

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7165126号
(P7165126)

(45)発行日 令和4年11月2日(2022.11.2)

(24)登録日 令和4年10月25日(2022.10.25)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 3 1 1

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 C S P

A 0 1 P 7/04 (2006.01)

A 0 1 N 43/90 1 0 4

A 0 1 P 7/02 (2006.01)

A 0 1 P 7/04

A 0 1 P 7/02

請求項の数 10 (全114頁)

(21)出願番号 特願2019-515229(P2019-515229)

(86)(22)出願日 平成29年9月15日(2017.9.15)

(65)公表番号 特表2019-529429(P2019-529429
A)

(43)公表日 令和1年10月17日(2019.10.17)

(86)国際出願番号 PCT/EP2017/073290

(87)国際公開番号 WO2018/050825

(87)国際公開日 平成30年3月22日(2018.3.22)

審査請求日 令和2年9月10日(2020.9.10)

(31)優先権主張番号 16189445.6

(32)優先日 平成28年9月19日(2016.9.19)

(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 507203353

バイエル・クロップサイエンス・アクチ
エンゲゼルシャフトドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム・ア
ム・ライン、アルフレート・ノベル・シ
ュトラッセ・5 0

(73)特許権者 591063187

バイエル アクチエンゲゼルシャフト
Bayer Aktiengesell
schaftドイツ・5 1 3 7 3・レーバークーゼン
・カイザー・ヴィルヘルム・アレー・1

(74)代理人 100114188

弁理士 小野 誠

(74)代理人 100119253

最終頁に続く

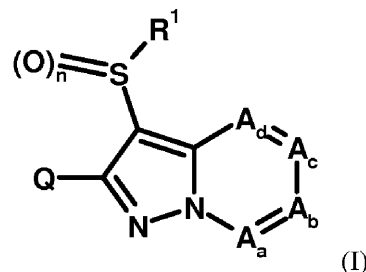
(54)【発明の名称】 ピラゾロ [1, 5 - a] ピリジン誘導体及びその殺有害生物剤としての使用

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式 (I) の化合物。

【化1】



〔式中、

A a は、窒素又は = C (R ^{1 0}) - であり、A b は、窒素又は = C (R ^{1 1}) - であり、A c は、窒素又は = C (R ^{1 2}) - であり、

A d は、窒素であり、

ここで、A a、A b、A c 及び A d の 2 個以下が窒素であることができ、

R ¹ は、(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_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、 (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_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_6) -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_2-C_6) -ハロアルキニル、 (C_2-C_6) -シアノアルキニル、 (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、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、 (C_3-C_8) -シクロアルキルアミノ、 (C_1-C_6) -アルキルカルボニルアミノ、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (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) -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) -ハロアルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (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) -ハロアルキルカルボニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (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) -アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルアミノスルホニル- (C_1-C_6) -アルキルであり、

又は、各場合で、同一に若しくは異なってモノ-若しくは多-アリール-、-ヘタリール-又は-複素環-置換されていてもよい (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_6) -アルキニル、 (C_3-C_8) -シクロアルキルであり、ここで、アリール、ヘタリール又は複素環はそれぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、アミノスルホニル、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (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) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ、 (C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルカルボニル、 (C_3-C_6) -トリアルキルシリル又はベンジルによって同一に若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、又は

R^1 は、アリール、ヘタリール又は複素環であり、それらはそれぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_3-C_8) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (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) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ、 (C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_2-C_6)

10

20

30

40

50

) -アルキルカルボニル、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルカルボニル、(C₃-C₈)-トリアルキルシリル、(=O) (複素環のみの場合) 及び(=O)₂ (複素環のみの場合) によって同一に若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、

R¹⁰、R¹¹、R¹²は独立に、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-(C₁-C₆)-アルキルシリル、(C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₃-C₈)-シクロアルキル-(C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₁-C₆)-アルキル-(C₃-C₈)-シクロアルキル、ハロ-(C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-ハロアルキル、(C₁-C₆)-シアノアルキル、(C₁-C₆)-ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁-C₆)
)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-ハロアルケニル、(C₂-C₆)-シアノアルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₂-C₆)-ハロアルキニル、(C₂-C₆)-シアノアルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-ハロアルコキシ、(C₁-C₆)-シアノアルコキシ、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₆)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-アルキル-(C₁-C₆)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-ハロアルキル-(C₁-C₆)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-アルキルチオ-(C₁-C₆)
)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル-(C₁-C₆)
)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₆)-アルキルカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルチオカルボニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルカルボニルオキシ、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₆)-ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₆)
)-アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルアミノチオカルボニル、ジ-(C₁-C₆)-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁-C₆)-アルキルアミノチオカルボニル、(C₂-C₆)-アルケニルアミノカルボニル、ジ-(C₂-C₆)-アルケニルアミノカルボニル、(C₃-C₈)-シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₆)-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₆)-アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₆)-アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁-C₆)-アルキルアミノスルホニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルアミノチオカルボニル、ジ-(C₁-C₆)-アルキルアミノチオカルボニル、(C₃-C₈)-シクロアルキルアミノ、(C₁-C₆)
)-アルキルカルボニルアミノであり、又は

各場合で1回若しくは複数回、同一に若しくは異なって置換されていてもよいアリール又はヘタリールであり、ここで、(ヘタリールの場合)少なくとも一つのカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、可能な置換基は、各場合で、次のもの：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C₁-C₆)アルキルシリル、(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₃-C₈)シクロアルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)ハロアルキル、(C₁-C₆)シアノアルキル、(C₁-C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂

10

20

30

40

50

$-C_6$) 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) 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) 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) 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、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、 (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、 (C_1-C_6) アルキルカルボニルアミノであり、

ここで、前記 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基で
あり、

Qは、部分飽和若しくは飽和複素環又はヘテロ芳香族8員、9員、10員、11員若し
くは12員縮合二環式又は三環式環系であり、ここで、少なくとも一つのカルボニル基が
存在していてもよく、及び/又は、ここで、前記環系は、同一に若しくは異なってモノ置
換若しくは多置換されていてもよく、前記置換基は、独立に、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

チオー (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノから選択されることができ、

10

20

又は、ここで、前記置換基は、独立にフェニル又は5員若しくは6員ヘテロ芳香環から選択されることができ、ここで、フェニル若しくは前記環は、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシによって同一若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、nは、0、1又は2である。]

【請求項2】

A aが、窒素又は=C(R¹₀)-であり、

A bが、窒素又は=C(R¹₁)-であり、

A cが、窒素又は=C(R¹₂)-であり、

A dが、窒素であり、

ここで、A a、A b、A c及びA dの2個以下が窒素であることができ、

R¹が、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) アルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルキニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキル - アミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - アミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスル

30

40

50

ホニルアミノであり、

又は、各場合で、同一に若しくは異なってモノー若しくはジアーリールー、－ヘタリールー又は－複素環－置換されていてもよい (C_1-C_4) アルキル、(C_1-C_4) アルコキシ、(C_2-C_4) アルケニル、(C_2-C_4) アルキニル、(C_3-C_6) シクロアルキルであり、ここで、アーリール、ヘタリール又は複素環が、それぞれ、同一に若しくは異なって、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、(C_1-C_4) アルキル、(C_3-C_4) シクロアルキル、(C_1-C_4) アルコキシ、(C_1-C_4) ハロアルキル、(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) 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) アルキルスルフィミノによってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、又は

R^1 が、アーリール、ヘタリール又は複素環であり、それらがそれぞれ、同一に若しくは異なって、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、(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) －ハロアルキル、(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) －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) －アルキルスルフィミノ、(C_1-C_4) －アルキルスルホキシイミノ、(C_1-C_4) －アルキルカルボニル、(C_3-C_4) －トリアルキルシリル、($=O$) (複素環のみの場合) 及び ($=O$)₂ (複素環のみの場合) によってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} が独立に、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_4) アルキルシリル、(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、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_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_2-C_4) アルケニル、(C_2-C_4) ハロアルケニル、(C_2-C_4) シアノアルケニル、(C_2-C_4) アルキニル、(C_2-C_4) ハロアルキニル、(C_2-C_4) シアノアルキニル、(C_1-C_4) アルコキシ、(C_1-C_4) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) シアノアルコキシ、(C_1-C_4) アルコキシ－(C_1-C_4) アルコキシ、(C_1-C_4) アルキルヒドロキシイミノ、(C_1-C_4) アルコキシイミノ、(C_1-C_4) アルキル－(C_1-C_4) アルコキシイミノ、(C_1-C_4) ハロアルキル－(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) アルキルチオ－(C_1-C_4) アルキル、(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) アルキルスルフィニル－(C_1-C_4) アルキル、(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－(C_1-C_4) アルキル、(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、アミノチオカルボニル、(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、ジ－(C_1-C_4) アルキルアミノスルホニル、(C_1-C_4) アルキルカルボニルアミノであり、

そしてさらに、フェニル又はヘタリールであり、それらがそれぞれ、同一に若しくは異なってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、ここで、(ヘタリールの場合) 少なくとも一つのカルボニル基が存在していてもよく、及び／又は、ここで、可能な置換基は、各場合で、次のもの：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(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、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_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_2-C_4) アルケニル、(C_2-C_4) ハロアルケニル、(C_2-C_4) シアノアルケ

10

20

30

40

50

ニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)シアノアルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ- (C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキル- (C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルキル- (C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルチオ- (C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル- (C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル- (C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ- (C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ- (C₁-C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ- (C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノであり、

ここで、前記R¹⁰、R¹¹、R¹²基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

Qが、ヘテロ芳香族8員、9員、10員、11員若しくは12員縮合二環式又は三環式環系であり、ここで、前記環系が、同一に若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、及び、ここで、前記置換基が、独立に、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- (C₁-C₆)-アルキルシリル、(C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₃-C₈)-シクロアルキル- (C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₁-C₆)-アルキル- (C₃-C₈)-シクロアルキル、ハロ- (C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-ハロアルキル、(C₁-C₆)-シアノアルキル、(C₁-C₆)-ヒドロキシアルキル、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-ハロアルケニル、(C₂-C₆)-シアノアルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₂-C₆)-アルキニルオキシ- (C₁-C₄)-アルキル、(C₂-C₆)-ハロアルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-ハロアルコキシ、(C₁-C₆)-ハロアルコキシ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニルオキシ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-ハロアルケニルオキシ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-シアノアルコキシ、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₆)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-アルキル- (C₁-C₆)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-アルキルチオ- (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル- (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルコキシ- (C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル- (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₆)-アルキルカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルカルボニル- (C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルチオカルボニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルカルボニルオキシ、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₆)-ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C₁-C₆)-アルキルアミノカルボニル、ジ- (C₁-C₆)-アルキルアミノチオカルボニル、(C₃-C₈)-シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₆)-アルキルア

10

20

30

40

50

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、(C_1-C_6) -アルキルカルボニルアミノ

から選択されることができ、

又は、ここで、前記置換基が、独立に、フェニル又は5員若しくは6員ヘテロ芳香環から選択されることができ、ここで、フェニル若しくは前記環が、 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に若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、

nが、0、1又は2である、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項3】

Aaが、窒素又は $=C(R^{10})-$ であり、

Abが、窒素又は $=C(R^{11})-$ であり、

Acが、窒素又は $=C(R^{12})-$ であり、

Adが、窒素であり、

ここで、Aa、Ab、Ac及びAdの2個以下が窒素であることができ、

R^{10} が、(C_1-C_4) -アルキル、(C_1-C_4) -ヒドロキシアルキル、(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_1-C_4) -アルキルチオ- (C_1-C_4) -アルキル、(C_1-C_4) -アルキルスルフィニル- (C_1-C_4) -アルキル又は(C_1-C_4) -アルキルスルホニル- (C_1-C_4) -アルキルであり、

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} が、独立に水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- (C_1-C_4) アルキルシリル、(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、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_1-C_4) 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) シアノアルケニル、(C_2-C_4) アルキニル、(C_2-C_4) ハロアルキニル、(C_2-C_4) シアノアルキニル、(C_1-C_4) アルコキシ、(C_1-C_4) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) シアノアルコキシ、(C_1-C_4) アルキルヒドロキシミノ、(C_1-C_4) アルコキシイミノ、(C_1-C_4) アルキル- (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、ジ- (C_1-C_4) アルキル-アミノスルホニル、(C_1-C_4) アルキルカルボニルアミノであり、

そしてさらには、フェニル又はヘタリールであり、それらがそれぞれ、同一に若しくは異なってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、(ヘタリールの場合) 少なくとも一つのカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、可能な置換基は、各場合で、次のもの：シアノ、ハロゲン、(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、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

10

20

30

40

50

）ハロアルキル、(C₁－C₄)シアノアルキル、(C₂－C₄)アルケニル、(C₂－C₄)ハロアルケニル、(C₂－C₄)シアノアルケニル、(C₂－C₄)アルキニル、(C₂－C₄)ハロアルキニル、(C₂－C₄)シアノアルキニル、(C₁－C₄)アルコキシ、(C₁－C₄)ハロアルコキシ、(C₁－C₄)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁－C₄)アルコキシイミノ、(C₁－C₄)アルキル－(C₁－C₄)アルコキシイミノ、(C₁－C₄)アルキルチオ、(C₁－C₄)ハロアルキルチオ、(C₁－C₄)アルキルスルフィニル、(C₁－C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁－C₄)アルキルスルホニル、(C₁－C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁－C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁－C₄)アルキルカルボニル、(C₁－C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁－C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ－(C₁－C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁－C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁－C₄)アルキルアミノ、ジ－(C₁－C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁－C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ－(C₁－C₄)アルキルアミノスルホニル、(C₁－C₄)アルキルカルボニルアミノであり、

ここで、前記 R¹⁰、R¹¹、R¹²基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

Qが、Q₁～Q₂₀の群からのヘテロ芳香族9員若しくは12員縮合二環式又は三環式環系：

10

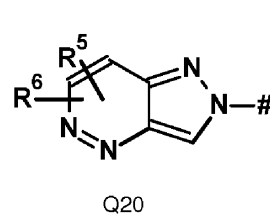
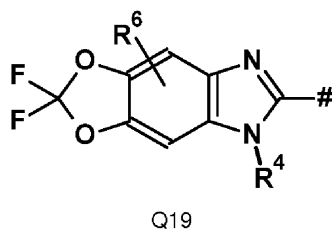
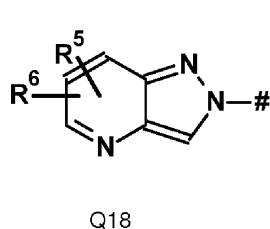
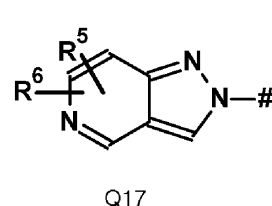
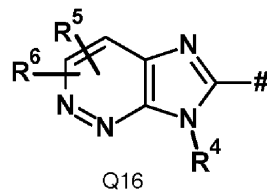
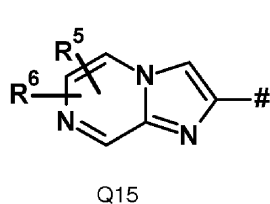
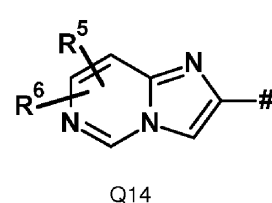
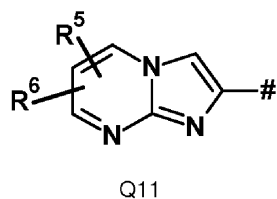
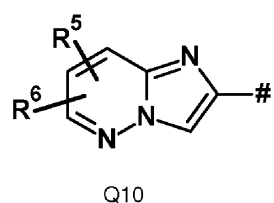
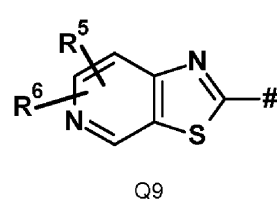
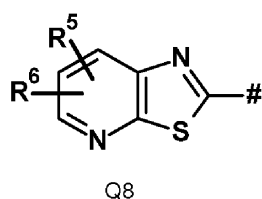
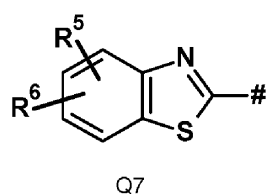
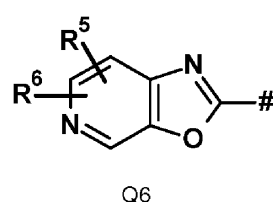
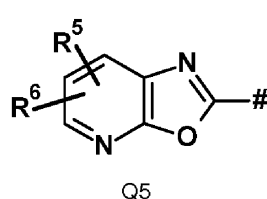
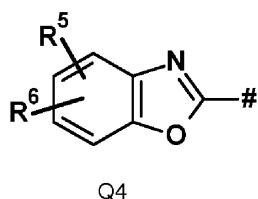
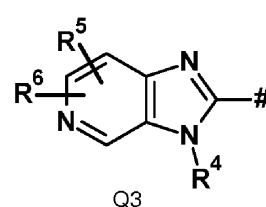
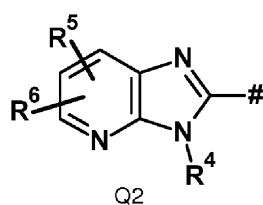
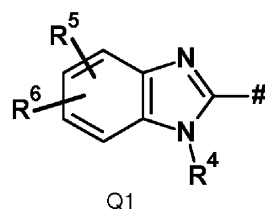
20

30

40

50

【化 2】



であり、

R^4 が、 (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) -アルケニルオキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -ハロアルケニルオキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_4) -ハロアルケニル、 (C_2-C_4) -シアノアルケニル、 (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、 (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- $(C_3-$

C₆) -シクロアルキル、(C₁-C₄) -アルキル - (C₃-C₆) -シクロアルキル、ハロ - (C₃-C₆) -シクロアルキル、(C₁-C₄) -アルキルチオ - (C₁-C₄) -アルキル、(C₁-C₄) -アルキルスルフィニル - (C₁-C₄) -アルキル、(C₁-C₄) -アルキルスルホニル - (C₁-C₄) -アルキル又は(C₁-C₄) -アルキルカルボニル - (C₁-C₄) -アルキルであり、

R⁵、R⁶が独立に、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁-C₄) -アルキル、(C₁-C₄) -ハロアルキル、(C₂-C₄) -アルケニル、(C₂-C₄) -ハロアルケニル、(C₂-C₄) -アルキニル、(C₂-C₄) -ハロアルキニル、(C₃-C₆) -シクロアルキル、(C₃-C₆) -シクロアルキル - (C₃-C₆) -シクロアルキル、(C₁-C₄) -アルキル - (C₃-C₆) -シクロアルキル、(C₁-C₄) -アルコキシ、(C₁-C₄) -ハロアルコキシ、(C₁-C₄) -アルコキシイミノ、(C₁-C₄) -アルキルチオ、(C₁-C₄) -ハロアルキルチオ、(C₁-C₄) -アルキルスルフィニル、(C₁-C₄) -ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄) -アルキルスルホニル、(C₁-C₄) -ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄) -アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄) -アルキルカルボニル、(C₁-C₄) -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₄) -アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁-C₄) -アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄) -アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄) -アルキルアミノ、ジ - (C₁-C₄) -アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄) -アルキルアミノスルホニル又はジ - (C₁-C₄) -アルキルアミノスルホニルであり、

nが、0、1又は2である、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項4】

A aが、窒素又は=C(R¹⁰) -であり、

A bが、窒素又は=C(R¹¹) -であり、

A cが、窒素又は=C(R¹²) -であり、

A dが、窒素であり、

ここで、A a、A b、A c及びA dの2個以下が窒素であることができ、

R¹が、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、シクロブチル、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、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルであり、

R¹⁰、R¹¹、R¹²が、独立に水素、シアノ、ハロゲン、(C₁-C₄) アルキル、(C₃-C₆) シクロアルキル、アミノカルボニル、(C₁-C₄) ハロアルキル、(C₁-C₄) アルコキシ、(C₁-C₄) ハロアルコキシ、(C₁-C₄) アルキルチオ、(C₁-C₄) アルキルスルフィニル、(C₁-C₄) アルキルスルホニル、(C₁-C₄) ハロアルキルチオ、(C₁-C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄) ハロアルキルスルホニル又は(C₁-C₄) アルキルカルボニルアミノであり、

ここで、前記R¹⁰、R¹¹、R¹²基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

Qが、Q₂、Q₃、Q₅、Q₆、Q₈、Q₉、Q₁₀、Q₁₁、Q₁₄、Q₁₅、Q₁₆又はQ₁₉の群からのヘテロ芳香族9員若しくは12員縮合二環式又は三環式環系：

10

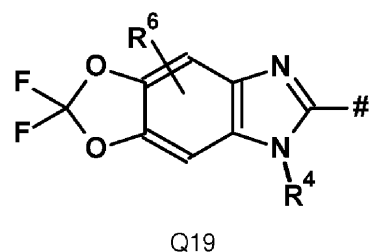
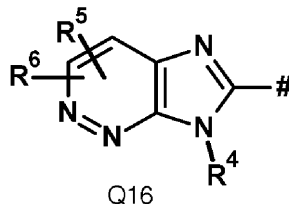
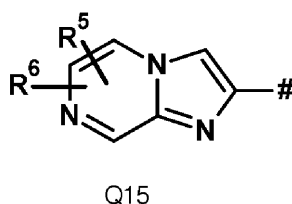
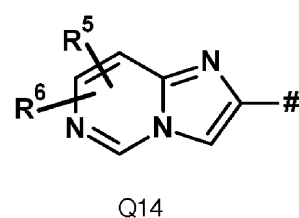
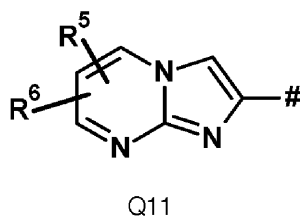
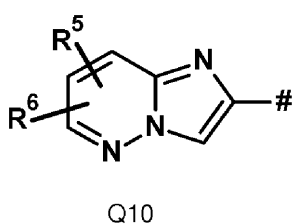
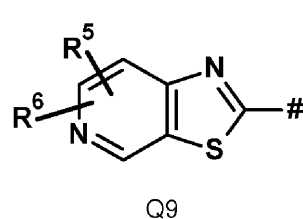
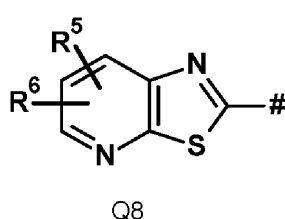
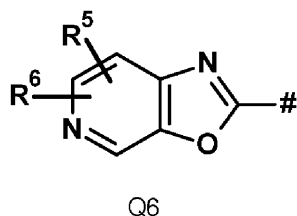
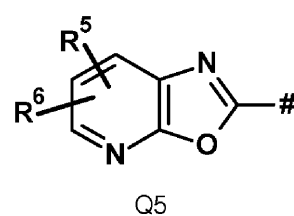
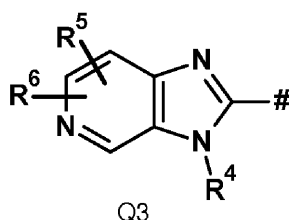
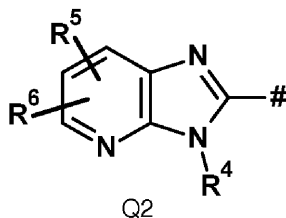
20

30

40

50

【化 3】



であり、

R^4 が、 (C_1-C_4) アルキル又は (C_1-C_4) アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキルであり、

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_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) アルキルカルボニル、 (C_1-C_4) ハロアルキルカルボニル、 (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) アルキルアミノスルホニル又はジ- (C_1-C_4) アルキルアミノスルホニルであり、

