたは微生物の抗原のクラスの、例えば：バベシア・カニス・ロッシ（*Babesia canis rossii*）、エイメリア・テネラ（*Eimeria tenella*）、エイメリア・プラエコキス（*Eimeria praecox*）、エイメリア・ネカトリキス（*Eimeria necatrix*）、エイメリア・ミチス（*Eimeria mitis*）、エイメリア・マキシマ（*Eimeria maxima*）、エイメリア・ブルネッチ（*Eimeria brunetti*）、エイメリア・アセルブリナ（*Eimeria acervulina*）、バベシア・カニス・ボゲリ（*Babesia c*

10

20

30

40

50

anis vogeli)、レイシュマニア・インファンツム (*Leishmania infantum*)、バベシア・カニス・カニス (*Babesia canis canis*)、ジクチオカウルス・ビビパルス (*Dictyocaulus viviparus*)。

【0391】

記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基または酸と塩を形成することもできる。

【0392】

媒介動物の防除

式(I)で表される化合物は、媒介動物 (*vector*) の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体 (例えば、ウイルス類、蠕虫類 (*worms*)、単細胞生物および細菌類) を病原体保有宿主 (植物、動物、ヒトなど) から宿主まで運ぶことが可能な節足動物 (特に、昆虫またはクモ形類動物) である。該病原体は、宿主に機械的に運ばれ得る (例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ)、または、宿主体内への注入後に運ばれ得る (例えば、蚊によるマラリア原虫)。

【0393】

媒介動物の例および媒介動物によって運ばれる疾患または病原体は、以下のとおりである：

1) 蚊類

- ・ ハマダラカ (*Anopheles*) : マラリア、フィラリア症；
- ・ アカイエカ (*Culex*) : 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、別の

蠕虫類の運搬；

- ・ ヤブカ (*Aedes*) : 黄熱病、デング熱、さらなるウイルス性疾患、フィラリア症；
- ・ ブユ (*Simuliidae*) : 蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (*Onchocerca volvulus*)) の運搬；
- ・ チョウバエ (*Psychodidae*) : リーシュマニア症の伝染；

2) シラミ類：皮膚感染、流行性発疹チフス；

3) ノミ類：伝染病、発疹熱、条虫；

4) ハエ類：睡眠病 (トリパノソーマ病)；コレラ、別の細菌性疾患；

5) ダニ類：ダニ症 (*acariosis*)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兔病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症 (*borreliosis*)；

6) マダニ類：ボレリア症 (*borrelioses*)、例えば、ライム病ボレリア (*Borrelia burgdorferi sensu lato.*)、ダットン回帰熱ボレリア (*Borrelia duttoni*)、ダニ媒介脳炎、Q熱 (*Coxiella burnetii*)、バベシア症 (*babesiosis*) (*Babesia canis canis*)、エーリキア症 (*ehrlichiosis*)。

【0394】

本発明に関連して、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類またはアザミウマ類などである。植物ウイルスを運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類および線虫類である。

【0395】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物および／またはヒトに運ぶことが可能な昆虫類およびクモ形類動物、例えば、蚊類 (特に、ヤブカ属 (*Aedes*) の蚊、ハマダラカ属 (*Anopheles*) の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ (*A. gambiae*)、アノフェレス・アラビエンシス (*A. arabiensis*)、アノフェレス・フネストゥス (*A. funestus*)、アノフェレス・ジルス (*A. dirus*) (マラリア)、および、アカイエカ属 (*Culex*) の蚊)、チョウバエ (*Psychodidae*)、例えば、サンチョウバエ (*Phlebotomus*)、ルツォミヤ (*Lutzomyia*)、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類およびマダニ類である。

【0396】

式（I）で表される化合物が抵抗性を打破する（*resistance-breaking*）場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【0397】

式（I）で表される化合物は、疾患の予防および／または媒介動物によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。かくして、本発明のさらなる態様は、例えば、農業において、園芸において、森林内において、庭園やレジャー施設において、および、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式（I）で表される化合物の使用である。

【0398】

工業材料の保護

式（I）で表される化合物は、昆虫類（例えば、コウチュウ目（*Coleoptera*）、ハチ目（*Hymenoptera*）、シロアリ目（*Isoptera*）、チョウ目（*Lepidoptera*）、チャタテムシ目（*Psocoptera*）およびシミ目（*Zygentoma*）の昆虫類）による攻撃または破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

【0399】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙および厚紙、皮革、木材、加工木材製品および塗料などを意味するものと理解される。本発明は、木材を保護するために使用するのが特に好ましい。

【0400】

さらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、少なくとも1種類のさらなる殺虫剤および／または少なくとも1種類の殺菌剤と一緒に使用する。

【0401】

さらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、即時使用可能な（*ready-to-use*）殺有害生物剤の形態にある。このことは、それらが、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能であるということの意味する。有用なさらなる殺虫剤または殺菌剤としては、特に、上記で挙げたものなどがある。

【0402】

驚くべきことに、式（I）で表される化合物は、海水または淡水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備および信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、式（I）で表される化合物は、単独で、または、別の活性化合物と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【0403】

衛生分野における害虫の防除

式（I）で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内保護分野において、衛生保護分野において、および、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間（例えば、住居、工場の通路、オフィス、車両の客室、動物育種施設）において遭遇する昆虫類、クモ形類動物、マダニ類およびダニ類を防除する為に、使用することができる。害虫を防除するために、式（I）で表される化合物は、単独で使用するか、または、別の活性化合物および／または補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。式（I）で表される化合物は、感受性種および抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

【0404】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱（*Arachnida*）のサソリ目（*Scorpiones*）、クモ目（*Araneae*）およびザトウムシ目（*Opiliones*）の害虫、ムカデ綱（*Chilopoda*）およびヤスデ綱（*Diplopoda*）の害虫、昆虫綱（*Insecta*）のゴキブリ目（*Blattodea*）、コウチュウ目（*Co*

10

20

30

40

50

leoptera)、ハサミムシ目(Dermaptera)、ハエ目(Diptera)、カメムシ亜目(Heteroptera)、ハチ目(Hymenoptera)、シロアリ目(Isoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、シラミ目(Phthiraptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)、バッタ目(SaltatoriaまたはOrthoptera)、ノミ目(Siphonaptera)およびシミ目(Zygentoma)の害虫、並びに、軟甲綱(Malacostraca)のワラジムシ目(Isopoda)の害虫などをあげることができる。

【0405】

施用は、例えば、エーロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレーおよび噴霧スプレー、自動霧化システム(automatic fogging system)、噴霧器(fogger)、泡、ゲル、セルローズ製またはプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲルおよび膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システムまたは受動型蒸発システム、防虫紙(moth papers)、防虫バッグ(moth bags)および防虫ゲル(moth gels)において実施するか、または、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、または、ベイトステーションで実施する。

【0406】

分析的測定

以下に記載されている分析的測定の手順は、明細書の個々の部分において特定の分析的測定に関する手順の個別的な記載がなされていない場合、本明細書全体における全ての情報に関する。

【0407】

質量分析法

酸性クロマトグラフィー条件下でのLC-MSを用いた $[M+H]^+$ または M^- の測定は、溶離液として、1リットルのアセトニトリル当たり1mLのギ酸および1リットルのミリポア水当たり0.9mLのギ酸を用いて実施した。「Zorbax Eclipse Plus C18 50mm×2.1mm、1.8μm カラム」を、カラムオープン温度55℃で使用した。

【0408】

機器：

LC-MS3：SQD2質量分析計とSample Managerサンプルチェンジャーが付いているWaters UPLC。直線勾配：0.0→1.70分 10%アセトニトリル→95%アセトニトリル、1.70→2.40分 一定95%アセトニトリル、流量：0.85mL/分。

【0409】

LC-MS6およびLC-MS7：Agilent 1290LC、Agilent MSD質量分析計、HTS PALサンプルチェンジャー。直線勾配：0.0→1.80分 10%アセトニトリル→95%アセトニトリル、1.80→2.50分、一定95%アセトニトリル、流量：1.0mL/分。

