

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2006-502226

(P2006-502226A)

(43) 公表日 平成18年1月19日(2006.1.19)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 F 7/10 (2006.01)	C O 7 F 7/10 C S P S	4 H O 1 1
A O 1 N 43/56 (2006.01)	A O 1 N 43/56 A	4 H O 4 9

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 64 頁)

(21) 出願番号 特願2004-543434 (P2004-543434)
 (86) (22) 出願日 平成15年10月1日 (2003. 10. 1)
 (85) 翻訳文提出日 平成17年3月31日 (2005. 3. 31)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2003/031677
 (87) 国際公開番号 W02004/033468
 (87) 国際公開日 平成16年4月22日 (2004. 4. 22)
 (31) 優先権主張番号 60/416, 364
 (32) 優先日 平成14年10月4日 (2002. 10. 4)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(71) 出願人 390023674
 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・
 アンド・カンパニー
 E. I. DU PONT DE NEMO
 URS AND COMPANY
 アメリカ合衆国、デラウェア州、ウィルミ
 ントン、マーケット・ストリート 100
 7
 (74) 代理人 100060782
 弁理士 小田島 平吉
 (72) 発明者 ラーム, ジョージ・フィリップ
 アメリカ合衆国デラウェア州19808ウ
 イルミントン・フェアヒルドライブ148

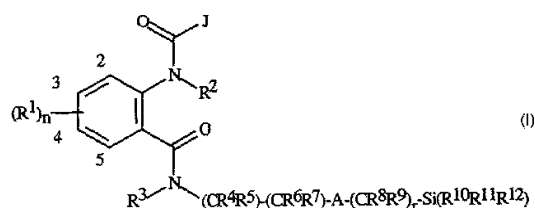
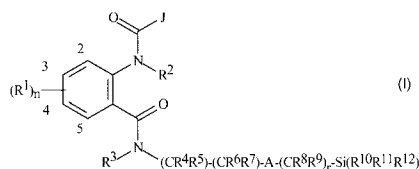
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アントラニルアミド殺虫剤

(57) 【要約】

本発明は、式 I

【化 1】



[式中、

AはOまたはS (O)_m であり、

Jは本明細書に定義されるようなフェニルまたは複素環であり、そして

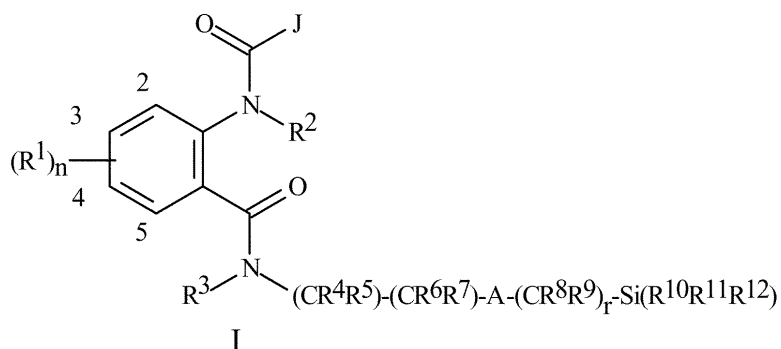
R¹ ~ R¹²、n、mおよびrは本開示に定義される通りである] の化合物、そのN - オキシドおよびそれらの適切な塩を提供する。また、無脊椎有害生物またはその環境を、生物学的に有効な量の式 I の化合物、そのN - オキシドまたはその化合物の適切な塩 (例えば、本明細書に記載の組成物として) と接触させることを含んでな

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



10

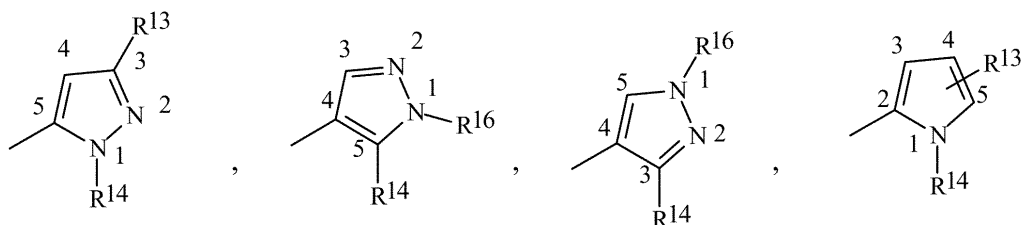
[式中、

A は O または $S(O)_m$ であり、J は場合により基 R^{1-5} から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基によって置換されていてもよいフェニルであるか、または

J は

20

【化 2】



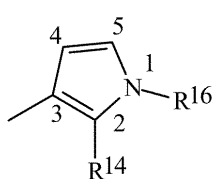
J-1

J-2

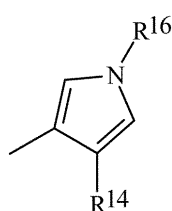
J-3

J-4

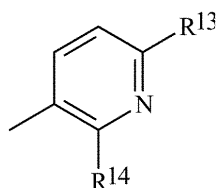
30



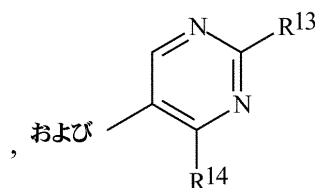
J-5



J-6



J-7



J-8

よりなる群から選択される複素環であり、

各 R^1 は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_5$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルよりなる群から独立して選

40

50

択されるか、あるいは

各 R^1 はそれぞれ場合により $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_4 \sim C_7$ (アルキル)シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルによって置換されているフェニル、ベンジルおよびフェノキシよりなる群から独立して選択され、

R^2 はH；またはそれぞれ場合によりハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノよりなる群から選択される1個もしくはそれ以上の置換基によって置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであるか、あるいは

R^2 は $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであり、

R^3 はH、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルであり、

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 はそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり、

R^{10} および R^{11} はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり、

R^{12} は場合により基 R^{17} から選択される1～3個の置換基によって置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたはフェニルであり、

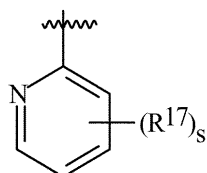
各 R^{13} はH、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルおよび $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルよりなる群から独立して選択され、

R^{14} は場合によりハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノよりなる群から選択される1個もしくはそれ以上の置換基によって置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、または場合により R^{17} から選択される1～3個の置換基によって置換されているフェニルであるか、

あるいは

R^{14} は

【化3】



;

であり、

$R^{1\ 5}$ は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであるか、あるいは

$R^{1\ 5}$ は場合により 1 ~ 3 個の $R^{1\ 7}$ によって置換されていてもよいフェニルまたはピリジルであり、

$R^{1\ 6}$ は H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルまたは $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルであり

10

、
各 $R^{1\ 7}$ は独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

m は 0、1 または 2 であり、

n は 0、1、2、3 または 4 であり、

r は 0 または 1 であり、そして

s は 0、1 または 2 である]

の化合物、その N -オキシドまたはそれらの適切な塩。

20

【請求項 2】

A が $S(O)_m$ であり、

R^1 基の 1 個が 2 位でフェニル環に結合し、そして該 R^1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

R^2 および R^3 がそれぞれ独立して H 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

30

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 がそれぞれ独立して H またはメチルであり、

R^8 および R^9 が H であり、

$R^{1\ 0}$ 、 $R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 2}$ がメチルであり、

n が 1 または 2 であり、そして

r が 1 である

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

各 R^1 が独立して CH_3 、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_p CF_3$ 、 $S(O)_p CHF_2$ 、 CN またはハロゲンであり、

R^2 および R^3 が H であり、そして

40

p が 0、1 または 2 である

請求項 2 に記載の化合物。

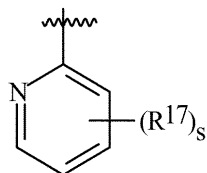
【請求項 4】

各 $R^{1\ 3}$ が H 、 CH_3 、 CF_3 、 CH_2CF_3 、 CHF_2 、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ またはハロゲンであり、

$R^{1\ 4}$ が場合により $R^{1\ 7}$ から選択される 1 ~ 2 個の置換基によって置換されていてもよいフェニルであるか、あるいは

$R^{1\ 4}$ が

【化 4】



;

であり、

R^{15} および R^{17} がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、
ハロゲンまたは CN であり、 10

各 R^{16} が CH_2CF_3 または CHF_2 であり、そして

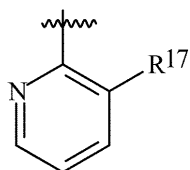
s が 0 または 1 である

請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

各 R^{13} が独立してハロゲン、 OCH_2CF_3 、 CHF_2 または CF_3 であり、
 R^{14} が

【化 5】



20

であり、そして

R^{17} が F、Cl または Br である

請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^6 および R^7 が H である請求項 5 に記載の化合物。

30

【請求項 7】

J が J - 1、J - 2、J - 4 または J - 8 である請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

J が J - 1 であり、

2 位でフェニル環に結合する R^1 が CH_3 、F、Cl または Br であり、第 2 の R^1 基が
4 位でフェニル環に結合しており、そして該第 2 の R^1 が CN、 CF_3 、F、Cl、Br
または I であり、

R^{13} が独立して Cl、Br、 OCH_2CF_3 または CF_3 であり、そして

n が 2 である

請求項 7 に記載の化合物。

40

【請求項 9】

無脊椎有害生物またはその環境を、請求項 1 に記載の化合物の生物学的に有効な量と接
触させることを含んでなる無脊椎有害生物の防除方法。

【請求項 10】

無脊椎有害生物がゴキブリ、アリまたはシロアリであり、該生物が該化合物を含んでな
る餌料組成物を消費することによって該化合物と接触する請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

無脊椎有害生物がカ、ブユ、サシバエ、メクラアブ、アブ、大形のハチ、イエロージャ
ケット (yellow jacket)、ホーネット (hornet)、マダニ、クモ、
アリまたはブヨであり、該生物を噴霧容器から分配される該化合物を含んでなる噴霧組成 50

物に接触させる請求項 9 に記載の方法。

【請求項 1 2】

請求項 1 に記載の化合物の生物学的に有効な量、ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の成分を含んでなり、場合により少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤の有効量をさらに含んでなる無脊椎有害生物の防除のための組成物。

【請求項 1 3】

(a) 請求項 1 に記載の化合物と、

(b) 噴射剤と

を含んでなる噴霧組成物。

10

【請求項 1 4】

(a) 請求項 1 に記載の化合物と、

(b) 1 種もしくはそれ以上の食物材料と、

(c) 場合により誘引剤と、

(c) 場合により保湿剤と

を含んでなる餌料組成物。

【請求項 1 5】

(a) 請求項 1 4 に記載の餌料組成物と、

(b) 餌料組成物を受け取るように構成されたハウジングであって、ハウジングの外側の位置から無脊椎有害生物が餌料組成物に接近することができるように、無脊椎有害生物が開口を通過可能であるサイズに作られた少なくとも 1 つの開口を有し、かつ無脊椎有害生物の潜在的または既知の活性位置にまたはその付近に配置されるようにさらに構成されたハウジングと

20

を含んでなる無脊椎有害生物の防除装置。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、以下に記載されるそれらの使用を含む、農業的および非農業的使用に適切な、特定の複素環式アミド、それらの N - オキシド、塩および組成物、ならびに農業的および非農業的環境の両方における無脊椎有害生物の防除のためのそれらの使用方法に関する。

30

【背景技術】

【0002】

高い作物効率を達成するために、無脊椎有害生物の防除は極めて重要である。成長中の農作物および貯蔵された農作物に及ぼす無脊椎有害生物による損害は、生産性の著しい減少を引き起こす可能性があり、それによって消費者に費用増加をもたらす可能性がある。林業、温室作物、装飾物、苗作物、貯蔵食品および繊維製品、家畜、家庭用品、ならびに公衆衛生および動物の健康においても無脊椎有害生物の防除は重要である。これらの目的のための多くの製品が市販品として入手可能であるが、より有効であり、費用が低く、毒性が低く、環境的に安全であるか、または異なる作用形態を有する新規化合物に対する必要性が存続している。

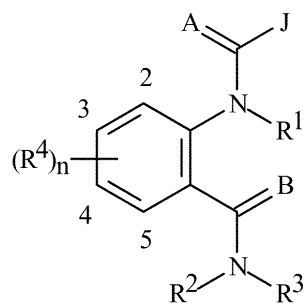
40

【0003】

特許文献 1 は、殺節足動物剤として、式 i の N - アシルアントラニル酸誘導体を開示する。

【0004】

【化 1】



i

10

【 0 0 0 5 】

[式中、特に、A および B は独立して O または S であり、J は場合により置換されていて
もよいフェニル環、5 員もしくは 6 員芳香族複素環、ナフチル環系または芳香族 8 員、9
員もしくは 10 員縮合ヘテロビシクロ環系であり、 R^1 および R^3 は独立して H または場
合により置換されていてよい $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 R^2 は、H または $C_1 \sim C_6$
アルキルであり、各 R^4 は独立して H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、
ハロゲンまたは CN であり、そして n は 1 ~ 4 である]

【 0 0 0 6 】

20

【特許文献 1】国際公開 01 / 070671 号パンフレット

【発明の開示】

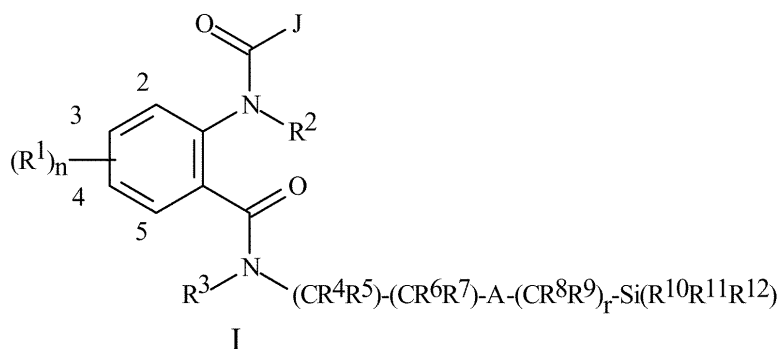
【課題を解決するための手段】

【 0 0 0 7 】

本発明は、式 I

【 0 0 0 8 】

【化 2】



I

30

【 0 0 0 9 】

[式中、

40

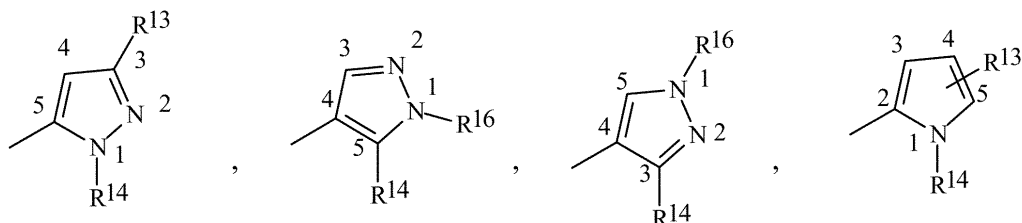
A は O または $S(O)_m$ であり、

J は場合により基 $R^{1 \sim 5}$ から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基によって置換されてい
てもよいフェニルであるか、または

J は

【 0 0 1 0 】

【化 3】



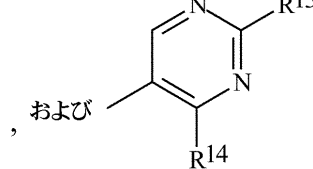
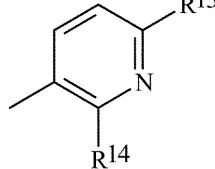
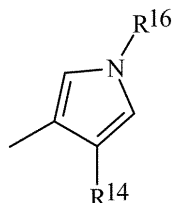
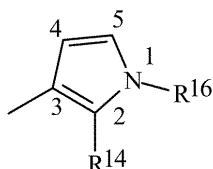
J-1

J-2

J-3

J-4

10



J-5

J-6

J-7

J-8

【 0 0 1 1 】

20

よりなる群から選択される複素環であり、

各 R^1 は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_5$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルよりなる群から独立して選

30

各 R^1 はそれぞれ場合により $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_4 \sim C_7$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルによって置換されていてもよいフェニル、ベン

40

ジルおよびフェノキシよりなる群から独立して選択され、
 R^2 は H；またはそれぞれ場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノよりなる群から選択される 1 個もしくはそれ以上の置換基によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであるか、あるいは

R^2 は $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであり、

50

R^3 は H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルであり、

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 はそれぞれ独立して H、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり、

R^{10} および R^{11} はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり、

R^{12} は場合により基 R^{17} から選択される 1～3 個の置換基によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたはフェニルであり、

各 R^{13} は H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルおよび $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルよりなる群から独立して選択され、

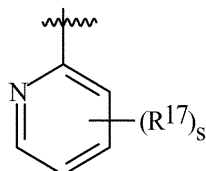
R^{14} は場合によりハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノよりなる群から選択される 1 個もしくはそれ以上の置換基によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、または場合により R^{17} から選択される 1～3 個の置換基によって置換されていてもよいフェニルであるか、

あるいは

R^{14} は

【0012】

【化4】



;

【0013】

であり、

R^{15} は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであるか、あるいは

R^{15} は場合により 1～3 個の R^{17} によって置換されていてもよいフェニルまたはピリジルであり、

R^{16} は H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルまたは $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルであり、

各 R^{17} は独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

m は 0、1 または 2 であり、

n は 0、1、2、3 または 4 であり、

r は 0 または 1 であり、そして

s は 0、1 または 2 である]

10

20

30

40

50

の化合物、その N - オキシドまたはそれらの農業的に適切な塩を提供する。

【0014】

また本発明は、無脊椎有害生物またはその環境を、生物学的に有効な量の式 I の化合物、その N - オキシドまたは化合物の適切な塩（例えば、本明細書に記載の組成物として）と接触させることを含んでなる、無脊椎有害生物を防除する方法を提供する。また本発明は、無脊椎有害生物またはその環境を、生物学的に有効な量の式 I の化合物、あるいは式 I の化合物、その N - オキシドまたは化合物の適切な塩、および生物学的に有効な量の無脊椎有害生物を防除するための少なくとも 1 種の追加の化合物または薬剤を含んでなる組成物と接触させる方法も提供する。

【0015】

また本発明は、生物学的に有効な量の式 I の化合物、その N - オキシドまたは化合物の適切な塩、ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の成分を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための組成物を提供する。また本発明は、生物学的に有効な量の式 I の化合物、その N - オキシドまたは化合物の適切な塩、および有効量の少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤を含んでなる組成物を提供する。

【発明を実施するための最良の形態】

【0016】

上記詳述において、単独または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」のような組み合わせられた単語のいずれかで使用される用語「アルキル」としては、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピルまたは種々のブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体のような直鎖または分枝鎖アルキルが挙げられる。「アルケニル」としては、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、ならびに種々のブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体のような直鎖または分枝鎖アルケンが挙げられる。「アルケニル」としては、1, 2 - プロパジエニルおよび 2, 4 - ヘキサジエニルのようなポリエンも挙げられる。「アルキニル」としては、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、ならびに種々のブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体のような直鎖または分枝鎖アルキンが挙げられる。「アルキニル」としては、2, 5 - ヘキサジエニルのような複数の三重結合から構成される部分も挙げることができる。「アルコキシ」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、n - プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ならびに種々のブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体が挙げられる。「アルキルチオ」としては、メチルチオ、エチルチオ、ならびに種々のプロピルチオおよびブチルチオ異性体のような分枝鎖または直鎖アルキルチオ部分が挙げられる。「アルキルスルフィニル」としては、アルキルスルフィニル基の両エナンチオマーが挙げられる。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ 、ならびに種々のブチルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ 、ならびに種々のブチルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」等は、上記例と同様に定義される。「シクロアルキル」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルが挙げられる。用語「シクロアルキルアミノ」としては、シクロペンチルアミノおよびシクロヘキシルアミノのような窒素原子によって結合された同一基が挙げられる。

【0017】

用語「複素」は、環または環系に関連して、少なくとも 1 個の環原子が炭素以外であり、窒素、酸素およびイオウよりなる群から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含有し得るが、ただし各環が 4 以下の窒素、2 以下の酸素および 2 以下のイオウを含有する環または環系を指す。用語「芳香族複素環または環系」および「芳香族縮合複素二環式環系」としては、完全芳香族複素環および多環式環系の少なくとも 1 個の環が芳香族である複素環（ここで、芳香族は、ヒュッケル則を満たすものを指す）が挙げられる。複素環式