R^6 が、水素であり、

n が、0、1又は2である、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項5】

Aaが、窒素又は $=C(R^{10})-$ であり、

Abが、窒素又は $=C(R^{11})-$ であり、

A c が、窒素又は $=C(R^{12})-$ であり、

A d が、窒素であり、

ここで、A a、A b、A c 及び A d の 2 個以下が窒素であることができ、

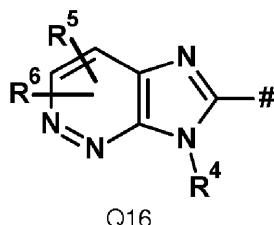
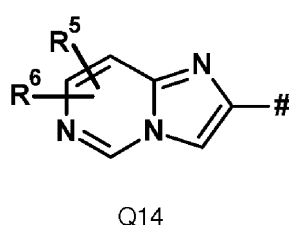
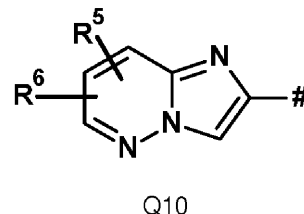
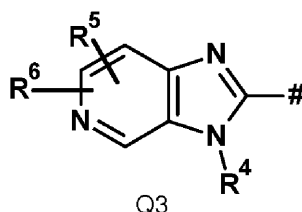
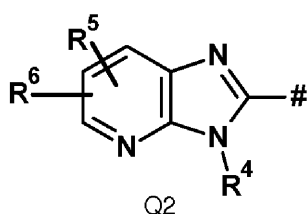
R^1 が、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル又はシクロプロピルであり、

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} が、独立に水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル、アミノカルボニル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、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、トリフルオロメチルスルホニル又はメトキシであり、

ここで、前記 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

Q が、Q 2、Q 3、Q 10、Q 14 又は Q 16 の群からのヘテロ芳香族 9 員縮合二環式環系：

【化 4】



であり、

R^4 が、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり、
 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、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又はトリフルオロメチルスルホニルであり、

R^6 が、水素であり、

n が、0、1 又は 2 である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 6】

A a が、 $=C(R^{10})-$ であり、

A b が、 $=C(R^{11})-$ であり、

A c が、 $=C(R^{12})-$ であり、

A d が、窒素であり、

R^1 が、エチルであり、

R^{10} が、水素又はメチルであり、

R^{11} が、水素、塩素、シアノ、アミノカルボニル又はシクロプロピルであり、

R^{12} が、水素又はメチルであり、

Q が、Q 2 又は Q 3 の群からのヘテロ芳香族 9 員縮合二環式環系であり、

R^4 が、メチルであり、

R⁵が、トリフルオロメチルであり、
R⁶が、水素であり、
nが、2である、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項7】

請求項1に記載の式(I)の化合物、及びさらに増量剤及び／又は界面活性剤を含む農薬製剤。

【請求項8】

さらなる農薬有効成分をさらに含む請求項7に記載の農薬製剤。

【請求項9】

害虫の防除方法であって、請求項1に記載の式(I)の化合物又は請求項7若しくは8に記載の農薬製剤を、当該害虫及び／又は当該害虫の生息場所に作用させる方法。

10

【請求項10】

害虫を防除するための、請求項1に記載の式(I)の化合物又は請求項7若しくは8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(animal pests)、特に節足動物、特別には昆虫及びクモ形類を防除するための殺ダニ剤及び／又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びにそれらの製造方法及び製造のための中間体に関する。

20

【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、WO2016/124563、WO2016/124557、WO2016/162318、WO2017/093180、EP16152384.0、EP16156911.6、EP16168252.1、WO2015/121136、WO2016//107742、WO2016/091731、WO2016/129684、EP16180168.3、EP16180170.9、EP16184163.0、EP16200177.0ですでに報告されている。

30

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【文献】WO2010/125985

WO2012/074135

WO2012/086848

WO2013/018928

WO2013/191113

WO2014/142292

40

WO2014/148451

WO2015/000715

WO2016/124563

WO2016/124557

WO2016/162318

WO2017/093180

EP16152384.0

EP16156911.6

EP16168252.1

WO2015/121136

50

WO 2016 / 107742

WO 2016 / 091731

WO 2016 / 129684

EP 16180168.3

EP 16180170.9

EP 16184163.0

EP 16200177.0

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

しかしながら、上記で引用の文書から既に公知である有効成分の一部は、使用において欠点を有しており、それは、それらがごく狭い範囲の利用分野しか持たないか、満足できる殺虫活性や殺ダニ活性を持たないかのいずれかである。

【0005】

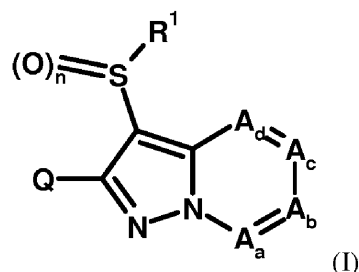
新規な縮合二環式複素環誘導体が見出され、それらは、すでに公知の化合物に勝る利点を有しており、例えば、より良好な生理特性若しくは環境特性、より広範囲の施用法、より良好な殺虫作用若しくは殺ダニ作用、そして作物植物との良好な適合性である。その縮合二環式複素環誘導体は、特に防除が困難な昆虫に対する、効力を改善するためのさらなる薬剤と併用することができる。

【課題を解決するための手段】

【0006】

従って、本発明は、下記式 (I) の新規な化合物を提供する。

【化1】



【0007】

式中 (構造1)、

A_a は、窒素又は =C(R¹⁰)- であり、

A_b は、窒素又は =C(R¹¹)- であり、

A_c は、窒素又は =C(R¹²)- であり、

A_d は、窒素又は =C(R¹³)- であり、

A_a、A_b、A_c 及び A_d の2個以下が窒素であることができ、

R¹ は、(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-ハロアルキル、(C₁-C₆)-シアノアルキル、(C₁-C₆)-ヒドロキシアルキル、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-ハロアルコキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-アルケニルオキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-ハロアルケニルオキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-ハロアルケニル、(C₂-C₆)-シアノアルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₂-C₆)-アルキニルオキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-ハロアルキニルオキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-ハロアルキニル、(C₂-C₆)-シアノアルキニル、(C₃-C₈)-シクロアルキル、(C₃-C₈)-シクロアルキル-(C₃-C₈)-シクロアルキル、ハロ-(C₃-C₈)-シクロアルキル、アミノ、(C₁-C₆)-アル

キルアミノ、ジ- (C_1-C_6) -アルキル-アミノ、(C_3-C_8) -シクロアルキルアミノ、(C_1-C_6) -アルキルカルボニルアミノ、(C_1-C_6) -アルキルチオ- (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) -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) -ハロアルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、(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) -ハロアルキルカルボニル- (C_1-C_6) -アルキル、(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) -ハロアルコキシカルボニル- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルアミノスルホニル- (C_1-C_6) -アルキルであり、

又は、各場合で、同一に若しくは異なってモノ-若しくは多-アリール-、-ヘタリール-又は-複素環-置換されていてもよい (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ、(C_2-C_6) -アルケニル、(C_2-C_6) -アルキニル、(C_3-C_8) -シクロアルキルであり、ここで、アリール、ヘタリール又は複素環はそれぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、アミノスルホニル、(C_1-C_6) -アルキル、(C_3-C_6) -シクロアルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ、(C_1-C_6) -ハロアルキル、(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) -アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) -アルキルスルホニル、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、(C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、(C_1-C_6) -アルキルカルボニル、(C_3-C_6) -トリアルキルシリル又はベンジルによって同一若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、又は

R^1 は、アリール、ヘタリール又は複素環であり、それらはそれぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C_1-C_6) -アルキル、(C_3-C_8) -シクロアルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ、(C_1-C_6) -ハロアルキル、(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) -アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) -アルキルスルホニル、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、(C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、(C_1-C_6) -アルキルカルボニル、(C_3-C_6) -トリアルキルシリル、($=O$) (複素環のみの場合) 又は ($=O$)₂ (複素環のみの場合) によって同一若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} は独立に、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) -アルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ、(C_1-C_6) -アルキルチオ、(C_1-C_6) -アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) -アルキルスルホニル、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ、(C_1-C_6) -アルキルスルフィミノ- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_1-C_6) -アルキル、(C_1-C_6) -アルキルスルホキシイミノ- (C_2-C_6) -アルキルカルボニル、(C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、(C_1-C_6) -アルキルカルボニル、(C_3-C_6) -トリアルキルシリル、($=O$) (複素環のみの場合) 又は ($=O$)₂ (複素環のみの場合) によって同一若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、

10

20

30

40

50

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) -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) -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_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)であり、又は

各場合で1回若しくは複数回、同一に若しくは異なって置換されていてもよいアリール又はヘタリールであり、ここで、(ヘタリールの場合)少なくとも一つのカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、可能な置換基は、各場合で、次のもの：シアノ、カルボキシル、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) 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) 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、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アル
 コキシ - (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)
 アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) ハロアルキル
 スルホニル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)
 アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルオ
 キシ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆)
 アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆)
 ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボ
 ニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₆) アルケニルアミノカル
 ボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアル
 キルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキ
 ルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキ
 ルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) アル
 キルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカル
 ボニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキ
 ルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノであり、

ここで、前記 R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³ 基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の
 置換基であり、

Q は、部分飽和若しくは飽和複素環又はヘテロ芳香族 8 員、9 員、10 員、11 員若し
 くは 12 員縮合二環式又は三環式環系であり、ここで、少なくとも一つのカルボニル基が
 存在していてもよく、及び／又は、ここで、前記環系は、同一若しくは異なってモノ置換
 若しくは多置換されていてもよく、前記置換基は、独立に、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 - (C₁ - C₆) - アルキルシリル、(C₃ - C₈)
 - シクロアルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₃ - C₈) - シクロ
 アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈)
 - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆)
 - シアノアルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボ
 ニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)
 - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆)
) - アルケニル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニル、(C₂ - C₆) - シアノアルケニル、
 (C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アル
 キル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₂ - C₆) - シアノアルキニル、(C₁ - C₆)
 - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ -
 (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキ
 ル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆)
 - シアノアルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキ
 シ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルキ
 ルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₁ - C₆)
 - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル - (C₁ - C₆) - アル
 コキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)
 - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ
 - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) -
 ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスル
 フィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆)
 - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆)
 - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホ
 ニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)
 - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₆) - アル
 キル、(C₁ - C₆) - アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルカルボ
 ニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル

10

20

30

40

50

、 (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)から選択されることができ、

10

又は、ここで、前記置換基は、独立にフェニル又は5員若しくは6員ヘテロ芳香環から選択されることができ、ここで、フェニル若しくは前記環は、 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若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、 n は、0、1又は2である。

【0008】

20

さらに、式(I)の化合物が、殺有害生物剤として、好ましくは殺虫剤及び／又は殺ダニ剤として非常に良好な効力を有し、さらには、特に作物植物に関して、非常に良好な植物適合性を有することも認められている。

【発明を実施するための形態】

【0009】

本発明による化合物は、概括的には、式(I)によって定義される。上記及び下記で言及の式中で提供される好ましい置換基又は基の範囲について、以下で説明する。

【0010】

構造2

Aaは、好ましくは窒素又は $=C(R^{10})-$ であり、

Abは、好ましくは窒素又は $=C(R^{11})-$ であり、

Acは、好ましくは窒素又は $=C(R^{12})-$ であり、

Adは、好ましくは窒素又は $=C(R^{13})-$ であり、

ここで、Aa、Ab、Ac及びAdの2個以下が窒素であることができ、

R^1 は、好ましくは (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) ヒドロキシアルキル、 (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) ハロアルケニルオキシ (C_1-C_4) アルキル、 (C_2-C_4) ハロアルケニル、 (C_2-C_4) シアノアルケニル、 (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、 (C_2-C_4) ハロアルキニルオキシ (C_1-C_4) アルキル、 (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、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) アルキルアミノ、ジ (C_1-C_4) アルキル (C_3-C_6) シクロアルキルアミノ、 (C_1-C_4) アルキルカルボニルアミノ、 (C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキルチオ (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキルスルフィニル (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル (C_1-C_4) アルキル

30

40

50

、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノであり、

又は、各場合で、同一に若しくは異なってモノー若しくはジアーリール、ヘタリール又は複素環置換されていてもよい(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキルであり、ここで、アーリール、ヘタリール又は複素環は、それぞれ、同一に若しくは異なって、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₃ - C₄) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィミノによってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、又は

R¹ は、好ましくはアーリール、ヘタリール又は複素環であり、それらはそれぞれ、同一に若しくは異なって、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィミノ、(C₁ - C₄) - アルキルスルホキシイミノ、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル、(C₃ - C₄) - トリアルキルシリル、(=O) (複素環のみの場合) 又は (=O)₂ (複素環のみの場合) によってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、

R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³ は好ましくは独立に、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 - (C₁ - C₄) アルキルシリル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) シアノアルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキル - (C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキル - (C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、NHCO - (C₁ - C₄) アルキル((C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ) であり、

そしてさらに、好ましくは、フェニル又はヘタリールであり、それらはそれぞれ、同一に若しくは異なってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、ここで、(ヘタリールの場合) 少なくとも一つのカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、可能な置換基は、各場合で、次のもの：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノ

10

20

30

40

50

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_2-C_4) アルケニル、 (C_2-C_4) ハロアルケニル、 (C_2-C_4) シアノアルケニル、 (C_2-C_4) アルキニル、 (C_2-C_4) ハロアルキニル、 (C_2-C_4) シアノアルキニル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) シアノアルコキシ、 (C_1-C_4) アルコキシ- (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) アルキルヒドロキシイミノ、 (C_1-C_4) アルコキシイミノ、 (C_1-C_4) アルキル- (C_1-C_4) アルコキシイミノ、 (C_1-C_4) ハロアルキル- (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) アルキルチオ- (C_1-C_4) アルキル、 (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) アルキルスルフィニル- (C_1-C_4) アルキル、 (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- (C_1-C_4) アルキル、 (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、ジ- (C_1-C_4) アルキルアミノスルホニル、 $NHCO-$ (C_1-C_4) アルキル ((C_1-C_4) アルキルカルボニルアミノ) であり、

10

ここで、前記 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

20

Qは、好ましくはヘテロ芳香族8員、9員、10員、11員若しくは12員縮合二環式又は三環式環系であり、ここで、前記環系は、同一に若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、及び、ここで、前記置換基は、独立に、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、

30

40

50

(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、ジ- (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ- (C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、ジ- (C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、NHCO- (C₁ - C₆) - アルキル ((C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノ) から選択されることができ、

又は、ここで、前記置換基は、独立に、フェニル又は5員若しくは6員ヘテロ芳香環から選択されることができ、ここで、フェニル若しくは前記環は、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシによって同一若しくは異なってモノ置換若しくは多置換されていてもよく、

n は、好ましくは0、1又は2である。

【0011】

構造3

Aa は、より好ましくは窒素又は = C (R¹⁰) - であり、

Ab は、より好ましくは窒素又は = C (R¹¹) - であり、

Ac は、より好ましくは窒素又は = C (R¹²) - であり、

Ad は、より好ましくは窒素又は = C (R¹³) - であり、

ここで、Aa、Ab、Ac 及び Ad の2個以下が窒素であることができ、

R¹ は、より好ましくは (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキルチオ- (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル- (C₁ - C₄) アルキル又は (C₁ - C₄) アルキルスルホニル- (C₁ - C₄) アルキルであり、

R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³ は、より好ましくは、独立に水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- (C₁ - C₄) アルキルシリル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル- (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル- (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ- (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) シアノアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキル- (C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ- (C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ- (C₁ - C₄) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル、ジ- (C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル、NHCO- (C₁ - C₄) アルキル ((C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ) であり、

そしてさらには、より好ましくはフェニル又はヘタリールであり、それらはそれぞれ、

同一に若しくは異なってモノ置換若しくはジ置換されていてもよく、ここで、（ヘタリールの場合）少なくとも一つのカルボニル基が存在していてもよく、及び／又は、ここで、可能な置換基は、各場合で、次のもの：シアノ、ハロゲン、（ 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、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 ）シアノアルケニル、（ C_2-C_4 ）アルキニル、（ C_2-C_4 ）ハロアルキニル、（ C_2-C_4 ）シアノアルキニル、（ C_1-C_4 ）アルコキシ、（ C_1-C_4 ）ハロアルコキシ、（ C_1-C_4 ）アルキルヒドロキシイミノ、（ C_1-C_4 ）アルコキシイミノ、（ C_1-C_4 ）アルキル-（ 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、ジ-（ C_1-C_4 ）アルキルアミノスルホニル、 $NHCO$ -（ C_1-C_4 ）アルキル（（ C_1-C_4 ）アルキルカルボニルアミノ）であり、

ここで、前記 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

Qは、より好ましくはQ1～Q20の群からのヘテロ芳香族9員若しくは12員縮合二環式又は三環式環系：

10

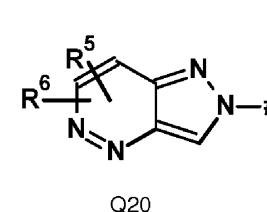
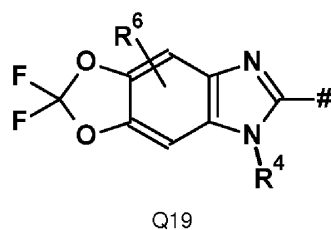
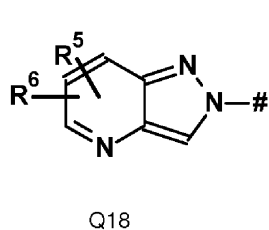
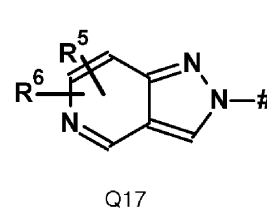
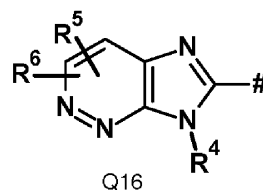
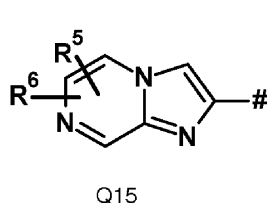
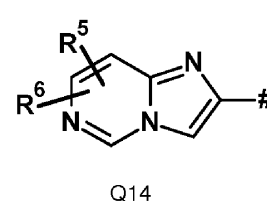
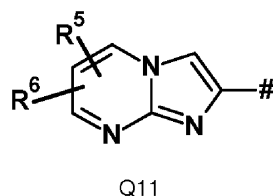
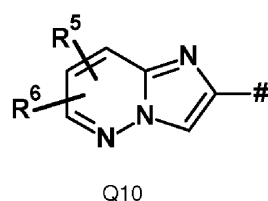
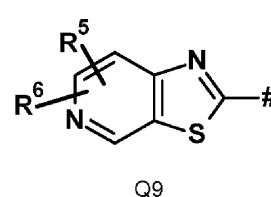
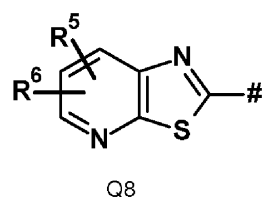
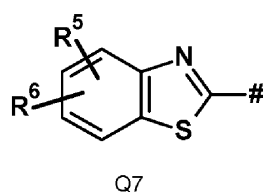
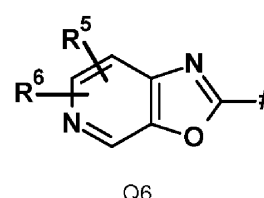
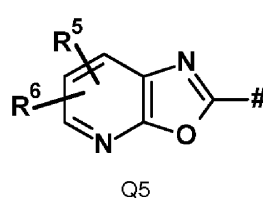
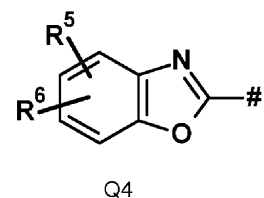
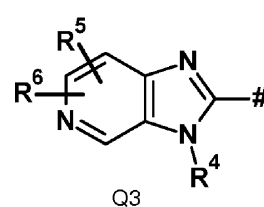
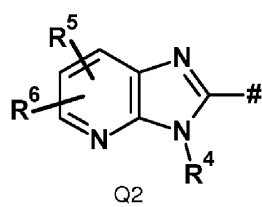
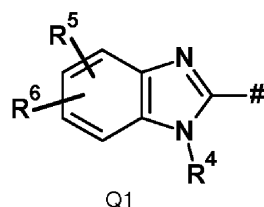
20

30

40

50

【化 2】



【 0 0 1 2】

であり、

R^4 は、より好ましくは $(C_1 - C_4)$ -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、 $(C_2 - C_4)$ -アルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_2 - C_4)$ -ハロアルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_2 - C_4)$ -ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ -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、 $(C_2 - C$

4) -ハロアルキニル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル- (C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルキル- (C₃-C₆)-シクロアルキル、ハロ- (C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルキルチオ- (C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル- (C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル- (C₁-C₄)-アルキル又は(C₁-C₄)-アルキルカルボニル- (C₁-C₄)-アルキルであり、

R⁵、R⁶は独立に、より好ましくは水素、シアノ、ハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-ハロアルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル、(C₂-C₄)-ハロアルキニル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル- (C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルキル- (C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルコキシミノ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)-アルキルカルボニル、(C₁-C₄)-ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノカルボニル、ジ- (C₁-C₄)-アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)-アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ- (C₁-C₄)-アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)-アルキルアミノスルホニル又はジ- (C₁-C₄)-アルキルアミノスルホニルであり、

nは、より好ましくは0、1又は2である。

[0013]

構造4-1

Aaは、さらにより好ましくは窒素又は=C(R¹⁰)-であり、

Abは、さらにより好ましくは窒素又は=C(R¹¹)-であり、

Acは、さらにより好ましくは窒素又は=C(R¹²)-であり、

Adは、さらにより好ましくは窒素又は=C(R¹³)-であり、

ここで、Aa、Ab、Ac及びAdの2個以下が窒素であることができ、

R¹は、さらにより好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、シクロブチル、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、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルであり、

R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³は、さらにより好ましくは独立に水素、シアノ、ハロゲン、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル又はNHCO- (C₁-C₄)アルキル((C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノ)であり、

ここで、前記R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

Qは、さらにより好ましくはQ2、Q3、Q5、Q6、Q8、Q9、Q10、Q11、Q14、Q15、Q16又はQ19の群からのヘテロ芳香族9員若しくは12員縮合二環式又は三環式環系：

10

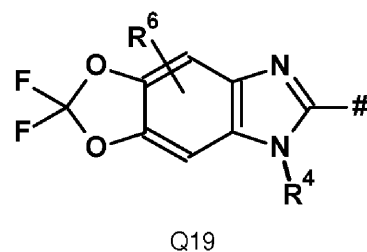
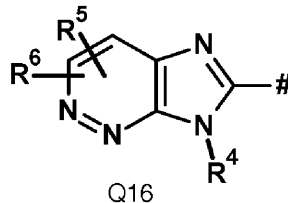
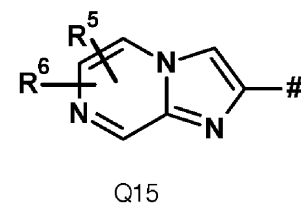
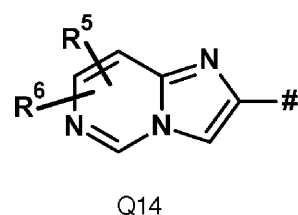
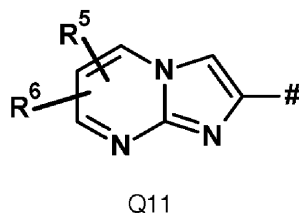
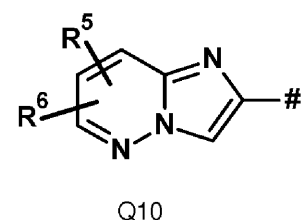
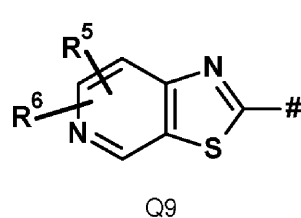
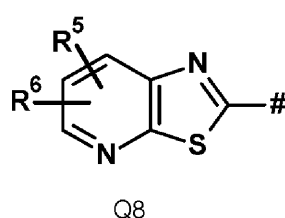
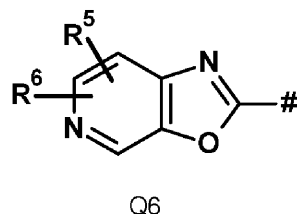
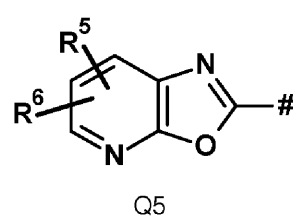
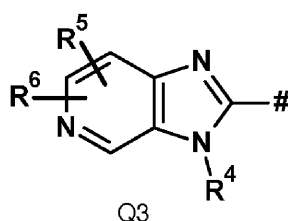
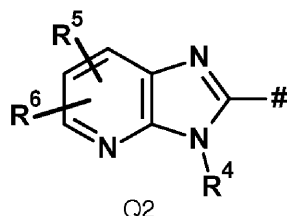
20