【0410】

中性クロマトグラフィー条件下でのLC-MSを用いた $[M+H]^+$ の測定は、溶離液として、アセトニトリルおよびミリポア水(79mg/Lの炭酸アンモニウム含有)を使用して実施した。

【0411】

機器：

LC-MS4：QDA質量分析計とFTNサンプルチェンジャーが付いているWaters IClass Acquity(カラム Waters Acquity 1.7μm 50mm×2.1mm、カラムオープン温度：45℃)。直線勾配：0.0→2.10分 10%アセトニトリル→95%アセトニトリル、2.10→3.00分 一定95%アセトニトリル、流量：0.7mL/分。

【0412】

LC-MS5: MSD質量分析計とHTS PALサンプルチェンジャーが付いているAgilent 1100 LC System (カラム: Zorbax XDB C18 1.8 μ m 50mm $\times$ 4.6mm、カラムオープン温度: 55 $^{\circ}$ C)。直線勾配: 0.0 $\rightarrow$ 4.25分 10%アセトニトリル $\rightarrow$ 95%アセトニトリル、4.25 $\rightarrow$ 5.80分 一定95%アセトニトリル、流量: 2.0mL/分。

【0413】

全ての場合において、保持時間インデックスは、3個 $\sim$ 16個の炭素を有する同族の一連の直鎖アルカン-2-オンの較正測定から決定し、ここで、最初のアルカノンに対するインデックスを300に設定し、最後のアルカノンに対するインデックスを1600に設定し、そして、連続するアルカノンの値の間で線形補間を実施した。

10

【0414】

^1H NMRスペクトルの測定は、1.7mm TCIサンプルヘッドを備えた「Bruker Avance III 400MHz 分光計」で、標準(0.00ppm)としてテトラメチルシランを使用して、溶媒 CD_3CN 、 CDCl_3 または d_6 -DMSOの中の溶液で実施した。あるいは、5mm CPNMPサンプルヘッドを備えた「Bruker Avance III 600MHz 分光計」または5mm TCIサンプルヘッドを備えた「Bruker Avance NEO 600MHz 分光計」を当該測定に使用した。一般に、当該測定は、サンプルヘッド温度298Kで実施した。異なる測定温度を使用した場合、そのことは個別に注記されている。

20

【0415】

NMRピークリスト法

選択された実施例の ^1H NMRデータは、 ^1H NMRピークリストの形態で示されている。各シグナルピークに対して、最初に δ 値(ppm)が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関する δ 値-シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

【0416】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

δ_1 (強度 $_1$) ; δ_2 (強度 $_2$) ; . . . ; δ_i (強度 $_i$) ; . . . ; δ_n (強度 $_n$) 。

【0417】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ(cm)と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピークまたは該シグナルの中央およびそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

30

【0418】

^1H NMRスペクトルの化学シフトを較正するために、テトラメチルシランを使用するか、サンプルがテトラメチルシランを含まない場合、その溶媒の化学シフトを使用する。従って、ある場合には、NMRピークリストは、テトラメチルシランのピークを含み得る。

【0419】

^1H NMRピークのリストは、従来の ^1H NMRの表現と類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

40

【0420】

さらに、それらは、従来の ^1H NMRの表現のように、溶媒のシグナル、本発明に係る化合物の立体異性体(これは、本発明により提供されてもよい)のシグナルおよび/または不純物のピークのシグナルも示し得る。

【0421】

NMR溶媒シグナル、問題の溶媒中のテトラメチルシランピークおよび水シグナルは、それらの記載された強度値が非常に高くなり得るので、相対強度の較正から除外される。

【0422】

本発明の化合物の(立体)異性体のピークおよび/または不純物のピークは通常、本発

50

明の化合物（例えば、 $>90\%$ の純度で）のピークよりも平均して低い強度を有する。

【0423】

そのような立体異性体および／または不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、「副産物の指紋 (by-product fingerprints)」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【0424】

目標化合物のピークを既知方法 (MestrelC、ACDシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用) で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、 ^1H NMRの慣習的な解釈における関連するピークのピーキングに類似しているであらう。

10

【0425】

JCAMPファイルでは使用される溶媒、分光計の測定周波数、および分光計モデルはそれぞれパラメータ「溶媒」、「周波数観察」、および「分光計／データシステム」を使用して見つけることができる。

【0426】

^{13}C NMRデータは、広帯域分離 ^{13}C NMRスペクトルを用いたピークリストとしての ^1H NMRデータと同様に記述される。ここでも、NMR溶媒シグナルおよびテトラメチルシランは、これらのシグナルが非常に高い強度値を有し得るので、相対強度の較正から除外される。

20

【0427】

^1H NMRピークリストのさらなる詳細は、Research Disclosure Database Number 564025の中の「Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications」に見出すことができる。

【0428】

log P値

log P値は、「EEC Directive 79/83 Annex V. A8」に従い、以下の方法を使用して、逆相カラム (C18) でのHPLC (高性能液体クロマトグラフィー) によって測定した：

30

【0429】

[a] log P値は、水中の0.9 mL/Lギ酸とアセトニトリル中の1.0 mL/Lギ酸を移動相として使用した酸性範囲内におけるLC-UV測定により決定した (アセトニトリル10%からアセトニトリル95%までの直線勾配)。

【0430】

[b] log P値は、水とアセトニトリル中の炭酸アンモニウム79 mg/Lを移動相として中性域でLC-UVにより測定する (10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配)。

【0431】

較正は、既知のlog P値を有する直鎖アルカン-2-オン (3~16個の炭素原子を有する) の同族シリーズを用いて行った。連続するアルカノン間の値は、線形回帰によって決定される。

40

【0432】

NMRスペクトル (実施例III-C-1、XLIII-1、XLII-1、XLI-1、XL. 1、XXXIX-1、XXXVIII-1) の測定は、Bruker AVANCE DRX 500 MHzおよびBruker AVANCE III 400 MHz機器で行った。

【実施例】

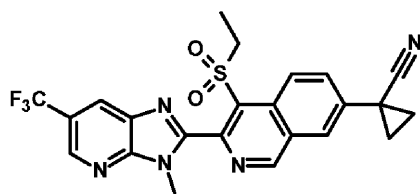
【0433】

調製実施例：

50

1- [4-エチルスルホニル-3- [3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル] -7-イソキノリル] シクロプロパンカルボニトリル (I-1)

【化20】



10

87 mg (0.18 mmol) の 1- [4-エチルスルファニル-3- [3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル] -7-イソキノリル] シクロプロパンカルボニトリルを 6 ml のジクロロメタンに溶解し、43.5 mg (0.94 mmol) のギ酸および 128.6 mg (1.32 mmol) の過酸化水素を室温で添加し、次いで混合物を室温で 16 時間攪拌した。混合物を水で希釈し、20% 亜硫酸水素ナトリウム溶液を添加し、混合物を 30 分間攪拌し、次いで 20% 炭酸水素ナトリウム溶液 2 ml を添加した。有機相を分離し、水相をジクロロメタンで 2 回抽出し、次いで、合わせた有機相を減圧下で溶媒を除去した。残渣を、移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチル勾配を使用するカラムクロマトグラフィーによって精製した。

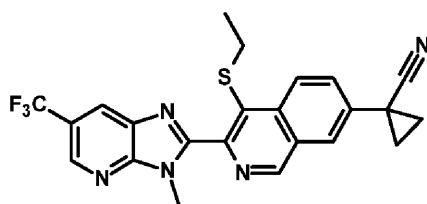
20

(logP (中性): 3.02; MH^+ : 486; ^1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1.27 (t, 3H), 1.79-1.82 (m, 2H), 1.99-2.02 (m, 2H), 3.78-3.83 (m, 2H), 8.02 (d, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.88 (s, 1H), 8.95 (d, 1H), 9.83 (s, 1H).