10

20

30

40

50

環または環系は、いずれかの利用可能な炭素または窒素を通して、前記炭素または窒素上の水素を置換することによって結合され得る。

【0018】

用語「ハロゲン」としては、単独または「ハロアルキル」のような組み合わせられた単語のいずれかで、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素が挙げられる。さらに「ハロアルキル」または「ハロシクロアルキル」のような組み合わせられた単語で使用される場合、前記アルキルまたはシクロアルキルは、同一であっても、または異なっているてもよいハロゲン原子により部分的または完全に置換されている。 「ハロアルキル」の例としては、 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 および CF_3CCl_2 が挙げられる。用語「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」等は、用語「ハロアルキル」と同様に定義される。「ハロアルケニル」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $\text{HC}(\text{CCHCl})$ 、 $\text{CF}_3\text{C}(\text{C})$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}(\text{C})$ および $\text{FCH}_2\text{C}(\text{CCH}_2)$ が挙げられる。「ハロアルコキシ」の例としては、 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 CCl_3S 、 CF_3S 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ および $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ が挙げられる。「ハロアルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ および $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ および $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ が挙げられる。

【0019】

「アルキルカルボニル」の例としては、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ および $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ が挙げられる。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ および種々のブトキシ-またはペントキシカルボニル異性体が挙げられる。「アルキルアミノカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ および種々のブチルアミノ-またはペンチルアミノカルボニル異性体が挙げられる。「ジアルキルアミノカルボニル」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(\text{H}_2)(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ および $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})$ が挙げられる。

【0020】

置換基中の全炭素原子数を接頭辞「 $\text{C}_i \sim \text{C}_j$ 」で表し、ここで、 i および j は 1 ~ 8 の数である。例えば、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからプロピルスルホニルまでを示し、 C_2 アルコキシアルキルは CH_3OCH_2 を示し、 C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ または $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ を示し、かつ C_4 アルコキシアルキルは、総数 4 の炭素原子を含有する、アルコキシ基により置換されているアルキル基の様々な異性体を示し、例としては $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。

【0021】

上記記述において、式 I の化合物が 1 つもしくはそれ以上の複素環式環から構成される場合、全ての置換基は、いずれかの利用可能な炭素または窒素を通して、前記炭素または窒素上の水素を置換することによって、これらの環に結合される。

【0022】

置換基の数が 2 個以上であり得ることを表す下付き文字を有する置換基により化合物が置換されている場合、前記置換基は (2 個以上である場合)、定義された置換基の群から独立して選択される。さらに下付き文字が範囲、例えば $(\text{R})_{i-j}$ を表す場合、置換基の数は i と j との間を全て含む整数から選択されてよい。

【0023】

10

20

30

40

50

基が、水素であり得る置換基、例えば R^{1-3} を含有する場合、次いで、この置換基が水素として見なされる場合、これは未置換である前記基と同等であることが認識される。基上の任意の置換基数が 0 である場合、例えば、 n が 0 である場合、次いで、これは未置換である前記基と同等であることが認識される。結合が、固定されていない状態で描写されている場合、置換基は、水素の置換によって、いずれかの利用可能な環上炭素に結合してもよい。

【0024】

本発明の化合物は、1 つもしくはそれ以上の立体異性体として存在することも可能である。様々な立体異性体としては、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体および幾何異性体が挙げられる。他の立体異性体に関して濃縮された場合、または他の立体異性体から分離された場合、1 つの立体異性体がより活性であり得、そして / または有利な効果を示し得ることを当業者は認識するだろう。加えて、当業者は、前記立体異性体をいかにして分離するか、濃縮するか、そして / または選択的に調製するかを知っている。従って、本発明は、式 I から選択される化合物、その N - オキシドおよび農業的に適切な塩を含んでなる。本発明の化合物は、立体異性体の混合物として、個々の立体異性体として、または光学的に活性な形態として存在してもよい。

【0025】

窒素はオキシドへの酸化に利用可能な孤立電子対を必要とすることから、全ての窒素含有複素環が N - オキシドを形成し得ないことを当業者は認識し、N - オキシドを形成できるそれらの窒素含有複素環を当業者は認知するだろう。第三級アミンが N - オキシドを形成し得ることも当業者は認知するだろう。複素環および第三級アミンの N - オキシドの調製に関する合成法は当業者に周知であり、過酢酸および m - クロロ過安息香酸 (MCPBA) のようなペルオキシ酸、過酸化水素、t - ブチルヒドロペルオキシドのようなアルキルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム、ならびにジメチジオキシランのようなジオキシランによる複素環および第三級アミンの酸化を含む。これらの N - オキシドの調製方法は文献に広く記載されており、再調査されている。例えば、T. L. ギルクリスト (T. L. Gilchrist) 著、コンプリヘンシブ オーガニック シンthesis (Comprehensive Organic Synthesis)、第 7 巻、第 748 ~ 750 頁、S. V. レイ (S. V. Ley) 編、ペルガモン プレス (Pergamon Press) ; M. ティスラー (M. Tisler) および B. スタノウニコ (B. Stanovnik) 著、コンプリヘンシブ ヘテロサイクリック ケミストリー (Comprehensive Heterocyclic Chemistry)、第 3 巻、第 18 ~ 20 頁、A. J. ボウルトン (A. J. Boulton) および A. マッキロップ (A. McKillop) 編、ペルガモン プレス (Pergamon Press) ; M. R. グリムメット (M. R. Grimmett) および B. R. T. ケーン (B. R. T. Keene) 著、アドバンシス イン ヘテロサイクリック ケミストリー (Advances in Heterocyclic Chemistry)、第 43 巻、第 149 ~ 161 頁、A. R. カトリッキー (A. R. Katritzky) 編、アカデミック プレス (Academic Press) ; M. ティスラー (M. Tisler) および B. スタノウニコ (B. Stanovnik) 著、アドバンシス イン ヘテロサイクリック ケミストリー (Advances in Heterocyclic Chemistry)、第 9 巻、第 285 ~ 291 頁、A. R. カトリッキー (A. R. Katritzky) および A. J. ボウルトン (A. J. Boulton) 編、アカデミック プレス (Academic Press) ; ならびに G. W. H. チーズマン (G. W. H. Cheeseman) および E. S. G. ウェルスティック (E. S. G. Wershtick) 著、アドバンシス イン ヘテロサイクリック ケミストリー (Advances in Heterocyclic Chemistry)、第 22 巻、第 390 ~ 392 頁、A. R. カトリッキー (A. R. Katritzky) および A. J. ボウルトン (A. J. Boulton) 編、アカデミック プレス (Academic Press) を参照のこと。

10

20

30

40

50

【0026】

本発明の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、オキサリ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸のような無機または有機酸による酸付加塩が挙げられる。

【0027】

良好な活性および/または合成の容易さの理由のため、好ましい化合物は以下の通りである。

好ましい1. Aは $S(O)_m$ であり、

R^1 基の1個は2位でフェニル環に結合し、そして前記 R^1 は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

R^2 および R^3 はそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 はそれぞれ独立してHまたはメチルであり、

R^8 および R^9 はHであり、

R^{10} 、 R^{11} および R^{12} はメチルであり、

nは1または2であり、そして

rは1である、上記式Iの化合物、ならびにそのN-オキシドおよびそれらの適切な塩。

【0028】

好ましい2. 各 R^1 は独立して CH_3 、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pOCHF_2$ 、CNまたはハロゲンであり、

R^2 および R^3 はHであり、そして

pは0、1または2である、好ましい1の化合物。

【0029】

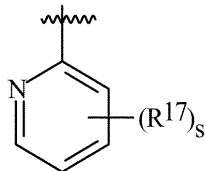
好ましい3. 各 R^{13} はH、 CH_3 、 CF_3 、 CH_2CF_3 、 $OCHF_2$ 、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ またはハロゲンであり、

R^{14} は場合により R^{17} から選択される1個もしくは2個の置換基によって置換されていてもよいフェニルであるか、あるいは

R^{14} は

【0030】

【化5】



;

【0031】

であり、

R^{15} および R^{17} はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲンまたはCNであり、

各 R^{16} は CH_2CF_3 または $OCHF_2$ であり、そして

sは0または1である、好ましい2の化合物。

【0032】

好ましい4. 各 R^{13} は独立してハロゲン、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ または CF_3 であり、

10

20

30

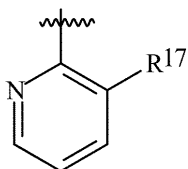
40

50

R^{1 4} は

【 0 0 3 3 】

【 化 6 】



【 0 0 3 4 】

であり、そして

R^{1 7} は F、Cl または Br である、好ましい 3 の化合物。

【 0 0 3 5 】

好ましい 5、R⁶ および R⁷ は H である、好ましい 4 の化合物。

【 0 0 3 6 】

好ましい 6、J は J - 1、J - 2、J - 4 または J - 8 である、好ましい 5 の化合物。

【 0 0 3 7 】

好ましい 7、J は J - 1 であり、

2 位でフェニル環に結合する R¹ 基は CH₃、F、Cl または Br であり、第 2 の R¹ 基は 4 位でフェニル環に結合しており、そして前記第 2 の R¹ は CN、CF₃、F、Cl、Br または I であり、

R^{1 3} は独立して Cl、Br、OCH₂CF₃ または CF₃ であり、そして

n は 2 である、好ましい 6 の化合物。

【 0 0 3 8 】

本発明の好ましい組成物および好ましい使用法は、上記好ましい化合物を含んでなるものである。

【 0 0 3 9 】

1 つもしくはそれ以上の以下のスキーム 1 ~ 15 に記載の方法および変法により、式 I の化合物を調製することができる。式 1 ~ 49 の化合物における J、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁶、R¹⁷、n および r の定義は、特記されない限り、上記発明の要約において定義された通りである。R^{1 a} および R^{1 b} は、R¹ として定義される。式 5 a、5 b および 13 a の化合物は、式 5 および 13 の様々なサブセットである。

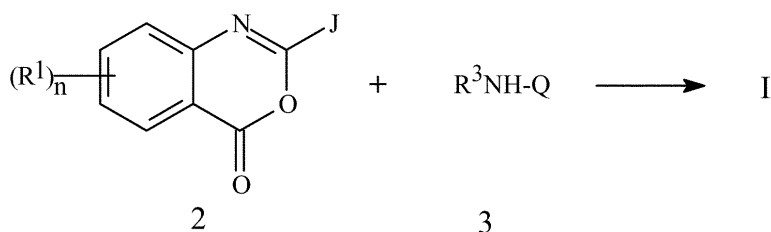
【 0 0 4 0 】

スキーム 1 に概説される通り、式 2 のベンゾオキサジノンと、式 3 のアミンとの反応によって、式 I の化合物を調製することができる。

【 0 0 4 1 】

【 化 7 】

スキーム 1



Q は (CR⁴R⁵)-(CR⁶R⁷)-A-(CR⁸R⁹)_r-Si(R¹⁰R¹¹R¹²)

【 0 0 4 2 】

そのまま、あるいはテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジクロロメタンおよびクロロホルムを含む様々な適切な溶媒中で、室温から溶媒の還流温度の範囲に及ぶ最適温度で、この反応を実行することができる。アントラニルアミドを生成するベンゾオキサジノンとアミンとの一般的反応は、化学文献に十分に証明されている。ベンゾオキサジノンの化学に関する概説に関して、ジャコブセン (Jakobsen) ら, バイオーガニック アンド メディシナル ケミストリー (Biorganic and Medicinal Chemistry) 2000, 8, 2095 - 2103、およびその中の引用文献を参照のこと。G. M. コッポラ (G. M. Coppola), ジャーナル オブ ヘテロサイクリック ケミストリー (J. Heterocyclic Chemistry) 1999, 36, 563 - 588 も参照のこと。式 3 のアミンの合成に関して、国際公開第 02 / 062807 号パンフレットを参照のこと。

10

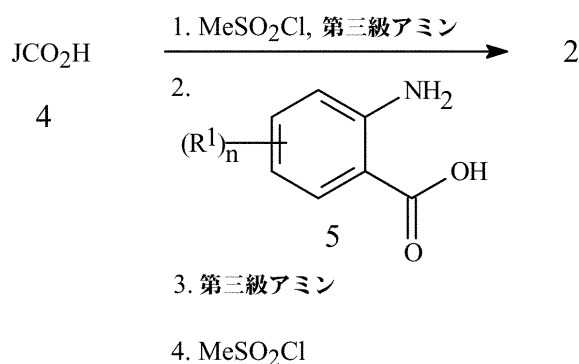
【0043】

様々な方法によって、式 2 のベンゾオキサジノンを調製することができる。特に有用である 2 つの方法を、スキーム 2 ~ 3 に詳述する。スキーム 2 において、式 4 のカルボン酸と式 5 のアントラニル酸とのカップリングによって、式 2 のベンゾオキサジノンを直接調製する。

【0044】

【化 8】

スキーム 2



20

30

【0045】

これは、トリエチルアミンまたはピリジンのような第三級アミンの存在下における、式 4 のピラゾールカルボン酸への塩化メタンスルホニルの連続添加、それに続く、式 5 のアントラニル酸の添加、それに続く、第三級アミンおよび塩化メタンスルホニルの第 2 の添加を伴う。この方法は、一般的にベンゾオキサジノンの良好な収率を可能にし、そしてより詳細に実施例 1 に説明される。

【0046】

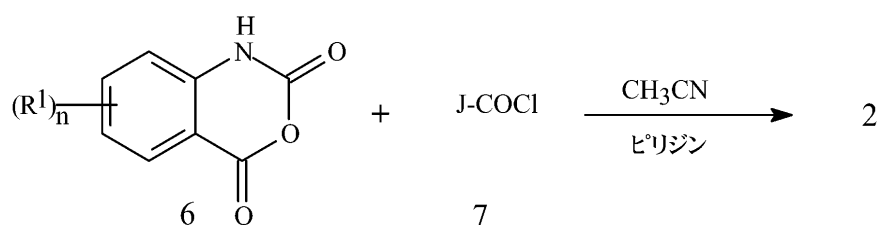
スキーム 3 は、式 2 のベンゾオキサジノンを直接提供するための、式 7 の酸塩化物と式 6 のイサト酸無水物とのカップリングを伴う、式 2 のベンゾオキサジノンの別の調製を示す。

40

【0047】

【化 9】

スキーム 3



50

【 0 0 4 8 】

この反応のためには、ピリジンまたはピリジン/アセトニトリルのような溶媒が適切である。塩化チオニルまたは塩化オキサリルによる塩素化のような既知の方法によって、式 4 の相当する酸から、式 7 の酸塩化物を入手可能である。

【 0 0 4 9 】

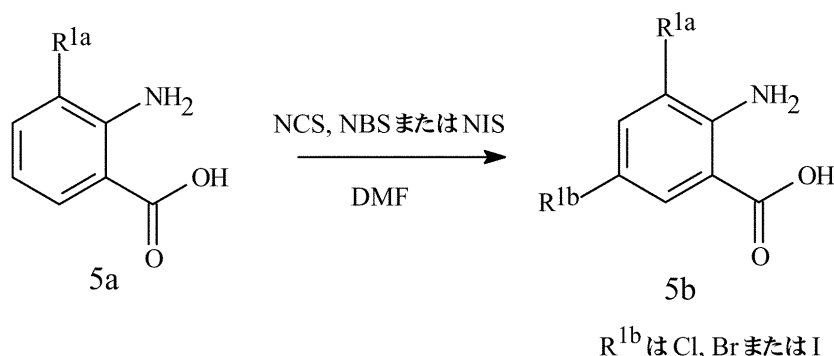
様々な既知の方法によって、式 5 のアントラニル酸を入手可能である。これらの化合物の多くが既知である。スキーム 4 に示される通り、N, N - ジメチルホルムアミド (DMF) のような適切な溶媒中で、それぞれ、N - クロロスクシンイミド (NCS)、N - ブロモスクシンイミド (NBS) または N - ヨードスクシンイミド (NIS) による式 5 a の未置換のアントラニル酸の直接ハロゲン化によって、クロロ、ブromoまたはヨードの R^{1b} 置換基を含有する式 5 b のアントラニル酸を調製することができる。式 5 b のアントラニル酸は、式 I の化合物の好ましいセットのための中間体を表す。

10

【 0 0 5 0 】

【 化 1 0 】

スキーム 4



20

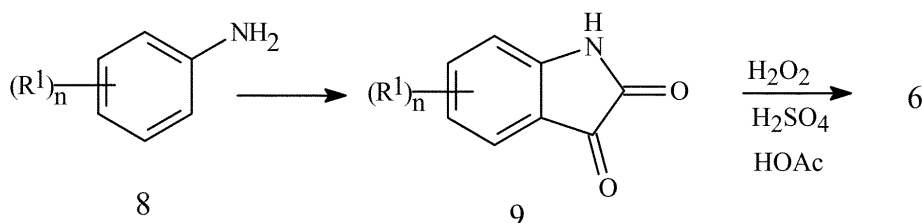
【 0 0 5 1 】

スキーム 5 に概説される通り、式 9 のイサチンから、式 6 のイサト酸無水物の調製を達成することができる。

【 0 0 5 2 】

【 化 1 1 】

スキーム 5



40

【 0 0 5 3 】

F. D. ポップ (F. D. Popp), アドバンスズ イン ヘテロサイクリック ケミストリー (Adv. Heterocycl. Chem.) 1975, 18, 1-58、および J. F. M. ダシルバ (J. F. M. Da Silva) ら, ジャーナル オブ ブラジリアン ケミカル ソサエティー (Journal of the Brazilian Chemical Society) 2001, 12 (3), 273-324 のような文献手順に従って、式 8 のアニリン誘導体から、式 9 のイサチンを入手可能である。過酸化水素によるイサチン 9 の酸化によって、良好な収率の相当するイサト酸無水物 6 が得られる (G. ライセンウェーバー (G. Reissenweber) および D. マンゴールド (D. Mangold), アンゲヴァント ヒエミー (インターナショナル

50

エディション イン イングリッシュ) 1980, 19, 222-223)。また、5と、ホスゲンまたはホスゲン相当との反応を伴う多くの既知の手順を介して、イサト酸無水物はアントラニル酸 5 から入手可能である。

【0054】

J が、場合により置換されていてもよいピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンに等しい複素環式酸 4 としては、式 J - 1 ~ J - 8 のものが挙げられる。より好ましい類似体としては、場合により置換されていてもよいフェニルまたはピリジルとして R^{14} によって置換されたピラゾール酸から誘導されたものが挙げられる。それぞれの代表例の合成に関する手順を、スキーム 6 ~ 15 に概説する。

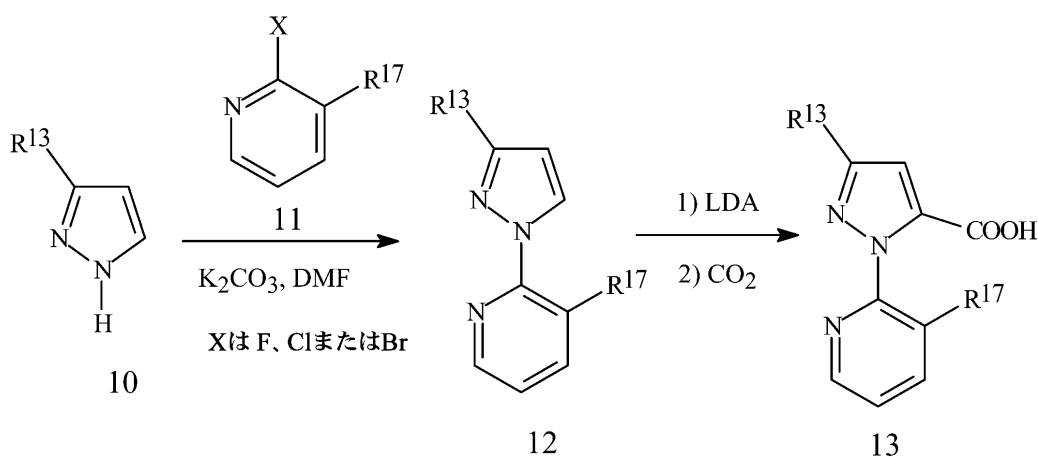
【0055】

R^{14} が 2 - ピリジルであり、かつ窒素に結合している、式 J - 1 に関連する式 13 の代表的なピラゾールカルボン酸の合成を、スキーム 6 に示す。ピラゾール 10 と、式 11 の 2 - ハロピリジンとの反応によって、所望の位置化学に対する良好な特異性を有する 1 - ピリジルピラゾール 12 が良好な収率で得られる。リチウムジイソプロピルアミド (LDA) による式 12 の化合物のメタレーション、それに続く、二酸化炭素によるリチウム塩のクエンチングによって、式 13 のピラゾール酸が得られる。

