

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6899817号

(P6899817)

(45) 発行日 令和3年7月7日 (2021. 7. 7)

(24) 登録日 令和3年6月17日 (2021. 6. 17)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 231/12 (2006. 01)

C O 7 D 231/12 C S P C

C O 7 D 249/06 (2006. 01)

C O 7 D 249/06 5 O 1

A O 1 P 7/02 (2006. 01)

A O 1 P 7/02

A O 1 P 7/04 (2006. 01)

A O 1 P 7/04

A O 1 N 43/56 (2006. 01)

A O 1 N 43/56

D

請求項の数 10 (全 184 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2018-506606 (P2018-506606)
 (86) (22) 出願日 平成28年8月11日 (2016. 8. 11)
 (65) 公表番号 特表2018-526353 (P2018-526353A)
 (43) 公表日 平成30年9月13日 (2018. 9. 13)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2016/069110
 (87) 国際公開番号 W02017/025590
 (87) 国際公開日 平成29年2月16日 (2017. 2. 16)
 審査請求日 令和1年8月7日 (2019. 8. 7)
 (31) 優先権主張番号 15180925. 8
 (32) 優先日 平成27年8月13日 (2015. 8. 13)
 (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・ノベラー・シュト
 ラーセ・5 0
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 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

最終頁に続く

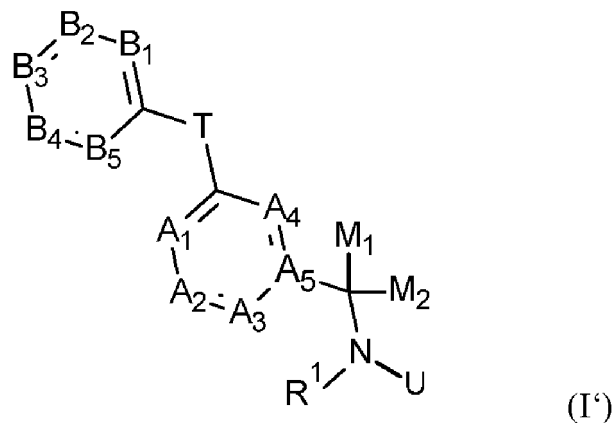
(54) 【発明の名称】 節足動物を防除するのに適しているピロール、ジアゾール、トリアゾール又はテトラゾールの誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I')

【化 1】



[式中、

Uは、 $-C(=W)-Q$ 又は $-SO_2-Q$ であり；

R^1 は、Hであるか、又は置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルであり；

部分構造は以下の通りであり；

A_1 は、 CR^2 であり；

A_2 は、 CR^3 であり；

A_3 は、 CR^4 であり；

A_4 は、 CR^5 であり；

A_5 は、Cであり；

B_1 は、 CR^6 であり；

B_2 は、 CR^7 であり；

B_3 は、 CR^8 であり；

B_4 は、 CR^9 であり；及び、

B_5 は、 CR^{10} であり；

M_1 、 M_2 は、それぞれ独立して、Hであるか、又は置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルであり；

R^2 、 R^3 、 R^5 は、それぞれ独立して、Hであり；

R^4 は、H又はハロゲンであり；

R^6 及び R^{10} は、それぞれ独立して、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル若しくはハロゲンで置換されている C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ若しくはハロゲンで置換されている C_1-C_6 -アルコキシであり；

R^7 及び R^9 は、それぞれ独立して、Hであり；

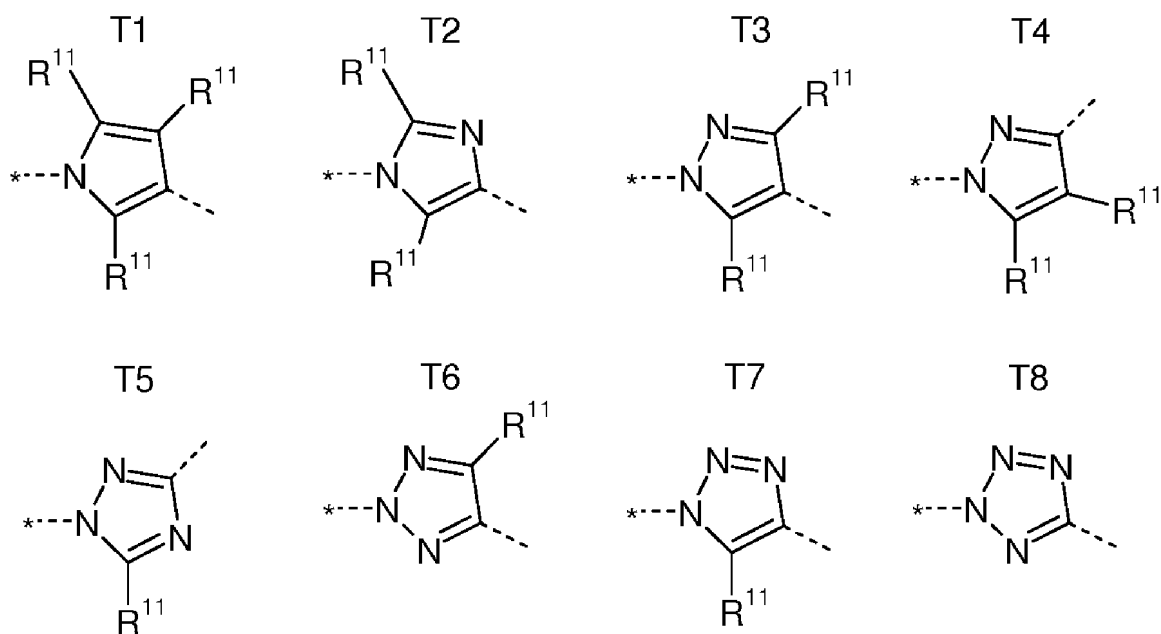
R^8 は、ハロゲン化 C_1-C_6 -アルキルであり；

Wは、O又はSであり；

Qは、いずれの場合にも独立してハロゲン及びシアノから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル若しくは C_3-C_6 -シクロアルキルであるか；又は、独立してハロゲン及びシアノから選択される1以上の置換基で置換されていてもよいフェニル若しくはピリジルから選択される6員芳香族環であり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1-T8：

【化2】



[ここで、環($C-B_1-B_2-B_3-B_4-B_5$)への結合は星印で示されている]

のうちの1つであり；

ここで、 $R^{1,1}$ は、独立して、Hであるか、又は、ハロゲン化されていてもよい C_{1-6} -アルキルであるか、又は、ハロゲンである〕
で表される化合物。

【請求項2】

Tにおける $R^{1,1}$ がHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

TがT2、T3又はT7である、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

TがT3である、請求項1から3のいずれか1項に記載の化合物。

10

【請求項5】

R^4 がH又はハロゲンである、請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

R^4 がF又はC1である、請求項1から5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

R^4 がFである、請求項1から6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

R^1 がHであり、及び、WがOである、請求項1から7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

20

殺虫剤組成物であって、請求項1～8のいずれか1項に記載されている式(I')で表される少なくとも1種類の化合物並びに増量剤及び／又は界面活性物質を含んでいる、前記殺虫剤組成物。

【請求項10】

害虫を防除するための、請求項1～8のいずれか1項に記載されている化合物又は請求項9に記載されている殺虫剤組成物の使用、ただし、人間への使用を除く。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

【0001】 本出願は、新規化合物、それらを調製する方法、及び、害虫(animal pest)（特に、節足動物、とりわけ、昆虫類、クモ形類動物及び線虫類）を防除するためのそれらの使用に関する。

30

【背景技術】

【0002】

【0002】 ハロゲンで置換されている特定の化合物が殺虫活性を有することは知られている(EP1911751、WO2012/069366、WO2012/080376、WO2012/107434、及び、WO2012/175474)。

【0003】

【0003】 WO2011/113756には、殺虫活性を有するトリアゾール誘導体が開示されている。

40

【0004】

【0004】 さらに、ハロゲンで置換されている特定の化合物がサイトカイン阻害活性を有することも知られている(WO2000/07980)。

【0005】

【0005】 現代の作物保護組成物は、例えば、それらの作用のレベル、作用の持続期間及び作用の範囲並びに可能性のある用途などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。毒性の問題及び別の活性成分又は製剤助剤との組合せ可能性についての問題は、活性成分の合成に関わる費用及び複雑さの問題と同様に、ある種の役割を果たす。さらに、抵抗性も生じ得る。これら全ての理由により、新規作物保護剤の探求は、決して完結したものとは考えることはできず、既知化合物と比較して少なくとも個々の態様に関して改

50

善されている特性を有する新規化合物が絶えず求められている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0006】

【特許文献1】 欧州特許出願公開第1911751号

【特許文献2】 国際特許出願公開第2012/069366号

【特許文献3】 国際特許出願公開第2012/080376号

【特許文献4】 国際特許出願公開第2012/107434号

【特許文献5】 国際特許出願公開第2012/175474号

【特許文献6】 国際特許出願公開第2011/113756号

10

【特許文献7】 国際特許出願公開第2000/07980号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

【0006】 本発明の目的は、さまざまな局面において殺有害生物剤のスペクトルを拡大する化合物を提供すること及び／又はそれらの活性を向上させることであつた。

【課題を解決するための手段】

【0008】

【0007】 驚くべきことに、ハロゲンで置換されている特定の化合物及びその塩が生物学的特性を有していて、害虫を防除するのに特に適しているということ、従って、農薬分野及び動物衛生の分野において特に優れた有用性を有しているということが分かった。

20

【0009】

【0008】 類似した化合物は、WO2010/051926から既に知られている。

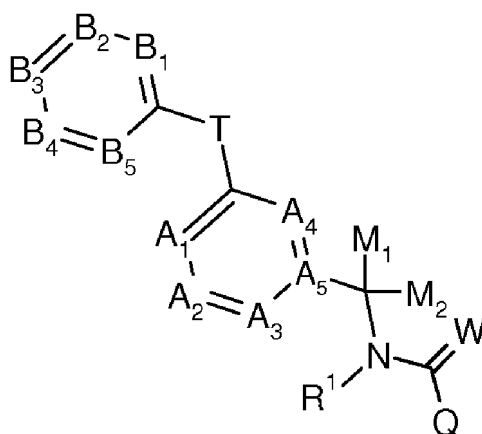
【0010】

概要

【0009】 本発明の1態様は、一般式(I)

【化1】

30



(I)

40

【0011】

〔式中、

R^1 は、Hであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり；又は、

50

R^1 は、Hであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル (C_1-C_3)-アルキル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり；

部分構造は以下の通りであり；

A_1 は、 CR^2 又はNであり；

A_2 は、 CR^3 又はNであり；

A_3 は、 CR^4 又はNであり；

A_4 は、 CR^5 又はNであり；

A_5 は、Cであり；

B_1 は、 CR^6 又はNであり；

B_2 は、 CR^7 又はNであり；

B_3 は、 CR^8 又はNであり；

B_4 は、 CR^9 又はNであり；及び、

B_5 は、 CR^{10} 又はNであり；

しかしながら、ここで、 $A_1 \sim A_4$ 部分構造うちの4以上はNではなく、及び、 $B_1 \sim B_5$ 部分構造うちの4以上は同時にNではなく；

M_1 、 M_2 は、それぞれ独立して、Hであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり；又は、

M_1 と M_2 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、置換されていてもよい3員、4員、5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでいてもよい）を形成し；又は、

M_1 又は M_2 は、 A_3 の R^4 、 A_3 の炭素原子及び A_5 と一緒に、5員又は6員の環（ここで、該環は、F、Cl、Br、I、 C_1-C_3 -アルキルで置換されていてもよく、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでいてもよい）を形成し；

R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 及び R^{10} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ若しくはN、 N -ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり；

A_2 部分構造と A_3 部分構造のいずれもNではない場合、 R^3 と R^4 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる5員又は6員の環を形成することができ；又は、

A_1 部分構造と A_2 部分構造のいずれもNではない場合、 R^2 と R^3 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、0個、1個又は2個の窒素原子を含んでいる6員環を形成することができ；

R^8 は、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ若しくはN、 N -ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり；又は、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよいC

10

20

30

40

50

C_1-C_6 -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_6) アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_6$ -アルキルアミノ若しくはN、 N -ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノであり；

Wは、O又はSであり；

Qは、H、ホルミル、ヒドロキシル、アミノであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_5 -ヘテロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -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_6 -アルキル、 C_6 -アリール、 $C_{10}-C_{14}$ -アリール、 C_1-C_5 -ヘテロアリール、 C_6 -アリール- (C_1-C_3)-アルキル、 C_{10} -アリール- (C_1-C_3)-アルキル、 C_{14} -アリール- (C_1-C_3)-アルキル、 C_1-C_5 -ヘテロアリール- (C_1-C_3)-アルキル、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ、 $N-C_1-C_4$ -アルキルカルボニルアミノ若しくはN、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであり；又は、

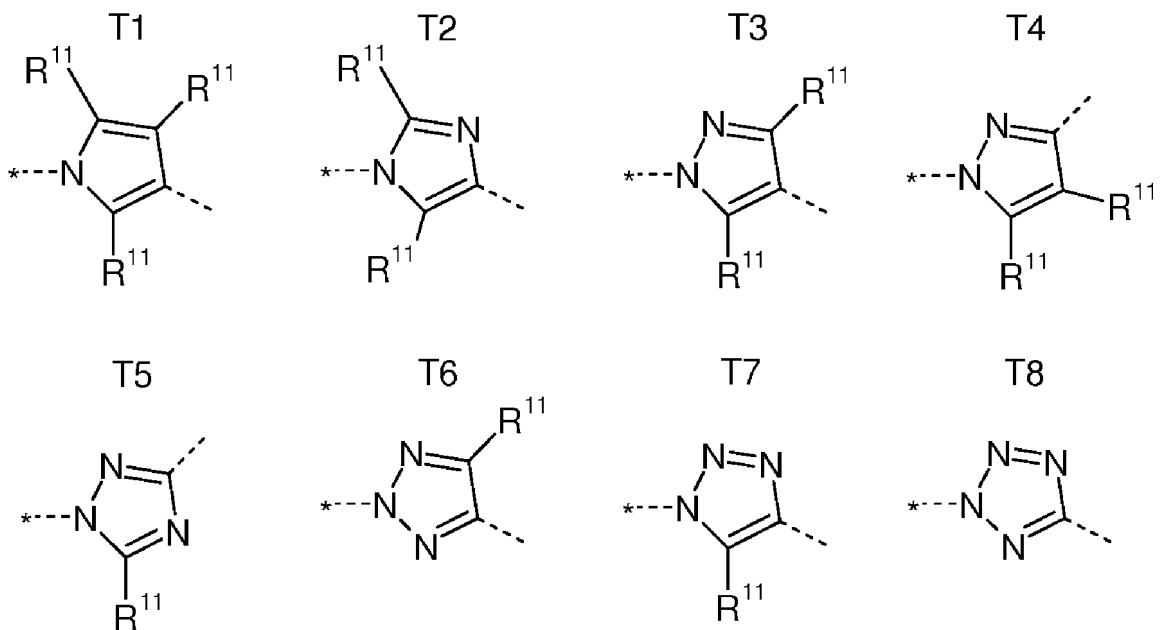
Vで多置換されていてもよい不飽和の6員炭素環であり；又は、

Vで多置換されていてもよい不飽和の4員、5員又は6員のヘテロ環式環であり；ここで、

Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルキニル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 $N-C_1-C_6$ -アルコキシイミノ- C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルスルファニル、 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若しくはN、 N -ジ- (C_1-C_6 -アルキル) アミノであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T1-T8：

【化2】



【0012】

[ここで、環 ($C-B_1-B_2-B_3-B_4-B_5$) への結合には星印*が付けられている]

のうちの1つであり；

ここで、 R^{11} は、いずれの場合にも独立して、Hであるか、又は、ハロゲン化されていてもよい C_1-C_6 -アルキルであるか、又は、ハロゲンである〕で表される化合物並びに式(I)で表される化合物の塩、N-オキシド及び互変異性体形態に関する。

【0013】

【0010】 本発明の好ましい実施形態は、段落【0009】に記載されている化合物〔ここで、Tにおける R^{11} は、Hである〕に関する。

【0014】

【0011】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】又は【0010】に記載されている化合物〔ここで、Tは、T₂、T₃又はT₇である〕に関する。

10

【0015】

【0012】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0011】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、 A_1 は CR^2 であり、 A_2 は CR^3 であり、 A_3 は CR^4 であり、 A_4 は CR^5 であり、 A_5 はCであり、及び、 R^2 、 R^3 及び R^5 はいずれの場合にもHである〕に関する。

【0016】

【0013】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0012】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、 A_1 は CR^2 であり、 A_2 はNであり、 A_3 は CR^4 であり、 A_4 は CR^5 であり、 A_5 はCであり、及び、 R^2 、 R^3 及び R^5 はいずれの場合にもHである〕に関する。

20

【0017】

【0014】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0013】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、 B_1 は CR^6 であり、 B_2 は CR^7 であり、 B_3 は CR^8 であり、 B_4 は CR^9 であり、及び、 B_5 は CR^{10} である〕に関する。

【0018】

【0015】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0014】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、 B_3 は CR^8 であり、及び、 R^8 はハロゲン化 C_1-C_6 -アルキルであり、及び、 B_2 は CR^7 であり、及び、 B_4 は CR^9 であり、及び、 R^7 及び R^9 はそれぞれHである〕に関する。

30

【0019】

【0016】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0015】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、 B_1 は CR^6 であり、及び、 B_5 は CR^{10} であり、及び、 R^6 及び R^{10} はそれぞれ場合により独立して、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル又はハロゲンで置換されている C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ又はハロゲンで置換されている C_1-C_6 -アルコキシである〕に関する。

【0020】

【0017】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0016】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、 A_3 は CR^4 であり、及び、 R^4 はH、ハロゲン（好ましくは、F又はCl、さらに好ましくは、F）であり、又は、 R^4 は CR^4 の炭素原子と A_5 とC-M₁若しくはC-M₂と一緒に5員若しくは6員の環（ここで、該環は、F、Cl、Br、I、 C_1-C_3 -アルキルで置換されていてもよく、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでもよい）を形成し、さらに好ましくは、5員炭素環を形成する〕に関する。

40

【0021】

【0018】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0017】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、M₁及びM₂は、それぞれ独立して、H又は C_1-C_6 -アルキルであり、さらに好ましくはHであり、又は、C-M₁若しくはC-M₂は CR^4 及び A_5 と一緒に5員若しくは6員の環（ここで、該環は、F、Cl、

50

Br、I、C₁－C₃－アルキルで置換されていてもよく、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでいてもよい）を形成し、さらに好ましくは、5員炭素環を形成する〕に関する。好ましくは、C－M₁又はC－M₂がCR⁴及びA₅と環を形成する場合、残りのMは、いずれの場合にも（M₂が環形成に関与している場合はM₁、又は、M₁が環形成に関与している場合はM₂）、Hである。

【0022】

【0019】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0018】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、R¹はHであり、及び、WはOである〕に関する。

10

【0023】

【0020】 本発明の好ましいさらなる実施形態は、段落【0009】～【0019】のいずれかに記載されている化合物〔ここで、Qは、いずれの場合にも独立してハロゲン、シアノで置換されていてもよいC₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキルであるか；又は、独立してハロゲン、シアノで置換されていてもよいフェニル又はピリジルから選択される6員芳香族環である〕に関する。

【0024】

【0021】 さらに態様は、段落【0009】～【0020】のいずれかに記載されている式（I）で表される少なくとも1種類の化合物並びに増量剤及び／又は界面活性物質を含んでいる殺虫剤組成物に関する。

20

【0025】

【0022】 さらに態様は、トランスジェニック種子又は従来の種子、及び、それらの種子から生じた植物を、害虫による侵襲から保護する方法に関し、ここで、該方法は、該種子を段落【0009】～【0020】のいずれかに記載されている少なくとも1種類の化合物で処理することを特徴とする。

【0026】

【0023】 さらに態様は、害虫を防除するための、段落【0009】～【0020】のいずれかに記載されている化合物又は段落【0021】に記載されている殺虫剤組成物の使用に関する。

【0027】

30

【0024】 さらに態様は、種子に関し、ここで、該種子には、段落【0009】～【0020】のいずれかに記載されている化合物が、コーティングの成分として、又は、コーティングに加えられた1又は複数のさらなる層として、施用されている。

【0028】

【0025】 さらに態様は、除草剤としての、段落【0009】～【0020】のいずれかに記載されている式（I）で表される化合物の使用に関する。

【発明を実施するための形態】

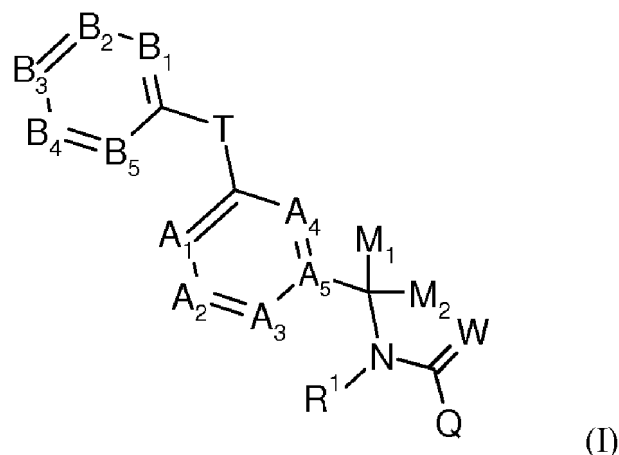
【0029】

本発明による化合物の実施形態

【0026】 一般式（I）で表される、殺虫活性、殺ダニ活性及び／又は殺寄生生物活性を有する新規ハロゲン置換化合物、並びに、式（I）で表される化合物の塩、N－オキシド及び互変異性体形態が見いだされた：

40

【化 3】



10

【0030】

上記式中、

R^1 は、Hであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1 - C_3) -アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3) -アルキルであり；又は、

20

R^1 は、Hであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル (C_1-C_3) -アルキル、アリール (C_1-C_3) -アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3) -アルキルであり；

部分構造は以下の通りであり：

A_1 は、 CR^2 又はNであり；

A_2 は、 CR^3 又はNであり；

A_3 は、 CR^4 又はNであり；

A_4 は、 CR^5 又はNであり；

A_5 は、Cであり；

B_1 は、 CR^6 又はNであり；

B_2 は、 CR^7 又はNであり；

B_3 は、 CR^8 又はNであり；

B_4 は、 CR^9 又はNであり；及び、

B_5 は、 CR^{10} 又はNであり；

30

しかしながら、ここで、 $A_1 \sim A_4$ 部分構造うちの4以上はNではなく、及び、 $B_1 \sim B_5$ 部分構造うちの4以上は同時にNではなく；

M_1 、 M_2 は、それぞれ独立して、Hであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_7 -シクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_1-C_3) -アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3) -アルキルであり；又は、

40

M_1 と M_2 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、置換されていてよい3員、4員、5員又は6員の環（ここで、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでいてもよい）を形成し；又は、

M_1 又は M_2 は、 A_3 の R^4 、 A_3 の炭素原子、 A_5 及びDと一緒に、5員又は6員の環（ここで、該環は、 R^6 で置換されていてよく、好ましくは、F、Cl、Br、I、

50

C₁－C₃－アルキルで置換されていてもよく、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでいてもよい）を形成し；

R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁹及びR¹⁰は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよいC₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－アルコキシ、N－C₁－C₆－アルコキシイミノ－C₁－C₃－アルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニル、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニル、N－C₁－C₆－アルキルアミノ若しくはN、N－ジ－C₁－C₆－アルキルアミノであり；

A₂部分構造とA₃部分構造のいずれもNではない場合、R³とR⁴は、それらが結合している炭素原子と一緒に、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個若しくは1個の酸素原子及び／又は0個若しくは1個の硫黄原子を含んでいる5員又は6員の環を形成することができ；又は、

A₁部分構造とA₂部分構造のいずれもNではない場合、R²とR³は、それらが結合している炭素原子と一緒に、0個、1個又は2個の窒素原子を含んでいる6員環を形成することができ；

R⁸は、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよいC₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－アルコキシ、N－C₁－C₆－アルコキシイミノ－C₁－C₃－アルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニル、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニル、N－C₁－C₆－アルキルアミノ若しくはN、N－ジ－C₁－C₆－アルキルアミノであり；又は、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよいC₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル（C₁－C₆）アルキル、C₁－C₆－アルコキシ、N－C₁－C₆－アルコキシイミノ－C₁－C₃－アルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニル、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニル、N－C₁－C₆－アルキルアミノ若しくはN、N－ジ－C₁－C₆－アルキルアミノであり；

Wは、O又はSであり；

Qは、H、ホルミル、ヒドロキシル、アミノであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい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－C₅－ヘテロシクロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₆－アルキル－C₃－C₆－シクロアルキル、C₃－C₆－シクロアルキル－C₁－C₆－アルキル、C₆－アリール、C₁₀－C₁₄－アリール、C₁－C₅－ヘテロアリール、C₆－アリール－（C₁－C₃）－アルキル、C₁₀－アリール－（C₁－C₃）－アルキル、C₁₄－アリール－（C₁－C₃）－アルキル、C₁－C₅－ヘテロアリール－（C₁－C₃）－アルキル、N－C₁－C₄－アルキルアミノ、N－C₁－C₄－アルキルカルボニルアミノ若しくはN、N－ジ－C₁－C₄－アルキルアミノであり；又は、

Vで多置換されていてもよい不飽和の6員炭素環であり；又は、

Vで多置換されていてもよい不飽和の4員、5員又は6員のヘテロ環式環であり；ここで、

Vは、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよいC₁－C₆－アルキル、C₁－C₄－アルケニル、C₁－C₄－アルキニル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－アルコキシ、N－C₁－C₆－アルコキシイミノ－C₁－C₃－アルキル、C₁－C₆－アルキルスルファニル、C₁－C₆－アルキルスルフィニル、C₁－C₆－アルキルスルホニル若しくはN、N－ジ－（C₁－C₆－アルキル）アミノであり；

Tは、以下に示されている5員ヘテロ芳香族系T₁－T₈：

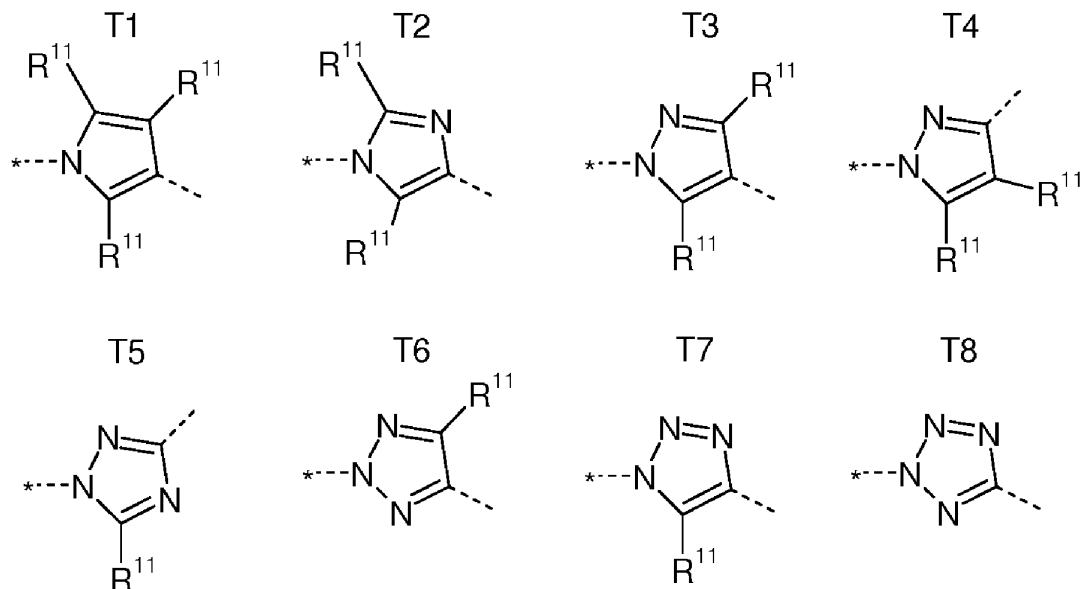
10

20

30

40

【化 4】



【0031】

〔ここで、環 (C-B₁-B₂-B₃-B₄-B₅) への結合は星印で示されている〕
 のうちの1つであり；

ここで、R¹¹ は、いずれの場合にも独立して、Hであるか、又は、ハロゲン化されていてもよいC₁-C₆-アルキルであるか、又は、ハロゲンである。

【0032】

R¹¹

〔0027〕 好ましいのは、化合物〔ここで、TにおけるR¹¹ は、Hである〕である。

【0033】

T

〔0028〕 好ましいのは、式 (I) 〔式中、Tは、T3又はT4であり、特に好ましくは、T3である〕で表される化合物である。

【0034】

〔0029〕 好ましいのは、式 (I) 〔式中、Tは、T3又はT4であり、特に好ましくは、T3であり、及び、TにおけるR⁶ は、いずれの場合にもHである〕で表される化合物である。

【0035】

〔0030〕 好ましいのは、さらにまた、化合物〔ここで、TはT1である〕である。

【0036】

〔0031〕 好ましいのは、式 (I) 〔式中、TはT1であり、T1におけるR¹¹ は、いずれの場合にもHである〕で表される化合物である。

【0037】

〔0032〕 好ましいのは、さらにまた、化合物〔ここで、Tは、T2である〕である。

【0038】

〔0033〕 好ましいのは、式 (I) 〔式中、TはT2であり、T2におけるR¹¹ は、いずれの場合にもHである〕で表される化合物である。好ましくは、B₁ はC-R⁶ であり、B₅ はC-R¹⁰ であり、B₃ はC-R⁸ であり、R⁸ はヘプタフルオロイソプロピルであり、B₂、B₄、A₁、A₂ 及びA₄ はCHであり、M₁ 及びM₂ はHであり、

20

30

40

50

WはOであり、 R^6 はハロゲン（好ましくは、Cl又はF、さらに好ましくは、Cl）であり、 R^{10} はハロゲン（好ましくは、Cl又はF、さらに好ましくは、Cl）であり、 A_3 はC- R^4 であり、 R^4 はハロゲン（好ましくは、F又はCl、さらに好ましくは、F）又は C_1-C_3 -アルキル（好ましくは、メチル）であり、 R^{11} はいずれの場合にもHであり、及び、Qは C_1-C_3 -アルキル（好ましくは、メチル又はエチル）又は C_3-C_4 -シクロアルキル（好ましくは、シクロプロピル）である。

【0039】

【0034】 好ましいのは、式（I）〔式中、Tは、T5、T6又はT7であり、特に好ましくは、T7である〕で表される化合物である。

【0040】

【0035】 好ましいのは、式（I）〔式中、Tは、T5、T6又はT7であり、特に好ましくは、T7であり、及び、T5、T6又はT7における R'' は、いずれの場合にもHである〕で表される化合物である。好ましくは、TはT7であり、 B_1 はC- R^6 であり、 B_5 はC- R^{10} であり、 B_3 はC- R^8 であり、 R^8 はヘプタフルオロイソプロピルであり、 B_2 、 B_4 、 A_1 、 A_2 及び A_4 はCHであり、 M_1 及び M_2 はHであり、 R^{11} はHであり、WはOであり、 R^6 はハロゲン（好ましくは、Cl又はF、さらに好ましくは、Cl）であり、 R^{10} はハロゲン（好ましくは、Cl又はF、さらに好ましくは、Cl）であり、 A_3 はC- R^4 であり、 R^4 はハロゲン（好ましくは、F又はCl、さらに好ましくは、Cl）であり、及び、Qは C_1-C_3 -アルキル（好ましくは、メチル又はエチル）又は C_3-C_4 -シクロアルキル（好ましくは、シクロプロピル）である。

【0041】

【0036】 好ましいのは、さらにまた、化合物〔ここで、Tは、T8である〕である。

【0042】

【0037】 好ましいのは、式（I）〔式中、TはT8であり、及び、T8における R'' は、いずれの場合にもHである〕で表される化合物である。

【0043】

【0038】 本発明の好ましい実施形態は、式（I）〔式中、Tは、T2、T3又はT7である〕で表される化合物に関する。

【0044】

A

【0039】 好ましいのは、さらにまた、化合物〔ここで、 A_1 は CR^2 であり、 A_2 は CR^3 であり、 A_3 は CR^4 であり、 A_4 は CR^5 であり、 A_5 はCである〕である。

【0045】

【0040】 好ましいのは、さらにまた、化合物〔ここで、 A_1 は CR^2 であり、 A_2 はNであり、 A_3 は CR^4 であり、 A_4 は CR^5 であり、 A_5 はCである〕である。

【0046】

B

【0041】 好ましいのは、さらにまた、化合物〔ここで、 B_1 は CR^6 であり、 B_2 は CR^7 であり、 B_3 は CR^8 であり、 B_4 は CR^9 であり、及び、 B_5 は CR^1 である〕である。

【0047】

【0042】 好ましいのは、さらにまた、化合物〔ここで、 A_1 は CR^2 であり、 A_2 は CR^3 であり、 A_3 は CR^4 であり、 A_4 は CR^5 であり、 A_5 はCであり、及び、 B_1 は CR^6 であり、 B_2 は CR^7 であり、 B_3 は CR^8 であり、 B_4 は CR^9 であり、及び、 B_5 は CR^1 である〕である。

【0048】

R^8

【0043】 好ましいのは、式(I)〔式中、 B_3 は CR^8 であり、及び、 R^8 は、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にもハロゲンで置換されている 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、 $N-C_1-C_4$ -アルコキシイミノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 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、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ若しくは N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノであり；又は、 B_3 は CR^8 であり、及び、 R^8 は、ハロゲン、シアノ、ニトロであるか、又は、いずれの場合にもハロゲンで置換されている C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキル(C_3-C_4)シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 $N-C_1-C_4$ -アルコキシイミノ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルファニル、 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(例えば、 SO_2CF_3)、 $N-C_1-C_4$ -アルキルアミノ若しくは N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノである〕で表される化合物である。

【0049】

【0044】 好ましいさらなる実施形態では、 R^8 は、ハロゲン(例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)であるか、又は、ハロゲンで置換されている C_1-C_4 -アルキル、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、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ファニル、 N 、 N -ジメチルアミノであるか；又は、 SO_2CF_3 、ハロゲン(例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)であるか、又は、ハロゲンで置換されている C_1-C_4 -アルキル若しくは C_1-C_4 -アルキル- C_3-C_4 -シクロアルキル、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、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ファニル、 N 、 N -ジメチルアミノである。

【0050】

【0045】 さらに好ましいさらなる実施形態では、 R^8 は、ハロゲン化 C_1-C_6

ーアルキル、好ましくは、ペルハロゲン化 C_1-C_6 ーアルキル、一層さらに好ましくは、ペルフッ素化 C_1-C_6 ーアルキルであるか、又は、ハロゲン化 (C_1-C_4 ーアルキル)ー C_3-C_4 ーシクロアルキル、好ましくは、ペルハロゲン化 (C_1-C_4 ーアルキル)ー C_3-C_4 ーシクロアルキル、一層さらに好ましくは、(ペルフッ素化 C_1-C_4 ーアルキル)ー C_3-C_4 ーシクロアルキルであるか、又は、 SO_2CF_3 である。

【0051】

【0046】 特に好ましい実施形態では、 R^8 は、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、トリフルオロメチルスルホニル、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ファニルであるか；又は、 SO_2CF_3 、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ペンタフルオロ-tert-ブチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、ノナフルオロ-sec-ブチル、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、トリフルオロメチルスルホニル、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ファニル、トリフルオロメチルシクロプロピル（例えば、1-トリフルオロメチルシクロプロピル）である。

【0052】

【0047】 特に好ましい実施形態では、 R^8 は、ペルフッ素化 C_1-C_3 ーアルキル、例えば、ペルフッ素化n-プロピル若しくはペルフッ素化i-プロピル ($-C_3F_7$)、ペルフッ素化エチル (C_2F_5) 又はペルフッ素化メチル (CF_3) であり、さらに好ましくは、ペルフッ素化n-プロピル若しくはペルフッ素化i-プロピル ($-C_3F_7$) 又はペルフッ素化メチルであるか；又は、ハロゲンで置換されている C_1-C_4 ーアルキル- C_3-C_4 ーシクロアルキル、例えば、(ペルフッ素化 C_1-C_4 ーアルキル)ー C_3-C_4 ーシクロアルキル、好ましくは、トリフルオロメチルシクロプロピル（例えば、1-トリフルオロメチルシクロプロピル）である。

【0053】

R^7 、 R^9

【0048】 好ましいのは、化合物〔ここで、 B_2 は CR^7 であり、及び、 B_4 は CR^9 であり、及び、 R^7 及び R^9 は、いずれの場合にもHである〕である。

【0054】

R^{10} 、 R^6

【0049】 好ましいのは、化合物〔ここで、 B_1 は CR^6 であり、及び、 B_5 は CR^{10} であり、及び、 R^6 及び R^{10} は、それぞれ、場合により独立して、ハロゲン（好ましくは、F、Cl、Br及びIからなる群から選択されるハロゲン；さらに好ましくは、Cl）であるか、又は、 C_1-C_6 ーアルキル（好ましくは、 CH_3 ）、 $-S-C_1-C_6$ ーアルキル（好ましくは、 $S-CH_3$ ）、 $-SO-C_1-C_6$ ーアルキル（好ましく

は、 $S(O)-CH_3$ ）、 $SO_2-C_1-C_6$ -アルキル（好ましくは、 SO_2-CH_3 ）及び C_1-C_6 -アルコキシ（好ましくは、 $-O-CH_3$ ）から選択されるハロゲン（好ましくは、F、Cl、Br及びIからなる群から選択されるハロゲン；さらに好ましくは、F）で置換されていてもよい基である]である。

【0055】

【0050】 好ましい実施形態では、 R^6 は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ 、又は、1フッ素化～3フッ化されている $-S-CH_3$ （ $=-S-CH_2F$ 、 $-S-CHF_2$ 又は $S-CF_3$ ）、 $-SO-CH_3$ 若しくは $-SO_2-CH_3$ である。

10

【0056】

【0051】 好ましい実施形態では、 R^6 は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ である。

【0057】

【0052】 好ましい実施形態では、 R^{10} は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ 、又は、1フッ素化～3フッ素化されている $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 若しくは $-SO_2-CH_3$ である。

20

【0058】

【0053】 好ましい実施形態では、 R^{10} は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ である。

【0059】

【0054】 好ましいさらなる実施形態では、 R^6 及び R^{10} は、いずれの場合にも $-CH_3$ であるか、又は、いずれの場合にもClである。

【0060】

【0055】 好ましいさらなる実施形態では、 R^6 はClであり、及び、 R^{10} は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ 、1フッ素化～3フッ素化されている $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 若しくは $-SO_2-CH_3$ であり；又は、 R^{10} はClであり、及び、 R^6 は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ 、1フッ素化～3フッ素化されている $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 若しくは $-SO_2-CH_3$ である。

30

【0061】

【0056】 好ましいさらなる実施形態では、 R^6 はClであり、及び、 R^{10} は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ であり；又は、 R^{10} はClであり、及び、 R^6 は、Cl、 $-CH_3$ 、 $-O-CH_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-SO-CH_3$ 、 $-SO_2-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-CH_2F$ である。

40

【0062】

R^2 、 R^3 、 R^5

【0057】 好ましいのは、化合物〔ここで、 A_1 は CR^2 であり、 A_2 は CR^3 であり、及び、 A_4 は CR^5 であり、及び、 R^2 、 R^3 及び R^5 は、いずれの場合にもHである〕である。

【0063】

R^4

【0058】 好ましいのは、化合物〔ここで、 A_3 は CR^4 であり、及び、 R^4 は、

50

Hであるか、又は、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルであるか、又は、ハロゲン（好ましくは、Br、F又はCl、さらに好ましくは、Cl又はF、一層さらに好ましくは、F）であり、又は、 R^4 は、 CR^4 の炭素原子と A_5 と $C-M_1$ 若しくは $C-M_2$ と一緒に5員若しくは6員の環（ここで、該環は、F、Cl、Br、I、 C_1-C_3 -アルキルで置換されていてもよく、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでいてもよい）を形成し、さらに好ましくは、5員炭素環を形成する]である。

【0064】

【0059】 好ましいさらなる実施形態では、 R^4 は、H、 C_1-C_4 -アルキル、フッ素化 C_1-C_4 -アルキル、Cl又はFであり、好ましくは、 CH_3 、 CF_3 、H、Cl又はFである。

10

【0065】

【0060】 好ましいさらなる実施形態では、 R^4 は、H、Cl又はFであり、好ましくは、Cl又はFである。好ましいさらなる実施形態では、 R^4 はClである。

【0066】

M_1 、 M_2

【0061】 好ましいのは、化合物〔ここで、 M_1 及び M_2 は、それぞれ独立して、H又は C_1-C_6 -アルキルであり、さらに好ましくはHであり、又は、 $C-M_1$ 若しくは $C-M_2$ は CR^4 の炭素原子及び A_5 と一緒に5員若しくは6員の環（ここで、該環は、F、Cl、Br、I、 C_1-C_3 -アルキルで置換されていてもよく、該環は、0個、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の酸素原子及び／又は0個、1個若しくは2個の硫黄原子を含んでいてもよい）を形成し、さらに好ましくは、5員炭素環を形成する]である。好ましくは、 $C-M_1$ 又は $C-M_2$ が CR^4 の炭素原子及び A_5 と環を形成する場合、残りのMは、いずれの場合にも（ M_2 が環形成に関与している場合は M_1 、又は、 M_1 が環形成に関与している場合は M_2 ）、Hである。