【0434】

1- [4-エチルスルファニル-3- [3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル] -7-イソキノリル] シクロプロパンカルボニトリル

【化21】



30

アルゴン下の 3 ml のジメチルホルムアミド中の 140 mg (0.28 mmol) の 2- [4-エチルスルファニル-3- [3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル] -7-イソキノリル] アセトニトリルおよび 108 mg (0.57 mmol) の 1, 2-ジブromoエタンの初期装入物に、34.2 mg (0.85 mmol) の水素化ナトリウムを 0℃で添加し、混合物を 0℃で 1 時間攪拌した。続いて、反応混合物を飽和塩化アンモニウム溶液に加え、酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機相を水および塩化ナトリウム溶液でそれぞれ 1 回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で溶媒を除去した。残渣を、移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチル勾配を使用するカラムクロマトグラフィーによって精製した。

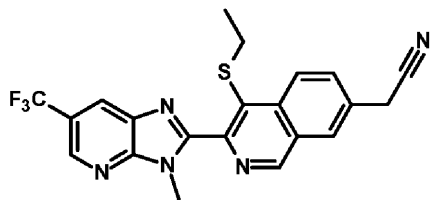
40

(logP (中性): 3.67; MH^+ : 454; ^1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 0.97 (t, 3H), 1.77-1.80 (m, 2H), 1.95-1.99 (m, 2H), 2.83 (q, 2H), 3.76 (s, 3H), 7.96 (d, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.62-8.65 (m, 2H), 8.87 (s, 1H), 9.54 (s, 1H).

【0435】

50

2- [4-エチルスルファニル-3- [3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル] -7-イソキノリル] アセトニトリル
【化22】



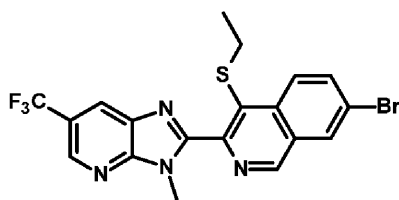
アルゴン下の12mlのDMFおよび2mlの水の混合物中の206mg (0.39mmol)の7-ブロモ-4-エチルスルファニル-3- [3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル] イソキノリン、390.4mg (1.96mmol)の4-イソオキサゾールボロン酸ピナコールエステルおよび417.2mg (2.74mmol)のフッ化セシウムの初期装入物に、57.4mg (0.07mmol)の1,1-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセンジクロロパラジウム (II)を加え、混合物をアルゴン下、130~135℃で16時間撹拌した。その後、溶媒を減圧留去し、残渣を移動相として水/アセトニトリル勾配に0.1ml/lギ酸を加えたものを用いてカラムクロマトグラフィーにより精製した。

【0436】

中間体を、37mgのフッ化カリウムの存在下、8mlの水および2mlのメタノールの混合物中で、90℃で1時間撹拌した。溶媒を留去した後、残渣をそれぞれ10mlの水とジクロロメタンの混合物に加えた。有機相を分離し、水相をジクロロメタンで2回抽出し、合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、次いで溶媒を減圧下で留去した。
(logP (中性): 3.22; MH^+ : 428; ^1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 0.98 (t, 3H), 2.84 (q, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.42 (s, 2H), 8.02 (d, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.65-8.67 (m, 2H), 8.87 (s, 1H), 9.57 (s, 1H).

【0437】

7-ブロモ-4-エチルスルファニル-3- [3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル] イソキノリン
【化23】

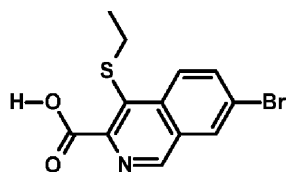


500mg (2.61mmol)のN2-メチル-5- (トリフルオロメチル) ピリジン-2, 3-ジアミン、1.021g (3.27mmol)の7-ブロモ-4-エチルスルファニルイソキノリン-3-カルボン酸および501mg (2.61mmol)の1-エチル-3- (3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 ($EDCI \cdot HCl$)を9mlのピリジンに溶解し、120℃で20時間撹拌した。その後、溶媒を減圧留去し、残渣を水と混合し、酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を再び減圧下で留去した。残渣を50mlの水と混合し、9時間加熱沸騰させた。反応混合物を水と混合し、沈殿した固体を吸引濾過し、水で洗浄し、乾燥した。
(logP (中性): 4.36; MH^+ : 467; ^1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 0.98 (t, 3H), 2.84 (q, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.42 (s, 2H), 8.19 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.6 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.87 (s, 1H), 9.51 (s, 1H).

【0438】

7-ブロモ-4-エチルスルファニルイソキノリン-3-カルボン酸（実施例：I I I - C - 1）

【化 2 4】



50 ml の無水テトラヒドロフラン（THF）中の 6.60 g（20.2 mmol）の 7-ブロモ-4-エチルスルファニルイソキノリン-3-カルボン酸メチルの溶液に、0.867 g（20.7 mmol）の水酸化リチウム水和物（LiOH×H₂O）および 70 ml の蒸留水を加え、室温で 6 時間撹拌した。テトラヒドロフランを留去し、水溶液を硫酸水素ナトリウム（NaHSO₄）で pH 4 に調整した。沈殿した固体を濾別し、200 ml の酢酸エチルに溶解した。溶液を硫酸ナトリウムで乾燥し、次いで溶媒を減圧下で留去した。

10

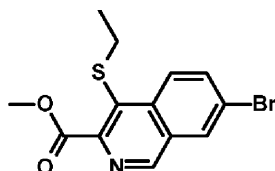
¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1.08 (t, 3H), 2.89 (q, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.44 (d, 1H), 8.56 (s, 1H), 9.32 (s, 1H), 13.57 (s, 1H).

【0 4 3 9】

7-ブロモ-4-エチルスルファニルイソキノリン-3-カルボン酸メチル（実施例：X L I I I - 1）

20

【化 2 5】



前の段階から得られた 7-ブロモ-4-スルファニルイソキノリン-3-カルボン酸メチルの溶液に、20.2 g（130 mmol）のヨウ化エチルを加え、反応混合物を室温で 16 時間撹拌した。その後、溶媒を減圧留去し、残渣を 200 ml の酢酸エチルに溶解した。有機相を 100 ml の水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾別し、溶媒を再び減圧下で留去した。残渣を、溶離液としてヘキサン／酢酸エチル（7：3）を用いるカラムクロマトグラフィーによって精製した。

30

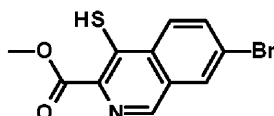
¹H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 1.17 (t, 3H), 2.88 (q, 2H), 4.02 (s, 3H), 7.90 (d, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.49 (d, 1H), 9.11 (s, 1H).

【0 4 4 0】

7-ブロモ-4-スルファニルイソキノリン-3-カルボン酸メチル（実施例：X L I I - 1）

【化 2 6】

40



アルゴン下、40 ml のメタノール中の 12.0 g（32.5 mmol）の 7-ブロモ-4-（ジメチルカルバモイルスルファニル）イソキノリン-3-カルボン酸メチルの溶液に、ナトリウムメトキシドのメタノール溶液（2.25 g（97.8 mmol）のナトリウムを 100 ml のメタノールに添加することによって調製した）を添加した。反応混合物を 60 °C に 8 時間加熱した。続いて、溶液を室温に冷却し、さらに精製することなく

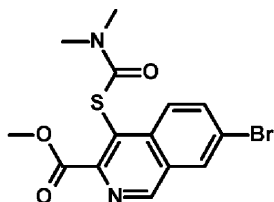
50

次の段階で使用した。

【0441】

7-ブロモ-4-(ジメチルカルバモイルスルファニル)イソキノリン-3-カルボン酸メチル(実施例: XLI-1)

【化27】



10

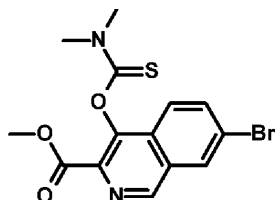
アルゴン下、180 ml のジフェニルエーテル中の 18.0 g (48.7 mmol) の 7-ブロモ-4-(ジメチルカルバモチオイルオキシ)イソキノリン-3-カルボン酸メチルの溶液を 190 °C で 6 時間攪拌し、次いで室温に冷却し、1500 ml のヘキサンに加えた。生成物を沈殿物の濾過により得た。

¹H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 2.99 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 7.86 (d, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.26 (d, 1H), 9.20 (s, 1H).