【0056】

【化 12】

スキーム 6



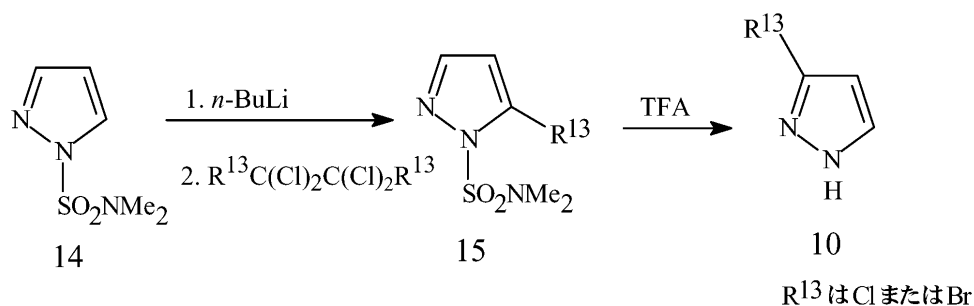
【0057】

R^{13} が CF_3 、Cl または Br である式 10 の出発ピラゾールは、既知の化合物である。文献手順 (ジャーナル オブ フルオリン ケミストリー (J. Fluorine Chem.) 1991, 53 (1), 61-70) によって、 R^{13} が CF_3 であるピラゾール 10 を調製することができる。文献手順 (H. ライムリンガー (H. Reimlinger) および A. ヴァン オーヴェシュトラテン (A. Van Overstraeten), ヒェーミッシュ ベリヒト (Chem. Ber.) 1966, 99 (10), 3350-7) によって、 R^{13} が Cl または Br であるピラゾール 10 を調製することもできる。 R^{13} が Cl または Br である 10 の調製に関する有用な別の方法について、スキーム 7 に示す。n - ブチルリチウムによるスルファモイルピラゾール 14 のメタレーション、それに続く、ヘキサクロロエタン (Cl である R^{13} に関して) または 1, 2 - ジブROMOTETRAクロロエタン (Br である R^{13} に関して) のいずれかによるアニオンの直接ハロゲン化によって、ハロゲン化誘導体 15 が得られる。室温でのトリフルオロ酢酸 (TFA) によるスルファモイル基の除去は、手際よく進み、そして R^{13} が Cl または Br であるピラゾール 10 がそれぞれ良好な収率で得られる。

【0058】

【化 1 3】

スキーム 7



10

【0059】

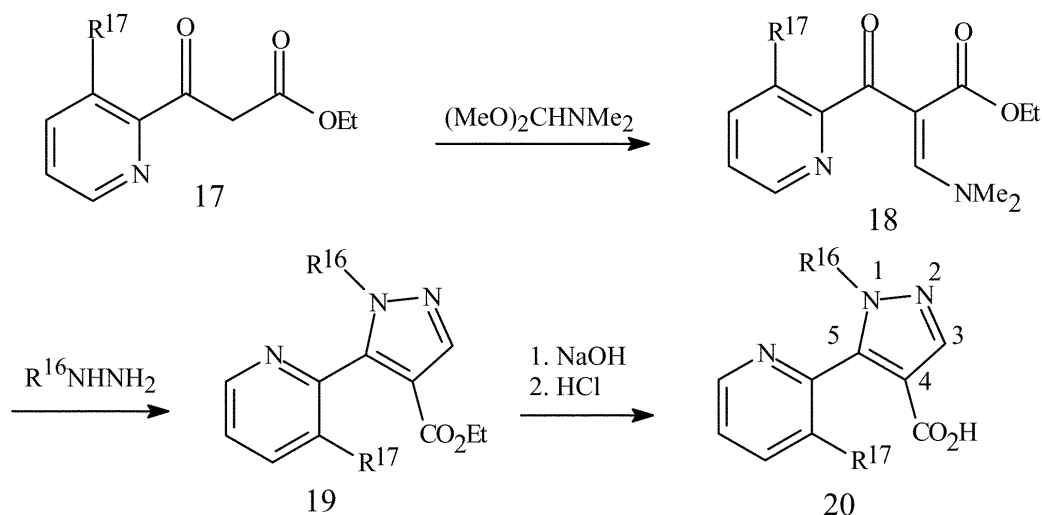
R¹⁴ が 2 - ピリジルであり、かつピラゾール環の 5 位に結合している、式 J - 2 に関連する式 20 の代表的なピラゾール酸の合成を、スキーム 8 に示す。式 18 のジメチルアミノイリデンケトエステルと置換ヒドラジンとの反応によって、ピリジルピラゾール 19 が得られる。好ましい R¹⁶ 置換基としては、アルキルおよびハロアルキルが挙げられるが、トリフルオロエチルが特に好ましい。標準加水分解によって、エステル 19 は式 20 の酸へと変換される。

【0060】

20

【化 1 4】

スキーム 8



30

【0061】

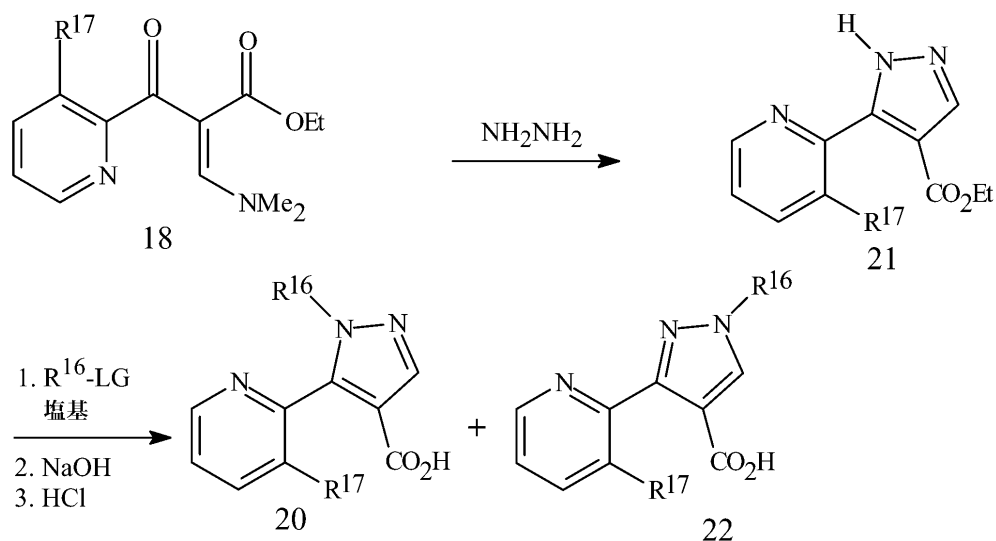
R¹⁴ が 2 - ピリジルであり、かつピラゾール環の 3 位に結合している、式 J - 3 に関連する式 22 の代表的なピラゾール酸の合成、ならびに式 20 の別の合成を、スキーム 9 に示す。式 18 のジメチルアミノイリデンケトエステルとヒドラジンとの反応によって、ピラゾール 21 が得られる。ピラゾール 21 と、アルキル化剤 R¹⁶ - LG [式中、LG はハロゲン (例えば、Br、I)、OS(O)₂CH₃ (メタンスルホネート)、OS(O)₂CF₃、OS(O)₂Ph - p - CH₃ (p - トルエンシルホネート) 等のような脱離基である] との反応によって、ピリジルピラゾールの混合物が得られる。ピラゾール異性体のこの混合物は、クロマトグラフィー法によって容易に分離され、そして相当する酸 20 および 22 に変換される。好ましい R¹⁶ 置換基としては、アルキルおよびハロアルキル基が挙げられる。

40

【0062】

【化 1 5】

スキーム 9



10

【0063】

20

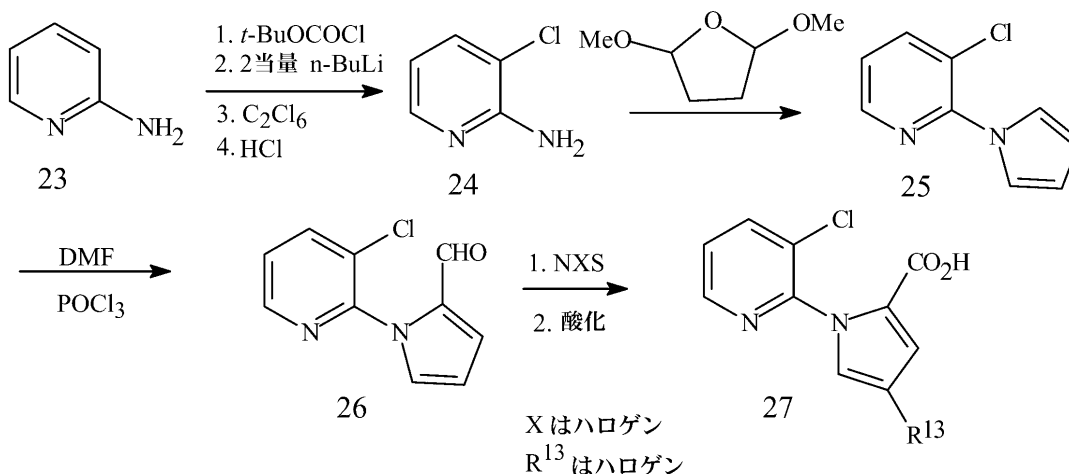
R^{14} が 2 - ピリジルであり、かつピロール環の窒素に結合している、式 J - 4 に関連する式 27 のピラゾール酸の合成を、スキーム 10 に示す。3 - クロロ - 2 - アミノピリジン 24 は既知の化合物である（ジャーナル オブ ヘテロサイクリック ケミストリー（J. Heterocycl. Chem.）1987, 24（5）, 1313 - 16 を参照のこと）。2 - アミノピリジン 23 からの 24 の都合のよい調製は、保護、オルト - メタレーション、塩素化およびそれに続く脱保護を含む。2, 5 - ジメトキシテトラヒドロフランによる式 24 の化合物の処理によって、ピロール 25 が得られる。標準ヴィルスマイヤー - ハーク（Vilsmeier - Haack）ホルミル化条件を使用することによって、式 26 のアルデヒドへのピロール 25 のホルミル化を完了することができる。N - ハロスクシンイミド（NXS）による式 26 の化合物のハロゲン化は、ピロール環の 4 位

30

【0064】

【化 16】

スキーム 10



10

【0065】

R¹⁴ がフェニルまたは 2 - ピリジルであり、かつピロール環の 2 位に結合している、式 J - 5 に関連する式 33 のピロール酸の合成を、スキーム 11 に示す。式 29 のアリールスルホンアミドによる式 30 のアレンの付加環化 (パブリ, N. P. (Pavri, N. P.); トルデル, M. L. (Trudell, M. L.), ジャーナル オブ オーガニック ケミストリー (J. Org. Chem.) 1997, 62, 2649 - 2651 を参照のこと) によって、式 31 のピロリンが得られる。テトラブチルアンモニウムフロリド (TBAF) による式 31 のピロリンの処理によって、式 32 のピロールが得られる。ピロール 32 と、アルキル化剤 R¹⁶ - LG [式中、上記で定義される通り、LG は脱離基である] との反応と、それに続く加水分解によって、式 33 のピロール酸が得られる。

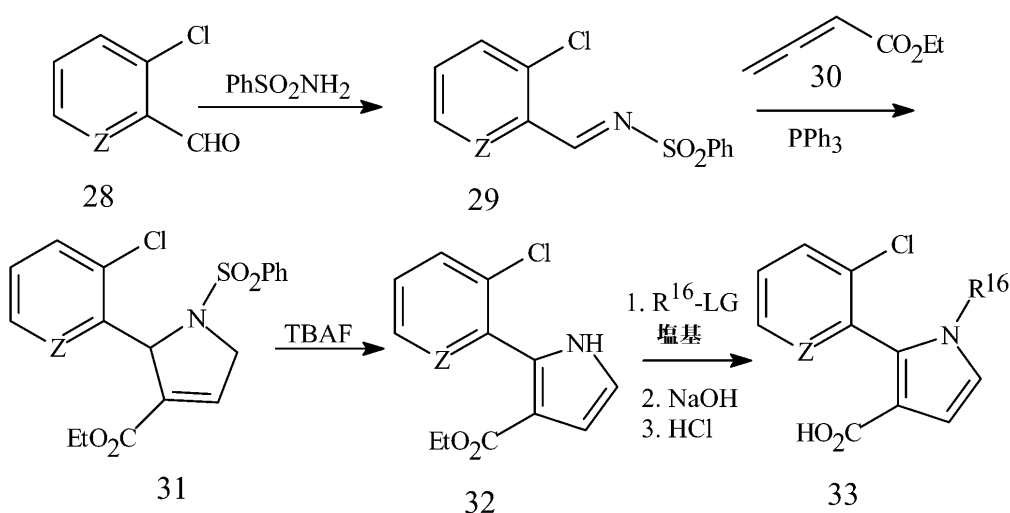
20

【0066】

【化 17】

30

スキーム 11



式中、Zは、NまたはCH

40

【0067】

R¹⁴ が 2 - クロロフェニルまたは 3 - クロロ - 2 - ピリジルである、式 J - 6 に関連する式 36 のピロール酸の合成を、スキーム 12 に示す。式 34 のケイ皮酸エステルと、

50

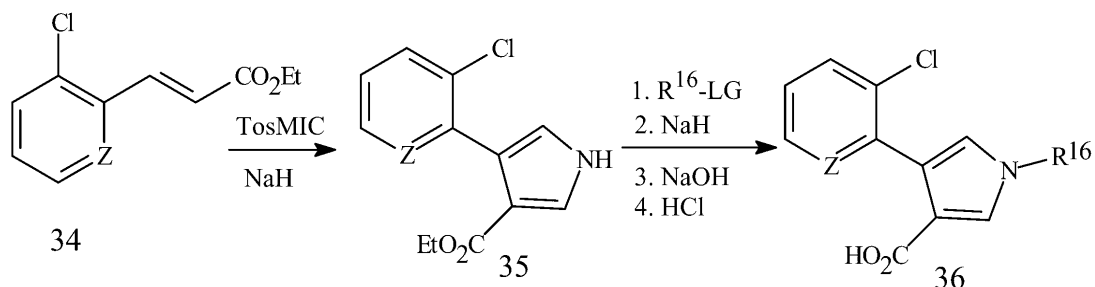
トシルメチルイソシアニド (TosMIC) との反応によって、式 35 のピロールが提供される。この方法に関する先行文献としては、スー, Z (Xu, Z) ら, ジャーナル オブ オーガニック ケミストリー (J. Org. Chem.) 1998, 63, 5031 - 5041 を参照のこと。式 35 の化合物と、式 R^{16} -LG [式中、上記で定義される通り、LG は脱離基である] のアルキル化剤との反応と、それに続くエステル加水分解によって、式 36 のピロール酸が得られる。

【 0 0 6 8 】

【 化 1 8 】

スキーム 12

10



式中、Zは、NまたはCH

20

【 0 0 6 9 】

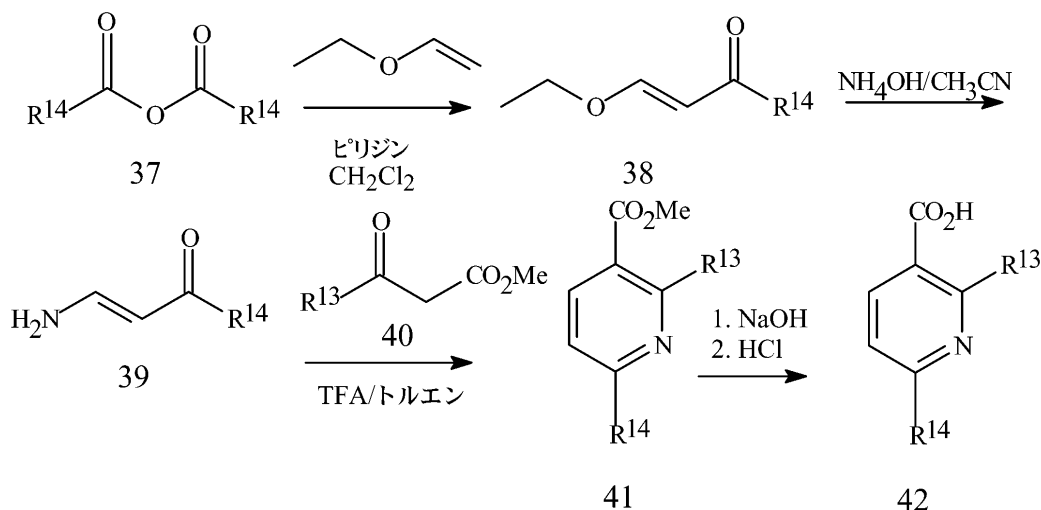
式 J - 7 に関連する式 42 のピリジン酸の合成を、式 13 に示す。この手順は、 α -ケトエステル 40 および 4 - アミノブテノン 39 からのピリジンの既知の合成を伴う。置換基 R^{13} および R^{14} としては、例えば、フェニル、アルキルおよびハロアルキルが挙げられる。

【 0 0 7 0 】

【 化 1 9 】

スキーム 13

30



40

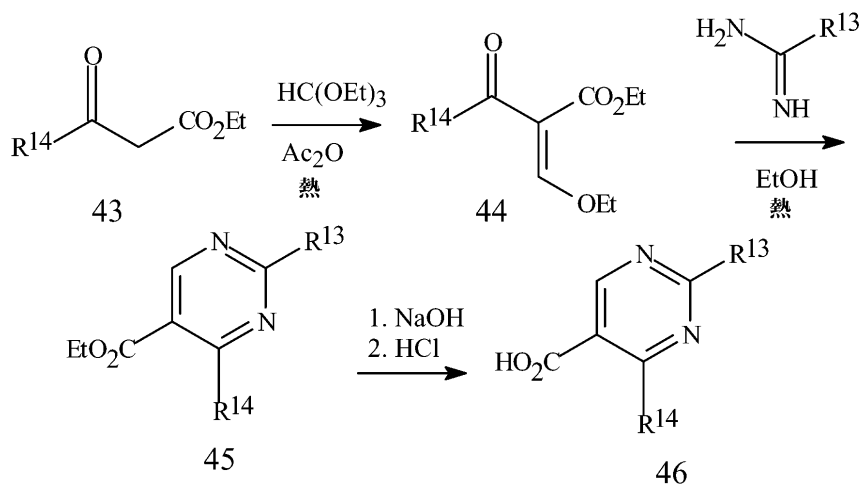
【 0 0 7 1 】

式 J - 8 に関連する式 46 のピリジン酸の合成を、式 14 に示す。この手順は、ピニリデンケトエステル 44 およびアミジンからのピリミジンの既知の合成を伴う。置換基 R^{13} および R^{14} としては、例えば、フェニル、アルキルおよびハロアルキルが挙げられる。

【 0 0 7 2 】

【化 2 0】

スキーム 14



10

【 0 0 7 3】

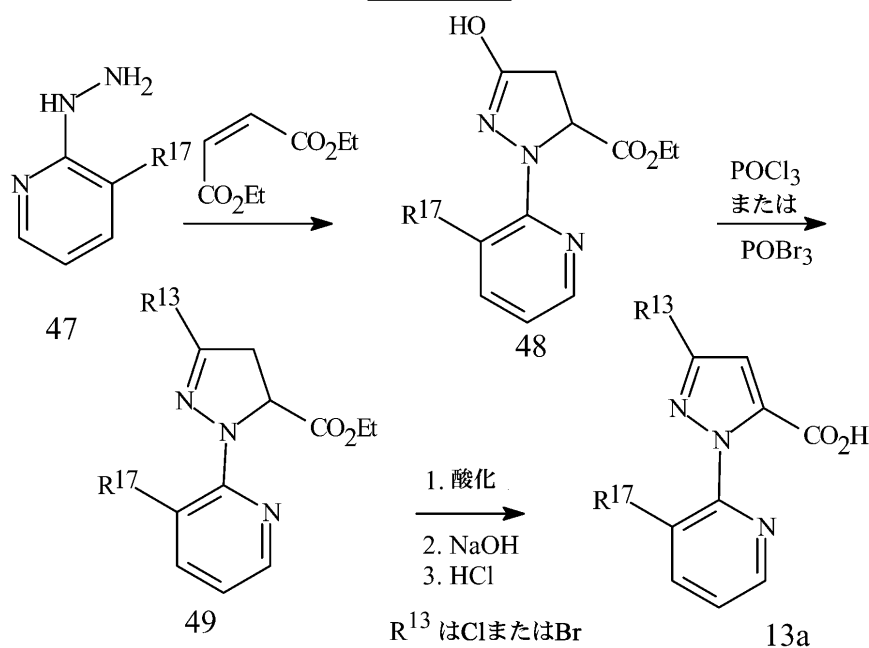
スキーム 6 に図示される方法の別の方法として、スキーム 15 に概説される方法によって、 R^{13} が Cl または Br である式 13a のピラゾールカルボン酸を調製することができる。ヒドラジノピリジン 47 とマレイン酸ジエチルとの反応により、ピラゾロン 48 が得られる。オキシ塩化リンまたはオキシ臭化リンによる塩素化または臭素化により、式 49 のハロ誘導体を得られる。場合によりピラゾールエステルを得るための酸の存在下における式 49 の化合物の酸化、それに続く、エステル官能性のカルボン酸への転換により、式 13a の化合物が提供される。酸化剤は、過酸化水素、有機ペルオキシド、過硫酸カリウム、過硫酸ナトリウム、過硫酸アンモニウム、モノ過硫酸カリウム（例えば、オキソン（Oxone）（登録商標））または過マンガン酸カリウムであり得る。