30

40

50

【化 3】



【 0 0 1 4】

であり、

R^4 は、さらにより好ましくは $(C_1 - C_4)$ - アルキル又は $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ $(C_1 - C_4)$ - アルキルであり、

R^5 は、さらにより好ましくは水素、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、 $(C_3 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキ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、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル又は $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニルであり、

R^6 は、さらにより好ましくは水素であり、

n は、さらにより好ましくは 0、1 又は 2 である。

【 0 0 1 5】

構造 4-2

A a、A b、A c、A d、Q、R¹⁰、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構造 4-1 で提供の定義を有し、

R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³は、さらにより好ましくは独立に水素、シアノ、ハロゲン、(C₁-C₄) アルキル、(C₃-C₆) シクロアルキル、アミノカルボニル、(C₁-C₄) ハロアルキル、(C₁-C₄) アルコキシ、(C₁-C₄) ハロアルコキシ、(C₁-C₄) アルキルチオ、(C₁-C₄) アルキルスルフィニル、(C₁-C₄) アルキルスルホニル、(C₁-C₄) ハロアルキルチオ、(C₁-C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄) ハロアルキルスルホニル又はNHCO-(C₁-C₄) アルキル((C₁-C₄) アルキルカルボニルアミノ)であり、

ここで、前記R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基である。

【0016】

構造 5-1

A aは、特に窒素又は=C(R¹⁰)-であり、

A bは、特に窒素又は=C(R¹¹)-であり、

A cは、特に窒素又は=C(R¹²)-であり、

A dは、特に窒素又は=C(R¹³)-であり、

ここで、A a、A b、A c及びA dの2個以下が窒素であることができ、

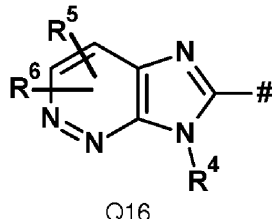
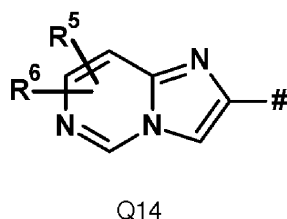
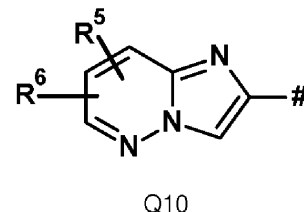
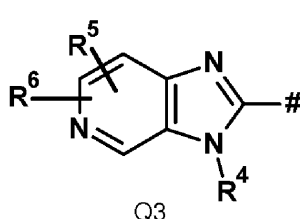
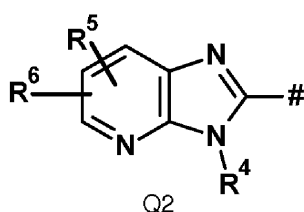
R¹は、特にメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル又はシクロプロピルであり、

R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³は特に、独立に水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、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、トリフルオロメチルスルホニル又はメトキシであり、

ここで、前記R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基であり、

Qは、特にQ 2、Q 3、Q 10、Q 14又はQ 16の群からのヘテロ芳香族9員縮合二環式環系：

【化 4】



【0017】

であり、

R⁴は、特にメチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり、

R⁵は、さらにより好ましくはフッ素、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 、 CHFCFH_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 (CHFCF_3 、 CF_2CHF_2)、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、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又はトリフルオロメチルスルホニルであり、

R^6 は、特には水素であり、

n は、特には0、1又は2である。

【0018】

構造5-2

Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 Q 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び n は、構造5-1で提供の定義を有し、

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} は特には、独立に水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、メチル、エチル、シクロプロピル、アミノカルボニル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、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、トリフルオロメチルスルホニル又はメトキシであり、

前記 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 基の一つのみ若しくは二つが、水素以外の置換基である。

【0019】

構造6-1

Aa は、特別には $=\text{C}(\text{R}^{10})-$ であり、

Ab は、特別には $=\text{C}(\text{R}^{11})-$ であり、

Ac は、特別には $=\text{C}(\text{R}^{12})-$ であり、

Ad は、特別には窒素又は $=\text{C}(\text{R}^{13})-$ であり、

R^1 は、特別にはエチルであり、

R^{10} は、特別には水素又はメチルであり、

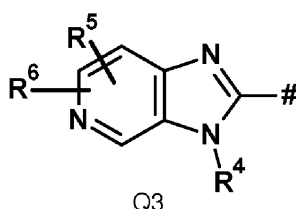
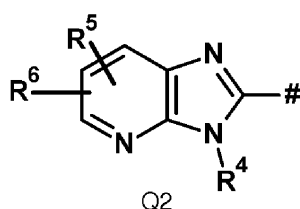
R^{11} は、特別には水素、塩素又はトリフルオロメチルであり、

R^{12} は、特別には水素又はメチルであり、

R^{13} は、特別には水素であり、

Q は、特別には $\text{Q}2$ 又は $\text{Q}3$ の群からのヘテロ芳香族9員縮合二環式環系：

【化5】



【0020】

であり、

R^4 は、特別にはメチルであり、

R^5 は、特別にはトリフルオロメチル又はペンタフルオロエチルであり、

R^6 は、特別には水素であり、

n は、特別には0又は2である。

【0021】

構造6-2

Aa は、特別には $=\text{C}(\text{R}^{10})-$ であり、

Ab は、特別には $=\text{C}(\text{R}^{11})-$ であり、

Ac は、特別には $=\text{C}(\text{R}^{12})-$ であり、

Ad は、特別には窒素又は $=\text{C}(\text{R}^{13})-$ であり、

R^1 は、特別にはエチルであり、
 R^{10} は、特別には水素又はメチルであり、
 R^{11} は、特別には水素であり、
 R^{12} は、特別には水素又はメチルであり、
 R^{13} は、特別には水素であり、
 Q は、特別には $Q3$ の群からのヘテロ芳香族 9 員縮合二環式環系であり、
 R^4 は、特別にはメチルであり、
 R^5 は、特別にはトリフルオロメチルであり、
 R^6 は、特別には水素であり、
 n は、特別には 2 である。

10

【0022】

構造 6-3

Aa は、特別には $=C(R^{10})-$ であり、
 Ab は、特別には $=C(R^{11})-$ であり、
 Ac は、特別には $=C(R^{12})-$ であり、
 Ad は、特別には窒素又は $=C(R^{13})-$ であり、
 R^1 は、特別にはエチルであり、
 R^{10} は、特別には水素又はメチルであり、
 R^{11} は、特別には水素、塩素、シアノ、アミノカルボニル ($-C(O)NH_2$) 又はシクロプロピルであり、
 R^{12} は、特別には水素又はメチルであり、
 R^{13} は、特別には水素であり、
 Q は、特別には $Q2$ 又は $Q3$ の群からのヘテロ芳香族 9 員縮合二環式環系であり、
 R^4 は、特別にはメチルであり、
 R^5 は、特別にはトリフルオロメチルであり、
 R^6 は、特別には水素であり、
 n は、特別には 2 である。

20

【0023】

置換基 Aa は、置換基 A_a と同一であり；置換基 Ab は、置換基 A_b と同一であり、置換基 Ac は、置換基 A_c と同一であり、置換基 Ad は、置換基 A_d と同一である。

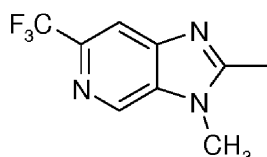
30

【0024】

好ましい実施形態において、本発明は、

Q が、

【化 6】



40

【0025】

であり、

Aa 、 Ab 、 Ac 、 Ad 、 R^1 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 及び n が、構造 (1) 又は構造 (2) 又は構造 (3) 又は構造 (4-1) 又は構造 (4-2) 又は構造 (5-1) 又は構造 (5-2) 又は構造 (6-1) 又は構造 (6-2) 又は構造 (6-3) に記載の定義を有する、式 (I) の化合物に関するものである。

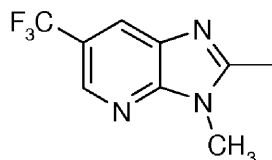
【0026】

好ましい実施形態において、本発明は、

Q が、

50

【化 7】



【0027】

であり、

A a、A b、A c、A d、 R^1 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 及びnが、構造(1)又は構造(2)又は構造(3)又は構造(4-1)又は構造(4-2)又は構造(5-1)又は構造(5-2)又は構造(6-1)又は構造(6-2)又は構造(6-3)に記載の定義を有する、式(I)の化合物に関するものである。

10

【0028】

好ましい実施形態において、本発明は、

A aが、 $=C(R^{10})-$ であり、

A bが、 $=C(R^{11})-$ であり、

A cが、 $=C(R^{12})-$ であり、

A dが、 $=C(R^{13})-$ であり、

Q、 R^1 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 及びnが、構造(1)又は構造(2)又は構造(3)又は構造(4-1)又は構造(4-2)又は構造(5-1)又は構造(5-2)又は構造(6-1)又は構造(6-2)又は構造(6-3)に記載の定義を有する、式(I)の化合物に関するものである。

20

【0029】

好ましい実施形態において、本発明は、

A aが、 $=C(R^{10})-$ であり、

A bが、 $=C(R^{11})-$ であり、

A cが、 $=C(R^{12})-$ であり、

A dが、窒素であり、

Q、 R^1 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 及びnが、構造(1)又は構造(2)又は構造(3)又は構造(4-1)又は構造(4-2)又は構造(5-1)又は構造(5-2)又は構造(6-1)又は構造(6-2)又は構造(6-3)に記載の定義を有する、式(I)の化合物に関するものである。

30

【0030】

好ましい定義において、別段の断りがない限り、

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素の群から選択され、そして好ましくは、フッ素、塩素及び臭素の群から選択され、

アリール(より大きい単位の一部として、例えばアリールアルキルを含む)は、フェニル、ベンジル、ナフチル、アントリル及びフェナントレニルの群から選択され、そして好ましくはフェニルであり、

40

ヘタリール(ヘテロアリールと同義、より大きい単位の一部として、例えばヘタリールアルキルを含む)は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベン

50

ゾイミダゾリル、2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル及びインドリジニルの群から選択され、

複素環は、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は1個の酸素原子及び／又は1個の硫黄原子を含む飽和4員、5員若しくは6員の環であり、例えばアゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、チエタニル、テトラヒドロチオフエニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル及びチオモルホリニルである。

【0031】

特に好ましい定義において、別段の断りがない限り、

ハロゲン、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素の群から選択され、そして好ましくはフッ素、塩素及び臭素の群から選択され、

アリール（より大きい単位の一部として、例えばアリールアルキルを含む）は、フェニル、ベンジル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの群から選択され、そして好ましくはフェニルであり、

ヘタリール（より大きい単位の一部として、例えばヘタリールアルキルを含む）は、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ピリダジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、チアゾリル及びテトラゾリルからなる群から選択され、

複素環は、オキセタニル、テトラヒドロフリル及びピペラジニルからなる群から選択される。

【0032】

本発明の文脈において、別途異なって定義されていない限り、「アルキル」という用語は、それ自体で、又は別の用語との組み合わせで、例えばハロアルキルで、1から12個の炭素原子を有し、分岐若しくは未分岐であることができる飽和脂肪族炭化水素基の遊離基を意味するものと理解される。 C_1-C_{12} -アルキル基の例には、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*-ウンデシル及び*n*-ドデシルがある。これらのアルキル基の中では、特に好ましいものは、 C_1-C_6 -アルキル基である。特に好ましいものは、 C_1-C_4 -アルキル基である。

【0033】

本発明によれば、別途異なって定義されていない限り、「アルケニル」という用語は、それ自体で、又は別の用語との組み合わせで、少なくとも1個の二重結合を有する直鎖若しくは分岐の C_2-C_{12} -アルケニル基を意味するものと理解され、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-ヘキセニル及び1, 4-ヘキサジエニルである。これらの中で、好ましいものは C_2-C_6 -アルケニル基であり、特に好ましいものは C_2-C_4 -アルケニル基である。

【0034】

本発明によれば、別途異なって定義されていない限り、「アルキニル」という用語は、それ自体で、又は別の用語との組み合わせで、少なくとも1個の三重結合を有する直鎖若しくは分岐の C_2-C_{12} -アルキニル基を意味するものと理解され、例えばエチニル、1-プロピニル及びプロパルギルである。これらの中で、好ましいものは C_3-C_6 -アルキニル基であり、特に好ましいものは C_3-C_4 -アルキニル基である。そのアルキニル基は、少なくとも1個の二重結合を含んでいてもよい。

【0035】

本発明によれば、別途異なって定義されていない限り、「シクロアルキル」という用語

10

20

30

40

50

は、それ自体で、又は別の用語との組み合わせで、 C_3-C_8 -シクロアルキル基を意味するものと理解され、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、シクロヘプチル及びシクロオクチルである。これらの中で、好ましいものは C_3-C_6 -シクロアルキル基である。

【0036】

「アルコキシ」という用語は、それ自体で、又は別の用語との組み合わせで、例えばハロアルコキシで、この場合では、 O -アルキル基を意味するものと理解され、「アルキル」という用語は上記で定義の通りである。

【0037】

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、又は可能な置換基の最大数まで多ハロゲン化されている。多ハロゲン化の場合、ハロゲン原子は同一であるか異なっていることができる。この場合、ハロゲンはフッ素、塩素、臭素又はヨウ素、特別にはフッ素、塩素又は臭素である。

【0038】

別段の断りがない限り、置換されていてもよい基は、モノ置換されているか多置換されていてもよく、多置換の場合の置換基は同一であっても異なってもよい。

【0039】

一般用語で提供された、又は好ましい範囲内で列挙された基の定義又は説明は、相応に、最終生成物に、そして原料及び中間体に適用される。これらの基の定義は、所望に応じて互いに組み合わせることができ、すなわち個々の好ましい範囲間での組み合わせなどがある。

【0040】

本発明に従って好ましくは、好ましいものと上記で挙げた意味の組み合わせを含む式(I)の化合物を使用する。

【0041】

本発明に従って特に好ましくは、特に好ましいものと上記で挙げた意味の組み合わせを含む式(I)の化合物を使用する。

【0042】

本発明に従って非常に特に好ましくは、非常に特に好ましいものと上記で挙げた定義の組み合わせを含む式(I)の化合物を使用する。

【0043】

本発明に従って最も好ましくは、最も好ましいものと上記で挙げた意味の組み合わせを含む式(I)の化合物を使用する。

【0044】

本発明に従って特別に使用されるものは、特別に強調されるものと上記で挙げた意味の組み合わせを含む式(I)の化合物である。

【0045】

置換基の性質に応じて、式(I)の化合物は、幾何異性体及び／又は光学活性異性体又は多様な組成の相当する異性体混合物の形態を取ることができる。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体及びこれら異性体のいずれか所望の混合物を包含する。

【0046】

式(I)の本発明の化合物は、下記の図式に示した方法によって得ることができる。

【0047】

方法A

QがQ1～Q9及びQ19である式(I)の化合物は、公知の方法によって、例えばWO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715、WO2015/121136、WO2016/12

10

20

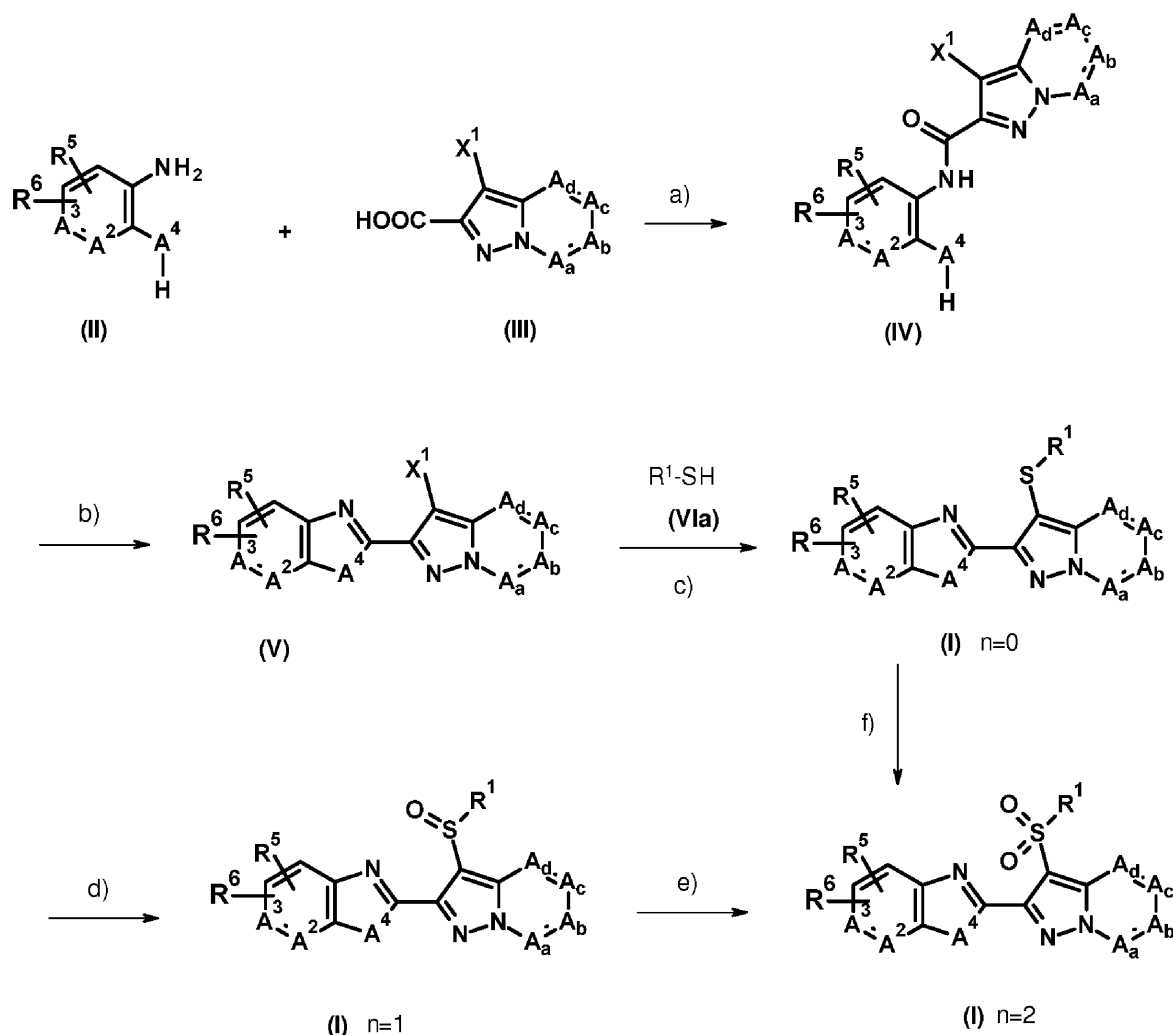
30

40

50

4 5 6 3 又は WO 2 0 1 6 / 1 2 4 5 5 7 に記載の方法と同様にして製造することができる。

【化 8】



【0048】

基 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A_a 、 A_b 、 A_c 、 A_d 及び n は、上記で記載の定義を有し、 A^2 及び A^3 は CH 又は N であり (A^2 及び A^3 が同時に N であることはできない。)、 A^4 は O 、 S 又は $\text{N}-\text{R}^4$ であり、 X^1 はハロゲンである。

【0049】

段階 a)

式 (IV) の化合物は、US 5 5 7 6 3 3 5 に記載の方法と同様にして、縮合剤又は塩基の存在下に式 (II) の化合物を式 (III) のカルボン酸と反応させることで製造することができる。

【0050】

式 (II) の化合物は、市販されているか、公知の方法によって、例えば US 2 0 0 3 / 6 9 2 5 7、WO 2 0 0 6 / 6 5 7 0 3、WO 2 0 0 9 / 1 3 1 2 3 7、WO 2 0 1 0 / 1 2 5 9 8 5、WO 2 0 1 1 / 0 4 3 4 0 4、WO 2 0 1 1 / 0 4 0 6 2 9、WO 2 0 1 2 / 0 8 6 8 4 8、WO 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8 又は WO 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 に記載の方法と同様にして製造することができる。

【0051】

式 (III) のカルボン酸は、市販されているか、公知の方法によって製造することができる。可能な製造経路を、方法 G 及び H に記載している。

【0052】

式 (I I) の化合物の式 (I I I) のカルボン酸との反応は、無希釈で又は溶媒中で行うことができ、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。好ましいものは、エーテル類、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-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えばアセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエン又はキシレン；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又はN-メチルピロリドン、又は窒素化合物、例えばピリジンである。

【0053】

好適な縮合剤は、例えば、カルボジイミド類、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) 又は1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミドである。

10

【0054】

好適な塩基は、そのような反応で代表的に使用される無機塩基である。好ましくは、例えばアルカリ金属若しくはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩および炭酸水素塩からなる群から選択される塩基を用いる。ここで特に好ましいものは、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、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。

【0055】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、そして0℃～180℃の温度で行うことができ；好ましくは、その反応は、標準圧及び20～140℃の温度で行う。

20

【0056】

段階b)

式 (V) の化合物は、例えばWO 2009/131237、WO 2010/125985、WO 2011/043404、WO 2011/040629、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2015/000715又はWO 2015/121136に記載の方法と同様に、式 (I V) の化合物を縮合させることによって製造することができる。

【0057】

式 (V) の化合物への変換は、無希釈で又は溶媒中で行うことができ、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。好ましいものは、エーテル類、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-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えばアセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエン又はキシレン；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又はN-メチルピロリドン、又は窒素化合物、例えばピリジンである。

30

【0058】

その反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下に行うことができる。

【0059】

好適な縮合剤の例には、カルボジイミド類、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) 又は1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば無水酢酸、トリフルオロ無水酢酸；トリフェニルホスフィン、塩基及び四塩化炭素の混合物、又はトリフェニルホスフィン及びアゾジエステル、例えばジエチルアゾジカルボン酸の混合物がある。

40

【0060】

記載の反応で使用可能な好適な酸の例には、スルホン酸、例えばパラートルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば酢酸、又はポリリン酸がある。

【0061】

好適な塩基の例には、窒素複素環、例えばピリジン、ピコリン、2, 6-ルチジン、1

50

、8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)；三級アミン類、例えばトリエチルアミン及び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、炭酸カリウム及び水素化ナトリウムがある。

【0062】

好適な塩素化剤の1例は、オキシ塩化リンである。

【0063】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、及び0℃～200℃の温度で行うことができる。

【0064】

段階c)

nが0である式(I)の化合物は、式(V)の化合物を、塩基の存在下に式(VIa)の化合物と反応させることで製造することができる。

【0065】

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又はイソプロピルメルカプタンは、市販されているか、公知の方法によって、例えばUS 2006/25633、US 2006/111591、US 2820062、Chemical Communications, 13(2000), 1163-1164又はJournal of the American Chemical Society, 44(1922), 1329に記載の方法と同様にして製造することができる。

【0066】

nが0である式(I)の化合物への変換は、無希釈で又は溶媒中で行うことができ、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。好ましいものは、エーテル類、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；ニトリル類、例えばアセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエン又はキシレン；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-メチルピロリドン又はジメチルスルホキシドである。

【0067】

好適な塩基の例は、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸水素塩および炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。ここで好ましいものは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸水素ナトリウムである。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。

【0068】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、及び0℃～200℃の温度で行うことができる。

【0069】

記載の反応において、X¹は好ましくはフッ素又は塩素原子である。

【0070】

代わるものとして、X¹が臭素である場合、別の選択肢は、好適なリチウム塩基との金属交換と、それに続く適切な市販のジスルフィドとの反応である。この点に関しては、Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 20(2010), 2770-2775を参照する。