20

【0067】

R^1

【0062】 好ましいのは、化合物〔ここで、 R^1 はHである]である。

【0068】

【0063】 さらに、好ましいのは、化合物〔ここで、 R^1 は、 C_1-C_4 -アルキル（好ましくは、メチル）又は C_3-C_7 -シクロアルキル（ C_1-C_3 ）-アルキル（好ましくは、シクロプロピルメチレン）である]である。

30

【0069】

W

【0064】 好ましい実施形態では、WはOである。

【0070】

【0065】 好ましいさらなる実施形態では、WはSである。

【0071】

Q

【0066】 好ましいのは、化合物〔ここで、Qは、いずれの場合にも独立してハロゲン若しくはシアノで置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルであるか、又は、6員芳香族環（例えば、フェニル又はピリジル）であり、さらに好ましくは、いずれの場合にもハロゲン及びシアノから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルである]である。

40

【0072】

【0067】 好ましい実施形態では、Qは、ハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_4 -アルキルであり、さらに好ましくは、 C_1-C_4 -アルキルである。

【0073】

【0068】 好ましいさらなる実施形態では、Qは、シクロプロピル又は1-シアノ

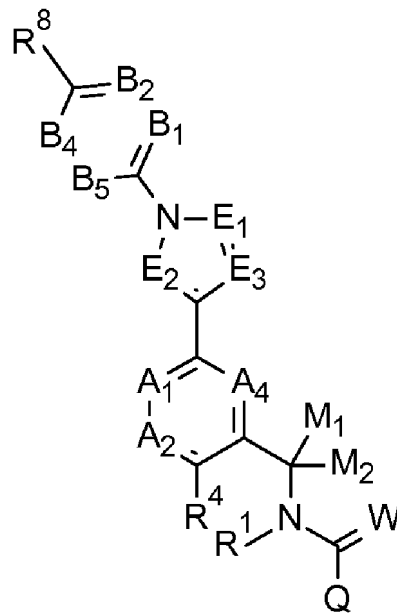
50

シクロプロピルである。

【0074】

[0069] 好ましいのは、式 (I a)

【化5】



(Ia)

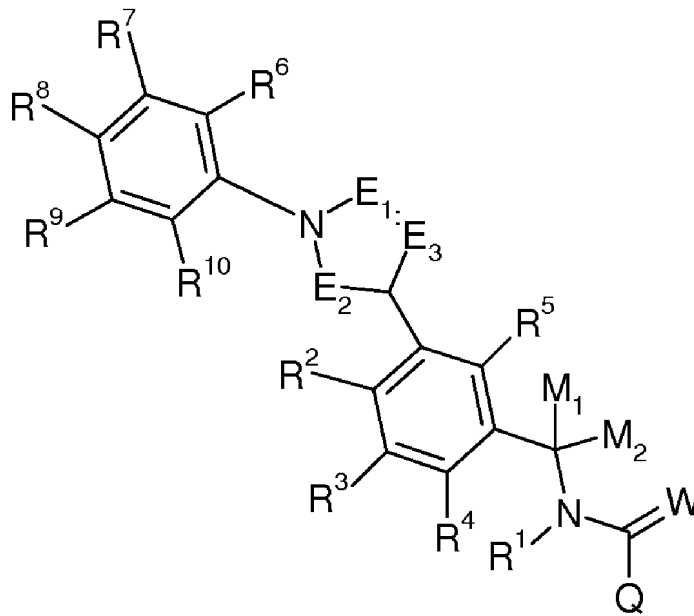
【0075】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 B_1 、 B_2 、 B_4 及び B_5 、 A_1 、 A_2 、 A_4 、 R^1 、 R^4 、 R^8 、 W 、 Q 、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ~ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりであり、及び、 E_1 、 E_2 、 E_3 は、それぞれ独立して、 N 又は $C-R^6$ であり、及び、 E_1 と E_2 の間の窒素及び E_2 と E_3 の間の炭素と一緒に $T_1 \sim T_8$ から選択される環 T 、好ましくは、段落 [0027] ~ [0038] のいずれかに記載されている環 T である。特に好ましいのは、式 (I a) [式中、 R^1 は H である] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I b) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I a) [式中、 B_1 、 B_2 、 B_4 及び B_5 、 A_1 、 A_2 、 A_4 、 R^1 、 R^4 、 R^8 、 W 、 Q 、 M_1 及び M_2 は、表 1 中で定義されているとおりである] で表される化合物である。

【0076】

[0070] 好ましいのは、さらにまた、式 (I b)

【化 6】



(Ib)

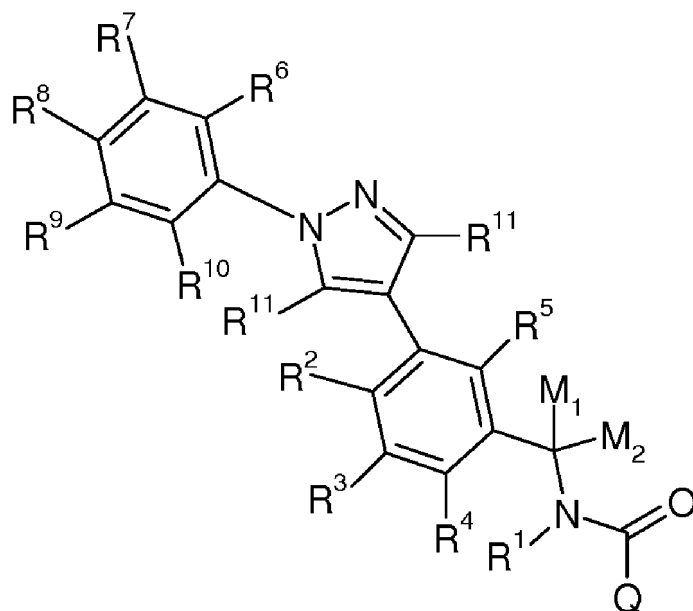
【0077】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、 W 、 Q 、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりであり、及び、 E_1 、 E_2 、 E_3 は、それぞれ独立して、 N 又は $C-R^6$ であり、及び、 E_1 と E_2 の間の窒素及び E_2 と E_3 の間の炭素と一緒に $T1 \sim T8$ から選択される環 T 、好ましくは、段落 [0027] ～ [0038] のいずれかに記載されている環 T である。特に好ましいのは、式 (Ib) [式中、 R^1 は H である] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (Ib) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0078】

[0071] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-T3)

【化 7】



10

(I-T3)

20

【0079】

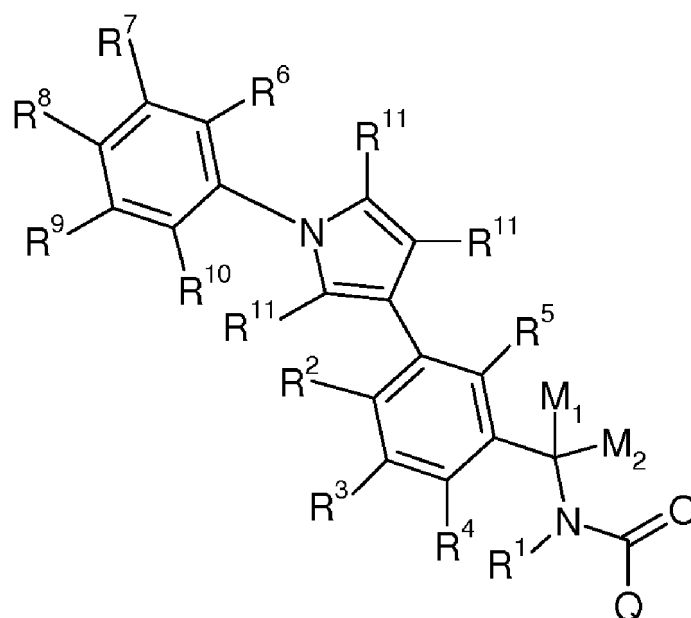
で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、W、Q、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式 (I-T3) [式中、 R^1 はHである] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-T3) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0080】

30

[0072] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-T1)

【化 8】



(I-T1)

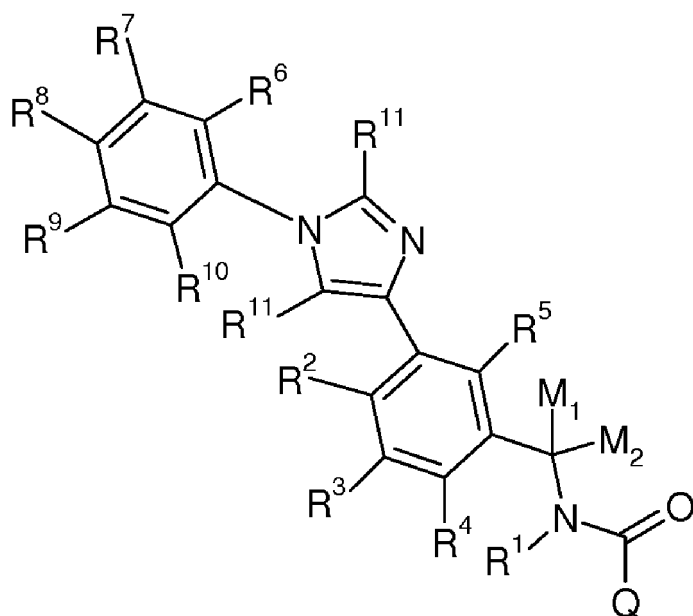
【0081】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、W、Q、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式 (I-T1) [式中、 R^1 はHである] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-T1) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0082】

[0073] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-T2)

【化 9】



(I-T2)

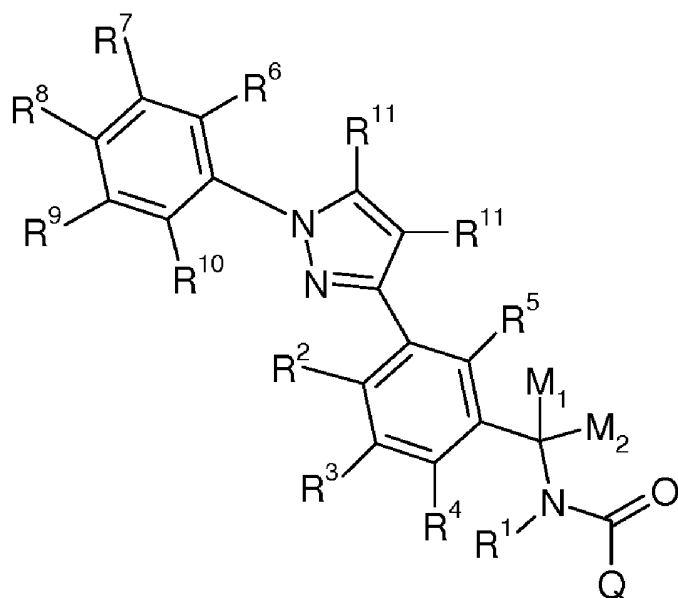
【0083】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、W、Q、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式 (I-T2) [式中、 R^1 はHである] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-T2) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0084】

[0074] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-T4)

【化 1 0】



(I-T4)

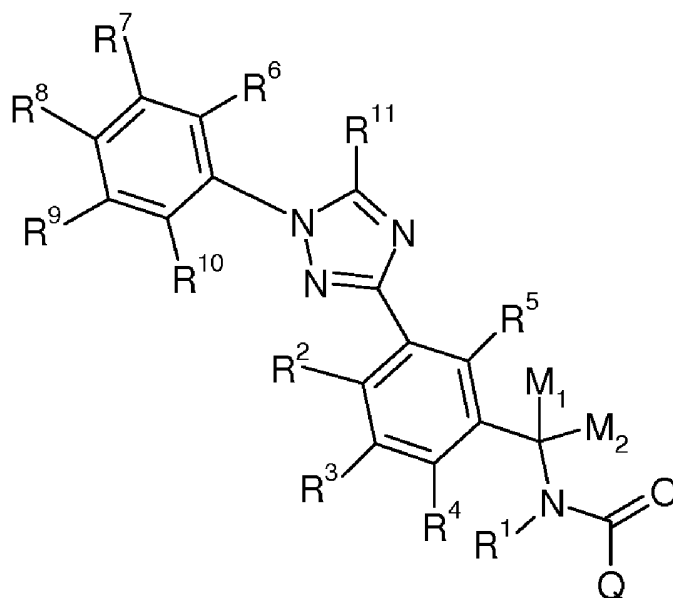
【0085】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、W、Q、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式 (I-T4) [式中、 R^1 は H である] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-T4) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0086】

[0075] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-T5)

【化 1 1】



10

(I-T5)

20

【0087】

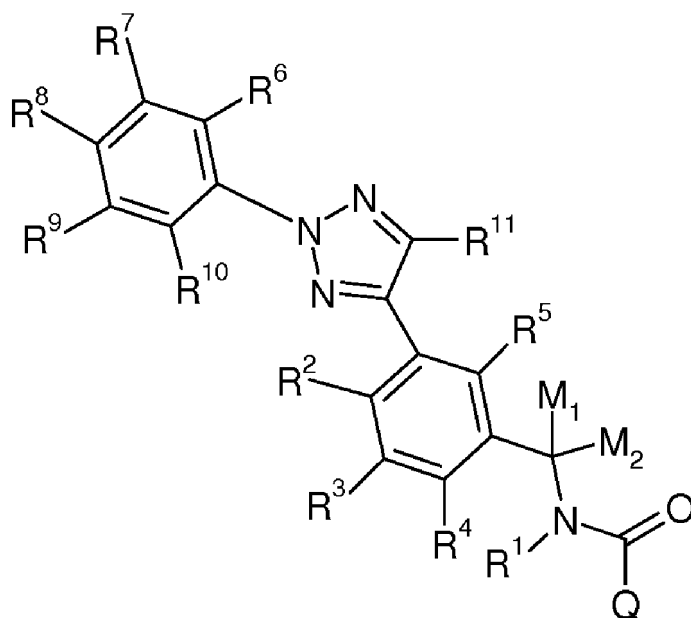
で表される化合物であり、ここで、上記式中、R¹～R¹⁰、W、Q、M₁及びM₂は、段落〔0026〕～〔0066〕のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式（I-T5）〔式中、R¹はHである〕で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式（I-T5）〔式中、R¹はメチルである〕で表される化合物である。

【0088】

〔0076〕 好ましいのは、さらにまた、式（I-T6）

30

【化 1 2】



(I-T6)

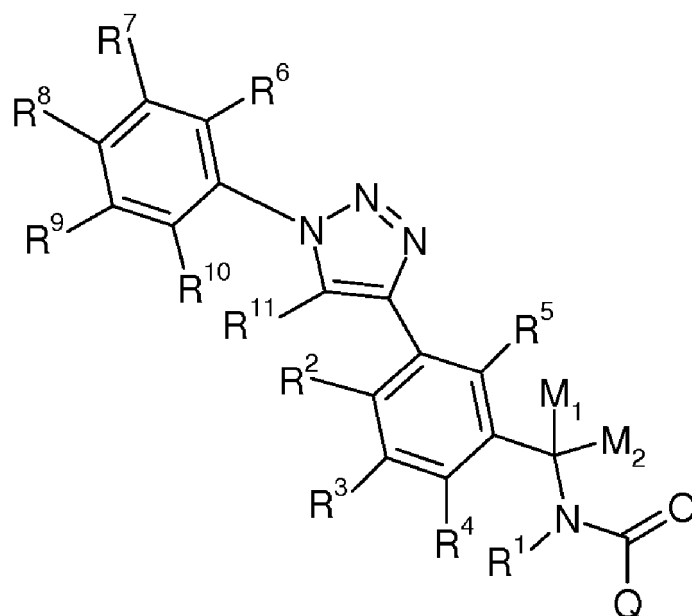
【0089】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、W、Q、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式 (I-T6) [式中、 R^1 は H である] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-T6) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0090】

[0077] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-T7)

【化 1 3】



(I-T7)

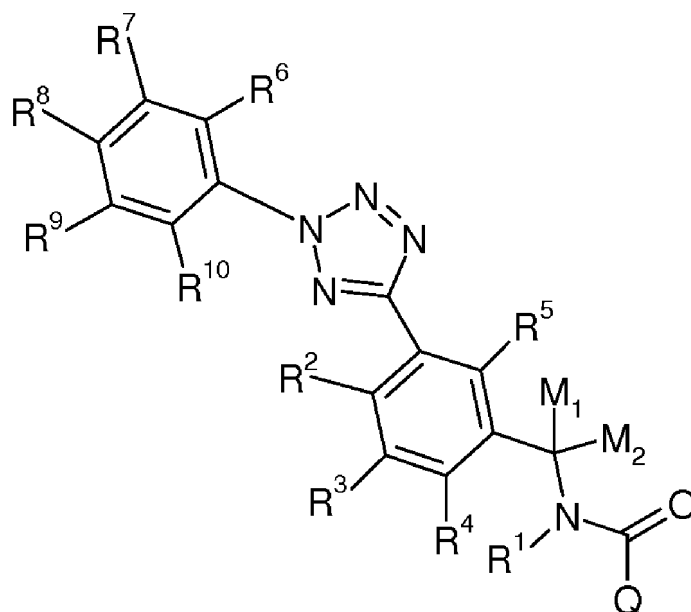
【0091】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、W、Q、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式 (I-T7) [式中、 R^1 は H である] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-T7) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0092】

[0078] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-T8)

【化 1 4】



(I-T8)

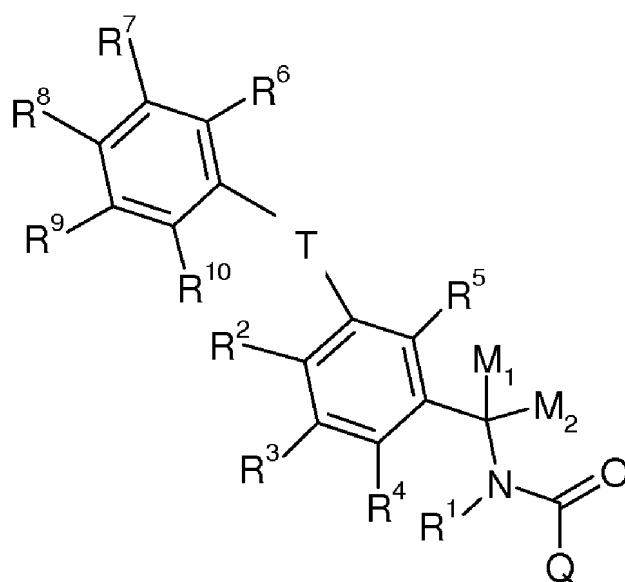
【0093】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、R¹～R¹⁰、W、Q、M₁及びM₂は、段落〔0026〕～〔0066〕のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式(I-T8)〔式中、R¹はHである〕で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式(I-T8)〔式中、R¹はメチルである〕で表される化合物である。

【0094】

〔0079〕 好ましいのは、さらにまた、式(I-Ta)

【化 1 5】



(I-Ta)

【0095】

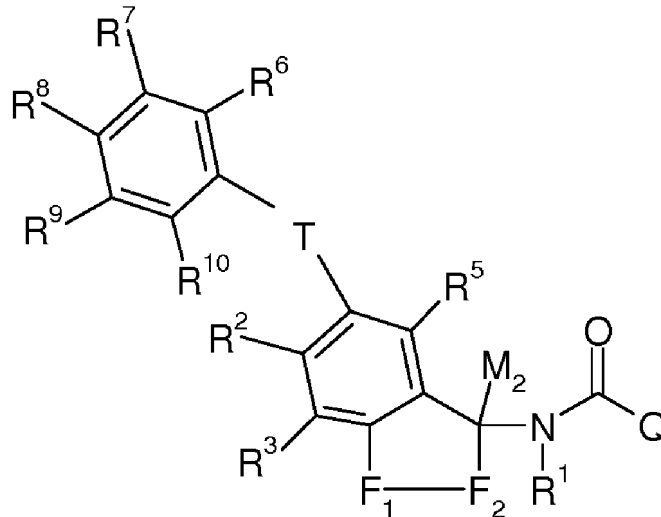
で表される化合物であり、ここで、上記式中、 $R^1 \sim R^{10}$ 、 W 、 Q 、 M_1 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。特に好ましいのは、式 (I-Ta) [式中、 R^1 はHである] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-Ta) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0096】

[0080] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-Tb)

【化16】

10



20

(I-Tb)

【0097】

30

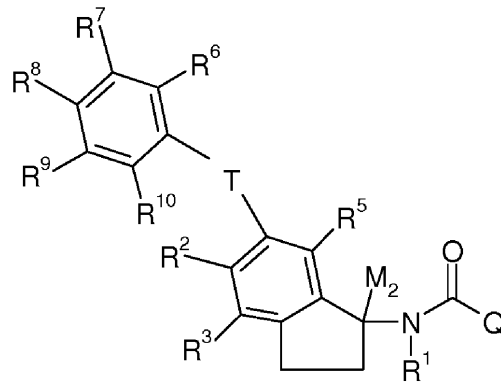
で表される化合物であり、ここで、上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 $R^5 \sim R^{10}$ 、 T 、 Q 及び M_2 は、段落 [0026] ～ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりであり、 F_1 及び F_2 は、それぞれ独立して、 $C-R^6$ 、 $N-R^6$ 、 O 又は S である。この場合、 T は、特に好ましくは、 T_2 、 T_7 又は T_3 であり、特に好ましくは、 T_3 である。特に好ましいのは、式 (I-Tb) [式中、 R^1 はHである] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-Tb) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。

【0098】

[0081] 好ましいのは、さらにまた、式 (I-Tc)

40

【化 1 7】



(I-Tc)

10

【0099】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 $R^5 \sim R^{10}$ 、 T 、 Q 及び M_2 は、段落 [0026] ~ [0066] のいずれかに従って定義されているとおりである。この場合、 T は、特に好ましくは、 T_2 、 T_7 又は T_3 であり、特に好ましくは、 T_3 である。特に好ましいのは、式 (I-Tc) [式中、 R^1 は H である] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-Tc) [式中、 R^1 はメチルである] で表される化合物である。好ましいのは、さらにまた、式 (I-Tc) [式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^7 、 R^9 及び M_2 は、いずれの場合にも H であり、 R^8 はヘプタフルオロイソプロピルであり、 Q は、 $C_1 - C_3$ -アルキル (好ましくは、メチル又はエチル、さらに好ましくは、エチル) であり、 R^{10} はハロゲン (好ましくは、F 又は Cl、さらに好ましくは、Cl) であり、及び、 R^6 は、いずれの場合にもハロゲン化 (好ましくは、フッ素化) されている $C_1 - C_3$ -アルキル又は $C_1 - C_3$ -アルコキシであり、好ましくは、 CF_3 、 OCF_3 又は $OCHF_2$ である] で表される化合物である。

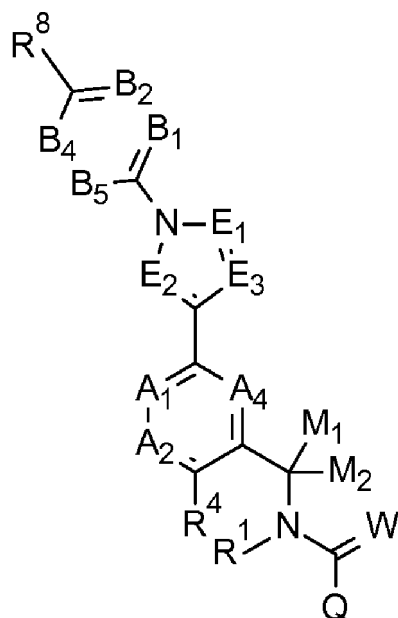
20

【0100】

[0082] 特に好ましいのは、式 (Ia)

30

【化 18】



(Ia)

【0101】

で表される化合物であり、ここで、上記式中、

R^8 は、フッ素化 C_1-C_4 -アルキルであり、さらに好ましくは、ペルフルオロ化 C_1-C_4 -アルキルであり、特に好ましくは、ヘプタフルオロイソプロピルであり；

B_1 は $C-R^6$ であり、及び、 B_5 は $-R^{10}$ であり、ここで、 R^6 及び R^{10} は、それぞれ独立して、ハロゲンであるか、又は、いずれの場合にもフッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 $-S-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO_2-C_1-C_4$ -アルキル又は C_1-C_4 -アルコキシであり、さらに好ましくは、それぞれ独立して、 Cl 、フッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 $-S-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO_2-C_1-C_4$ -アルキル又はフッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシであり、一層さらに好ましくは、それぞれ独立して、 Cl 、フッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 $-S-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO_2-C_1-C_4$ -アルキル又はフッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシであり、特に好ましくは、それぞれ独立して、 OCF_3 、 CHF_2 、 Cl 、メチル、 $-S$ -メチル、 $-SO$ -メチル、 $-SO_2$ -メチルであり；

B_2 、 B_4 、 E_2 及び E_3 、 A_1 及び A_4 は、 CH であり；

M_1 は、 H であり；

E_1 は、 N であり；

A_2 は、 $C-H$ 又は N であり；

R^4 は、 H 、 F 又は Cl であり；

R^1 は、 H 、 C_1-C_4 -アルキル又はシクロプロピルカルボニル ($C_3H_5-C(=O)-$) であり、好ましくは、 H 、メチル又はシクロプロピルカルボニルであり、さらに好ましくは、 H 又はメチルであり；

Q は、ハロゲン化されていてもよい（好ましくは、フッ素化されていてもよい） C_1-C_4 -アルキル又はハロゲン化されていてもよいシクロプロピルであり、さらに好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル又はシクロブ

ロピルであり；及び、

Wは、Oである。

【0102】

〔0083〕 好ましいのは、さらにまた、式（I a）で表される化合物であり、ここで、式中、

R^8 は、フッ素化 C_1-C_4 -アルキルであり、さらに好ましくは、ペルフッ素化 C_1-C_4 -アルキルであり、特に好ましくは、ヘプタフルオロイソプロピルであり；

B_1 は $C-R^6$ であり、及び、 B_5 は $-R^{10}$ であり、ここで、 R^6 及び R^{10} は、それぞれ独立して、ハロゲンであるか、又は、それぞれフッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 $-S-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO_2-C_1-C_4$ -アルキル又は C_1-C_4 -アルコキシであり、さらに好ましくは、それぞれ独立して、Cl、フッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 $-S-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO_2-C_1-C_4$ -アルキル又はフッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシであり、一層さらに好ましくは、それぞれ独立して、Cl、フッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルキル、 $-S-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO-C_1-C_4$ -アルキル、 $-SO_2-C_1-C_4$ -アルキル又はフッ素化されていてもよい C_1-C_4 -アルコキシであり、特に好ましくは、それぞれ独立して、 OCF_3 、 CHF_2 、Cl、メチル、 $-S$ -メチル、 $-SO$ -メチル、 $-SO_2$ -メチルであり；

B_2 、 B_4 、 E_2 及び E_3 、 A_1 及び A_4 は、CHであり；

M_1 は、Hであり；

E_1 は、Nであり；

A_2 は、C-H又はNであり；

R^4 は、H、F又はClであり；

R^1 は、H、 C_1-C_4 -アルキル又はシクロプロピルカルボニル（ $C_3H_5-C(=O)-$ ）であり、好ましくは、H、メチル又はシクロプロピルカルボニルであり、さらに好ましくは、H又はメチルであり；

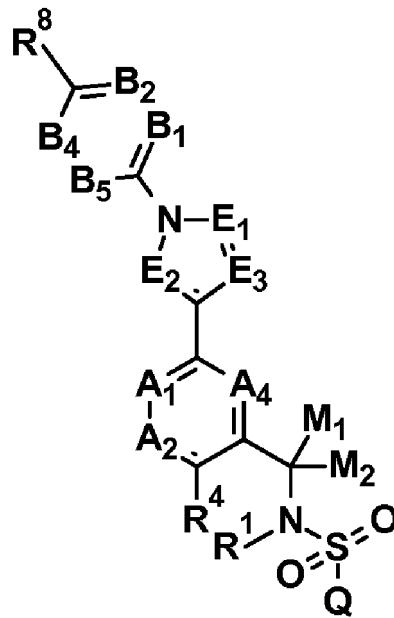
Qは、ハロゲン化されていてもよい（好ましくは、フッ素化されていてもよい） C_1-C_4 -アルキル又はハロゲン化されていてもよいシクロプロピルであり、さらに好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル又はシクロプロピルであり；及び、

Wは、Sである。

【0103】

本発明のさらなる態様は、式（I c）

【化 1 9】



(Ic)

【0104】

で表される化合物に関し、ここで、上記式中、 $-S(O)_2-$ 基は、QとNの間に存在している。 B_1 、 B_2 、 B_4 及び B_5 、 A_1 、 A_2 、 A_4 、 E_1 、 E_2 、 E_3 、 R^1 、 R^4 、 R^8 、Q、 M_1 及び M_2 は、この場合、式(I)、式(Ia)、式(I-Ta)、式(I-Tb)及び式(I-Tc)で表される化合物に関して本明細書中に記載されている定義、好ましい定義又は特に好ましい定義を有する。好ましくは、 B_1 、 B_2 、 B_4 及び B_5 は、 $C-R^6$ 、 $C-R^7$ 、 $C-R^9$ 、 $C-R^{10}$ であり、及び、 A_1 、 A_2 、 A_4 は、 $C-R^2$ 、 $C-R^3$ 、 $C-R^5$ であり、及び、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^7 、 R^9 、 M_1 及び M_2 は、いずれの場合にもHであり、及び、 R^8 はヘプタフルオロイソプロピルであり、及び、 R^6 及び R^{10} は、いずれの場合にも、それぞれ独立して、ハロゲン（好ましくは、F又はCl、さらに好ましくは、Cl）であり、及び、Qは、 C_1-C_3 -アルキル（好ましくは、メチル又はエチル）であり、及び、 E_1 はNであり、及び、 E_2 及び E_3 は、 $C-H$ である。

【0105】

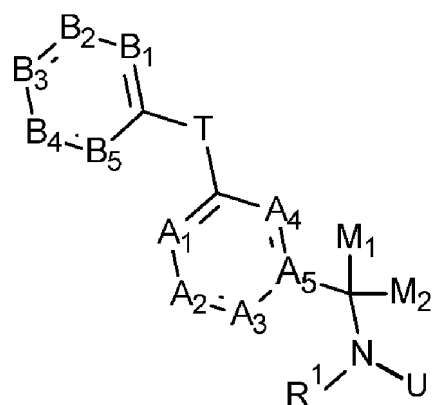
[0084] 従って、本発明は、式(I')

10

20

30

【化 2 0】



(I')

10

【0106】

で表される化合物にも関し、ここで、上記式中、

Uは、 $-C(=W)-Q$ 又は $-S(O)_2-Q$ であり；及び、

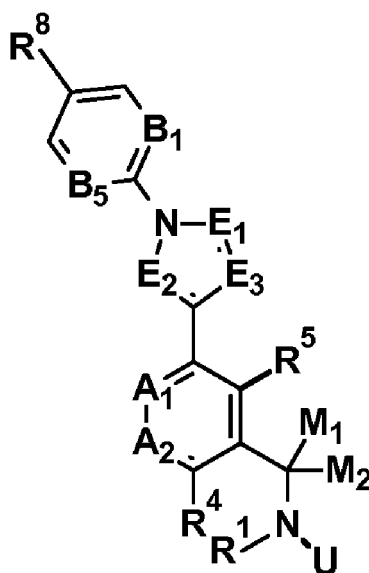
20

B_1 、 B_2 、 B_3 、 B_4 及び B_5 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 及び A_5 、T、 R^1 、 M_1 及び M_2 、及び、Qは、いずれの場合にも、式(I)で表される化合物及びその好ましい実施形態並びに式(Ic)で表される化合物及びその好ましい実施形態において特定されている定義を有し得る。

【0107】

[0085] 従って、本発明は、式(I'')

【化 2 1】



(I'')

30

40

【0108】

で表される化合物にも関し、ここで、上記式中、

Uは、 $-C(=W)-Q$ 又は $-S(O)_2-Q$ であり；及び、

B_1 及び B_5 、 A_1 、 A_2 、 E_1 、 E_2 、 E_3 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^8 、 M_1 、 M_2

50

及びQは、いずれの場合にも、式(I')で表される化合物及びその好ましい実施形態において特定されている意味を有し得る。R⁸は、好ましくは、ヘプタフルオロイソプロピルである。

【0109】

[0086] さらに態様は、トランスジェニック種子又は従来の種子、及び、それらの種子から生じた植物を、害虫による侵襲から保護する方法に関し、ここで、該方法は、該種子を本明細書中に記載されている式(I)又は式(I)から誘導される式で表される少なくとも1種類の化合物で処理することを特徴とする。

【0110】

[0087] さらに態様は、害虫を防除するための、本明細書中に記載されている式(I)若しくは式(I)から誘導される式で表される化合物又は本明細書中に記載されている殺虫剤組成物の使用に関する。

10

【0111】

[0088] さらに態様は、媒介動物(vector)の防除における、本明細書中に記載されている式(I)又は式(I)から誘導される式で表される化合物の使用に関する。

【0112】

[0089] さらに態様は、種子に関し、ここで、該種子には、本明細書中に記載されている式(I)又は式(I)から誘導される式で表される化合物が、コーティングの成分として、又は、コーティングに加えられた1又は複数のさらなる層として、施用されている。

20

【0113】

[0090] 従って、さらに態様は、本明細書中に記載されている式(I)若しくは式(I)から誘導される式で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいるコーティングを施用する方法、又は、本明細書中に記載されている式(I)若しくは式(I)から誘導される式で表される化合物を施用する方法(ここで、該化合物は、コーティングに加えられた1又は複数のさらなる層として種子に施用される)に関し、ここで、該方法は、以下の段階を含んでいる：(a)種子を本明細書中に記載されている式(I)若しくは式(I)から誘導される式で表される化合物からなるコーティング材料又は本明細書中に記載されている式(I)若しくは式(I)から誘導される式で表される化合物を含んでいるコーティング材料と混合させる段階、(b)得られたコーティングされた種子組成物を改質する(enriching)段階、(c)得られた改質された種子組成物を乾燥させる段階、(d)得られた乾燥させた種子組成物を非凝集化(disagglomerating)又は脱凝集化(deagglomerating)させる段階。

30

【0114】

[0091] 本明細書中に記載されている式(I)で表される化合物又は式(I)から誘導される式で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態、及び／又は、光学活性異性体の形態、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態で、存在し得る。本発明は、純粋な異性体及び異性体混合物の両方に関する。

【0115】

40

[0092] 本発明の化合物は、金属錯体としても存在し得る。

【0116】

定義

[0093] 当業者は、表現「a」又は「an」が、本出願において使用されている場合、その状況に応じて、「1」、「1以上」又は「少なくとも1」を意味し得るということを知っている。

【0117】

[0094] 環系及び基などの本明細書中に記載される全ての構造に関して、隣接する原子は、-O-O-又は-O-S-であってはならない。

【0118】

50

〔0095〕 可変数の可能な炭素原子（C原子）を有する構造は、より具体的に明記することを目的として、本出願においては、 $C_{L L} - C_{U L}$ 炭素原子の下限— $C_{L L} - C_{U L}$ 炭素原子の上限構造（ $C_{L L} - C_{U L}$ 構造）と記載され得る。例えば、アルキル基は3～10個の炭素原子で構成されることがき、その場合、 $C_3 - C_{10}$ —アルキルに対応する。炭素原子とヘテロ原子で構成される環構造は、「 $L L \sim U L$ 員」構造と記載され得る。6員環構造の1つの例は、トルエン（メチル基で置換されている6員環構造）である。

【0119】

〔0096〕 置換基に関する集合語、例えば、 $(C_{L L} - C_{U L})$ —アルキルが、複合置換基、例えば、 $(C_{L L} - C_{U L})$ —シクロアルキル— $(C_{L L} - C_{U L})$ —アルキルの最後にある場合、その複合置換基の最初にある構成要素、例えば、 $(C_{L L} - C_{U L})$ —シクロアルキルは、同じように又は異なるように、そして、独立して、後者の置換基、例えば、 $(C_{L L} - C_{U L})$ —アルキルで1置換又は多置換され得る。化学基、環系及び環状基に関して本出願中で使用されている全ての集合語は、「 $C_{L L} - C_{U L}$ 」又は「 $L L \sim U L$ 員」を追加することに、より具体的に明記することができる。

10

【0120】

〔0097〕 異なるように定義されていない限り、集合語に関する定義は、複合置換基におけるこれらの集合語にも適用される。例えば、 $C_{L L} - C_{U L}$ —アルキルの定義は、複合置換基、例えば、 $C_{L L} - C_{U L}$ —シクロアルキル— $C_{L L} - C_{U L}$ —アルキルの一部としての $C_{L L} - C_{U L}$ —アルキルにも適用される。

20

【0121】

〔0098〕 本出願において記載されている実施例は、限定的に考えられるべきではなく、単に一部の実施形態について詳細に記載しているに過ぎないということは、当業者には明白である。

【0122】

〔0099〕 上記式中で与えられている記号の定義においては、以下の置換基を概して代表する集合語を使用した。

【0123】

〔0100〕 ハロゲンは、第7主族の元素、好ましくは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素、さらに好ましくは、フッ素、塩素及び臭素、一層さらに好ましくは、フッ素及び塩素を意味する。

30

【0124】

〔0101〕 ヘテロ原子の例は、N、O、S、P、B、Siである。好ましくは、用語「ヘテロ原子」は、N、S及びOに関する。

【0125】

〔0102〕 本発明によれば、「アルキル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、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、*s*—ブチル、*t*—ブチル、ペンチル、1—メチルブチル、2—メチルブチル、3—メチルブチル、1, 2—ジメチルプロピル、1, 1—ジメチルプロピル、2, 2—ジメチルプロピル、1—エチルプロピル、ヘキシル、1—メチルペンチル、2—メチルペンチル、3—メチルペンチル、4—メチルペンチル、1, 2—ジメチルプロピル、1, 3—ジメチルブチル、1, 4—ジメチルブチル、2, 3—ジメチルブチル、1, 1—ジメチルブチル、2, 2—ジメチルブチル、3, 3—ジメチルブチル、1, 1, 2—トリメチルプロピル、1, 2, 2—トリメチルプロピル、1—エチルブチル及び2—エチルブチルを表す。1～4個の炭素原子を有するアルキル、例えば、とりわけ、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、*s*—ブチル又は*t*—ブチルなども好ましい。本発明によるアルキル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

40

【0126】

〔0103〕 本発明によれば、「アルケニル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは2～6個の炭素原子及び少なくとも1つの二重結合を有する、直鎖又は分

50

枝鎖の炭化水素、例えば、ビニル、2-プロペニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジメチル-3-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル及び1-エチル-2-メチル-2-プロペニルを表す。2~4個の炭素原子を有するアルケニル、例えば、とりわけ、2-プロペニル、2-ブテニル又は1-メチル-2-プロペニルなども好ましい。本発明によるアルケニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0127】

【0104】 本発明によれば、「アルキニル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは2~6個の炭素原子及び少なくとも1つの三重結合を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1, 1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメチル-3-ブチニル、1, 2-ジメチル-3-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル及び2, 5-ヘキサジニルを表す。2~4個の炭素原子を有するアルキニル、例えば、とりわけ、エチニル、2-プロピニル又は2-ブチニル-2-プロペニルなども好ましい。本発明によるアルキニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0128】

【0105】 本発明によれば、「シクロアルキル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは3~10個の炭素を有する、単環式、二環式又は三環式の炭化水素、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、シクロオクチル、ビスクロ[2, 2, 1]ヘプチル、ビスクロ[2, 2, 2]オクチル又はアダマンチルを表す。3個、4個、5個、6個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキル、例えば、とりわけ、シクロプロピル又はシクロブチルなども好ましい。本発明によるシクロアルキル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0129】

【0106】 本発明によれば、「アルキルシクロアルキル」は、好ましくは4~10個又は4~7個の炭素原子を有する、単環式、二環式又は三環式のアルキルシクロアルキル、例えば、メチルシクロプロピル、エチルシクロプロピル、イソプロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチル及び4-メチルシクロヘキシルを表す。4個、5個又は7個の炭素原子を有するアルキルシクロアルキル、例えば、とりわけ、エチルシクロプロピル

又は4-メチルシクロヘキシルなども好ましい。本発明によるアルキルシクロアルキル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0130】

【0107】 本発明によれば、「シクロアルキルアルキル」は、好ましくは4～10個又は4～7個の炭素原子を有する、単環式、二環式又は三環式のシクロアルキルアルキル、例えば、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル及びシクロペンチルエチルを表す。4個、5個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、例えば、とりわけ、シクロプロピルメチル又はシクロブチルメチルなども好ましい。本発明によるシクロアルキルアルキル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

10

【0131】

【0108】 本発明によれば、「ヒドロキシアルキル」は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルコール、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、s-ブタノール及びt-ブタノールを表す。1～4個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル基も好ましい。本発明によるヒドロキシアルキル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0132】

【0109】 本発明によれば、「アルコキシ」は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のO-アルキル、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ及びt-ブトキシを表す。1～4個の炭素原子を有するアルコキシ基も好ましい。本発明によるアルコキシ基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0133】

【0110】 本発明によれば、「アルキルスルファニル」は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のS-アルキル、例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオ及びt-ブチルチオを表す。1～4個の炭素原子を有するアルキルスルファニル基も好ましい。本発明によるアルキルスルファニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

【0134】

【0111】 本発明によれば、「アルキルスルフィニル」は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキルスルフィニル、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル及びt-ブチルスルフィニルを表す。1～4個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル基も好ましい。本発明によるアルキルスルフィニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0135】