20

【 0 0 7 4】

【化 2 1】

スキーム 15



30

40

【 0 0 7 5】

式 I の化合物を調製するための上記のいくつかの試薬および反応条件は、中間体に存在

50

する特定の官能基には適合しないであろうことが認識される。これらの例において、合成系中に保護/脱保護配列または官能性の相互転換を組み入れることにより、所望の生成物を得ることが助けられるだろう。保護基の使用および選択は化学合成の当業者に明白であろう（例えば、グリーン，T.W. (Greene, T.W.)；ワッツ，P.G.M. (Wuts, P.G.M.) プロテクトティブ グループス イン オーガニック シンテシス (Protective Groups in Organic Synthesis)，第2版；ウィリー (Wiley)：ニューヨーク (New York)，1991を参照のこと)。いくつかの場合、いずれかの個々のスキームに記述されたように与えられた試薬の導入後、式Iの化合物の合成を完了するために、詳細に記載されていない追加の慣例合成工程を実行する必要があることを当業者は認識するだろう。式Iの化合物を調製するために提案された特定の順序により示されるもの以外の順番で、上記スキームに図示された工程の組み合わせを実行する必要があることも当業者は認識するだろう。

10

【0076】

置換基を加えるため、または存在する置換基を変性するために、本明細書に記載の式Iの化合物および中間体に、様々な求電子、求核、ラジカル、有機金属、酸化および還元反応を受けさせることができることも当業者は認識するだろう。

【0077】

さらなる詳細がなくても、前記を使用する当業者は、本発明をその最も十分な範囲まで利用することができると考えられる。従って、以下の実施例は単なる実例として解釈され、かついずれかの様式に本開示を限定するものではない。クロマトグラフィー溶媒混合物を除いて、または特記されない限り、パーセントは重量によるものである。特記されない限り、クロマトグラフィー溶媒混合物に関する部およびパーセントは体積によるものである。¹H NMRスペクトルは、テトラメチルシランからのppm低磁場で報告され、sは一重項であり、dは二重項であり、tは三重項であり、qは四重項であり、mは多重項であり、ddは二重項の二重項であり、dtは三重項の二重項であり、br sは広域一重項である。

20

【実施例】

【0078】

実施例 1

3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - メチル - 6 - [[[1 - メチル - 2 - [[(トリメチルシリル)メチル]チオ]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドの調製
工程A：2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - オキソ - 3 - ピラゾリジンカルボン酸エチルの調製

30

メカニカルスターラー、温度計、添加ロート、還流冷却器および窒素インレットを備えた2 L 4つ口フラスコに、無水エタノール (250 mL) およびナトリウムエトキシドのエタノール溶液 (21%、190 mL、0.504 モル) を充填した。混合物を加熱し、約83 °Cで還流させた。次いで、それを3 - クロロ - 2 (1H) - ピリジノンヒドラゾン (68.0 g、0.474 モル) によって処理した。混合物を再加熱し、5分間かけて還流させた。次いで、5分間かけて、黄色スラリーをマレイン酸ジエチル (88.0 mL、0.544 モル) によって滴下処理した。添加の間、還流速度は著しく増加した。全ての添加が終了するまでに、出発材料は溶解した。得られた赤オレンジ色溶液を、還流下で10分間保持した。65 °Cまで冷却後、反応混合物を氷酢酸 (50.0 mL、0.873 モル) によって処理した。沈殿物が形成した。混合物を水 (650 mL) で希釈し、沈殿物を溶解させた。オレンジ色溶液を氷浴で冷却させた。生成物は、28 °Cで沈殿を開始した。2時間、約2 °Cでスラリーを保持した。生成物を濾過によって単離し、水性エタノール (40%、3 x 50 mL) によって洗浄し、次いで、約1時間、フィルター上で空気乾燥させた。高結晶性、淡オレンジ色粉末として、表題生成物の化合物が得られた (70.3 g、収率55%)。¹H NMRによって、重要な不純物は観察されなかった。

40

¹H NMR (DMSO - d₆) : 1.22 (t, 3H), 2.35 (d, 1H), 2 50

． 9 1 (d d , 1 H) , 4 . 2 0 (q , 2 H) , 4 . 8 4 (d , 1 H) , 7 . 2 0 (d d , 1 H) , 7 . 9 2 (d , 1 H) , 8 . 2 7 (d , 1 H) , 1 0 . 1 8 (s , 1 H) 。

【 0 0 7 9 】

工程 B : 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチルの調製

メカニカルスターラー、温度計、還流冷却器および窒素インレットを備えた 1 L 4 つ口フラスコに、アセトニトリル (4 0 0 m L) 、 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 5 - オキソ - 3 - ピラゾリジンカルボン酸エチル (すなわち、工程 A の生成物) (5 0 . 0 g 、 0 . 1 8 5 モル) およびオキシ臭化リン (3 4 . 0 g 、 0 . 1 1 9 モル) を充填した。オレンジ色スラリーを加熱し、 2 0 分間かけて 8 3 で還流させた。得られた混濁オレンジ色溶液を還流下で 7 5 分間保持し、この時点で、高密度、黄褐色の、結晶性沈殿物が形成した。還流冷却器を蒸留ヘッドと交換し、そして混濁無色蒸留液 (3 0 0 m L) を回収した。メカニカルスターラーを備えた第 2 の 1 L 4 つ口フラスコに、重炭酸ナトリウム (4 5 g 、 0 . 5 4 モル) および水 (2 0 0 m L) を充填した。5 分間かけて、濃縮反応混合物を重炭酸ナトリウムスラリーに添加した。得られた二相混合物を 5 分間、強力に攪拌し、この時点で気体発生が止まった。混合物をジクロロメタン (2 0 0 m L) で希釈し、次いで 7 5 分間攪拌した。混合物を、 5 g のセライト (C e l i t e) (登録商標) 5 4 5 の珪藻土フィルターエイドによって処理し、次いで、濾過し、茶色タール状物質を除去した。濾液を分液ロートへと移した。茶色有機層 (4 0 0 m L) を分離し、次いで、硫酸マグネシウム (1 5 g) およびダルコ (D a r c o) (登録商標) G 6 0 活性化チャコール (2 . 0 g) によって処理した。得られたスラリーを 1 5 分間、磁気によって攪拌し、次いで濾過し、硫酸マグネシウムおよびチャコールを除去した。緑色濾液をシリカゲル (3 g) によって処理し、そして数分間攪拌した。深青緑色シリカゲルを濾過によって除去し、濾液をロータリーエバポレーター上で濃縮した。生成物は淡琥珀色油状物 (5 8 . 6 g 、 収率 9 5 %) からなり、これは静置下で結晶化した。 ^1H NMR によって観察された唯一の明白な不純物は、 0 . 3 % のアセトニトリルであった。

^1H NMR (DMSO - d_6) : 1 . 1 5 (t , 3 H) , 3 . 2 9 (d d , 1 H) , 3 . 6 0 (d d , 1 H) , 4 . 1 1 (q , 2 H) , 5 . 2 0 (d d , 1 H) , 6 . 9 9 (d d , 1 H) , 7 . 8 4 (d , 1 H) , 8 . 1 2 (d , 1 H) 。

【 0 0 8 0 】

工程 C : 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチルの調製

メカニカルスターラー、温度計、還流冷却器および窒素インレットを備えた 1 L 4 つ口フラスコに、 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル (すなわち、工程 B の生成物) (4 0 . 2 g 、 0 . 1 2 1 モル) 、アセトニトリル (3 0 0 m L) および硫酸 (9 8 % 、 1 3 . 0 m L 、 0 . 2 4 5 モル) を充填した。硫酸添加時に、混合物は、 2 2 から 3 6 へと自然発熱した。数分間攪拌後、混合物を過硫酸カリウム (4 8 . 0 g 、 0 . 1 7 8 モル) によって処理した。スラリーを加熱し、 8 4 で 2 時間還流させた。まだ温かい (5 0 ~ 6 5) 、得られたオレンジ色スラリーを濾過し、白色沈殿物を除去した。濾過ケーキをアセトニトリルで 2 回洗浄した (2 x 5 0 m L) 。ロータリーエバポレーター上で、濾液を約 2 0 0 m L まで濃縮した。メカニカルスターラーを備えた第 2 の 1 L 4 つ口フラスコに、水 (4 0 0 m L) を充填した。約 5 分間かけて、濃縮された反応物質を水に添加した。濾過によって生成物を単離し、水性アセトニトリル (2 0 % 、 1 0 0 m L) および水 (7 5 m L) によって連続的に洗浄し、次いで、約 1 時間、フィルター上で空気乾燥させた。生成物は、結晶性オレンジ色粉末からなった (3 6 . 6 g 、 収率 9 0 %) 。 ^1H NMR によって観察された唯一の明白な不純物は、約 1 % の未知物質および 0 . 5 % のアセトニトリルであった。

^1H NMR (DMSO - d_6) : 1 . 0 9 (t , 3 H) , 4 . 1 6 (q , 2 H) , 7 . 3 5 (s , 1 H) , 7 . 7 2 (d d , 1 H) , 8 . 3 9 (d , 1 H) , 8 . 5 9 (d ,

1 H)。

【0081】

工程D：3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸の調製

メカニカルスターラー、温度計および窒素インレットを備えた300 mL 4つ口フラスコに、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸エチル(すなわち、工程Cの生成物)(純度98.5%、25.0 g、0.0756モル)、メタノール(75 mL)、水(50 mL)および水酸化ナトリウムペレット(3.30 g、0.0825モル)を充填した。水酸化ナトリウム添加時に、混合物は29

から34へと自然発熱し、そして出発材料の溶解が開始した。周囲条件下で90分間
10 攪拌後、全ての出発材料は溶解した。得られた暗オレンジ色溶液を、ロータリーエバポレーター上で約90 mLまで濃縮した。次いで、濃縮された反応混合物を水(160 mL)で希釈した。水溶液をエーテル(100 mL)で抽出した。次いで、水層を、マグネチックスターラーを備えた500 mL エルレンマイヤーフラスコに移した。約10分間かけて、溶液を、濃塩酸(8.50 g、0.0839モル)によって滴下処理した。濾過によって生成物を単離し、水(2×40 mL)によって再スラリー化し、水(25 mL)でカバ

ーを1回洗浄し、次いで、2時間、フィルター上で空気乾燥させた。生成物は、結晶性、
20 黄褐色粉末からなった(20.9 g、収率91%)。¹H NMRによって観察された唯一の明白な不純物は、約0.8%の未知物質および0.7%のエーテルであった。

¹H NMR(DMSO-d₆): 7.25(s, 1H), 13.95(br s, 1
H), 8.56(d, 1H), 8.25(d, 1H), 7.68(dd, 1H)。

【0082】

工程E：2 - [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] - 6 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - 3, 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オンの調製

塩化メタンスルホニル(1.0 mL、1.5 g、13ミリモル)をアセトニトリル(10 mL)に溶解し、そして混合物を-5℃まで冷却した。-5℃~0℃で、アセトニトリル(10 mL)中、3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸(すなわち、工程Dの生成物)(3.02 g、10ミリモル)および
30 ピリジン(1.4 mL、1.4 g、17ミリモル)の溶液を、5分間かけて滴下して添加した。添加の間、スラリーが形成した。この温度で混合物を5分間攪拌し、次いで、アセトニトリル(10 mL)中、2 - アミノ - 3 - メチル - 5 - クロロ安息香酸(1.86 g、10ミリモル)およびピリジン(2.8 mL、2.7 g、35ミリモル)の混合物を添加し、さらなるアセトニトリル(5 mL)ですすいだ。混合物を-5℃~0℃で15分間攪拌し、次いで、5分間かけて、-5℃~0℃の温度で、アセトニトリル(5 mL)中、塩化メタンスルホニル(1.0 mL、1.5 mL、13ミリモル)を滴下して添加した。この温度で反応混合物を15分間以上攪拌し、次いで、ゆっくり室温まで加温し、そして4時間攪拌した。水(20 mL)を滴下して添加し、そして混合物を15分間攪拌した。次いで、混合物を濾過し、そして2:1アセトニトリル - 水(3×3 mL)、次いでアセトニトリル(2×3 mL)で固体を洗浄し、そして窒素下で乾燥させて、203℃~20
40 5℃で融解する4.07 g(粗製収率90.2%)の淡黄色粉末として表題の生成物を得た。ゾルボックス(Zorbax)(登録商標)RX-C8クロマトグラフィーカラム(4.6 mm×25 cm、溶出剤25%~95%アセトニトリル/pH3の水)を使用する生成物のHPLCによって、表題の生成物に相当し、かつ95.7%の総クロマトグラムピーク面積を有する主要ピークが示された。

¹H NMR(DMSO-d₆): 1.72(s, 3H) 7.52(s, 1H), 7.72-7.78(m, 2H), 7.88(m, 1H), 8.37(dd, 1H), 8.62(dd, 1H)。

【0083】

工程F：3 - ブロモ - N - [4 - クロロ - 2 - メチル - 6 - [[[1 - メチル - 2 - [[

10

20

30

40

50

(トリメチルシリル)メチル]チオ]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの調製

テトラヒドロフラン中、2-[3-プロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンゾオキサジン-4-オン(すなわち、工程Eのベンゾオキサジノン生成物)(0.23g、0.51ミリモル)の溶液に、1-トリメチルシリルメチルチオ-2-プロピルアミン(0.103g、0.58ミリモル)を添加し、そして反応混合物を80℃まで3時間加熱し、次いで室温まで冷却した。減圧下でテトラヒドロフラン溶媒をエバポレーションし、そして残渣固体を、溶出剤としてヘキサン/酢酸エチル(5:1)によってシリカゲル上でクロマトグラフして、m.p. 151 ~ 153℃の白色固体(73mg)として、本発明の化合物である表題の生成物を得た。 10

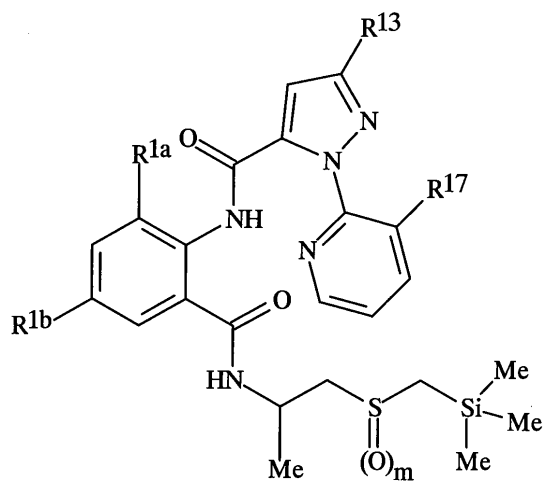
¹H NMR(CDCl₃): 0.097(s, 9H), 1.30(d, 3H), 1.83(s, 2H), 2.19(s, 3H), 2.70(d, 2H), 4.32(m, 1H), 6.22(bd, 1H), 7.22(m, 2H), 7.05(s, 1H), 7.28(m, 2H), 7.38(dd, 1H), 7.84(dd, 1H), 8.45(dd, 1H), 10.10(bs, 1H)。

【0084】

当該分野で既知の方法とともに本明細書に記載の手順により、以下の表1~8の化合物を調製することができる。表中、以下の略号を使用する: Meはメチルであり、そしてCNはシアノである。 20

【0085】

表 1



<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>		<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>
Me	Cl	Cl	Cl	0		Me	Cl	Cl	Cl	1
Me	Br	Cl	Cl	0		Me	Br	Cl	Cl	1
Me	F	Cl	Cl	0		Me	F	Cl	Cl	1
Me	I	Cl	Cl	0		Me	I	Cl	Cl	1
Me	CN	Cl	Cl	0		Me	CN	Cl	Cl	1
Cl	Cl	Cl	Cl	0		Cl	Cl	Cl	Cl	1
Cl	Br	Cl	Cl	0		Cl	Br	Cl	Cl	1
Cl	F	Cl	Cl	0		Cl	F	Cl	Cl	1

【 0 0 8 6 】

30

【表 2】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>
Cl	I	Cl	Cl	0	Cl	I	Cl	Cl	1
Cl	CN	Cl	Cl	0	Cl	CN	Cl	Cl	1
Br	Cl	Cl	Cl	0	Br	Cl	Cl	Cl	1
Br	Br	Cl	Cl	0	Br	Br	Cl	Cl	1
Br	F	Cl	Cl	0	Br	F	Cl	Cl	1
Br	I	Cl	Cl	0	Br	I	Cl	Cl	1
Br	CN	Cl	Cl	0	Br	CN	Cl	Cl	1
Me	Cl	Br	Cl	0	Me	Cl	Br	Cl	1
Me	Br	Br	Cl	0	Me	Br	Br	Cl	1
Me	F	Br	Cl	0	Me	F	Br	Cl	1
Me	I	Br	Cl	0	Me	I	Br	Cl	1
Me	CN	Br	Cl	0	Me	CN	Br	Cl	1
Cl	Cl	Br	Cl	0	Cl	Cl	Br	Cl	1
Cl	Br	Br	Cl	0	Cl	Br	Br	Cl	1
Cl	F	Br	Cl	0	Cl	F	Br	Cl	1
Cl	I	Br	Cl	0	Cl	I	Br	Cl	1
Cl	CN	Br	Cl	0	Cl	CN	Br	Cl	1
Br	Cl	Br	Cl	0	Br	Cl	Br	Cl	1
Br	Br	Br	Cl	0	Br	Br	Br	Cl	1
Br	F	Br	Cl	0	Br	F	Br	Cl	1
Br	I	Br	Cl	0	Br	I	Br	Cl	1
Br	CN	Br	Cl	0	Br	CN	Br	Cl	1
Me	Cl	CF ₃	Cl	0	Me	Cl	CF ₃	Cl	1
Me	Br	CF ₃	Cl	0	Me	Br	CF ₃	Cl	1
Me	F	CF ₃	Cl	0	Me	F	CF ₃	Cl	1
Me	I	CF ₃	Cl	0	Me	I	CF ₃	Cl	1
Me	CN	CF ₃	Cl	0	Me	CN	CF ₃	Cl	1
Cl	Cl	CF ₃	Cl	0	Cl	Cl	CF ₃	Cl	1
Cl	Br	CF ₃	Cl	0	Cl	Br	CF ₃	Cl	1
Cl	F	CF ₃	Cl	0	Cl	F	CF ₃	Cl	1
Cl	I	CF ₃	Cl	0	Cl	I	CF ₃	Cl	1
Cl	CN	CF ₃	Cl	0	Cl	CN	CF ₃	Cl	1
Br	Cl	CF ₃	Cl	0	Br	Cl	CF ₃	Cl	1
Br	Br	CF ₃	Cl	0	Br	Br	CF ₃	Cl	1
Br	F	CF ₃	Cl	0	Br	F	CF ₃	Cl	1
Br	I	CF ₃	Cl	0	Br	I	CF ₃	Cl	1
Br	CN	CF ₃	Cl	0	Br	CN	CF ₃	Cl	1

10

20

30

40

【表 3】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>
Me	Cl	OCHF ₂	Cl	0	Me	Cl	OCHF ₂	Cl	1
Me	Br	OCHF ₂	Cl	0	Me	Br	OCHF ₂	Cl	1
Me	F	OCHF ₂	Cl	0	Me	F	OCHF ₂	Cl	1
Me	I	OCHF ₂	Cl	0	Me	I	OCHF ₂	Cl	1
Me	CN	OCHF ₂	Cl	0	Me	CN	OCHF ₂	Cl	1
Cl	Cl	OCHF ₂	Cl	0	Cl	Cl	OCHF ₂	Cl	1
Cl	Br	OCHF ₂	Cl	0	Cl	Br	OCHF ₂	Cl	1
Cl	F	OCHF ₂	Cl	0	Cl	F	OCHF ₂	Cl	1
Cl	I	OCHF ₂	Cl	0	Cl	I	OCHF ₂	Cl	1
Cl	CN	OCHF ₂	Cl	0	Cl	CN	OCHF ₂	Cl	1
Br	Cl	OCHF ₂	Cl	0	Br	Cl	OCHF ₂	Cl	1
Br	Br	OCHF ₂	Cl	0	Br	Br	OCHF ₂	Cl	1
Br	F	OCHF ₂	Cl	0	Br	F	OCHF ₂	Cl	1
Br	I	OCHF ₂	Cl	0	Br	I	OCHF ₂	Cl	1
Br	CN	OCHF ₂	Cl	0	Br	CN	OCHF ₂	Cl	1
Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Me	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Me	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Me	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Me	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Me	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Me	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Cl	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Cl	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Cl	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Cl	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Br	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Br	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Br	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Br	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Br	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Br	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Br	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	Br	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	1
Me	Cl	Cl	Br	0	Me	Cl	Cl	Br	1
Me	Cl	Cl	Cl	2	Me	Cl	CF ₃	Cl	2
Me	Br	Cl	Cl	2	Me	Br	CF ₃	Cl	2
Me	F	Cl	Cl	2	Me	F	CF ₃	Cl	2
Me	I	Cl	Cl	2	Me	I	CF ₃	Cl	2
Me	CN	Cl	Cl	2	Me	CN	CF ₃	Cl	2
Cl	Cl	Cl	Cl	2	Cl	Cl	CF ₃	Cl	2