【0071】

好適なリチウム塩基は、例えば、n-ブチルリチウムである。

【0072】

nが0である式(I)の化合物への変換は、無希釈の形態で行うことができるか、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中に行うことができる。好ましいものは、エーテル類、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である。

【0073】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、0℃～200℃の温度で行うことができる。

【0074】

その反応は、マイクロ波装置中で行うことができる。

【0075】

段階 d)

nが1である式(I)の化合物は、nが0である式(I)の化合物を酸化することで製造することができる。その酸化は通常、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行われる。好ましいものは、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-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えばメタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸又は水である。

【0076】

好適な酸化剤の例には、過酸化水素、メタクロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウムである。

【0077】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、及び-20℃～120℃の温度で行うことができる。

【0078】

段階 e)

nが2である式(I)の化合物は、nが1である式(I)の化合物を酸化することで製造することができる。その酸化は通常、溶媒中で行われる。好ましいものは、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-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えばメタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸又は水である。

【0079】

好適な酸化剤の例には、過酸化水素及びメタクロロ過安息香酸がある。

【0080】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、及び-20℃～120℃の温度で行うことができる。

【0081】

段階 f)

nが2である式(I)の化合物は、nが0である式(I)の化合物を酸化することにより、1段階プロセスで製造することもできる。その酸化は通常、溶媒中で行われる。好ましいものは、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-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えばメタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸又は水である。

【0082】

好適な酸化剤の例には、過酸化水素及びメタクロロ過安息香酸である。

【0083】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、及び-20℃～120℃の温度で行うことができる。

【0084】

方法 B

QがQ10、Q11、Q14又は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又はJ. Med. Chem. 31, (1988), 1590に記載の方法と同様にして製造することができる。

10

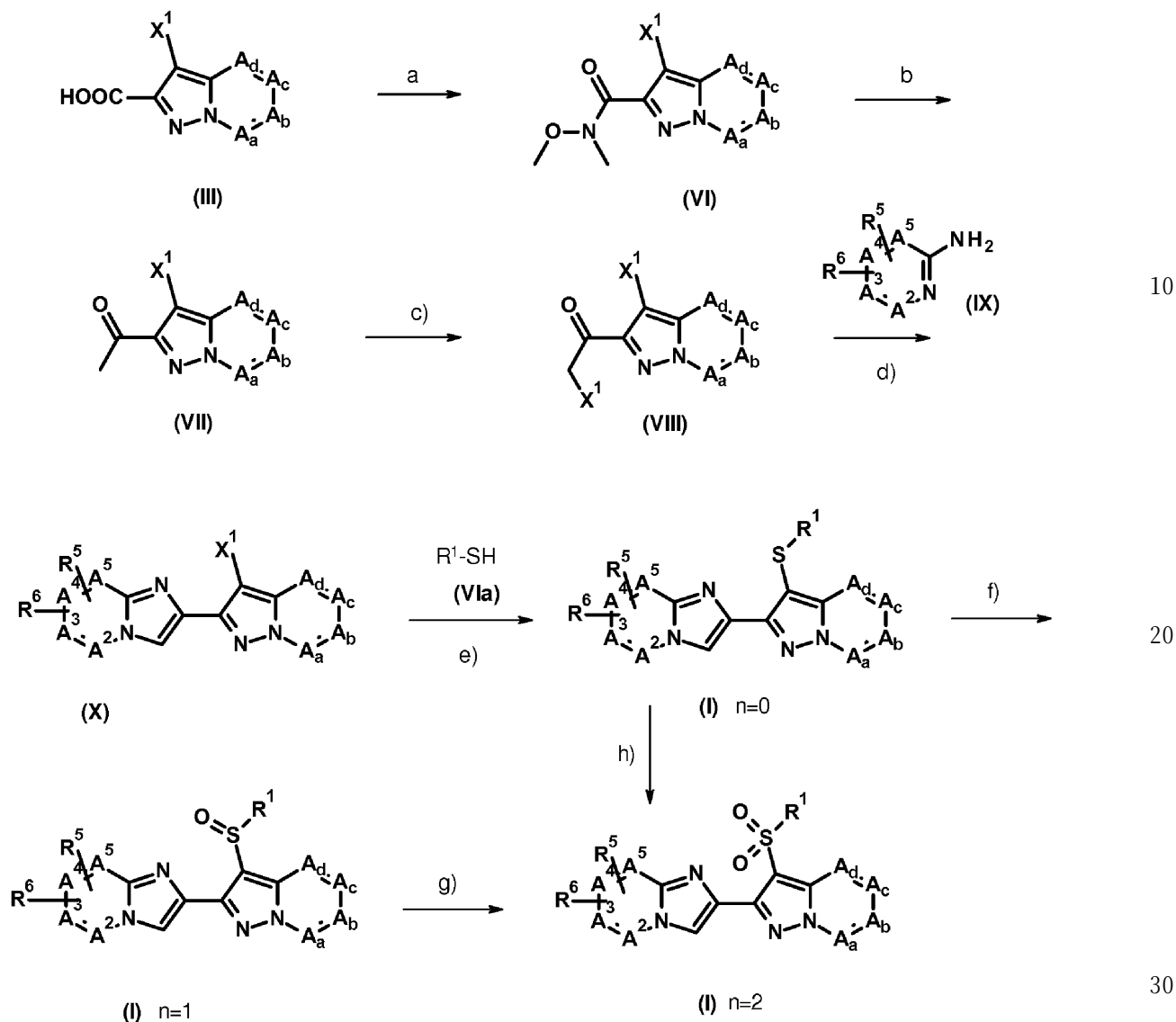
20

30

40

50

【化 9】



【0085】

基 R^1 、 R^5 、 R^6 、 A_a 、 A_b 、 A_c 、 A_d 及び n は、上記で記載の定義を有する。 A^2 、 A^3 、 A^4 及び A^5 は CH 又は N であり (A^2 、 A^3 、 A^4 及び A^5 が全て N であることはない。)、 X^1 はハロゲンである。

【0086】

段階 a)

式 (III) のカルボン酸は、WO2011/75643 又は EP2671582 に記載の方法と同様にして、O、N-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩の存在下に、式 (VI) のワインレブアミドに変換される。

【0087】

式 (III) のカルボン酸は、市販されているか、公知の方法によって製造することができる。可能な製造経路は、方法 G 及び H に記載されている。

【0088】

段階 b、c)

次に、式 (VI) の化合物を、公知の方法によって、例えば WO2011/75643 に記載の方法と同様にして、グリニャル試薬、例えばメチルマグネシウムブロミドで、式 (VII) のケトンに変換することができる。式 (VII) の化合物は、次に、例えば、US2012/302573 に記載の公知の方法と同様にしてハロゲン化することで得

ることができる。

【0089】

段階d)

式(X)の化合物は、式(VIII)の化合物を式(IX)のアミンで環化させることで製造することができる。その環化は、公知の方法によって、例えばWO2005/66177、WO2012/88411、WO2013/3298、US2009/203705、US2012/258951、WO2012/168733、WO2014/187762又はJ. Med. Chem. 31(1988) 1590-1595に記載の方法と同様にして、例えば、エタノール、アセトニトリル又はN,N-ジメチルホルムアミド中で行う。

10

【0090】

式(IX)の化合物は市販されている。

【0091】

段階e)

nが0である式(I)の化合物は、式(V)の化合物を、塩基の存在下に式(VIa)の化合物と反応させることで製造することができる。

【0092】

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又はイソプロピルメルカプタンは、市販されているか、公知の方法によって、例えばUS2006/25633、US2006/111591、US2820062、Chemical Communications, 13(2000), 1163又はJournal of the American Chemical Society, 44(1922), 1329に記載の方法と同様にして製造することができる。

20

【0093】

nが0である式(I)の化合物への変換は、無希釈形態で、又は溶媒中で行うことができ、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。好ましいものは、エーテル類、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；ニトリル類、例えばアセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えばトルエン又はキシレン；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-メチルピロリドン又はジメチルスルホキシドである。

30

【0094】

好適な塩基の例は、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸水素塩および炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。ここで好ましいものは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸水素ナトリウムである。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。

【0095】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で及び0℃~200℃の温度で行うことができる。

【0096】

記載の反応において、X¹は好ましくは、フッ素原子又は塩素原子である。

40

【0097】

代わるものとして、X¹が臭素である場合、別の選択肢は、好適なリチウム塩基との金属交換と、それに続く適切な市販のジスルフィドとの反応である。この点に関しては、Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 20(2010), 2770-2775を参照する。

【0098】

好適なリチウム塩基は、例えば、n-ブチルリチウムである。

【0099】

nが0である式(I)の化合物への変換は、無希釈形態で、又は溶媒中で行うことがで

50

き、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。好ましいものは、エーテル類、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である。

【0100】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、及び0℃～200℃の温度で行うことができる。

【0101】

その反応は、マイクロ波装置中で行うことができる。

【0102】

段階 f、g)

nが1である式(I)の化合物は、nが0である式(I)の化合物を酸化することで製造することができる。その酸化は、好適な酸化剤、例えば過酸化水素、メタクロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウムを用いて、公知の方法によって行われる。

【0103】

nが2である式(I)の化合物は、nが1である式(I)の化合物を酸化することで製造することができる。

【0104】

その酸化は通常、溶媒中で行う。好ましいものは、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-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えばメタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸又は水である。好適な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタクロロ過安息香酸である。

【0105】

段階 h)

nが2である式(I)の化合物は、nが0である式(I)の化合物を酸化することで1段階プロセスで製造することもできる。その酸化は通常、溶媒中で行う。好ましいものは、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-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えばメタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸又は水である。好適な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタクロロ過安息香酸である。

【0106】

方法 C

QがQ16である式(I)の化合物は、公知の方法によって、例えばWO2014/142292に記載の方法と同様にして製造することができる。

10

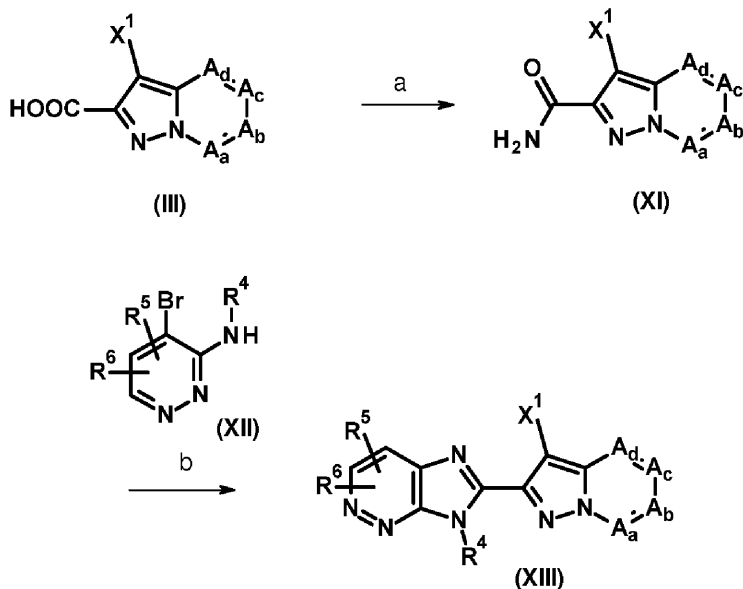
20

30

40

50

【化 10】



10

【0107】

R⁴、R⁵、R⁶、A_a、A_b、A_c及びA_d基は、上記で記載の定義を有する。X¹はハロゲンである。

20

【0108】

段階 a)

式 (XI) の化合物は、US 5 3 7 4 6 4 6 又は Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters (2003), 13, 1093 に記載の方法と同様にして、式 (III) の化合物を、縮合剤の存在下にアンモニア源と反応させることで製造することができる。

【0109】

式 (III) のカルボン酸は、市販されているか、公知の方法によって製造することができる。可能な製造経路は、方法 G 及び H に記載されている。

30

【0110】

ほとんどの場合、使用されるアンモニア源は、水酸化アンモニウムである。

【0111】

式 (III) の化合物のアンモニア源との反応は、好ましくは、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。好ましいものは、エーテル類、例えばジオキサン又はテトラヒドロフランである。

【0112】

好適な縮合剤は、例えば、カルボニルジイミダゾールである。

【0113】

その反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で行うことができる。好ましくは、その反応は、大気圧下に、20～70℃の温度で行う。

40

【0114】

段階 b)

式 (XIII) の化合物は、WO 2 0 1 4 / 1 4 2 2 9 2 に記載の方法と同様にして、パラジウム触媒／塩基性媒体の存在下に式 (XI) の化合物を式 (XIII) の化合物と反応させることで製造することができる。

【0115】

式 (XIII) の化合物は、例えば WO 2 0 1 4 / 1 4 2 2 9 2 に記載の方法と同様にして製造することができる。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) であることができる。非

50

常に多くの場合、使用される塩基は、無機塩基、例えばカリウム *tert*-ブトキシドである。

【0116】

その反応は、溶媒中で行う。非常に多くの場合、トルエンが用いられる。

【0117】

その反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で行うことができる。好ましくは、その反応は、大気圧下及び 20～110℃の温度で行われる。

【0118】

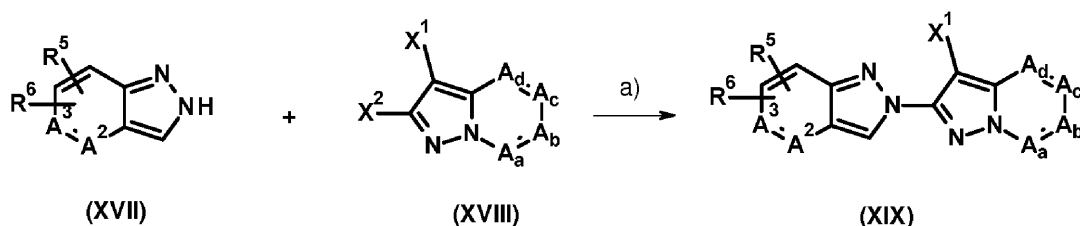
式 (XIII) の化合物の式 (I) の化合物へのさらなる変換は、方法 A と同様にして行われる。

【0119】

方法 D

Q が Q12、Q13、Q17 及び Q18 を表す式 (I) の化合物は、公知の方法によって、例えば WO2010/091310、WO2012/66061 又は WO2013/099041 に記載の方法と同様にして製造することができる。

【化11】



【0120】

R⁵、R⁶、A_a、A_b、A_c 及び A_d 基は、上記で記載の定義を有する。A² 及び A³ は CH 又は N である。X¹ 及び X² はハロゲンである。

【0121】

段階 a)

式 (XIX) の化合物は、例えば WO2010/091310、WO2012/66061 又は WO2013/099041 に記載の方法と同様にして、式 (XVII) の化合物を、塩基性条件下で式 (XVIII) の化合物と反応させることで製造することができる。

【0122】

式 (XVII) の化合物は、市販されているか、公知の方法によって、例えば WO2005/100353、WO2012/66061 又は *European Journal of Medicinal Chemistry* 45 (2010), 2214 に記載の方法と同様にして製造することができる。

式 (XVIII) の化合物は、市販されているか、公知の方法によって、例えば *Synthesis* 47 (2015), 3221-3230、*Chemical & Pharmaceutical Bulletin* 34 (1986), 1023-1031 又は WO2013/43521 に記載の方法と同様にして X² がハロゲンであって最初は水素が X¹ の位置にある式 (XVIII) の化合物を合成し、次に、WO2009/70567 に記載の方法と同様にして、例えば N-プロモコハク酸イミドにより、位置 X¹ で水素をハロゲンに交換することで製造することができる。

【0123】

使用される塩基は、通常、水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの無機塩基である。

【0124】

式 (XIX) の化合物への変換は通常、溶媒中、好ましくはニトリル、例えばアセトニトリル又はプロピオニトリル中で、又は非プロトン性極性溶媒、例えば N, N-ジメチル

10

20

30

40

50

ホルムアミド又はN-メチルピロリドン中で行う。

【0125】

その反応は、減圧下、標準圧、又は加圧下で、及び0℃～200℃の温度で行うことができる。

【0126】

或いは、式(XVII)の化合物の式(XVII I)の化合物との反応による式(XIX)の化合物の取得は、例えばAngewandte Chemie Int. Ed. (2011), 50, 8944に記載の方法と同様にして、パラジウム触媒N-アリール化によって行うこともできる。

【0127】

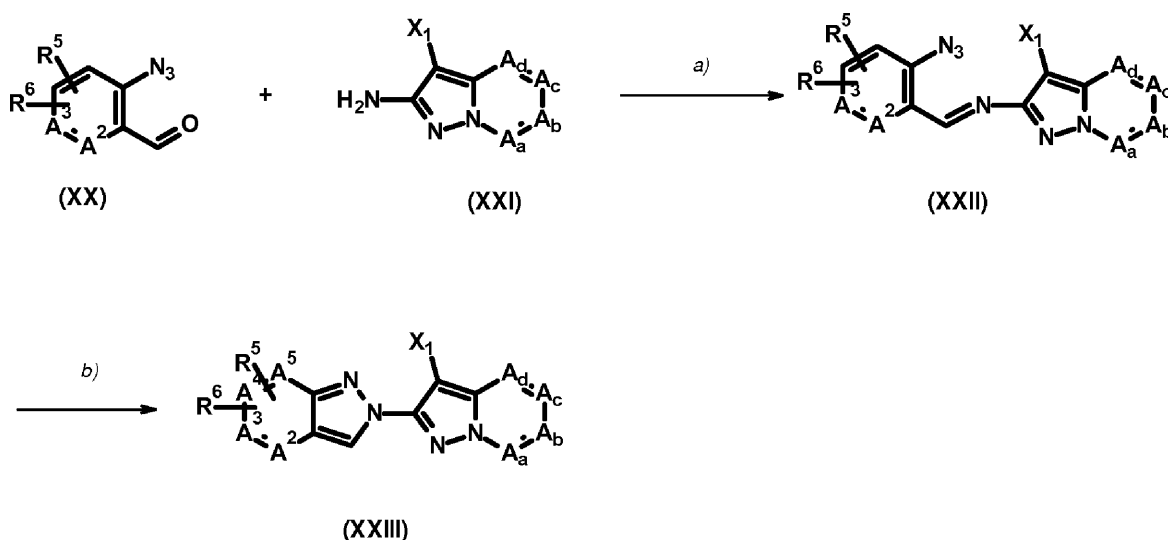
式(XIX)の化合物の式(I)の化合物へのさらなる変換は、方法Aと同様にして行う。

【0128】

方法E

方法Dに代わるものとして、QがQ17、Q18及びQ20である式(I)の化合物は、次のように製造することができる。

【化12】



【0129】

R⁵、R⁶、A^a、A^b、A^c及びA^d基は、上記で記載の定義を有し、X¹はハロゲンであり、A²、A³は窒素又はCHである。

【0130】

段階a)

式(XXII)の化合物は、Chemical Communications, 2011, 47, 10133、WO2012/66061A1、2012、Tetrahedron, (1992), 48, 3091に記載の方法に従って、式(XX)の化合物の式(XXI)の化合物との縮合によって製造することができる。

【0131】

式(XX)の化合物は、市販されているか、公知の方法によって製造することができる(例えば、WO2012/66061又はAustralian Journal of Chemistry, (1980), 33, 91を参照する。)

【0132】

式(XXI)の化合物は、市販されているか、公知の方法によって、例えばUS2007/82902、US2012/122888又はChemical and Pharmaceutical Bulletin 21(1973), 2146-2160に記載

の方法と同様にして、製造することができる。

【0133】

その縮合は、無希釈形態で、又は溶媒中で行うことができ、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。好ましいものは、アルコール類、例えばエタノール又はメタノール又はエーテル類、例えばTHFである。

【0134】

その反応は、プレンステッド酸又はルイス酸の使用によって触媒され、特に好ましくは、酢酸及びチタン塩、例えば四塩化チタン若しくはチタンテトラエトキッドを用いる。

【0135】

段階b)

WO2012/66061、又はOrganic Letters, (2011), 13, 3542と同様にして、式(XXII)の化合物を環化させて、式(XXIII)の化合物を得ることができる。その環化は、無希釈形態で、又は溶媒中で行うことができ、好ましくはその反応は、一般的な反応条件下で不活性である通常の溶媒から選択される溶媒中で行う。特に好ましいものは、高沸点溶媒、例えばトルエン又はDMSOである。

【0136】

その反応は、減圧下、標準圧下又は高圧下で、及び0℃～200℃温度で行うことができる。好ましいものは、100℃より高い温度である。

【0137】

その反応は、銅(I)塩を加えることで触媒することができる。

【0138】

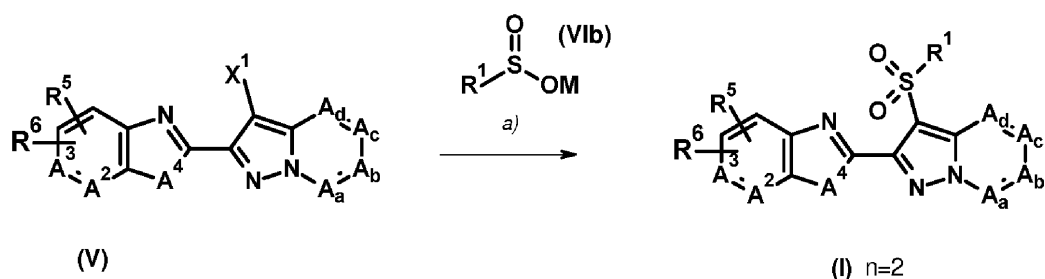
式(XXIII)の化合物の式(I)の化合物へのさらなる変換は、方法Aと同様にして行う。

【0139】

方法F

nが2である式(I)の化合物は、別法として、式(V)の化合物、(X)、(XII)、(XIX)又は(XXIII)から1段階プロセスで製造することができる。その方法について、方法Aからの式(V)の化合物の式(I)の化合物への変換に関連して説明する。

【化13】



【0140】

R¹、R⁴、R⁵、R⁶、A_a、A_b、A_c、及びA_d基は上記で記載の定義を有し、A²及びA³はCH又はNであり(A²及びA³が同時にNであることはできない。)、A⁴はO、S又はN-R⁴であり、X¹はハロゲン(好ましくは臭素又はヨウ素)である。Mはアルカリ金属である(好ましくはナトリウム又はカリウム)。

【0141】

nが2である式(I)の化合物は、例えばJournal of Organic Chemistry 70(2005)2696-2700に記載の方法と同様にして、式(V)の化合物から1段階プロセスで、式(VIb)の化合物とのハロゲン-スルホン交換によって製造することができる。その交換は通常、溶媒中で行う。好ましくは、極性非プ

ロトン性溶媒、例えばジメチルスルホキシド及びN，N－ジメチルホルムアミドを用いる。

【0142】

その反応は通常、銅（I）塩、例えばヨウ化銅（I）を加えることで触媒される。

【0143】

式（VIb）の化合物は、市販されているか、公知の方法によって、例えばOrganic Synthesis 57（1977）88－92；Tetrahedron Letters 9（1979）821－824及びBulletin de la Societe Chimique de France 4（1958）447－450に記載の方法と同様にして製造することができる。