【0442】

7-ブロモ-4-(ジメチルカルバモチオイルオキシ)イソキノリン-3-カルボン酸メチル(実施例: XL-1)

【化28】



20

250 ml の DMF 中の 16.8 g (59.6 mmol) の 7-ブロモ-4-ヒドロキシイソキノリン-3-カルボン酸メチルおよび 26.7 g (238 mmol) の 1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)の溶液に、9.60 g (77.7 mmol) の塩化ジメチルチオカルバモイルを少量ずつ添加した。反応混合物を室温で 16 時間攪拌し、次いで 1 リットルの水に添加した。水相を酢酸エチル 400 ml ずつで 3 回抽出し、合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、最後に溶媒を減圧留去した。

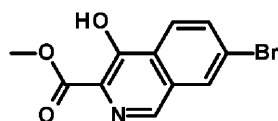
30

¹H-NMR (500 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 3.54 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 7.87 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 8.25 (s, 1H), 9.14 (s, 1H).

【0443】

7-ブロモ-4-ヒドロキシイソキノリン-3-カルボン酸メチル(実施例: XXXIX-1)

【化29】



40

390 ml の DMSO 中の 39.0 g (82.9 mmol) の 4-ブロモ-2-[[[2-メトキシ-2-オキソエチル](p-トリルスホニル)アミノ]メチル]安息香酸メチルの溶液に、メタノール中のナトリウムメトキシドの溶液(5.90 g (257 mmol) のナトリウムを 80 ml のメタノールに添加することによって調製した)を滴下し

50

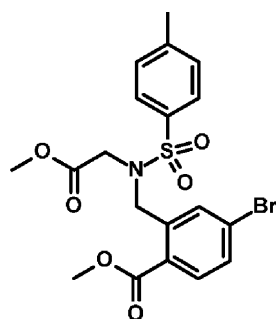
、内部温度を25℃未満に保った。反応混合物を室温で5時間攪拌し、次いで2 lの水に添加し、酢酸エチルの毎回300 mlで3回抽出した。合わせた有機相を塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。残渣をメタノールで洗浄することにより生成物を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (500 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 4.10 (s, 3H), 7.86 (dd, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.28 (d, 1H), 8.74 (s, 1H), 11.76 (s, 1H).

【0444】

4-ブロモ-2-[[(2-メトキシ-2-オキソエチル) (p-トリルスルホニル) アミノ] メチル] 安息香酸メチル (実施例: XXXVII-1)

【化30】



39.0 g (127 mmol) の4-ブロモ-2- (ブロモメチル) 安息香酸メチル、33.8 g (139 mmol) の (トルエン-4-スルホニルアミノ) 酢酸メチル、28.5 g (190 mmol) のヨウ化ナトリウムおよび26.2 g (190 mmol) の炭酸カリウムの溶液を室温で16時間攪拌し、次いで3 lの水に加えた。水相を酢酸エチル900 mlずつで2回抽出し、合わせた有機相を約500 mlに濃縮し、塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。残渣をメチル tert-ブチルエーテル (MTBE) で洗浄することにより、生成物を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 2.41 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 3.97 (s, 2H), 4.83 (s, 2H), 7.28 (m, 2H), 7.44 (d, 1H), 7.71 (m, 4H).

【0445】

実施例と同様におよび上記の調製方法に準じて、以下の式 (I) の化合物を得ることができる：

【0446】

10

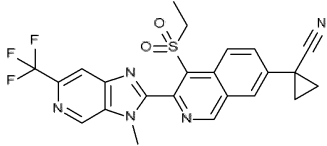
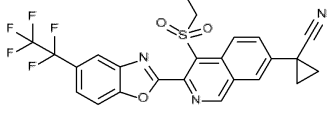
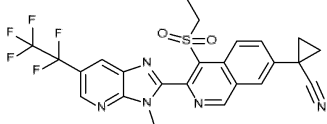
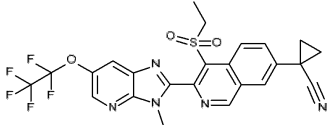
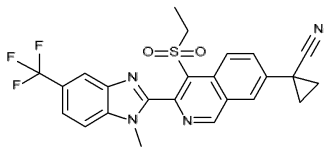
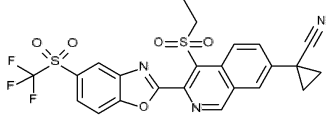
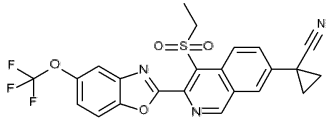
20

30

40

50

【表 1】

実施例	構造
I-2	
I-3	
I-4	
I-5	
I-6	
I-7	
I-8	

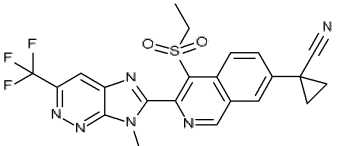
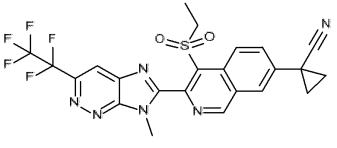
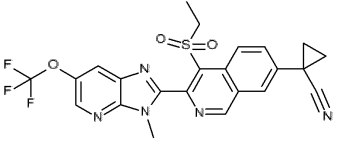
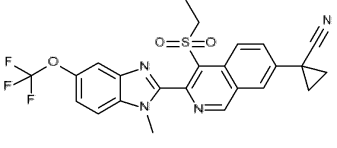
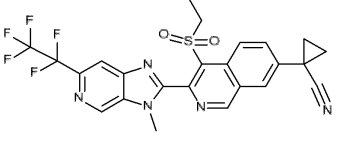
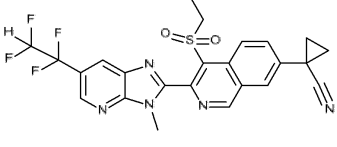
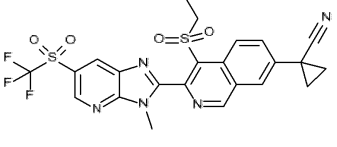
10

20

30

40

50

I-9	
I-10	
I-11	
I-12	
I-13	
I-14	
I-15	

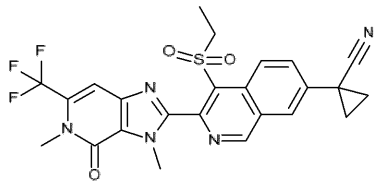
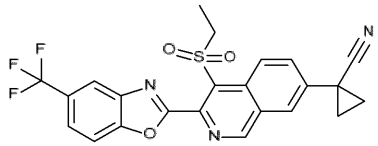
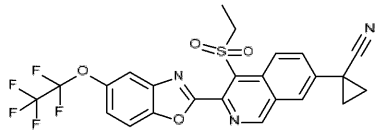
10