【0112】 本発明によれば、「アルキルスルホニル」は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖アルキルスルホニル、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル及びt-ブチルスルホニルを表す。1～4個の炭素原子を有するアルキルスルホニル基も好ましい。本発明によるアルキルスルホニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

40

【0136】

【0113】 本発明によれば、「アルキルカルボニル」は、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニル及びt-ブチルカルボニルなどの、好ましくは2～7個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキル-C(=O)を表す。1～4個の炭素原子を有するアルキルカルボニル

50

も好ましい。本発明によるアルキルカルボニルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0137】

【0114】 本発明によれば、「シクロアルキルカルボニル」は、シクロアルキル部分に好ましくは3～10個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のシクロアルキルカルボニル、例えば、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル、ビスクロ〔2. 2. 1〕ヘプチル、ビスクロ〔2. 2. 2〕オクチルカルボニル及びアダマンチルカルボニルを表す。シクロアルキル部分に3個、5個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキルカルボニルも好ましい。本発明によるシクロアルキルカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

10

【0138】

【0115】 本発明によれば、単独又は化学基の構成要素としての「アルコキシカルボニル」は、アルコキシ部分に好ましくは1～6個の炭素原子を有するか又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルコキシカルボニル、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニル及び*t*-ブトキシカルボニルを表す。本発明によるアルコキシカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0139】

【0116】 本発明によれば、「アルキルアミノカルボニル」は、アルキル部分に好ましくは1～6個の炭素原子又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキルアミノカルボニル、例えば、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、*n*-プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、*s*-ブチルアミノカルボニル及び*t*-ブチルアミノカルボニルを表す。本発明によるアルキルアミノカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0140】

【0117】 本発明によれば、「N, N-ジアルキルアミノカルボニル」は、アルキル部分に好ましくは1～6個の炭素原子又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のN, N-ジアルキルアミノカルボニル、例えば、N, N-ジメチルアミノカルボニル、N, N-ジエチルアミノカルボニル、N, N-ジ(*n*-プロピルアミノ)カルボニル、N, N-ジ(イソプロピルアミノ)カルボニル及びN, N-ジ(*s*-ブチルアミノ)カルボニルを表す。本発明によるN, N-ジアルキルアミノカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

【0141】

【0118】 本発明によれば、「アリール」は、好ましくは6～14個、特に6～10個の環炭素原子を有する、単環式、二環式又は多環式の芳香族系、例えば、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルを表し、好ましくは、フェニルを表す。さらに、アリールは、結合部位が芳香族系上にある多環式系、例えば、テトラヒドロナフチル、インデニル、インダニル、フルオレニル、ビフェニルなども表す。本発明によるアリール基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

40

【0142】

【0119】 置換されているアリールの例はアリールアルキルであり、これは、C₁ーC₄ーアルキル部分及び／又はC₆ーC₁₄ーアリール部分において1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで同様に置換され得る。そのようなアリールアルキルの例としては、ベンジル及び1-フェニルエチルなどを挙げることができる。

【0143】

【0120】 本発明によれば、「ヘテロ環」、「ヘテロ環式環」又は「ヘテロ環式環系」は、少なくとも1個の炭素原子がヘテロ原子（好ましくは、N、O、S、P、B、Si、Seからなる群から選択されるヘテロ原子）で置き換えられており且つ飽和、不飽和又はヘテロ芳香族である少なくとも1つの環（ここで、該環は、置換されていなくても又

50

は置換されていてもよく、結合部位は環原子上にある)を有する炭素環式環系を表す。異なるように定義されなていない限り、該ヘテロ環式環は、そのヘテロ環式環中に、好ましくは3~9個の環原子(特に、3~6個の環原子)と1個以上(好ましくは、1~4個、特に、1個、2個又は3個)のヘテロ原子(好ましくは、N、O及びSからなる群から選択されるヘテロ原子)を含んでいるが、2個の酸素原子は直接隣接してはならない。ヘテロ環式環は、通常、4個以下の窒素原子及び/又は2個以下の酸素原子及び/又は2個以下の硫黄原子を含んでいる。ヘテロシクリルラジカル又はヘテロ環式環が置換されていてもよい場合は、そのヘテロシクリルラジカル又はヘテロ環式環は、別の炭素環式環又はヘテロ環式環に縮合し得る。置換されていてもよいヘテロシクリルの場合、本発明は、多環式系、例えば、8-アザビシクロ[3.2.1]オクタニル又は1-アザビシクロ[2.2.1]ヘプチルなども包含する。置換されていてもよいヘテロシクリルの場合、本発明は、スピロ環式系、例えば、1-オキサ-5-アザスピロ[2.3]ヘキシルなども包含する。

10

【0144】

【0121】 本発明によるヘテロシクリル基は、例えば、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、ジオキソラニル、ジオキソリル、ピラゾリジニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、オキセタニル、オキシラニル、アゼチジニル、アジリジニル、オキサゼチジニル、オキサジリジニル、オキサゼパニル、オキサジナニル、アゼパニル、オキソピロリジニル、ジオキソピロリジニル、オキソモルホリニル、オキソピペラジニル及びオキセパニルなどである。

20

【0145】

【0122】 ヘテロアリーレン、即ち、ヘテロ芳香族系が、特に重要である。本発明によれば、表現「ヘテロアリール」は、ヘテロ芳香族化合物、即ち、ヘテロ環の上記定義に包含される完全に不飽和の芳香族ヘテロ環式化合物を表し、好ましくは、上記群から選択される1~3個(好ましくは、1個又は2個)の同一であるか又は異なっているヘテロ原子を有する5~7員の環を表す。本発明によるヘテロアリールは、例えば、フリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル及び1,2,4-トリアゾリル、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、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル及び1,2,5-オキサジアゾリル、アゼピニル、ピロリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル及び1,2,3-トリアジニル、1,2,4-オキサジニル、1,3,2-オキサジニル、1,3,6-オキサジニル及び1,2,6-オキサジニル、オキセピニル、チエピニル、1,2,4-トリアゾロニル、並びに、1,2,4-ジアゼピニルである。本発明によるヘテロアリール基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルでも置換され得る。

30

【0146】

表現「置換されている(されていてもよい)」基/置換基、例えば、置換されているアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、シクロアルキル、アリール、フェニル、ベンジル、ヘテロシクリル及びヘテロアリールラジカルなどは、例えば、置換されていない基礎構造に由来する置換されているラジカルを意味し、ここで、該置換基は、例えば、アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、イソシアノ、メルカプト、イソチオシアナト、 C_1-C_4 -カルボキシ、カルボンアミド、 SF_5 、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_2-C_4 -アルケニル、 C_3-C_4 -シクロアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 N -モノ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 N 、 N -ジ- C_1-C_4 -アルキルアミノ、 N - C_1-C_4 -アルカノイルアミノ、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_2-C_4 -アルケニルオキシ、 C_2-C_4 -アルキニルオキシ、 C_3-C_4 -シクロアルコキシ、 C_3-C_4 -シクロアルケニルオキシ、 C_1-C_4 -アルコキシカルボ

40

50

ニル、 C_2-C_4 — C_2-C_4 —アルケニルオキシカルボニル、 C_2-C_4 —アルキニルオキシカルボニル、 C_6 —アリールオキシカルボニル、 C_{10} —アリールオキシカルボニル、 C_{14} —アリールオキシカルボニル、 C_1-C_4 —アルカノイル、 C_2-C_4 —アルケニルカルボニル、 C_2-C_4 —アルキニルカルボニル、 C_6 —アリールカルボニル、 C_{10} —アリールカルボニル、 C_{14} —アリールカルボニル、 C_1-C_4 —アルキルスルファニル、 C_3-C_4 —シクロアルキルスルファニル、 C_1-C_4 —アルキルチオ、 C_2-C_4 —アルケニルチオ、 C_3-C_4 —シクロアルケニルチオ、 C_2-C_4 —アルキニルチオ、 C_1-C_4 —アルキルスルフェニル、及び、 C_1-C_4 —アルキルスルフィニル（ここで、 C_1-C_4 —アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーが包含される）、 C_1-C_4 —アルキルスルホニル、 N —モノ— C_1-C_4 —アルキルアミノスルホニル、 N 、 N —ジ— C_1-C_4 —アルキルアミノスルホニル、 C_1-C_4 —アルキルホスフィニル、 C_1-C_4 —アルキルホスホニル（ここで、 C_1-C_4 —アルキルホスフィニル及び C_1-C_4 —アルキルホスホニルに関して、両方のエナンチオマーが包含される）、 N — C_1-C_4 —アルキルアミノカルボニル、 N 、 N —ジ— C_1-C_4 —アルキルアミノカルボニル、 N — C_1-C_4 —アルカノイルアミノカルボニル、 N — C_1-C_4 —アルカノイル— N — C_1-C_4 —アルキルアミノカルボニル、 C_6 —アリール、 C_{10} —アリール、 C_{14} —アリール、 C_6 —アリールオキシ、 C_{10} —アリールオキシ、 C_{14} —アリールオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、 C_6 —アリールチオ、 C_{10} —アリールチオ、 C_{14} —アリールチオ、 C_6 —アリールアミノ、 C_{10} —アリールアミノ、 C_{14} —アリールアミノ、ベンジルアミノ、ヘテロシクリル及びトリアルキルシリル、二重結合によって結合している置換基（例えば、 C_1-C_4 —アルキリデン（例えば、メチリデン又はエチリデン）、オキソ基、イミノ基及び置換されているイミノ基）からなる群から選択される1の置換基又は2以上（好ましくは、1、2、3、4、5、6又は7）の置換基である。特に好ましい置換されている基は、ハロゲン化されている基である。2以上のラジカルが1以上の環を形成している場合、これらは、炭素環式、ヘテロ環式、飽和、部分的飽和、不飽和（例えば、芳香族）であることができ、及び、さらに置換されていてもよい。

【0147】

〔0123〕 例として上記で挙げられている置換基（「第1の置換基レベル」）は、それらが炭化水素質成分を含んでいる場合、例えば、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、シアノ、イソシアノ、アジド、アシルアミノ、オキソ基及びイミノ基からそれぞれ独立して選択される置換基のうちの1つ以上で、場合により、それらの中でさらに置換されていてもよい（「第2の置換基レベル」）。用語「置換されている（されていてもよい）」基は、好ましくは、1又は2の置換基レベルのみを包含する。

【0148】

〔0124〕 本発明によるハロゲンで置換された化学基又はハロゲン化された基（例えば、アルキル又はアルコキシ）は、ハロゲンで1置換されているか、又は、置換基の可能な最大数までハロゲンで多置換されている。そのような基は、ハロ基（例えば、ハロアルキル）とも称される。ハロゲンで多置換されている場合、該ハロゲン原子は、同一であっても又は異なってもよく、そして、全てが1個の炭素原子に結合していてもよく又は複数の炭素原子に結合してもよい。ここで、ハロゲンは、特に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し、好ましくは、フッ素、塩素又は臭素を表し、さらに好ましくは、フッ素又はC1を表す。より特定のには、ハロゲンで置換されている基は、モノハロシクロアルキル、例えば、1—フルオロシクロプロピル、2—フルオロシクロプロピル又は1—フルオロシクロブチル、モノハロアルキル、例えば、2—クロロエチル、2—フルオロエチル、1—クロロエチル、1—フルオロエチル、クロロメチル又はフルオロメチル、ペルハロアルキル、例えば、トリクロロメチル又はトリフルオロメチル又は CF_2CF_3 、ポリハロアルキル、例えば、ジフルオロメチル、2—フルオロ—2—クロロエチル、ジクロロメチル、1, 1, 2, 2—テトラフルオロエチル又は2, 2, 2—トリフルオロエチルである。ハロアルキルのさらなる例は、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロ

ロフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル及びペンタフルオロ-*n*-ブチルである。好ましいのは、1~4個の炭素原子とフッ素、塩素及び臭素から選択される1~9個（好ましくは、1~5個）の同一であるか又は異なっているハロゲン原子を有するハロアルキルである。特に好ましいのは、1個又は2個の炭素原子とフッ素及び塩素から選択される1~5個の同一であるか又は異なっているハロゲン原子を有するハロアルキル（例えば、とりわけ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又は2, 2-ジフルオロエチル）である。ハロゲンで置換されている化合物のさらなる例は、ハロアルコキシ基、例えば、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 、 OCH_2CHF_2 及び $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、ハロアルキルスルファニル基、例えば、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ又は2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルチオ、ハロアルキルスルフィニル基、例えば、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、1-フルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2, 2-ジフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル及び2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル基、例えば、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、1-フルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2, 2-ジフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル及び2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル基、例えば、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、1-フルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2, 2-ジフルオロエチルスルホニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル及び2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルホニルである。

【0149】

〔0125〕 炭素原子を有するラジカルの場合、好ましいのは、1~4個の炭素原子（特に、1個又は2個の炭素原子）を有するものである。一般に、ハロゲン（例えば、フッ素及び塩素）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ アルキル（好ましくは、メチル又はエチル）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ ハロアルキル（好ましくは、トリフルオロメチル）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ アルコキシ（好ましくは、メトキシ又はエトキシ）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ ハロアルコキシ、ニトロ及びシアノの群から選択される置換基が好ましい。ここで、特に好ましいのは、置換基メチル、メトキシ、フッ素及び塩素である。

【0150】

〔0126〕 置換されているアミノ（例えば、1置換アミノ又は2置換アミノ）は、例えば、アルキル、ヒドロキシル、アミノ、アルコキシ、アシル及びアリーの群から選択される1又は2の同一であるか又は異なっているラジカルによって、*N*-置換された置換アミノラジカルから選択されるラジカルであり；好ましくは、*N*-モノアルキルアミノ及び*N*, *N*-ジアルキルアミノ（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、*N*, *N*-ジメチルアミノ、*N*, *N*-ジエチルアミノ、*N*, *N*-ジ-*n*-プロピルアミノ、*N*, *N*-ジイソプロピルアミノ又は*N*, *N*-ジブチルアミノ）、*N*-モノアルコキシアリルアミノ又は*N*, *N*-ジアルコキシアリルアミノ基（例えば、*N*-メトキシメチルアミノ、*N*-メトキシエチルアミノ、*N*, *N*-ジ（メトキシメチル）アミノ又は*N*, *N*-ジ（メトキシエチル）アミノ）、*N*-モノアリールアミノ及び*N*, *N*-ジアリールアミノ、例えば、置

10

20

30

40

50

換されていてもよいアニリン、アシルアミノ、N、N-ジアシルアミノ、N-アルキル-N-アリールアミノ、N-アルキル-N-アシルアミノ及び飽和N-ヘテロ環であり；好ましいのは、1～4個の炭素原子を有するアルキルラジカルであり；アリールは、好ましくは、フェニル又は置換されているフェニルであり；アシルは、以下で定義されておりであり、好ましくは、 $(C_1 - C_4)$ -アルカノイルである。同様のことは、置換されているヒドロキシアミノ又はヒドラジノにも適用される。

【0151】

【0127】 本発明によれば、用語「環状アミノ基」は、1個以上の窒素原子を有するヘテロ芳香族環系又は脂肪族環系を包含する。ヘテロ環は、飽和又は不飽和であり、1以上の縮合されていてもよい環系で構成され、そして、さらなるヘテロ原子（例えば、1個又は2個の窒素原子、酸素原子及び／又は硫黄原子）を含んでいてもよい。さらに、この用語は、スピロ環系又は架橋環系を有する基も包含する。環状アミノ基を形成する原子の数は制限されず、例えば、一環系の場合は3～8個の環原子であることができ、及び、二環系の場合は7～11個の原子であることができる。

【0152】

【0128】 ヘテロ原子として窒素原子を有する飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例としては、1-アゼチジニル、ピロリジノ、2-ピロリジン-1-イル、1-ピロリル、ピペリジノ、1,4-ジヒドロピラジン-1-イル、1,2,5,6-テトラヒドロピラジン-1-イル、1,4-ジヒドロピリジン-1-イル、1,2,5,6-テトラヒドロピリジン-1-イル、ホモピペリジニルなどを挙げる事ができ；ヘテロ原子として2個以上の窒素原子を有する飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例としては、1-イミダゾリジニル、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-トリアゾリル、1-テトラゾリル、1-ピペラジニル、1-ホモピペラジニル、1,2-ジヒドロピペラジン-1-イル、1,2-ジヒドロピリミジン-1-イル、ペルヒドロピリミジン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イルなどを挙げる事ができ；ヘテロ原子として1個又は2個の酸素原子及び1～3個の窒素原子を有する飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例としては、例えば、オキサゾリジン-3-イル、2,3-ジヒドロイソキサゾール-2-イル、イソキサゾール-2-イル、1,2,3-オキサジアジン-2-イル、モルホリノなどを挙げる事ができ；ヘテロ原子として1～3個の窒素原子及び1～2個の硫黄原子を有する飽和及び不飽和の単環式基を有する環状アミノ基の例としては、チアゾリジン-3-イル、イソチアゾリン-2-イル、チオモルホリノ又はジオキソチオモルホリノなどを挙げる事ができ；飽和及び不飽和の縮合環状基を有する環状アミノ基の例としては、インドール-1-イル、1,2-ジヒドロベンゾイミダゾール-1-イル、ペルヒドロピロロ[1,2-a]ピラジン-2-イルなどを挙げる事ができ；スピロ環式基を有する環状アミノ基の例としては、2-アザスピロ[4,5]デカン-2-イルなどを挙げる事ができ；架橋ヘテロ環式基を有する環状アミノ基の例としては、2-アザビスシクロ[2.2.1]ヘプタン-7-イルなどを挙げる事ができる。

【0153】

【0129】 置換されているアミノは、さらに、窒素原子上に4つの有機置換基を有する第四級アンモニウム化合物（塩）も包含する。

【0154】

【0130】 置換されていてもよいフェニルは、好ましくは、置換されていないフェニルであるか、又は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルスルファニル、シアノ、イソシアノ及びニトロからなる群から選択される同一であるか若しくは異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているフェニル、例えば、o-トリル、m-トリル及びp-トリル、ジメチルフェニル

、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル及び4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル及び4-フルオロフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル及び4-トリフルオロメチルフェニル、2-トリクロロメチルフェニル、3-トリクロロメチルフェニル及び4-トリクロロメチルフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル及び2, 3-ジクロロフェニル、o-メトキシフェニル、m-メトキシフェニル及びp-メトキシフェニル、4-ヘプタフルオロフェニルである。

【0155】

〔0131〕 置換されていてもよいシクロアルキルは、好ましくは、置換されていないシクロアルキルであるか、又は、ハロゲン、シアノ、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -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) -アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル及び (C_1-C_4) -ハロアルコキシからなる群から選択される同一であるか若しくは異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているシクロアルキル、特に、1又は2の (C_1-C_4) -アルキルラジカルで置換されているシクロアルキルである。

10

【0156】

〔0132〕 置換されていてもよいヘテロシクリルは、好ましくは、置換されていないヘテロシクリルであるか、又は、ハロゲン、シアノ、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -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) -アルコキシ- (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシ、ニトロ及びオキソからなる群から選択される同一であるか又は異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているヘテロシクリル、特に、ハロゲン、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルキル及びオキソからなる群から選択されるラジカルで1置換若しくは多置換されているヘテロシクリル、最も好ましくは、1若しくは2の (C_1-C_4) -アルキルラジカルで置換されているヘテロシクリルである。

20

【0157】

〔0133〕 アルキルで置換されているヘテロアリアル基の例は、フリルメチル、チエニルメチル、ピラゾリルメチル、イミダゾリルメチル、1, 2, 3-トリアゾリルメチル及び1, 2, 4-トリアゾリルメチル、イソオキサゾリルメチル、チアゾリルメチル、イソチアゾリルメチル、1, 2, 3-オキサジアゾリルメチル、1, 3, 4-オキサジアゾリルメチル、1, 2, 4-オキサジアゾリルメチル及び1, 2, 5-オキサジアゾリルメチル、アゼピニルメチル、ピロリルメチル、ピリジルメチル、ピリダジニルメチル、ピリミジニルメチル、ピラジニルメチル、1, 3, 5-トリアジニルメチル、1, 2, 4-トリアジニルメチル及び1, 2, 3-トリアジニルメチル、1, 2, 4-オキサジニルメチル、1, 3, 2-オキサジニルメチル、1, 3, 6-オキサジニルメチル及び1, 2, 6-オキサジニルメチル、オキセピニルメチル、チエピニルメチル、並びに、1, 2, 4-ジアゼピニルメチルである。

30

【0158】

〔0134〕 本発明の化合物は、好ましい実施形態で存在し得る。本明細書に記載されている個々の実施形態は、互いに組み合わせることができる。自然法則に反し、従って、当業者が自身の専門知識に基づいて除外するであろう組合せは含まれない。例えば、隣接する3個以上の酸素原子を有する環構造は除外される。

40

【0159】

異性体

〔0135〕 式(I)で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態、及び／又は、光学活性異性体の形態、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態でも、存在し得る。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、純粋な異性体

50

及びそれら異性体の任意の所望の混合物を包含する。

【0160】

方法及び使用

【0136】 本発明は、さらに、害虫を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、式（I）で表される化合物を害虫及び／又はそれらの生息環境に作用させる。害虫の該防除は、好ましくは、農業及び林業において、並びに、材料物質（material）の保護において、実施される。これは、好ましくは、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。

【0161】

【0137】 本発明は、さらに、殺有害生物剤としての、特に、作物保護剤としての、式（I）で表される化合物の使用にも関する。

【0162】

【0138】 本出願に関連して、用語「殺有害生物剤（pesticide）」は、常に、用語「作物保護剤」も包含する。

【0163】

【0139】 式（I）で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、恒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、貯蔵生産物や材料物質の保護において、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、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。

【0164】

【0140】 本特許出願に関連して、用語「衛生学（hygiene）」は、疾患（特に、感染症）を予防すること、並びに、ヒト、動物及び／若しくは環境を健康に保つのに役立つこと、並びに／又は、清潔を維持することを目的とする、全ての手段、プロセス及び方法の全体を意味するものと理解される。本発明によれば、これには、特に、きれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、例えば、繊維又は硬質表面（主に、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）をきれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、並びに、それらを衛生害虫及び／又はその排泄物が存在していない状態に維持することが包含される。本発明によれば、再度これに関連して、ヒト又は動物の身体を外科的に又は治療的に処置する方法、及び、ヒト又は動物の身体に対してなされる診断プロセスは、除外される。

【0165】

【0141】 かくして、用語「衛生学の分野」には、そのような衛生学的な手段、プロセス及び方法が重要である全ての領域、技術分野及び商業的な利用、例えば、調理場、パン屋、空港、浴場、スイミングプール、ショッピングセンター、ホテル、病院、畜舎などの衛生が包含される。

【0166】

【0142】 従って、用語「衛生害虫」は、衛生学の分野におけるその存在が問題である（特に、健康上の理由で問題である）１種類以上の害虫を意味するものと理解される。従って、主な目的は、衛生害虫を最小限に抑制するか若しくは防止すること、又は、衛生学の分野において衛生害虫との接触を最小限に抑制するか若しくは防止することである。このことは、特に、殺害虫剤を使用することによって達成することが可能であり、ここで、該殺害虫剤は、予防的に使用することが可能であり、及び、害虫が発生している場合においてのみ、その害虫を防除するために使用することが可能である。害虫との接触を回避するか又は低減させることによって作用する薬剤を使用することも可能である。衛生害虫は、例えば、以下に挙げられている生物である。

【0167】

【0143】 かくして、用語「衛生学的な保護」には、そのような衛生学的な手段、プロセス及び方法を維持及び／又は改善するのに役立つ全ての行為が包含される。

【0168】

【0144】 式(I)で表される化合物は、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有効であり、並びに、さらに、全ての発育段階又は特定の発育段階に対して活性を示す。上記害虫としては、以下のものを挙げることができる：

【0145】 節足動物門の害虫、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 s 10
i ro)、アケリア・クコ(Aceria kuko)、アケリア・シェルドニ(Ace
ria sheldoni)、アクロプス属種(Aculops spp.)、アクルス
属種(Aculus spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ(Aculus f
ockeui)、アクルス・シュレクテンダリ(Aculus schlechtend
ali)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アムフィテトラニク
ス・ピエネンシス(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(Bryobi 20
a praetiosa)、セントルロイデス属種(Centruroides spp
.)、コリオプテス属種(Choriopetes spp.)、デルマニسس・ガリナエ
(Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス・プテロニシス
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(Eote
tranychus spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ(Eote
tranychus hicoriae)、エピトリメルス・ピリ(Epitrimerus
s 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 30
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(Glycyphag
us 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 s
pp.)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス(Hemitarsonemus lat
us) (=ポリファゴタルソネムス・ラツス(Polyphagotarsonemus
latus))、ヒアロンマ属種(Hyalomma spp.)、イキソデス属種(I
xodes spp.)、ラトロデクツス属種(Latrodectus spp.)
、ロキソスケレス属種(Loxosceles spp.)、ネウトロムビクラ・アウツ
ムナリス(Neutrombicula autumnalis)、ヌフェルサ属種(N 40
uphersa spp.)、オリゴニクス属種(Oligonychus spp.)
、例えば、オリゴニクス・コフエアエ(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(O
ligonychus mangiferus)、オリゴニクス・プラテンシス(Ol
igonychus pratensis)、オリゴニクス・プニカエ(Oligony
chus punicae)、オリゴニクス・イオテルシ(Oligonychus y
othersi)、オルニトドルス属種(Ornithodoros spp.)、オル
ニトニسس属種(Ornithonyssus spp.)、パノニクス属種(Pano 50

nychus 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 multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピンキ (*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 (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコベルシシ (*Vasates lycopersici*) ;

10

20

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*)、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*) ;

30

40

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 (*Acanthosc elides obtectus*)、アドレッツス属種 (*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

50

(*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・グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus* spp.)、アピオン属種 (*Apion* spp.)、アポゴニア属種 (*Apogonia* spp.)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus* spp.)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulea*)、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・ルフイマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorrhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites* spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*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 caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*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 undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera 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

10

20

30

40

50

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 subcristata*)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faustinus* spp.)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx* spp.)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポストカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・プベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサンガイネア (*Lachnosterna consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius* spp.)、レマ属種 (*Lema* spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リストロノツス属種 (*Listronotus* spp.) (=ヒペロデス属種 (*Hyperodes* spp.)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、ルペロデス属種 (*Luperodes* spp.)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、リクツス属種 (*Lycetus* spp.)、メガセリス属種 (*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.)、ナウパクツス・キサントグラフィ (*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 cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorhynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiorhynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiorhynchus rugosostriatus*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorhynchus 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* s

pp.)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllotreta armoraciae*)、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*)、リンコホルス属種 (*Rhynchophorus* spp.)、リンコホルス・フェルギネウス (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パルマルム (*Rhynchophorus palmarum*)、シノキシロン・ペルホランス (*Sinoxylon perforans*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種 (*Sphenophorus* spp.)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属種 (*Sternechus* spp.)、例えば、ステルネクス・パルダツス (*Sternechus paludatus*)、シムフィレテス属種 (*Symphyletes* spp.)、タニメクス属種 (*Tanymecus* spp.)、例えば、タニメクス・ジラチコリス (*Tanymecus dilaticollis*)、タニメクス・インジクス (*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パリアツス (*Tanymecus palliatus*)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebrio ides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium* spp.)、例えば、トリボリウム・アウダキス (*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム (*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma* spp.)、チキウス属種 (*Tychius* spp.)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus* spp.)、ザブルス属種 (*Zabrus* spp.)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrioides*) ;

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

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes* spp.)、例えば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種 (*Agromyza* spp.)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha* spp.)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属種 (*Asphondylia*

a 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.) 10、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・ピピエンシス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリセタ属種 (*Culiseta* spp.)、クテレブラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura* spp.)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デリア属種 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アントクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロリレガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia platyura*)、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*)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミイア属種 (*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属種 (*Mansonina* 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・フリット (*Oscinella frit*)、パラタニタルス属種 (*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミア又はペゴミイア属種 (*Pegomya* or 50

Pegomyia spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒオシアミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophila casei*)、プラチパレア・ポエシロプテラ (*Platyparea poeciloptera*)、プロジプロシス属種 (*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラタ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種 (*Tetanops* spp.)、チプラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チプラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チプラ・シムプレキス (*Tipula simplex*)、トキシトリパナ・クルビカウダ (*Toxotrypana curvicauda*) ;

10

20

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*)、アシルトシホン属種 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシホン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocanthus* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes prolella*)、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 glycines*)、アフイス・ゴシパイ (*Aphis gossypii*)、アフイス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフイス・イリノイセンシス (*Aphis illinoisensis*)、アフイス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフイス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフイス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフイス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフイス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフイス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla*

30

40

50

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 (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコプシラ・ピリコ 10
ラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、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 (*Ceratovacuna 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 (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*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 20
ッコミチルス・ハリイ (*Coccoomytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus 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 viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・キテンデニ (*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ジウラフィス属種 (*Diuraphis* spp.)、ドラリス属種 (*Doralis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムポアスカ属種 (*Empoasca* spp.)、例えば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ (*Empoasca faba*)、エムポアスカ・マリグナ (*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エムポアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属種 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム (*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*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.)、エウセルリス・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 (*Furcas* 30
40
50

pis oceanica)、ゲオコックス・コフェアエ (Geococcus coffeae)、グリカスピス属種 (Glycaspis spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (Heteropsylla cubana)、ヘテロプシラ・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・プルカシ (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 (Lopholeuca sp. 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・ファシフロンス (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 pecanisi)、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)、ネチゴニセラ・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 (Pemphigus 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 populiveneris)、ペレグリンウス・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)、プロエオミズス・パッセリニイ (Phloeomyzus

10

20

30

40

50

passerinii)、ホロドン・フマリ(Phorodon humi)、
 フィロキセラ属種(Phylloxera spp.)、例えば、フィロキセラ・デバ
 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 fla
 va)、プロトプルビナリア・ピリホルミス(Protopulvinaria pyr
 iformis)、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 ca
 lceolariae)、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(Pulvi
 naria spp.)、ピリラ属種(Pyrrilla 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 juglansregi
 ae)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス(Quadraspidiotu
 s ostreaeformis)、クアドラスピジオツス・ペルニシオスス(Quad
 raspidiotus perniciosus)、クエサダ・ギガス(Quesada
 gigas)、ラストロコックス属種(Rastrococcus spp.)、ロ
 パロシウム属種(Rhopalosiphum spp.)、例えば、ロパロシウム・マ
 イジス(Rhopalosiphum maidis)、ロパロシウム・オキシアカンタ
 エ(Rhopalosiphum oxyacanthae)、ロパロシウム・パジ
 (Rhopalosiphum padi)、ロパロシウム・ルフィアブドミナレ(Rho
 palosiphum rufiabdominale)、サイセチア属種(Saissetia spp.)、
 10
 20
 30
 40
 50

Triozia diospyri）、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.）、ウナスピス属種 (*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・ジルトス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウェッチ (*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 hero*s)、エウスキスツス・セルブス (*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.)、ハリオモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオパルチス属種 (*Heliopeletis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリサ属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトコリサ・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 (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリスス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、メガコプタ・クリブラリア (*Megacopta cribraria*)、ミリダエ (*Miridae*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonion atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (*Nezara viridula*)、ニシウス属種 (*Nysius* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、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 perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* 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.)、カムボ

10

20

30

40

50

ノツス属種 (*Camponotus* spp.)、ドリコベスブラ属種 (*Dolichovespula* spp.)、ジプリオン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジプリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカムパ・テスツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、リネピテマ (イリジオミルメクス)・フミレ (*Linepithema (Iridiomyrmex) humile*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラトレキナ属種 (*Paratrechina* spp.)、パラベスブラ属種 (*Paravespula* spp.)、プラギオレピス属種 (*Plagiolepis* spp.)、シレキス属種 (*Sirex* spp.)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属種 (*Tapinoma* spp.)、テクノミルメクス・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*)、ポルセリオ・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 (*Kaloterme* 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*)、アドキシソフィエス属種 (*Adoxophyes* spp.)、例えば、アドキシソフィエス・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 (*Argyroploce* spp.)、アウトグラフィ属種 (*Autographa* spp.)、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブラストデクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブククラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ブッセオラ属種 (*Busseola* spp.)、カコエシア属種 (*Cacoecia* spp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)

10

20

30

40

50

)、カルボカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルボシ
 ナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトビア・ブル
 マタ (*Cheimatobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo* spp.)
 、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプ
 レッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Cho*
reutis pariana)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura*
 spp.)、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcit*
es)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロ
 セルス属種 (*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリ
 ス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cne* 10
phasia spp.)、コノポモルファ属種 (*Conopomorpha* spp.)
)、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属種
 (*Copitarsia* spp.)、シジア属種 (*Cydia* spp.)、例えば、
 シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydi*
a pomonella)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*
)、ジアファニア属種 (*Diaphania* spp.)、ジパロプシス属種 (*Dipa*
ropsis spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea sacc*
haralis)、エアリアス属種 (*Earias* spp.)、エクジトロファ・アウ
 ランチウム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモパルプス・リグ
 ノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリ 20
 ナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*Ephestia* s
 pp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、
 エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア
 属種 (*Epinotia* spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphy*
a postvittana)、エランニス属種 (*Erannis* spp.)、エルス
 コビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana*)、エチエラ属
 種 (*Etiella* spp.)、エウドシマ属種 (*Eudocima* spp.)、エ
 ウリア属種 (*Eulia* spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ (*Eupoeci*
lia 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 chrysorrh* 30
oea)、エウキソア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*Feltia*
 spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラシ
 ラリア属種 (*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属種 (*Grapholi*
tha spp.)、例えば、グラホリタ・モレスト (*Grapholita mole*
sta)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholita prunivora*)、ヘ
 ジレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicove*
rpa spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa a*
rmigera)、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 (*Heli*
othis virescens)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofm* 40
annophila pseudospretella)、ホモエオソマ属種 (*Homo*
eosoma spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パ
 デラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*K*
akivoria flavofasciata)、ランピデス属種 (*Lampides*
 spp.)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、ラスペイレシア・モレ
 スタ (*Laspeyresia molesta*)、レウシノデス・オルボナリス (*Le*
ucinodes 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 coffee*
lla)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リト
 コレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*) 50

、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア
 属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia bo-
 otrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albico-
 sta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア
 ・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia*
 spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マ
 ラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ
 ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Ma-
 mestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis le-
 da*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis* 10
obviella)、ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata*)、
 ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属
 種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketis* spp.)、
 オンフィサ属種 (*Omphisa* spp.)、オペロフテラ属種 (*Operoph-
 tera* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Ortha-
 ga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オスト
 リニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フランメア
 (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペ
 クチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッ
 シピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属 20
 種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorima-
 eae* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea*
operculella)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis*
citrella)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.
 .)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter* *blancardella*)、
 フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonorycter* *crataegella*)、
 ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば、
 ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Plat-
 ynota stultana*)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia in-
 terpunctella*)、プルシア属種 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キ 30
 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 (*Prays* sp.
 p.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プロトバルセ属種 (*Prot-
 oparce* spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseudaletia* spp.)、
 例えば、プセウダレチア・ユニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、
 プセウドプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia include-
 ns*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキブル
 シア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobi-
 us* spp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (*Schoenobi-
 us bipunctifer*)、シルポファガ属種 (*Scirpophaga* spp. 40
)、例えば、シルポファガ・インノタタ (*Scirpophaga innotata*)、
 スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Sesami-
 a* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferen-
 s*)、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 (*Spodo-
 ptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera*
exigua)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugipe-
 rda*)、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 (*Stenom-
 a* spp.)、ストモプテリキス・スブセシベラ (*Stomopteryx subs* 50

ecivella)、シナンテドン属種 (*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、タウメトポエア属種 (*Thaumetopoea* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)、例えば、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属種 (*Virachola* spp.)；

バッタ目 (*Orthoptera*) 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*)；

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

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

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

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、カエタナホトリプス・レエウウェニ (*Chaetanaphothrips leeuweni*)、ドレパノトリプス・レウテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エンネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella* spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ (*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オッシデンタリス (*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・スクルトゼイ (*Frankliniella schultzei*)、フランクリニエラ・トリチシ (*Frankliniella tritici*)、フランクリニエラ・バシニイ (*Frankliniella vaccinii*)、フランクリニエラ・ウィリアムシ (*Frankliniella williamsi*)、ハプロトリプス属種 (*Haplothrips* spp.)、へ

10

20

30

40

50

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*)、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.)、タエニノトリプス・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*)；

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*)；

10

コムカデ綱 (*Symphyla*) 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*) の害虫、特に、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、

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.)；

20

扁形動物門 (*Platyhelminthes*) 及び線形動物門 (*Nematoda*) の、動物及びヒトの寄生生物、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.)、例えば、アンシロストマ・ズオデナレ (*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストマ・セイラニクム (*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロストマ・ブラジリエンシス (*Ancylostoma braziliensis*)、アンギオストロンギルス属種 (*Angiostrongylus* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala* spp.)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、アスカリジア属種 (*Ascaridia* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、例えば、ブルギア・マライイ (*Brugia malayi*)、ブルギア・チモリ (*Brugia timori*)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、クロノルキス属種 (*Clo* 40
norchis spp.)、コオペリア属種 (*Cooperia* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、シアトストマ属種 (*Cyathostoma* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、例えば、ジクチオカウルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、例えば、ジフィロボトリウム・ラツム (*Diphyllobothrium latum*)、ジピリジウム属種 (*Dipylidium* spp.)、ジロフィラリア (*Dirofilaria* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、例えば、ドラクンクルス・メジネンシス (*Dracunculus medinensis*)、エキノコックス属種 (*E* 50

chinococcus spp.)、例えば、エキノコックス・グラヌロルス (*Echinococcus granulosus*)、エキノコックス・マルチロクラリス (*Echinococcus multilocularis*)、エキノストマ属種 (*Echinostoma* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、例えば、エンテロビウス・ベルミクラリス (*Enterobius vermicularis*)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス属種 (*Fascioloides* spp.)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、フィロロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ハブロンネマ属種 (*Habronema* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、例えば、ヒメノレピス・ナナ (*Hymenolepis nana*)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostrongylus* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、例えば、ロア・ロア (*Loa Loa*)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、メトルキス属種 (*Metorchis* spp.)、メソセストイデス属種 (*Mesocestoides* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* 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.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、例えば、オンコセルカ・ボルブルス (*Onchocerca volvulus*)、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パッサルルス属種 (*Passalurus* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スキストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* 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.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)、例えば、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、例えば、タエニア・サギナタ (*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム (*Taenia solium*)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* 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.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)、例えば、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・プセウドブ

シラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコビルハル
 ジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichoststrongylus* spp.)、トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、例えば、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria*)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、例えば、ウケレリア・バンクロフト (*Wuchereria bancrofti*) ;

線形動物門 (*Nematoda*) の植物害虫 (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.)、
 10 例えば、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデス・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 nortonii*)、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
 20 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*)、クリコネメラ・キセノプラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノプラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Criconemoi*
 30 *des* spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemoi*
des ferniae)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoi*
des onoense)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoi*
des ornatum)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、
 40 例えば、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコドルス属種 (*Dolichodorus* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystra*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoi*
 50 *des* spp.)、ヘミシクリオホラ属種 (*Hemicycliophora* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycine*s)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ヒルスクマニエラ属種 (*Hirschmaniella* spp.)、ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longidorus* spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、例えば、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファ

ラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコブス属種 (*Nacobbus* spp.)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus* spp.)、パロンギドルス属種 (*Paralongidorus* spp.)、パラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus* spp.)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus* spp.)、例えば、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラチレンクス属種 (*Paratylenchus* spp.)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus* spp.)、プシレンクス属種 (*Psilenchus* spp.)、プンクトデラ属種 (*Punctodera* spp.)、クイニスルシウス属種 (*Quinisulcius* spp.)、ラドホルス属種 (*Radopholus* spp.)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus* spp.)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus* spp.)、スクテロネマ属種 (*Scutellonema* spp.)、スバングイナ属種 (*Subanguina* spp.)、トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス (*Trichodorus obtusus*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス (*Tylenchorhynchus annulatus*)、チレンクルス属種 (*Tylenchulus* spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)。

【0169】

【0148】 さらにまた、原生動物亜界 (*Protozoa*) の、コクシジウム目 (*Coccidia*)、例えば、エイメリア属種 (*Eimeria* spp.) などでも防除することができる。

【0170】

線虫類

【0149】 本発明に関連して、用語「線虫類」は、線形動物門の全ての種を包含し、ここで、特に、植物若しくは菌類に対する寄生性生物として作用するか又はこれらの生物の体内若しくは表面上に損傷を引き起こす種 (例えば、アフェレンキダ目 (*Aphelenchida*)、メロイドギネ目 (*Meloidogyne*)、チレンキダ目 (*Tylenchida*) などの目の各種)、又は、ヒト及び動物に対する寄生性生物として作用するか又はこれらの生物の体内若しくは表面上に損傷を引き起こす種 (例えば、トリキネリダ目 (*Trichinellida*)、チレンキダ目 (*Tylenchida*)、ラブリヂチダ目 (*Rhabditida*) 及びスピルリダ目 (*Spirurida*) などの目の各種) を包含し、及び、さらに、別の寄生性の蠕虫類も包含する。