【0144】

好適な硫黄試薬の例は、スルフィン酸の塩である。

【0145】

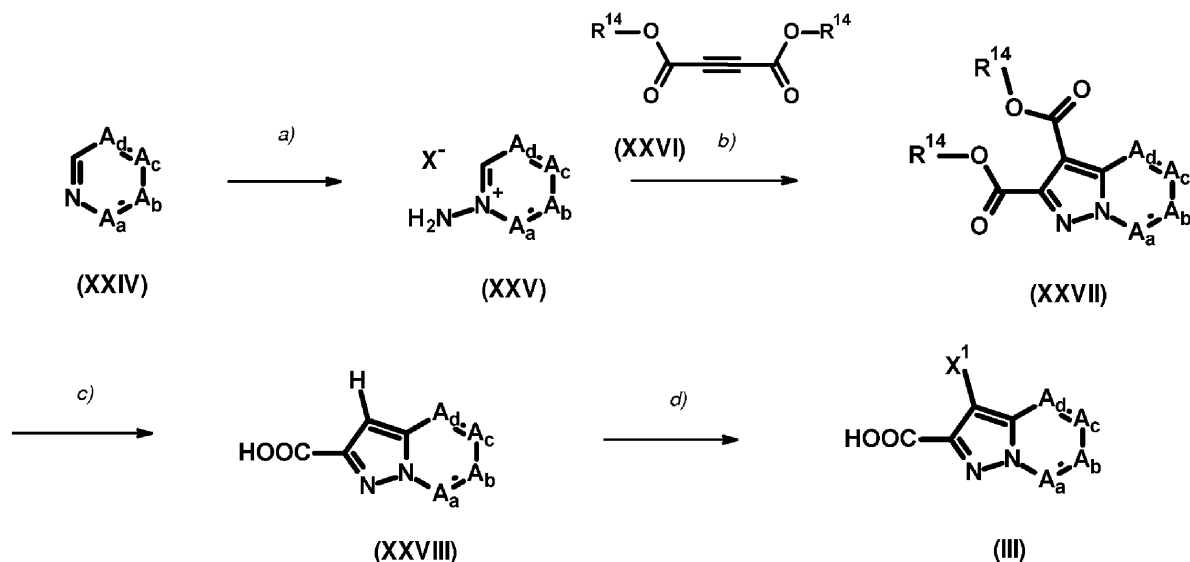
その反応は、減圧下、標準圧下又は高圧下で、及び－20℃～120℃の温度で行うことができる。

【0146】

方法G

式（III）のカルボン酸は、市販されているか、公知の方法によって、例えばWO 2011／15343、WO 2014／14874又はWO 2010／34738に記載の方法と同様にして、式（XXIV）のピリジンから製造することができる。

【化14】



【0147】

A_a 、 A_b 、 A_c 及び A_d 基は上記で記載の定義を有し、 X^- はハライドイオン、好ましくはヨードであり、 X^1 はハロゲンであり、 R^{14} は（ C_1-C_4 ）アルキルである。

【0148】

段階a)

式（XXV）の化合物を、WO 2011／15343、WO 2014／14874又はWO 2010／34738に記載の方法と同様にして、塩基、例えば炭酸カリウムの存在下に式（XXIV）の化合物をヒドロキシルアミノ－O－スルホン酸と反応させることでN－イミノピリジニウム中間体に変換することができ、第2段階で、当該中間体を、好適な溶媒、例えばエタノール中、酸、例えばヨウ化水素酸（HI）の存在下に式（XXV）の1－アミノ－ピリジニウム誘導体に変換する。式（XXIV）のピリジン誘導体は市販されている。

【0149】

段階b）及びc）

式 (XXVII) の化合物は、WO2011/15343、WO2014/14874 又は WO2010/34738 に記載の方法と同様にして、式 (XXV) のアルキンとの 1, 3-双極性環状付加で式 (XXVI) の化合物から製造することができる。異性体が生成する場合、それらは、クロマトグラフィー法によって個々の異性体に分離することができる。このようにして、式 (XXVII) のジエステルを、異性体的に純粋な形で得ることができる。好適な酸、例えば硫酸水溶液中で加熱することで、脱炭酸及びエステル官能基の同時加水分解によって、式 (XXVII) の化合物を式 (XXVIII) の酸に変換することができる。

【0150】

段階 d)

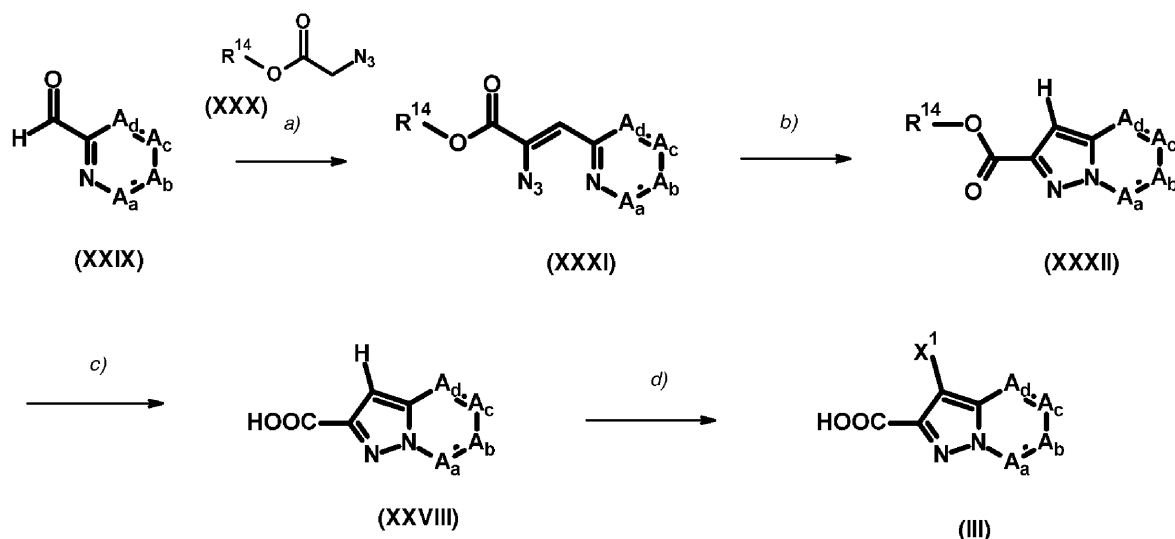
式 (III) の化合物は、ハロゲン化を介した標準法によって、例えば WO2011/50284 又は WO2016/12896 に記載の方法と同様にして、例えば、好適な溶媒、例えばジクロロメタン又は 1, 2-ジクロロエタン中、ハロゲン化剤として N-クロロコハク酸イミド又は N-ブromoコハク酸イミドを用いて製造することができる。

【0151】

方法 H

さらなる方法において、Journal of Medicinal Chemistry 56 (2013), 9635-9645、Synthesis 16 (2005), 2751-2757 又は WO2009/29625 に記載の方法と同様にして、式 (XXIX) の 2-ホルミルピリジン誘導体から式 (III) のカルボン酸を製造することができる。

【化15】



【0152】

A_a 、 A_b 、 A_c 及び A_d 基は上記で記載の定義を有し、 X^1 はハロゲンであり、 R^{14} は (C_1-C_4) アルキルである。

【0153】

段階 a)

式 (XXXI) の化合物は、Journal of Medicinal Chemistry 56 (2013), 9635-9645、Synthesis 16 (2005), 2751-2757 又は WO2009/29625 に記載の方法と同様にして、好適な溶媒、例えばメタノール中、好適な塩基、例えばナトリウムメトキシドの存在下に、式 (XXIX) の化合物を式 (XXX) のアルキルアジドアセテート誘導体と反応させることで製造することができる。式 (XXIX) の化合物は市販されているか、標準法によって製造することができる。

【0154】

段階 b)

式 (XXXXII) の化合物は、Journal of Medicinal Chemistry 56 (2013)、9635-9645、Synthesis 16 (2005)、2751-2757 又は WO2009/29625 に記載の方法と同様にして、好適な溶媒、例えばキシレン中、式 (XXXXI) の化合物を環化させることで製造することができる。その反応は、減圧下、標準圧下又は高圧下で、及び高温で行うことができる。好ましくは、100℃より高い温度である。

【0155】

段階 c、d)

式 (XXXXII) のエステルは、標準法を用いて、例えば、溶媒としてのアルコール、例えばエタノール又はテトラヒドロフラン及び水の混合物中、塩基としてのアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム又は水酸化リチウムによって、式 (XXVII) の酸に変換することができる。

【0156】

式 (III) の化合物へのさらなる変換を、方法 G に記載の方法と同様にして、ハロゲン化を介した標準法によって行う。

【0157】

方法及び使用

本発明は、さらに、式 (I) の化合物を害虫及び／又はそれらの生息環境に作用させる、害虫を防除する方法に関するものでもある。その害虫防除は、好ましくは、農業及び林業において、並びに、材料保護において実施される。好ましくは、それは、ヒト又は動物の身体の外科的な又は治療的な処置方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法を除外するものである。

【0158】

本発明は、さらに、殺有害生物剤としての、特に、作物保護組成物としての、式 (I) の化合物の使用にも関する。

【0159】

本願に関連して、各場合での「殺有害生物剤 (pesticide)」という用語は、常に、「作物保護組成物」という用語も包含する。

【0160】

式 (I) の化合物は、植物が良好な耐性を示し、内温動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、生物的ストレス因子及び非生物的ストレス因子に対して植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、特別には線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。

【0161】

本特許出願に関連して、「衛生 (hygiene)」という用語は、疾患（特に、感染症）を予防することを目的とするありとあらゆる手段、準備及び手段、並びに、ヒト及び動物の健康を保護するのに及び／又は環境を保護するのに及び／又は清潔を維持するのに役立つありとあらゆる手段、準備及び手段を意味するものと理解されるべきである。本発明によれば、これには特に、例えば、テキスタイル又は硬質表面（特に、ガラス製、木製、コンクリート製、磁器製、セラミック製、プラスチック製の表面、又は、金属（類）製の表面）を衛生害虫及び／又はその分泌物が存在していない状態に維持するために、それらを清浄化、消毒及び滅菌する手段などがある。これに関連して、本発明の保護の範囲は、好ましくは、ヒト身体又は動物身体に対して施される外科的又は治療的処置手順、及び、ヒト身体又は動物身体に対してなされる診断手順を除くものである。

【0162】

「衛生部門 (hygiene sector)」という用語は、これらの衛生上の手段

10

20

30

40

50

、準備及び手順が重要である全ての区域、技術分野及び産業上の利用、例えば、調理場、パン屋、空港、浴室、スイミングプール、デパート、ホテル、病院、家畜小屋、動物飼育などにおける衛生に関する全ての区域、技術分野及び産業上の利用を包含するものである。

【0163】

従って、「衛生有害生物 (hygiene pest)」という用語は、特に健康上の理由に関して衛生部門においてその存在が問題である、1種類以上の害虫を意味するものと理解されるべきである。従って、主目的は、衛生有害生物の存在及び／又は、衛生部門での衛生有害生物との接触を回避若しくは最小限度に制限することである。このことは、特に、発生を予防するため及び既に発生している害虫を阻止するための両方に使用することが可能な農薬を使用することによって達成することが可能である。病害生物への曝露を防止するか低減させ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、下記で言及される生物などがある。

10

【0164】

従って、「衛生的保護 (hygiene protection)」という用語は、その衛生上の手段、準備及び手順を維持及び／又は改善する全ての行為を包含するものである。

【0165】

式 (I) の化合物は、好ましくは、殺有害生物剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して活性であり、全ての発育段階又は特定の発育段階に対しても活性を示す。上記有害生物としては、以下のものを挙げることができる：

20

節足動物門の有害生物、特に、クモ綱 (Arachnida) の、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・フォッケウイ (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 (Choriotptes 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)、デルマセントル属種 (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・ドメスチクス (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.)、イクソデス属種 (Ixodes spp.)、ラトロデクツス属種 (Latrodectus spp.)、ロキソスケレス属種 (Loxos

30

40

50

celes 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 mangiferus*)、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.)、オルニトニスス属種 (*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 (*Phyllocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multigigituli*)、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・スピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフス (*Tarsoneumus confusus*)、タルソネムス・パリズス (*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.) ;

トビムシ目 (*Collembola*) 又はトビムシ綱の、例えば、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*)

10

20

30

40

50

a)、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*) ;

コウチュウ目 (*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.)、アエチナ・ツミダ (*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、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.)、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 (*Apononia* 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・オブテクツス (*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 (*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・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatipes*)、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*)、シリンドロコブツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコブツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコブツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*Dermestes* 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・ウンデシムプンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunc*

10

20

30

40

50

tata 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 zea*)、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.)、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 (*Hel lula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx* spp.)、ヒラモルフア・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hyl otrupes bajulus*)、ヒペラ・ポスチカ (*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・コンサンガイネア (*Lachnosterna consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricornis*)、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・コフェエラ (*Leucoptera coffeella*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhopterus oryzophilus*)、リストロノツス属種 (*Listronotus* (=ヒペロデス (*Hyperodes*)) spp.)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、ルペロデス属種 (*Luperodes* spp.)、ルペロモルフア・キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、リクツス属種 (*Lyctus* spp.)、メガセルス属種 (*Megascelis* spp.)、メラノツス属種 (*Melanotus* spp.)、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.)、ナウパクトゥス・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 (*Neogalerucella* 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 (*Otiorhynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiorhynchus*

10

20

30

40

50

chus cribricollis)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiornchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiornchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiornchus rugosostriarius*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiornchus 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・ジュンクンダ (*Oxycetonia 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 (*Phyllotreta spp.*)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllotreta armoricariae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllotreta 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*)、リンコフォルス属種 (*Rhynchophorus spp.*)、リンコフォルス・フェルギネウス (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコフォルス・パルマルム (*Rhynchophorus palmarum*)、シノキシロン・ペルフォランス (*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・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrioides*)；

革翅目 (*Dermaptera*) の、例えばアニソラビス・マリチメ (*Anisobis maritime*)、フォルフィクラ・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

10

20

30

40

50

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・スチクチクス (*Aedes stic-
 ticus*)、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 pyrivora*)、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.*)、クテブレラ属種 (*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 florilega*)、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.*)、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 (*Hippobosca 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・フイドブレンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ル

10

20

30

40

50

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 (*Mansonia* 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*)、ペゴミヤ (*Pegomya*) 又はペゴミヤ (*Pegomyia* spp.)、例えば、ペゴミヤ・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミヤ・ヒオシヤミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミヤ・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 (*Piophilacasei*)、プラチパレア・ポエシロプテラ (*Platyparea poeciloptera*)、プロジプロシス属種 (*Prodiptosis* 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.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チブラ・シムプレキス (*Tipula simplex*)、トキシトリパナ・クルビカウダ (*Toxotrypana curvicauda*) ;

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、アシルトシポン・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 devastans*)、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、(*Aonidiella aurantii*)、(*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフイス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフイス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフイス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフイス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフイス・グリシネス (*Aphis gl*

10

20

30

40

50

ycines)、アフィス・ゴシパイ (*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘ
 デラエ (*Aphis hederiae*)、アフィス・イリノイセンシス (*Aphis il
 linoiensis*)、アフィス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*
)、アフィス・ナスツルチイ (*Aphis 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 spiraecola*)、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 api
 calis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla spp.*)、アスピジエラ
 属種 (*Aspidiella spp.*)、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 spp.*)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacort
 hum 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 (*Blastopsylla occidentalis*)、
 ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melale
 ucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichr
 ysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus spp.*)、ブレビコリネ・ブ
 ラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Caco
 psylla spp.*)、例えば、カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla py
 ricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginat
 a*)、カプリニア属種 (*Capulinia spp.*)、カルネオセファラ・フルギダ
 (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Cera
 tovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロ
 プラステス属種 (*Ceroplastes spp.*)、カエトシホン・フラガエホリイ
 (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス
 (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlori
 ta 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 (*Chrysomphalus aonidum*)、
 クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ
 ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Cocco
 mytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus spp.*)、例えば、コッ
 クス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、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 viri
 dis*)、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 (*Ctena
 rytaina spp.*)、ダルブルス属種 (*Dalbulus spp.*)、ジアレウ
 ロデス・チッテンデニ (*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウ
 ロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Dia
 phorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis spp.*)、ジウラフ
 イス属種 (*Diuraphis spp.*)、ドラリス属種 (*Doralis spp.*)
 、ドロシカ属種 (*Drosicha spp.*)、ジサフィス属種 (*Dysaphis s
 pp.*)、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 (*Dysaphis plantaginea*)、ジサ
 フィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dys
 micoccus spp.*)、エムポアスカ属種 (*Empoasca spp.*)、例え
 ば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca 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 (*Eri*

10

20

30

40

50

osoma 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 (*Eriosoma 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 bilobatus*)、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 oceanica*)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロブシラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロブシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、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・ブルカシ (*Icerya purchasi*)、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 (*Laodelphax 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 (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、ロホレウカスピス・ジャポニカ (*Lopholeucaspis japonica*)、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 (*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンズ (*Macrosteles facifrons*)、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 (*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・プルイノサ (*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*)、モネリオプシス・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 ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotianae*)、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 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ネツチゴニクラ・スペクトラ (*Nettigoniclla spectra*)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphig*

10

20

30

40

50

us spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populiveneriae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属種 (*Perkinsiella* spp.)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、フロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトプルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロンギスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、プルビナリア属種 (*Pulvinaria* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランスレギアエ (*Quadraspidiotus juglansregiae*)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Quadraspidiotus ostraeaformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidiotus perniciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシフム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフエアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクトア (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミナム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus 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.)、スティクトセファラ・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

10

20

30

40

50

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・トリスチス (*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・パイリス (*Dasynus pipe ris*)、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・セルプス (*Euschistus servus*)、エウスキスツス・トリスチグムス (*Euschistus tristigmus*)、エウスキスツス・バリオラリウス (*Euschistus variolarius*)、エウリデマ属種 (*Eurydema* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ハリオモルフア・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオパルチス属種 (*Hel iopeltis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobile llus*)、レプトコリスア属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトコリスア・バリコルニス (*Leptocorisa 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 (*Lygocor is 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 (*M egacopta 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*)、ニシウス属種 (*Nysius* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、Pentomidae (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma qua drata*)、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 pe rsea*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サーベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスターネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotin*

10

20

30

40

50

ophora 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.) ;

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.)、ドリコベスプラ属種 (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・テストジネア (Hoplocampa testudinea)、ラシウス属種 (Lasius spp.)、リネピテマ・フミレ (Linepithema humile)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、パラトレチナ属種 (Paratrechina spp.)、パラベスプラ属種 (Paravespula spp.)、プラギオレピス属種 (Plagiolepis spp.)、シレキス属種 (Sirex spp.)、ソレノプシス・インビクタ (Solenopsis invicta)、タピノマ属種 (Tapinoma spp.)、テクノピルメクス・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・アウロプンクタ (Wasmannia auropunctata)、キセリス属種 (Xeris spp.) ;

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)、ボルセリオ・スカベル (Porcellio scaber) ;

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・クムランズ (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 (Kalotermes 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) ;

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)、アドキソフィエス属種 (Adoxophyes spp.)、例えば、アドキソフィエス・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 (Argyroproce spp.)、アルトグラファ属種 (Auto grapha spp.)、バラトラ・ブラシカエ (Barathra brassica

10

20

30

40

50

e)、ブラストダクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボルボ・シンナ
ラ (*Borbo cinnara*)、ブクラトリキス・ツルベリエラ (*Buccula*
trix thurberiella)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus pi*
niarius)、ブッセオラ属種 (*Busseola spp.*)、カコエシア属種 (*Cacoecia spp.*)、カ
ロブチリア・テイボラ (*Caloptilia the*
ivora)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルポカブ
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 (*Chei*
matobia brumata)、キロ属種 (*Chilo spp.*)、例えば、キロ・
ブレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプレッサリス (*Ch*
ilo suppressalis)、コレウチス・パリアナ (*Choreutis pa*
riana)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura spp.*)、クリソ
デイクス・チャルシテス (*Chrysodeixis chalcites*)、クリシア
・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属種 (*Cn*
aphalocerus spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (*Cnapha*
locrocis medinalis)、クネファシア属種 (*Cnephasia sp*
pp.)、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 (*Copitars*
ia 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 noctu*
ides)、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・サッカラルリス (*Diatraea saccharalis*)、エアリ
アス属種 (*Earias spp.*)、エクジトロファ・アウランチュム (*Ecdyto*
lopha aurantium)、エラスモパルプス・リグノセルス (*Elasmop*
alpus lignosellus)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana sacc*
harina)、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 sp*
pp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphyas postvittana*)
、エランニス属種 (*Erannis spp.*)、エルショビエラ・ムスクラナ (*Ers*
choviella 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 (*Eux*
oa spp.)、フェルチア属種 (*Feltia spp.*)、ガレリア・メロネラ (*G*
alleria mellonella)、グラシラリア属種 (*Gracillaria*
spp.)、グラホリタ属種 (*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 (*G*
rapholitha prunivora)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta sp*
pp.)、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*)、
ホフマンフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospre*
tella)、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma spp.*)、ホモナ属種 (*H*
omona 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*)、ラムピデス属種 (*Lampides spp.*)、ラフィグマ属種 (*Laphyg*

10

20

30

40

50

ma 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・コフェエラ
 (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocol
 letis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocol
 letis blancardella*)、リトファネ・アンテナタ (*Lithopha
 ne 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 (*L
 oxagrotis 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 (*L
 yonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacoso
 ma 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 (*Mythi
 mna separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloa
 cellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*O
 iketicus* spp.)、オムフィサ属種 (*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 (*Parna
 ra* 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・オベルクレラ (*Pht
 horimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyl
 locnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonor
 ycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllon
 orycter blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyl
 lonorycter crataegella*)、ピエリス属種 (*Pieris* s
 pp.)、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 (*P
 lodia 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*))、プライス属種 (*P
 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punkタ (*Pseudaletia uni
 puncta*)、プセウドプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia in
 cludens*)、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 (*Scho
 enobius* spp.)、例えば、スコエノビウス・ビpunkチフェル (*Schoe
 nobius 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 innot
 ata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Se
 samia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia infe
 rens*)、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 (*Sp*

10

20

30

40

50

odoptera 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.) ;

10

バッタ目 (Orthoptera) 又は (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) ;

20

シラミ目 (Phthiraptera) の、例えば、ダマリニア属種 (Damalinia 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.) ;

30

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

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

40

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)、チャエタナフォツトリプス・レウウエニ (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 (Franklinie

50

lla schultzei)、フランクリエラ・トリチシ (Frankliniella tritici)、フランクリエラ・バシニイ (Frankliniella vaccinii)、フランクリエラ・ウィリアムシ (Frankliniella williamsi)、ハプロツリプス属種 (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)、トリプス属種 (Thrips spp.)、例えば、トリプス・パルミ (Thrips palmi)、トリプスタバシ (Thrips tabaci) ;

10

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 (Scutigerebella spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ (Scutigerebella 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.) ; 及び、さらに、

20

マキガイ綱 (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 (plant pests) (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 arachididis)、アフエレンコイデス・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・ロンギカウザツス (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・ペスチス (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

30

40

50

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 (*Criconemoides* spp.)、例えば、クリコネモイデス・
 フェルニアエ (*Criconemoides ferniae*)、クリコネモイデス・オ
 ノエンセ (*Criconemoides onoense*)、クリコネモイデス・オルナ
 ツム (*Criconemoides ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Dityl
 enchus* spp.)、例えば、ジチレンクス・ジブサシ (*Dityl
 enchus 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 (*Globo
 dera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera ro
 stochiensis*)、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
 dihystra*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoides*
 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 gly
 cines*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schacht
 ii*)、ヒルシュマニエラ属種 (*Hirschmaniella* spp.)、ホプロラ
 イムス属種 (*Hoplolaimus* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longido
 rus* spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus af
 ricanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、例えば、
 メロイドギネ・キトウオオジ (*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 (*Meloid
 ogyne 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 (*Neotyle
 nchus* 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 (*Pa
 ratylenchus* 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 pe
 netrans*)、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 (*Pu
 nctodera* spp.)、クイニスルシウス属種 (*Quinisulcius* sp
 p.)、ラドホルス属種 (*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 (*Rotylenc
 hulus* 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 (*Suban
 guina* 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 (*X
 iphinema* spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema
 index*)。

【0166】

10

20

30

40

50

式（I）の化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤（microbicide）若しくは除雄剤（gametocide）として、例えば、殺菌剤（fungicide）、抗真菌剤（antimycotic）、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤（これは、ウィロイドに対する作用薬も包含する）としても使用し得るか、又は、MLO（マイコプラズマ様生物）及びRLO（リケッチア様生物）に対する作用薬としても使用し得る。場合により、式（I）の化合物は、別の有効成分を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【0167】

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、農薬としての製剤及びその製剤から調製される使用形態〔例えば、灌注液、滴下液及び散布液〕にも関する。任意に、該使用形態は、さらなる農薬、及び／又は、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又はダイズ油メチルエステル）、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び／又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び／又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩（例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素ニアンモニウム）、及び／又は、保持促進剤（retention promoter）（例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアアポリマー）、及び／又は、湿潤剤（例えば、グリセロール）、及び／又は、肥料（例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料）を含有する。