10

20

30

40

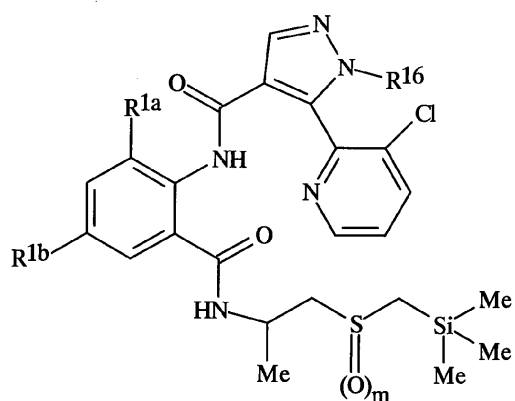
【表 4】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>R¹⁷</u>	<u>m</u>
Cl	Br	Cl	Cl	2	Cl	Br	CF ₃	Cl	2
Cl	F	Cl	Cl	2	Cl	F	CF ₃	Cl	2
Cl	I	Cl	Cl	2	Cl	I	CF ₃	Cl	2
Cl	CN	Cl	Cl	2	Cl	CN	CF ₃	Cl	2
Br	Cl	Cl	Cl	2	Br	Cl	CF ₃	Cl	2
Br	Br	Cl	Cl	2	Br	Br	CF ₃	Cl	2
Br	F	Cl	Cl	2	Br	F	CF ₃	Cl	2
Br	I	Cl	Cl	2	Br	I	CF ₃	Cl	2
Br	CN	Cl	Cl	2	Br	CN	CF ₃	Cl	2
Me	Cl	Br	Cl	2	Me	Cl	OCHF ₂	Cl	2
Me	Br	Br	Cl	2	Me	Br	OCHF ₂	Cl	2
Me	F	Br	Cl	2	Me	F	OCHF ₂	Cl	2
Me	I	Br	Cl	2	Me	I	OCHF ₂	Cl	2
Me	CN	Br	Cl	2	Me	CN	OCHF ₂	Cl	2
Cl	Cl	Br	Cl	2	Cl	Cl	OCHF ₂	Cl	2
Cl	Br	Br	Cl	2	Cl	Br	OCHF ₂	Cl	2
Cl	F	Br	Cl	2	Cl	F	OCHF ₂	Cl	2
Cl	I	Br	Cl	2	Cl	I	OCHF ₂	Cl	2
Cl	CN	Br	Cl	2	Cl	CN	OCHF ₂	Cl	2
Br	Cl	Br	Cl	2	Br	Cl	OCHF ₂	Cl	2
Br	Br	Br	Cl	2	Br	Br	OCHF ₂	Cl	2
Br	F	Br	Cl	2	Br	F	OCHF ₂	Cl	2
Br	I	Br	Cl	2	Br	I	OCHF ₂	Cl	2
Br	CN	Br	Cl	2	Br	CN	OCHF ₂	Cl	2
Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	2	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	2
Me	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	2	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	2
Me	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	2	Cl	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	2
Me	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	2	Cl	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	2
Me	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	2	Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	2
Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	2	Br	I	OCH ₂ CF ₃	Cl	2
Br	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	2	Br	CN	OCH ₂ CF ₃	Cl	2
Br	F	OCH ₂ CF ₃	Cl	2					

【 0 0 8 9 】

【表 5】

表 2



<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>
Me	Cl	CHF ₂	0	Me	Cl	CHF ₂	1
Me	Br	CHF ₂	0	Me	Br	CHF ₂	1
Me	F	CHF ₂	0	Me	F	CHF ₂	1
Me	I	CHF ₂	0	Me	I	CHF ₂	1
Me	CN	CHF ₂	0	Me	CN	CHF ₂	1
Cl	Cl	CHF ₂	0	Cl	Cl	CHF ₂	1
Cl	Br	CHF ₂	0	Cl	Br	CHF ₂	1
Cl	F	CHF ₂	0	Cl	F	CHF ₂	1
Cl	I	CHF ₂	0	Cl	I	CHF ₂	1
Cl	CN	CHF ₂	0	Cl	CN	CHF ₂	1
Br	Cl	CHF ₂	0	Br	Cl	CHF ₂	1
Br	Br	CHF ₂	0	Br	Br	CHF ₂	1
Br	F	CHF ₂	0	Br	F	CHF ₂	1
Br	I	CHF ₂	0	Br	I	CHF ₂	1
Br	CN	CHF ₂	0	Br	CN	CHF ₂	1
Me	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Me	Br	CH ₂ CF ₃	0	Me	Br	CH ₂ CF ₃	1
Me	F	CH ₂ CF ₃	0	Me	F	CH ₂ CF ₃	1
Me	I	CH ₂ CF ₃	0	Me	I	CH ₂ CF ₃	1
Me	CN	CH ₂ CF ₃	0	Me	CN	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Br	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	1
Cl	F	CH ₂ CF ₃	0	Cl	F	CH ₂ CF ₃	1
Cl	I	CH ₂ CF ₃	0	Cl	I	CH ₂ CF ₃	1
Cl	CN	CH ₂ CF ₃	0	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	1
Br	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Br	Br	CH ₂ CF ₃	0	Br	Br	CH ₂ CF ₃	1

【表 6】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>
Br	F	CH ₂ CF ₃	0	Br	F	CH ₂ CF ₃	1
Br	I	CH ₂ CF ₃	0	Br	I	CH ₂ CF ₃	1
Br	CN	CH ₂ CF ₃	0	Br	CN	CH ₂ CF ₃	1
Me	Cl	CHF ₂	2	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Me	Br	CHF ₂	2	Me	Br	CH ₂ CF ₃	2
Me	F	CHF ₂	2	Me	F	CH ₂ CF ₃	2
Me	I	CHF ₂	2	Me	I	CH ₂ CF ₃	2
Me	CN	CHF ₂	2	Me	CN	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Cl	CHF ₂	2	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Br	CHF ₂	2	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	2
Cl	F	CHF ₂	2	Cl	F	CH ₂ CF ₃	2
Cl	I	CHF ₂	2	Cl	I	CH ₂ CF ₃	2
Cl	CN	CHF ₂	2	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	2
Br	Cl	CHF ₂	2	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Br	Br	CHF ₂	2	Br	Br	CH ₂ CF ₃	2
Br	F	CHF ₂	2	Br	F	CH ₂ CF ₃	2
Br	I	CHF ₂	2	Br	I	CH ₂ CF ₃	2
Br	CN	CHF ₂	2	Br	CN	CH ₂ CF ₃	2

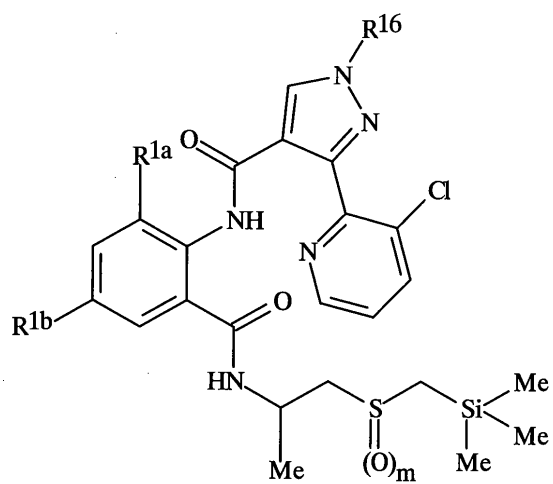
10

20

【 0 0 9 1 】

【表 7】

表 3



10

<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>
Me	Cl	CHF ₂	0	Me	Cl	CHF ₂	1
Me	Br	CHF ₂	0	Me	Br	CHF ₂	1
Me	F	CHF ₂	0	Me	F	CHF ₂	1
Me	I	CHF ₂	0	Me	I	CHF ₂	1
Me	CN	CHF ₂	0	Me	CN	CHF ₂	1

20

【 0 0 9 2 】

【表 8】

<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>
Cl	Cl	CHF ₂	0	Cl	Cl	CHF ₂	1
Cl	Br	CHF ₂	0	Cl	Br	CHF ₂	1
Cl	F	CHF ₂	0	Cl	F	CHF ₂	1
Cl	I	CHF ₂	0	Cl	I	CHF ₂	1
Cl	CN	CHF ₂	0	Cl	CN	CHF ₂	1
Br	Cl	CHF ₂	0	Br	Cl	CHF ₂	1
Br	Br	CHF ₂	0	Br	Br	CHF ₂	1
Br	F	CHF ₂	0	Br	F	CHF ₂	1
Br	I	CHF ₂	0	Br	I	CHF ₂	1
Br	CN	CHF ₂	0	Br	CN	CHF ₂	1
Me	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Me	Br	CH ₂ CF ₃	0	Me	Br	CH ₂ CF ₃	1
Me	F	CH ₂ CF ₃	0	Me	F	CH ₂ CF ₃	1
Me	I	CH ₂ CF ₃	0	Me	I	CH ₂ CF ₃	1
Me	CN	CH ₂ CF ₃	0	Me	CN	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Br	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	1
Cl	F	CH ₂ CF ₃	0	Cl	F	CH ₂ CF ₃	1
Cl	I	CH ₂ CF ₃	0	Cl	I	CH ₂ CF ₃	1
Cl	CN	CH ₂ CF ₃	0	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	1
Br	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Br	Br	CH ₂ CF ₃	0	Br	Br	CH ₂ CF ₃	1
Br	F	CH ₂ CF ₃	0	Br	F	CH ₂ CF ₃	1
Br	I	CH ₂ CF ₃	0	Br	I	CH ₂ CF ₃	1
Br	CN	CH ₂ CF ₃	0	Br	CN	CH ₂ CF ₃	1
Me	Cl	CHF ₂	2	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Me	Br	CHF ₂	2	Me	Br	CH ₂ CF ₃	2
Me	F	CHF ₂	2	Me	F	CH ₂ CF ₃	2
Me	I	CHF ₂	2	Me	I	CH ₂ CF ₃	2
Me	CN	CHF ₂	2	Me	CN	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Cl	CHF ₂	2	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Br	CHF ₂	2	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	2
Cl	F	CHF ₂	2	Cl	F	CH ₂ CF ₃	2
Cl	I	CHF ₂	2	Cl	I	CH ₂ CF ₃	2
Cl	CN	CHF ₂	2	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	2
Br	Cl	CHF ₂	2	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Br	Br	CHF ₂	2	Br	Br	CH ₂ CF ₃	2

10

20

30

40

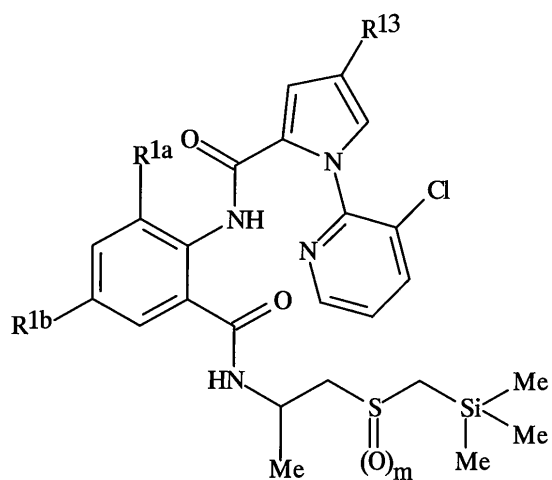
【表 9】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>
Br	F	CHF ₂	2	Br	F	CH ₂ CF ₃	2
Br	I	CHF ₂	2	Br	I	CH ₂ CF ₃	2
Br	CN	CHF ₂	2	Br	CN	CH ₂ CF ₃	2

【 0 0 9 4 】

【表 1 0】

表 4



10

<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R13</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R13</u>	<u>m</u>
Me	Cl	Cl	0	Me	Cl	Cl	1
Me	Br	Cl	0	Me	Br	Cl	1
Me	F	Cl	0	Me	F	Cl	1
Me	I	Cl	0	Me	I	Cl	1
Me	CN	Cl	0	Me	CN	Cl	1
Cl	Cl	Cl	0	Cl	Cl	Cl	1
Cl	Br	Cl	0	Cl	Br	Cl	1
Cl	F	Cl	0	Cl	F	Cl	1
Cl	I	Cl	0	Cl	I	Cl	1
Cl	CN	Cl	0	Cl	CN	Cl	1
Br	Cl	Cl	0	Br	Cl	Cl	1
Br	Br	Cl	0	Br	Br	Cl	1
Br	F	Cl	0	Br	F	Cl	1
Br	I	Cl	0	Br	I	Cl	1
Br	CN	Cl	0	Br	CN	Cl	1
Me	Cl	Br	0	Me	Cl	Br	1
Me	Br	Br	0	Me	Br	Br	1
Me	F	Br	0	Me	F	Br	1
Me	I	Br	0	Me	I	Br	1
Me	CN	Br	0	Me	CN	Br	1

20

30

40

【 0 0 9 5 】

【表 1 1】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>
Cl	Cl	Br	0	Cl	Cl	Br	1
Cl	Br	Br	0	Cl	Br	Br	1
Cl	F	Br	0	Cl	F	Br	1
Cl	I	Br	0	Cl	I	Br	1
Cl	CN	Br	0	Cl	CN	Br	1
Br	Cl	Br	0	Br	Cl	Br	1
Br	Br	Br	0	Br	Br	Br	1
Br	F	Br	0	Br	F	Br	1
Br	I	Br	0	Br	I	Br	1
Br	CN	Br	0	Br	CN	Br	1
Me	Cl	Cl	2	Me	Cl	Br	2
Me	Br	Cl	2	Me	Br	Br	2
Me	F	Cl	2	Me	F	Br	2
Me	I	Cl	2	Me	I	Br	2
Me	CN	Cl	2	Me	CN	Br	2
Cl	Cl	Cl	2	Cl	Cl	Br	2
Cl	Br	Cl	2	Cl	Br	Br	2
Cl	F	Cl	2	Cl	F	Br	2
Cl	I	Cl	2	Cl	I	Br	2
Cl	CN	Cl	2	Cl	CN	Br	2
Br	Cl	Cl	2	Br	Cl	Br	2
Br	Br	Cl	2	Br	Br	Br	2
Br	F	Cl	2	Br	F	Br	2
Br	I	Cl	2	Br	I	Br	2
Br	CN	Cl	2	Br	CN	Br	2

10

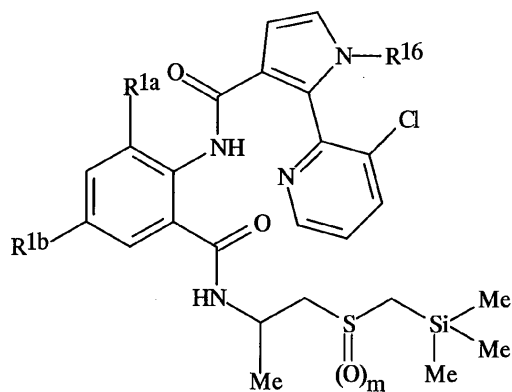
20

30

【 0 0 9 6 】

【表 1 2】

表 5



<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>
Me	Cl	CHF ₂	0	Me	Cl	CHF ₂	1
Me	Br	CHF ₂	0	Me	Br	CHF ₂	1
Me	F	CHF ₂	0	Me	F	CHF ₂	1
Me	I	CHF ₂	0	Me	I	CHF ₂	1
Me	CN	CHF ₂	0	Me	CN	CHF ₂	1
Cl	Cl	CHF ₂	0	Cl	Cl	CHF ₂	1
Cl	Br	CHF ₂	0	Cl	Br	CHF ₂	1
Cl	F	CHF ₂	0	Cl	F	CHF ₂	1
Cl	I	CHF ₂	0	Cl	I	CHF ₂	1
Cl	CN	CHF ₂	0	Cl	CN	CHF ₂	1
Br	Cl	CHF ₂	0	Br	Cl	CHF ₂	1
Br	Br	CHF ₂	0	Br	Br	CHF ₂	1
Br	F	CHF ₂	0	Br	F	CHF ₂	1
Br	I	CHF ₂	0	Br	I	CHF ₂	1
Br	CN	CHF ₂	0	Br	CN	CHF ₂	1
Me	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Me	Br	CH ₂ CF ₃	0	Me	Br	CH ₂ CF ₃	1
Me	F	CH ₂ CF ₃	0	Me	F	CH ₂ CF ₃	1
Me	I	CH ₂ CF ₃	0	Me	I	CH ₂ CF ₃	1
Me	CN	CH ₂ CF ₃	0	Me	CN	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Br	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	1
Cl	F	CH ₂ CF ₃	0	Cl	F	CH ₂ CF ₃	1
Cl	I	CH ₂ CF ₃	0	Cl	I	CH ₂ CF ₃	1
Cl	CN	CH ₂ CF ₃	0	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	1
Br	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Br	Br	CH ₂ CF ₃	0	Br	Br	CH ₂ CF ₃	1

【0097】

【表 1 3】

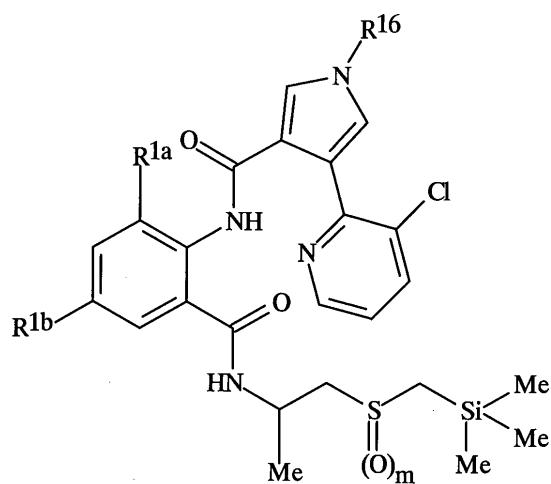
<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>
Br	F	CH ₂ CF ₃	0	Br	F	CH ₂ CF ₃	1
Br	I	CH ₂ CF ₃	0	Br	I	CH ₂ CF ₃	1
Br	CN	CH ₂ CF ₃	0	Br	CN	CH ₂ CF ₃	1
Me	Cl	CHF ₂	2	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Me	Br	CHF ₂	2	Me	Br	CH ₂ CF ₃	2
Me	F	CHF ₂	2	Me	F	CH ₂ CF ₃	2
Me	I	CHF ₂	2	Me	I	CH ₂ CF ₃	2
Me	CN	CHF ₂	2	Me	CN	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Cl	CHF ₂	2	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Br	CHF ₂	2	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	2
Cl	F	CHF ₂	2	Cl	F	CH ₂ CF ₃	2
Cl	I	CHF ₂	2	Cl	I	CH ₂ CF ₃	2
Cl	CN	CHF ₂	2	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	2
Br	Cl	CHF ₂	2	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Br	Br	CHF ₂	2	Br	Br	CH ₂ CF ₃	2
Br	F	CHF ₂	2	Br	F	CH ₂ CF ₃	2
Br	I	CHF ₂	2	Br	I	CH ₂ CF ₃	2
Br	CN	CHF ₂	2	Br	CN	CH ₂ CF ₃	2

10

20

【 0 0 9 8 】

表 6



<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R16</u>	<u>m</u>
Me	Cl	CHF ₂	0	Me	Cl	CHF ₂	1
Me	Br	CHF ₂	0	Me	Br	CHF ₂	1
Me	F	CHF ₂	0	Me	F	CHF ₂	1
Me	I	CHF ₂	0	Me	I	CHF ₂	1
Me	CN	CHF ₂	0	Me	CN	CHF ₂	1