【0171】

【0150】 作物保護における殺線虫剤は、本明細書中に記載されている場合、線虫類を防除することが可能である。

【0172】

【0151】 用語「線虫類を防除する (*controlling nematodes*)」は、線虫類を殺すことを意味するか、又は、線虫類の発育若しくは成長を妨げるか若しくは遅延させることを意味するか、又は、線虫類が植物組織の中に侵入するか若しくは植物組織から吸汁することを妨げるか若しくは遅延させることを意味する。

【0173】

【0152】 ここで、当該化合物の効力は、式（I）で表される化合物で処理された植物若しくは植物の部分又は処理された土壌と処理されていない植物若しくは植物の部分又は処理されていない土壌（100%）の間で、線虫類の死虫率、こぶの形成、シストの形成、土壌の単位体積当たりの線虫類の密度、根1本当たりの線虫類の密度、土壌の単位体積当たりの線虫の卵の数、線虫類の運動性を比較することによって、確認される。好ましくは、処理されていない植物、植物の部分又は処理されていない土壌と比較して、25～50%の低減が達成され、さらに好ましくは、51～79%の低減が達成され、及び、最も好ましくは、撲滅すること、又は、線虫類の発育及び成長の完全な防止（80%～100%低減）が達成される。本明細書中に記載されている「線虫類の防除」は、線虫類の増殖（シスト及び／又は卵の発育）を防除することも意味する。さらにまた、式（I）で表される化合物は、植物又は動物を健康な状態に維持するために使用することも可能であり、及び、線虫類を防除するために、治療的に、予防的に又は全身的に使用することも可能である。

10

【0174】

【0153】 当業者は、線虫類の死虫率、こぶの形成、シストの形成、土壌の単位体積当たりの線虫類の密度、根1本当たりの線虫類の密度、土壌の単位体積当たりの線虫の卵の数、線虫類の運動性について確認する方法を知っている。

【0175】

【0154】 式（I）で表される化合物を使用することで、植物を健康な状態に維持することが可能であり、また、式（I）で表される化合物を使用することは、線虫類に起因する損傷を低減させること及び収穫量を増大させることも包含する。

20

【0176】

【0155】 本発明に関連して、用語「線虫類」は、植物に対して損傷を引き起こす全ての線虫を包含する植物線虫類を示している。植物線虫類は、植物寄生性線虫類及び土壌介在性線虫類を包含する。植物寄生性線虫類としては、以下のものを挙げることができる：外部寄生虫、例えば、キシフィネマ属種（*Xiphinema* spp.）、ロングドルス属種（*Longidorus* spp.）及びトリコドルス属種（*Trichodorus* spp.）；半寄生虫、例えば、チレンクルス属種（*Tylenchulus* spp.）；移動性内部寄生虫（migratory endoparasite）、例えば、ブラチレンクス属種（*Pratylenchus* spp.）、ラドホルス属種（*Radopholus* spp.）及びスクテロネマ属種（*Scutellonema* spp.）；非移動性寄生虫（non-migratory parasite）、例えば、ヘテロデラ属種（*Heterodera* spp.）、グロボデラ属種（*Globodera* spp.）及びメロイドギネ属種（*Meloidogyne* spp.）；及び、さらに、茎及び葉内部寄生虫、例えば、ジチレンクス属種（*Ditylenchus* spp.）、アフエレンコイデス属種（*Aphelenchoides* spp.）及びヒルシュマニエラ属種（*Hirschmaniella* spp.）。特に有害な根寄生性土壌線虫類は、例えば、ヘテロデラ属（*Heterodera*）若しくはグロボデラ属（*Globodera*）のシスト形成性線虫類、及び／又は、メロイドギネ属（*Meloidogyne*）のネコブ線虫類などである。これらの属の有害な種は、例えば、以下のものである：メロイドギネ・インコグニタ（*Meloidogyne incognita*）、ヘテロデラ・グリシネス（*Heterodera glycines*）（ダイズシストセンチュウ）、グロボデラ・パリダ（*Globodera pallida*）及びグロボデラ・ロストキエンシス（*Globodera rostochiensis*）（ジャガイモシストセンチュウ）；これらの種は、本明細書中に記載されている化合物で効果的に防除される。しかしながら、本明細書中に記載されている化合物を使用することは、決してこれらの属又は種に限定されるものではなく、さらに、他の線虫類にも同様に及ぶ。

30

40

【0177】

50

[0156] 植物線虫類としては、例えば、以下のものを挙げることができる： ア
グレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ・トリ
チシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデス・フラガリア (*Aphelenchoides fragariae*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、アフ
エレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、ベロノライムス・グラ
シリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカ
ウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス
・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス・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*)、及び
、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、カコパウル
ス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノプラキス (*Criconemella xenoplax*)
(=メソクリコネマ・キセノプラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、及び、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、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 onense*)、クリコネモイデス・
オルナツム (*Criconemoides ornatum*)、及び、クリコネモイデス
属種 (*Criconemoides* spp.)、ジチレンクス・デストルクトル (*Ditylenchus destructor*)、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ジチレンクス・ミセリオファグス (*Ditylenchus myceliophagus*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、ジチレンクス属種
(*Ditylenchus* spp.)、ドリコドルス・ヘテロセファルス (*Dolichodorus heterocephalus*)、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*) (=ヘテロデラ・パリダ (*Heterodera pallida*))、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*) (ジャガイモシストセンチュウ)、グロボデラ・ソラナセアルム (*Globodera solanacearum*)、グロボデラ・タバクム (*Globodera tabacum*)、グロボデラ・ビルギニア (*Globodera virginia*)、
並びに、非移動性シスト形成性寄生虫、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、ヘリコチレンクス・ジゴニクス (*Helicotylenchus digonicus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystrera*)、ヘリコチレンクス・エリトリネ (*Helicotylenchus erythriner*)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*)、ヘリコチレンクス・ナンヌス (*Helicotylenchus nannus*)、ヘリコチレンクス・プセウドロボスツス (*Helicotylenchus pseudorobustus*)、及び、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、ヘミクリコネモイデス (*Hemicriconemoides*)、ヘミシクリオホラ・アレナリア (*Hemicycliophora arenaria*)、ヘミシクリオホラ・ヌダタ (*Hemicycliophora nudata*)、ヘミシクリオホラ・パルバナ (*Hemicycliophora parvana*)、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテ
ロデラ・クルシフェラエ (*Heterodera cruciferae*)、ヘテロデラ
・グリシネス (*Heterodera glycines*) (ダイズシストセンチュウ)
、ヘテロデラ・オリザエ (*Heterodera oryzae*)、ヘテロデラ・スカハ

10

20

30

40

50

クチイ (*Heterodera schachtii*)、ヘテロデラ・ゼアエ (*Heterodera zeae*)、並びに、非移動性シスト形成性線虫、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、ヒルシュマニエラ・グラシリス (*Hirschmanella gracilis*)、ヒルシュマニエラ・オリザエ (*Hirschmanella oryzae*)、ヒルシュマニエラ・スピニカウダタ (*Hirschmanella spinicaudata*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、ヒルシュマニエラ属種、ホプロライムス・アエギプチイ (*Hoplolaimus aegyptii*)、ホプロライムス・カリホルニクス (*Hoplolaimus californicus*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、ホプロライムス・インジクス (*Hoplolaimus indicus*)、ホプロライムス・マグニ
 スチルス (*Hoplolaimus magnistylus*)、ホプロライムス・パラ
 ロブスツス (*Hoplolaimus pararobustus*)、ロンギドルス・ア
 フリカヌス (*Longidorus africanus*)、ロンギドルス・ブレビアン
 スラツス (*Longidorus breviannulatus*)、ロンギドルス・エ
 ロンガツス (*Longidorus elongatus*)、ロンギドルス・ラエビカピ
 タツス (*Longidorus laevicapitatus*)、ロンギドルス・ビネ
 アコラ (*Longidorus vineacola*)、及び、外部寄生虫、ロンギドル
 ス属種 (*Longidorus* spp.)、メロイドギネ・アクロネア (*Meloidogyne acronea*)、メロイドギネ・アフリカナ (*Meloidogyne
 africana*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arena
 ria*)、メロイドギネ・アレナリア・タメシ (*Meloidogyne arenar
 ia thamesi*)、メロイドギネ・アルチエラ (*Meloidogyne art
 iella*)、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoo
 di*)、メロイドギネ・コフェイコラ (*Meloidogyne coffeicola*)、メロイドギネ・エチオピカ (*Meloidogyne ethiopica*)、メロ
 イドギネ・エキシグア (*Meloidogyne exigua*)、メロイドギネ・ファ
 ラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・グラミニコラ (*Me
 loidogyne graminicola*)、メロイドギネ・グラミニス (*Melo
 idogyne graminis*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne
 hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incogn
 ita*)、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ (*Meloidogyne inco
 gnita acrita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne j
 avanica*)、メロイドギネ・キクイエンス (*Meloidogyne kiku
 yensis*)、メロイドギネ・ミノル (*Meloidogyne minor*)、メロ
 イドギネ・ナアシ (*Meloidogyne naasi*)、メロイドギネ・パラナエン
 シス (*Meloidogyne paranaensis*)、メロイドギネ・タメシ (*Me
 loidogyne thamesi*)、及び、非移動性寄生虫、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコブス・アベルランス (*Nacobbus aberrans*)、ネオチレンクス
 ・ビギシ (*Neotylenchus vigissi*)、パラフェレンクス・プセウド
 パリエチヌス (*Paraphelenchus pseudoparietinus*)、
 パラトリコドルス・アリウス (*Paratrichodorus allius*)、パラ
 トリコドルス・ロバツス (*Paratrichodorus lobatus*)、パラト
 リコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラトリコドル
 ス・ナヌス (*Paratrichodorus nanus*)、パラトリコドルス・ポロ
 ス (*Paratrichodorus porosus*)、パラトリコドルス・テレス
 (*Paratrichodorus teres*)、及び、パラトリコドルス属種 (*Pa
 ratrichodorus* spp.)、パラチレンクス・ハマツス (*Paratylench
 enchus hamatus*)、パラチレンクス・ミヌツス (*Paratylench*

10

20

30

40

50

us minutus)、パラチレンクス・プロジェクトス (Paratylenchus projectus)、及び、パラチレンクス属種 (Paratylenchus spp.)、プラチレンクス・アギリス (Pratylenchus agilis)、プラチレンクス・アレニ (Pratylenchus allenii)、プラチレンクス・アンジヌス (Pratylenchus andinus)、プラチレンクス・ブラキウルス (Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・セアリス (Pratylenchus cerealis)、プラチレンクス・コフェアエ (Pratylenchus coffeae)、プラチレンクス・クレナツス (Pratylenchus crenatus)、プラチレンクス・デラトレイ (Pratylenchus delattrei)、プラチレンクス・ギイビカウダツス (Pratylenchus giibbicaudatus)、プラチレンクス・ゴオデイイ (Pratylenchus goodeyi)、プラチレンクス・ハマツス (Pratylenchus hamatus)、プラチレンクス・ヘキシシス (Pratylenchus hexincisus)、プラチレンクス・ロオシ (Pratylenchus loosii)、プラチレンクス・ネグレクツス (Pratylenchus neglectus)、プラチレンクス・ペネトランス (Pratylenchus penetrans)、プラチレンクス・プラテンシス (Pratylenchus pratensis)、プラチレンクス・スクリブネリ (Pratylenchus scribneri)、プラチレンクス・テレス (Pratylenchus teres)、プラチレンクス・トルネイ (Pratylenchus thornei)、プラチレンクス・ブルヌス (Pratylenchus vulnus)、プラチレンクス・ゼアエ (Pratylenchus zeaee)、及び、移動性内部寄生虫、プラチレンクス属種 (Pratylenchus spp.)、プセウドハレンクス・ミヌツス (Pseudohalenchus minutus)、プシレンクス・マグニデンス (Psilenchus magnidens)、プシレンクス・ツミズス (Psilenchus tumidus)、プンクトデラ・カルコエンシス (Punctodera chalcensis)、キニスルシウス・アクツス (Quinisulcius acutus)、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)、移動性内部寄生虫、ラドホルス属種 (Radopholus spp.)、ロチレンクルス・ボレアリス (Rotylenchulus borealis)、ロチレンクルス・パルプス (Rotylenchulus parvus)、ロチレンクルス・レニホルミス (Rotylenchulus reniformis)、及び、ロチレンクルス属種 (Rotylenchulus spp.)、ロチレンクス・ラウレンチヌス (Rotylenchus laurentinus)、ロチレンクス・マクロドラツス (Rotylenchus macrodorus)、ロチレンクス・ロブスツス (Rotylenchus robustus)、ロチレンクス・ユニホルミス (Rotylenchus uniformis)、及び、ロチレンクス属種 (Rotylenchus spp.)、スクテロネマ・ブラキウルム (Scutellonema brachyurum)、スクテロネマ・ブラジス (Scutellonema bradys)、スクテロネマ・クラトリカウダツム (Scutellonema clathricaudatum)、及び、移動性内部寄生虫、スクテロネマ属種 (Scutellonema spp.)、スバングイナ・ラジシオラ (Subanguina radiciola)、テチレンクス・ニコチアナエ (Tetylenchus nicotianae)、トリコドルス・シリンドリクス (Trichodorus cylindricus)、トリコドルス・ミノル (Trichodorus minor)、トリコドルス・プリミチプス (Trichodorus primitivus)、トリコドルス・プロキシムス (Trichodorus proximus)、トリコドルス・シミリス (Trichodorus similis)、トリコドルス・スパルス (Trichodorus sparsus)、及び、外部寄生虫

10

20

30

40

50

、トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、チレンコリンクス・アグリ (*Tylenchorhynchus agri*)、チレンコリンクス・ブラシカエ (*Tylenchorhynchus brassicae*)、チレンコリンクス・クラルス (*Tylenchorhynchus clarus*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・ジギタツス (*Tylenchorhynchus digitatus*)、チレンコリンクス・エブリエンシス (*Tylenchorhynchus ebreiensis*)、チレンコリンクス・マキシムス (*Tylenchorhynchus maximus*)、チレンコリンクス・ヌズス (*Tylenchorhynchus nudus*)、チレンコリンクス・ブルガリス (*Tylenchorhynchus vulgaris*)、及び、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、及び、半寄生虫、チレンクルス属種 (*Tylenchulus* spp.)、キシフィネマ・アメリカナム (*Xiphinema americanum*)、キシフィネマ・ブレビコレ (*Xiphinema brevicolle*)、キシフィネマ・ジモルフィカウダツム (*Xiphinema dimorphicaudatum*)、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)、及び、外部寄生虫、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)。

【0178】

〔0157〕 防除するために式 (I) で表される化合物を使用することが可能な線虫類としては、以下のものを挙げることができる： メロイドギネ属の線虫、例えば、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、及び、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*)； ジチレンクス属の線虫、例えば、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、及び、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*)； プラチレンクス属の線虫、例えば、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、キクネグサレセンチュウ (*Pratylenchus fallax*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、チャネグサレセンチュウ (*Pratylenchus loosii*)、及び、クルミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus vulnus*)； グロボデラ属の線虫、例えば、ジャガイモシストセンチュウ (*yellow potato cyst nematode*) (*Globodera rostochiensis*)、及び、ジャガイモシストセンチュウ (*white potato cyst nematode*) (*Globodera pallida*)； ヘテロデラ属の線虫、例えば、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、及び、テンサイシストセンチュウ (*beet cyst eelworm*) (*Heterodera schachtii*)； アフェレンコイデス属の線虫、例えば、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、ハガレセンチュウ (*chrysanthemum nematode*) (*Aphelenchoides ritzemabosi*)、及び、イチゴセンチュウ (*Aphelenchoides fragariae*)； アフェレンクス属の線虫、例えば、ニセネグサレセンチュウ (*fungivorous nematode*) (*Aphelenchus avenae*)； ラドホルス属の線虫、例えば、ネモグリセンチュウ (*burrowing nematode*) (*Radopholus similis*)； チレンクルス属の線虫、例えば、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)； ロチレンクルス属の線虫、例えば、ニセフクロセンチュウ (*Rotylenchulus reniformis*)； 樹木に生息する線虫、例えば、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*)、及び、赤輪病センチュウ (*red ring nematode*) (*Bursaphelench*

10

20

30

40

50

us cocophilus) ; など。

【0179】

【0158】 保護するために式 (I) で表される化合物を使用することが可能な植物としては、例えば、以下のものを挙げることができる： 禾穀類（例えば、イネ、オオムギ、コムギ、ライムギ、エンバク、トウモロコシなど）、マメ類（ダイズ、アズキ、ソラマメ、エンドウマメ、ピーナッツなど）、果樹／果実（リンゴ、柑橘類、ナシ、ブドウの木、モモ、ウメ、サクラ、クルミ、アーモンド、バナナ、イチゴなど）、野菜種（キャベツ、トマト、ホウレンソウ、ブロッコリー、レタス、タマネギ、ネギ、コショウなど）、根菜類（ニンジン、ジャガイモ、サツマイモ、ラディッシュ、レンコン、カブなど）、工業原料用の植物（ワタ、アサ、カジノキ、ミツマタ、アブラナ、ビート、ホップ、サトウキビ、テンサイ、オリーブ、ゴム、ヤシ、コーヒー、タバコ、チャなど）、ウリ科植物（カボチャ、キュウリ、スイカ、メロンなど）、牧草類（カモガヤ、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファなど）、芝草類（コウシュンシバ (*mascarene grass*)、ベントグラスなど）、香料植物など（ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、コショウ、ショウガなど）、及び、花卉類（キク、バラ、ランなど）。

【0180】

【0159】 式 (I) で表される化合物は、コーヒーの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、メロイドギネ・エキシグア (*Meloidogyne exigua*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・コフェイコラ (*Meloidogyne coffeicola*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、及び、さらに、メロイドギネ・パラナエンシス (*Meloidogyne paranaensis*)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus* spp.)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、及び、スクテロネマ属種 (*Scutellonema* spp.)。

【0181】

【0160】 式 (I) で表される化合物は、ジャガイモの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、及び、さらに、プラチレンクス・アレニ (*Pratylenchus alleeni*)、プラチレンクス・アンジヌス (*Pratylenchus andinus*)、プラチレンクス・セレアリス (*Pratylenchus cerealis*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ロオシ (*Pratylenchus loosi*)、プラチレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・テレス (*Pratylenchus teres*)、プラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus thornei*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、トリコドルス・シリンドリクス (*Trichodorus cylindricus*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、トリコドルス・プロキシムス (*Trichodorus proximus*)、トリコドルス・シミリス (*Trichodorus similis*)、トリコドルス・スパルス (*Trichodorus sparsus*)、パラトリコドル

ス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラトリコドルス・アリウス (*Paratrichodorus allius*)、パラトリコドルス・ナヌス (*Paratrichodorus nanus*)、パラトリコドルス・テレス (*Paratrichodorus teres*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、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・タメシ (*Meloidogyne thamesi*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、ナコブス・アベルランス (*Nacobbus aberrans*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、ジチレンクス・デストルクトル (*Ditylenchus destructor*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)、ネオチレンクス・ビギシ (*Neotylenchus vigissi*)、パラフェレンクス・プセウドパリエチヌス (*Paraphelenchus pseudoparietinus*)、アフエレンコイデス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、及び、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)。

10

【0182】

20

【0161】 式 (I) で表される化合物は、トマトの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・コフエアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、メロイドギネ・エキシグア (*Meloidogyne exigua*)、ナコブス・アベルランス (*Nacobbus aberrans*)、グロボデラ・ソラナセアルム (*Globodera solanacearum*)、ドリコドルス・ヘテロセファルス (*Dolichodorus heterocephalus*)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)。

30

【0183】

【0162】 式 (I) で表される化合物は、ウリ科植物の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)、及び、プラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus thornei*)。

40

【0184】

【0163】 式 (I) で表される化合物は、ワタの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus g*

50

aleatus)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)。

【0185】

〔0164〕 式(I)で表される化合物は、トウモロコシの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・デラトレイ (*Pratylenchus delattrei*)、プラチレンクス・ヘキシシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、(ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*))、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ロンギドルス・ブレビアンヌラツス (*Longidorus breviannulatus*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・アレナリア・タメシ (*Meloidogyne arenaria thamesi*)、メロイドギネ・グラミニス (*Meloidogyne graminis*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ (*Meloidogyne incognita acrita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・ナアシ (*Meloidogyne naasi*)、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・オリザエ (*Heterodera oryzae*)、ヘテロデラ・ゼアエ (*Heterodera zeae*)、プンクトデラ・カルコエンシス (*Punctodera chalcensis*)、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ホプロライムス・アエギプタイ (*Hoplolaimus aegyptii*)、ホプロライムス・マグニスチルス (*Hoplolaimus magnistylus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、ホプロライムス・インジクス (*Hoplolaimus indicus*)、ヘリコチレンクス・ジゴニクス (*Helicotylenchus digonicus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihyssera*)、ヘリコチレンクス・プセウドロボツス (*Helicotylenchus pseudorobustus*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、ドリコドルス・ヘテロセファルス (*Dolichodorus heterocephalus*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス・ボレアリス (*Rotylenchulus borealis*)、ロチレンクルス・パルプス (*Rotylenchulus parvus*)、チレンコリンクス・アグリ (*Tylenchorhynchus agri*)、チレンコリンクス・クラルス (*Tylenchorhynchus clarus*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・マキシムス (*Tylenchorhynchus maximus*)、チレンコリンクス・ヌズス (*Tylenchorhynchus nudus*)、チレンコリンクス・ブルガリス (*Tylenchorhynchus vulgaris*)、キニスルシウス・アクツス (*Quinisulcius acutus*)、パラチレンクス・ミヌツス (*Paratylenchus minutus*)、ヘミシクリオホラ・パルバナ (*Hemicycliophora parvana*)、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、スクテロネマ・ブラキウ

10

20

30

40

50

ルム (*Scutellonema brachyurum*)、及び、スバングイナ・ラジシオラ (*Subanguina radiciola*)。

【0186】

【0165】 式 (I) で表される化合物は、ダイズの線虫類、特に、以下のものを排除するものに特に適している： プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ヘテロデラ・グリシネス (*Heterodera glycines*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、及び、さらに、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・アレニ (*Pratylenchus allenii*)、プラチレンクス・アギリス (*Pratylenchus agilis*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、(ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*))、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)。

【0187】

【0166】 式 (I) で表される化合物は、タバコの線虫類、特に、以下のものを排除するものに特に適している： メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus thornei*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、ロンギドルス・エロンガツ (*Longidorus elongatus*)、パラトリコドルス・ロバツス (*Paratrichodorus lobatus*)、トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、グロボデラ・タバクム (*Globodera tabacum*)、グロボデラ・ソラナセアルム (*Globodera solanacearum*)、グロボデラ・ビルギニアエ (*Globodera virginiae*)、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus* spp.)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、キシフィネマ・アメリカナム (*Xiphinema americanum*)、クリコネメラ属種 (*Cricone-mella* spp.)、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus*

10

20

30

40

50

us reniformis)、チレンコリンクス・クライトニ (Tylenchorhynchus claytoni)、パラチレンクス属種 (Paratylenchus spp.)、及び、テチレンクス・ニコチアナエ (Tetylenchus nicotianae)。

【0188】

【0167】 式 (I) で表される化合物は、柑橘類の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・コフェアエ (Pratylenchus coffeae)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・ブルヌス (Pratylenchus vulnus)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (Belonolaimus longicaudatus)、パラトリコドルス・ミノル (Paratrichodorus minor)、パラトリコドルス・ポロスス (Paratrichodorus porosus)、トリコドルス (Trichodorus)、メロイドギネ・インコグニタ (Meloidogyne incognita)、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ (Meloidogyne incognita acrita)、メロイドギネ・ジャバニカ (Meloidogyne javanica)、ロチレンクス・マクロドラツス (Rotylenchus macrodoratus)、キシフィネマ・アメリカナム (Xiphinema americanum)、キシフィネマ・ブレビコレ (Xiphinema brevicolle)、キシフィネマ・インデキス (Xiphinema index)、クリコネメラ属種 (Criconemella spp.)、ヘミクリコネモイデス (Hemicriconemoides)、ラドホルス・シミリス (Radopholus similis)、及び、ラドホルス・シトロフィルス (Radopholus citrophilus)、ヘミシクリオホラ・アレナリア (Hemicycliophora arenaria)、ヘミシクリオホラ・ヌダタ (Hemicycliophora nudata)、及び、チレンクルス・セミペネトランス (Tylenchulus semipenetrans)。

【0189】

【0168】 式 (I) で表される化合物は、バナナの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・コフェアエ (Pratylenchus coffeae)、ラドホルス・シミリス (Radopholus similis)、及び、さらに、プラチレンクス・ギイビカウダツス (Pratylenchus giibbicaudatus)、プラチレンクス・ロオシ (Pratylenchus loosii)、メロイドギネ属種 (Meloidogyne spp.)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス (Helicotylenchus multicinctus)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (Helicotylenchus dihystra)、及び、ロチレンクルス属種 (Rotylenchulus spp.)。

【0190】

【0169】 式 (I) で表される化合物は、パイナップルの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ゼアエ (Pratylenchus zeae)、プラチレンクス・プラテンシス (Pratylenchus pratensis)、プラチレンクス・ブラキウルス (Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・ゴオデイイ (Pratylenchus goodii)、メロイドギネ属種 (Meloidogyne spp.)、ロチレンクルス・レニホルミス (Rotylenchulus reniformis)、及び、さらに、ロンギドルス・エロンガツス (Longidorus elongatus)、ロンギドルス・ラエビカピタツス (Longidorus laeovicapitatus)、トリコドルス・プリミチブス (Trichodorus primitivus)、トリコドルス・ミノル (Trichodorus minor)、ヘテロデラ属種 (Heterodera spp.)、ジチレンクス・ミセリオファグス (Ditylenchus myceliophagus)、ホプロライムス・カリホルニクス (Hoplolaim

10

20

30

40

50

us californicus)、ホプロライムス・パラロブスツス (Hoplola
 imus pararobustus)、ホプロライムス・インジクス (Hoplola
 imus indicus)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (Helicotylen
 chus dihystra)、ヘリコチレンクス・ナンヌス (Helicotyle
 nchus nannus)、ヘリコチレンクス・マルチシンクツス (Helicoty
 lenchus multicinctus)、ヘリコチレンクス・エリトリネ (Hel
 icotylenchus erythrine)、キシフィネマ・ジモルフィカウダツ
 ム (Xiphinema dimorphicaudatum)、ラドホルス・シミリス
 (Radopholus similis)、チレンコリンクス・ジギタツス (Tyle
 nchorhynchus digitatus)、チレンコリンクス・エブリエンシス
 (Tylenchorhynchus ebricensis)、パラチレンクス・ミヌツ
 ス (Paratylenchus minutus)、スクテロネマ・クラトリカウダツ
 ム (Scutellonema clathricaudatum)、スクテロネマ・ブ
 ラジス (Scutellonema bradys)、プシレンクス・ツミズス (Psi
 lenchus tumidus)、プシレンクス・マグニデンス (Psilenchu
 s magnidens)、プセウドハレンクス・ミヌツス (Pseudohalenc
 hus minutus)、クリコネモイデス・フェルニアエ (Criconemoi
 des ferniae)、クリコネモイデス・オノエンセ (Criconemoides
 onoense)、及び、クリコネモイデス・オルナツム (Criconemoide
 s ornatum)。

10

20

【0191】

【0170】 式 (I) で表される化合物は、ブドウの木の線虫類、特に、以下のもの
 を防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ブルヌス (Pratylen
 chus vulnus)、メロイドギネ・アレナリア (Meloidogyne are
 naria)、メロイドギネ・インコグニタ (Meloidogyne incogni
 ta)、メロイドギネ・ジャバニカ (Meloidogyne javanica)、キ
 シフィネマ・アメリカヌム (Xiphinema americanum)、キシフィネ
 マ・インデキス (Xiphinema index)、及び、さらに、プラチレンクス・
 プラテンシス (Pratylenchus pratensis)、プラチレンクス・ス
 クリブネリ (Pratylenchus scribneri)、プラチレンクス・ネグ
 レクツス (Pratylenchus neglectus)、プラチレンクス・ブラキ
 ウルス (Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・トルネ
 イ (Pratylenchus thornei)、及び、チレンクルス・セミペネトラ
 ンス (Tylenchulus semipenetrans)。

30

【0192】

【0171】 式 (I) で表される化合物は、樹木作物－仁果類の線虫類、特に、以下
 のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ペネトランス (Prat
 ylenchus penetrans)、及び、プラチレンクス・ブルヌス (Prat
 ylenchus vulnus)、ロンギドルス・エロンガツス (Longidoru
 s elongatus)、メロイドギネ・インコグニタ (Meloidogyne i
 ncognita)、及び、メロイドギネ・ハブラ (Meloidogyne hapl
 a)。

40

【0193】

【0172】 式 (I) で表される化合物は、樹木作物－核果類の線虫類、特に、以下
 のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ペネトランス (Prat
 ylenchus penetrans)、プラチレンクス・ブルヌス (Pratyle
 nchus vulnus)、メロイドギネ・アレナリア (Meloidogyne a
 renaria)、メロイドギネ・ハブラ (Meloidogyne hapla)、メ
 ロイドギネ・ジャバニカ (Meloidogyne javanica)、メロイドギネ
 ・インコグニタ (Meloidogyne incognita)、クリコネメラ・キセ

50

ノブラキス (*Criconemella xenoplax*)、及び、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystra*)、キシフィネマ・アメリカナム (*Xiphinema americanum*)、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、パラチレンクス・ハマツス (*Paratylenchus hamatus*)、パラチレンクス・プロジェクトス (*Paratylenchus projectus*)、スクテロネマ・ブラキウルム (*Scutellonema brachyurum*)、及び、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)。

10

【0194】

〔0173〕 式(I)で表される化合物は、樹木作物、サトウキビ及びイネの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、及び、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus* spp.)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、アフエレンコイデス (*Aphelenchoides* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、及び、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)。

20

【0195】

〔0174〕 本発明に関連して、用語「線虫類」は、ヒト又は動物に対して損傷を引き起こす線虫類も示している。

【0196】

〔0175〕 ヒト又は動物に対して有害な特定の線虫種は、以下のものである： ベンチュウ目 (*Trichinellida*) の、例えば：トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、トリコモソイデス属種 (*Trichomosoides* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)；

30

クキセンチュウ目 (*Tylenchida*) の、例えば：ミクロネマ属種 (*Micronema* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)；

カンセンチュウ目 (*Rhabditida*) の、例えば：ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、オエソファゴドンツス属種 (*Oesophagodontus* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema* spp.)、ギアロセファルス属種 (*Gyaloccephalus* spp.)、シリンドロファリンキス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cyclococercus* spp.)、シリコステファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、アンシロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ブノストムム属種 (

40

50

Bunostomum spp.)、グロボセファルス属種 (Globocephalus spp.)、シンガムス属種 (Syngamus spp.)、シアトストマ属種 (Cyathostoma spp.)、メタストロンギルス属種 (Metastrongylus spp.)、ジクチオカウルス属種 (Dictyocaulus spp.)、ムエレリウス属種 (Muellerius spp.)、プロトストロンギルス属種 (Protostrongylus spp.)、ネオストロンギルス属種 (Neostongylus spp.)、シストカウルス属種 (Cystocaulus spp.)、プネウモストロンギルス属種 (Pneumostongylus spp.)、スピコカウルス属種 (Spicocaulus spp.)、エラホストロンギルス属種 (Elaphostongylus spp.)、パレラホストロンギルス属種 (Paraelaphostongylus spp.)、クレノソマ属種 (Crenosoma spp.)、パラクレノソマ属種 (Paracrenosoma spp.)、オスレルス属種 (Oslerus spp.)、アンギオストロンギルス属種 (Angiostongylus spp.)、アエルロストロンギルス属種 (Aelurostrongylus spp.)、フィラロイデス属種 (Filaroides spp.)、パラフィラロイデス属種 (Parafilaroides spp.)、トリコストロンギルス属種 (Trichostrongylus spp.)、ハエモンクス属種 (Haemonchus spp.)、オステルタギア属種 (Ostertagia spp.)、テラドルサギア属種 (Teladorsagia spp.)、マルシャラギア属種 (Marshallagia spp.)、クーペリア属種 (Cooperia spp.)、ニッポストロンギルス属種 (Nippostrongylus spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (Heligmosomoides spp.)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、ヒオストロンギルス属種 (Hyostongylus spp.)、オベリスコイデス属種 (Obeliscooides spp.)、アミドストムム属種 (Amidostomum spp.)、オルラヌス属種 (Ollulanus spp.) ;

センビセンチュウ目 (Spirurida) の、例えば：オキシウリス属種 (Oxyuris spp.)、エンテロビウス属種 (Enterobius spp.)、パスルルス属種 (Passalurus spp.)、シファシア属種 (Syphacia spp.)、アスピクルリス属種 (Aspiculuris spp.)、ヘテラキス属種 (Heterakis spp.)、アスカリス属種 (Ascaris spp.)、トキサスカリス属種 (Toxascaris spp.)、トキシカラ属種 (Toxocara spp.)、バイリサスカリス属種 (Baylisascaris spp.)、パラスカリス属種 (Parascaris spp.)、アニサキス属種 (Anisakis spp.) アスカリジア属種、(Ascaridia spp.)、グナトストマ属種 (Gnathostoma spp.)、フィサロプテラ属種 (Physaloptera spp.)、テラジア属種 (Thelazia spp.)、ゴンギロネマ属種 (Gongylonema spp.)、ハブロネマ属種 (Habronema spp.)、パラブロネマ属種 (Parabronema spp.)、ドラスキア属種 (Draschia spp.)、ドラクンクルス属種 (Dracunculus spp.)、ステファノフィラリア属種 (Stephanofilaria spp.)、パラフィラリア属種 (Parafilaria spp.)、セタリア属種 (Setaria spp.)、ロア属種 (Loa spp.)、ジロフィラリア属種 (Dirofilaria spp.)、リトモソイデス属種 (Litomosoides spp.)、ブルギア属種 (Brugia spp.)、ウケレリア属種 (Wuchereria spp.)、オンコセルカ属種 (Onchocerca spp.)、スピロセルカ属種 (Spirocerca spp.)。

【0197】

多くの種類の既知殺線虫剤は、別の寄生性蠕虫類に対しても活性を示し、従って、ヒト及び動物における寄生虫である蠕虫類（これらは、必ずしも線虫の群に属する必要はない

10

20

30

40

50

）を防除するために使用される。本発明は、式（I）で表される化合物の駆虫薬としての使用にも関する。病原性を有する内部寄生性蠕虫類としては、扁形動物門（Platyhelmintha）〔例えば、単生類（Monogenea）、条虫類（cestodes）及び吸虫類（trematodes）〕、鉤頭動物門（Acanthocephala）及び舌形動物門（Pentastoma）などがある。以下の蠕虫類を好ましいものとして挙げることができる：

単生類（Monogenea）：例えば：ギロダクチルス属種（Gyrodactylus spp.）、ダクチログルス属種（Dactylogyrus spp.）、ポリストマ属種（Polystoma spp.）；

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

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

吸虫類（Trematodes）：二生亜綱（Digenea）の、例えば：ジプロストムム属種（Diplostomum spp.）、ポストジプロストムム属種（Posthodiplostomum spp.）、シストソマ属種（Schistosoma spp.）、トリコビルハルジア属種（Trichobilharzia spp.）、オルニトビルハルジア属種（Ornithobilharzia spp.）、アウストロビルハルジア属種（Austrotrichobilharzia spp.）、ギガントビルハルジア属種（Gigantobilharzia spp.）、レウコクロリジウム属種（Leucochloridium spp.）、ブラキライマ属種（Brachylaima spp.）、エキノストマ属種（Echinostoma spp.）、エキノパリフィウム属種（Echinoparyphium spp.）、エキノカスムス属種（Echinocasmus spp.）、ヒポデラエウム属種（Hypoderaeum spp.）、ファシオラ属種（Fasciola spp.）、ファシオロイデス属種（Fascioloides spp.）、ファシオロプシス属種（Fasciolopsis spp.）、シクロコエルム属種（Cyclocoelum spp.）、チフロコエルム属種（Typhlocoelum spp.）、パラムフィストムム属種（Paramphistomum spp.）、カリコホロン属種（Calicophoron spp.）、コチロホロン属種（Cotylophoron spp.）、ギガントコチレ属種（Gigantocotyle spp.）、フィスコエデリウス属種（Fischkoederius spp.）、ガストロチラクス属種（Gastrothyl

10

20

30

40

50

acus spp.)、ノトコチルス属種 (Notocotylus spp.)、カタトロピス属種 (Catatropis spp.)、プラギオルキス属種 (Plagiorchis spp.)、プロストゴニムス属種 (Prosthogonimus spp.)、ジクロコエリウム属種 (Dicrocoelium spp.)、エウリトレマ属種 (Eurytrema spp.)、トログロトレマ属種 (Troglootrema spp.)、パラゴニムス属種 (Paragonimus spp.)、コリリクム属種 (Collyriclum spp.)、ナノフィエツス属種 (Nanophyetus spp.)、オピストルキス属種 (Opisthorchis spp.)、クロノルキス属種 (Clonorchis spp.)、メトルキス属種 (Metorchis spp.)、ヘテロフィエス属種 (Heterophyes spp.)、メタゴニムス属種 (Metagonimus 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.) ; ポリモルフス目 (Polymorphida) の、例えば : フィリコリス属種 (Filicollis spp.) ; サジョ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.) ;

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) : シタムシ目 (Porocephalida) の、例えば : リングアツラ属種 (Linguatula spp.)。

【0198】

獣医学の分野において、及び、畜産業において、式 (I) で表される化合物の投与は、既知方法で、直接行うか、又は、適切な使用形態で、経腸的に、非経口的に、経皮的に若しくは経鼻的に行う。投与は、予防的又は治療的であり得る。

【0199】

【0176】 式 (I) で表される化合物は、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。それらは、場合により、別の活性化化合物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。

【0200】

製剤

【0177】 本発明は、さらに、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいる、殺有害生物剤としての製剤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。場合により、該使用形態は、さらなる殺有害生物剤、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二アンモニウム)、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ーポリマー)、及び／又は、湿潤剤 (例えば、グリセロール)、及び／又は、肥料 (

10

20

30

40

50

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。

【0201】

〔0178〕 慣習的な製剤は、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）、及び、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、さらなる農薬活性成分を含有する。

10

【0202】

〔0179〕 好ましいのは、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（frost protection agent）、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高める成分であって、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、拡張（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。

20

【0203】

〔0180〕 これらの製剤は、既知方法で、例えば、式（I）で表される化合物を補助剤（例えば、増量剤、溶媒及び／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り調製する。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。

【0204】

〔0181〕 使用する補助剤は、式（I）で表される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（ready-to-use）殺有害生物剤、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。

30

【0205】

〔0182〕 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、脂肪類及び油類を包含する）及び（ポリ）エーテル類、単純アミン類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）。

40

【0206】

〔0183〕 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。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、鉱油留分、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

50

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、水。

【0207】

〔0184〕 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又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、鉱油留分、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、さらに、水である。

10

【0208】

〔0185〕 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。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる： 例えば、アンモニウム塩、及び、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリン、クレイ、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、合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ、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。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシの穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

20

【0209】

〔0186〕 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。特に適しているのは、標準温度及び大気圧下では気体である増量剤又は担体、例えば、エアゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、及び、さらに、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0210】

〔0187〕 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、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである： 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の塩、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）で表される化合物のうちの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且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

30

40

【0211】

〔0188〕 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である。

50

【0212】

【0189】 存在させ得るさらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、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。さらに、泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

【0213】

【0190】 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り得る。

10

【0214】

【0191】 適切な場合には、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は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式（I）で表される化合物は、製剤を目的として通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

【0215】

【0192】 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。

20

【0216】

【0193】 本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬活性化合物の浸透を向上させるために典型的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、（一般には、水性の）施用液から、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、それによって、活性成分のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。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（coconut 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することができる。

30

【0217】

【0194】 該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量%～98重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.01重量%～95重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、最も好ましくは、0.5重量%～90重量%の式（I）で表される化合物を含んでいる。

40

【0218】

【0195】 該製剤（特に、殺有害生物剤）から調製された使用形態の中の式（I）で表される化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態中の式（I）で表される化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.00000001重量%～95重量%の式（I）で表される化合物、好ましくは、0.00001重量%～1重量%の式（I）で表される化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。

【0219】

混合物

【0196】 式（I）で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するため

50

に、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、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 (microbiological agent)、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤 (phytonic)、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質及び／又は植物成長調節剤との混合物において使用することもできる。さらに、この種の活性成分組合せは、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。

10

【0220】

【0197】 さらに、式 (I) で表される化合物は、別の活性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もできる。同様に、式 (I) で表される化合物は、植物の特性 (例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質) を向上させるための作用剤と混合して使用することも可能である。

20

【0221】

【0198】 本発明による特定の実施形態では、式 (I) で表される化合物は、製剤の中に、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。

【0222】

【0199】 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。

【0223】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤

30

【0200】 本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「“The Pesticide Manual”, 16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、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>」)。

【0224】

(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、XM C、及び、キシリルカルブ；又は、

40

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、クロルピリホスーメチル、クマホス、シアノホス、ジメトナー 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、ヘプテノホス、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

50

ル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン－メチル、パラチオン、パラチオン－メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス－メチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、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。

【0225】

(2) GABA制御塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、
シクロジェン－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。