【0168】

一般的な製剤は、例えば、以下のものである：水溶性液剤（SL）、乳剤（EC）、水中油型エマルジョン剤（EW）、懸濁製剤（SC、SE、FS、OD）、顆粒水和剤（WG）、顆粒剤（GR）、カプセル製剤（capsule concentrates）（CS）；これらの製剤型及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、場合により、さらなる農薬有効成分を含有する。

【0169】

好ましいものは、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、殺生物剤、増粘剤及び／又は他の補助剤（例えば、アジュバント）など〕を含有している製剤又は使用形態である。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増強する成分であって、その成分自体が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、拡展（spreading）、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

【0170】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式（I）の化合物を補助剤（例えば、増量剤、溶媒及び／若しくは固体担体、並びに／又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤）と混合させることによって製造する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

【0171】

使用する補助剤は、式（I）の化合物の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態

(例えば、即時使用可能な農薬、例えば、散布液又は種子粉衣製品)に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び／又は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。

【0172】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである：芳香族及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）、アルコール類及びポリオール類（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、及び／又は、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、脂肪族及び油類を包含する）及び（ポリ）エーテル類、単純な及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）、及び、ラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）。

10

【0173】

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、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、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又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及びジメチルスルホキシド、及びさらに水。

20

【0174】

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、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素若しくは塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、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、鉱油及び植物油、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、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、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又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、及び水である。

30

【0175】

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。好適な担体としては、詳細には、次のもの：例えば、アンモニウム塩、及び天然微粉碎鉱物、例えば、カオリン、アルミナ類、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、合成微粉碎岩石、例えば、高分散シリカ、酸化アルミニウム、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及び／又は、固形肥料などがある。そのような担体の混合物を使用することも同様に可能である。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、無機及び有機の粗びき粉からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

40

【0176】

液化ガスの増量剤又は溶媒を使用することも可能である。特に好適な増量剤又は担体は、標準温度及び大気圧下では気体であるものであり、例えば、エアロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、さらには、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0177】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び／若しくは泡形成剤、分散剤又は湿展剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例としては、以下のものを挙げることができる：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

50

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又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）、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、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオン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、及び、メチルセルロース。式（Ⅰ）の化合物のうちの１種類及び／又は該不活性担体のうちの１種類が水不溶性であり、か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。

10

【０１７８】

該製剤及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には、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及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、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などがある。

【０１７９】

存在してもよいさらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び／若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤である。泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

20

【０１８０】

さらにまた、該製剤及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、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、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、鉱油及び植物油であることができる。

【０１８１】

適切であれば、該製剤及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としては、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、展着剤がある。一般的に、式（Ⅰ）の化合物は、製剤を目的として通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

30

【０１８２】

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）又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）が包含される。

【０１８３】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬有効成分の浸透を促進するために代表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、及び／又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、従って、有効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。この特性を確認するために、文献（Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152）に記載されている方法を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（coco nut fatty ethoxy late）（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

40

50

ミンエトキシレート（１５）、又は、アンモニウム塩及び／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。

【０１８４】

当該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、０．０００００００１重量％から９８重量％の式（Ｉ）の化合物を含んでおり、より好ましくは、０．０１重量％から９５重量％の式（Ｉ）の化合物を含んでおり、最も好ましくは、０．５重量％から９０重量％の式（Ｉ）の化合物を含んでいる。

【０１８５】

当該製剤（特に、農薬）から調製された使用形態の中の式（Ｉ）の化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態中の式（Ｉ）の化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、０．０００００００１重量％から９５重量％の式（Ｉ）の化合物、好ましくは、０．００００１重量％から１重量％の式（Ｉ）の化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。

【０１８６】

混合物

式（Ｉ）の化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大し、作用の持続期間を延長し、作用速度を高め、撥水性を防止するために、又は、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、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、情報化学物質及び／又は植物成長調節剤との混合物で使用することも可能である。さらに、この種の有効成分組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、及び／又は、非生物的要因（例えば、高温又は低温）に対する耐性、渇水に対する耐性又は水中若しくは土壤中の塩分の含有量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、開花性能及び結果性能を改善することも可能であり、発芽能力及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、収穫高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、収穫された生産物の品質及び／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／又は、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。

【０１８７】

さらに、式（Ｉ）の化合物は、別の有効成分又は情報化学物質（例えば、誘引剤、及び／又は、鳥忌避剤、及び／又は、植物活性化剤、及び／又は、成長調節剤、及び／又は、肥料）との混合物の中に存在させることができる。同様に、式（Ｉ）の化合物を用いて、植物の特性（例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質）を向上させることも可能である。

【０１８８】

本発明による特定の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、製剤又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。

【０１８９】

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。場合により、言及された全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能である場合、好適な塩基若しくは酸と塩を形成することもできる。

【０１９０】

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有効成分は、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、又は、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>」）。分類は、本特許出願の出願

時点で入手可能なIRAC作用機序分類法（IRAC Mode of Action Classification Scheme）に基づくものである。

【0191】

（１）アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害薬、例えば、カーバメート系、例えば、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、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、及び、キシリルカルブ；又は、有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホスーエチル、アジンホスーメチル、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、クロルピリホスーメチル、クマホス、シアノホス、ジメトンーSーメチル、ダイアジノン、ジクロルボス／DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、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、ヘブテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、Oー（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、オキシジメトンーメチル、パラチオンーメチル、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、ピリミホスーメチル、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、テメホス、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、及び、バミドチオン；

（２）GABA依存性塩化物チャンネル遮断薬、例えば、シクロジエン有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系（フィプロール系）、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル；

（３）ナトリウムチャンネル調節剤、例えば、ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、dーシスートランスアレスリン、dー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ー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、アルファーシペルメトリン、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）ートランス異性体〕、デルタメトリン、エムペントリン〔（EZ）ー（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、タウーフルバリネート、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）ートランス異性体〕、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、及び、トランスフルトリン；又は、DDT；又は、メトキシクロル；

（４）ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）競争的調節剤、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、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、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；又は、スルホキサフル若しくはフルピラジフロ；

（５）ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリック調節剤、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；

（６）グルタミン酸依存性塩化物チャンネル（GluCl）アロステリック調節剤、例えば、アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン；

（７）幼若ホルモン模倣剤、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロブレン、キノブレン、及び、メトブレン；又は、フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン；

10

20

30

40

50

(8) 各種非特異的(多部位)阻害剤、例えば、ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル、又はクロロピクリン、又はフッ化スルフリル、又はホウ砂、又は吐酒石、又はメチルイソシアネート発生剤、例えばダゾメット(diazomet)及びメタム；

(9) 弦音器官調節剤、例えばピメトロジン又はフロニカミド；

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロビダジン；又は、エトキサゾール；

(11) 昆虫中腸膜の微生物ディスラプター、例えば、バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス(*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バシルス・スファエリクス(*Bacillus 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*)、及び、Bt植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1；

(12) 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、例えばジアフェンチウロン；又は、有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、プロパルギット；又は、テトラジホン；

(13) プロトン勾配破壊による酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルアミド；

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断剤、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップーナトリウム；

(15) キチン生合成の阻害薬(タイプ0)、例えば、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、及び、トリフルムロン；

(16) キチン生合成の阻害薬(タイプ1)、例えば、ブプロフェジン；

(17) 脱皮ディスラプター(特に、双翅目の場合)、例えば、シロマジン；

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド；

(19) オクトパミン受容体作動薬、例えば、アミトラズ；

(20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム；

(21) ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬、例えば、METI殺ダニ剤、例えば、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、及び、トルフェンピラド；又は、ロテノン(Derris)；

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン；

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、テトロノ酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト；

(24) ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害薬、例えば、ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛；又は、シアン化物、シアン化カルシウム、シアン化カリウム及びシアン化ナトリウム；

(25) ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬、例えば、 β -ケトニトリル誘導体、例えばシエノピラフェン及びシフルメトフェン、並びにカルボキシアニリド類、例えばピフルブミド；

10

20

30

40

50

(28) リアノジン受容体調節剤、例えば、ジアミド系、例えば、クロラントラニプロール、シアントラニプロール、及び、フルベンジアミド、

さらなる有効成分、例えば、アフィドピロベン、アフォキシレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、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 (chloroprallethrin)、氷晶石 (cryolite)、シクラニプロール、シクロキサプリド、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 (epsilon metofluthrin)、ε-モムフルトリン (epsilon momfluthrin)、ジフロビダジン、フロメトキン、フルアザインドリジン、フルエンシルホン、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 (fluhexafon)、フルオピラム、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、イプロジオン、κ-ビフェントリン、κ-テフルトリン、ロチラネル (lotilaner)、メペルフルトリン、パイコングディング (paichongding)、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)、テトラメチルフルトリン、テトラニプロール、テトラクロルアントラニプロール (tetrachlorantraniliprole)、チオキサザフェン、チオフルオキシメート (thiofluoximate)、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim) 及び、ヨードメタン；さらには、バシルス・フィルムス (Bacillus firmus) に基づく調製物 (I-1582, BioNeem, Votivo)、及び以下の化合物：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 (WO2006/043635 から公知) (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 (WO2003/106457 から公知) (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 (WO2006/003494 から公知) (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 (WO2010052161 から公知) (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-イルエチルカーボネート (EP2647626 から公知) (CAS-1440516-42-6)、4- (ブタ-2-イン-1-イルオキシ) -6- (3, 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 から公知) (CAS 792914-58-0)、PF1364 (JP2010/018586 から公知) (CAS 登録番号 1204776-60-2)、N- [(2E)-1- [(6-クロロピリジン-3-イル) メチル] ピリジン-2 (1H)-イリデン] -2, 2, 2-トリフルオロアセトアミド (WO2012/029672 から公知) (CAS 1363400-41-2)、(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 から公知) (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 から公知) (CAS 1226889-14-0)、5-プロモ-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 から公知) (CAS 1449220-44-3)、4- [5- (3, 5-ジクロロフェニ

10

20

30

40

50

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)ベンズアミド及び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から公知)(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]プロパンアミド及び(-)-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から公知)(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から公知)(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、(Liudai ben jia xuan an、CN103109816Aから公知)(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から公知)(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から公知)(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から公知)(CAS 1108184-52-6); (2E)-及び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から公知)(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-ベンゾイミダゾール-2-イル)フェニルエステル(CN103524422Aから公知)(CAS 1542271-46-4); (4aS)-7-クロロ-2, 5-ジヒドロ-2-[[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から公知)(CAS 1370358-69-2); 6-デオキシ-3-O-エチル-2, 4-ジ-O-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]カーバメート]- α -L-マンノピラノース(US2014/0275503A1から公知)(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]

10

20

30

40

50

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から公知) (CAS 934001-66-8) 及び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)チオ]プロパンアミド (WO2015/058021A1、WO2015/058028A1から公知) (CAS 1477919-27-9)。

【0192】

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有効成分は公知であり、例えば、「Pesticide Manual」(16th Ed., British Crop Protection Council)に記載されているか、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>)。

【0193】

分類(1)～(15)に記載されている全ての混合成分は、場合により、それらの官能基に基づいて可能であれば、好適な塩基又は酸と塩を形成することができる。分類(1)～(15)で言及の全ての殺菌剤混合成分は、場合により、互変異体型を包含し得る。

【0194】

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) 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)

10

20

30

40

50

- [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 - ({ (2 R, 4 S) - 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) - 1 H - 1, 2, 4 - トリア
 ザール、(1. 038) 1 - ({ (2 S, 4 S) - 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) -
 1 H - 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 } - 1 H - 1, 2
 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1. 040) 1 - { [r e l (2 R,
 3 R) - 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 } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(
 1. 041) 1 - { [r e l (2 R, 3 S) - 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 } - 1 H - 1, 2, 4 - トリア
 ザール - 5 - イルチオシアネート、(1. 042) 2 - [(2 R, 4 R, 5 R) - 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 - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1. 04
 3) 2 - [(2 R, 4 R, 5 S) - 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 - 3 H - 1, 2, 4
 - トリアゾール - 3 - チオン、(1. 044) 2 - [(2 R, 4 S, 5 R) - 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 - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1. 045)
 2 - [(2 R, 4 S, 5 S) - 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 - 3 H - 1, 2, 4 - ト
 リアゾール - 3 - チオン、(1. 046) 2 - [(2 S, 4 R, 5 R) - 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 - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1. 047) 2 -
 [(2 S, 4 R, 5 S) - 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 - 3 H - 1, 2, 4 - トリア
 ザール - 3 - チオン、(1. 048) 2 - [(2 S, 4 S, 5 R) - 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 - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1. 049) 2 - [(
 2 S, 4 S, 5 S) - 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 - 3 H - 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 - 3 H - 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 - (1 H - 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 - (1 H - 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 - (1 H - 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 - (1 H - 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 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1. 0
 56) 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 - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3
 - チオン、(1. 057) 2 - { [r e l (2 R, 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル)

10

20

30

40

50

- 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 - { 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-ブロモ-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-ブロモ-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-ブロモ-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-ブロモ-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-ブロモ-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-ブロモ-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。

10

20

30

40

50

【0195】

2) 複合体I又は複合体IIにおける呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2.001)ベンゾ
 ビンジフルビル、(2.002)ビキサフェン、(2.003)ボスカリド、(2.00
 4)カルボキシシン、(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)イソフェタ
 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, 9
 S)、(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, 9
 R)、(2.012)イソピラザム(アンチ-エピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9S
 R)、(2.013)イソピラザム(シン-エピマー性ラセミ体(1RS, 4SR, 9R
 S)とアンチ-エピマー性ラセミ体(1RS, 4SR, 9SR)の混合物)、(2.01
 4)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-エピマー性ラセミ体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(p
 y d i f l u m e t o f e n)、(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、(2.0
 23)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-1
 H-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]-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-1
 H-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-1
 H-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)N-(5-クロロ-2-イソプロピ
 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

10

20

30

40

50

チル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(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)-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-カルボキサミド、(2.050) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.051) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.052) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.053) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.054) N-シクロプロピル-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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.055) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.056) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド。

【0196】

3) 複合体IIIにおける呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3.001) アメトクトラジン、(3.002) アミスルプロム、(3.003) アゾキシストロビン、(3.004) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3.005) クモキシストロビン、(3.006) シアゾファミド、(3.007) ジモキシストロビン、(3.008) エノキサストロビン、(3.009) ファモキサドン、(3.010) フェンアミドン、(3.011) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、(3.012) フルオキサストロビン、(3.013) クレソキシム-メチル、(3.014) メトミノストロビン、(3.015) オリサストロビン、(3.016) ピコキシストロビン、(3.017) ピラクロストロビン、(3.018) ピラメトスト

10

20

30

40

50

ロビン、(3.019) ピラオキシストロビン、(3.020) トリフロキシストロビン、(3.021) (2E) - 2 - {2 - [(1E) - 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、(3.022) (2E, 3Z) - 5 - {1 - (4 - クロロフェニル) - 1H - 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、(3.023) (2R) - 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、(3.024) (2S) - 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、(3.025) (3S, 6S, 7R, 8R) - 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、(3.026) 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、(3.027) 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、(3.028) (2E, 3Z) - 5 - {1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 1H - 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。

【0197】

4) 有糸分裂及び細胞分裂阻害薬、例えば、(4.001) カルベンダジム、(4.002) ジエトフェンカルブ、(4.003) エタボキサム、(4.004) フルオピコリド、(4.005) ペンシクロン、(4.006) チアベンダゾール、(4.007) チオファネート - 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

10

20

30

40

50

オロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン。

【0198】

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) 塩基性塩化銅、(5.009) 硫酸銅 (2+)、(5.010) ジチアノン、(5.011) ドジン、(5.012) ホルペット、(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) 硫黄及び硫黄剤、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。

10

【0199】

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。

【0200】

7) アミノ酸及び／又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、(7.006) 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。

20

【0201】

8) ATP 産生阻害薬、例えば、(8.001) シルチオフアム。

【0202】

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) ジメトモルフ、(9.003) フルモルフ、(9.004) イプロバリカルブ、(9.005) マンジプロパミド、(9.006) ピリモルフ (pyrimorph)、(9.007) バリフェナレート、(9.008) (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) プロパー - 2 - エン - 1 - オン、(9.009) (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) プロパー - 2 - エン - 1 - オン。

30

【0203】

10) 脂質及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。

【0204】

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。

【0205】

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)。

40

【0206】

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) イプロジオン、(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) ビンクロゾリン。

【0207】

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。

50

【0208】

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 (oxyfenthin)、(15.024) ペンタクロロフェノール及び塩、(15.025) ホスホン酸及びその塩、(15.026) プロパモカルブ-ホセチレート (propamocarb-fosetyl ate)、(15.027) ビリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、(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)-1H-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) 2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトロン、(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-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-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-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、(15.041) 2-{2-[(7,8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]-6-フルオロフェニル}プロパン-2-オール、(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-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾ

10

20

30

40

50

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及びその塩、(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) 3-(4, 4-ジフルオロ-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、(15.048) 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異体型: 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) ブター-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。

【0209】

混合成分としての生物農薬

式(I)の化合物は、生物農薬と組み合わせることができる。

【0210】

生物農薬としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(例えば、タンパク質又は二次代謝産物)などがある。

【0211】

生物農薬としては、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及び生物学的殺虫剤、殺菌剤又は殺線虫剤として作用する細菌などがある。

【0212】

生物農薬として使用される、又は使用可能なそのような細菌類の例は、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)、又は、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、又は、バシルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)株I-1582(受託番号CN CM I-1582)、又は、バシルス・プミルス(*Bacillus pumilus*)、特に、株GB34(受託番号ATCC 700814)及び株QST2808(受託番号NRRL B-30087)、又は、バシルス・スブチリス(*Bacillus subtilis*)、特に、株GB03(受託番号ATCC SD-1397)、又は、バシルス・スブチリス(*Bacillus subtilis*)株QST713(受託番号NRRL B-21661)、又は、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・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 イスラエレンシス(*B. thurin*

10

20

30

40

50

giensis subspecies israelensis) (抗原型 H-14) 株 AM65-52 (受託番号 ATCC 1276)、又は、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)、又は、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、又は、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)。

【0213】

生物農薬として使用されるか使用可能な菌類及び酵母類の例は、以下のものである。

【0214】

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*)、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 又は株 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)。

【0215】

生物農薬として使用されるか使用可能なウィルス類の例は、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)、コドリガ (*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*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV。

【0216】

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定に特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び菌類も、同様に包含される。例としては、以下のものがある：

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*)、アゾスピリルム属種 (*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、*Pseudomonas cepacia*) として知られていた)、ギガスポラ属種 (*Gigaspora* spp.) 又はギガスポラ・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.)、ピソリツス・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*)、*10*
 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 (*Scleroderma* spp.)、スイルス属種 (*Suillus* spp.)、ストレプトミセス (*Streptomyces* spp.)。

【0217】

生物農薬として使用されるか使用可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物 (これは、タンパク質及び二次代謝産物を包含する) の例は、以下のものである：*20*

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*) / ピレトリン類、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、Regalia、(「Requiem (商標名) 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、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。*30*

【0218】

混合成分としての薬害軽減剤

式 (I) の化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセット (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)、メフェンピル (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)。*40*

【0219】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物部分を処理することができる。ここで、植物は、*50*

望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物（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及び植物個体群、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）及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類及びブドウ）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、又は、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、又は、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る。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又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、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。植物部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及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、果実及び種子、さらには、根、塊茎及び根茎などである。植物部分には、収穫された植物又は収穫された植物部分、並びに、栄養繁殖器官（*vegetative propagation material*）及び生殖繁殖器官（*generative propagation material*）、例えば、挿穂（*cutting*）、塊茎、根茎、かき苗（*slip*）及び種子などもある。

10

20

【0220】

式（I）の化合物を用いた植物及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、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息場所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（*propagation material*）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行う。

【0221】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びその部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、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育種法により得られた植物種及び植物品種、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な方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種（遺伝子組換え生物）及びそれらの部分を処理する。「部分（*parts*）」又は「植物の部分（*parts of plants*）」又は「植物の部分（*plant parts*）」という用語については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、個々の市販の慣習的な植物品種又は使用されている慣習的な品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得た、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、生物型又は遺伝子型であることができる。

30

40

【0222】

トランスジェニック植物、種子処理、及び、統合事象

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又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）は、特定の有利な有用特性（「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を含むものである。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、渇水又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、成熟促進、収穫量向上、収穫された生産物の向上した品質及び／又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵性及び／又は改善された加工性などである。そのような特性のさらなる特に強調される例は、害虫及び有害微生物に対する（例えば、昆虫

50

類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及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 *CryIA(a)*、*CryIA(b)*、*CryIA(c)*、*CryIIA*、*CryIIIA*、*CryIIIB2*、*Cry9c*、*Cry2Ab*、*Cry3Bb* 及び *CryIF* 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、害虫及び有害微生物に対する (例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及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、細菌類及び／又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*)、システムイン (*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及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の活性除草化合物 (例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシン) に対する植物の向上した耐性 (例えば、「*PAT*」遺伝子) である。対象となる所望の特定 (「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、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物 (果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類及びブドウである。) 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、タバコ及びナタネは特に重要である。特に強調される特性 (「形質」) は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

【0223】

作物保護－処理の種類

植物及び植物部分は、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 (灌漑 (*drenching*))、点滴灌漑などによって、直接、又は、植物及び植物部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に対する作用させることにより、さらには、繁殖器官 (*propagation material*) 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、スラリー処理により、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによって式 (I) の化合物で処理される。さらに、式 (I) の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、又は、該施用形態若しくは式 (I) の化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

【0224】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用であり、それは、式 (I) の化合物を茎葉部に施用することを意味し、その場合、処理頻度及び施用量は、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。

【0225】

浸透移行性有効成分の場合、式 (I) の化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。従って、植物は、その植物の生息環境に対して式 (I) の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、灌水 (*drenching*) によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させる [即ち、植物の成育場所 (例えば、土壌、又は、水耕系) に式 (I) の化合物の液体形態を含浸させる] ことによって、又は、土壌施用 [即ち、本発明による式 (I) の化合物を固体形態で (例えば、顆粒形態で) 植物の成育場所に導入する] 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) の化合物 (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。

【0226】

種子の処理

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。そうではあっても、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、播種後又は出芽後に農薬を追加で施用することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及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、使用する有効成分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及び発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する有効成分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及び発芽中の植物の最適な保護を達成するために、有害生物抵抗性トランスジェニック植物又は有害生物耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性又は殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

10

【0227】

従って、本発明は、特に、有害生物による攻撃から種子及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）の化合物のうちの1種類で処理することによる。種子及び発芽中の植物を有害生物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）の化合物と混合成分によって、1回の操作で同時に又は順次に処理するような方法も包含する。それはさらに、該種子を、式（I）の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。

【0228】

20

本発明はまた、種子及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）の化合物の使用にも関する。

【0229】

さらに、本発明は、害虫に対して保護されるように、本発明による式（I）の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）の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）の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）の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）の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）の化合物と混合成分が被膜の一部として又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。

30

【0230】

本発明は、さらに、式（I）の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。

【0231】

式（I）の化合物が浸透移行的に作用する場合に得られる利点の一つは、種子処理が、種子自体を保護するだけでなく、発芽後に害虫から、種子から得られる植物も保護するという点である。このようにして、播種時又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。

40

【0232】

別の有利な点は、式（I）の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及び出芽が増進され得るということである。

【0233】

式（I）の化合物を、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。

【0234】

さらに、式（I）の化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、その結果として、共生生物（例えば、根粒菌、菌根菌及び／又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、及び／又は、窒素固定が最適化さ

50

れる。

【0235】

式(I)の化合物は、農業において、温室内で、森林で又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、アワ及びエンバク)、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、テンサイ及び飼料用ビート)、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、タマネギ及びレタス)、果実植物、芝生及び観賞植物の種子である。穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネ、野菜及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

10

【0236】

既に上記で記載したように、式(I)の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、ポリペプチド(特に、殺虫特性及び／又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*)種又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。

20

【0237】

本発明に関連して、式(I)の化合物は、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、被毛又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、及び、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。或いは、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。イネ種子の場合、例えば、イネ胚の一定段階(「鳩胸段階(*pigeon breast stage*)」)に達するまで水中に浸漬させ、それによって発芽を刺激し、より均一な出芽となる種子を用いることも可能である。