20

30

40

50

I-16	
I-17	
I-18	

¹H NMRスペクトル

【 0 4 4 7 】

【表 2】

I-2: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.8228 (4.3); 9.2778 (3.9); 8.9542 (2.0); 8.9313 (2.2); 8.5247 (2.5); 8.5195 (2.6); 8.3162 (0.4); 8.2495 (4.0); 8.0380 (1.6); 8.0325 (1.5); 8.0150 (1.5); 8.0095 (1.5); 3.8782 (16.0); 3.7824 (1.0); 3.7650 (1.0); 3.3250 (65.8); 2.6758 (0.7); 2.6713 (1.0); 2.6667 (0.7); 2.5248 (2.8); 2.5200 (4.4); 2.5112 (62.4); 2.5069 (127.5); 2.5023 (167.2); 2.4978 (119.8); 2.4934 (57.4); 2.3337 (0.7); 2.3291 (1.0); 2.3246 (0.7); 2.0748 (0.8); 2.0271 (1.0); 2.0137 (2.9); 2.0066 (3.2); 1.9950 (1.2); 1.8210 (1.3); 1.8085 (3.0); 1.8015 (3.1); 1.7877 (1.0); 1.2692 (3.8); 1.2506 (8.5); 1.2321 (3.8); 0.1459 (0.5); 0.0080 (3.7); -0.0001 (116.8); -0.0085 (3.9); -0.1495 (0.5)	
I-3: ¹H-NMR(400.2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.8283 (7.5); 8.8941 (3.4); 8.8713 (3.8); 8.5305 (4.5); 8.5253 (4.5); 8.3165 (0.5); 8.3072 (4.2); 8.3040 (4.2); 8.1733 (3.3); 8.1518 (3.9); 8.0567 (2.7); 8.0513 (2.6); 8.0338 (2.6); 8.0283 (2.6); 7.8866 (2.3); 7.8831 (2.3); 7.8650 (2.0); 7.8612 (2.0); 3.7969 (1.9); 3.7784 (6.3); 3.7599 (6.4); 3.7414 (1.9); 3.3269 (110.4); 2.6765 (0.7); 2.6719 (1.0); 2.6673 (0.7); 2.5254 (3.1); 2.5206 (4.8); 2.5119 (58.8); 2.5074 (117.8); 2.5029 (154.2); 2.4983 (112.2); 2.4938 (54.2); 2.3343 (0.7); 2.3297 (0.9); 2.3252 (0.7); 2.3210 (0.3); 2.0314 (1.9); 2.0181 (5.2); 2.0109 (5.7); 1.9992 (2.4); 1.8315 (2.4); 1.8189 (5.4); 1.8119 (5.5); 1.7979 (1.8); 1.2901 (7.2); 1.2716 (16.0); 1.2531 (7.0); 1.2341 (0.5); 0.0080 (1.8); -0.0002 (53.1); -0.0085 (1.7)	
I-4: ¹H-NMR(600.1 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.8246 (3.8); 8.9552 (1.8); 8.9400 (2.0); 8.8072 (2.1); 8.8040 (2.2); 8.5685 (2.1); 8.5653 (2.2); 8.5206 (2.2); 8.5169 (2.3); 8.0366 (1.4); 8.0329 (1.4); 8.0213 (1.4); 8.0176 (1.5); 4.0359 (0.8); 4.0241 (0.8); 3.8160 (0.4); 3.8049 (0.9); 3.7925 (1.0); 3.7825 (16.0); 3.3222 (82.4); 2.6150 (0.4); 2.5240 (0.9); 2.5209 (1.1); 2.5178 (1.0); 2.5090 (19.2); 2.5060 (42.6); 2.5029 (59.9); 2.4999 (43.2); 2.4969 (19.8); 2.3869 (0.4); 2.0198 (0.9); 2.0110 (2.8); 2.0065 (3.0);	