10

【0226】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター／電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、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－シーストランスアレスリン、d－トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S－シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シペルメトリン、アルファーシペルメトリン、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)－トランス異性体〕、デルタメトリン、エムペントリン〔(EZ)－(1R)異性体〕、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ－フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)－トランス異性体〕、プラレトリン、ピレトリン類（除虫菊（pyrethrum））、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)異性体〕、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

20

DDT；又は、メトキシクロル。

【0227】

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）作動薬、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、
スルホキサフロル、又は、フルピラジフロル。

30

【0228】

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリック活性化薬、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。

【0229】

(6) 塩化物チャンネル活性化薬、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。

40

【0230】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、
幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレン、キノプレン、及び、メトプレン；又は、
フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン。

【0231】

(8) 作用機序が知られていないか又は特定されていない活性成分、例えば、

50

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。

【0232】

(9) 選択的摂食阻害薬、例えば、
ピメトロジン；又は、フロニカミド。

【0233】

(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。

【0234】

(11) 昆虫中腸膜の微生物ディスラプター、例えば、
バシルス・ツリンギエンシス・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・ツリンギエンシス・亜種・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリンギエンシス・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、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

10

20

【0235】

(12) 酸化的リン酸化阻害薬、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。

【0236】

(13) H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、例えば、
クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルアミド。

30

【0237】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体拮抗薬、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。

【0238】

(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。

【0239】

(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。

40

【0240】

(17) 脱皮阻害薬（特に、双翅目（即ち、双翅類）に関する）、例えば、
シロマジン。

【0241】

(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。

【0242】

(19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、

50

アミトラズ。

【0243】

(20) 複合体 I I I 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。

【0244】

(21) 複合体 I 電子伝達阻害薬、例えば、
M E T I 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 (D e r r i s) 。

【0245】

(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。

【0246】

(23) アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害薬、例えば、
テトロン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。

【0247】

(24) 複合体 I V 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。

【0248】

(25) 複合体 I I 電子伝達阻害薬、例えば、
シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン。

【0249】

(28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、
ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、及び、フ
ルベンジアミド。

【0250】

作用機序が知られていないか又は不明瞭であるさらなる活性化合物、例えば、アフイド
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、
ビフェナゼート、ブロフラニリド (b r o f l a n i l i d e)、プロモプロピレート、
キノメチオナート、氷晶石 (c r y o l i t e)、シクラニリプロール、シクロキサプリ
ド (c y c l o x a p r i d)、シハロジアミド (c y h a l o d i a m i d e)、ジク
ロロメゾチアズ (d i c l o r o m e z o t i a z)、ジコホル、ジフロビダジン、フロ
メトキン、フルアザインドリジン (f l u a z a i n d o l i z i n e)、フルエンズル
ホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルヘキサホン
(f l u h e x a f o n)、フルオピラム、フルアラネル、フルキサメタミド、フフェノ
ジド (f u f e n o z i d e)、グアジピル (g u a d i p y r)、ヘプタフルトリン、
イミダクロチズ、イプロジオン、ロチラネル (l o t i l a n e r)、メペルフルトリン
、パイコングディング (p a i c h o n g d i n g)、ピフルブミド、ピリダリル、ピリ
フルキナゾン、ピリミノストロビン、サロラネル (s a r o l a n e r)、テトラメチル
フルトリン、テトラニリプロール (t e t r a n i l i p r o l e)、テトラクロラント
ラニリプロール (t e t r a c h l o r a n t r a n i l i p r o l e)、チオキサザフ
ェン、チオフルオキシメート (t h i o f l u o x i m a t e)、トリフルメゾピリム、
及び、ヨードメタン；並びに、さらに、バシルス・フィルムス (B a c i l l u s f i
r m u s) に基づく調製物 (I - 1 5 8 2, B i o N e e m, V o t i v o)、及び
、以下の活性化合物： 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) - 1 H - 1 , 2
 , 4 - トリアゾール - 5 - アミン (W O 2 0 0 6 / 0 4 3 6 3 5 から既知)、 { 1 ' - [

10

20

30

40

50

(2E) - 3 - (4-クロロフェニル) プロパー-2-エン-1-イル] - 5-フルオロス
 ピロ [インドール-3, 4'-ピペリジン] - 1 (2H) - イル} (2-クロロピリジン
 - 4-イル) メタノン (WO 2003/106457 から既知)、2-クロロ-N- [2
 - {1- [(2E) - 3 - (4-クロロフェニル) プロパー-2-エン-1-イル] ピペリ
 ジン-4-イル} - 4- (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO 2
 006/003494 から既知)、3- (2, 5-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] デカー-3-エン-2-オン (WO 20
 09/049851 から既知)、3- (2, 5-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] デカー-3-エン-4-イルエチルカルボネ
 ト (WO 2009/049851 から既知)、4- (ブター-2-イン-1-イルオキシ) 10
 - 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 (WO 20
 04/099160 から既知)、4- (ブター-2-イン-1-イルオキシ) - 6- (3-
 クロロフェニル) ピリミジン (WO 2003/076415 から既知)、PF 1364 (C
 AS Reg. No. 1204776-60-2)、2- [2- ({ [3-ブromo-1- (3-クロ
 ロピリジン-2-イル) - 1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミ
 ノ) - 5-クロロ-3-メチルベンゾイル] - 2-メチルヒドラジンカルボン酸メチル (W
 O 2005/085216 から既知)、2- [2- ({ [3-ブromo-1- (3-クロ
 ロピリジン-2-イル) - 1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミ
 ノ) - 5-シアノ-3-メチルベンゾイル] - 2-エチルヒドラジンカルボン酸メチル (W
 O 2005/085216 から既知)、2- [2- ({ [3-ブromo-1- (3-クロ
 ロピリジン-2-イル) - 1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミ
 ノ) - 5-シアノ-3-メ
 チルベンゾイル] - 2-メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/08521
 6 から既知)、2- [3, 5-ジブromo-2- ({ [3-ブromo-1- (3-クロ
 ロピリジン-2-イル) - 1H-ピラゾール-5-イル] カルボニル} アミ
 ノ) ベンゾイル] -
 2-エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、N-
 [2- (5-アミノ-1, 3, 4-チアジャゾール-2-イル) - 4-クロロ-6-メチ
 ルフェニル] - 3-ブromo-1- (3-クロロピリジン-2-イル) - 1H-ピラゾール
 - 5-カルボキサミド (CN 102057925 から既知)、4- [5- (3, 5-ジク
 ロロフェニル) - 5- (トリフルオロメチル) - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾー
 ル-3-イル] - 2-メチル-N- (1-オキシドチエタン-3-イル) ベンズアミド (30
 WO 2009/080250 から既知)、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 (WO 2012/029672 から既知)、1- [(2-クロロ-1, 3-チ
 アゾール-5-イル) メチル] - 4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド [1, 2-a
] ピリミジン-1-イウム-2-オレート (WO 2009/099929 から既知)、1
 - [(6-クロロピリジン-3-イル) メチル] - 4-オキソ-3-フェニル-4H-ピ
 リド [1, 2-a] ピリミジン-1-イウム-2-オレート (WO 2009/09992
 9 から既知)、4- (3- {2, 6-ジクロロ-4- [(3, 3-ジクロロプロパー-2-
 エン-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 (CN 101337940 から既知)、N- [2- (tert-ブ
 チルカルバモイル) - 4-クロロ-6-メチルフェニル] - 1- (3-クロロピリジン-
 2-イル) - 3- (フルオロメトキシ) - 1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (WO
 2008/134969 から既知)、[2- (2, 4-ジクロロフェニル) - 3-オキソ
 - 4-オキサスピロ [4. 5] デカー-1-エン-1-イル] 炭酸ブチル (CN 10206
 0818 から既知)、(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 (WO 2013/1
 44213 から既知)、N- (メチルスルホニル) - 6- [2- (ピリジン-3-イル)
 - 1, 3-チアゾール-5-イル] ピリジン-2-カルボキサミド (WO 2012/00
 0896 から既知)、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

10

20

30

40

50

ールー5ーカルボキサミド(WO2010/051926から既知)、5ーブロモー4ークロローNー[4ークロロー2ーメチルー6ー(メチルカルバモイル)フェニル]ー2ー(3ークロロー2ーピリジル)ピラゾールー3ーカルボキサミド(CN103232431から既知)。

【0251】

殺菌剤

〔0201〕 本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」に記載されているか、又は、インターネット上に記載されている(例えば、「<http://www.allanwood.net/pesticides>」)。

10

【0252】

〔0202〕 クラス(1)～(15)に記載されている全ての殺菌剤混合成分は、適切な官能基が存在している場合には、対応する塩基又は酸と塩を形成し得る。さらに、クラス(1)～(15)に記載されている殺菌剤混合成分は、互変異性が可能である場合には、互変異性体形態も包含する。

【0253】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.01)アルジモルフ、(1.02)アザコナゾール、(1.03)ビテルタノール、(1.04)ブロムコナゾール、(1.05)シプロコナゾール、(1.06)ジクロブトラゾール、(1.07)ジフェノコナゾール、(1.08)ジニコナゾール、(1.09)ジニコナゾールーM、(1.10)ドデモルフ、(1.11)酢酸ドデモルフ、(1.12)エポキシコナゾール、(1.13)エタコナゾール、(1.14)フェナリモール、(1.15)フェンブコナゾール、(1.16)フェンヘキサミド、(1.17)フェンプロピジン、(1.18)フェンプロピモルフ、(1.19)フルキンコナゾール、(1.20)フルフルプリミドール、(1.21)フルシラゾール、(1.22)フルトリアホル、(1.23)フルコナゾール、(1.24)フルコナゾールーシス、(1.25)ヘキサコナゾール、(1.26)イマザリル、(1.27)硫酸イマザリル、(1.28)イミベンコナゾール、(1.29)イブコナゾール、(1.30)メトコナゾール、(1.31)ミクロブタニル、(1.32)ナフチフィン、(1.33)ヌアリモール、(1.34)オキシポコナゾール、(1.35)パクロブトラゾール、(1.36)ペフラゾエート、(1.37)ペンコナゾール、(1.38)ピペラリン、(1.39)プロクロラズ、(1.40)プロピコナゾール、(1.41)プロチオコナゾール、(1.42)ピリブチカルブ、(1.43)ピリフェノックス、(1.44)キンコナゾール、(1.45)シメコナゾール、(1.46)スピロキサミン、(1.47)テブコナゾール、(1.48)テルビナフィン、(1.49)テトラコナゾール、(1.50)トリアジメホン、(1.51)トリアジメノール、(1.52)トリデモルフ、(1.53)トリフルミゾール、(1.54)トリホリン、(1.55)トリチコナゾール、(1.56)ウニコナゾール、(1.57)ウニコナゾールーp、(1.58)ビニコナゾール、(1.59)ポリコナゾール、(1.60)1ー(4ークロロフェニル)ー2ー(1Hー1,2,4ートリアゾールー1ーイル)シクロヘプタノール、(1.61)1ー(2,2ージメチルー2,3ージヒドロ1Hーインデンー1ーイル)ー1Hーイミダゾールー5ーカルボン酸メチルエステル、(1.62)N'ー{5ー(ジフルオロメチル)ー2ーメチルー4ー[3ー(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}ーNーエチルーNーメチルイミドホルムアミド、(1.63)NーエチルーNーメチルーN'ー{2ーメチルー5ー(トリフルオロメチル)ー4ー[3ー(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}イミドホルムアミド、(1.64)Oー[1ー(4ーメトキシフェノキシ)ー3,3ージメチルブタンー2ーイル]1Hーイミダゾールー1ーカルボチオエート、(1.65)ピリソキサゾール、(1.66)2ー{[3ー(2ークロロフェニル)ー2ー(2,4ージフルオロフェニル)オキシランー2ーイル]メチル}ー2,4ージヒドロ3Hー1,2,4ートリアゾールー3ーチオン、(1.67)1ー{[3ー(2ークロロフェニル)ー2ー(2,4ージフルオロフェニル

20

30

40

50

ル) オキシラン-2-イル] メチル} -1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1. 68) 5-(アリスルファニル)-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. 69) 2-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 70) 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. 71) 2-{[rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} -2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 72) 1-{[rel (2R, 3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} -1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1. 73) 1-{[rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル} -1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1. 74) 5-(アリスルファニル)-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. 75) 5-(アリスルファニル)-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. 76) 2-[(2S, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 77) 2-[(2R, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 78) 2-[(2R, 4R, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 79) 2-[(2S, 4R, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 80) 2-[(2S, 4S, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 81) 2-[(2R, 4S, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 82) 2-[(2R, 4R, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 83) 2-[(2S, 4R, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(1. 84) 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. 85) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 86) 2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ペンタン-2-オール、(1. 87) 2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ) フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール、(1. 88) 2-[2-クロロ-4-(2, 4-ジクロロフェノキシ) フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) プロパン-2-オール、(1. 89) (2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-

10

20

30

40

50

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. 90) (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. 91) (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. 92) (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. 93) (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. 94) (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. 95) 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。

【0254】

(2) 呼吸鎖の複合体 I 又は複合体 I I の阻害薬、例えば、(2. 01) ビキサフェン、(2. 02) ボスカリド、(2. 03) カルボキシシン、(2. 04) ジフルメトリン、(2. 05) フェンフラム、(2. 06) フルオピラム、(2. 07) フルトラニル、(2. 08) フルキサピロキサド、(2. 09) フラメトピル、(2. 10) フルメシクロックス、(2. 11) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 (1RS, 4SR, 9RS) とアンチ-エピマー性ラセミ化合物 (1RS, 4SR, 9SR) の混合物)、(2. 12) イソピラザム (アンチ-エピマー性ラセミ化合物 1RS、4SR、9SR)、(2. 13) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9S)、(2. 14) イソピラザム (アンチ-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9R)、(2. 15) イソピラザム (シン-エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9RS)、(2. 16) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9R)、(2. 17) イソピラザム (シン-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9S)、(2. 18) メプロニル、(2. 19) オキシカルボキシシン、(2. 20) ペンフルフェン、(2. 21) ペンチオピラド、(2. 22) セダキサン、(2. 23) チフルザミド、(2. 24) 1-メチル-N-[2-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 25) 3-(ジフルオロメチル) - 1-メチル-N-[2-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 26) 3-(ジフルオロメチル) - N-[4-フルオロ-2-(1, 1, 2, 3, 3-ヘキサフルオロプロポキシ) フェニル] - 1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 27) 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. 28) 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. 29) ベンゾビンジフルピル、(2. 30) 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. 31) 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. 32) 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. 33) 1, 3, 5-トリメチル-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. 34) 1-メチル-3-(トリフルオロメチル) - N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン

10

20

30

40

50

-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.35)1-メチル-3-
 (トリフルオロメチル)-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、(2.36)
 1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-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、(2.37)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3S)-1,1,3-
 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、(2.38)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、(2.39)1,3,5-トリメチル-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、(2.40)1,3,5-トリメチル-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、(2.41)ペノダニル、(2.42)2-クロロ-
 N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジ
 ン-3-カルボキサミド、(2.43)イソフェタミド、(2.44)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、(2.45)N-(4'-クロロビフェニル
 -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
 キキサミド、(2.46)N-(2',4'-ジクロロビフェニル-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、(2.47)
 3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4'-(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、(2.48)N-(2',5'
 -ジフルオロビフェニル-2-イル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1
 H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.49)3-(ジフルオロメチル)-1-メ
 チル-N-[4'-(プロパー-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピ
 ラゾール-4-カルボキサミド、(2.50)5-フルオロ-1,3-ジメチル-N-[
 4'-(プロパー-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4
 -カルボキサミド、(2.51)2-クロロ-N-[4'-(プロパー-1-イン-1-イ
 ル)ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(2.52)3-(ジフルオロメチル)-
 N-[4'-(3,3-ジメチルブター-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-
 1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.53)N-[4'-(3,
 3-ジメチルブター-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-5-フルオロ-1,
 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.54)3-(ジフルオ
 ロメチル)-N-(4'-エチルビフェニル-2-イル)-1-メチル-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(2.55)N-(4'-エチルビフェニル-2-イル)-
 5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.56
)2-クロロ-N-(4'-エチルビフェニル-2-イル)ニコチンアミド、(2.57
)2-クロロ-N-[4'-(3,3-ジメチルブター-1-イン-1-イル)ビフェニ
 ル-2-イル]ニコチンアミド、(2.58)4-(ジフルオロメチル)-2-メチル-
 N-[4'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1,3-チアゾール-5
 -カルボキサミド、(2.59)5-フルオロ-N-[4'-(3-ヒドロキシ-3-メ
 チルブター-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1,3-ジメチル-1H-ピ
 ラゾール-4-カルボキサミド、(2.60)2-クロロ-N-[4'-(3-ヒドロキ
 シ-3-メチルブター-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(
 2.61)3-(ジフルオロメチル)-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチルブター
 1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カ
 ルボキサミド、(2.62)5-フルオロ-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチルブ
 ター-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1,3-ジメチル-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(2.63)2-クロロ-N-[4'-(3-メトキシ-3-

10

20

30

40

50

メチルブター-1-イン-1-イル) ビフェニル-2-イル] ニコチンアミド、(2. 64) 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. 65) 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. 66) 1, 3-ジメチル-N-[(3S)-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 67) 3-(ジフルオロメチル)-N-メトキシ-1-メチル-N-[1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)プロパン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 68) 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. 69) 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. 70) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド。

【0255】

(3) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3. 01) アメトクトラジン、(3. 02) アミスルブロム、(3. 03) アゾキシストロビン、(3. 04) シアゾファミド、(3. 05) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3. 06) クモキシストロビン、(3. 07) ジモキシストロビン、(3. 08) エノキサストロビン、(3. 09) ファモキサドン、(3. 10) フェンアミドン、(3. 11) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、(3. 12) フルオキサストロビン、(3. 13) クレソキシム-メチル、(3. 14) メトミノストロビン、(3. 15) オリサストロビン、(3. 16) ピコキシストロビン、(3. 17) ピラクロストロビン、(3. 18) ピラメトストロビン、(3. 19) ピラオキシストロビン、(3. 20) ピリベンカルブ、(3. 21) トリクロピリカルブ、(3. 22) トリフロキシストロビン、(3. 23) (2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3. 24) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)アセトアミド、(3. 25) (2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル}フェニル}アセトアミド、(3. 26) (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. 27) フェナミノストロビン (fenaminostrobin)、(3. 28) 5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン、(3. 29) (2E)-2-{2-[({シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}スルファニル)メチル}フェニル}-3-メトキシアクリル酸メチルエステル、(3. 30) 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. 31) 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. 32) 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. 33) (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-ジメチルペンター-3-エンアミド。

【0256】

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.01)ベノミル、(4.02)カルペンダジム、(4.03)クロルフェナゾール、(4.04)ジエトフェンカルブ、(4.05)エタボキサム、(4.06)フルオピコリド、(4.07)フベリダゾール、(4.08)ペンシクロン、(4.09)チアベンダゾール、(4.10)チオファネートメチル、(4.11)チオファネート、(4.12)ゾキサミド、(4.13)5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、(4.14)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。

【0257】

10

(5) 多部位に作用し得る化合物、例えば、(5.01)ボルドー液、(5.02)カプタホール、(5.03)キャプタン、(5.04)クロロタロニル、(5.05)水酸化銅、(5.06)ナフテン酸銅、(5.07)酸化銅、(5.08)塩基性塩化銅、(5.09)硫酸銅(2+)、(5.10)ジクロフルアニド、(5.11)ジチアノン、(5.12)ドジン、(5.13)ドジン遊離塩基、(5.14)ファーバム、(5.15)フルオロホルベット、(5.16)ホルベット、(5.17)グアザチン、(5.18)酢酸グアザチン、(5.19)イミノクタジン、(5.20)イミノクタジンアルベシル酸塩、(5.21)イミノクタジン三酢酸塩、(5.22)マンカップパー、(5.23)マンゼブ、(5.24)マンネブ、(5.25)メチラム、(5.26)メチラム亜鉛(metiram zinc)、(5.27)オキシシン銅、(5.28)プロパミジン(propamidine)、(5.29)プロピネブ、(5.30)硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.31)チウラム、(5.32)トリルフルアニド、(5.33)ジネブ、(5.34)ジラム、(5.35)アニラジン。

20

【0258】

(6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6.01)アシベンゾラルーS-メチル、(6.02)イソチアニル、(6.03)プロベナゾール、(6.04)チアジニル、(6.05)ラミナリン(laminarin)。

【0259】

(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、(7.01)アンドプリム(andoprim)、(7.02)ブラストサイジン-S、(7.03)シプロジニル、(7.04)カスガマイシン、(7.05)カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.06)メパニピリム、(7.07)ピリメタニル、(7.08)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、(7.09)オキシテトラサイクリン、(7.10)ストレプトマイシン。

30

【0260】

(8) ATP産生阻害薬、例えば、(8.01)酢酸トリフェニルスズ、(8.02)塩化トリフェニルスズ、(8.03)水酸化トリフェニルスズ、(8.04)シルチオフアム。

【0261】

(9) 細胞壁合成阻害薬、例えば、(9.01)ベンチアバリカルブ、(9.02)ジメトモルフ、(9.03)フルモルフ、(9.04)イプロバリカルブ、(9.05)マンジプロパミド、(9.06)ポリオキシシン、(9.07)ポリオキシソリム、(9.08)バリダマイシン、(9.09)バリフェナレート、(9.10)ポリオキシシンB、(9.11)(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、(9.12)(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。

40

【0262】

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10.01)ビフェニル、(10.02)クロロネブ、(10.03)ジクロラン、(10.04)エジフェンホス、(10.05)

50

． 05) エトリジアゾール、(10. 06) ヨードカルブ (i o d o c a r b)、(10. 07) イプロベンホス、(10. 08) イソプロチオラン、(10. 09) プロパモカルブ、(10. 10) プロパモカルブ塩酸塩、(10. 11) プロチオカルブ、(10. 12) ピラゾホス、(10. 13) キントゼン、(10. 14) テクナゼン、(10. 15) トルクロホスーメチル。

【0263】

(11) メラニン生合成阻害薬、例えば、(11. 01) カルプロパミド、(11. 02) ジクロシメット、(11. 03) フェノキサニル、(11. 04) フタリド、(11. 05) ピロキロン、(11. 06) トリシクラゾール、(11. 07) {3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル) アミノ] ブタン-2-イル} カルバミン酸2, 2, 2-トリフルオロエチル。

10

【0264】

(12) 核酸合成阻害薬、例えば、(12. 01) ベナラキシル、(12. 02) ベナラキシルーM (キララキシル (k i r a l a x y l))、(12. 03) ブピリメート、(12. 04) クロジラコン、(12. 05) ジメチリモール、(12. 06) エチリモール、(12. 07) フララキシル、(12. 08) ヒメキサゾール、(12. 09) メタラキシル、(12. 10) メタラキシルーM (メフェノキサム)、(12. 11) オフラセ、(12. 12) オキサジキシル、(12. 13) オキソリン酸、(12. 14) オクチリノン。

20

【0265】

(13) シグナル伝達阻害薬、例えば、(13. 01) クロゾリネート、(13. 02) フェンピクロニル、(13. 03) フルジオキソニル、(13. 04) イプロジオン、(13. 05) プロシミドン、(13. 06) キノキシフェン、(13. 07) ピンクロゾリン、(13. 08) プロキナジド。

【0266】

(14) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14. 01) ビナパクリル、(14. 02) ジノカップ、(14. 03) フェリムゾン、(14. 04) フルアジナム、(14. 05) メプチルジノカップ。

【0267】

(15) さらなる化合物、例えば、(15. 001) ベンチアゾール、(15. 002) ベトキサジン、(15. 003) カプシマイシン (c a p s i m y c i n)、(15. 004) カルボン、(15. 005) キノメチオネート、(15. 006) ピリオフェノン (クラザフェノン (c h l a z a f e n o n e))、(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) ダゾメット、(15. 012) デバカルブ、(15. 013) ジクロロフェン、(15. 014) ジクロメジン、(15. 015) ジフェンゾコート、(15. 016) ジフェンゾコートメチル硫酸塩、(15. 017) ジフェニルアミン、(15. 018) エコメイト、(15. 019) フェンピラザミン、(15. 020) フルメトベル、(15. 021) フルオルイミド、(15. 022) フルスルファミド、(15. 023) フルチアニル、(15. 024) ホセチルーアルミニウム、(15. 025) ホセチルーカルシウム、(15. 026) ホセチルーナトリウム、(15. 027) ヘキサクロロベンゼン、(15. 028) イルママイシン、(15. 029) メタスルホカルブ、(15. 030) イソチオシアン酸メチル、(15. 031) メトラフェノン、(15. 032) ミルディオマイシン、(15. 033) ナタマイシン、(15. 034) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15. 035) ニトロタルーイソプロピル、(15. 036) オキサモカルブ (o x a m o c a r b)、(15. 037) オキシフェンチン (o x y f e n t h i n)、(15. 038) ペンタクロロフェノール及び塩、(15. 039) フェノトリン、(15. 040) 亜リン酸及びその塩、(15. 041) プロパモカルブ-ホセチレート (p r o p a m o c a r b - f o s e t y l a t e)、(15. 042) プロパノシン-ナトリウム (p r o p a n o s i n - s

30

40

50

odium)、(15.043)ピリモルフ、(15.044)ピロールニトリン、(15.045)テブフロキン、(15.046)テクロフタラム、(15.047)トルニファニド、(15.048)トリアゾキシド、(15.049)トリクラミド、(15.050)ザリラミド、(15.051)2-メチルプロパン酸(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-イルエステル、(15.052)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、(15.053)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、(15.054)オキサチアピプロリン、(15.055)1H-イミダゾール-1-カルボン酸1-(4-メトキシフェノキシ)-3, 3-ジメチルブタン-2-イルエステル、(15.056)2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(15.057)2, 3-ジブチル-6-クロロチエノ[2, 3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、(15.058)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、(15.059)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5R)-5-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、(15.060)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5S)-5-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、(15.061)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-{4-[4-(5-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、(15.062)2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、(15.063)2-クロロ-5-[2-クロロ-1-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル]ピリジン、(15.064)2-フェニルフェノール及び塩、(15.065)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、(15.066)3, 4, 5-トリクロロピリジン-2, 6-ジカルボン酸ニトリル、(15.067)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、(15.068)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、(15.069)5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(15.070)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-スルホヒドラジド、(15.071)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、(15.072)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、(15.073)5-メチル-6-オクチル[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-7-アミン、(15.074)(2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチルエステル、(15.075)N'-(4-{[3-(4-クロロベンジル)-1, 2, 4-チアジアゾール-5-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、(15.076)N-(4-クロロベンジル)-3-[3-メトキシ-4-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]プロパンアミド、(15.077)N-[(4-クロロフェニル)(シアノ)メチル]-3-[3-メトキシ-4-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]プロパンアミド、(15.078)N-[(5

10

20

30

40

50

-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]-2, 4-ジクロロニコチンアミド、
 (15. 079) N-[1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]-2, 4-ジクロロニコチンアミド、
 (15. 080) N-[1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]-2-フルオロ-4-ヨードニコチンアミド、
 (15. 081) N-{(E)-[(シクロプロピルメトキシ)イミノ][6-(ジフルオロメトキシ)-2, 3-ジフルオロフェニル]メチル}-2-フェニルアセトアミド、
 (15. 082) N-{(Z)-[(シクロプロピルメトキシ)イミノ][6-(ジフルオロメトキシ)-2, 3-ジフルオロフェニル]メチル}-2-フェニルアセトアミド、
 (15. 083) N'-{4-[(3-tert-ブチル-4-シアノ-1, 2-チアゾール-5-イル)オキシ]-2-クロロ-5-メチルフェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、
 (15. 084) N-メチル-2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-N-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタリン-1-イル)-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、
 (15. 085) N-メチル-2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-N-[(1R)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタリン-1-イル]-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、
 (15. 086) N-メチル-2-(1-{[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-N-[(1S)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタリン-1-イル]-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、
 (15. 087) {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}カルバミン酸ペンチルエステル、
 (15. 088) フェナジン-1-カルボン酸、
 (15. 089) キノリン-8-オール、
 (15. 090) キノリン-8-オールスルフェート(2:1)、
 (15. 091) {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-ブチルエステル、
 (15. 092) (5-ブロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル)(2, 3, 4-トリメトキシ-6-メチルフェニル)メタノン、
 (15. 093) N-[2-(4-{[3-(4-クロロフェニル)プロパー-2-イン-1-イル]オキシ}-3-メトキシフェニル)エチル]-N2-(メチルスルホニル)バリンアミド、
 (15. 094) 4-オキソ-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、
 (15. 095) {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}カルバミン酸ブター-3-イン-1-イルエステル、
 (15. 096) 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性体形態: 4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2(1H)-オン)、
 (15. 097) 3, 4, 5-トリヒドロキシ安息香酸プロピル、
 (15. 098) [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、
 (15. 099) (S)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、
 (15. 100) (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、
 (15. 101) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、
 (15. 102) 2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、
 (15. 103) 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. 104) 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. 105) アブシジン酸、
 (15. 106) 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-メチルイミドホルミアミド、
 (15. 107) N'-{5-ブロモ-6-[1-(3

10

20

30

40

50

, 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-メチルイミドホルミアミド、(15. 108) N' - {5-プロモ-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-メチルイミドホルミアミド、(15. 109) N' - {5-プロモ-
 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-メチルイミドホルミアミド、(15. 110) N' - {
 5-プロモ-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-メチルイミドホルミアミド、(15. 111) N'
 - {5-プロモ-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-メチルイミドホルミアミド、(15. 1
 12) 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、(15. 1
 13) 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、(15.
 114) 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、(1
 5. 115) 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、(15. 116) 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-メチル-1H-ピラゾール-4-カ
 ルボキサミド、(15. 117) 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、(15. 118) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)
) - 5-フルオロ-N-(5-フルオロ-2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1
 H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 119) 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、(15. 120) 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、(15. 12
 1) 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、(15. 122) 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、(15. 123) 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、(15. 124) 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、(15. 125) 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、(15. 126) 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、(15.
 127) 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、(15. 128) 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-1
 H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 129) 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、(15.

10

20

30

40

50

130) 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、(15.131) 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、(15.132) N'-(2,5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.133) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.134) N-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(15.135) 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-ベンゾオキサアゼピン、(15.136) 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、(15.137) 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、(15.138) 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、(15.139) 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、(15.140) 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、(15.141) 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、(15.142) 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、(15.143) 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、(15.144) 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、(15.145) 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、(15.146) 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、(15.147) 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、(15.148) 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、(15.149) 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、(15.150) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.151) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.152) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.153) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.154) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.155) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.156) 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-メチルイミドホルミアミド、(15.157) N'-(

10

20

30

40

50

(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-メチルイミドホルミアミド、(15. 158) 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-メチルイミドホルミアミド、(15. 159) 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-メチルイミドホルミアミド、(15. 160) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 161) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 162) 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 163) 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. 164) 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}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15. 165) 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-{(5S)-5-[2-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 166) 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-{(5R)-5-[2-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 167) 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-{(5S)-5-[2-フルオロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 168) 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-{(5R)-5-[2-フルオロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 169) 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-{(5S)-5-[2-クロロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 170) 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-{(5R)-5-[2-クロロ-6-(プロパー-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル}-1, 3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15. 171) 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}フェニルメタンスルホネート、(15. 172) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3

10

20

30

40

50

， 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、（15．173）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、（15．174）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。

10

【0268】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

【0203】 式（I）で表される化合物は、生物学的殺有害生物剤と組み合わせることができる。

【0269】

【0204】 生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物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。

【0270】

【0205】 生物学的殺有害生物剤としては、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌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。

20

【0271】

【0206】 生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な上記細菌類の例は、以下のものである：

バシルス・アミロリクエファシエンシス（*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 CNCM 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. thuringiensis subspecies israelensis*）（抗原型 H-14）株AM65-52（受託番号 ATCC 1276）、又は、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 アイザワイ（*B. thuringiensis subsp. aizawai*）、特に、株ABTS-1857（SD-1372）、又は、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 クルスタキ（*B. thuringiensis subsp. kurstaki*）株HD-1、又は、バシルス・ツリンギエンシス 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AQ612

30

40

50

1 (= 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)。

【0272】

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

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

【0273】

[0207] 生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能なウイルス類の例は、以下のものである：

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) 顆粒病ウイルス (GV)、コドリリング (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 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。

【0274】

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、それらの特定の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。その例としては、以下のものなどがある：

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illum属種 (*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セパシア (*Pseudomonas cepacia*) として知られていた)、ギガスポラ属種 (*Gigaspora* spp.) 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 (*Lact*

obacillus buchneri)、パラグロムス属種(Paraglomus spp.)、ピソリトゥス・チンクトルス(Pisolithus tinctorus)、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.)。

【0275】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な、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:

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

【0276】

混合成分としての薬害軽減剤

【0208】 式(I)で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセット(一メキシル)、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(一エチル)、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(一エチル)、メフェンピル(一ジエチル)、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)。

【0277】

植物及び植物の部分

【0209】 本発明に従って、全ての植物及び植物の部分进行处理することができる。ここで、植物は、望ましい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、ピーマン及びトウガラシ、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、ハウレンソウ、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(果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実を有するもの及びブドウの木)などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的

10

20

30

40

50

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、生物工学的方法と遺伝子工学的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、植物の全ての成育段階、例えば、種子、挿穂（cutting）、及び、幼植物（未成熟植物）から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、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、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などである。収穫物（収穫された植物又は植物の部分）、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、植物の部分に包含される。

10

【0278】

【0210】 式（I）で表される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、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官（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も行う。

20

【0279】

【0211】 上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、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学的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的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。用語「部分（parts）」又は「植物の部分（parts of plants）」又は「植物の部分（plant parts）」については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な植物品種又は使用されている慣習的な植物品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって栽培された、新しい特性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

30

【0280】

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

【0212】 特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温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、高められた開能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び／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に別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類）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

40

50

C r y I F並びにそれらの組合せ〕によって植物体内で産生された毒素による、害虫及び有害微生物（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類）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（S A R）、システミン（s y s t e m i n）、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、特定の除草活性化合物（例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート類又はホスフィノトリシン）に対する植物の向上した耐性である（例えば、「P A T」遺伝子）。望まれる当該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。上記トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、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種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの）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。特に重要な特性（「形質」）は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類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。

10

【0281】

作物保護－処理の種類

20

【0213】 植物及び植物の部分は、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（s p r e a d i n g－o n）、注入、灌水（灌注（d r e n c h i n g））、点滴灌漑などによって、式（I）で表される化合物で直接的に処理するか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることによって処理し、また、繁殖器官（p r o p a g a t i o n m a t e r i a l）の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理、液体種子処理、スラリー処理によっても処理し、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても処理する。さらに、式（I）で表される化合物を微量散布法（u l t r a－l o w v o l u m e m e t h o d）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）で表される化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

30

【0282】

【0214】 植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用である。即ち、式（I）で表される化合物を茎葉部に施用し、その際、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。

【0283】

【0215】 浸透移行性活性化合物の場合、式（I）で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。従って、植物は、その植物の生息環境に対して式（I）で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注（d r e n c h i n g）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）で表される化合物の液体形態を含浸させる〕ことによって、又は、土壌施用〔即ち、式（I）で表される化合物を固体形態で（例えば、顆粒形態で）植物の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。水稲作物の場合には、これは、固体施用形態にある式（I）で表される化合物（例えば、粒剤として）を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

40

【0284】

種子の処理

【0216】 植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。それにもかかわらず、種子の処理には、必ずしも満足の

50

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殺有害生物剤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、使用する活性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、使用する活性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、害虫抵抗性トランスジェニック植物又は害虫耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性又は殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

【0285】

10

【0217】 従って、本発明は、特に、害虫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）で表される化合物のうちの1種類で処理することによる。種子及び発芽中の植物を害虫による攻撃から保護するための本発明の方法は、さらに、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、1回の操作で同時に又は順次に処理するような方法も包含する。それは、さらにまた、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、異なった時点で処理するような方法も包含する。

【0286】

【0218】 本発明は、さらに、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）で表される化合物の使用にも関する。

20

【0287】

【0219】 本発明は、さらに、害虫に対して保護されるように、式（I）で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式（I）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式（I）で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式（I）で表される化合物と混合成分が被膜の一部分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

【0288】

【0220】 本発明は、さらに、式（I）で表される化合物で処理された後で、埃による種子の摩耗を防止するために、フィルムコーティングプロセスに付される種子にも関する。

【0289】

【0221】 式（I）で表される浸透移行的に作用する化合物における有利な点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時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

【0290】

【0222】 別の有利な点は、式（I）で表される化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽及び出芽が増進され得るということである。

【0291】

【0223】 式（I）で表される化合物を、特に、トランスジェニック種子に対しても使用することが可能であるということも、有利であると考えられる。

【0292】

【0224】 さらに、式（I）で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、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

50

は、窒素固定が最適化される。

【0293】

【0225】 式（I）で表される化合物は、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を包含する。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、野菜類及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

10

【0294】

【0226】 既に上記で記載したように、式（I）で表される化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、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、この場合、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

【0295】

【0227】 本発明に関連して、式（I）で表される化合物は、種子に対して施用する。該種子は、好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。かくして、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。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子（例えば、プライミング）を使用することもできる。イネの種子の場合、例えば、特定の段階（鳩胸段階）に達するまで水中で予め吸水させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が改善され、及び、出芽がより均一になる。

30

【0296】

【0228】 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）で表される化合物の量及び／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活性成分の場合に、確実に実施しなければならない。

40

【0297】

【0229】 一般に、式（I）で表される化合物は、適切な製剤の形態で種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤及びプロセスは、当業者には知られている。

【0298】

【0230】 式（I）で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤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。

【0299】

50

〔0231〕 これらの製剤は、既知方法で、式（I）で表される化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることによって、製造する。

【0300】

〔0232〕 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中であまり溶解しない顔料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。

10

【0301】

〔0233〕 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な湿潤剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネート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ことができる。

【0302】

〔0234〕 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、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、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使用することができる。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体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ーホルムアルデヒド縮合物である。

20

【0303】

〔0235〕 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用することができる。

30

【0304】

〔0236〕 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ールなどを挙げることができる。

【0305】

〔0237〕 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレイ及び微粉化シリカなどを挙げることができる。

40

【0306】

〔0238〕 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げることができる。

【0307】

〔0239〕 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（cf. R. Wegler “Chemie

50

der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

【0308】

【0240】 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、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、濃厚剤 (concentrate) 又は水で希釈することによって濃厚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使用することが可能である。

10

【0309】

【0241】 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤又はその種子粉衣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剤を、そのまま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。

20

【0310】

【0242】 本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該剤中の式 (I) で表される化合物の特定の含有量及び当該種子に左右される。式 (I) で表される化合物の施用量は、一般に、種子 1 kg 当たり 0.001~50 g であり、好ましくは、種子 1 kg 当たり 0.01~15 g である。

【0311】

動物衛生

30

【0243】 動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式 (I) で表される化合物は、動物寄生物に対して、特に、外部寄生物又は内部寄生物に対して、活性を示す。用語「内部寄生物」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。外部寄生物は、典型的には、及び、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類及びダニ類である。

【0312】

【0244】 獣医学の分野において、内温動物に対する毒性が好ましい程度である式 (I) で表される化合物は、動物育種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物を防除するのに適している。

40

【0313】

【0245】 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；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；魚類及び甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類及び甲殻類の動物；及び、さらに、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0314】

【0246】 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、テングネズミ、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。

50

【0315】

【0247】 好ましい実施形態では、式（I）で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0316】

【0248】 好ましい別の実施形態では、式（I）で表される化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、及び、特に、家禽類に対して、投与される。

【0317】

【0249】 動物寄生生物を防除するために式（I）で表される化合物を使用することは、上記動物の病気、死亡事例を低減又は予防すること、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。

【0318】

【0250】 動物衛生の分野に関連して、用語「防除する（control）」又は「防除する（controlling）」は、式（I）で表される化合物が、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）で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すことが可能であること、その成長を阻害することが可能であること、又は、その増殖を阻害することが可能であることを意味する。

【0319】

【0251】 節足動物としては、以下のものを挙げることができる：

アノプリダ目（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.）、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、トリメノポン属種（Trimenopon spp.）、メノポン属種（Menopon spp.）、トリノトン属種（Trinoton spp.）、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ属種（Werneckiella spp.）、レピケントロン属種（Lepikentron spp.）、ダマリナ属種（Damalina spp.）、トリコデクテス属種（Trichodectes spp.）、フェリコラ属種（Felicola spp.）； 双翅目（Diptera）並びにネマトセリナ亜目（Nematocera）及びブラキセリナ亜目（Brachycera）の、例えば、アエデス属種（Aedes spp.）、アノフェレス属種（Anopheles spp.）、クレキス属種（Culex spp.）、シムリウム属種（Simulium spp.）、エウシムリウム属種（Eusimulium spp.）、フレボトムス属種（Phlebotomus spp.）、ルトゾミヤ属種（Lutzomyia spp.）、クリコイデス属種（Culicoides spp.）、クリソプス属種（Chrysops spp.）、オダグミア属種（Odagmia spp.）、ウィルヘルミア属種（Wilhelmia spp.）、ヒボミトラ属種（Hybomitra spp.）、アチロツス属種（Atylotus spp.）、タバヌス属種（Tabanus spp.）、ハエマトポタ属種（Haematopota spp.）、フィリポミヤ属種（Philipomyia spp.）、ブラウラ属種（Braulia spp.）、ムスカ属種（Musca spp.）、ヒドロタエア属種（Hydrotaea spp.）、ストモキス属種（Stomoxys spp.）、ハエマトピア属種（Haematobia spp.）、モレリア属種（Morellia spp.）、ファンニア属種（Fannia spp.）、グロシナ属種（Glossina spp.）、カリホラ属種（Calliphora spp.）、ルシリア属種（Luci