30

【0238】

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、又は、種子から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)の化合物の量及び／又はさらなる添加剤の量を選択することに、概して注意しなければならない。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有効成分の場合に、確実に実施しなければならない。

【0239】

一般に、式(I)の化合物は、好適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及びプロセスは、当業者には知られている。

40

【0240】

式(I)の化合物は、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、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換することが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換することも可能である。

【0241】

これらの製剤は、既知方法で、式(I)の化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び溶媒又は希釈剤、色素、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、接着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることに

50

よって製造される。

【0242】

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色素は、そのような目的に関して慣習的な全ての色素である。水中であまり溶解しない顔料又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」及び「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。

【0243】

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、農薬有効成分の製剤に関して慣習的に使用される、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又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。

10

【0244】

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及び／又は乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に一般的な非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を好ましく使用することができる。好適な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及びトリステチ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又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及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。

20

【0245】

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、農薬有効成分の製剤に一般に使用される全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用する。

【0246】

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、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマルなどを挙げることができる。

30

【0247】

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、改質粘土及び微粉化シリカなどを挙げることができる。

【0248】

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接着剤は、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及びチロースなどを挙げることができる。

40

【0249】

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及びジベレリンA7である。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(c f. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

【0250】

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

50

子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、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) 又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、エンバク及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、ダイズ及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、又は、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又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。

【0251】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又は水を加えることによってその種子粉衣製剤から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、バッチ式又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又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、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。

【0252】

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) の化合物の特定の含有量及び当該種子に左右される。式 (I) の化合物の施用量は、一般に、種子 1 kg 当たり 0.001 から 50 g であり、好ましくは、種子 1 kg 当たり 0.01 から 15 g である。

【0253】

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) の化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物又は内部寄生生物に対して、活性を示す。「内部寄生生物」という用語は、特に、蠕虫類及び原生動物（例えば、コクシジウム）を包含する。外部寄生生物は、代表的には、及び、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類又はダニ類である。

【0254】

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) の化合物は、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物 (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。

【0255】

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、ウシ及びブタ；又は家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、及び、特に、ニワトリ；又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及び甲殻類の動物；又は、場合により、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0256】

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、及び、特に、イヌ、ネコ、籠の鳥、爬虫類、両生類、又は、水槽の魚。

【0257】

具体的実施形態では、式 (I) の化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0258】

別の具体的実施形態では、式 (I) の化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、又は、特に、家禽類に対して、投与される。

【0259】

動物寄生生物を防除するために式 (I) の化合物を使用することは、上記動物の病気、

10

20

30

40

50

死亡事例を低減又は予防すること、及び、生産性（performance）（肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）の低下を低減又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、及び、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

【0260】

動物衛生の分野に関連して、本発明の文脈での「防除する（control）」又は「防除する（controlling）」という用語は、式（I）の化合物が、寄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）の化合物が、個々の寄生生物を殺し、その成長を阻害し、又は、その増殖を阻害することを意味する。

10

【0261】

節足動物としては、例えば、下記のものなどがあるが、これらに限定されるものではない。

【0262】

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.）、及び、ソレノポテス属種（Solenopotes spp.）；

マロファギダ目（Mallophagida）並びにアムブリセリナ亜目（Amblycerina）及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）及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.）、クリソミヤ属種（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.）、ルトゾミヤ属種（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.）、フィリポミヤ属種（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.）、チプラ属種（Tipula spp.）、ウィルヘルミア属種（Wilhelmia spp.）、ウォールファールチ

30

40

50

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.)、プレキス属種 (*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* spp.) ; 及び、さらに、ゴキブリ目 (*Blattarida*) の有害害虫及び衛生害虫。
【0263】

10

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 (*Acarina*) 及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、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、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、デルマニッス属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニッス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニッス属種 (*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 (*Actiniedida* (*Prostigmata*)) の、例えば、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属種 (*Cheyletiella* spp.)、デモデキス属種 (*Demodex* spp.)、リストロホルス属種 (*Listrophorus* spp.)、ミオピア属種 (*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. ; 及び、アカリジダ目 (*Acaridida* (*Astigmata*)) の、例えば、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、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 (*Cytodites* 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.)。

20

30

40

【0264】

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*)

50

a) の、例えば、ギアルジア属種 (*Giardia* spp.)、スピロヌクレウス属種 (*Spironucleus* 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* sp.)、ユーアメーバ科 (*Euamoebidae*)、例えば、ハルトマネラ属種 (*Hartmannella* sp.) ;

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.)、及び、さらに、例えば、ミキソゾア属種 (*Myxozoa* spp.)。

【0265】

ヒト又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*)、線虫、舌形動物門 (*Pentastoma*) 及び扁形動物門 (*Platyhelminthes*) [例えば、単生類 (*Monogenea*)、条虫類 (*Cestodes*) 及び吸虫類 (*Trematodes*)] などがある。

【0266】

例証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ことができる：

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 (*Trogglecephalus* sp

10

20

30

40

50

p. ;

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 (Diphyllbothrium 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 (Mesocostoides 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.)、スチレシア属種 (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 (Echinocasmus 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.)、ブラギオルキス属種 (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 (Prost

10

20

30

40

50

hogonimus 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.)、チフロコエラム属種 (Typhlococelum 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: ミクロネマ属種 (Micronema spp.)、パラストラングロイデス属種 (Parastrangyloides 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 (Amidostomum 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 (Haemonchus 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

10

20

30

40

50

(*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 (*Trichostrongylus* spp.)、トログロストロンギルス属種 (*Troglostrongylus* 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 (*Baylisascaris* 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 (*Crassicauda* spp.)、ジペタロネマ属種 (*Dipetalonema* spp.)、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 (*Filaria* 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 (*Litomosoides* 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 (*Parafilaria* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パスアルス属種 (*Passalurus* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、プロブストマイリア属種 (*Probstmayria* spp.)、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 (*Strongyluris* 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* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.) ;

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) : ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば：マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorchis* spp.) ; サジヨウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば：モニリホルミス属種 (*Moniliformis* spp.) ;

ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば：フィリコリス属種 (*Filicollis* 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 (*Leptorhynchoides* spp.) ;

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

【0267】

獣医学の分野において、及び、畜産業において、式 (I) の化合物は、当技術分野で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、非経口、経皮又は経鼻経路を介して投与する。投与は、予防的、感染後防御的 (*metaphylactic*) 又は治療的であり得る。

10

20

30

40

50

【0268】

かくして、本発明の1実施形態は、薬物として使用するための式(I)の化合物である。

【0269】

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)の化合物に関する。

【0270】

本発明のさらなる特定の態様は、抗蠕虫剤として使用するための、特に、殺線虫剤、殺扁形動物剤(platyhelminthicide)、殺鉤頭動物剤(acanthocephalicide)又は殺舌形動物剤(pentastomicide)として使用するための、式(I)の化合物に関する。

【0271】

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)の化合物に関する。

【0272】

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、非常に特には、殺虫剤又は殺ダニ剤として使用するための、式(I)の化合物に関する。

【0273】

本発明のさらなる態様は、有効量の少なくとも一つの式(I)の化合物及び次のもの：薬学的に許容される賦形剤(例えば、固体希釈剤又は液体希釈剤)、薬学的に許容される補助剤(例えば、界面活性剤)、特に、動物薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容される賦形剤、及び／又は、動物薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容される補助剤のうちの少なくとも一つを含む動物薬製剤である。

【0274】

本発明の関連する態様は、本明細書中に記載されている動物薬製剤を製造する方法であって、少なくとも一つの式(I)の化合物を、薬学的に許容される賦形剤及び／又は補助剤(特に、動物薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容される賦形剤、及び／又は、動物薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容される補助剤)と混合させる段階を含む方法である。

【0275】

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及び殺内部寄生生物薬製剤の群から選択される動物薬製剤、特に、駆虫薬製剤、抗原生動物薬製剤及び殺節足動物薬製剤の群から選択される動物薬製剤、非常に特には、殺線虫薬製剤、殺扁形動物薬製剤、殺鉤頭動物薬製剤、殺舌形動物薬製剤、殺虫薬製剤及び殺ダニ薬製剤の群から選択される動物薬製剤、並びに、それらを製造する方法である。

【0276】

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及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であって、そのような処置を必要とする動物(特に、非ヒト動物)において有効量の式(I)の化合物を使用することによる方法に関するものである。

【0277】

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及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であって、そのような処置を必要とする動物(特に、非ヒト動物)において本明細書中で定義されている動物薬製剤を使用することによる方法に関するものである。

【0278】

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及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)の化合物の使用に関する。

【0279】

動物衛生又は獣医学に関連して、「処置(treatment)」という用語は、予防

10

20

30

40

50

的処置、感染後防御的処置又は治療的処置を包含する。

【0280】

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、少なくとも一つの式（I）の化合物と別の活性化合物（特に、殺内部寄生生物薬及び殺外部寄生生物薬）の混合物が提供される。

【0281】

動物衛生の分野においては、「混合物」は、2種類の（又は、それより多い）異なる有効成分が共通の製剤に製剤され、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、それぞれの有効成分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、2種類より多くの有効成分を使用する場合、全ての有効成分を共通の製剤に製剤することができ、又は、全ての有効成分を別々の製剤に製剤することが可能である；同様に、有効成分のうちの一部と一緒に製剤し且つ有効成分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、当該複数の有効成分を別々に施用することが可能であるか、又は、連続して施用することが可能である。

【0282】

本明細書中において「一般名」によって特定されている有効成分は既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」（上記を参照）に記載されているか、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>」）。

【0283】

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有効成分としては、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及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有効成分について、現在の「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいた上記分類に従って、以下に列挙する：（1）アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害薬；（2）GABA依存性塩化物チャンネル遮断薬；（3）ナトリウムチャンネル調節薬；（4）ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）競合的調節薬；（5）ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリック調節薬；（6）グルタミン酸依存性塩化物チャンネル（GluCl）アロステリック調節薬；（7）幼若ホルモン模倣物質；（8）種々の非特異的（多部位）阻害薬；（9）弦音器官調節薬；（10）ダニ成長阻害薬；（12）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；（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；（14）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；（15）キチン生合成の阻害薬（タイプ0）；（16）キチン生合成の阻害薬（タイプ1）；（17）脱皮ディスラプター（特に、双翅目で）；（18）エクジソン受容体作動薬；（19）オクトパミン受容体作動薬；（21）ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬；（25）ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬；（20）ミトコンドリア複合体IIII電子伝達阻害薬；（22）電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬；（23）アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬；（28）リアノジン受容体調節薬；

作用機序が未知であるか非特異的である有効成分、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、ゴシプルレ、フルテンジン、プロモプロピレート、氷晶石（cryolite）；

別の種類の化合物、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、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、アロムフェンビンホス（-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；又は、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；又は、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、（シスー、トランスー）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、シスーレスメトリン、ヘプタフルトリン、ピオエタノメトリン、ピオペルメトリン、フェンピリトリン、シスーシペルメトリン、シスーペルメトリン、クロシトリン、シハロトリン（ラムダー）、クロバポルトリン、又は、ハロゲン化炭化水素化合物（HCH類）；

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、又は、フェロモン類、例えば、天然産物類、例えば、ツリングエンシン（thuringiensin）、コドレモン、又は、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（chlormebuforn）、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。

【0284】

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有効成分としては、限定するものではないが、駆虫有効成分及び抗原生動物有効成分などを挙げることができる。

【0285】

該駆虫活性化合物としては、限定するものではないが、以下の殺線虫活性化合物、殺吸虫活性化合物及び／又は殺条虫活性化合物などを挙げることができる：

大環状ラクトン類の種類の、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及びプロベンゾイミダゾール類の種類の、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（parabendazole）、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種類の、好ましくは、環状デブシペプチド類（depsipetides）の種類の、特に、24員の環状デブシペプチド類の種類の、例えば：エモデプシド（emodepside）、PF1022A；

テトラヒドロピリミジン類の種類の、例えば：モランテル、ピランテル、オキサントル；イミダゾチアゾール類の種類の、例えば：ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

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

10

20

30

40

50

アミノアセトニトリル類の種類の、例えば：モネパンテル (monepantel) ;
パラヘルクアミド類の種類の、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種類の、例えば：トリプロムサラン、プロモキサニド、プロチア
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種類の、例えば：ニトロキシニル、ビチオノール、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種類の、例えば：トリクロロホン、ナフタロホス (naphth
halofos) 、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/キノリン類の種類の、例えば：プラジクアンテル (praziqua
ntel) 、エプシプランテル ;

ピペラジン類の種類の、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種類の、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 ;

各種他の種類の、例えば：ブナミジン、ニリダゾール、レゾランテル、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 (mi
rasan) 、ミラシル (miracil) 、ルカントン、ヒカントン、ヘトリン (he
tolin) 、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、ペフェニウム、アモスカネート (amoscanate) 、クロルスロン。
【0286】

抗原生動物有効成分としては、限定するものではないが、以下の有効成分を挙げるこ
とができる :

トリアジン類の種類の、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種類の、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種類の、例えば：ミルベマイシン、エリスロマイシン ;

キノロン類の種類の、例えば：エンロフロキサシン、プラドフロキサシン ;

キニン類の種類の、例えば：クロロキン ;

ピリミジン類の種類の、例えば：ピリメタミン ;

スルホンアミド類の種類の、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 ;

チアミン類の種類の、例えば：アンプロリウム ;

リンコサミド類の種類の、例えば：クリンダマイシン ;

カルバニリド類の種類の、例えば：イミドカルブ ;

ニトロフラン類の種類の、例えば：ニフルチモクス ;

キナゾリンアルカロイド類の種類の、例えば：ハロフギノン ;

各種他の種類の、例えば：オキサムニキン、パロモマイシン ;

ワクチン又は微生物からの抗原の種類の、例えば：バベシア・カニス・ロッシ (Bab
esia canis rossi) 、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 (Eimer
ia 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 (E
imeria acervulina) 、バベシア・カニス・ボゲリ (Babesia ca
nis vogeli) 、レイシュマニア・インファンツム (Leishmania i
nfantum) 、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) 。
【0287】

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

10

20

30

40

50

り、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。

【0288】

媒介動物の防除

式(I)の化合物は、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)、単細胞生物及び細菌類)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、昆虫又はクモ形類動物)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)、又は、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)。

【0289】

媒介動物の例及び媒介動物によって運ばれる疾患又は病原体は、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、蠕虫類の運搬；

－ヤブカ(Aedes)：黄熱病、デング熱、別のウイルス性疾患、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(borellioses)、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(Babesia canis canis)、エーリキア症(ehrlichiosis)。

【0290】

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、ヨコバイ類又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、甲虫類及び線虫類である。

【0291】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物及び／又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、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・フネスツス(A. funestus)、アノフェレス・ジルス(A. dirus)(マラリア)、及び、アカイエカ属(Culex)の蚊]、チョウバエ(Psychodidae)、例えば、サシチョウバエ(Phlebotomus)、ルツォミヤ(Lutzomyia)、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。

【0292】

式(I)の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。

【0293】

式(I)の化合物は、疾患の予防及び／又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、森林において、庭園やレジャー施設において、及び、さらに、材料

10

20

30

40

50

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）の化合物の使用である。

【0294】

工業材料の保護

式（I）の化合物は、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）及びシミ目（Zygentoma）の昆虫類〕による攻撃又は破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

【0295】

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、紙及び厚紙、皮革、木材、加工木材製品及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。

【0296】

さらなる実施形態では、式（I）の化合物は、少なくとも1種類のさらなる殺虫剤及び／又は少なくとも1種類の殺菌剤と一緒に使用する。

【0297】

さらなる実施形態では、式（I）の化合物は、即時使用可能な農薬の形態を取り、それは、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ことを意味する。有用なさらなる殺虫剤又は殺菌剤には、特に、上記で挙げたものなどがある。

【0298】

驚くべきことに、式（I）の化合物は、海水又は淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及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）の化合物は、単独で、又は、別の有効成分と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【0299】

衛生分野における害虫の防除

式（I）の化合物は、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、及び、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、動物飼育施設）において遭遇する昆虫類、クモ形類動物、マダニ類及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）の化合物は、単独で使用するか、又は、他の有効成分及び／又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）の化合物は、感受性種及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。

【0300】

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）及びザトウムシ目（Opiliones）の害虫、ムカデ綱（Chilopoda）及びヤスデ綱（Diplopoda）の害虫、昆虫綱（Insecta）のゴキブリ目（Blattodea）、コウチュウ目（Coleoptera）、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 又は Orthoptera）、ノミ目（Siphonaptera）及びシミ目（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。

【0301】

施用は、例えば、エアロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム（automatic fogging system）、噴

10

20

30

40

50

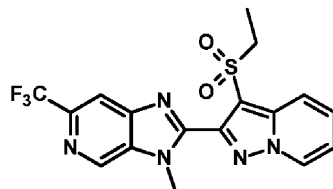
霧器 (f o g g e r)、泡、ゲル、セルロース製又はプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙 (m o t h p a p e r s)、防虫バッグ (m o t h b a g s) 及び防虫ゲル (m o t h g e l s) において実施するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、又は、餌場で実施する。

【0302】

製造例：

2- (3-エチルスルホニルピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) -3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-c] ピリジン (実施例 1-1)

【化16】



【0303】

マイクロ波合成ユニット (Anton Paar、Monowave 400) 中、2- (3-ブromoピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) -3-メチル-6- (トリフルオロメチル) -イミダゾ [4, 5-c] ピリジン 100mg (0.25mmol)、エタンスルフィン酸ナトリウム 146.6mg (1.26mmol) 及びヨウ化銅 (I) 7.2mg (0.03mmol) を、120℃で4時間にわたり、N, N-ジメチルホルムアミド 10mL 中で攪拌した。次に、塩化ナトリウム溶液を反応混合物に加え、それを酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に留去した。残留物を、溶離液として水/アセトニトリル勾配を用いる分取 HPLC によるカラムクロマトグラフィー精製によって精製した。

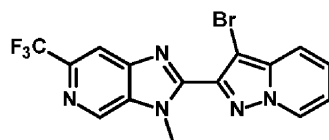
【0304】

(log P (中性) : 2.26 ; MH⁺ : 410 ; ¹H NMR (600MHz、D₆-DMSO) δ ppm : 1.23 (t、3H)、3.74 (q、2H)、4.10 (s、3H)、7.39-7.41 (m、1H)、7.77-7.80 (m、1H)、8.17 (d、1H)、8.32 (s、1H)、9.07 (d、1H)、9.30 (s、1H)。

【0305】

2- (3-ブromoピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) -3-メチル-6- (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5-c] ピリジン

【化17】



【0306】

N3-メチル-6- (トリフルオロメチル) ピリジン-3, 4-ジアミン 320mg (1.67mmol)、3-ブromoピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-カルボン酸 504mg (2.09mmol) 及び 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) 321mg (1.67mmol) を、アルゴン下に室温で16時間、ピリジン 10mL 中で攪拌した。反応混合物から減圧下に溶媒を除去し、残留物に水を加え、酢酸エチルで抽出を行った。有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に留去した。次に、残留物を、パラートルエンスルホン酸 159mg (83mmol)

l) の存在下に、還流下に6時間にわたりトルエン10mL中で攪拌した。混合物を、炭酸水素ナトリウム溶液と混合し、酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、次に、溶媒を減圧下に留去した。

【0307】

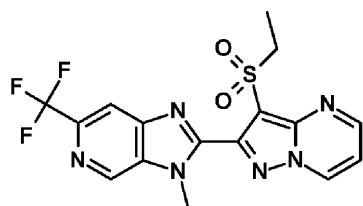
(log P (中性) : 2.86 ; MH^+ : 396 ; ^1H NMR (400MHz、 D_6 -DMSO) δ ppm : 4.29 (s, 3H)、7.21 (t, 1H)、7.53 (t, 1H)、7.78 (d, 1H)、8.32 (s, 1H)、8.92 (d, 1H)、9.27 (s, 1H)。

【0308】

実施例と同様にして、そして上記で記載の製造方法に従って、下記の式(I)の化合物を製造することができる。

【0309】

2-(3-エチルスルホニルピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-2-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]-ピリジン(実施例I-2)
【化18】



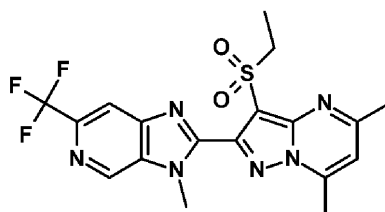
【0310】

(log P (中性) : 1.58 ; MH^+ : 411 ; ^1H NMR (400MHz、 D_6 -DMSO) δ ppm : 1.20 (t, 3H)、3.55 (q, 2H)、3.97 (s, 3H)、7.56-7.59 (m, 1H)、8.32 (s, 1H)、9.03-9.06 (m, 1H)、9.29 (s, 1H)、9.51 (d, 1H)。

【0311】

3-エチルスルホニル-5,7-ジメチル-2-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン(実施例I-3)

【化19】



【0312】

(log P (中性) : 2.00 ; MH^+ : 439 ; ^1H NMR (400MHz、 D_6 -DMSO) δ ppm : 1.17 (t, 3H)、2.69 (s, 3H)、2.80 (s, 3H)、3.53 (q, 2H)、3.95 (s, 3H)、7.42 (s, 1H)、8.30 (s, 1H)、9.27 (s, 1H)。

【0313】

実施例と同様にして、そして、上記の製造方法に従って、下記の式(I)の化合物を得ることができる。

10

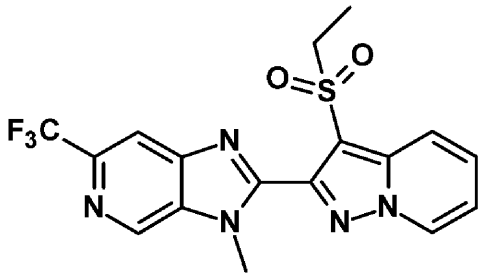
20

30

40

50

【表 1】

実施例	構造
I-1	

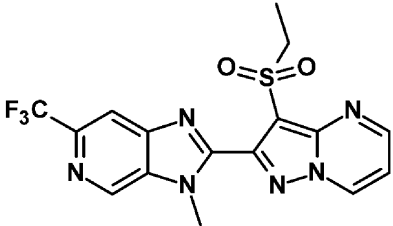
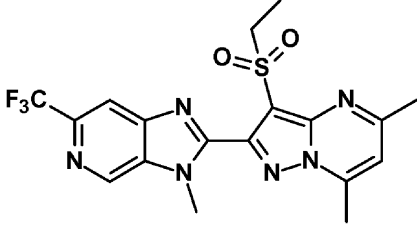
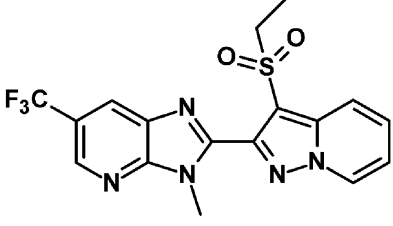
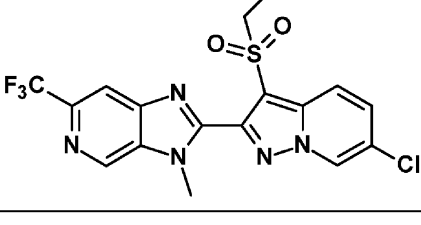
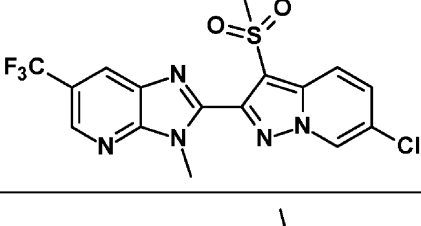
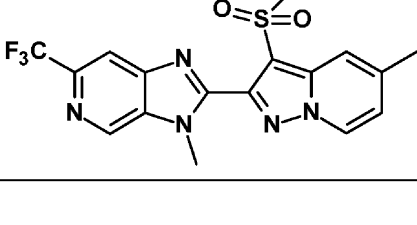
10