【 0 0 9 9 】

【表 1 5】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>
Cl	Cl	CHF ₂	0	Cl	Cl	CHF ₂	1
Cl	Br	CHF ₂	0	Cl	Br	CHF ₂	1
Cl	F	CHF ₂	0	Cl	F	CHF ₂	1
Cl	I	CHF ₂	0	Cl	I	CHF ₂	1
Cl	CN	CHF ₂	0	Cl	CN	CHF ₂	1
Br	Cl	CHF ₂	0	Br	Cl	CHF ₂	1
Br	Br	CHF ₂	0	Br	Br	CHF ₂	1
Br	F	CHF ₂	0	Br	F	CHF ₂	1
Br	I	CHF ₂	0	Br	I	CHF ₂	1
Br	CN	CHF ₂	0	Br	CN	CHF ₂	1
Me	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Me	Br	CH ₂ CF ₃	0	Me	Br	CH ₂ CF ₃	1
Me	F	CH ₂ CF ₃	0	Me	F	CH ₂ CF ₃	1
Me	I	CH ₂ CF ₃	0	Me	I	CH ₂ CF ₃	1
Me	CN	CH ₂ CF ₃	0	Me	CN	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Br	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	1
Cl	F	CH ₂ CF ₃	0	Cl	F	CH ₂ CF ₃	1
Cl	I	CH ₂ CF ₃	0	Cl	I	CH ₂ CF ₃	1
Cl	CN	CH ₂ CF ₃	0	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	1
Br	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Br	Br	CH ₂ CF ₃	0	Br	Br	CH ₂ CF ₃	1
Br	F	CH ₂ CF ₃	0	Br	F	CH ₂ CF ₃	1
Br	I	CH ₂ CF ₃	0	Br	I	CH ₂ CF ₃	1
Br	CN	CH ₂ CF ₃	0	Br	CN	CH ₂ CF ₃	1
Me	Cl	CHF ₂	2	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Me	Br	CHF ₂	2	Me	Br	CH ₂ CF ₃	2
Me	F	CHF ₂	2	Me	F	CH ₂ CF ₃	2
Me	I	CHF ₂	2	Me	I	CH ₂ CF ₃	2
Me	CN	CHF ₂	2	Me	CN	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Cl	CHF ₂	2	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Br	CHF ₂	2	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	2
Cl	F	CHF ₂	2	Cl	F	CH ₂ CF ₃	2
Cl	I	CHF ₂	2	Cl	I	CH ₂ CF ₃	2
Cl	CN	CHF ₂	2	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	2
Br	Cl	CHF ₂	2	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Br	Br	CHF ₂	2	Br	Br	CH ₂ CF ₃	2

10

20

30

40

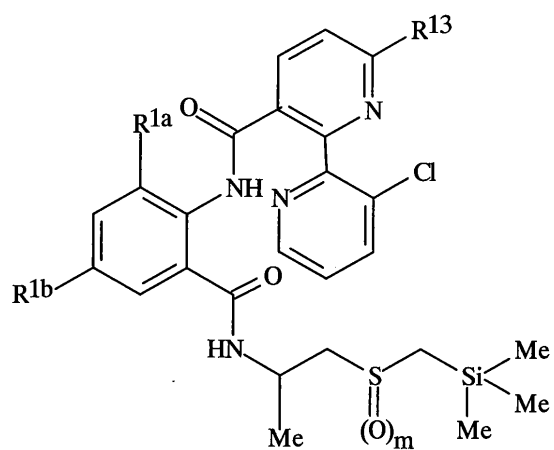
【表 1 6】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹⁶</u>	<u>m</u>
Br	F	CHF ₂	2	Br	F	CH ₂ CF ₃	2
Br	I	CHF ₂	2	Br	I	CH ₂ CF ₃	2
Br	CN	CHF ₂	2	Br	CN	CH ₂ CF ₃	2

【 0 1 0 1 】

【表 1 7】

表 7



10

<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R13</u>	<u>m</u>	<u>R1a</u>	<u>R1b</u>	<u>R13</u>	<u>m</u>
Me	Cl	CF ₃	0	Me	Cl	CF ₃	1
Me	Br	CF ₃	0	Me	Br	CF ₃	1
Me	F	CF ₃	0	Me	F	CF ₃	1
Me	I	CF ₃	0	Me	I	CF ₃	1
Me	CN	CF ₃	0	Me	CN	CF ₃	1
Cl	Cl	CF ₃	0	Cl	Cl	CF ₃	1
Cl	Br	CF ₃	0	Cl	Br	CF ₃	1
Cl	F	CF ₃	0	Cl	F	CF ₃	1
Cl	I	CF ₃	0	Cl	I	CF ₃	1
Cl	CN	CF ₃	0	Cl	CN	CF ₃	1
Br	Cl	CF ₃	0	Br	Cl	CF ₃	1
Br	Br	CF ₃	0	Br	Br	CF ₃	1
Br	F	CF ₃	0	Br	F	CF ₃	1
Br	I	CF ₃	0	Br	I	CF ₃	1
Br	CN	CF ₃	0	Br	CN	CF ₃	1
Me	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Me	Br	CH ₂ CF ₃	0	Me	Br	CH ₂ CF ₃	1
Me	F	CH ₂ CF ₃	0	Me	F	CH ₂ CF ₃	1
Me	I	CH ₂ CF ₃	0	Me	I	CH ₂ CF ₃	1
Me	CN	CH ₂ CF ₃	0	Me	CN	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	1

20

30

40

【 0 1 0 2 】

【表 1 8】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>
Cl	Br	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	1
Cl	F	CH ₂ CF ₃	0	Cl	F	CH ₂ CF ₃	1
Cl	I	CH ₂ CF ₃	0	Cl	I	CH ₂ CF ₃	1
Cl	CN	CH ₂ CF ₃	0	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	1
Br	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Br	Br	CH ₂ CF ₃	0	Br	Br	CH ₂ CF ₃	1
Br	F	CH ₂ CF ₃	0	Br	F	CH ₂ CF ₃	1
Br	I	CH ₂ CF ₃	0	Br	I	CH ₂ CF ₃	1
Br	CN	CH ₂ CF ₃	0	Br	CN	CH ₂ CF ₃	1
Me	Cl	CF ₃	2	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Me	Br	CF ₃	2	Me	Br	CH ₂ CF ₃	2
Me	F	CF ₃	2	Me	F	CH ₂ CF ₃	2
Me	I	CF ₃	2	Me	I	CH ₂ CF ₃	2
Me	CN	CF ₃	2	Me	CN	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Cl	CF ₃	2	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Br	CF ₃	2	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	2
Cl	F	CF ₃	2	Cl	F	CH ₂ CF ₃	2
Cl	I	CF ₃	2	Cl	I	CH ₂ CF ₃	2
Cl	CN	CF ₃	2	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	2
Br	Cl	CF ₃	2	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Br	Br	CF ₃	2	Br	Br	CH ₂ CF ₃	2
Br	F	CF ₃	2	Br	F	CH ₂ CF ₃	2
Br	I	CF ₃	2	Br	I	CH ₂ CF ₃	2
Br	CN	CF ₃	2	Br	CN	CH ₂ CF ₃	2

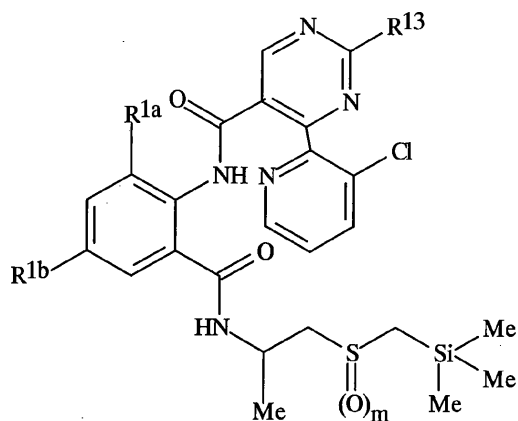
10

20

30

【 0 1 0 3 】

表 8



<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>
Me	Cl	CHF ₂	0	Me	Cl	CHF ₂	1
Me	Br	CHF ₂	0	Me	Br	CHF ₂	1
Me	F	CHF ₂	0	Me	F	CHF ₂	1
Me	I	CHF ₂	0	Me	I	CHF ₂	1
Me	CN	CHF ₂	0	Me	CN	CHF ₂	1
Cl	Cl	CHF ₂	0	Cl	Cl	CHF ₂	1
Cl	Br	CHF ₂	0	Cl	Br	CHF ₂	1
Cl	F	CHF ₂	0	Cl	F	CHF ₂	1
Cl	I	CHF ₂	0	Cl	I	CHF ₂	1
Cl	CN	CHF ₂	0	Cl	CN	CHF ₂	1
Br	Cl	CHF ₂	0	Br	Cl	CHF ₂	1
Br	Br	CHF ₂	0	Br	Br	CHF ₂	1
Br	F	CHF ₂	0	Br	F	CHF ₂	1
Br	I	CHF ₂	0	Br	I	CHF ₂	1
Br	CN	CHF ₂	0	Br	CN	CHF ₂	1
Me	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Me	Br	CH ₂ CF ₃	0	Me	Br	CH ₂ CF ₃	1
Me	F	CH ₂ CF ₃	0	Me	F	CH ₂ CF ₃	1
Me	I	CH ₂ CF ₃	0	Me	I	CH ₂ CF ₃	1
Me	CN	CH ₂ CF ₃	0	Me	CN	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Cl	Br	CH ₂ CF ₃	0	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	1
Cl	F	CH ₂ CF ₃	0	Cl	F	CH ₂ CF ₃	1
Cl	I	CH ₂ CF ₃	0	Cl	I	CH ₂ CF ₃	1
Cl	CN	CH ₂ CF ₃	0	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	1
Br	Cl	CH ₂ CF ₃	0	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	1
Br	Br	CH ₂ CF ₃	0	Br	Br	CH ₂ CF ₃	1

【表 2 0】

<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>	<u>R^{1a}</u>	<u>R^{1b}</u>	<u>R¹³</u>	<u>m</u>
Br	F	CH ₂ CF ₃	0	Br	F	CH ₂ CF ₃	1
Br	I	CH ₂ CF ₃	0	Br	I	CH ₂ CF ₃	1
Br	CN	CH ₂ CF ₃	0	Br	CN	CH ₂ CF ₃	1
Me	Cl	CHF ₂	2	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Me	Br	CHF ₂	2	Me	Br	CH ₂ CF ₃	2
Me	F	CHF ₂	2	Me	F	CH ₂ CF ₃	2
Me	I	CHF ₂	2	Me	I	CH ₂ CF ₃	2
Me	CN	CHF ₂	2	Me	CN	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Cl	CHF ₂	2	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Cl	Br	CHF ₂	2	Cl	Br	CH ₂ CF ₃	2
Cl	F	CHF ₂	2	Cl	F	CH ₂ CF ₃	2
Cl	I	CHF ₂	2	Cl	I	CH ₂ CF ₃	2
Cl	CN	CHF ₂	2	Cl	CN	CH ₂ CF ₃	2
Br	Cl	CHF ₂	2	Br	Cl	CH ₂ CF ₃	2
Br	Br	CHF ₂	2	Br	Br	CH ₂ CF ₃	2
Br	F	CHF ₂	2	Br	F	CH ₂ CF ₃	2
Br	I	CHF ₂	2	Br	I	CH ₂ CF ₃	2
Br	CN	CHF ₂	2	Br	CN	CH ₂ CF ₃	2

10

20

【0105】

製剤 / 効用

本発明の化合物は一般的に、少なくとも1種の液体希釈剤、固体希釈剤または界面活性剤を含んでなる農業的または非農業的使用に適切な担体とともに製剤または組成物として使用される。製剤または組成物成分は、活性成分の物性、適用形態、ならびに土壌タイプ、湿度および温度のような環境要因と調和するように選択される。有用な製剤は、場合によりゲルへと濃厚化されることが可能な、溶液（乳化可能な濃縮物を含む）、懸濁液、乳液（ミクロエマルジョンおよび／またはサスポエマルジョンを含む）等のような液体を含む。有用な製剤はさらに、水分散性（「水和」）または水溶性であり得る、ダスト、粉末、顆粒、ペレット、タブレット、フィルム等のような固体を含む。活性成分を（マイクロ）カプセル化することができ、さらに懸濁液または固体製剤へと形成することができ、あるいは活性成分の全製剤をカプセル化（または「オーバーコート」）することができる。カプセル化により、活性成分放出を制御することができるか、または遅らせることができる。噴霧可能な製剤を適切な培地に施すことができ、1ヘクタールあたり約1～数百リットルの噴霧量で使用する事ができる。さらなる製剤の中間体として、最初に高強度組成物を使用する。

30

40

【0106】

製剤は典型的に、以下の100重量%まで加算される適切な範囲内で、有効量の活性成分、希釈剤および界面活性剤を含有する。

【0107】

【表 2 1】

	重量%		
	活性成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性顆粒、 タブレットおよび粉末	5-90	0-94	1-15
懸濁液、乳液、溶液 (乳化可能濃縮物を含む)	5-50	40-95	0-15
ダスト	1-25	70-99	0-5
顆粒およびベレット	0.01-99	5-99.99	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

10

【0108】

典型的な固体希釈剤は、ワトキンス (Watkins) ら、ハンドブック オブ イン
セクティサイド ダスト ディリュエント アンド キャリアズ (Handbook
of Insecticide Dust Diluents and Carriers) 第2版、ドーランド ブックス (Dorland Books)、コールドウェル (Caldwell)、ニュージャージー (New Jersey) に記載されている。典
型的な液体希釈剤は、マルスデン (Marsden)、ソルベンツ ガイド (Solvents Guide) 第2版、インターサイエンス (Interscience)、ニュー
ヨーク (New York)、1950 に記載されている。マクカッチェオンズ デタ
ージェンツ アンド エマルシフィアズ アニュアル (McCutcheon's De
tergents and Emulsifiers Annual)、アルレッド パ
ブリッシング コーポレーション (Allured Publ. Corp.)、リッジウ
ッド (Ridgewood)、ニュージャージー (New Jersey) およびシスレ
ー (Sisely) およびウッド (Wood)、エンサイクロペディア オブ サーフ
ェイス アクティブ エージェンツ (Encyclopedia of Surface
Active Agents)、ケミカル パブリッシング カンパニー インコーポレ
イテッド (Chemical Publ. Co., Inc.)、ニューヨーク (New
York)、1964 は界面活性剤および推奨される使用を記載している。全ての製剤は
、発泡、ケーキング、腐食、微生物の増殖等を低下させるための添加剤、または粘度を増
加させるための増粘剤を少量含量することが可能である。

20

30

【0109】

界面活性剤としては、例えば、ポリエトキシ化アルコール、ポリエトキシ化アルキ
ルフェノール、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ジアルキルスルホスクシネ
ート、アルキルスルフェート、アルキルベンゼンスルホネート、オルガノシリコン、N
、N - ジアルキルタウレート、リグニンスルホネート、ナフタレンスルホネートホルム
アルデヒド縮合物、ポリカルボキシレートおよびポリオキシエチレン/ポリオキシプロピレ
ンブロックコポリマーが挙げられる。固体希釈剤としては、例えば、ベントナイト、モン
モリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンのような粘土、澱粉、糖、シリカ、タル
ク、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびに
硫酸ナトリウムが挙げられる。液体希釈剤としては、例えば、水、N、N - ジメチルホル
ムアミド、ジメチルスルホキシド、N - アルキルピロリドン、エチレングリコール、ポリ
プロピレングリコール、パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、オリーブ

40

50

油、ひまし油、亜麻仁油、桐油、ゴマ油、コーン油、ピーナッツ油、綿実油、大豆油、菜種油およびココナッツ油、脂肪酸エステル、シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンのようなケトン、ならびにメタノール、シクロヘキサノール、デカノールおよびテトラヒドロフルフリルアルコールのようなアルコールが挙げられる。

【0110】

成分を単純に混合することにより、乳化可能濃縮物を含む溶液を調製することができる。ブレンドおよび通常、ハンマーミルまたは流体エネルギーミルにおいて粉碎することにより、ダストおよび粉末を調製することができる。懸濁液は通常、湿式粉碎により調製される。例えば、米国特許第3,060,084号明細書を参照のこと。予備形成された顆粒担体上に活性材料を噴霧することにより、または凝集技術により、顆粒およびペレットを調製することができる。ブローニング(Browning)、「アグロメレーション(Agglomeration)」、ケミカルエンジニアリング(Chemical Engineering)、1967年12月4日、第147~48頁、ペリーズケミカルエンジニアズハンドブック(Perry's Chemical Engineer's Handbook)、第4版、マグロー-ヒル(McGraw-Hill)、ニューヨーク(New York)、1963、第8~57頁以下および国際公開第91/13546号パンフレットを参照のこと。米国特許第4,172,714号明細書に記載されるようにペレットを調製することができる。米国特許第4,144,050号明細書、米国特許第3,920,442号明細書およびDE3,246,493号明細書に教示されるように水分散性および水溶性顆粒を調製することができる。米国特許第5,180,587号明細書、米国特許第5,232,701号明細書および米国特許第5,208,030号明細書に教示されるようにタブレットを調製することができる。GB2,095,558号明細書および米国特許第3,299,566号明細書に教示されるようにフィルムを調製することができる。

【0111】

製剤の分野に関するさらなる情報に関しては、T.S.ウッズ(T.S.Woods)、ペスティサイドケミストリーアンドバイオサイエンス、ザフード-エンバイロメントチャレンジ(Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge)における「ザフォーミュレーターズツールボックス-プロダクトフォームスフォーモダンアグリカルチャー(The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture)」、T.ブルックス(T.Brooks)およびT.R.ロバーツ(T.R.Roberts)編、プロシーディングスオブザナインスインターナショナルコンGRESSオンペスティサイドケミストリー(Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry)、ザロイヤルソサエティーオブケミストリー(The Royal Society of Chemistry)、ケンブリッジ(Cambridge)、1999、第120~133を参照のこと。米国特許第3,235,361号、第6欄、第16行~第7欄、第19行および実施例10~41;米国特許第3,309,192号、第5欄、第43行~第7欄、第62行および実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138~140、162~164、166、167および169~182;米国特許第2,891,855号、第3欄、第66行~第5欄、第17行および実施例1~4;クリングマン(Klingman)、ウィードコントロールアズアサイエンス(Weed Control as a Science)、ジョンウィリーアンドサンズインコーポレイテッド(John Wiley and Sons, Inc)、ニューヨーク(New York)、1961、第81~96頁;ならびにハンス(Hance)ら、ウィードコントロールハンドブック(Weed Control Handbook)、第8版、ブラックウェルサイエンティフィックパブリ

ケーションズ (Blackwell Scientific Publications)、オックスフォード (Oxford)、1989 も参照のこと。

【0112】

以下の実施例において、全てのパーセントは重量によるものであり、全ての製剤は従来法で調製される。化合物の番号は、索引表 A の化合物を参照する。

【0113】

【表 2 2】

実施例 A

水和粉末

化合物 1	65.0%
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
シリコアルミン酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト(煅焼物)	23.0%

10

【0114】

【表 2 3】

実施例 B

顆粒

化合物 1	10.0%
アタパルジャイト顆粒 (低揮発性素材、0.71/0.30mm、U.S.S No.25~50シープ)	90.0%

20

【0115】

【表 2 4】

実施例 C

押出ペレット

化合物 1	25.0%
無水硫酸ナトリウム	10.0%
粗製リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%