10

20

30

40

50

lia spp.)、クリソミイア属種 (Chrysomyia spp.)、ウォール
 ファールチア属種 (Wohlfahrtia spp.)、サルコファガ属種 (Sarcophaga spp.)、オエストルス属種 (Oestrus spp.)、ヒポデル
 マ属種 (Hypoderma spp.)、ガステロフィルス属種 (Gasterophilus spp.)、ヒポボスカ属種 (Hippobosca spp.)、リポプテ
 ナ属種 (Lipoptena spp.)、メロファグス属種 (Melophagus spp.)、リノエストルス属種 (Rhinoestrus spp.)、チプラ属種 (Tipula spp.) ; ノミ目 (Siphonapterida) の、例えば、プ
 レキス属種 (Pulex spp.)、クテノセファリデス属種 (Ctenocephalides spp.)、ツンガ属種 (Tunga spp.)、キセノプシラ属種 (Xenopsylla spp.)、セラトフィルス属種 (Ceratophyllus spp.) ;

10

ヘテロプテリダ目 (Heteropterida) の、例えば、シメキス属種 (Cimex spp.)、トリアトマ属種 (Triatoma spp.)、ロドニウス属種 (Rhodnius spp.)、パンストロングイルス属種 (Panstrongylus spp.) ; 並びに、さらに、ゴキブリ目 (Blattarida) の有害害虫及び衛生害虫。

【0320】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げることができる :

ダニ亜綱 (Acarari (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、イキシデス属種 (Ixodes spp.)、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (Rhipicephalus (Boophilus) 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.)、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سس属種 (Dermanyssus spp.)、オルニトニسس属種 (Ornithonyssus spp.)、プネウモニسس属種 (Pneumonyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、プネウモニسس属種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属種 (Sternostoma spp.)、バロア属種 (Varroa spp.)、アカラピス属種 (Acarapis spp.) ; アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) の、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、デモデキス属種 (Demodex spp.)、トロムビクラ属種 (Trombicula spp.)、ネオトロムビクラ属種 (Neotrombiculla spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.) ; 及び、アカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、アカルス属種 (Acarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、クネミドコプテス属種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス属種 (Cytodites

20

30

40

50

spp.)、ラミノシオプテス属種 (Laminosioptes spp.)。

【0321】

寄生性原生動物としては、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、トリパノソーマ科 (Trypanosomatidae)、例えば、トリパノソーマ・b.・ブルセイ (Trypanosoma b. brucei)、トリパノソーマ・b.・ガムビエンセ (T. b. gambiense)、トリパノソーマ・b.・ロデシエンセ (T. b. rhodesiense)、トリパノソーマ・コンゴレンセ (T. congolense)、トリパノソーマ・クルジ (T. cruzi)、トリパノソーマ・エバンシ (T. evansi)、トリパノソーマ・エクイヌム (T. equinum)、トリパノソーマ・レウィシ (T. lewisi)、トリパノソーマ・ペルカエ (T. percae)、トリパノソーマ・シミアエ (T. simiae)、トリパノソーマ・ビバキス (T. vivax)、レイスマニア・ブラシリエンシス (Leishmania brasiliensis)、レイスマニア・ドノバニ (L. donovani)、レイスマニア・トロピカ (L. tropica)；例えば、トリコモナス科 (Trichomonadidae)、例えば、ギアルジア・ラムブリア (Giardia lamblia)、ギアルジア・カニス (G. canis)；

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、エントモエバ・ヒストリチカ (Entamoeba histolytica)；ハルトマネリダエ科 (Hartmannellidae)、例えば、アカンタモエバ属種 (Acanthamoeba sp.)、ハルマレラ属種 (Harmanella sp.)；

アピコンプレックス門 (Apicomplexa) (胞子虫類 (Sporozoa))、例えば、エイメリア科 (Eimeriidae)、例えば、エイメリア・アセルブリナ (Eimeria acervulina)、エイメリア・アデノイデス (E. adenoides)、エイメリア・アラバメンシス (E. alabamensis)、エイメリア・アナチス (E. anatis)、エイメリア・アンセリナ (E. anserina)、エイメリア・アルロインギ (E. arloingi)、エイメリア・アシャタ (E. ashata)、エイメリア・アウブルネンシス (E. auburnensis)、エイメリア・ボビス (E. bovis)、エイメリア・ブルネッチ (E. brunetti)、エイメリア・カニス (E. canis)、エイメリア・キンキラエ (E. chinchillae)、エイメリア・クルペアルム (E. clupearum)、エイメリア・コルムバエ (E. columbae)、エイメリア・コントルタ (E. contorta)、エイメリア・克蘭ダリス (E. crandallii)、エイメリア・デブリエクキ (E. deblickei)、エイメリア・ジスベルサ (E. dispersa)、エイメリア・エリプソイダレス (E. ellipsooidales)、エイメリア・ファルシホルミス (E. falciformis)、エイメリア・ファウレイ (E. faurei)、エイメリア・フラベセンス (E. flavescentis)、エイメリア・ガロパボニス (E. gallopavonis)、エイメリア・ハガニ (E. hageni)、エイメリア・インテスチナリス (E. intestinalis)、エイメリア・イロクオイナ (E. iroquoiana)、エイメリア・イレシズア (E. irresidua)、エイメリア・ラベアナ (E. labbeana)、エイメリア・レウカルチ (E. leucarti)、エイメリア・マグナ (E. magna)、エイメリア・マキシマ (E. maxima)、エイメリア・メジア (E. media)、エイメリア・メレアグリジス (E. meleagridis)、エイメリア・メレアグリミチス (E. meleagrimitis)、エイメリア・ミチス (E. mitis)、エイメリア・ネカトリキス (E. necatrix)、エイメリア・ニナコーリアキモバエ (E. ninakohlyakimovae)、エイメリア・オビス (E. ovis)、エイメリア・パルバ (E. parva)、エイメリア・パボニス (E. pavonis)、エイメリア・ペルホランス (E. perholans)；

10

20

30

40

50

perforans)、エイメリア・ファサニ (E. phasani)、エイメリア・ピリホルミス (E. piriformis)、エイメリア・プラエコキス (E. praecox)、エイメリア・レシズア (E. residua)、エイメリア・スカブラ (E. scabra)、エイメリア属種 (E. spec.)、エイメリア・ステダ (E. stiedai)、エイメリア・スイス (E. suis)、エイメリア・テナラ (E. tenella)、エイメリア・ツルンカタ (E. truncata)、エイメリア・ツルッタエ (E. truttae)、エイメリア・ズエルニイ (E. zuernii)、グロビジウム属種 (Globidium spec.)、イソスポラ・ベリ (Isospora belli)、イソスポラ・カニス (I. canis)、イソスポラ・フェリス (I. felis)、イソスポラ・オヒオエンシス (I. ohioensis)、イソスポラ・リボルタ (I. rivolta)、イソスポラ属種 (I. spec.)、イソスポラ・スイス (I. suis)、シスチスポラ属種 (Cystispora spec.)、クリプトスポリジウム属種 (Cryptosporidium spec.)、特に、クリプトスポリジウム・パルブム (C. parvum)；例えば、トキソプラズマ科 (Toxoplasmodidae)、例えば、トキソプラズマ・ゴンジイ (Toxoplasma gondii)、ハモンジア・ヘイドルニイ (Hammondia heydornii)、ネオスポラ・カニヌム (Neospora caninum)、ベスノイチア・ベスノイチイ (Besnoitia besnoitii)；例えば、肉胞子虫科 (Sarcocystidae)、例えば、サルコシスチス・ボビカニス (Sarcocystis bovicanis)、サルコシスチス・ボビホルミス (S. bovi hominis)、サルコシスチス・オビカニス (S. ovicanis)、サルコシスチス・オビフェリス (S. ovifelis)、サルコシスチス・ネウロナ (S. neurona)、サルコシスチス属種 (S. spec.)、サルコシスチス・スイホミニス (S. sui hominis)；例えば、レウコゾイダエ科 (Leucozooidae)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ (Leucozytozoon simondi)；例えば、プラスモディウム科 (Plasmodiidae)、例えば、プラスモジウム・ベルゲイ (Plasmodium berghei)、プラスモジウム・ファルシパルム (P. falciparum)、プラスモジウム・マラリアエ (P. malariae)、プラスモジウム・オバレ (P. ovale)、プラスモジウム・ビバキス (P. vivax)、プラスモジウム属種 (P. spec.)；例えば、ピロプラズマ亜目 (Piroplasmae)、例えば、バベシア・アルゲンチナ (Babesia argentina)、バベシア・ボビス (B. bovis)、バベシア・カニス (B. canis)、バベシア属種 (B. spec.)、テイレリア・パルバ (Theileria parva)、テイレリア属種 (Theileria spec.)；例えば、アデレア亜目 (Adeleina)、例えば、ヘパトゾオン・カニス (Hepatozoon canis)、ヘパトゾオン属種 (H. spec.)。

【0322】

病原性内部寄生生物（これは、蠕虫類である）としては、扁形動物門 (Platyhelmintha)〔例えば、単生類 (Monogenea)、条虫類 (cestodes) 及び吸虫類 (trematodes)〕、線形動物、鉤頭動物門 (Acanthocephala) 及び舌形動物門 (Pentastoma) などがある。これらのものとしては、以下のものを挙げることができる：

単生綱 (Monogenea)：例えば：ギロダクチルス属種 (Gyrodactylus spp.)、ダクチログイルス属種 (Dactylogyrus spp.)、ポリストマ属種 (Polystoma spp.)；

条虫類 (Cestodes)：ギョウジョウチュウ目 (Pseudophyllidea) の、例えば：ジフィロボトリウム属種 (Diphyllbothrium spp.)、スピロメトラ属種 (Spirometra spp.)、シストセファルス属種 (Schistocephalus spp.)、リグラ属種 (Ligula spp.)

10

20

30

40

50

、ボトリジウム属種 (*Bothridium* spp.)、ジフロゴノポルス属種 (*Diphlogonoporus* spp.)；

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

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

線虫類：ベンチュウ目 (*Trichinellida*) の、例えば：トリクリス属種 (

10

20

30

40

50

Trichuris spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、トリコモソイデス属種 (*Trichomosoides* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)；

クキセンチュウ目 (*Tylenchida*) の、例えば：ミクロネマ属種 (*Micronema* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)；

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

センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、パスアルス属種 (*Passalurus* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、ト

10

20

30

40

50

キサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキソカラ属種 (*Toxocara* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属種、(*Ascaridia* spp.)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、セラジア属種 (*Thelazia* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハブロンエマ属種 (*Habronema* spp.)、パラブロンエマ属種 (*Parabronema* spp.)、ドラスキア属種 (*Draschia* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* 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.)；ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば：フィリコリス属種 (*Filicollis* spp.)；サジョ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.)；

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.)。

【0323】

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

【0324】

かくして、本発明の一実施形態は、薬物としての式 (I) で表される化合物の使用である。

【0325】

[0252] さらに態様は、坑内部寄生生物剤としての、特に、殺蠕虫剤 (*helminthi-
cidal agent*) 又は坑原生動物剤 (*antiprotozoic agent*) としての、式 (I) で表される化合物の使用である。式 (I) で表される化合物は、例えば、動物育種において、畜産業において、動物舎の中で、及び、衛生学の分野において、坑内部寄生生物剤として使用するのに、特に、殺蠕虫剤又は坑原生動物剤として使用するのに、適している。

【0326】

[0253] さらに態様は、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) で表される化合物の使用に関する。さらに態様は、例えば、畜産業における、動物育種における、動物舎の中における、又は、衛生学の分野における、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) で表される化合物の使用に関する。

【0327】

駆虫性混合成分

〔0254〕 以下の駆虫性混合成分を例として挙げる事ができる：

殺吸虫活性化化合物 (trematocidally active compound) 及び殺条虫活性化化合物 (cestocidally active compound) を包含する駆虫活性化化合物：

大環状ラクトン系の、例えば、アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシン、モキシデクチン、ネマデクチン、セラメクチン；

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

シクロオクタデプシペプチド系 (cyclooctadepsipeptides) の、例えば、エモデプシド (emodepside)、PF1022；

アミノアセトニトリル誘導體系の、例えば、モネパンテル (monepantel)；

テトラヒドロピリミジン系の、例えば、モランテル、ピランテル、オキサニテル；

イミダゾチアゾール系の、例えば、ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

サリチルアニリド系の、例えば、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、トリブロムサラン；

パラヘルクアミド系の、例えば、デルクアンテル、パラヘルクアミド；

アミノフェニルアミジン系の、例えば、アミダンテル、デアシル化アミダンテル (dAMD)、トリベンジミジン；

有機リン酸エステル系の、例えば、クマホス、クルホメート、ジクロルボス、ハロキソン、ナフタロホス (naphthalofos)、トリクロルホン；

置換フェノール系の、例えば、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)、ニトロキシニル；

ピペラジノン系の、例えば、プラジクアンテル (praziquantel)、エブシプランテル；

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

【0328】

媒介動物の防除

〔0255〕 式 (I) で表される化合物は、媒介動物 (vector) の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体 (例えば、ウイルス類、蠕虫類 (worms)、単細胞生物及び細菌類) 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)。

【0329】

〔0256〕 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、フィラリア症、別のウイルス性疾患 ;
- ・ ブユ (*Simuliidae*) : 蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (*Onchocerca volvulus*)) の運搬 ;
- (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 ;
- (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、野兎病、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 (*borelliosis*) ;
- (6) マダニ類 : ボレリア症 (*borellioses*)、例えば、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*)。

【0330】

[0257] 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。

【0331】

[0258] 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〕、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。

【0332】

[0259] 式 (I) で表される化合物が抵抗性を打破する (*resistance-breaking*) 場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【0333】

[0260] 式 (I) で表される化合物は、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、森林内において、庭園やレジャー施設において、及び、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式 (I) で表される化合物の使用である。

【0334】

工業材料の保護

[0261] 式 (I) で表される化合物は、昆虫類〔例えば、コウチュウ目 (*Coleoptera*)、ハチ目 (*Hymenoptera*)、シロアリ目 (*Isoptera*)、チョウ目 (*Lepidoptera*)、チャタテムシ目 (*Psocoptera*) 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。

【0335】

[0262] 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。

【0336】

〔0263〕さらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、少なくとも1種類のさらなる殺虫剤及び／又は少なくとも1種類の殺菌剤と一緒に使用する。

【0337】

〔0264〕さらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、即時使用可能な（ready-to-use）殺有害生物剤として存在している。即ち、それは、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。適切なさらなる殺虫剤又は殺菌剤は、特に、上記で挙げたものである。

【0338】

〔0265〕驚くべきことに、式（I）で表される化合物は、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）で表される化合物は、単独で、又は、別の活性成分と組合せて、防汚剤として使用することができる。

10

【0339】

衛生分野における害虫の防除

〔0266〕式（I）で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定のには、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、オフィス及び車両の客室）において遭遇する昆虫類、クモ形類動物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）で表される化合物は、単独で使用するか、又は、別の活性成分及び／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）で表される化合物は、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。

20

【0340】

〔0267〕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。

30

【0341】

〔0268〕施用は、例えば、エーロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム（automatic fogging system）、噴霧器（fogger）、泡、ゲル、セルロー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（moth papers）、防虫バッグ（moth bags）及び防虫ゲル（moth gels）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、ベイトステーションで実施する。

40

【0342】

〔0269〕本発明のさらなる態様は、除草剤としての、式（I）で表される化合物の使用である。

【0343】

調製方法

〔0270〕本発明による化合物は、当業者には既知の慣習的な方法で調製すること

50

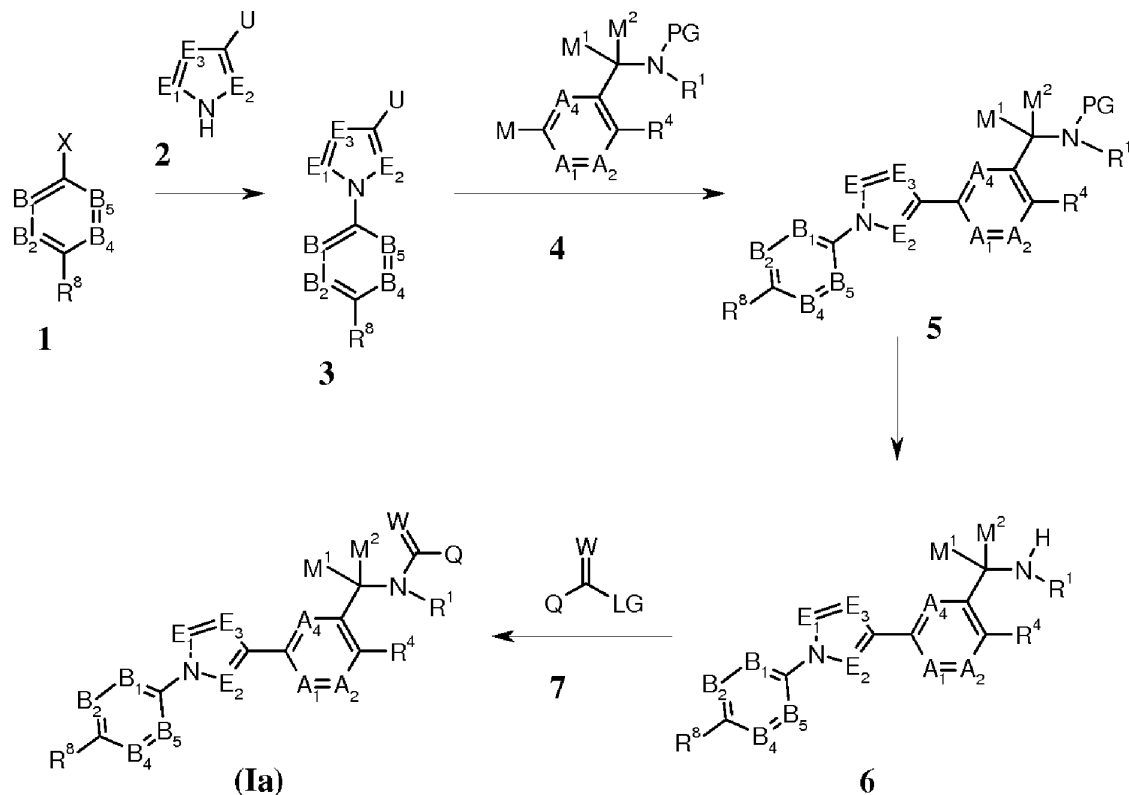
ができる。

【0344】

〔0271〕 反応スキーム1は、本発明による化合物(Ia)に関する一般的な調製方法を示している。

【0345】

反応スキーム1
【化22】



【0346】

〔0272〕 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^1 、 M_1 、 M_2 、 Q 、 R^4 及び R^8 は、上記で記載されているように定義される。 W は酸素である。 PG は、適切な保護基(例えば、 t -ブトキシカルボニル)を表す。 LG は、脱離基(例えば、塩素)を表す。 E_1-E_3 、炭素及び窒素からなる5員環は、 T のもとで定義されている5員ヘテロ環を表す。 X は、ハロゲン(例えば、フッ素)を表す。 U は、 M が硼酸、硼酸エステル又はトリフルオロボロネートを表す場合、臭素、ヨウ素又はトリフラートを表す。 U は、 M が臭素、ヨウ素又はトリフラートである場合、硼酸、硼酸エステル、トリフルオロボロネート又は $ZnCl$ である。

【0347】

〔0273〕 一般構造(Ia)の本発明による化合物は、中間体6を一般構造7のアシル化剤と反応させることによって、当業者には既知の方法で調製することができる。一般構造6の中間体は、一般構造5の N -保護された誘導体から調製することができる[例えば、以下のものを参照されたい: Greene-Wuts T. W. (2006) Protection for the Amino Group, in Greene's Protective Groups in Organic Synthesis, Fourth Edition, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, NJ, USA, S. 706 ff.]. 一般構造5の化合物は、パラジウムが触媒する反応を用いて、共反応体3及び4から調製することが

できる〔例えば、WO 2005/040110； WO 2009/089508； WO 2015/067647〕。一般構造4の化合物は、は、市販されているか、又は、当業者には既知の方法で調製することができる（例えば、以下のものを参照されたい：WO2006/053166； US 2012/0088764； WO 2008/70447）。一般構造3の化合物は、対応する出発物質1及び2から、芳香族系の求核置換反応（X＝塩素又はフッ素）〔例えば、以下のものを参照されたい：WO 2007/107470； Tetrahedron Letters 2003, 44, 7629-7632〕によって、又は、遷移金属が触媒する反応（X＝臭素又はヨウ素）〔例えば、以下のものを参照されたい：WO 2012/003405； WO 2009/158371〕によって、文献から知られている方法で調製することができる。一般構造3の化合物を調製するためのさらなる方法は、文献に記載されている〔例えば、以下のものを参照されたい：WO 2015/067647〕。

10

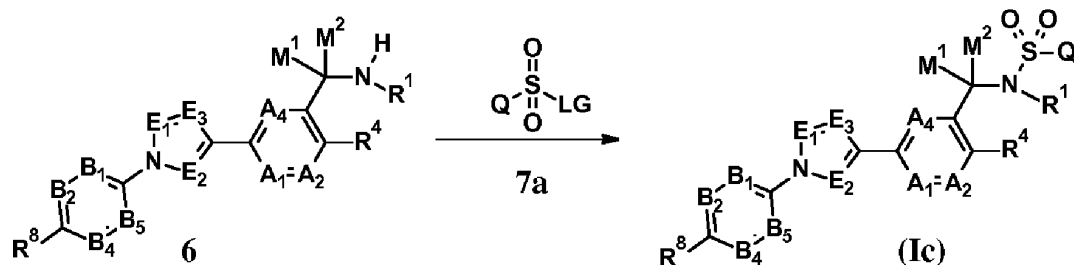
【0348】

〔0274〕 反応スキーム1aは、本発明による化合物（Ic）に関する一般的な調製方法を示している。

【0349】

反応スキーム1a

【化23】



20

【0350】

〔0275〕 ラジカルA₁、A₂、A₄、B₁、B₂、B₄、B₅、R¹、M₁、M₂、Q、R⁴及びR⁸は、上記で定義されているとおりである。LGは、脱離基（例えば、塩素）である。E₁－E₃、炭素及び窒素からなる5員環は、Tのもとで定義されている5員ヘテロ環である。

30

【0351】

〔0276〕 本発明による一般構造（Ic）の化合物は、中間体6を一般構造7aのスルホニル化剤と反応させることによって、当業者には既知の方法で調製することができる。

【0352】

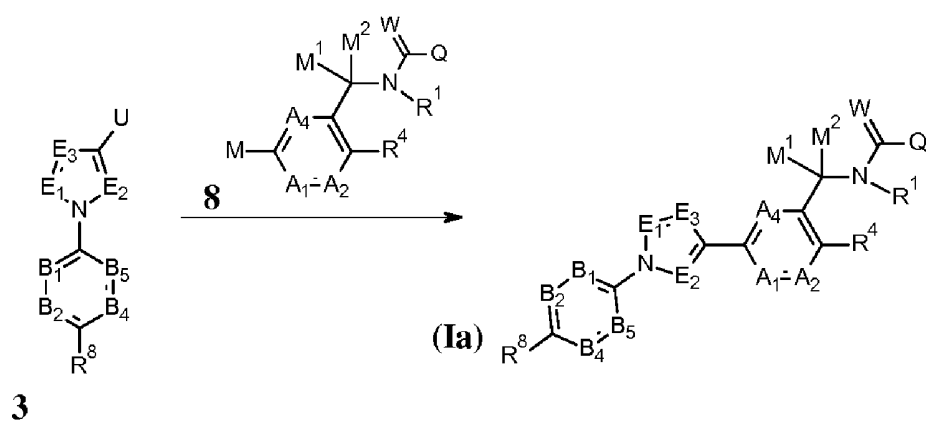
〔0277〕 反応スキーム2は、本発明による化合物（Ia）に関する一般的なさらなる調製方法を示している。

40

【0353】

反応スキーム2

【化 2 4】



10

【0354】

【0278】 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^1 、 M_1 、 M_2 、 Q 、 R^4 及び R^8 は、上記で記載されているように定義される。 W は酸素である。 E_1-E_3 、炭素及び窒素からなる5員環は、 T のもとで定義されている5員ヘテロ環を表す。 U は、 M がボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートを表す場合、臭素、ヨウ素又はトリフラートを表す。 U は、 M が臭素、ヨウ素又はトリフラートである場合、ボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートである。

20

【0355】

【0279】 一般構造 (Ia) の本発明による化合物は、は、パラジウムが触媒する反応を用いて、共反応体 3 及び 8 から調製することができる [例えば、以下のものを参照されたい：WO 2005/040110； WO 2009/089508； WO 2015/067647]。一般構造 3 の化合物の調製に関しては、上記ですでに記載した。

【0356】

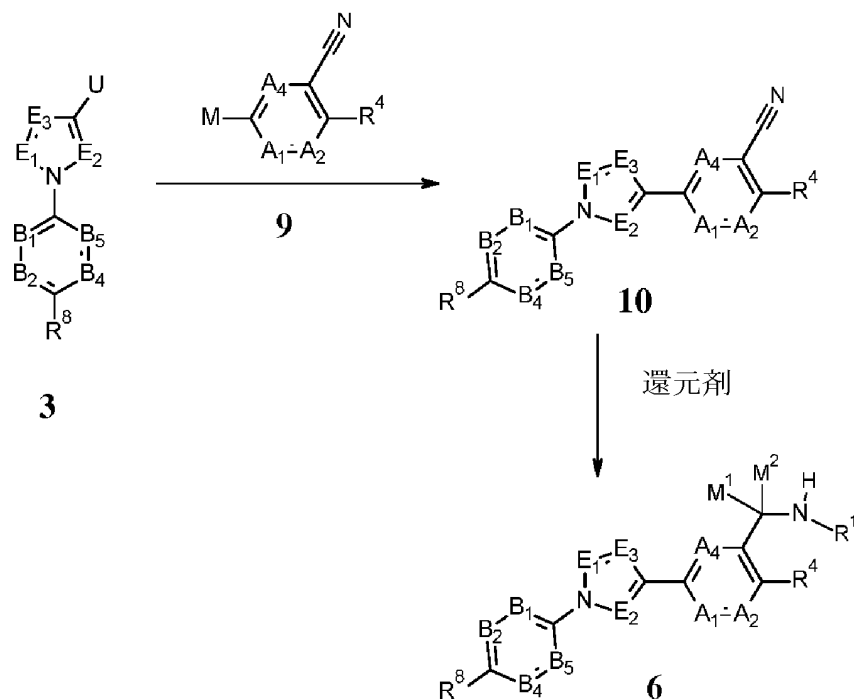
【0280】 反応スキーム 3 は、中間体 6 に関する一般的な調製方法を示している。

30

【0357】

反応スキーム 3

【化 2 5】



10

20

【0358】

〔0281〕 ラジカル A₁、A₂、A₄、B₁、B₂、B₄、B₅、R¹、Q、R⁴ 及び R⁸ は、上記で記載されているように定義される。反応スキーム 3 における M₁、M₂ 及び R¹ は、水素である。E₁—E₃、炭素及び窒素からなる 5 員環は、T のもとで定義されている 5 員ヘテロ環を表す。U は、M がボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートを表す場合、臭素、ヨウ素又はトリフラートを表す。U は、M が臭素、ヨウ素又はトリフラートである場合、ボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートである。

30

【0359】

〔0282〕 一般構造 6 の中間体は、構造 10 の化合物から、トリフルオロ酢酸の存在下で適切な還元剤（例えば、NaBH₄）と反応させることによって調製することができる〔例えば、以下のものを参照されたい：Houben-Weyl, Methode n der Organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry], Volume E16d/2 (Georg Thieme Verlag Stuttgart), p. 1006 ff.〕。一般構造 10 の化合物は、パラジウムが触媒する反応を用いて、共反応体 3 及び 9 から調製することができる〔例えば、以下のものを参照されたい：WO 2003/087061; US 2009-0203690〕。一般構造 9 の化合物は、市販されているか、又は、当業者には既知の方法で調製することができる。

40

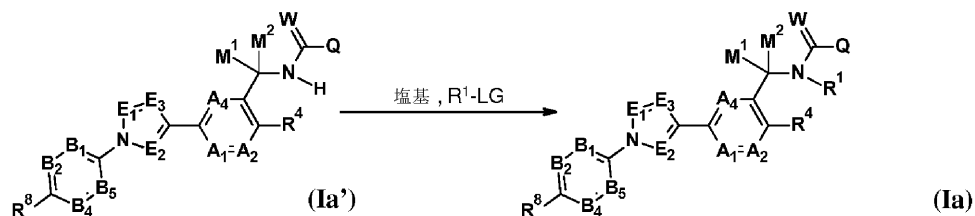
【0360】

式 (Ia)〔式中、R¹ は、H ではなく、例えば、メチルである〕で表される化合物は、反応スキーム 4 に従って調製することができる。

【0361】

反応スキーム 4

【化 2 6】



【0362】

【0283】 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 M_1 、 M_2 、 Q 、 R^4 及び R^8 は、上記で記載されているように定義され、及び、この場合における R^1 は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル (C_1-C_3)-アルキル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_1-C_3)-アルキルであり、好ましくは、いずれの場合にも置換されていてよい C_1-C_4 -アルキル又はシクロプロピルカルボニルであり、さらに好ましくは、メチルである。 W は酸素である。 LG は、脱離基（例えば、ヨウ素）を表す。 E_1-E_3 、炭素及び窒素からなる5員環は、 T のもとで定義されている5員ヘテロ環を表す。

【0363】

【0284】 本発明による一般構造 (Ia') ($R^1 = H$) の化合物は、反応スキーム4に対応させて、適切な塩基を用いて脱プロトン化し、及び、適切な求電子試薬と反応させることによって、本発明による一般構造 (Ia) [ここで、 R^1 は、定義による別のラジカルに対応する] の化合物に変換させることができる [例えば、以下のものを参照されたい：WO 2001/96283；Journal of the American Chemical Society (2009), 131, 10253；Organic Letters (2011), 13, 5920；例えば、合成実施例 Ia-24]。

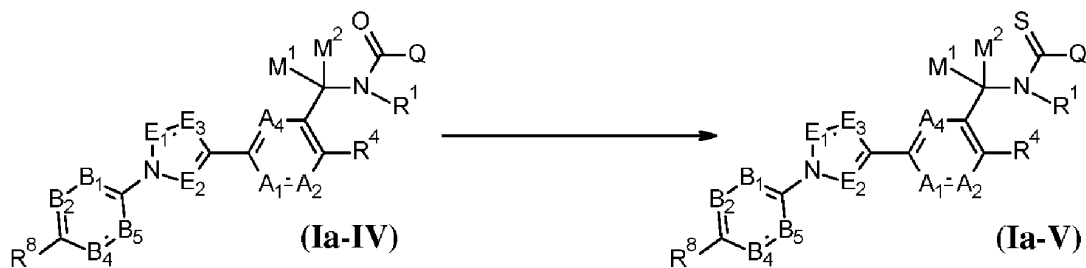
【0364】

【0285】 反応スキーム4aは、式 (Ia) [式中、 W は硫黄である] で表される化合物に関する一般的な調製方法を示している。

【0365】

反応スキーム4a

【化 2 7】



【0366】

【0286】 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 M_1 、 M_2 、 Q 、 R^4 及び R^8 は、上記で定義されているとおりであり、及び、 R^1 は、 H であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい 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_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_7 -シクロアルキル (C_1-C_3)-アルキル、アリール (C_1-C_3)-アルキル、ヘテロアリー

ル ($C_1 - C_3$) - アルキルであり、好ましくは、Hであるか、又は、いずれの場合にも置換されていてよい $C_1 - C_4$ - アルキルであり、さらに好ましくは、H及びメチルである。 $E_1 - E_3$ 、炭素及び窒素からなる5員環は、Tのもとで定義されている5員ヘテロ環である。

【0367】

【0287】 本発明による一般構造 (I a - I V) の化合物は、反応スキーム 4 a に従い、適切な試薬 (例えば、ローソン試薬又は P_4S_{10}) を用いて硫化することによって、本発明による一般構造 (I a - V) の化合物に変換させることができる [例えば、以下のものを参照されたい: US 2012/0165339; WO 2004/018411; 例えば、合成実施例 I a - 162]。

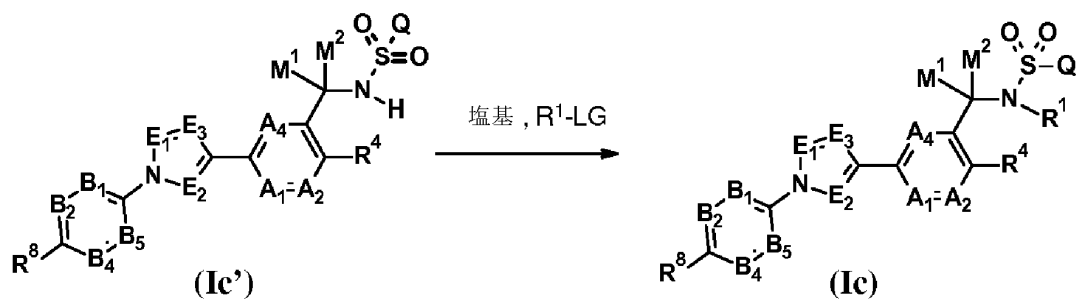
【0368】

【0288】 式 (I c) [式中、 R^1 は、Hではなく、例えば、メチルである] で表される化合物は、反応スキーム 4 b に従って調製することができる。

【0369】

反応スキーム 4 b

【化28】



【0370】

【0289】 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 M_1 、 M_2 、 Q 、 R^4 、 R^8 及び R^{11} は、上記で定義されているとおりであり、及び、この場合における R^1 は、いずれの場合にも置換されていてよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル ($C_1 - C_3$) - アルキル、アリール ($C_1 - C_3$) - アルキル、ヘテロアリール ($C_1 - C_3$) - アルキルであり、好ましくは、いずれの場合にも置換されていてよい $C_1 - C_4$ - アルキル又はシクロプロピルカルボニルであり、さらに好ましくは、メチルである。LGは、脱離基 (例えば、ヨウ素) である。 $E_1 - E_3$ 、炭素及び窒素からなる5員環は、Tのもとで定義されている5員ヘテロ環である。

【0371】

【0290】 本発明による一般構造 (I c') ($R^1 = H$) の化合物は、反応スキーム 4 b に従って、適切な塩基を用いて脱プロトン化し、及び、適切な求電子試薬と反応させることによって、本発明による一般構造 (I c) [ここで、 R^1 は、定義による別のラジカルに対応する] の化合物に変換させることができる [例えば、以下のものを参照されたい: WO 2001/96283; Journal of the American Chemical Society (2009), 131, 10253; Organic Letters (2011), 13, 5920; 例えば、合成実施例 I c - 03]。

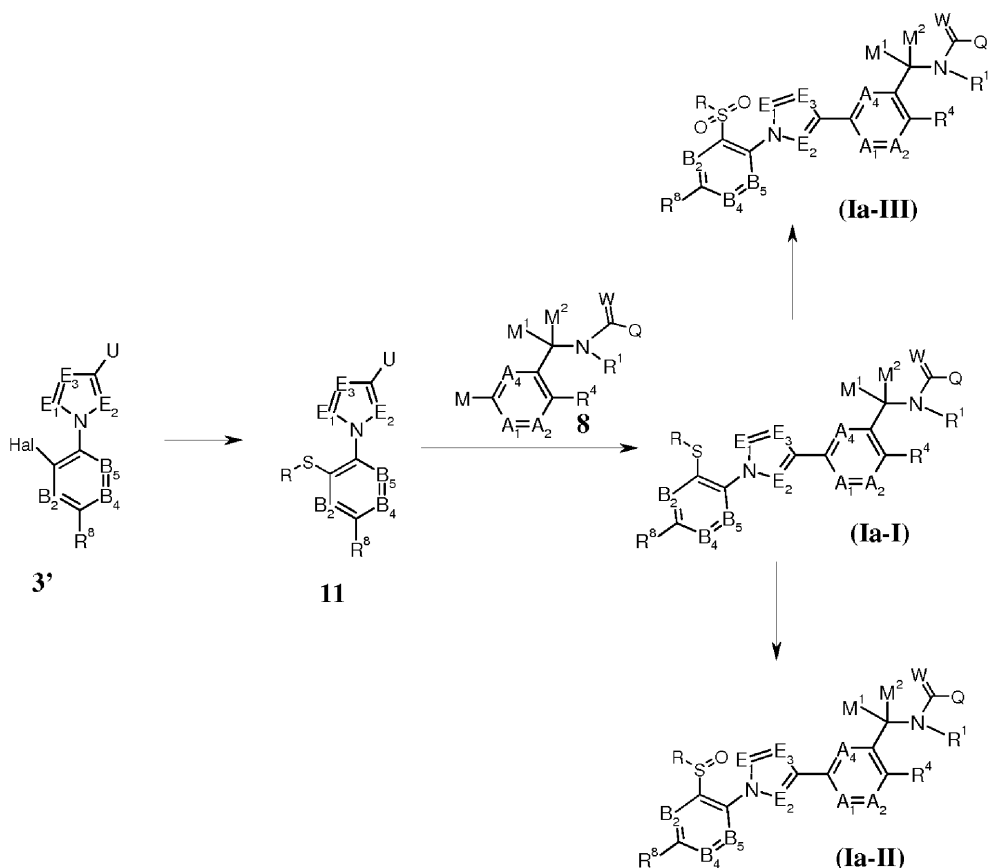
【0372】

【0291】 反応スキーム 5 は、本発明による化合物 (I a - I) ~ (I a - III) に関する一般的な調製方法を示している。

【0373】

反応スキーム5

【化29】



【0374】

【0292】 ラジカル $A_1, A_2, A_4, B_2, B_4, B_5, B_5, R^1, M_1, M_2, Q, R^4$ 及び R^8 は、上記で記載されているように定義される。 W は酸素である。 Hal は、 F, Cl, Br 又は I であり、好ましくは、 Cl である。 E_1-E_3 、炭素及び窒素からなる5員環は、 T のもとで定義されている5員ヘテロ環を表す。 R は、置換されていてもよい C_1-C_6 -アルキルである。 U は、 M がボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートを表す場合、臭素、ヨウ素又はトリフラートを表す。 U は、 M が臭素、ヨウ素又はトリフラートである場合、ボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートである。

【0375】

【0293】 一般構造11の化合物は、一般構造(3')の中間体から、適切な求核試薬(例えば、ナトリウムチオメトキシド)と反応させることによって、調製することができる(下記合成実施例を参照されたい)。一般構造(Ia-I)の化合物は、パラジウムが触媒する反応を用いて、共反応体11及び8から調製することができる[例えば、以下のものを参照されたい: WO 2005/040110; WO 2009/089508; WO 2015/067647]。本発明による一般構造(Ia-I, Ia-II, Ia-III)の化合物は、当業者には既知の方法で、本発明による化合物(Ia-I)を適切な酸化剤(例えば、 m -クロロ過安息香酸又は H_2O_2)と反応させることによって、調製することができる(下記合成実施例を参照されたい)。

【0376】

【0294】 反応スキーム6は、出発物質8に関する一般的な調製方法を示している。

【0377】

10

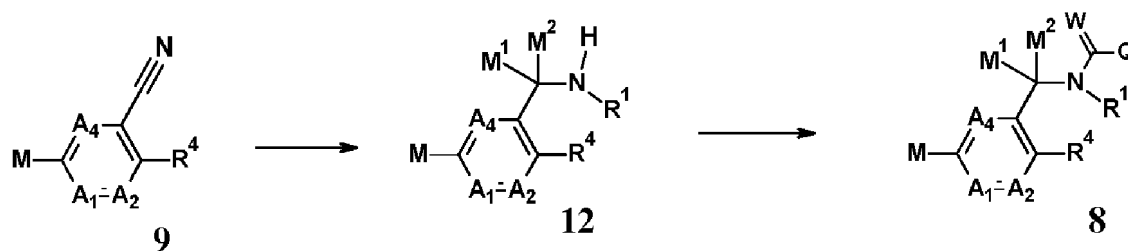
20

30

40

50

反応スキーム 6
【化 3 0】



10

【0378】

【0295】 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 R^1 、 M_1 、 M_2 、 Q 及び R^4 は、上記で記載されているように定義される。 W は酸素である。 M は、ボロン酸、ボロン酸エステル、トリフルオロボロネート、臭素、ヨウ素又はトリフラートである。

【0379】

【0296】 一般構造 8 の化合物は、中間体 12 から、当業者には既知の方法で、アシル化剤と反応させることによって、調製することができる。 M がボロン酸、ボロン酸エステル又はトリフルオロボロネートであり且つ M_1 及び M_2 がそれぞれ水素である場合、一般構造 12 の化合物は、中間体 9 から出発して、水素化によって得ることができる [例えば、以下のものを参照されたい：WO 2015/81280]。 M が臭素、ヨウ素又はトリフラートであり且つ M_1 又は M_2 のいずれかが水素ではない基である場合、一般構造 12 の化合物は、中間体 9 から出発して、適切な求核試薬（例えば、メチルマグネシウムブロミド）を添加することによって、得ることができる [例えば、以下のものを参照されたい：WO 2011/054436]。一般構造 9 の化合物は、市販されているか、又は、当業者には既知の方法で調製することができる。