20

30

40

50

I-2	
I-3	
I-4	
I-5	
I-6	
I-7	

10

20

30

40

50

I-8	
I-9	
I-10	
I-11	
I-12	
I-13	

10

20

30

40

【0314】

log P値は、逆相カラム（C18）でのHPLC（高速液体クロマトグラフィー）によって、EEC通達79／831補遺V．A8に従って測定する。温度：55℃。

【0315】

酸性範囲でのLC-MS測定は、pH2.7で、溶離液として0.1%ギ酸水溶液及びアセトニトリル（0.1%ギ酸含有）；10%アセトニトリルから95%アセトニトリルの直線勾配を用いて行う。表中では、log P（HCOOH）と称している。

【0316】

中性範囲でのLC-MS測定は、pH7.8で、溶離液として0.001M炭酸水素ア

50

ンモニウム水溶液及びアセトニトリル；10%アセトニトリルから95%アセトニトリルの直線勾配を用いて行う。表中では、log P（中性）と称している。

【0317】

較正は、log P値が既知である分岐していないアルカン-2-オン類（炭素原子数3～16）を用いて行う（二つの連続するアルカノン間の直線内挿による保持時間に基づいて測定されたlog P値）。

【0318】

選択された例のNMRデータを、従来の形態で（ δ 値、多重項分裂、水素原子数）、又はNMRピークリストとして列記する。

【0319】

各場合で、NMRスペクトラムを記録した溶媒を記載する。

【0320】

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記載される。各シグナルピークについて、最初に δ 値（ppm単位）と次に小括弧内のシグナル強度が列記されている。異なるシグナルピークについての δ 値-シグナル強度数値のペアは、セミコロンによって互いに分離されて列記されている。

【0321】

従って、一つの実施例のピークリストは、下記の形を取る。

【0322】

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

鋭いシグナルの強度は、cm単位でのNMRスペクトラムの印刷例におけるシグナルの高さと相関しており、シグナル強度の真の比を示すものである。広いシグナルの場合、いくつかのピーク若しくはそのシグナルの中央並びにその相対強度を、スペクトラム中の最も強いシグナルとの比較で示すことができる。

【0323】

^1H NMRスペクトラムの化学シフトの較正のため、本発明者らは、テトラメチルシラン及び／又は特にDMSO中で測定されるスペクトラムの場合には使用される溶媒の化学シフトを用いる。従って、NMRピークリストにおいては、テトラメチルシランピークがある場合があるが、必ずしもそうである必要はない。

【0324】

^1H NMRピークのリストは、旧来の ^1H NMR印刷と同様であることから、通常は、旧来のNMR解釈で列記される全てのピークを含む。

【0325】

さらに、旧来の ^1H NMR印刷のように、それらは、溶媒シグナル、標的化合物の立体異性体（やはり、本発明の主題の一部を形成する。）のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルを示し得る。

【0326】

溶媒及び／又は水の δ 範囲内で化合物シグナルを報告するにおいて、本発明者らの ^1H -NMRピークリストでは、通常の溶媒ピーク、例えば、通常は概して高い強度を有するDMSO- D_6 中のDMSOのピーク及び水のピークが示されている。

【0327】

標的化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常は、標的化合物のピークより概して低い強度を有する（例えば、純度>90%）。

【0328】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の製造方法に代表的なものであり得る。従って、それらのピークは、この場合、「副生成物フィンガープリント」を参照して本発明者らの製造方法の再現性を確認する上で役立ち得る。

【0329】

公知の方法（MestReC、ACDシミュレーションで、さらには、経験的に評価さ

10

20

30

40

50

れる期待値で)で標的化合物のピークを計算する専門家であれば、必要に応じて適宜に別の強度フィルターを用いて標的化合物のピークを分離することができる。この分離は、旧来の ^1H NMR解釈での関連するピーク選択と同様であると考えられる。

【0330】

研究開示データベース番号(the Research Disclosure Database Number) 564025に、 ^1H NMRピークリストのさらなる詳細がある。

【表2】

実施例	
I-10	^1H -NMR(400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.5148(1.6);9.5107(1.7);9.4973(1.7);9.4931(1.7);9.0413(1.6);9.0372(1.7);9.0307(1.8);9.0265(1.7);8.9076(2.2);8.9039(2.3);8.7048(2.3);8.7005(2.3);7.5845(1.6);7.5739(1.6);7.5669(1.6);7.5563(1.6);3.9786(0.5);3.8718(16.0);3.6013(1.0);3.5828(3.4);3.5643(3.4);3.5456(1.0);3.3227(307.2);2.6751(1.0);2.6707(1.4);2.6663(1.1);2.5240(3.4);2.5103(90.7);2.5061(187.1);2.5017(247.9);2.4972(178.7);2.4930(87.3);2.3329(1.1);2.3285(1.5);2.3240(1.1);1.2288(0.5);1.2189(3.6);1.2005(7.9);1.1820(3.5);0.1461(0.3);0.0079(2.3);-0.0002(74.7);-0.0084(2.9)
I-9	^1H -NMR(400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 8.8949(2.7);8.8919(2.7);8.6783(2.7);8.6739(2.7);7.4133(3.9);3.8477(16.0);3.5764(1.1);3.5579(3.5);3.5394(3.5);3.5212(1.1);3.3206(77.1);2.7990(12.6);2.6861(14.4);2.6712(1.0);2.6663(0.7);2.5905(0.4);2.5058(85.3);2.5017(109.1);2.4974(82.2);2.3283(0.6);2.3240(0.5);2.0743(2.9);2.0738(2.9);1.2354(0.6);1.1952(3.9);1.1768(8.1);1.1584(3.6);0.1458(0.5);0.0070(5.1);-0.0001(102.5);-0.0007(101.1);-0.1498(0.5)
I-8	^1H -NMR(400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.2894(3.9);8.9254(3.1);8.3199(4.3);8.0597(2.1);8.0365(2.3);7.5414(1.7);7.5378(1.6);7.5179(1.5);7.5144(1.5);4.0978(16.0);3.7623(1.0);3.7439(3.2);3.7254(3.2);3.7072(1.0);3.3199(45.7);2.6753(0.4);2.6712(0.6);2.6668(0.4);2.5244(1.5);2.5108(39.2);2.5066(78.0);2.5021(100.6);2.4977(71.6);2.3333(0.4);2.3289(0.6);2.3242(0.4);2.1623(0.6);2.1537(0.6);2.1414(1.1);2.1289(0.7);2.1205(0.6);1.2296(3.5);1.2112(7.7);1.1928(3.3);1.0803(0.6);1.0687(1.9);1.0635(2.2);1.0526(1.1);1.0477(2.0);1.0425(2.0);1.0320(0.8);0.9016(0.8);0.8904(2.4);0.8863(2.3);0.8784(2.1);0.8737(2.5);0.8616(0.6);0.1462(0.5);0.0079(3.7);-0.0002(107.2);-0.0085(4.2);-0.1494(0.5)
I-7	^1H -NMR(400.0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9.2907(3.7);8.9634(2.0);8.9458(2.0);8.3193(3.9);7.9394(2.3);7.2625(1.4);7.2580(1.5);7.2448(1.4);7.2402(1.4);4.0817(16.0);3.7375(0.9);3.7191(3.2);3.7006(3.2);3.6822(1.0);3.3196(4

10

20

30

40

50

	9.1);2.6753(0.4);2.6707(0.6);2.6662(0.4);2.5242(11.4);2.5104(36.3);2.5062(74.4);2.5017(99.7);2.4972(73.6);2.4929(37.0);2.3330(0.4);2.3285(0.6);2.3239(0.5);1.2416(3.4);1.2233(7.6);1.2048(3.3);0.1459(0.5);0.0079(3.9);-0.0001(105.3);-0.0084(4.8);-0.1498(0.5)
I-6	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4988(2.6);9.4963(2.6);9.4944(2.3);8.9197(2.1);8.9154(2.2);8.7265(2.3);8.7227(2.2);8.1873(2.0);8.1633(2.4);7.8754(1.8);7.8709(1.8);7.8514(1.6);7.8469(1.7);4.0180(16.0);3.8426(0.9);3.8245(3.0);3.8060(3.0);3.7876(0.9);3.3575(18.0);2.6750(0.7);2.6706(0.9);2.6662(0.7);2.5240(2.1);2.5104(56.6);2.5061(120.2);2.5016(162.5);2.4971(117.2);2.4927(56.3);2.3325(0.6);2.3284(0.9);2.3240(0.7);1.2550(3.1);1.2367(7.3);1.2182(3.2);0.0079(0.5);-0.0002(19.0);-0.0085(0.7)
I-5	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4985(2.7);9.4960(2.7);9.2988(3.9);8.3368(4.1);8.1763(2.1);8.1522(2.5);7.8804(2.0);7.8759(2.0);7.8564(1.7);7.8519(1.8);4.1066(16.0);3.8036(0.9);3.7853(3.2);3.7668(3.2);3.7485(0.9);3.3211(31.6);2.6754(0.4);2.6708(0.6);2.6664(0.4);2.5241(1.3);2.5104(35.2);2.5063(72.1);2.5018(95.5);2.4974(68.9);2.4931(33.4);2.3328(0.4);2.3284(0.6);2.3241(0.4);1.2479(3.4);1.2296(7.6);1.2111(3.3);0.1459(0.5);0.0078(3.7);-0.0002(107.1);-0.0085(4.2);-0.1498(0.5)
I-4	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.0862(2.1);9.0688(2.1);8.9096(2.8);8.7163(2.9);8.1984(1.8);8.1761(2.0);7.8051(1.2);7.7859(1.4);7.7649(1.1);7.4206(1.1);7.4031(2.0);7.3858(1.0);4.0173(16.0);3.8176(1.0);3.7992(3.4);3.7807(3.4);3.7623(1.1);3.3225(20.0);2.6725(0.3);2.5070(49.2);2.5032(60.6);2.3299(0.4);2.0757(0.7);1.2552(3.6);1.2368(7.8);1.2184(3.5);-0.0002(11.1)
I-3	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2740(4.4);8.3147(1.1);8.2989(4.6);7.4156(4.0);3.9479(16.0);3.5601(1.2);3.5418(3.5);3.5234(3.6);3.5052(1.1);3.3904(0.4);3.3798(0.4);3.3185(513.6);3.2795(0.5);2.8921(0.4);2.7949(12.6);2.7312(0.6);2.6868(14.8);2.6747(4.5);2.6706(5.5);2.6185(0.5);2.5884(0.7);2.5057(66.1.2);2.5014(891.6);2.4972(678.3);2.3327(3.9);2.3282(5.2);1.1920(3.7);1.1738(8.1);1.1553(3.6);0.1464(3.7);0.0080(34.3);0.0000(771.2);-0.1491(3.6)
I-2	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5112(2.3);9.5082(2.3);9.4947(2.2);9.2867(4.7);9.0394(2.7);9.0324(2.4);8.3211(5.2);8.2531(0.7);7.5866(1.9);7.5763(2.2);7.5687(1.8);7.5585(1.7);7.0853(0.6);6.6784(0.5);4.0249(0.5);3.9737(16.0);3.5823(1.6);3.5643(4.0);3.5460(3.9);3.5271(1.5);3.3213(556.4);3.1258(2.0);2.6708(6.3);2.5049(951.8);2.5015(1007.1);2.3934(0.5);2.3282(5.7);1.2747(0.7);1.2565(1.3);1.2380(1.6);1.2149(4.5);1.1962(8.5);1.1773(3.9);1.1475(0.4);1.1075(0.4);0.1459(2.5);-0.0001(490.0);-0.0704(0.5);-0.0854(0.4);-0.1503(2.4)
I-1	¹ H-NMR(601.6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 19.9774(0.9);9.2980(3.3);9.0762(1.8);9.0647(1.8);8.3235(3.5);8.1818(1.6);8.1669(1.8);7.8018(1.0);7.7886(1.2);7.7739(1.0);7.4144(0.9);7.4049(1.7);7.4027(1.7);7.3933(0.9);4.1021(16.0);3.7611(0.9);3.7490(3.1);3.7368(3.1);3.7246(1.0);3.3031(85.0);2.6120(1.2);2.5213(2.1);2.5182(2.6);2.5152(2.5);2.5063(72.5);2.5033(157.6);2.5003(220.8);2.4973(157.9);2.4943(72.6);2.3846(1.3);1.2398(3.2);1.2275(7.5);1.2152(3.4);0.0964(1.0);0.0052(6.8);-0.0002(239.8);-0.0057(8.0);-0.1000(1.0)
I-11	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9647(2.1);8.9471(2.1);8.9039(2.4);8.9008(2.5);8.7035(2.5);8.6999(2.5);7.9510(2.5);7.2583(1.5);7.2538(1.5);7.2404(1.5);7.2361(1.5);3.9929(16.0);3.7771(0.9);3.7587(3.2);3.7403(3.2);3.7221(1.0);3.3214(27.5);2.6718(0.4);2.5235(11.1);2.5071(50.0);2.5028(65.1);2.4984(48.2);2.3296(0.4);2.0754(2.0);1.2505(3.4);1.2321(7.8);1.2137(3.3);0.0077(0.4);-0.0002(8.4)
I-12	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.5596(3.6);9.3093(4.4);8.3448(4.9);8.3286(1.5);8.2191(1.1);8.1956(3.8);8.1801(2.8);8.1776(2.9);8.1567(0.8);8.1540(0.9);7.8180(1.4);4.4510(0.9);4.1280(16.0);3.8146(1.0);3.7961(3.3);3.7777(3.4);3.7594(1.1);3.3211(38.1);2.6713(0.5);2.6672(0.4);2.5065(68.7);2.5024(90.9);2.4981(69.0);2.3332(0.4);2.3290(0.5);2.0749(0.8);1.2582(3.5);1.2399(7.9);1.2215(3.6);0.0000(64.4)
I-13	¹ H-NMR(400 MHz, D ₆ -DMSO) δ ppm: 1,24 (t, 3H), 3,80 (q, 2H), 4,12 (s, 3H), 8,02 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 9,31 (s, 1H), 10,00 (s, 1H).

10

20

30

40

【 0 3 3 1 】

使用例

ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) - 噴霧試験 ; O P - 抵抗性

溶媒 : アセトン 7 8 . 0 重量部

ジメチルホルムアミド 1 . 5 重量部

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分 1 重量部を指定重量部の溶媒で溶解させ、所望の濃度まで、乳化剤を濃度 1 0 0 0 p p m で含む水を追加する。さらなる試験濃縮液を製造するため、その製剤を、乳化剤含有水で希釈する。

50

【0332】

全ての成育段階のナミハダニ (*greenhouse red spider mite*) (*Tetranychus urticae*) が発生しているマメ葉 (インゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*)) の円板に、所望の濃度の有効成分製剤を噴霧する。

【0333】

6日後、効力 (%) を求める。100% は、全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全くなかったことを意味する。

【0334】

この試験では例えば、製造例からの次の化合物：I-2 が、施用量 20 g / ha で 90 % の効力を示す。

【0335】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験

溶媒：アセトン 78 重量部

ジメチルホルムアミド 1.5 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分 1 重量部を指定重量部の溶媒で溶解させ、所望の濃度まで、乳化剤を濃度 1000 ppm で含む水を追加する。さらなる試験濃縮液を製造するため、その製剤を、乳化剤含有水で希釈する。

【0336】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ葉 (*Brassica pekinensis*) の円板に、所望濃度の有効成分製剤を噴霧する。

【0337】

5日後に、効力 (%) を求める。100% は、全てのアブラムシが死んでいることを意味し、0% は死んだアブラムシがなかったことを意味する。

【0338】

この試験では例えば、製造例からの次の化合物：I-1、I-3 が、施用量 100 g / ha で 100% の効力を示す。

【0339】

この試験では例えば、製造例からの次の化合物：I-2、I-4、I-6 が、施用量 100 g / ha で 90% の効力を示す。

【0340】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 経口試験

溶媒：アセトン 100 重量部

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分 1 重量部を指定重量部の溶媒で溶解させ、所望の濃度まで水を追加する。

【0341】

有効成分調製液 50 μ L をマイクロタイタープレートに移し、IPL41 昆虫培地 (3% + 15% 砂糖) 150 μ L を加えて最終体積 200 μ L とする。次に、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*) の混合群はそのパラフィルムを刺して、その溶液を飲むことができる。

【0342】

5日後に、効力 (%) を求める。100% は、全てのアブラムシが死んでいることを意味し、0% は死んだアブラムシがなかったことを意味する。

【0343】

この試験では例えば、製造例からの次の化合物：I-1、I-2、I-3 が、施用量 20 ppm で 100% の効力を示す。

【0344】

この試験では例えば、製造例からの次の化合物：I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6が、施用量4 ppmで100%の効力を示す。

【0345】

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

溶媒：アセトン78.0重量部

ジメチルホルムアミド1.5重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分1重量部を指定重量部の溶媒で溶解させ、所望の濃度まで、乳化剤を濃度1000 ppmで含む水を追加する。さらなる試験濃縮液を製造するため、その製剤を、乳化剤含有水で希釈する。

10

【0346】

ハクサイ葉 (Brassica pekinensis) の円板に、所望濃度の有効成分製剤を噴霧し、乾燥後にマスタードビートル (mustard beetle) (Phaedon cochleariae) の幼虫を付ける。

【0347】

7日後に、効力(%)を求める。100%は、全てのビートル幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだビートル幼虫が全くなかったことを意味する。

【0348】

この試験では例えば、製造例からの次の化合物：I-4、I-5、I-6が、施用量100 g/haで100%の効力を示す。

20

【0349】

ヨトウガ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験

溶媒：アセトン78.0重量部

ジメチルホルムアミド1.5重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分1重量部を指定重量部の溶媒で溶解させ、所望の濃度まで、乳化剤を濃度1000 ppmで含む水を追加する。さらなる試験濃縮液を製造するため、その製剤を、乳化剤含有水で希釈する。

【0350】

トウモロコシ (Zea mays) の葉片に、所望の濃度の有効成分製剤を噴霧し、乾燥後に、アワヨトウ (Spodoptera frugiperda) の毛虫を付ける。

30

【0351】

7日後に、効力(%)を求める。100%は、全ての毛虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ毛虫が全くなかったことを意味する。

【0352】

この試験では例えば、製造例からの次の化合物：I-4、I-5、I-6が、施用量100 g/haで100%の効力を示す。

【0353】

ネコノミ (Ctenocephalides felis) - ネコノミ成体によるイン・ビトロ接触試験

40

試験管をコーティングするため、最初に、有効成分9 mgをアセトンp.a. 1 mLに溶かし、次にアセトンp.a. で希釈して所望の濃度とする。その溶液250 µLを、オービタルシェーカーでの回転及び揺動 (30 rpmで2時間揺動回転) によって25 mLガラス管の内壁及び底部に均一に分布させる。900 ppmの有効成分溶液及び内表面積44.7 cm²で、均一分布と仮定すると、5 µg/cm²の面積基準用量が達成される。

【0354】

溶媒を留去した後、試験管にネコノミ (Ctenocephalides felis) 成体5から10匹を付け、有孔プラスチック蓋で密閉し、室温及び環境湿度で水平位でインキュベートする。48時間後、効力を求める。このために、管を直立させ、ノミを試験管の底にたたき落とす。底部で動かないままのノミ又は動きがぎこちないノミは、死ん

50

でいるか瀕死状態であると考えられる。

【0355】

施用量 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ で本試験において少なくとも80%の効力が達成された場合、物質はネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対して良好な効力を示す。100%効力は、全てのノミが死亡しているか瀕死状態であったことを意味する。0%効力は、害を受けたノミが全くなかったことを意味する。

【0356】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：I-1、I-4が、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($500 \text{ g}/\text{ha}$) の施用量で、100%の効力を示す。

【0357】

オウシマダニ (*Boophilus microplus*) - 注入試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分10mgを溶媒0.5mLと混合し、その濃縮液を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0358】

吸血した成体雌オウシマダニ (*Boophilus microplus*) 5匹の腹部に、有効成分溶液 $1 \mu\text{L}$ を注入する。動物をシャーレに移し入れ、人工気象室 (climate-controlled room) 中で維持する。

【0359】

7日後、受精卵の産卵によって効力を評価する。肉眼では受精卵に見えない卵は、約42日後の幼虫孵化まで人工気象室内に保存する。100%効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが全くなかったことを意味し、0%は、全ての卵が受精卵であることを意味する。

【0360】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：I-3が、 $20 \mu\text{g}/\text{動物の施用量}$ で、100%の効力を示す。

【0361】

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - 経口試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分10mgをジメチルスルホキシド0.5mLと混合する。クエン酸塩添加ウシ血液で希釈して、所望の濃度を得る。

【0362】

飢餓状態のネコノミ (*Ctenocephalides felis*) 成体約20をチャンバに入れ、その頂部及び底部をガーゼで閉じる。底がパラフィルムで閉じられた金属シリンダーをチャンバに入れる。そのシリンダーには、血液/有効成分製剤が入っており、それをノミがパラフィルム膜を介して吸うことができる。

【0363】

2日後、死亡率(%)を求める。100%は、全てのノミが死んでおり、0%は死んだノミが全くなかったことを意味する。

【0364】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：I-1、I-3が、100ppmの施用量で、100%の効力を示す。

【0365】

ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) 試験

溶媒：ジメチルスルホキシド

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分10mgをジメチルスルホキシド0.5mLと混合し、濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0366】

ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) のL1幼虫約20匹を、馬肉ミンチ及び所望の濃度の有効成分製剤を含む試験容器に移し入れる。

【0367】

10

20

30

40

50

2日後、死亡率(%)を求める。100%は、全ての幼虫が死んでおり、0%は死んだ幼虫が全くなかったことを意味する。

【0368】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：I-1、I-4が、100ppmの施用量で、100%の効力を示す。

【0369】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：I-3が、100ppmの施用量で、97%の効力を示す。

【0370】

イエバエ(Musca domestica)試験

10

溶媒：ジメチルスルホキシド

好適な有効成分製剤を製造するため、有効成分10mgをジメチルスルホキシド0.5mLと混合し、濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0371】

砂糖溶液及び所望の濃度の有効成分製剤で処理したスポンジの入った容器に、イエバエ成体(Musca domestica)10匹を付ける。

【0372】

2日後、死亡率(%)を求める。100%は、全てのハエが死んでおり、0%は死んだハエが全くなかったことを意味する。

【0373】

20

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：I-4が、100ppmの施用量で、90%の効力を示す。

30

40

50

フロントページの続き

- 弁理士 金山 賢教
(74)代理人 100124855
- 弁理士 坪倉 道明
(74)代理人 100129713
- 弁理士 重森 一輝
(74)代理人 100137213
- 弁理士 安藤 健司
(74)代理人 100143823
- 弁理士 市川 英彦
(74)代理人 100151448
- 弁理士 青木 孝博
(74)代理人 100183519
- 弁理士 櫻田 芳恵
(74)代理人 100196483
- 弁理士 川寄 洋祐
(74)代理人 100203035
- 弁理士 五味淵 琢也
(74)代理人 100185959
- 弁理士 今藤 敏和
(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 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、ツー・デン・フースフェレン・2 3
- (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、ロッテンシュトラッセ・1 0
- (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 カウシュービーズ, ニーナ
ドイツ国、5 1 4 6 7・ベルギッシュ・グラートバッハ、イルレンフェルダー・ヴェーク・3 8 アー
- (72)発明者 モスリン, マルク
ドイツ国、5 0 9 3 5・ケルン、バッヘマー・シュトラッセ・3 4 1アー
- (72)発明者 ヴィルケ, デイビッド
ドイツ国、4 0 2 3 5・デュッセルドルフ、デガーシュトラッセ・4
- (72)発明者 ウィロット, マシュー
ドイツ国、4 0 2 1 5・デュッセルドルフ、ヤーンシュトラッセ・1 5
- (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 ゲルゲンス, ウルリッヒ
ドイツ国、4 0 8 8 2・ラーティンゲン、フェスター・シュトラッセ・3 7
- (72)発明者 ツベルグ, アンドレアス

ドイツ国、4 2 7 8 1・ハーン、シンターシュトラセ・8 6

審査官 伊佐地 公美

- (56)参考文献 国際公開第2016/129684 (WO, A1)
特表2011-510061 (JP, A)
国際公開第2017/061497 (WO, A1)
国際公開第2017/155103 (WO, A1)
- (58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)
C07D
A01N
A01P
Caplus/REGISTRY (STN)