10

20

30

40

50

I-1: ¹ H-NMR(600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.8124 (3.8); 8.9544 (1.7); 8.9391 (2.0); 8.5658 (1.9); 8.5618 (1.9); 8.5112 (2.2); 8.5076 (2.2); 8.3315 (2.0); 8.3278 (1.9); 8.0291 (1.4); 8.0254 (1.4); 8.0138 (1.4); 8.0101 (1.4); 3.8226 (0.4); 3.8105 (1.0); 3.7984 (1.0); 3.7522 (16.0); 3.3192 (99.3); 2.6174 (0.4); 2.6143 (0.5); 2.6113 (0.3); 2.5233 (1.0); 2.5202 (1.3); 2.5171 (1.2); 2.5083 (23.8); 2.5053 (53.6); 2.5022 (76.0); 2.4992 (54.6); 2.4962 (24.7); 2.3893 (0.4); 2.3861 (0.5); 2.3831 (0.3); 2.0156 (1.0); 2.0068 (2.8); 2.0023 (3.0); 1.9943 (1.1); 1.9888 (1.0); 1.8136 (1.2); 1.8050 (2.8); 1.8004 (3.0); 1.7913 (1.0); 1.3980 (0.6); 1.2768 (3.6); 1.2645 (8.1); 1.2521 (3.6); 1.1757 (0.5); 0.0054 (1.9); -0.0001 (73.0); -0.0057 (2.2)
I-6: ¹ H-NMR(600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.7953 (3.6); 9.7947 (3.6); 8.9671 (1.8); 8.9519 (1.9); 8.4978 (2.3); 8.4942 (2.2); 8.0689 (2.0); 8.0120 (1.5); 8.0083 (1.4); 7.9967 (1.5); 7.9930 (1.5); 7.9388 (1.5); 7.9246 (1.7); 7.7139 (1.2); 7.7112 (1.2); 7.6995 (1.1); 7.6970 (1.1); 3.8263 (0.6); 3.7753 (16.0); 3.3193 (91.2); 2.6171 (0.4); 2.6141 (0.5); 2.6111 (0.4); 2.5231 (1.1); 2.5200 (1.4); 2.5169 (1.3); 2.5081 (25.4); 2.5051 (56.6); 2.5020 (79.8); 2.4989 (56.6); 2.4959 (25.2); 2.3889 (0.3); 2.3858 (0.5); 2.3827 (0.3); 2.0108 (0.9); 2.0020 (2.8); 1.9975 (3.0); 1.9887 (2.1); 1.8111 (1.2); 1.8024 (2.7); 1.7979 (3.0); 1.7887 (0.9); 1.2796 (3.6); 1.2672 (8.1); 1.2548 (3.6); 1.1874 (0.4); 1.1755 (0.7); 1.1637 (0.3); 0.0054 (2.2); -0.0001 (81.6); -0.0057 (2.4)
I-7: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.8458 (7.6); 8.8851 (3.4); 8.8622 (3.7); 8.7749 (4.3); 8.7707 (4.4); 8.5449 (4.4); 8.5397 (4.5); 8.3932 (3.3); 8.3714 (6.3); 8.3306 (3.1); 8.3262 (3.1); 8.3160 (0.7); 8.3089 (1.6); 8.3043 (1.6); 8.0687 (2.7); 8.0633 (2.7); 8.0458 (2.6); 8.0404 (2.6); 3.7952 (1.8); 3.7767 (6.1); 3.7582 (6.2); 3.7397 (1.9); 3.3284 (151.2); 2.6801 (0.5); 2.6760 (1.1); 2.6714 (1.6); 2.6669 (1.2); 2.6624 (0.6); 2.5248 (5.1); 2.5114 (91.8); 2.5070 (185.3); 2.5024 (247.1); 2.4979 (184.4); 2.4934 (92.4); 2.3384 (0.5); 2.3338 (1.1); 2.3293 (1.6); 2.3248 (1.2); 2.0865 (4.3); 2.0365 (1.9); 2.0231 (5.1); 2.0159 (5.7); 2.0043 (2.4); 1.8348 (2.4); 1.8221 (5.4); 1.8151 (5.6); 1.8012 (1.8); 1.3512 (0.6); 1.2981 (0.8); 1.2850 (7.1); 1.2666 (16.0); 1.2591 (1.9); 1.2480 (7.2); 1.2332 (1.4); 0.1458 (0.5); 0.0080 (5.1); -0.0002 (137.1); -0.0085 (5.4); -0.1497 (0.6)
I-8: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.8150 (8.7); 8.8922 (3.8); 8.8694 (4.2); 8.5207 (5.0); 8.5156 (5.2); 8.3160 (0.6); 8.0489 (2.9); 8.0435 (2.9); 8.0334 (5.8); 8.0260 (3.0); 8.0206 (3.0); 8.0111 (6.2); 7.9954 (3.8); 7.9922 (4.0); 7.5864 (2.2); 7.5823 (2.2); 7.5644 (1.9); 7.5600 (2.0); 3.7918 (2.0); 3.7734 (6.8); 3.7549 (6.9); 3.7364 (2.1); 3.3244 (197.0); 2.6754 (1.6); 2.6708 (2.2); 2.6664 (1.7); 2.5241 (6.4); 2.5064 (263.7); 2.5020 (350.2); 2.4976 (265.8); 2.3332 (1.6); 2.3289 (2.2); 2.3245 (1.6); 2.0270 (2.1); 2.0135 (5.9); 2.0063 (6.5); 1.9946 (2.7); 1.8270 (2.6); 1.8145 (6.1); 1.8075 (6.3); 1.7936 (2.0); 1.5877 (0.5); 1.2886 (7.4); 1.2701 (16.0); 1.2516 (7.4); 1.2346 (1.1); 0.1457 (0.8); 0.0078 (5.4); -0.0002 (159.7); -0.0082 (8.1); -0.1500 (0.8)
I-9: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.8632 (4.3); 8.9378 (1.9); 8.9150 (2.1); 8.7196 (6.5); 8.5558 (2.5); 8.5506 (2.5); 8.3159 (0.5); 8.0663 (1.5); 8.0609 (1.5); 8.0434 (1.5); 8.0379 (1.5); 5.7562 (0.5); 3.9438 (16.0); 3.7778 (0.6); 3.7592 (1.7); 3.7405 (1.7); 3.7228 (0.6); 3.3252 (162.8); 2.6757 (1.2); 2.6711 (1.6); 2.6666 (1.2); 2.6621 (0.6); 2.5245 (5.0); 2.5197 (7.6); 2.5111 (92.7); 2.5067 (188.4); 2.5021 (250.5); 2.4976 (184.5); 2.4931 (91.3); 2.3379 (0.5); 2.3335 (1.1); 2.3290 (1.6); 2.3245 (1.1); 2.0383 (1.0); 2.0248 (2.9); 2.0178 (3.2); 2.0061 (1.3); 1.8286 (1.3); 1.8161 (3.0); 1.8091 (3.1); 1.7953 (1.0); 1.3509 (0.6); 1.2983 (0.3); 1.2688 (4.0); 1.2584 (1.0); 1.2503 (8.9); 1.2318 (5.5); 0.8535 (0.4); 0.1460 (0.4); 0.0080 (3.0); -0.0002 (96.7); -0.0084 (3.5); -0.1497 (0.4)
I-10: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.8657 (4.8); 8.9369 (2.1); 8.9139 (2.3); 8.7628 (6.5); 8.5569 (2.8); 8.5519 (2.8); 8.0684 (1.6); 8.0631 (1.5); 8.0454 (1.5); 8.0401 (1.5); 3.9469 (16.0); 3.7783 (0.7); 3.7603 (1.9); 3.7419 (1.9); 3.7236 (0.7); 3.3261 (77.6); 2.6760 (0.6); 2.6716 (0.8); 2.6674 (0.6); 2.5246 (2.8); 2.5070 (94.6); 2.5026 (122.9); 2.4983 (92.3); 2.3337 (0.6); 2.3295 (0.7); 2.3251 (0.6); 2.0866 (2.1); 2.0400 (1.1); 2.0264 (3.2); 2.0194 (3.6); 2.0076 (1.4); 1.8296 (1.4); 1.8172 (3.3); 1.8102 (3.4); 1.7963 (1.1); 1.2686 (4.0); 1.2500 (8.6); 1.2316 (4.0); 0.0076 (1.3); -0.0002 (35.9); -0.0083 (1.6)
I-11: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.8124 (4.3); 8.9575 (2.0); 8.9346 (2.2); 8.5970 (2.1); 8.5920 (2.2); 8.5116 (2.5); 8.5065 (2.5); 8.3410 (2.0); 8.3377 (2.0); 8.0319 (1.5); 8.0264 (1.5); 8.0089 (1.5); 8.0034 (1.5); 3.8302 (0.6); 3.8120 (1.6); 3.7936 (1.7); 3.7759 (0.6); 3.7465 (16.0); 3.3214 (42.1); 2.6754 (0.6); 2.6711 (0.8); 2.6667 (0.6); 2.5246 (2.4); 2.5109 (52.4); 2.5066 (107.2); 2.5022 (141.0); 2.4977 (101.2); 2.4934 (49.0); 2.3334 (0.6); 2.3291 (0.8); 2.3244 (0.6); 2.0224 (1.0); 2.0089 (3.0); 2.0018 (3.2); 1.9892 (2.2); 1.8180 (1.3); 1.8054 (3.0); 1.7984 (3.1); 1.7846 (1.0); 1.3976 (1.6); 1.2821 (3.7); 1.2636 (8.2); 1.2450 (3.7); 1.1752 (0.6); -0.0002 (2.3)
I-12: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.7838 (4.5); 8.9686 (2.0); 8.9456 (2.2); 8.4894 (2.6); 8.4843 (2.6); 8.0103 (1.6); 8.0049 (1.5); 7.9873 (1.5); 7.9818 (1.5); 7.8272 (2.6); 7.8051 (2.9); 7.6972 (2.2); 7.3977 (1.2); 7.3756 (1.0); 7.3725 (1.0); 3.8386 (1.1); 3.8206 (1.1); 3.7430 (16.0); 3.3238 (83.0); 2.6757 (0.4); 2.6712 (0.6); 2.6668 (0.4); 2.5246 (1.8); 2.5111 (39.2); 2.5068 (79.6); 2.5023 (104.1); 2.4978 (73.9); 2.4935 (35.3); 2.3334 (0.4); 2.3290 (0.6); 2.3247 (0.4); 2.0146 (1.0); 2.0012 (3.1); 1.9940 (3.4); 1.9891 (2.0); 1.9825 (1.4); 1.8130 (1.4); 1.8005 (3.2); 1.7935 (3.2); 1.7797 (1.0); 1.3976 (0.9); 1.2822 (3.8); 1.2637 (8.2); 1.2452 (3.7); 1.1930 (0.3); 1.1752 (0.7); 1.1574 (0.3); -0.0002 (1.6)
I-13: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.8225 (4.3); 9.2995 (4.0); 8.9533 (2.0); 8.9303 (2.2); 8.5238 (2.5); 8.5186 (2.6); 8.2730 (4.0); 8.2711 (4.3); 8.0400 (1.6); 8.0346 (1.5); 8.0170 (1.5); 8.0116 (1.5); 3.8778 (16.0); 3.7817 (1.0); 3.7646 (1.0); 3.3190 (50.9); 2.6752 (0.7); 2.6707 (1.1); 2.6662 (0.8); 2.5242 (2.9); 2.5195 (4.5); 2.5107 (64.5); 2.5063 (134.0); 2.5018 (177.8); 2.4972 (127.7); 2.4927 (61.7); 2.3376 (0.4); 2.3332 (0.8); 2.3286 (1.1); 2.3241 (0.8); 2.0740 (0.4); 2.0269 (1.0); 2.0134 (2.9); 2.0064 (3.2); 1.9947 (1.2); 1.8209 (1.3); 1.8083 (3.0); 1.8013 (3.1); 1.7874 (1.0); 1.2689 (3.8); 1.2503 (8.6); 1.2318 (3.8); 0.0080 (2.1); -0.0002 (67.6); -0.0085 (2.3)
I-14: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO):