20

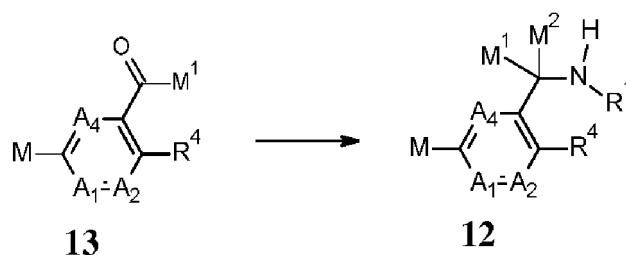
【0380】

【0297】 反応スキーム 7 は、出発物質 12 に関する一般的な調製方法を示している。

【0381】

反応スキーム 7

【化 3 1】



30

40

【0382】

【0298】 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 R^1 、 M_1 、 M_2 、 Q 及び R^4 は、上記で定義されているとおりである。 W は酸素である。 M は、臭素、ヨウ素又はトリフラートである。

【0383】

【0299】 M_1 又は M_2 が水素ではない基である場合、一般構造 12 の化合物は、一般構造 13 のケトンから出発し、還元剤として例えばシアノ水素化ホウ素ナトリウムを使用して、還元的アミノ化に付すことによって得ることができる [例えば、以下のものを参照されたい：WO 2010/132437； WO 2014/089048]。一般

50

構造 13 の化合物、市販されているか、又は、当業者には既知の方法で調製することができる。

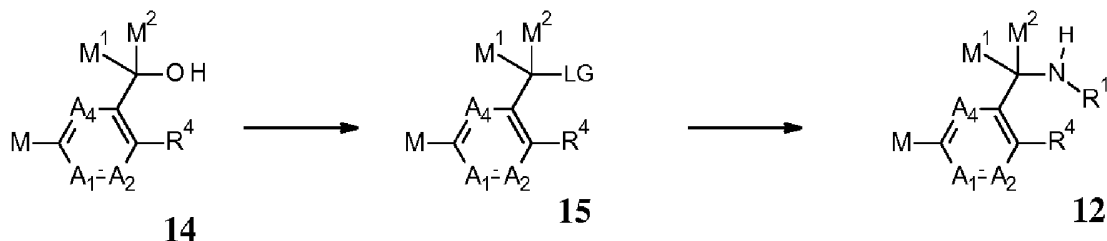
【0384】

〔0300〕 反応スキーム 8 は、出発物質 12 に関する一般的な調製方法を示している。

【0385】

反応スキーム 8

【化 32】



10

【0386】

〔0301〕 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 R^1 、 M_1 、 M_2 、 Q 及び R^4 は、上記で定義されているとおりである。 W は酸素である。 M は、臭素、ヨウ素又はトリフラートである。

20

【0387】

〔0302〕 基 M_1 又は基 M_2 のうちの 1 つ以下が水素ではない置換基である場合、一般構造 12 の化合物は、一般構造 14 の化合物から出発して得ることができる。この目的のために、一般構造 14 の化合物におけるヒドロキシル官能基を適切な脱離基 (LG) (例えば、メタンスルホネート) に変換させ、結果として、一般構造 15 の中間体を得られる。その脱離基を適切な窒素求核試薬 (例えば、アンモニア) で置き換えることによって、一般構造 12 の化合物が得られる。特定の窒素求核試薬 (例えば、アジド類又はフタルイミド類) を使用する場合、一般構造 12 の化合物を得るためには、付加的な段階が必要である。この目的のために必要な段階は、当業者には知られている [例えば、以下のものを参照されたい: WO 2015/009977; WO 2011/124998; WO 2013/045451]。一般構造 14 の化合物は、市販されているか、又は、当業者には既知の方法で調製することができる。

30

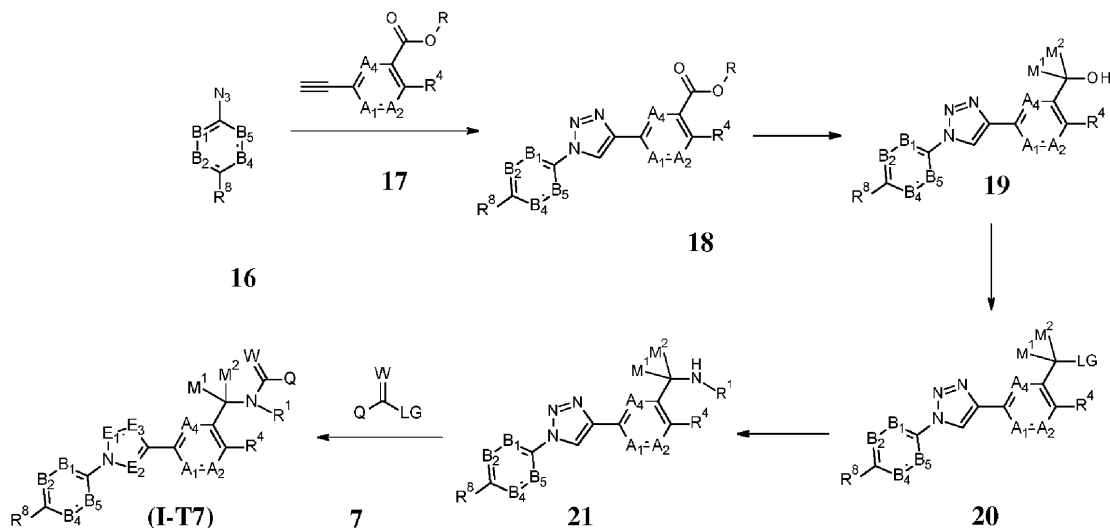
【0388】

〔0303〕 反応スキーム 9 は、式 (I-T7) で表される化合物に関する一般的な調製方法を示している。

【0389】

反応スキーム 9

【化 3 3】



【0390】

【0304】 ラジカル A_1 、 A_2 、 A_4 、 B_1 、 B_2 、 B_4 、 B_5 、 R^1 、 M_1 、 M_2 、 Q 、 R^4 及び R^8 は、上記で定義されているとおりである。 W は酸素である。 R は、アルキル（例えば、メチル又はエチル）であり、 LG は、脱離基（例えば、塩素又はメタンスルホネート）である。

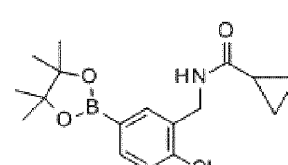
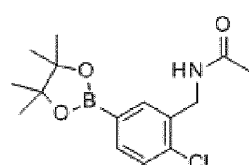
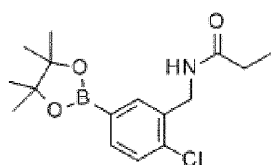
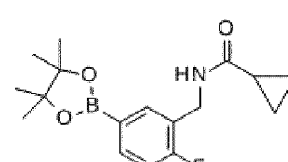
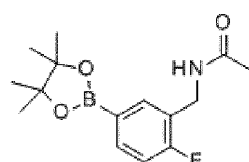
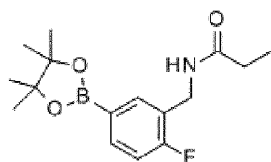
【0391】

【0305】 本発明による一般構造 (I-T7) の化合物は、当業者には既知の方法で、中間体 21 を一般構造 7 のアシル化剤と反応させることによって調製することができる。基 M_1 又は基 M_2 のうちの 1 つ以下が水素ではない置換基である場合、一般構造 21 の中間体は、一般構造 19 の化合物から得ることができる。この目的のために、一般構造 19 の化合物におけるヒドロキシル官能基を、当業者には既知の方法で、最初に脱離基（例えば、メタンスルホネート）に変換させ、結果として、一般構造 20 の中間体が得られる。その脱離基を適切な窒素求核試薬（例えば、アンモニア）で置き換えることによって、一般構造 21 の化合物が得られる [例えば、以下のものを参照されたい：WO 2009/097992]。一般構造 19 の化合物は、一般構造 18 の中間体から出発して、当業者には既知の方法で、適切な還元剤（例えば、DIBAL-H）を用いて還元することによって得ることができる [例えば、以下のものを参照されたい：WO 2012/138648]。一般構造 18 の化合物は、一般構造 16 の中間体を、例えば Cu 触媒のもとで、一般構造 17 の中間体を用いて付加環化することによって得ることができる（例えば、以下のものを参照されたい：Med. Chem. Commun. 2011, 2, 638）。一般構造 16 及び一般構造 17 の中間体は、市販されているか、又は、当業者には既知の方法で調製することができる。

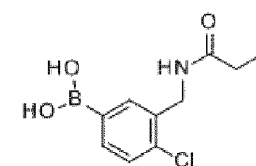
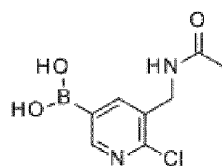
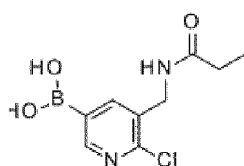
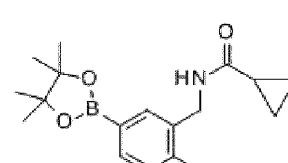
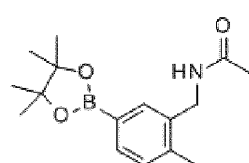
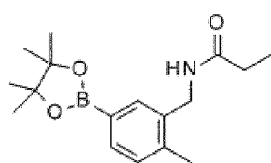
【0392】

【0306】 さらに、1 実施形態は、式 (I) [式中、 Q は、メチル、エチル、シクロアルキルであり、 R^4 は、F、Cl 又はメチルであり、及び、 A_1 、 A_2 及び A_3 は、C-H である] で表される化合物を調製するための下記中間体に関する。

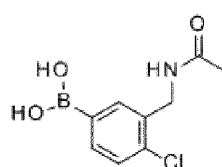
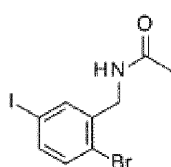
【化 3 4】



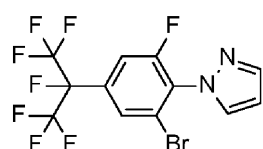
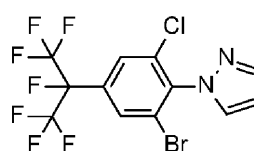
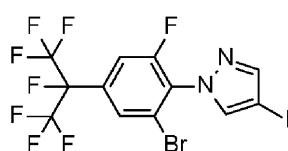
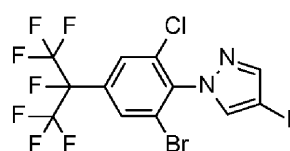
10



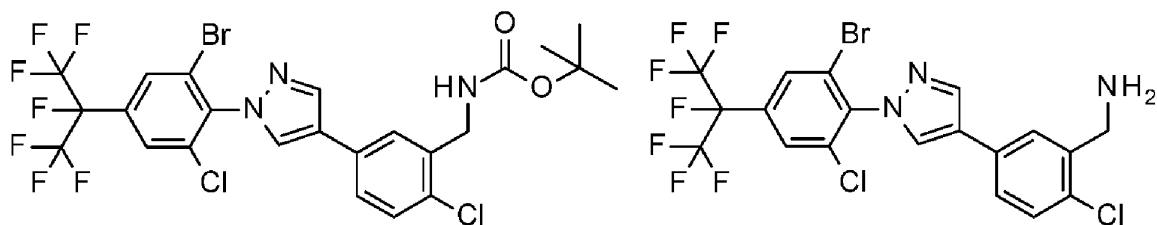
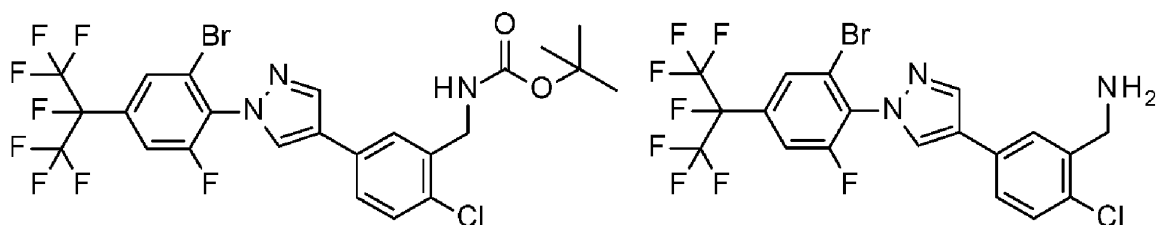
20



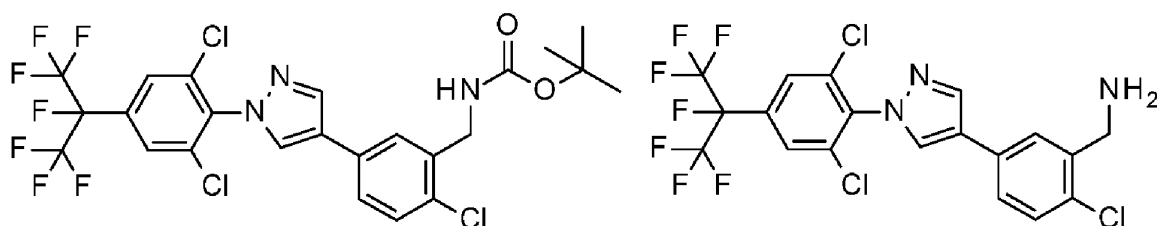
30



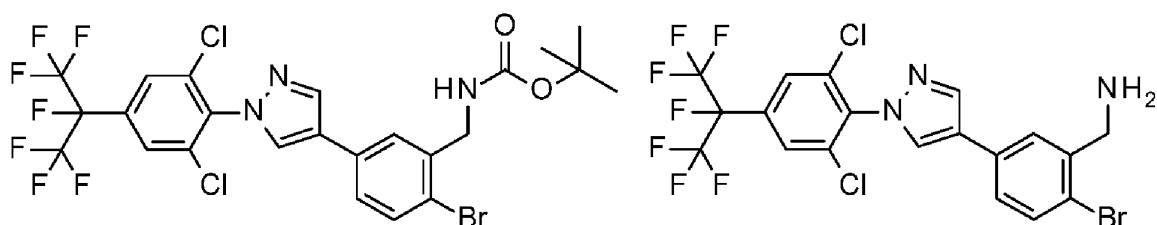
40



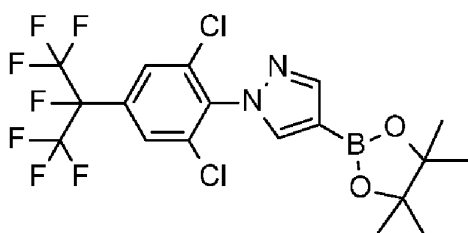
10



20



30



【実施例】

【0393】

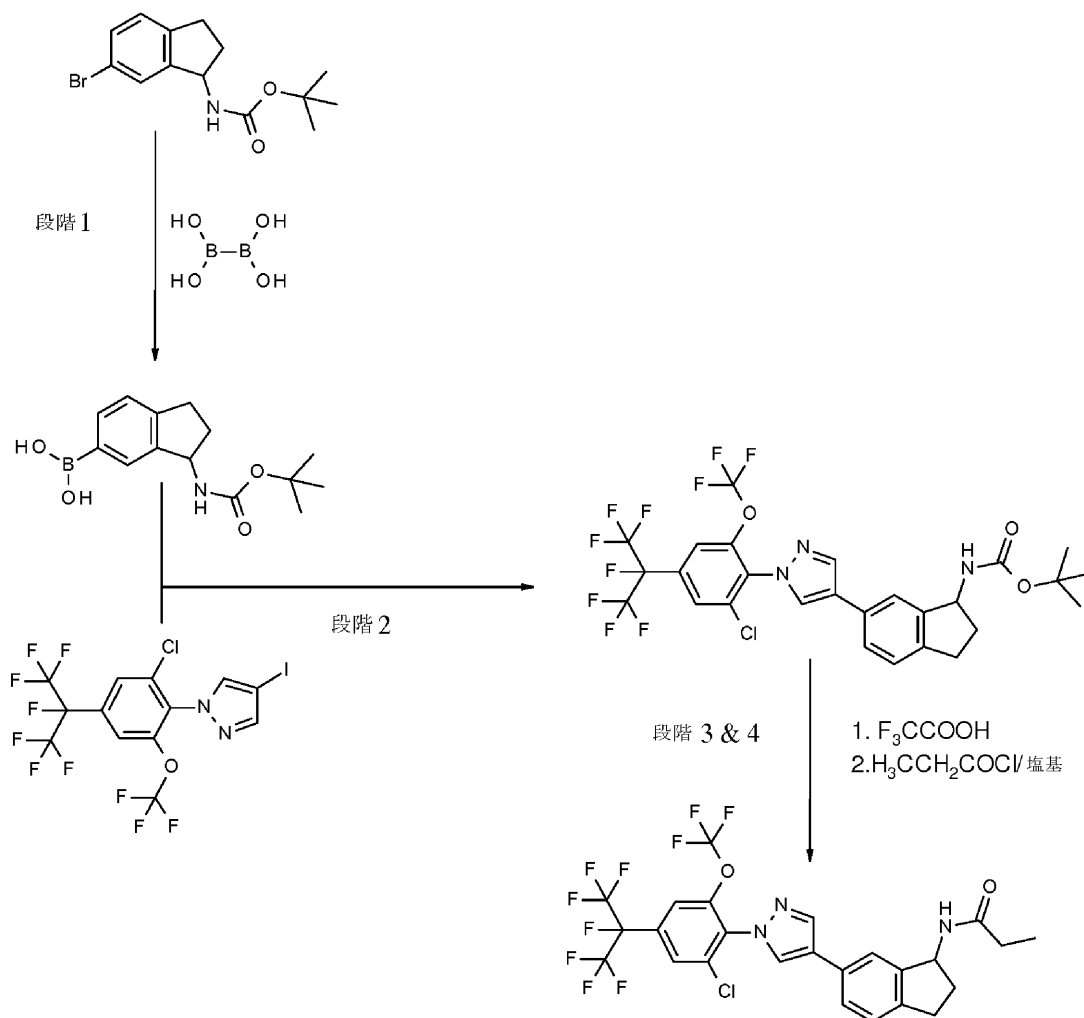
実験セクション

N-(6-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)プロパンアミド (I-Tc-01) の調製

反応スキーム10

40

【化 3 5】



【0394】

段階 1: {3-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル} ほう酸の調製

【0307】 836mg (2.68mmol) の tert-ブチル (6-ブロモ-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル) カルバメート (市販されている)、480mg (5.35mmol) のテトラヒドロキシジボラン及び89.4mg (0.134mmol) の Cataxium A Pd G2 を、アルゴン下、100mL 容フラスコの中に最初に装入した。次いで、アルゴンを用いて脱ガスした11mL のメタノール及び1.038g (8.03mmol、1.4mL) のジイソプロピルエチルアミンを添加し、その混合物を60分間50℃に加熱した。その混合物を冷却し、溶媒を、減圧下、ロータリーエバポレーターで除去した。その残渣を酢酸エチルに溶解させ、その有機相を、順次、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、5%リン酸二水素ナトリウム水溶液で洗浄し、及び、飽和塩化ナトリウム水溶液で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下、ロータリーエバポレーターで蒸発させた。その残渣を、少量のジクロロメタンを加えた石油エーテルと一緒に攪拌した。その固体を吸引濾過し、減圧下で乾燥させた。473mg の {3-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル} ボロン酸が得られた。

【0395】

HPLC-MS^{a)}: log P = 2.1、質量 (m/z) = 222 [(M+H) - 57]⁺;

¹H-NMR (400MHz, d₃-アセトニトリル): δ (ppm): 7.64 (s,

1 H), 7.61 (d, J=7.5 Hz, 1 H), 7.23 (d, J=7.5 Hz, 1 H), 6.02 (s, 2 H (広幅)), 5.59 (s, 1 H (広幅)), 5.05-5.12 (m, 1 H), 2.9-2.95 (m, 1 H), 2.76-2.86 (m, 1 H), 2.41-2.5 (m, 1 H), 1.71-1.82 (m, 1 H), 1.45 (s, 9 H)。

【0396】

段階2: tert-ブチル(6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)カルバメートの調製

【0308】 10.6 mLのイソプロパノールの中の293 mg (0.472 mmol)及び137.416 mg (0.496 mmol)の{3-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル}ボロン酸を、アルゴン下、100 mL容フラスコの中に最初に装入し、1.44 mLの脱ガスした1モル炭酸カリウム水溶液及び27.286 mg (0.05 mmol)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)を添加した。次いで、その混合物を3時間攪拌しながら65℃に加熱した。後処理のために、その混合物を冷却し、溶媒を、減圧下、ロータリーエバポレーターで蒸発させた。その残渣を酢酸エチルと水の間で分配させ、その有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、蒸発させた。その残渣を、40 gのシリカゲルを含んでいるカートリッジで、純粋なシクロヘキサンからシクロヘキサン/酢酸エチル(80:20)(v/v)までの勾配を使用して精製した。323 mgのtert-ブチル(6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)カルバメートが純度95%(LC/MS面積)で得られた。

【0397】

HPLC-MS^{a)}: log P=6.1、質量(m/z)=662 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR(400 MHz, d₃-アセトニトリル): δ(ppm): 8.13 (s, 1 H), 8.09 (s, 1 H), 7.96 (s, 1 H), 7.75 (s, 1 H), 7.45-7.51 (m, 2 H), 7.27 (d, J=8.1 Hz, 1 H), 5.65 (s, 1 H (広幅)), 5.02-5.18 (m, 1 H), 2.9-3.0 (m, 1 H), 2.76-2.88 (m, 1 H), 2.42-2.53 (m, 1 H), 1.73-1.89 (m, 1 H), 1.46 (s, 9 H)。

【0398】

段階3: 6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}インダン-1-アミンの調製

【0309】 4 mLのジクロロメタンの中の323 mg (0.488 mmol)のtert-ブチル(6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)カルバメートを25 mL容フラスコの中に最初に装入し、次いで、0.75 mLのトリフルオロ酢酸を滴下して加えた。添加が終了した後、その混合物を室温で30分間攪拌した。後処理のために、その混合物を、減圧下、ロータリーエバポレーターで蒸発させた。その残渣を取って3 mLのジクロロメタンの中に入れ、4.63 mLの10%水性NaOHを用いてアルカリ性とした。その有機相を分離し、その水相を、毎回5 mLのジクロロメタンで2回、再抽出した。次いで、その抽出物を合して飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、蒸発させた。172 mgの6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}インダン-1-アミンが得られた。

【0399】

HPLC-MS^{a)} : log P = 2.43、質量 (m/z) = 545 [(M+H) - 17]⁺ ;

¹H-NMR (400 MHz, d₃-アセトニトリル) : δ (ppm) : 8.15 (s, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.43 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 4.25-4.39 (m, 1H), 2.88-3.0 (m, 1H), 2.72-2.82 (m, 1H), 2.38-2.50 (m, 1H), 1.59-1.70 (m, 1H)。

【0400】

段階4 : N-(6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)プロパンアミド (I-Tc-01) の調製

【0310】 172 mg (0.306 mmol) の6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}インダン-1-アミンを5 mL のジクロロメタンに溶解させ、次いで、93 mg (128 μL, 0.919 mmol) のトリエチルアミンを添加した。その溶液を0℃まで冷却し、次いで、2 mL のジクロロメタンに溶解させた32.142 mg (30 μL, 0.337 mmol) のプロピオニルクロリドを滴下して加えた。次いで、その混合物を室温でさらに2時間攪拌した。次いで、その混合物を、最初に5%リン酸二水素ナトリウム水溶液で洗浄し、次いで、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下、ロータリーエバポレーターで蒸発させた。その残渣を、シリカを含んでいる15 g カートリッジ及び純粋なシクロヘキサンから55:45 (v/v) のシクロヘキサン/酢酸エチルまでの勾配を使用するクロマトグラフィーで精製した。134 mg のN-(6-{1-[2-クロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)プロパンアミド (I-Tc-01) が得られた。

【0401】

HPLC-MS^{a)} : log P = 4.84、質量 (m/z) = 618 [(M+H)]⁺ ;
(I-Tc-01) の¹H-NMR : (400 MHz, d₃-アセトニトリル) : δ (ppm) : 8.14 (s, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.58-6.68 (m, 1H (広幅)), 5.39 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.91-3.1 (m, 1H), 2.80-2.90 (m, 1H), 2.43-2.53 (m, 1H), 2.18-2.23 (m, 2H), 1.72-1.88 (m, 1H), 1.15 (t, J = 7.6 Hz, 3H)。

【0402】

N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)シクロプロパンカルボキサミド (Ia-25) の調製

反応スキーム11

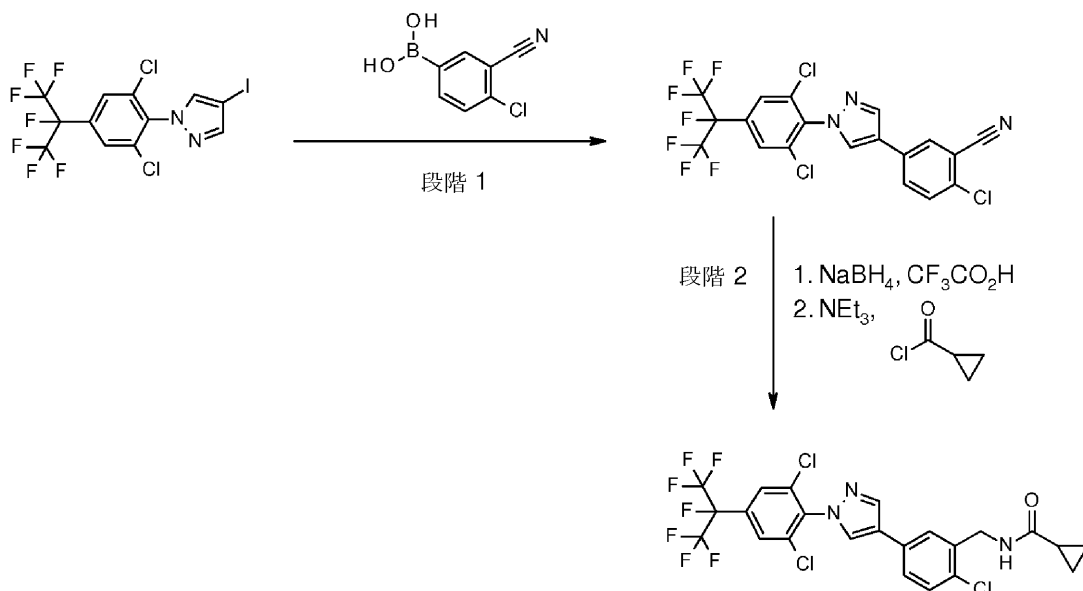
10

20

30

40

【化 3 6】



【0403】

段階 1: 2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-ピラゾール-4-イル} ベンゾニトリルの調製

20

〔0311〕 2.0 g (3.9 mmol) の 1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -4-ヨード-1H-ピラゾールと 0.83 g (4.6 mmol) の (4-クロロ-3-シアノフェニル) ホウ酸を 65 mL のジキサンに溶解させた溶液に、アルゴン下、21.7 mL の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を添加した。その反応混合物を 80 °C で 16 時間攪拌した。有機溶媒を減圧下で除去し、その水相を酢酸エチルで繰り返し抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣を、シリカゲルでの MPLC (勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→20:80) によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、1.57 g の 2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-ピラゾール-4-イル} ベンゾニトリルが得られた。

30

【0404】

HPLC-MS^{a)}: log P = 5.3、質量 (m/z) = 518 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): 8.107 (9.7); 7.886 (10.1); 7.842 (5.8); 7.837 (6.2); 7.751 (16.0); 7.722 (2.9); 7.717 (2.7); 7.701 (3.8); 7.696 (3.6); 7.570 (6.3); 7.548 (4.7); 7.263 (15.7); 5.301 (0.6); 2.045 (0.6); 1.592 (20.7); 1.259 (0.4); 0.000 (14.8); -0.001 (14.2)。

40

【0405】

段階 2: N- (2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-ピラゾール-4-イル} ベンジル) シクロプロパンカルボキサミド (Ia-25) の調製

〔0312〕 0.06 g (0.8 mmol) のトリフルオロ酢酸を 1 mL の THF に溶解させた溶液を、室温で、31 mg (0.83 mmol) の水素化ホウ素ナトリウムを 2 mL の THF に懸濁させた懸濁液に滴下して加えた。2 分間経過した後、この混合物に、86 mg (0.17 mmol) の 2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-

50

ピラゾール-4-イル} ベンゾニトリルを1 mLのTHFに溶解させた溶液を滴下して加えた。その反応物を室温で40時間攪拌し、次いで、10℃未満まで冷却し、1 mLのを添加した。有機溶媒を減圧下で除去し、水を添加し、その水相をジクロロメタンで繰り返し抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。

【0406】

【0313】 その残渣(89 mg)を3 mLのTHFに溶解させ、0℃で、13 μ L (0.14 mmol)のシクロプロパノイルクロリド及び25 μ L (0.18 mmol)のトリエチルアミンを添加した。その溶液を室温で16時間攪拌し、次いで、溶媒を減圧下で除去した。その残渣を取って酢酸エチルの中に入れ、水で洗浄した。その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その粗製生成物をHPLC(勾配： H_2O /アセトニトリル)によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、28 mgのN-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)シクロプロパンカルボキサミド(Ia-25)が得られた。

【0407】

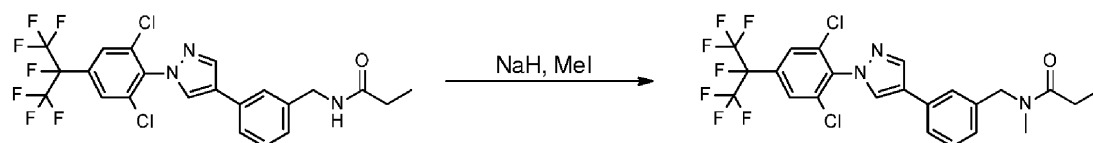
HPLC-MS^{a)}: log P=4.80、質量(m/z)=590 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR(400 MHz, d₆-DMSO): s. NMRピークリストを参照されたい。

【0408】

N-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)-N-メチルプロパンアミド(Ia-22)の調製

反応スキーム12

【化37】



【0409】

【0314】 64 mg (0.12 mmol)のN-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)プロパンアミドを3.2 mLのTHFに溶解させた溶液に、0℃で、8 mg (0.2 mmol)の水素化ナトリウム(鉱油中の55%分散液)を添加した。0℃で10分間経過した後、11 μ L (0.18 mmol)のヨードメタンを滴下して加えた。次いで、氷浴を除去した。室温で16時間経過した後、溶媒を減圧下で除去し、その残渣に水を添加した。相を分離し、その水相を酢酸エチルで繰り返し抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をシリカゲルでのMPLC(勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→30:70)によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、47 mgのN-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)-N-メチルプロパンアミド(Ia-22)が得られた。

【0410】

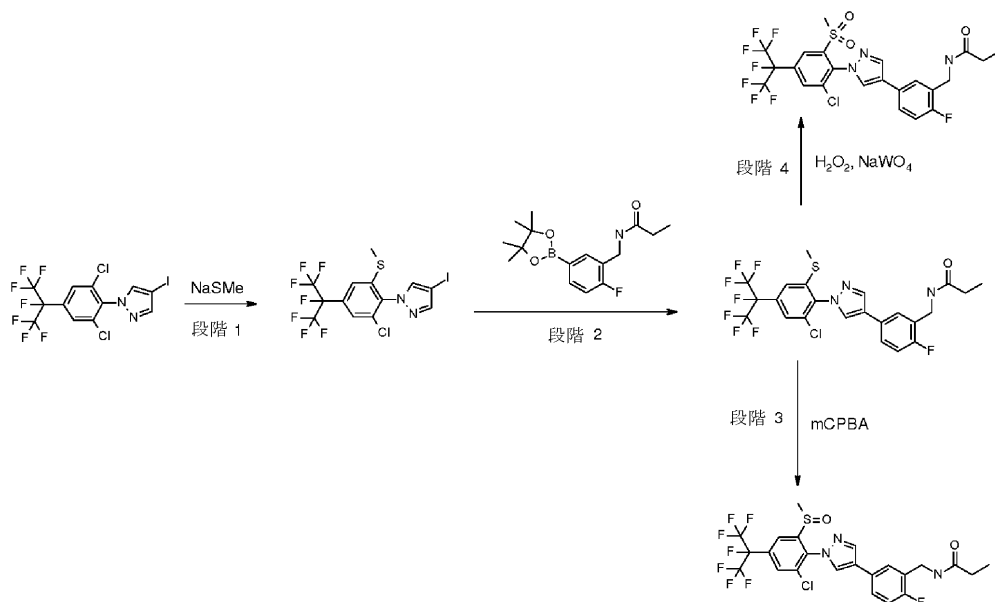
HPLC-MS^{a)}: log P=4.72、質量(m/z)=556 [(M+H)]⁺; (Ia-25)の¹H-NMR(400 MHz, d₆-DMSO): s. NMRピークリストを参照されたい。

【0411】

N-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド (I a-10)、N-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルフィニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド (I-a-45) 及び N-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルホニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド (I-a-46) の調製

反応スキーム 13

【化 38】



【0412】

段階 1: 1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-4-ヨード-1H-ピラゾールの調製

【0315】 2.1 g (4.14 mmol) の 1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-4-ヨード-1H-ピラゾールを 7.6 mL の DMF に溶解させた溶液に、0℃で、2 mL の DMF 中の 367 mg (4.97 mmol) のナトリウムチオメトキシドを滴下して加えた。その反応混合物を室温で 2 時間攪拌した。その混合物に EtOAc を添加し、H₂O で繰り返し洗浄した。その有機相を MgSO₄ で脱水し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をカラムクロマトグラフィー (EtOAc/c-hex) で精製した。1.91 g の 1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-4-ヨード-1H-ピラゾールが得られた。

【0413】

HPLC-MS^{a)}: log P = 5.19、質量 (m/z) = 518 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ (ppm): 8.30 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 2.50 (s, 3H)。

【0414】

段階 2: N-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプ

タフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド(Ia-10)の調製

【0316】 300mg (0.57mmol)の1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-4-ヨード-1H-ピラゾール、206mg (0.67mmol)のN-[2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]プロパンアミド及び27mg (0.02mmol)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)を5mLのジキサンに溶解させ、2mLの飽和NaHCO₃水溶液を添加した。その混合物を80℃で一晩攪拌した。その反応混合物を室温まで冷却し、シリカゲルで濾過した。その濾液を濃縮し、その残渣をHPLC(MeCN/H₂O)で精製した。87mgのN-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド(Ia-10)が得られた。

10

【0415】

HPLC-MS^{a)}: log P=4.29、質量(m/z)=572 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400MHz, d₆-DMSO): s. NMRピークリストを参照されたい。

【0416】

段階3: N-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルフィニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド(Ia-45)の調製

20

【0317】 34mg (0.05mmol)のN-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミドを10mLのCH₂Cl₂に溶解させ、13g (0.05mmol)のm-クロロ過安息香酸を0℃で添加した。その反応混合物を0℃で2時間攪拌した。1M NaOHを添加することによって反応を終了させた。相を分離し、その有機相を濃縮した。その残渣をカラムクロマトグラフィー(EtOAc/c-hex)で精製した。18mgのN-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルフィニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド(Ia-45)が得られた。

30

【0417】

HPLC-MS^{a)}: log P=3.52、質量(m/z)=588 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (Ia-45) (400MHz, d₆-DMSO): δ(ppm): 8.74 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.28-8.24 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 7.64-7.57 (m, 2H), 7.25 (t, 1H), 4.32 (d, 2H), 2.68 (s, 3H), 2.17 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)。

【0418】

段階4: N-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルホニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド(Ia-46)の調製

40

【0318】 34mg (0.05mmol)のN-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルファニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド及び1mgのNa₂WO₄を3mLの酢酸に溶解させた。その反応混合物を40℃に加熱し、15μL (0.17mmol)の35% H₂O₂を添加した。その反応物を50℃で2時間攪拌した。その混合物を室温まで冷却し、CH₂Cl₂を添加し、順次、飽和NaHCO₃水溶液及び飽和NaCl水溶液で洗浄した。その有機相をMgSO₄で脱水し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をカラムクロマトグラフィー(EtOAc

50

c/c-hex)で精製した。11mgのN-(5-{1-[2-クロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-6-(メチルスルホニル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}-2-フルオロベンジル)プロパンアミド(Ia-46)が得られた。

【0419】

HPLC-MS^{a)}: log P=3.65、質量(m/z)=603 [(M)]⁺;
¹H-NMR (Ia-46) (400MHz, d₆-DMSO): δ(ppm): 8.60 (s, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.26-8.24 (m, 2H), 7.62-7.57 (m, 2H), 7.23 (t, 1H), 4.32 (d, 2H), 3.36 (s, 3H), 2.17 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)。

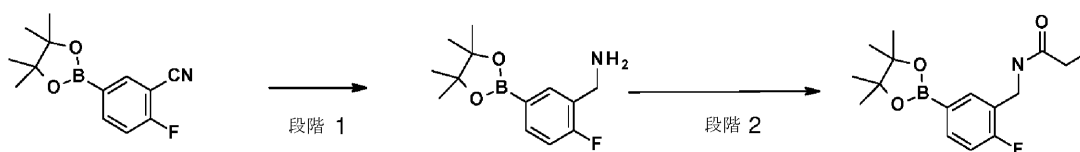
10

【0420】

N-[2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]プロパンアミドの調製

反応スキーム14

【化39】



20

【0421】

段階1: 1-[2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)フェニル]メタンアミンの調製

【0319】 2.30g (9.03mmol)の2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンゾニトリルを46mLの7Mメタノール性アンモニア溶液に溶解させ、ラネーニッケルを添加し、その混合物を、5バールのH₂圧力下、40℃で2時間攪拌した。その反応溶液を室温まで冷却し、濾過した。その濾液を濃縮した。2.77gの1-[2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)フェニル]メタンアミンが得られた。

30

【0422】

HPLC-MS^{a)}: log P=1.15、質量(m/z)=252 [(M+H)]⁺;
¹H-NMR (400MHz, d₆-DMSO): δ(ppm): 7.82 (d, 1H), 7.58-7.50 (m, 1H), 7.12-7.05 (m, 1H), 3.72 (s, 2H), 1.72 (s, 2H), 1.28 (s, 12H)。

【0423】

段階2: N-[2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]プロパンアミドの調製

40

【0320】 510mg (2.03mmol)の1-[2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)フェニル]メタンアミンをCH₂Cl₂に溶解させ、0℃で、0.56mL (4.06mmol)のNEt₃と0.19mLのプロピオニルクロリドをCH₂Cl₂に溶解させた溶液に滴下して加えた。その反応混合物を室温で2時間攪拌した。その混合物に1M HClを添加し、CH₂Cl₂で抽出した。その有機相を合してMgSO₄で脱水し、溶媒を減圧下で除去した。626mgのN-[2-フルオロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]プロパンアミドが得られた。

【0424】

HPLC-MS^{a)}: log P=2.70、質量(m/z)=308 [(M+H)]⁺;

50

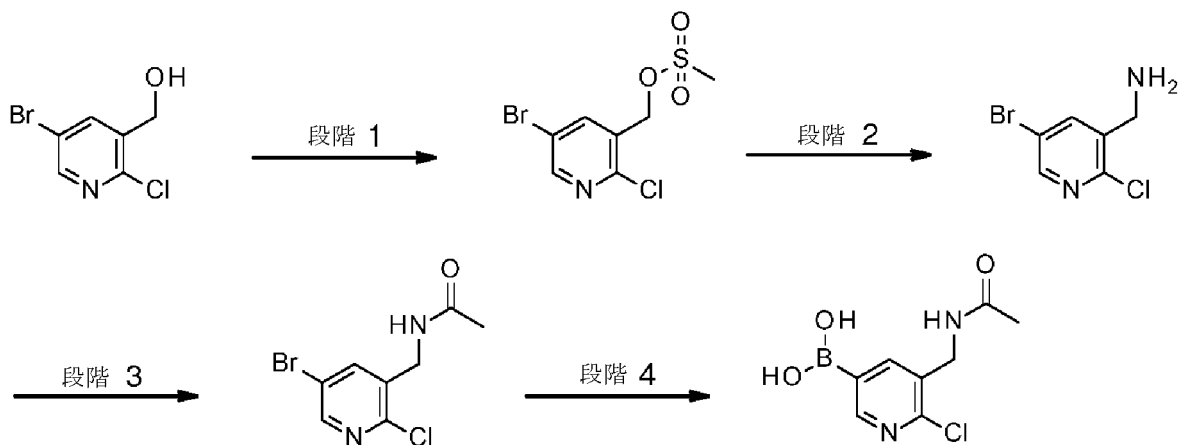
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO) : δ (ppm) : 8.30 (t, 1H), 7.65–7.60 (m, 2H), 7.19–7.14 (m, 1H), 4.28 (d, 2H), 8.52 (q, 2H), 1.29 (s, 12H), 1.01 (t, 3H)。

【0425】

[5-(アセトアミドメチル)-6-クロロピリジン-3-イル] ボロン酸の調製

反応スキーム 15

【化40】



【0426】

段階1： (5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル) メチルメタンスルホネートの調製

【0321】 5.00 g (19.1 mmol、純度85%)の(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メタノールと10 mL (57 mmol)のN,N-ジイソプロピルエチルアミンを150 mLのTHFに溶解させた溶液を0℃まで冷却し、1.5 mL (19 mmol)のメタンスルホニルクロリドを添加した。その反応溶液を60分間攪拌し、次いで、ジクロロメタンを添加した。その溶液を水、飽和炭酸水素ナトリウム溶液及び飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水した。溶媒を減圧下で除去し、6.50 gの(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メチルメタンスルホネートが得られた。

【0427】

HPLC-MS^{a)} : $\log P = 1.95$ 、質量(m/z) = 302 [(M+H)]⁺ ; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, d_6 -DMSO) : $\delta = 8.645$ (4.9) ; 8.638 (5.0) ; 8.396 (0.3) ; 8.314 (4.8) ; 8.307 (4.6) ; 5.376 (0.5) ; 5.318 (16.0) ; 4.808 (1.0) ; 3.339 (31.4) ; 3.320 (11.3) ; 2.525 (0.6) ; 2.511 (11.4) ; 2.507 (22.9) ; 2.502 (31.2) ; 2.498 (23.7) ; 2.494 (11.8) ; 2.294 (2.2) ; 1.356 (1.2) ; 1.275 (0.6) ; 1.259 (0.9) ; 1.244 (0.9) ; 0.000 (0.7)。

【0428】

段階2： 1-(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メタンアミンの調製

【0322】 135 mLの25%アンモニア水溶液と163 mLのエタノールの混合物に、0℃で、7.00 g (23.3 mmol)の(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メチルメタンスルホネートを添加した。その溶液を室温で一晩攪拌し、次いで、減圧下で濃縮した。その残渣に140 mLの2 M水酸化ナトリウム水溶液を添加し、その混合物をジクロロメタンで徹底的に抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。4.78 gの1-(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メタンアミンが得られた。

【0429】

HPLC-MS^{a)} : 質量 (m/z) = 223 [(M+H)]⁺ ;

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 8.426 (4.8) ; 8.420 (5.1) ; 8.208 (5.1) ; 8.202 (4.8) ; 3.747 (16.0) ; 3.321 (2.9) ; 2.526 (0.6) ; 2.512 (10.7) ; 2.508 (21.7) ; 2.503 (29.8) ; 2.499 (22.6) ; 2.494 (11.4) ; 2.293 (0.6) ; 2.000 (4.1) ; 0.008 (0.7) ; 0.000 (18.6) ; -0.008 (0.8) 。

【0430】

段階3 : N-[(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メチル]アセトアミドの調製

10

【0323】 2.50 g (11.3 mmol) の1-(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メタンアミンを50 mLのCH₂Cl₂に溶解させた溶液に0.87 g (11 mmol)の塩化アセチル及び3.46 mL (24.8 mmol)のトリメチルアミンを添加し、その混合物を室温で一晩攪拌した。ジクロロメタンを添加し、次いで、その溶液を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水した。溶媒を減圧下で除去し、かくして、2.88 gのN-[(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メチル]アセトアミドが得られた。

【0431】

HPLC-MS^{a)} : log P = 1.15、質量 (m/z) = 265 [(M+H)]⁺ ;

20

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 8.491 (2.4) ; 8.484 (2.4) ; 8.456 (0.4) ; 8.442 (0.7) ; 7.939 (2.2) ; 7.933 (2.2) ; 4.289 (3.3) ; 4.274 (3.3) ; 3.320 (18.3) ; 2.524 (0.3) ; 2.511 (9.4) ; 2.507 (20.4) ; 2.502 (29.0) ; 2.498 (21.8) ; 2.493 (10.5) ; 2.124 (0.3) ; 1.920 (16.0) ; 0.000 (2.5) 。

【0432】

段階4 : [5-(アセトアミドメチル)-6-クロロピリジン-3-イル]ホウ酸の調製

【0324】 40 mLの酸素非含有メタノールに、2.15 g (8.16 mmol)の(N-[(5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-イル)メチル]アセトアミド、2.19 g (24.5 mmol)のテトラヒドロキシジボロン、273 mg (0.41 mmol)のクロロ[(ジ(1-アダマンチル)-N-ブチルホスフィン)-2-(2-アミノビフェニル)]パラジウム(II)及び3.80 mL (24.5 mmol)のN,N-ジエチルイソプロピルアミンを添加した。その反応溶液を5時間40℃に加熱し、次いで、室温で一晩攪拌した。1 M水酸化ナトリウム水溶液を添加し、その有機溶媒を減圧下で除去した。次いで、追加の1 M水酸化ナトリウム水溶液及びメチルtert-ブチルエーテルを添加し、不溶性成分を濾過した。その濾液を有機相と水相に分離させた。その水相をメチルtert-ブチルエーテルで繰り返し抽出し、その有機相を1 M水酸化ナトリウム水溶液で繰り返し抽出した。その水相を合して濃塩酸を用いて酸性化してpH 0とし、飽和塩化ナトリウム溶液を添加し、その混合物をメチルエチルケトンで繰り返し抽出した。そのメチルエチルケトン抽出物を飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、溶媒を減圧下で除去した。かくして、2.05 gの[5-(アセトアミドメチル)-6-クロロピリジン-3-イル]ボロン酸が得られた。

30

40

【0433】

HPLC-MS^{a)} : 質量 (m/z) = 229 [(M+H)]⁺ ;

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 8.577 (2.7) ; 8.572 (2.8) ; 8.453 (0.5) ; 8.432 (0.8) ; 8.417 (1.3) ; 8.404 (0.7) ; 8.036 (2.4) ; 8.031 (2.4) ; 4.293 (3.6) ; 4.279 (3.6) ; 2.520 (0.5) ; 2.511 (14.9) ; 2.