30

【0116】

【表 2 5】

実施例 D

乳化可能濃縮物

化合物 1	20.0%
油溶性スルホネートとポリオキシエチレンエーテルのブレンド	10.0%
イソホロン	70.0%

40

【0117】

50

【表 2 6】

実施例 E

粒体

化合物 1	0.5%
セルロース	2.5%
ラクトース	4.0%
コーンミール	93.0%

10

【0118】

本発明の化合物は、都合のよい代謝および/または土壌残留パターンを持つことを特徴とし、農業と非農業の無脊椎有害生物のスペクトルを制御する活性を呈する。(本願開示内容の文脈において、「無脊椎有害生物の防除」とは、摂食(feeding)を大きく低下させる無脊椎有害生物の発育または有害生物によって引き起こされる他の損傷あるいは被害の阻害(死滅させることを含む)を意味し、関連の表現については同様に定義する。)本願開示で用いる場合、「無脊椎有害生物」という用語には、有害生物として経済的観点から重要である節足動物、腹足類および線虫を含む。「節足動物」という用語には、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ、ヤスデ、ダンゴムシ、コムカデを含む。「腹足類」という用語には、カタツムリ、ナメクジ、その他の柄眼目を含む。「線虫」という用語には、回虫、犬系状虫および植物寄生性線虫(線虫綱)、吸虫(吸虫綱)、鉤頭動物門および条虫(条虫綱)などのあらゆる蠕虫類を含む。すべての化合物があらゆる有害生物に同じように有効だとは限らないことは当業者であれば分かるであろう。本発明の化合物は、経済的に重要な農業的および非農業的有害生物に対して活性を示す。用語「農業的」は、食品および繊維のような農作物の生産を指し、禾穀類(例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦、米、トウモロコシ)、大豆、野菜作物(例えば、レタス、キャベツ、トマト、豆)、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、綿および果樹(例えば、梨状果、石果および柑橘類果物)の育成を含む。用語「非農業的」は、他の園芸作物(例えば森林、温室、苗床または原野で育成されない装飾用植物)、公衆衛生(人間の健康)および動物の健康、家庭用および商業用建造体、家庭用品、ならびに貯蔵製品用途または有害生物を指す。無脊椎有害生物防除範囲および経済的重要性の理由のため、無脊椎有害生物防除による綿、トウモロコシ、大豆、米、野菜作物、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウおよび果樹の農作物の保護(無脊椎有害生物により引き起こされる損害または傷害から)は、本発明の好ましい実施形態である。農業的および非農業的有害生物としては、ヤガ科のアーミーワーム、根切虫、ルーパー、タバコガ(ハスモンヨトウ(*Spodoptera fugiperda* J. E. スミス(Smith))、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua* ヒュブネル(Huebner))、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon* ハフナゲル(Hufnagel))、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni* ヒュブネル(Huebner))、オオタバコガ(*Heliothis virescens* ファブリシウス(Fabricius))など);メイガ科の穿孔性害虫、繭を作る害虫、食葉に巣を作る群居性害虫、コーンワーム、アオムシ、葉脈を残して葉を食害する害虫(アワノメイガ(*Ostrinia nubilalis* ヒュブネル(Huebner))、ネーブルオレンジワーム(*Amyelois transitella* ウォーカー(Walker))、ウスギンツトガ(*Crambus caliginosellus* クレメンズ(Clemens))、クロオビクロノメイガ(*Herpetogramma licarsisalis* ウォーカー(Walker))など);ハマキガ科のハマキムシ、芽を食害する害虫、種子を食害する害虫、果実を食害する害虫(コドリング(*Cydia pomonella* リンネ(Linnaeus))、グレープベリーモス(*Endopiza viteana* クレメンズ(Cleme

20

30

40

50

ns))、ナシヒメシンクイ(*Grapholitha molesta* ブスク(*Busck*))など)；経済的観点から重要な他の多くの鱗翅目(コナガ(*Plutella xylostella* リンネ(*Linnaeus*))、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella* ソーンダズ(*Saunders*))、マイマイガ(*Lymantria dispar*) リンネ(*Linnaeus*)など)などの鱗翅目の幼虫；チャバネゴキブリ科およびゴキブリ科(トウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis* リンネ(*Linnaeus*))、アジアゴキブリ(*Blattella asahinai* ミズクボ(*Mizukubo*))、チャバネゴキブリ(*Blattella germanica* リンネ(*Linnaeus*))、チャオビゴキブリ(*Supella longipalpa* ファブリシウス(*Fabricius*))、ワ 10
モンゴキブリ(*Periplaneta americana* リンネ(*Linnaeus*))、トビイロゴキブリ(*Periplaneta brunnea* バーマイスター(*Burmeister*))、マデラゴキブリ(*Leucophaea maderae* ファブリシウス(*Fabricius*))などのゴキブリをはじめとするゴキブリ目のニフおよび成虫；ヒゲナガゾウムシ科、マメゾウムシ科、ゾウムシ科のゾウムシ(ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis* ボヘマン(*Boheman*))、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus* クッセル(*Kuschel*))、オサゾウムシ(*Sitophilus granarius* リンネ(*Linnaeus*))、ココクゾウムシ(*Sitophilus oryzae*) リンネ(*Linnaeus*))；ハムシ科のノミハムシ、ウリハムシ、根食い線虫、 20
ハムシ、イモハムシおよびハモグリムシ(コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata* セイ(*Say*))、ウエスタンコーンルートワーム(*Dia brotica virgifera virgifera* ルコンテ(*LeConte*))など)；コガネムシ科(*Scarabaeidae*)のコガネムシおよび他の甲虫(マメコガネ(*Popillia japonica* ニューマン(*Newman*))、ヨーロッパコガネムシ(*European chafer*)(*Rhizotrogus majalis* ラゾウモブスキー(*Razoumowsky*))など)；カツオブシムシ科のカツオブシムシ；コメツキムシ科のコメツキムシ；キクイムシ科のキクイムシ、ゴミムシダマシ科のコクヌストモドキをはじめとする鞘翅目の食葉性幼虫および成虫が挙げられる。また、農業的および非農業的有害生物としては、クギヌキハサミムシ科のハサミ 30
ムシ(ヨーロッパクギヌキハサミムシ(*Forficula auricularia*) リンネ(*Linnaeus*))、ブラックイヤウイグ(*black earwig*)(*Chelisoches morio* ファブリシウス(*Fabricius*))など)をはじめとする革翅目の成虫および幼虫；カスミカメムシ科のカスミカメムシ、セミ科のセミ、ヨコバイ科のヨコバイ(カキノヒメヨコバイ(*Empoasca*) spp. など)、アワフキムシ科(*Fulgoroidea*)およびウンカ科のプラントホッパー、ツノゼミ科のツノゼミ、キジラミ科のキジラミ、コナジラミ科のコナジラミ、アブラムシ科のアブラムシ、ネアブラムシ科のネアブラムシ、コナカイガラムシ科のコナカイガラムシ、カタカイガラムシ科、マルカイガラムシ科およびワタフキカイガラムシ科のカイガラムシ、ゲンバイムシ科のゲンバイムシ、カメムシ科のカメムシ、ナガカメムシ科のナガカメムシ 40
(*cinch bug*)(*Blissus* spp. など)ならびに他のコバネナガカメムシ、コガシラアワフキ科のアワフキムシ、ヘリカメムシ科のヘリカメムシ、ホシカメムシ科のアカホシカメムシおよびホシカメムシなどの半翅目および同翅目の成虫およびニフも挙げられる。さらに、ハダニ科のハダニおよびアカダニ(リンゴハダニ(*Panonychus ulmi* コッチ(*Koch*))、ナミハダニ(*Tetranychus urticae* コッチ(*Koch*))、マクダニエルダニ(*Tetranychus mcdanieli* マクレガー(*McGregor*))など)、ヒメハダニ科のヒメハダニ(カンキツヒメハダニ(*Brevipalpus lewisii* マクレガー(*McGregor*))など)、フシダニ科のサビダニおよびフシダニならびに他の食葉性ダニ 50
などのコナダニ(ダニ)ならびに、人間および動物の健康にとって重要なダニすなわち、

チリダニ科のヒョウダニ、ニキビダニ科のニキビダニ、ニクダニ科のムギコナダニ、マダニ科のマダニ(シカダニ(*Ixodes scapularis* セイ(Say))、オーストラリアマダニ(*Ixodes holocyclus* ニューマン(Neumann))、カクマダニ(*Dermacentor variabilis* セイ(Say))、ローンスターチック(*lone star tick*)(*Amblyomma americanum* リンネ(Linnaeus))、キュウセンダニ科、シラミダニ科、ヒゼンダニ科の疥癬や皮癬のダニの成虫および幼虫；バッタ、イナゴおよびコオロギ(クルマバッタ(*Melanoplus sanguinipes* ファブリシウス(Fabricius))、*M. differentialis* トーマス(Thomas))、アメリカイナゴ(*Schistocerca americana* ドルーリー(Drury)など)、サバクバッタ(*Schistocerca gregaria* フォースカル(Forsk.)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria* リンネ(Linnaeus))、ヨーロッパイエコオロギ(*Achetia domesticus* リンネ(Linnaeus))、ケラ(*Gryllotalpa* spp.)など)をはじめとする直翅目の成虫および幼若虫；ハモグリムシ、ユスリカ、ミバエ(ミバエ科)、キモグリバエ(*Oscinella frit* リンネ(Linnaeus))、ウジバエ、イエバエ(*Musca domestica* リンネ(Linnaeus))など)、ヒメイエバエ(*Fannia canicularis* リンネ(Linnaeus))、*F. femoralis* ステイン(Stein)など)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans* リンネ(Linnaeus))、イエバエの一種(*face fly*)、ノサシバエ、クロバエ(*Chrysomya* spp.、*Phormia* spp.)および他のイエバエ(*muscoïd*)害虫、アブ(*Tabanus* spp.など)、ウマバエ(*Gastrophilus* spp.、*Oestrus* spp.など)、ウシバエ(*Hypoderma* spp.など)、メクラアブ(*Chrysops* spp.)、ヒツジシラミバエ(*Melophagus ovinus* リンネ(Linnaeus)など)ならびに他の短角亜目、カ(*Aedes* spp.、*Anopheles* spp.、*Culex* spp.など)、ブユ(*Prosimulium* spp.、*Simulium* spp.など)、クロヌカカ、スナバエ、*sciarids*および他の長角亜目をはじめとする双翅目の成虫および幼若虫；ネギアザミウマ(*Thrips tabaci* リンデマン(Lindeman))および他の食葉性アザミウマをはじめとする総翅目の成虫および幼若虫；アリ(アカオオアリ(*Camponotus ferrugineus* ファブリシウス(Fabricius))、クロオオアリ(*Camponotus pennsylvanicus* デ・ギーア(De Geer))、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis* リンネ(Linnaeus))、チビヒアリ(*Wasmannia auropunctata* Roger)、アカカミアリ(*Solenopsis geminata* ファブリシウス(Fabricius))、ヒアリ(*Solenopsis invicta* ブレン(Buren))、アルゼンチンアリ(*Iridomyrmex humilis* メイル(Mayr))、アシナガキアリ(*Paratrechina longicornis* ラトレイル(Latreille))、トビイロシワアリ(*Tetramorium caespitum* リンネ(Linnaeus))、ヒメトビイロケアリ(*Lasius alienus* フォースター(Forster))、コヌカアリ(*Tapinoma sessile* セイ(Say))、ハチ(クマバチを含む)、ホーネット(*hornet*)、イエロージャケット(*yellow jacket*)、大形のハチ(*wasp*)をはじめとするハチ目の昆虫害虫；ミゾガシラシロアリ(*Reticulitermes flavipes* コラー(Kollar))、セイヨウシロアリ(*Reticulitermes hesperus* バンクス(Banks))、イエシロアリ(*Coptotermes formosanus* シラキ(Shiraki))、ハワイシロアリ(*Incisitermes immigrans* シンダー(Snyder))および他の経済的観点から重要であるシロアリなどのシロアリ目の昆虫害虫；セイヨウシミ(L

episma saccharina リンネ (*Linnaeus*))、マダラシミ (*Thermobia domestica* パッカード (*Packard*)) などのシミ目の昆虫害虫；コロモジラミ (*Pediculus humanus capitis* デ・ギア (*De Geer*))、アタマジラミ (*Pediculus humanus humanus* リンネ (*Linnaeus*))、ニワトリハジラミ (*Menacanthus stramineus* ニッツ (*Nitszch*))、イヌハジラミ (*Trichodectes canis* デ・ギア (*De Geer*))、*fluff louse* (*Goniocotes gallinae* デ・ギア (*De Geer*))、ヒツジハジラミ (*Bovicola ovis* シュランク (*Schrank*))、ウシジラミ (*short-nosed cattle louse*) (*Haematopinus euryesternus* ニッツ (*Nitszch*))、ウシジラミ (*long-nosed cattle louse*) (*Linognathus vituli* リンネ (*Linnaeus*)) ならびに、人間や動物につく他の吸血シラミおよびハジラミを含むハジラミ目の昆虫害虫；ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis* ロッシュチャイルド (*Rothschild*))、ネコノミ (*Ctenocephalides felis* ブーシュ (*Bouche*))、イヌノミ (*Ctenocephalides canis* カーティス (*Curtis*))、ニワトリノミ (*Ceratophyllus gallinae* シュランク (*Schrank*))、ニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea* ウェストウッド (*Westwood*))、ヒトノミ (*Pulex irritans* リンネ (*Linnaeus*)) および人間や鳥を悩ます他のノミを含むノミ目の昆虫害虫が挙げられる。包含されるさらに他の節足動物害虫として、ドクイトグモ (*Loxosceles reclusa* グレッチュおよびミュレイク (*Gertsch & Mulaik*)) ならびにクロゴケグモ (*Latrodectus mactans* ファブリシウス (*Fabricius*)) などのクモ目のクモ、イエムカデ (*Scutigera coleoptrata* リンネ (*Linnaeus*)) などの唇脚綱ゲジ目のムカデが挙げられる。本発明の化合物は、経済的観点から重要な農業害虫（すなわち、ネコブセンチュウ属の根こぶ線虫、ネグサレセンチュウ属の根ぐされ線虫、ユミハリセンチュウ属のユミハリ線虫など）ならびに動物および人間の健康を害する害虫（すなわち、経済的観点から重要なあらゆる吸虫、条虫および回虫であり、ウマの普通円虫 (*Strongylus vulgaris*)、イヌの犬回虫 (*Toxocara canis*)、ヒツジの捻転胃虫 (*Haemonchus contortus*)、イヌの犬糸状虫 (*Dirofilaria immitis* レイディ (*Leidy*))、ウマの葉状条虫 (*Anoplocephala perfoliata*)、反芻動物の肝蛭虫 (*Fasciola hepatica* リンネ (*Linnaeus*)) など）などであるがこれに限定されるものではない、円虫目、回虫目、蟯虫目、ラブジチダ目、センビセンチュウ目、エノブルス目の経済的観点から重要な虫類をはじめとする、線虫綱、条虫綱、吸虫綱および鉤頭動物門の虫類にも活性を有する。

【0119】

本発明の化合物は、鱗翅目（ヤガの幼虫 (*Alabama argillacea* Huebner)、果樹ハマキムシ (*Archips argyrospila* Walker)、セイヨウハマキ (*A. rosana* Linnaeus) およびその他のハマキ (*Archips*) 種、ニカメイチュウ (*Chilo suppressalis* Walker)、コブノメイガ (*Cnaphalocrosis medinalis* Guenee)、ハムシモドキの幼虫 (*Crambus caliginosellus* Clemens)、シバツトガ (*Crambus teterrellus* Zincken)、コドリリング (*Cydia pomonella* Linnaeus)、ミスジアオリング (*Earias insulana* Boisduval)、クサオピリング (*Earias vittella* Fabricius)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera* Huebner)、オオタバコガの幼虫 (*Helicoverpa zea* Boddie)、オオタバコガの幼虫 (*Heliothis vir*

escens Fabricius)、クロオビクロノメイガ (*Herpetogramma licarsialis Walker*)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana Denis & Schiffermüller*)、ワタアカミムシガ (*Pectinophora gossypiella Saunders*)、ミカンコハモグリ (*Phyllocnistis citrella Stainton*)、オオモンシロチョウ (*Pieris brassicae Linnaeus*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae Linnaeus*)、コナガ (*Plutella xylostella Linnaeus*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua Huebner*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura Fabricius*)、ヨトウガの一種 (*Spodoptera frugiperda J. E. Smith*)、イラクサキンウワバ (*Trichoplusia ni Huebner*) およびキバガの一種 (*Tuta absoluta Meyrick*) などの害虫に対して特に高い活性を示す。また、本発明の化合物は、エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum Harris*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora Koch*)、マメクロアブラムシ (*Aphis fabae Scopoli*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii Glover*)、リンゴアブラムシ (*Aphis pomi De Geer*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola Patch*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani Kaltenbach*)、イチゴケナガアブラムシ (*Chaetosiphon fragaefolii Cockerell*)、ロシアコムギアブラムシ (*Diuraphis noxia Kurdjumov / Mordvilko*)、バラリンゴアブラムシ (*Dysaphis plantaginea Paaserini*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum Hausmann*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni Geoffroy*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi Kaltenbach*)、穀類につくアブラムシ (*Metopolophium dirrhodum Walker*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae Thomas*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae Sulzer*)、レタスアブラムシ (*Nasonovia ribisnigri Mosley*)、コブアブラムシ (*Pemphigus spp.*)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis Fitch*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi Linnaeus*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum Rondani*)、ムギヒゲナガアブラムシ (*Sitobion avenae Fabricius*)、マダラアルファルファアブラムシ (*Therioaphis maculata Buckton*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe*) およびミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricida Kirkaldy*)、カサアブラムシ (*Adelges spp.*)、ペカンネアブラムシ (*Phylloxera devastatrix Pergande*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci Gennadius*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii Bellows & Perring*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri Ashmead*) およびオンシツコナジラミ (*Trialeturodes vaporariorum Westwood*)、ジャガイモヒメヨコバイ (*Empoasca fabae Harris*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus Fallen*)、フタテンヨコバイ (*Macrolestes quadrilineatus Forbes*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps Uhler*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus Stal*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens Stal*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis Ash*

mead)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera* Horvath)、イネウンカ(*Sogatodes orizicola* Muir)、シロリンゴヨコバイ(*Typhlocyba pomaria* McAtee)、チマダラヒメヨコバイ(*Erythroneoura* spp.)、十七年ゼミ(*Magcicada septendecim* Linnaeus)、イセリヤカイガラムシ(*Icerya purchasi* Maskell)、サンホゼカイガラムシ(*Quadraspidiotus perniciosus* Comstock)、ミカンコナカイガラムシ(*Planococcus citri* Risso)、他のコナカイガラムシ(*Pseudococcus* spp.)、ヨーロッパナシキジラミ(*Cacopsylla pyricola* Foerster)、カキキジラミ(*Trioza diospyri* Ashmead)を含む同翅目の虫類に対して商業的に有用な活性を有する。これらの化合物は、アオクサカメムシ(*Acrosternum hilare* Say)、ヘリカメムシの一種(*Anasa tristis* De Geer)、コバネナガカメの一種(*Blissus leucopterus leucopterus* Say)、コットンレーズバグ(*Corythuca gossypii* Fabricius)、トマトバグ(*Cyrtopeltis modesta* Distant)、アカホシカメムシ(*Dysdercus suturellus* Herrich-Schaeffer)、茶色のカメムシの一種(*Euchistus servus* Say)、イッテンカメムシ(*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois)、ヒメマダラカメムシ(*Graptosthetus* spp.)、マツノミヘリカメムシ(*Leptoglossus corculus* Say)、ミドリメクラガメ(*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois)、ミナミアオカメムシ(*Nezara viridula* Linnaeus)、イネカメムシ(*Oebalus pugnax* Fabricius)、ナガカメムシの一種(*Oncopeltus fasciatus* Dallas)、ワタノミハムシ(*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter)を含む半翅目の虫類に対する活性も有する。本発明の化合物で防除される他の昆虫目としては、総翅目(ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis* Pergande)、ミカンアザミウマ(*Scirtothrips citri* Moulton)、ダイズアザミウマ(*Sericothrips variabilis* Beach)およびネギアザミウマ(*Thrips tabaci* Lindeman)など; 鞘翅目(コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata* Say)、インゲンテントウ(*Epilachna varivestis* Mulsant)およびアグリオテス(*Agriotes*)属、アトウス(*Athous*)属またはリモニウス(*Limonius*)属のコメツキムシの幼虫など)が挙げられる。

【0120】

本発明の化合物を、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺線虫剤、殺バクテリア剤、殺ダニ剤、発根刺激剤のような成長調整剤、不妊化剤、信号化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激剤、他の生物学的に活性な化合物または昆虫病原性バクテリア、ウィルスまたは菌・カビ類を含む、1種もしくはそれ以上の他の生物学的に活性な化合物または薬剤と混合して、より広範囲の農業的効用を与える多成分有害生物防除剤を形成することもできる。従って、本発明の組成物は、生物学的に有効な量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤をさらに含んでなり得る。本発明の化合物と配合することができるかか生物学的に活性な化合物または薬剤の例は、アバメクチン、アセフェート、アセトアミブリド、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス・メチル、ピフェントリン、ピフェナゼート、ブプロフェジン、カルボフラン、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホス・メチル、クロムアフェノジド、クロチアニジン、シフルトリン、シフルトリン、シハロトリン、シハロトリン、シベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレ

ート、エチプロール、フェノチカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェン
 プロキシメート、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルシトリネート、
 -フルバリネート、フルフェノクロン、ホノホス、ハロフェノジド、ヘキサフルムロン
 、イミダクロプリド、インドキサカルブ、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、
 メタルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メトミル、メトブレン、メトキシクロル、
 モノクロトホス、メトキシフェノジド、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、パラチオ
 ン、パラチオン - メチル、ベルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメト、ホスファミド
 ン、ピリミカルブ、プロフェノホス、ピメトロジン、ピリダリル、ピリプロキシフェン、
 ロテノン、スピノサド、スルプロホス、テブフェノジド、テフルベンズロン、テフルトリ
 ン、テルブホス、テトラクロルピンホス、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカル
 ブ、チオスルタブ - ナトリウム、トラロメトリン、トリクロルホンおよびトリフルムロン
 のような殺虫剤；アシベンゾラー、アゾキシストロピン、ベノミル、ブラストサイジン -
 S、ボルドー混合物（三塩基性硫酸銅）、プロムコナゾール、カルプロパミド、カプタホ
 ール、カプタン、カルベンダジム、クロロネブ、クロロタロニル、酸塩化銅、銅塩、シフ
 ルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、（S） - 3, 5 - ジク
 ロロ - N - （3 - クロロ - 1 - エチル - 1 - メチル - 2 - オキシプロピル） - 4 - メチル
 ベンズアミド（RH7281）、ジクロシメト（S - 2900）、ジクロメジン、ジクロ
 ラン、ジフェノコナゾール、（S） - 3, 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 2 - （メチルチオ
 ） - 5 - フェニル - 3 - （フェニルアミノ） - 4H - イミダゾール - 4 - オン（RP40
 7213）、ジメトモルフ、ジモキシストロピン、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M
 、ドジン、エジフェンホス、エボキシコナゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェ
 ナリモル、フェンプロコナゾール、フェンカラミド（SZX0722）、フェンピクロニル
 、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンチンアセテート、フェンチンヒドロキ
 シド、フルアジナム、フルジオキソニル、フルメトバー（RPA403397）、フルキ
 ンコナゾール、フルシラゾール、フルトラニル、フルトリアホール、ホルベット、ホセチ
 ル - アルミニウム、フララキシル、フラメタピル（S - 82658）、ヘキサコナゾール
 、イブコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イソプロチオラン、カスガマイシン
 、クレソキシム - メチル、マンコゼブ、マネブ、メフェノキサム、メプロニル、メタラキ
 シル、メトコナゾール、メトミノストロピン / フェノミノストロピン（SSF - 126）
 、ミクロブタニル、ネオ - アソジン（メタンアルソネート第二鉄）、オキサジキシル、ペ
 ンコナゾール、ペンシクロン、プロベナゾール、プロクロラズ、プロパモカルブ、プロピ
 コナゾール、ピリフェノックス、ピラクロストロピン、ピリメタニル、ピロキロン、キノ
 キシフェン、スピロキサミン、イオウ、テブコナゾール、テトラコナゾール、チアベンダ
 ゴール、チフルズアミド、チオフアナート - メチル、チラム、チアジニル、トリアジメホ
 ン、トリアジメノール、トリシクラゾール、トリフロキシストロピン、トリチコナゾール
 、バリダマイシンおよびピンクロゾリンのような殺菌・殺カビ剤；アルジカルブ、オキサ
 ミルおよびフェナミホスのような殺線虫剤；ストレプトマイシンのような殺バクテリア剤
 ；アミトラズ、チノメチオナト、クロロベンジレート、シヘキサチン、ジコホール、ジエ
 ノクロル、エトキサゾール、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェンプロパトリ
 ン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾクス、プロパルギット、ピリダベンおよびテブ
 フェンピラドのような殺ダニ剤；ならびに亜種アイザワイ（aizawai）およびクル
 スターキ（kurs taki）を含むバチルス・チューリングゲンシス（Bacillus
 thuringiensis）、バチルス・チューリングゲンシス（Bacillus
 thuringiensis）デルタエンドトキシン、バクロウィルス、および昆虫病原
 性バクテリア、ウィルスおよび菌・カビ類のような生物剤である。無脊椎有害生物に対し
 てタンパク質毒性（例えば、バチルス・チューリングゲンシス（Bacillus
 thuringiensis）毒素）を発現するように遺伝的に形質転換された植物に、本発明
 の化合物およびそれらの組成物を適用してもよい。外因性の無脊椎有害生物防除化合物お
 よび組成物の効果は、発現された毒素タンパク質と相乗的であり得る。

【0121】

これらの農業用保護剤に関する一般的参照は、ザ ペスティサイド マニュアル (The Pesticide Manual) 第12版、C. D. S. トムリン (C. D. S. Tomlin) 編、ブリティッシュ クロップ プロテクション カウンシル (British Crop Protection Council)、英国、サリー州、ファーンナム (Farnham, Surrey, U.K.)、2000である。

【0122】

本発明の化合物と混合するために好ましい殺虫剤および殺ダニ剤としては、シベルメトリン、シハロトリン、シフルトリン、 α -シフルトリン、エスフェンバレレート、フェンバレレートおよびトラロメトリンのようなピレスロイド；フェノチカルブ、メトミル、オキサミルおよびチオジカルブのようなカルバメート；クロチアニジン、イミダクロプリドおよびチアクロプリドのようなネオニコチノイド；インドキサカルブのような神経細胞ナトリウムチャンネルブロッカー；スピノサド、アバメクチン、アベルメクチンおよびエマメクチンのような殺虫性大環状ラクトン；エンドスルファン、エチプロールおよびフィプロニルのような γ -アミノ絡酸 (GABA) 拮抗剤；フルフェノクスロンおよびトリフルムロンのような殺虫性尿素；ジオフェノランおよびピリプロキシフェンのような幼若ホルモン模倣品 (mimic)；ピメトロジン；ならびにアミトラズが挙げられる。本発明の化合物と混合するのに好ましい生物剤としては、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) およびバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシン、ならびにバクロウィルス科の構成員を含む天然由来および遺伝子改変ウィルス性殺虫剤、ならびに食虫性菌・カビ類が挙げられる。

【0123】

最も好ましい混合物としては、本発明の化合物とシハロトリンとの混合物、本発明の化合物と α -シフルトリンとの混合物、本発明の化合物とエスフェンバレレートとの混合物、本発明の化合物とメトミルとの混合物、本発明の化合物とイミダクロプリドとの混合物、本発明の化合物とチアクロプリドとの混合物、本発明の化合物とインドキサカルブとの混合物、本発明の化合物とアバメクチンとの混合物、本発明の化合物とエンドスルファンとの混合物、本発明の化合物とエチプロールとの混合物、本発明の化合物とフィプロニルとの混合物、本発明の化合物とフルフェノクスロンとの混合物、本発明の化合物とピリプロキシフェンとの混合物、本発明の化合物とピメトロジンとの混合物、本発明の化合物とアミトラズとの混合物、本発明の化合物とバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) との混合物、および本発明の化合物とバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシンとの混合物が挙げられる。

【0124】

特定の例において、同様の範囲の防除を有するが作用様式が異なる他の無脊椎有害生物防除化合物または薬剤との組み合わせは、抵抗処理に関して特に有利である。従って、本発明の組成物は、同様の範囲の防除を有するが作用様式が異なる少なくとも1種の追加の無脊椎有害生物防除化合物または薬剤の生物学的に有効な量をさらに含んでなり得る。植物保護化合物 (例えば、タンパク質) を発現するように遺伝子改変された植物または植物の位置を本発明の化合物の生物学的に有効な量と接触させることによって、より広い範囲の植物保護をもたらすこともでき、抵抗処理に有利となり得る。

【0125】

農業的および/または非農業的外寄生位置を含む有害生物環境に、保護されるべき領域に、または防除されるべき有害生物に直接、1種もしくはそれ以上の本発明の化合物を有効量で適用することにより、無脊椎有害生物は農業的および/または非農業的適用において防除される。従って、本発明は、無脊椎動物またはそれらの環境と、1種もしくはそれ以上の本発明の化合物の生物学的に有効な量と、あるいは少なくとも1種のかかる化合物を含んでなる組成物と、または少なくとも1種のかかる化合物および有効量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物もしくは薬剤を含んでなる組成物とを接触させるこ

とを含んでなる、農業的および／または非農業的適用における無脊椎動物の防除方法をさらに含んでなる。本発明の化合物および少なくとも１種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤の有効量を含んでなる適切な組成物の例としては、追加の生物学的に活性な化合物が、本発明の化合物と同一顆粒上に、または本発明の化合物が存在する顆粒から分離された顆粒上に存在する顆粒組成物が挙げられる。

【 0 1 2 6 】

好ましい接触方法は噴霧による。あるいは、本発明の化合物を含んでなる顆粒組成物を植物の葉面または土壌に適用することができる。本発明の化合物は、植物と、液体製剤の土壌水薬、土壌への顆粒製剤、苗床箱処理または移植浸透として適用される本発明の化合物を含んでなる組成物との接触による、植物の取り込みを介しても有効に運搬される。外寄生位置に、本発明の化合物を含んでなる組成物を局所適用することによっても、化合物は有効である。他の接触方法としては、直接および残留噴霧、空気噴霧、ゲル、シードコート、マイクロカプセル化、浸透移行性取り込み、餌料、イヤータグ、ボラス、霧発生器、燻蒸剤、エーロゾル、ダスト等による本発明の化合物または組成物の適用が挙げられる。無脊椎動物防除装置（例えば、昆虫網）を製作するために、本発明の化合物を材料中に含浸させてもよい。

10

【 0 1 2 7 】

無脊椎有害動物によって消費されるか、またはトラップ、餌料ステーション等のような装置内に使用される餌料組成物中に、本発明の化合物を組み入れることができる。かかる餌料組成物は、（a）活性成分、すなわち、式Ⅰの化合物、それらのN-オキシドまたは塩と、（b）１種もしくはそれ以上の食物材料と、（c）場合により誘引剤と、（d）場合により１種もしくはそれ以上の保湿剤とを含んでなる、顆粒の形態であり得る。注目すべきは、約 0.001 ~ 5 % の間の活性成分と、約 40 ~ 99 % の食物材料および／または誘引剤と、場合により、約 0.05 ~ 10 % の保湿剤とを含んでなる、顆粒または餌料組成物であり、これは、非常に低い適用率で、特に、直接接触よりも摂取による致死量である活性成分の適用量での土壌無脊椎有害生物の防除において有効である。注目すべきは、食料源および誘引剤の両方として機能する、いくつかの食物材料である。食物材料としては、炭水化物、タンパク質および脂質が挙げられる。食物材料の例は、植物粉、糖、澱粉、動物脂肪、植物油、酵母抽出物および乳固形分である。誘引剤の例は、果物もしくは植物抽出物、香料、または他の動物もしくは植物成分、フェロモン、または標的の無脊椎有害生物を誘引することが既知である他の薬剤のような着臭剤および風味剤である。保湿剤、すなわち、湿分を保持する薬剤の例は、グリコールおよび他のポリオール、グリセリンおよびソルビトールである。注目すべきは、アリ（ant）、シロアリ（termite）およびゴキブリ（cockroach）を個々または組み合わせで含む無脊椎有害生物を防除するために使用される餌料組成物（およびかかる餌料組成物を利用する方法）である。無脊椎有害生物の防除装置は、本発明の餌料組成物と、餌料組成物を受け取るために適応されたハウジングとを含んでなり得る。ここで、ハウジングは、ハウジングの外側の位置から無脊椎有害生物が餌料組成物へ接近することができるように、無脊椎有害生物が開口を通過可能であるサイズに作られた少なくとも１つの開口を有し、そしてハウジングは、無脊椎有害生物の潜在的もしくは既知の活性位置に、またはその付近に配置されるようにさらに構成される。

20

30

40

【 0 1 2 8 】

本発明の化合物を純粋な状態で適用することができるが、最も頻繁な適用は、適切な担体、希釈剤および界面活性剤とともに、可能であれば期待される最終用途次第の食品と組み合わせで１種もしくはそれ以上の化合物を含んでなる製剤である。好ましい適用方法は、化合物の水分散系または精製された油溶液の噴霧を含む。噴霧油、噴霧油濃縮物、散布展着剤、アジュバント、他の溶媒およびピペロニルブトキシドのような協力剤との組み合わせもしばしば化合物効能を増加させる。非農業的使用に関して、缶、ボトルまたは他の容器のような噴霧容器から、ポンプの手段によって、または高压容器、例えば、加圧エーロゾル噴霧缶からそれを放出することによって、かかる噴霧を適用することができる。か

50

かる噴霧組成物は、様々な形態、例えば、噴霧、ミスト、泡、フェームまたはフォッグを取ることができる。従って、かかる噴霧組成物は、場合によっては、噴射剤、発泡剤等をさらに含み得る。注目すべきは、本発明の化合物または組成物と、噴射剤とを含んでなる噴霧組成物である。代表的な噴射剤としては、限定されないが、メタン、エタン、プロパン、イソプロパン、ブタン、イソブタン、ブテン、ペンタン、イソペンタン、ネオペンタン、ペンテン、ヒドロフルオロカーボン、クロロフルオロカーボン、ジメチルエーテル、およびそれらの混合物が挙げられる。注目すべきは、カ(mosquito)、ブユ(black fly)、サシバエ(stable fly)、メクラアブ(deer fly)、アブ(horse fly)、ワスプ(wasp)、イエロージャケット(yellow jacket)、ホーネット(hornet)、マダニ(tick)、クモ(spider)、アリ(ant)、ブヨ(gnat)等を個々または組み合わせで含む無脊椎有害生物を防除するために使用される噴霧組成物(および噴霧容器から分配されるかかる噴霧組成物を利用する方法)である。

10

【0129】

有効な防除に必要とされる適用率(すなわち、「生物学的に有効な量」)は、防除されるべき無脊椎動物の種類、有害生物の生命サイクル、生命段階、大きさ、位置、年齢、宿主作物または動物、摂食行動、交接行動、周囲湿度、温度等のような要因次第である。通常的环境下において、農業的生態系における有害生物を防除するために1ヘクタールあたり約0.01~2kgの活性成分の適用率が十分であるが、0.0001kg/ヘクタール程度の少なさでも十分であり、または8kg/ヘクタール程度の多さが必要とされてもよい。非農業的適用に関して、有効な使用率は、約1.0~50mg/平方メートルの範囲であるが、0.1mg/平方メートル程度の少なさでも十分であり、または150mg/平方メートル程度の多さが必要とされてもよい。所望のレベルの無脊椎有害生物防除に必要な生物学的に有効な量を当業者は容易に決定することができる。

20

【0130】

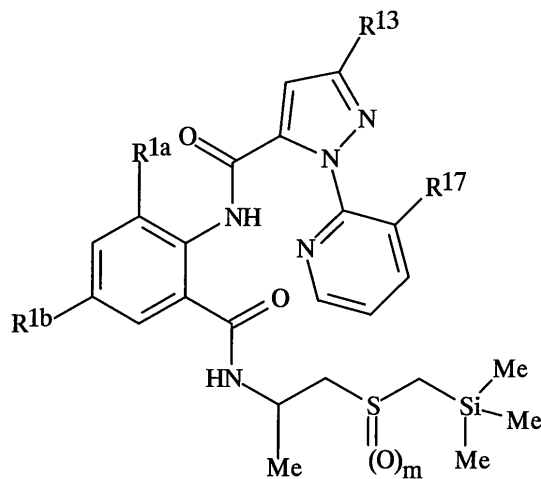
以下の試験は、特定の有害生物に対する本発明の化合物の防除効能を実証する。「防除効能」とは、著しく低下した摂食を引き起こす、無脊椎有害生物発育の抑制(死亡を含む)を意味する。しかしながら、化合物により得られる有害生物防除保護はこれらの種類に制限されない。化合物の記述に関しては索引表Aを参照のこと。索引表において略号「Me」はメチルである。略号「Ex.」は「実施例」を表し、その後ろに化合物が調製される実施例を示す数字が続く。

30

【0131】

【表 2 7】

索引表 A



化合物	R ^{1a}	R ^{1b}	R ¹³	R ¹⁷	m	融点℃
1(実施例 1)	Me	Cl	Br	Cl	0	151-153
2	Cl	Cl	Br	Cl	0	171-172
3	Me	CN	CF ₃	Cl	0	202-203
4	Me	I	Br	Cl	0	161-162
5	Me	Cl	CF ₃	Cl	0	152-153
6	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	0	151-152

【0132】

本発明の生物学的実施例

試験 A

コナガ (*Plutella xylostella*) の防除を評価するために、12 ~ 14 日齢ラディッシュ植物を内部に含む小型開放容器で試験ユニットを構成した。コアサンプラーの使用により、昆虫食餌の一片において 10 ~ 15 個体の新生幼虫で、これを事前に外寄生させ、シート上に多くの発育幼虫を有する硬化した昆虫食餌のシートからプラグを取り出し、そして幼虫および食餌を含有するプラグを試験ユニットに移した。食餌プラグが乾燥すると、幼虫は試験植物上へと移動した。

【0133】

特記されない限り、10% アセトン、90% 水、ならびに 300 ppm の X-77 (登録商標) スプレッダー ロー-フォーム フォーミュラ (Spreader Lo-Form Formula) 非イオン性界面活性剤 (アルキルアリールポリオキシエチレン、遊離脂肪酸、グリコールおよびイソプロパノール含有) (米国、コロラド州、グリーリーのラブランド・インダストリーズ・インコーポレイテッド (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA)) を含有する溶液を使用して、試験化合物を配合した。各試験ユニット上 1.27 cm (0.5 インチ) 上に位置する 1/8 インチカスタムポディーを有する SUJ2 噴霧器ノズル (米国、イリノイ州、ホイートンのスプレーイング・システムズ・カンパニー (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA)) を通して、配合された化合物を 1 mL 液体で適用した。試験化合物 2、3、4、5 および 6 を 10 ppm で噴霧し、そして試験化合物 1 を 50 ppm で噴霧し、全てについて三回繰り返した。配合され

た試験化合物の噴霧後、各試験ユニットを1時間乾燥させ、次いで黒色のスクリーンキャップを上部に置いた。25 および70%相対湿度で育成チャンバー中に6日間、試験ユニットを保持した。次いで、消費された葉を基準にして、植物摂食損害を視覚的に評価した。

【0134】

試験された化合物の中で、以下のものが非常に良好なレベルから優れたレベルの植物保護(20%以下の範囲の摂食損害)をもたらした: 1、2、3、4、5および6。

【0135】

試験B

ヨトウガの一種(*Spodoptera fugiperda*)の防除を評価するために、4~5日齢コーン(トウモロコシ)植物を内部に含む小型開放容器で試験ユニットを構成した。昆虫食餌の一片において10~15個体の1日齢幼虫で、(コアサンプラーの使用により)これを事前に外寄生させた。

10

【0136】

試験Aに記載された通り、試験化合物2、3、4、5および6を配合し、10ppmで噴霧し、そして試験化合物1を配合し、50ppmで噴霧した。適用を三回繰り返した。噴霧後、試験Aに記載された通り試験ユニットを育成チャンバー中で保持し、次いで視覚的に評価した。

【0137】

試験された化合物の中で、以下のものが優れたレベルの植物保護(20%以下の範囲の摂食損害)をもたらした: 1、2、3、4、5および6。

20

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/US 03/31677

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07F7/08 A01N55/10

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07F C07D A01N

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 01 70671 A (DU PONT ; LAHM GEORGE P (US); MYERS BRIAN J (US); SELBY THOMAS P (U) 27 September 2001 (2001-09-27) cited in the application claim 1; examples	1-15
A	WO 02 062807 A (ERDELEN CHRISTOPH ; BAYER AG (DE); BRETSCHNEIDER THOMAS (DE)) 15 August 2002 (2002-08-15) abstract; examples	1-15



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

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

E earlier document but published on or after the International filing date

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

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

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

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

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

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

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

24 February 2004

Date of mailing of the international search report

04/03/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. Box 5818 Patentplan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx: 51 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

De Jong, B

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/US 03/31677

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0170671	A	27-09-2001	AU 5094601 A	03-10-2001
			BR 0109757 A	04-02-2003
			CA 2400167 A1	27-09-2001
			CN 1419537 T	21-05-2003
			EP 1265850 A2	18-12-2002
			HU 0300263 A2	28-06-2003
			JP 2003528070 T	24-09-2003
			NZ 520728 A	26-09-2003
			WO 0170671 A2	27-09-2001
WO 02062807	A	15-08-2002	DE 10115406 A1	08-08-2002
			WO 02062807 A1	15-08-2002
			EP 1360190 A1	12-11-2003

フロントページの続き

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT, BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HU,IE,IT,LU,MC,NL,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA, GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ, EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,M W,MX,MZ,NI,NO,NZ,OM,PG,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SY,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA ,ZM,ZW

(72)発明者 セルビイ, トーマス・ポール

アメリカ合衆国デラウェア州 1 9 8 0 8 ウイルミントン・ハンターコート 1 1 6

(72)発明者 スティブンソン, トーマス・マーティン

アメリカ合衆国デラウェア州 1 9 7 0 2 ニューアーク・イロコイスコート 1 0 3

Fターム(参考) 4H011 AC01 BA01 BB09 DA13

4H049 VN01 VP01 VQ59 VR24 VU02

【要約の続き】

る、無脊椎有害生物の防除方法も開示される。また本発明は、生物学的に有効な量の式 I の化合物、その N - オキシドまたはその化合物の適切な塩と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の成分とを含んでなる、無脊椎有害生物の防除のための組成物に関する。