10

20

30

40

50

δ = 9.8205 (4.5); 9.2622 (4.0); 8.9549 (1.9); 8.9318 (2.2); 8.5215 (2.6); 8.5165 (2.6); 8.3142 (0.7); 8.1618 (4.2); 8.1601 (4.2); 8.0361 (1.5); 8.0308 (1.5); 8.0132 (1.5); 8.0077 (1.4); 7.1851 (0.4); 7.0675 (0.4); 7.0544 (0.7); 7.0389 (0.4); 6.9227 (0.4); 4.0381 (0.6); 4.0202 (0.6); 3.8709 (16.0); 3.7867 (1.0); 3.7678 (1.1); 3.3260 (561.8); 2.6754 (1.7); 2.6709 (2.4); 2.6664 (1.8); 2.6618 (0.8); 2.5243 (7.5); 2.5194 (11.6); 2.5108 (156.5); 2.5065 (318.1); 2.5020 (415.9); 2.4975 (295.9); 2.4931 (141.7); 2.3377 (0.9); 2.3332 (1.8); 2.3288 (2.4); 2.3242 (1.8); 2.0258 (1.0); 2.0123 (3.1); 2.0054 (3.4); 1.9934 (1.4); 1.9886 (2.8); 1.8209 (1.4); 1.8084 (3.1); 1.8013 (3.2); 1.7876 (1.1); 1.3979 (0.8); 1.2717 (3.9); 1.2532 (8.5); 1.2346 (4.1); 1.1928 (0.7); 1.1750 (1.3); 1.1573 (0.7); -0.0002 (6.6)	
I-15: $^1\text{H-NMR}$ (400.2 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.8441 (4.2); 9.1640 (3.0); 9.1587 (3.1); 8.9756 (2.6); 8.9704 (2.5); 8.9468 (1.9); 8.9239 (2.1); 8.5403 (2.5); 8.5351 (2.5); 8.0538 (1.5); 8.0483 (1.5); 8.0308 (1.5); 8.0253 (1.5); 4.0557 (0.5); 4.0379 (1.4); 4.0201 (1.4); 4.0023 (0.5); 3.8234 (16.0); 3.7924 (1.6); 3.7740 (1.5); 3.7560 (0.6); 3.3330 (112.8); 2.6768 (0.6); 2.6722 (0.8); 2.6675 (0.6); 2.5256 (2.5); 2.5208 (3.8); 2.5122 (44.2); 2.5078 (88.5); 2.5032 (116.0); 2.4986 (85.2); 2.4941 (42.1); 2.3345 (0.5); 2.3300 (0.7); 2.3255 (0.5); 2.0339 (1.0); 2.0206 (2.8); 2.0133 (3.3); 2.0017 (1.3); 1.9896 (6.1); 1.8258 (1.3); 1.8130 (2.9); 1.8061 (3.0); 1.7923 (1.0); 1.3974 (1.2); 1.2796 (3.8); 1.2611 (8.4); 1.2426 (3.7); 1.1931 (1.7); 1.1753 (3.3); 1.1575 (1.6); 0.1459 (0.6); 0.0079 (4.5); -0.0002 (128.8); -0.0085 (5.2); -0.1496 (0.6)	10
I-16: $^1\text{H-NMR}$ (400.2 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.7957 (4.5); 8.9390 (2.0); 8.9160 (2.2); 8.4967 (2.7); 8.4917 (2.6); 8.0152 (1.5); 8.0098 (1.5); 7.9922 (1.5); 7.9868 (1.4); 7.4037 (4.6); 3.9306 (16.0); 3.7577 (1.1); 3.7420 (1.1); 3.6466 (7.9); 3.3286 (144.6); 2.6759 (0.8); 2.6714 (1.0); 2.6671 (0.7); 2.5247 (3.3); 2.5070 (125.8); 2.5025 (162.7); 2.4980 (118.4); 2.3338 (0.7); 2.3293 (1.0); 2.3248 (0.7); 2.0170 (1.0); 2.0035 (3.1); 1.9965 (3.4); 1.9850 (1.3); 1.8112 (1.4); 1.7987 (3.2); 1.7917 (3.2); 1.7778 (1.0); 1.2643 (3.8); 1.2457 (8.4); 1.2272 (3.8); 0.0079 (2.9); -0.0002 (75.2); -0.0085 (2.8); -0.1497 (0.3)	
I-17: $^1\text{H-NMR}$ (400.2 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.8269 (7.6); 8.8963 (3.5); 8.8734 (3.8); 8.5300 (4.5); 8.5248 (4.5); 8.3482 (4.4); 8.3165 (0.4); 8.1413 (3.1); 8.1199 (3.8); 8.0550 (2.8); 8.0495 (2.6); 8.0320 (2.6); 8.0266 (2.6); 7.9362 (2.6); 7.9326 (2.5); 7.9147 (2.1); 7.9109 (2.0); 5.7567 (6.7); 3.7965 (1.9); 3.7780 (6.3); 3.7594 (6.4); 3.7410 (2.0); 3.3302 (191.8); 3.2570 (0.7); 2.6765 (0.9); 2.6720 (1.2); 2.6674 (0.8); 2.6629 (0.4); 2.5253 (3.7); 2.5118 (73.5); 2.5075 (144.8); 2.5030 (187.4); 2.4985 (134.6); 2.4941 (64.8); 2.3343 (0.8); 2.3298 (1.1); 2.3254 (0.8); 2.3209 (0.4); 2.0306 (1.9); 2.0172 (5.4); 2.0100 (5.8); 1.9983 (2.4); 1.8312 (2.5); 1.8187 (5.5); 1.8117 (5.6); 1.7977 (1.8); 1.2908 (7.2); 1.2723 (16.0); 1.2538 (7.2); 1.2338 (0.9); 0.1460 (0.4); 0.0079 (3.0); -0.0001 (84.1); -0.0084 (3.0); -0.1495 (0.4)	20
I-18: $^1\text{H-NMR}$ (400.2 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.8171 (7.7); 8.8922 (3.4); 8.8693 (3.8); 8.5225 (4.4); 8.5173 (4.5); 8.3159 (0.8); 8.0503 (3.0); 8.0432 (6.1); 8.0274 (2.9); 8.0210 (7.2); 7.9903 (3.9); 7.9845 (4.0); 7.5683 (2.3); 7.5620 (2.2); 7.5459 (2.1); 7.5400 (2.1); 3.7949 (1.8); 3.7763 (6.1); 3.7577 (6.2); 3.7392 (2.0); 3.3300 (566.1); 2.6758 (2.3); 2.6713 (3.2); 2.6669 (2.4); 2.5245 (9.3); 2.5111 (192.6); 2.5068 (385.8); 2.5023 (505.4); 2.4978 (365.7); 2.4934 (177.9); 2.3337 (2.2); 2.3291 (3.0); 2.3246 (2.2); 2.0863 (2.2); 2.0279 (1.9); 2.0145 (5.3); 2.0071 (5.7); 1.9955 (2.4); 1.8281 (2.4); 1.8156 (5.5); 1.8086 (5.6); 1.7947 (1.8); 1.2971 (0.8); 1.2895 (7.3); 1.2710 (16.0); 1.2525 (7.2); 1.2345 (1.1); 0.1459 (1.0); 0.0078 (8.0); -0.0002 (223.5); -0.0084 (8.0); -0.1498 (1.0)	

【0448】

使用実施例

ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) - 噴霧試験

溶媒： 78 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性化化合物製剤を製造するために、1 重量部の活性化化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで 1000 ppm の乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0449】

予め膨潤させた小麦粒 (*Triticum aestivum*) を、寒天および少量の水を満たしたマルチウェルプレート中で 1 日間インキュベートする (キャビティあたり 5 種子粒)。発芽したコムギ穀粒に、所望の濃度の活性化化合物製剤を噴霧する。その後、各キャビティにジアブロチカ・バルテアタの甲虫幼虫 10 ~ 20 匹を感染させる。

【0450】

7 日後、効力 (%) を測定する。100 % は、全てのコムギ植物が未処理の非感染対照におけるように成長したことを意味し; 0 % は成長したコムギ植物が無かったことを意味する。

【0451】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、100 g / ha (= 32 μ g / キャビティ) の施用率で 100 % の効力を示す: 実施例 I-2、I-3、I-4、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14。

10

20

30

40

50

【0452】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) – 噴霧試験

溶媒： 78 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性化合物製剤を製造するために、1 重量部の活性化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで 1000 ppm の乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0453】

全ての生育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が生息しているハクサイ葉 (*Brassica pekinensis*) のディスクに、所望の濃度の活性化合物製剤を噴霧する。

10

【0454】

5 日後、効力 (%) を測定する。100 % はすべてのアブラムシが死んだことを意味し、0 % は死んだアブラムシが無かったことを意味する。

【0455】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、100 g / ha の施用率で 100 % の効力を示す：I-4、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14。

【0456】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、100 g / ha の施用率で 90 % の効力を示す：I-1、I-2、I-5、I-6、I-9。

20

【0457】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) – 経口試験

溶媒： 100 重量部のアセトン

適切な活性化合物製剤を製造するために、1 重量部の活性化合物を、指定された重量部の溶媒を用いて溶解し、所望の濃度が達成されるまで水で作る。

【0458】

50 µl の活性化合物調製物をマイクロタイタープレートに移し、150 µl の IPL 41 昆虫培地 (33 % + 15 % 糖) で 200 µl の最終容量にする。続いて、プレートパラフィルムで密封し、第 2 のマイクロタイタープレート内のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) の混合集団がパラフィルムを通して溶液を穿孔し、吸収することができる。

30

【0459】

5 日後、効力 (%) を測定する。100 % はすべてのアブラムシが死んだことを意味し、0 % は死んだアブラムシが無かったことを意味する。

【0460】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、4 ppm の施用率で 100 % の効力を示す：実施例 I-1、I-2、I-4、I-5、I-6、I-11、I-12、I-13、I-14。

【0461】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、0.8 ppm の施用率で 100 % の効力を示す。I-4、I-11、I-13、I-14。

40

【0462】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、0.8 ppm の施用率で 90 % の効力を示す。I-1、I-2、I-9、I-10、I-12。

【0463】

マスタードビートル (*Phaedon cochleariae*) – 噴霧試験

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

50

適切な活性化合物製剤を製造するために、1重量部の活性化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0464】

ハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望の濃度の活性化合物製剤を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (*Phaedon cochleariae*) の幼虫を生息させる。

【0465】

7日後、効力(%)を測定する。100%は、すべてのマスタードビートルの幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだマスタードビートルの幼虫が無かったことを意味する。

【0466】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、100g/haの施用率で100%の効力を示す：実施例I-1。

【0467】

ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) - 噴霧試験

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性化合物製剤を製造するために、1重量部の活性化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0468】

トウモロコシ (*Zea mays*) の葉ディスクに、所望の濃度の活性化合物製剤を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫 (*caterpillars*) を生息させる。

【0469】

7日後、効力(%)を測定する。100%はすべての幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ幼虫が無かったことを意味する。

【0470】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、100g/haの施用率で100%の効力を示す。I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14。

【0471】

ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) - 噴霧試験、OP耐性

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性化合物製剤を製造するために、1重量部の活性化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0472】

全ての成育段階のナミハダニ (*greenhouse red spider mite*) (*Tetranychus urticae*) が生息しているインゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*) の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

【0473】

6日後、効力(%)を測定する。100%はすべてのナミハダニが死んだことを意味し、0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0474】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、100g/haの施用率で

10

20

30

40

50

90%の効力を示す：実施例I-9。

【0475】

比較実験

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 噴霧試験 (MYZUPE)

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性化合物製剤を製造するために、1重量部の活性化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0476】

全ての生育段階のモモアカアブラムシ (Myzus persicae) が生息しているハクサイ葉 (Brassica pekinensis) のディスクに、所望の濃度の活性化合物製剤を噴霧する。

【0477】

所望の期間後、効力(%)を測定する。100%はすべてのアブラムシが死んだことを意味し、0%は死んだアブラムシが無かったことを意味する。

【0478】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、先行技術よりも優れた効力を示す：表を参照のこと。

【0479】

マスタードビートル (Phaedon cochleariae) - 噴霧試験 (PHAECO)

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性化合物製剤を製造するために、1重量部の活性化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0480】

ハクサイ (Brassica pekinensis) の葉のディスクに、所望の濃度の活性化合物製剤を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (Phaedon cochleariae) の幼虫を生息させる。

【0481】

所望の期間後、効力(%)を測定する。100%は、すべてのマスタードビートルの幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだマスタードビートルの幼虫が無かったことを意味する。

【0482】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、先行技術よりも優れた効力を示す：表を参照のこと。

【0483】

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験 (SPODFR)

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性化合物製剤を製造するために、1重量部の活性化合物を、記載された重量部の溶媒を用いて溶解し、そして所望の濃度に達するまで1000ppmの乳化剤濃度を含有する水で作る。さらなる試験濃度を得るために、製剤を乳化剤含有水で希釈する。

【0484】

10

20

30

40

50

トウモロコシ (*Zea mays*) の葉ディスクに、所望の濃度の活性化合物製剤を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫 (caterpillars) を生息させる。

【0485】

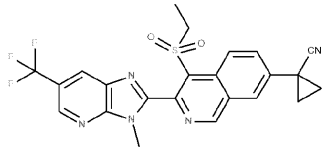
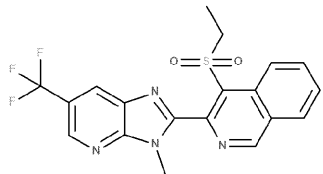
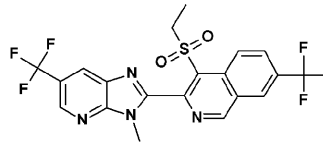
所望の期間後、効力 (%) を測定する。100 % はすべての幼虫が死んだことを意味し、0 % は、死んだ幼虫が無かったことを意味する。

【0486】

この試験において、例えば、調製例からの以下の化合物は、先行技術よりも優れた効力を示す：表を参照のこと。

【0487】

【表3】

物質	構造	害虫種	濃度	効力 (%) dat
実施例 I-1 本発明		PHAECO	20 (g ai/ha)	100 7dat
			4 (g ai/ha)	100 7dat
		SPODFR	20 (g ai/ha)	100 7dat
			4 (g ai/ha)	100 7dat
		MYZUPE	0.8 (g ai/ha)	83 7dat
			100 (g ai/ha)	90 5dat
例 I'-47 W02017/07 2039 から 既知		PHAECO	20 (g ai/ha)	67 7dat
			4 (g ai/ha)	0 7dat
		SPODFR	20 (g ai/ha)	67 7dat
			4 (g ai/ha)	33 7dat
			0.8 (g ai/ha)	0 7dat
例 I'-51 W02017/07 2039 から 既知		MYZUPE	100 (g ai/ha)	90 5dat
			20 (g ai/ha)	0 5dat
			4 (g ai/ha)	0 5dat

d a t = 処理後の日数

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

C O 7 D 413/04 (2006.01)
C O 7 D 487/04 (2006.01)

F I

C O 7 D 413/04
C O 7 D 471/04 1 0 7 E
C O 7 D 487/04 1 4 4

(74)代理人 100143823

弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100183519

弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483

弁理士 川崎 洋祐

(74)代理人 100160749

弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255

弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100202267

弁理士 森山 正浩

(74)代理人 100182132

弁理士 河野 隆

(74)代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812

弁理士 城山 康文

(72)発明者 フィッシャー, リュディガー

ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツォー・デン・フースフェレン・2 3

(72)発明者 ウィロット, マシュー

ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム・アム・ライン、ロットェンシュトラーセ・1 0

(72)発明者 ヘイガー, ドミニク

ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、キルヒシュトラーセ・2 7 アー

(72)発明者 ホフマイスター, ラウラ

ドイツ国、4 0 5 9 3・デュッセルドルフ、ウルデンバッハー・アレー・1 9

(72)発明者 イルグ, ケルスティン

ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、ノイツサー・ヴァール・3 2

(72)発明者 レーゼル, ピーター

ドイツ国、5 1 3 7 1・レーバークーゼン、アム・ショッカー・5

(72)発明者 ザーシュ, セルゲイ

ウクライナ国、0 7 4 0 0・ブロバルイ、コロレンコ・ストリート・6 4、アパートメント・1 1 8

審査官 安藤 倫世

(56)参考文献

特表 2 0 2 2 - 5 2 1 4 3 8 (J P, A)

特表 2 0 1 8 - 5 3 6 6 3 9 (J P, A)

国際公開第 2 0 1 7 / 1 4 6 2 2 0 (W O, A 1)

特表 2 0 1 7 - 5 3 1 6 1 6 (J P, A)

特開 2 0 1 7 - 1 7 8 8 2 0 (J P, A)

特表 2 0 1 8 - 5 0 1 2 2 6 (J P, A)

国際公開第 2 0 1 8 / 0 8 4 1 4 2 (W O, A 1)

国際公開第 2 0 2 0 / 1 7 3 8 6 0 (W O, A 1)

国際公開第 2 0 1 9 / 0 3 8 1 9 5 (W O, A 1)

国際公開第 2 0 1 8 / 1 3 8 0 5 0 (W O, A 1)

国際公開第 2 0 1 6 / 1 2 1 9 9 7 (W O, A 1)

KOYANAGI,T. et al, Bioisosterism in agrochemicals, ACS Symposium Series, 1995年, Vo
l. 584, Chapter 2, pp. 15-24, Synthesis and Chemistry of Agrochemicals IV
(58)調査した分野 (Int.Cl., D B名)
C 0 7 D
A 0 1 N
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)