50

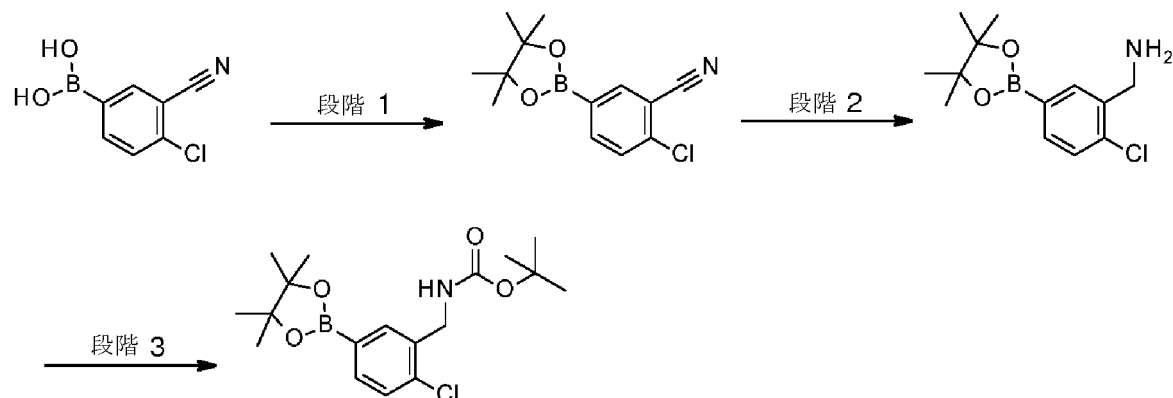
507 (33.1); 2.502 (47.7); 2.498 (36.9); 2.493 (18.8); 2.456 (0.6); 2.438 (1.4); 2.420 (1.4); 2.402 (0.5); 2.067 (5.7); 1.917 (16.0); 1.909 (1.5); 1.892 (1.2); 0.925 (1.8); 0.907 (3.5); 0.888 (1.7); 0.000 (5.9); -0.008 (0.3)。

【0434】

tert-ブチル [2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]カルバメートの調製

反応スキーム16

【化41】



【0435】

段階1: 2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンゾニトリル

【0325】 10.0 g (55.1 mmol) の(4-クロロ-3-シアノフェニル)ボロン酸と6.52 g (55.1 mmol)のピナコールとモレキュラーシーブの懸濁液を室温で24時間攪拌した。その反応溶液をセライトで濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をシリカゲルでのMPLC (勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→50:50) によるクロマトグラフィーで精製した。かくして、12.6 gの2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンゾニトリルが得られた。

【0436】

HPLC-MS^{a)}: log P=4.19、質量(m/z)=264 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400 MHz, d6-DMSO): δ=8.065 (0.8); 8.062 (0.9); 7.953 (0.5); 7.950 (0.4); 7.933 (0.6); 7.929 (0.6); 7.786 (0.9); 7.765 (0.7); 3.320 (8.9); 2.512 (3.7); 2.507 (8.0); 2.503 (11.4); 2.498 (8.7); 2.494 (4.3); 1.311 (16.0); 0.000 (0.7)。

【0437】

段階2: 1-[2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)フェニル]メタンアミン

【0326】 12.0 g (45.5 mmol)の2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンゾニトリルを450 mLの7Mメタノール性アンモニア溶液に溶解させた溶液に、6 gのラネーコバルトを添加し、その反応溶液を、20バールの水素圧下、室温で16時間攪拌した。その反応混合物を濾過し、その濾液を減圧下で濃縮した。13.9 gの淡黄色-緑色の固体が得られた。

【0438】

10

20

30

40

50

HPLC-MS^{a)} : $\log P = 1.27$ 、質量 (m/z) = 268 [(M+H)]⁺。

【0439】

段階3: tert-ブチル [2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]カルバメート

【0327】 段階2からの2.00gの粗製生成物と2.13g (9.75mmol)の二炭酸ジ-tert-ブチルを20mLのCH₂Cl₂に溶解させた溶液に、0℃で、1.31mL (9.43mmol)のトリメチルアミンを添加した。その反応混合物を室温で一晩攪拌し、水を添加し、その混合物をCH₂Cl₂で抽出した。その有機相を合して飽和ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をシリカゲルでのMPLC (勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→100:0) によるクロマトグラフィーで分離させた。0.81gのtert-ブチル [2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]カルバメート、及び、所望の生成物と副産物の混合フラクション0.73gが得られた。この混合物を、再度、クロマトグラフィーで分離させた。その分離は、HPLC (勾配: H₂O/アセトニトリル) で実施し、追加の0.45gのtert-ブチル [2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]カルバメートが得られた。

【0440】

HPLC-MS^{a)} : $\log P = 4.73$ 、質量 (m/z) = 312 [(M+H) - 56]⁺;

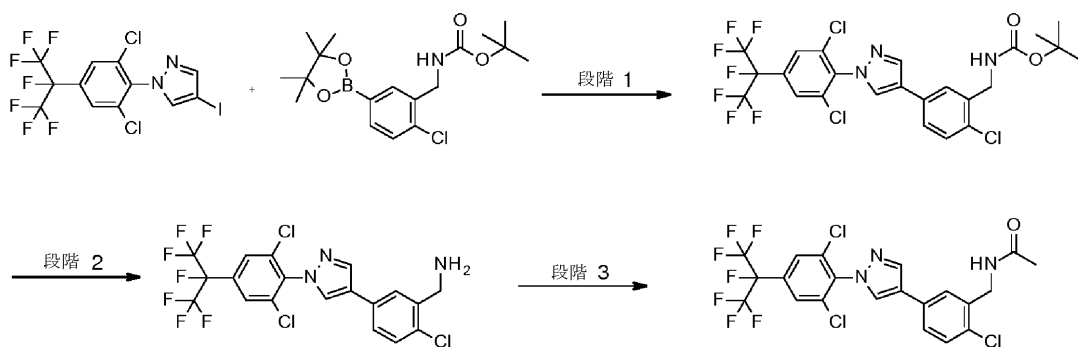
¹H-NMR (400MHz, d₆-DMSO) : $\delta = 7.637$ (0.6); 7.542 (0.4); 7.539 (0.4); 7.523 (0.6); 7.519 (0.6); 7.433 (1.1); 7.414 (0.8); 4.198 (0.7); 4.183 (0.7); 3.318 (15.8); 2.510 (5.9); 2.506 (12.2); 2.502 (16.8); 2.497 (12.7); 2.493 (6.3); 2.073 (0.9); 1.419 (6.3); 1.289 (16.0); 0.008 (0.7); 0.000 (20.2); -0.008 (0.8)。

【0441】

N-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド (Ia-05) の調製

反応スキーム17

【化42】



【0442】

段階1: tert-ブチル (2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)カルバメート

【0328】 1.49g (2.93mmol)の1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-4-ヨー

ド-1H-ピラゾールと1.25g (3.39mmol)のtert-ブチル[2-クロロ-5-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキソボロラン-2-イル)ベンジル]カルバメートを40mLの1,4-ジキサンに溶解させた溶液に20mLの飽和NaHCO₃水溶液を添加し、その反応混合物を80℃で一晩攪拌した。次いで、有機溶媒を減圧下で除去し、その水相を酢酸エチルで徹底的に抽出した。その有機相を合して飽和ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過した。溶媒を減圧下で除去した。その残渣をシリカゲルでのMPLC (勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→100:0)によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、1.41gのtert-ブチル(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)カルバメートが得られた。

10

【0443】

HPLC-MS^{a)}: log P=5.78、質量(m/z)=620 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400MHz, d₆-DMSO): δ=8.608 (3.4); 8.264 (2.7); 8.080 (5.9); 7.589 (1.7); 7.562 (1.3); 7.539 (0.4); 7.475 (2.4); 7.455 (1.7); 7.410 (0.5); 7.395 (0.8); 7.380 (0.5); 4.247 (2.0); 4.233 (1.9); 3.322 (45.3); 2.672 (0.4); 2.502 (60.3); 2.498 (50.3); 2.329 (0.4); 1.988 (0.5); 1.411 (16.0); 1.398 (8.6); 1.309 (0.6); 0.000 (53.2)。

20

【0444】

段階2: 1-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}フェニル)メタンアミン

【0329】 25.6mLのトリフルオロ酢酸を1.37g (2.21mmol)のtert-ブチル(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)カルバメートに添加した。その反応混合物を室温で30分間攪拌し、次いで、減圧下で濃縮した。その残渣に飽和NaHCO₃溶液を添加し、その混合物を酢酸エチルで徹底的に抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。1.06gの1-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}フェニル)メタンアミンが得られた。

30

【0445】

HPLC-MS^{a)}: log P=2.41、質量(m/z)=522 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400MHz, d₆-DMSO): δ=8.639 (9.6); 8.352 (9.6); 8.315 (0.4); 8.082 (16.0); 7.865 (4.3); 7.861 (4.4); 7.552 (2.3); 7.547 (2.2); 7.532 (3.1); 7.526 (3.1); 7.498 (0.4); 7.478 (0.4); 7.436 (6.4); 7.416 (4.6); 4.057 (0.5); 4.039 (1.6); 4.021 (1.6); 4.003 (0.5); 3.847 (0.7); 3.812 (11.9); 3.320 (12.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.4); 2.511 (33.1); 2.507 (66.9); 2.502 (90.6); 2.498 (67.7); 2.493 (33.1); 2.334 (0.5); 2.329 (0.6); 2.325 (0.5); 2.149 (1.4); 1.989 (6.7); 1.193 (1.7); 1.176 (3.5); 1.158 (1.7); 0.146 (0.5); 0.008 (4.4); 0.000 (119.0); -0.008 (4.5); -0.150 (0.5)。

40

【0446】

50

段階 3: N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド、及び、N-アセチル-N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド

[0330] 1. 0 g (1.9 mmol) の 1-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}フェニル)メタンアミンを 50 mL の THF に溶解させた溶液に、0℃で、0.55 mL (3.9 mmol) のトリエチルアミン及び 309 mg (3.93 mmol) の塩化アセチルを添加した。その反応混合物を室温で一晩攪拌し、次いで、減圧下で濃縮した。その残渣を取って酢酸エチルの中に入れ、水で洗浄し、その有機相を硫酸ナトリウムで脱水した。溶媒を減圧下で除去し、その残渣を RP シリカゲルでの MPLC (勾配: H₂O/アセトニトリル) によるクロマトグラフィーで分離させた。1.26 g の N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド、及び、所望の生成物と副産物の混合フラクション 0.45 g が得られた。これを、再度、クロマトグラフィーで分離させた。その分離は、HPLC (勾配: H₂O/アセトニトリル) で実施して、追加の 0.21 g の N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド及び 70 mg の N-アセチル-N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミドが得られた。

【0447】

N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド (Ia-05):

HPLC-MS^{a)}: log P = 4.13、質量 (m/z) = 564 [(M+H)]⁺;

¹H-NMR (表 1 の実施例 Ia-05 を参照されたい);

N-アセチル-N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド (Ia-108)

HPLC-MS^{a)}: log P = 5.14、質量 (m/z) = 606 [(M+H)]⁺;

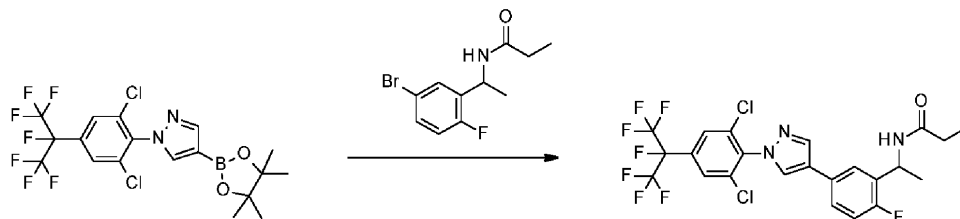
¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.730 (2.8); 8.388 (2.8); 8.084 (4.8); 7.642 (0.7); 7.638 (0.7); 7.617 (1.0); 7.541 (1.7); 7.521 (1.2); 7.251 (1.5); 4.946 (3.6); 3.316 (20.5); 2.671 (0.4); 2.501 (63.8); 2.404 (16.0); 2.328 (0.4); 2.073 (0.6); 0.000 (8.7)。

【0448】

N-[1-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}フェニル)エチル]プロパンアミド (Ia-47) の調製

反応スキーム 18

【化 4 3】



【0 4 4 9】

10

N-〔1-（5-ブロモ-2-フルオロフェニル）エチル〕プロパンアミド

【0 3 3 1】 250 mg (1.15 mmol) の1-（5-ブロモ-2-フルオロフェニル）エタノンと1.33 g (17.2 mmol) の酢酸アンモニウムの溶液に、0℃で、362 mg (5.75 mmol) のシアノ水素化ホウ素ナトリウムを添加し、その反応混合物を環流しながら一晩加熱した。その反応混合物に水及び飽和炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、その混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。245 mg の粗製生成物が得られた。

【0 4 5 0】

【0 3 3 2】 前記前駆物質の80 mg の粗製生成物を CH_2Cl_2 に溶解させた溶液に、0.09 mL (0.50 mmol) のN,N-ジイソプロピルエチルアミン及び24 mg (0.26 mmol) のプロピオニルクロリドを添加した。その反応溶液を室温で一晩攪拌し、次いで、溶媒を減圧下で除去した。その残渣を取って酢酸エチルの中に入れ、1 M塩酸及び水で洗浄した。次いで、その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をRPシリカゲルでのMPLC（勾配： H_2O /アセトニトリル）によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、22 mg のN-〔1-（5-ブロモ-2-フルオロフェニル）エチル〕プロパンアミドが得られた。

20

【0 4 5 1】

HPLC-MS^{a)} : $\log P = 2.14$ 、質量 (m/z) = 276 [(M+H)]⁺ ;
¹H-NMR (400 MHz, d_6 -DMSO) : $\delta = 8.310$ (1.2) ; 8.291 (1.2) ; 7.520 (1.7) ; 7.514 (2.2) ; 7.504 (1.7) ; 7.497 (2.2) ; 7.482 (1.3) ; 7.475 (1.0) ; 7.470 (1.5) ; 7.464 (1.1) ; 7.460 (1.5) ; 7.453 (1.3) ; 7.449 (1.5) ; 7.442 (1.1) ; 7.181 (2.6) ; 7.160 (2.4) ; 7.156 (2.8) ; 7.134 (2.3) ; 5.123 (0.3) ; 5.105 (1.3) ; 5.087 (1.9) ; 5.069 (1.3) ; 5.051 (0.3) ; 3.318 (36.8) ; 2.671 (0.3) ; 2.524 (0.7) ; 2.519 (1.1) ; 2.511 (19.9) ; 2.506 (42.9) ; 2.502 (58.3) ; 2.497 (41.8) ; 2.493 (19.7) ; 2.328 (0.3) ; 2.157 (2.0) ; 2.138 (6.7) ; 2.119 (7.1) ; 2.101 (2.4) ; 1.323 (9.9) ; 1.305 (9.9) ; 1.001 (7.7) ; 0.982 (16.0) ; 0.963 (7.2) ; 0.000 (5.2) 。

30

40

【0 4 5 2】

1-〔2,6-ジクロロ-4-（1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル）フェニル〕-4-（4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル）-1H-ピラゾール

【0 3 3 3】 1.27 g (2.50 mmol) の1-〔2,6-ジクロロ-4-（1,1,1,2,3,3,3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル）フェニル〕-4-ヨード-1H-ピラゾールをTHFに溶解させた溶液に、-39℃で、イソプロピルマグネシウムクロリドリチウムクロリド錯体の1.3 M溶液2.12 mLを滴下して加え、次いで

50

、その反応溶液を -38°C で30分間攪拌した。次いで、 0.59 mL (2.9 mmol)の2-イソプロポキシ-4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロランを滴下して加え、冷却浴を除去し、その反応溶液を室温で1時間攪拌した。飽和塩化アンモニウム溶液を添加し、その混合物をシクロヘキサンで繰り返し抽出した。その有機相を合して飽和炭酸水素ナトリウム溶液及び飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をシリカゲルでのMPLC (勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→30:70) によるクロマトグラフィーで精製した。かくして、 270 mg の1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-4-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロラン-2-イル)-1H-ピラゾールが得られた。

10

【0453】

HPLC-MS^{a)}: $\log P=5.55$ 、質量(m/z)= $507[(M+H)]^{+}$; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz , d_6 -DMSO): $\delta=8.361(1.8)$; $8.045(2.5)$; $7.956(1.8)$; $3.316(30.9)$; $2.523(1.0)$; $2.510(19.5)$; $2.506(38.9)$; $2.501(51.1)$; $2.497(37.6)$; $2.493(18.8)$; $1.398(3.0)$; $1.293(16.0)$; $0.000(1.8)$ 。

【0454】

N-[1-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}フェニル)エチル]プロパンアミド

20

【0334】 22 mg ($80\text{ }\mu\text{mol}$)のN-[1-(5-ブromo-2-フルオロフェニル)エチル]プロパンアミドと 41 mg ($80\text{ }\mu\text{mol}$)の1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-4-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキソボロラン-2-イル)-1H-ピラゾールをブタノールに溶解させた溶液に、 105 mg (0.32 mmol)の Cs_2CO_3 、水及び 2 mg ($2\text{ }\mu\text{mol}$)の $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ を添加した。その反応溶液を 80°C で6時間攪拌し、及び、室温で一晩攪拌した。次いで、水を添加し、その混合物を酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をRPシリカゲルでのMPLC (勾配： H_2O /アセトニトリル) によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、 5 mg のN-[1-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}フェニル)エチル]プロパンアミド (Ia-47) が得られた。

30

【0455】

HPLC-MS^{a)}: $\log P=4.41$ 、質量(m/z)= $574[(M+H)]^{+}$; $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz , d_6 -DMSO): $\delta=8.695(0.8)$; $8.564(8.7)$; $8.313(0.4)$; $8.268(8.8)$; $8.245(2.7)$; $8.227(2.4)$; $8.144(0.7)$; $8.138(0.7)$; $8.080(13.9)$; $8.034(1.8)$; $8.017(0.4)$; $7.980(0.3)$; $7.960(0.4)$; $7.852(0.8)$; $7.848(0.8)$; $7.645(1.9)$; $7.640(2.2)$; $7.627(2.1)$; $7.622(2.2)$; $7.572(1.3)$; $7.566(1.3)$; $7.560(1.4)$; $7.551(1.6)$; $7.545(1.4)$; $7.539(1.3)$; $7.533(1.1)$; $7.224(2.3)$; $7.202(2.5)$; $7.198(2.7)$; $7.177(2.1)$; $6.594(0.4)$; $6.588(0.7)$; $6.583(0.4)$; $5.754(2.0)$; $5.186(0.4)$; $5.168(1.5)$; $5.150(2.2)$; $5.131(1.5)$; $5.114(0.4)$; $3.319(268.0)$; $2.675(0.9)$; $2.670(1.2)$; $2.666(0.9)$; $2.523(2.9)$; $2.510(75$

40

50

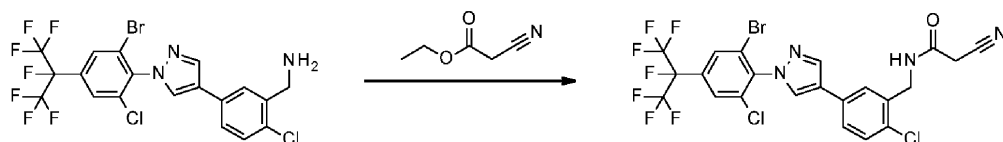
. 5) ; 2. 506 (154. 7) ; 2. 501 (205. 7) ; 2. 497 (151. 1) ; 2. 333 (0. 9) ; 2. 328 (1. 3) ; 2. 323 (0. 9) ; 2. 185 (2. 1) ; 2. 166 (6. 8) ; 2. 147 (7. 3) ; 2. 128 (2. 5) ; 1. 384 (10. 2) ; 1. 366 (10. 2) ; 1. 234 (0. 5) ; 1. 225 (0. 4) ; 1. 011 (7. 8) ; 0. 992 (16. 0) ; 0. 973 (7. 4) ; 0. 007 (1. 4) ; 0. 000 (42. 7) ; -0. 008 (1. 8)。

【0456】

N- (5- {1- [2-ブロモ-6-クロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-ピラゾール-4-イル} -2-クロロベンジル) -2-シアノアセトアミド (I a-137) の調製

反応スキーム 19

【化44】



【0457】

【0335】 100mg (177 μ mol) の1- (5- {1- [2-ブロモ-6-クロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-ピラゾール-4-イル} -2-クロロフェニル) メタンアミンと1. 3 μ L (89 μ mol) の1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデカー7-エンを1mLのTHFに溶解させた溶液に、3. 8 μ L (0. 35mmol) のシアノ酢酸エチルを添加した。その反応溶液を室温で一晩攪拌した。次いで、追加の3. 8 μ L (0. 35mmol) のシアノ酢酸エチル及び1. 3 μ L (89 μ mol) の1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデカー7-エンを添加し、その混合物を室温で2日間攪拌した。0. 1M塩酸を添加し、その反応混合物を酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して水で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をHPLC (勾配: H₂O / アセトニトリル) によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、47mgのN- (5- {1- [2-ブロモ-6-クロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-ピラゾール-4-イル} -2-クロロベンジル) -2-シアノアセトアミド (I a-137) が得られた。

【0458】

HPLC-MS^{a)} : log P = 4. 28、質量 (m/z) = 633 [(M+H)]⁺ ; ¹H-NMR (400MHz, d₆-DMSO) : δ = 8. 795 (0. 6) ; 8. 773 (1. 4) ; 8. 759 (2. 8) ; 8. 746 (1. 5) ; 8. 663 (8. 8) ; 8. 373 (8. 9) ; 8. 350 (0. 6) ; 8. 315 (0. 4) ; 8. 158 (5. 1) ; 8. 115 (4. 9) ; 7. 669 (0. 4) ; 7. 650 (0. 8) ; 7. 633 (2. 7) ; 7. 614 (10. 9) ; 7. 510 (3. 9) ; 7. 488 (3. 0) ; 4. 399 (6. 1) ; 4. 386 (6. 4) ; 3. 795 (16. 0) ; 3. 319 (30. 3) ; 2. 672 (1. 3) ; 2. 502 (211. 0) ; 2. 499 (188. 3) ; 2. 329 (1. 2) ; 2. 074 (1. 6) ; 0. 002 (29. 6) ; 0. 000 (33. 8)。

【0459】

tert-ブチル (2-ブロモ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-ピラゾール-4-イル} ベンジル) カルバメートの調製

反応スキーム 20

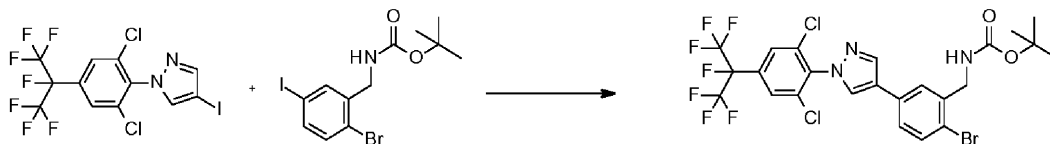
10

20

30

40

【化 4 5】



【0 4 6 0】

【0 3 3 6】 1. 50 g (2.96 mmol) の1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-4-ヨード-1H-ピラゾールをTHFに溶解させた溶液に、-39℃で、イソプロピルマグネシウムクロリドリチウムクロリド錯体の1.3M溶液2.50 mLを滴下して加え、その反応溶液を-38℃で60分間攪拌した。次いで、5.07 mL (3.6 mmol) の1.3M ZnCl₂溶液を滴下して加え、冷却浴を除去し、その反応溶液を室温で30分間攪拌した。次いで、1.34 g (3.3 mmol) のtert-ブチル(2-ブロモ-5-ヨードベンジル)カルバメートと55 mg (0.24 mmol) のトリ-2-フリルホスフィンと43 mg (74 μmol) のビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)を3 mLのTHFに溶解させた溶液を添加し、その反応溶液を室温で一晩攪拌した。飽和塩化アンモニウム溶液を添加し、その混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をシリカゲルでのMPLC(勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→20:80)によるクロマトグラフィーで精製した。かくして、610 mgのtert-ブチル(2-ブロモ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)カルバメートが得られた。

【0 4 6 1】

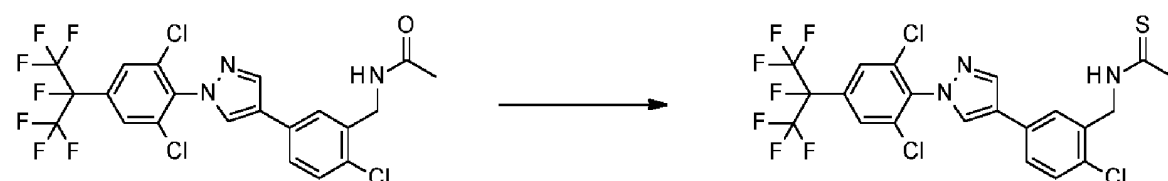
HPLC-MS^{a)}: log P=5.93、質量(m/z)=666 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ=8.618 (1.8); 8.264 (1.4); 8.084 (3.2); 7.641 (1.0); 7.621 (1.3); 7.566 (0.8); 7.505 (0.6); 7.485 (0.5); 7.412 (0.4); 4.213 (1.1); 4.198 (1.1); 3.322 (41.4); 2.671 (0.3); 2.506 (47.9); 2.502 (60.4); 2.498 (44.1); 2.329 (0.3); 1.416 (9.0); 1.398 (16.0); 1.314 (0.35); 1.170 (0.35); 0.008 (2.5); 0.000 (48.6)。

【0 4 6 2】

N-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)エタンチオアミド (I a-162) の調製

反応スキーム 2 1

【化 4 6】



【0 4 6 3】

【0 3 3 7】 100 mg (178 μmol) のN-(2-クロロ-5-{1-[2,

10

20

30

40

50

6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル}-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミドと43mg(0.11mmol)の4-メトキシフェニルジチオホスホン酸無水物を2mLのTHFに溶解させた溶液を、環流しながら90分間加熱した。次いで、その反応混合物をシリカゲルに吸着させ、シリカゲルでのMPLC(勾配:酢酸エチル/シクロヘキサン 0:100→30:70)によるクロマトグラフィーで精製した。かくして、68mgのN-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)エタンチオアミド(Ia-162)が得られた。

【0464】

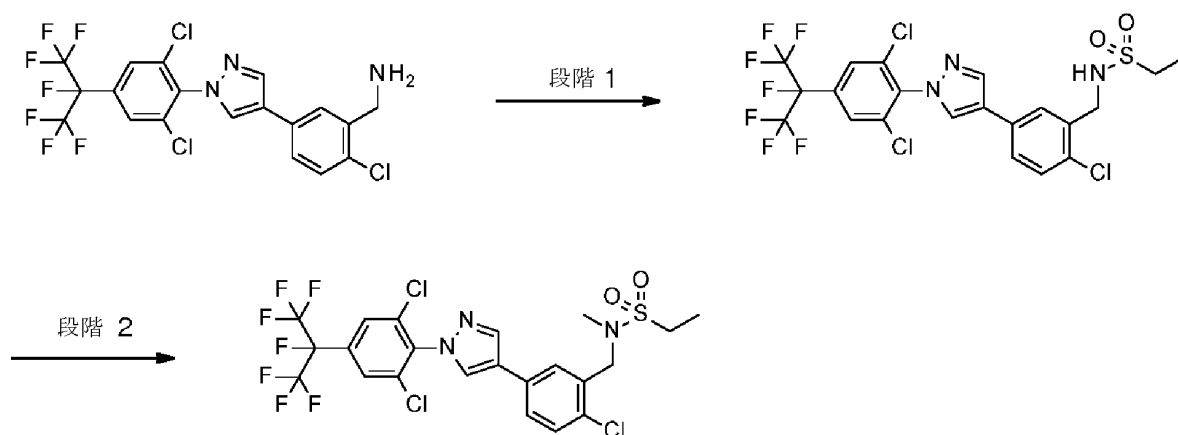
HPLC-MS^{a)}: log P=4.98、質量(m/z)=580[(M+H)]⁺; ¹H-NMR(400MHz, d₆-DMSO): δ=s. NMRピークリスト。

【0465】

N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)-N-メチルエタンスルホンアミド(Ic-03)の調製

反応スキーム22

【化47】



【0466】

段階1: N-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)エタンスルホンアミド(Ic-02)

[0338] 80mg(0.15mmol)の1-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}フェニル)メタンアミンと32μL(0.23mmol)のトリエチルアミンを3mLのCH₂Cl₂に溶解させた溶液に、0℃で、17μL(0.18mmol)のエタンスルホニルクロリドを添加し、その混合物を室温で一晩攪拌した。その反応混合物に水を添加し、次いで、CH₂Cl₂で繰り返し抽出した。その有機相を合して水で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をHPLC(勾配:H₂O/アセトニトリル)によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、63mgのN-(2-クロロ-5-{1-[2, 6-ジクロロ-4-(1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-ピラゾール-4-イル}ベンジル)エタンスルホンアミド(Ic-02)が得られた。

【0467】

HPLC-MS^{a)}: log P=4.65、質量(m/z)=612[(M+H)]⁺; ¹H-NMR(400MHz, d₆-DMSO): δ=s. NMRピークリスト。

【0468】

段階2： N-（2-クロロ-5-〔1-〔2,6-ジクロロ-4-（1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル）フェニル〕-1H-ピラゾール-4-イル〕ベンジル）-N-メチルエタンスルホンアミド（Ic-03）

【0339】 60mg（90μmol）のN-（2-クロロ-5-〔1-〔2,6-ジクロロ-4-（1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル）フェニル〕-1H-ピラゾール-4-イル〕ベンジル）エタンスルホンアミドを3mLのTHFに溶解させた溶液に、0℃で、9mg（0.2mmol）の水素化ナトリウム（鉱油中の55%分散液）を添加した。0℃で30分間経過した後、42mg（0.29mmol）のヨードメタンを滴下して加えた。その反応溶液を0℃で1時間攪拌し、及び、室温で1時間攪拌した。次いで、水を添加し、その混合物を酢酸エチルで徹底的に抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をHPLC（勾配：H₂O／アセトニトリル）によるクロマトグラフィーで分離させた。かくして、11mgのN-（2-クロロ-5-〔1-〔2,6-ジクロロ-4-（1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル）フェニル〕-1H-ピラゾール-4-イル〕ベンジル）-N-メチルエタンスルホンアミド（Ic-03）が得られた。

10

【0469】

HPLC-MS^a)：logP=5.21、質量(m/z)=628[(M+H)]⁺；
¹H-NMR（400MHz，d6-DMSO）：δ=s. NMRピークリスト。

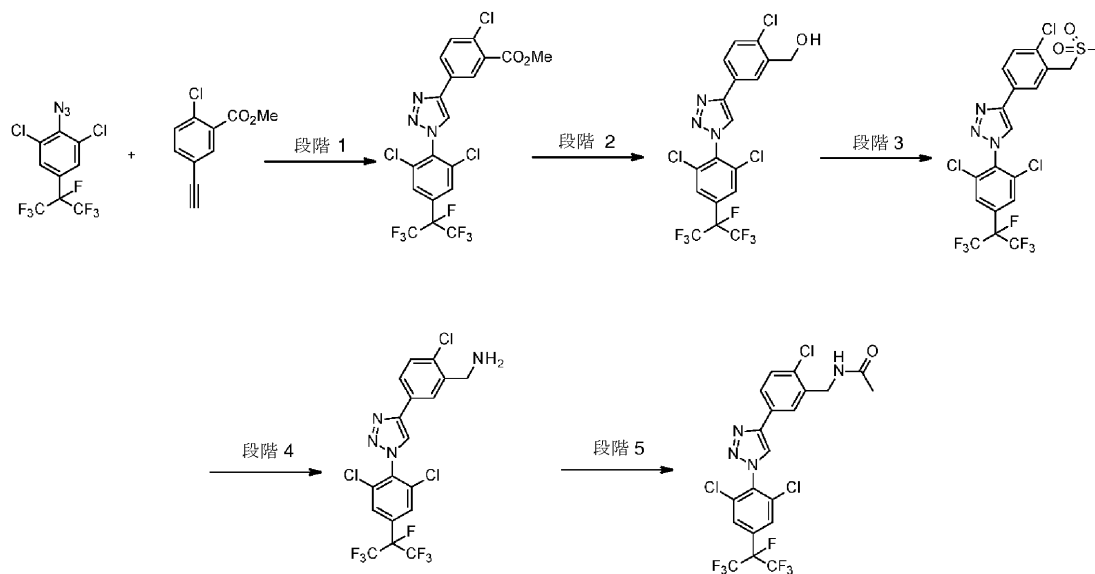
20

【0470】

N-（2-クロロ-5-〔1-〔2,6-ジクロロ-4-（1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル）フェニル〕-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル〕ベンジル）アセトアミド（I-T7-01）の調製

反応スキーム23

【化48】



30

40

【0471】

段階1： 2-クロロ-5-〔1-〔2,6-ジクロロ-4-（1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル）フェニル〕-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル〕安息香酸メチル

【0340】 2-アジド-1,3-ジクロロ-5-（1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル）フェニル

50

ヘプタフルオロプロパン-2-イル) ベンゼン (1.02 g) と2-クロロ-5-エチニル安息香酸メチル (613 mg) を $t\text{-BuOH}/\text{H}_2\text{O}$ (2:1) (3.4 mL) に溶解させた溶液に、 $\text{CuSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ (71.5 mg)、アスコルビン酸ナトリウム (56.8 mg) 及びトリス [(1-ベンジル-1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル) メチル] アミン (15.2 mg) を添加した。その混合物を室温で5時間攪拌した。その反応溶液を EtOAc で希釈し、濾過した。その濾液を H_2O で洗浄し、その水相を EtOAc で抽出した。その有機相を合して MgSO_4 で脱水し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をカラムクロマトグラフィー ($\text{EtOAc}/c\text{-Hex}$) で精製した。812 mg の2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル} 安息香酸メチルが得られた。

10

【0472】

HPLC-MS^{a)}: $\log P = 5.14$ 、質量 (m/z) = 551 [(M+H)]⁺; ¹H-NMR (400 MHz, d_6 -DMSO): $\delta = 9.24$ (s, 1H), 8.38 (d, 1H), 8.21 (s, 2H), 8.11-8.09 (m, 1H), 7.76 (d, 1H), 3.92 (s, 3H)。

【0473】

段階2: (2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル} フェニル) メタノール

20

【0341】 2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル} 安息香酸メチル (1.03 g) を無水トルエンに溶解させた溶液に、-70℃で、アルゴン雰囲気下、トルエン (9 mL) 中のDIBAL-H 1Mを滴下して加えた。-70℃で1時間経過した後、完全な変換は達成されなかった。完全な変換が達成されるまで、追加のトルエン中のDIBAL-H 1Mを添加した。Na-K酒石酸塩水溶液 (20%) を添加することによって、反応を終了させた。グリセロール (0.2 mL/mmole DIBAL-H) を添加し、その混合物を室温で1時間攪拌した。相を分離し、その水相を EtOAc で抽出した。その有機相を合して H_2O 及び飽和NaCl水溶液で洗浄し、 MgSO_4 で脱水した。溶媒を減圧下で除去した。1.02 g の (2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル} フェニル) メタノールが得られた。これは、それ以上精製することなく、次の段階で使

30

【0474】

HPLC-MS^{a)}: $\log P = 4.27$ 、質量 (m/z) = 522 [(M+H)]⁺。

【0475】

段階3: 4- {4-クロロ-3- [(メチルスルホニル) メチル] フェニル} -1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-1, 2, 3-トリアゾール

40

【0342】 (2-クロロ-5- {1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル} フェニル) メタノール (1.03 g) とN,N-ジイソプロピルアミン (1.03 mL) を無水THFに溶解させた溶液に、0℃で、メチルスルホニルクロリド (0.15 mL) を滴下して加えた。その溶液を室温で1時間攪拌した。その混合物を CH_2Cl_2 で希釈し、 H_2O 、飽和NaHCO₃水溶液及び飽和NaCl水溶液で洗浄した。その有機相を MgSO_4 で脱水し、溶媒を減圧下で除去した。1.13 g の4- {4-クロロ-3- [(メチルスルホニル) メチル] フェニル} -1- [2, 6-ジクロロ-4- (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘプタフルオロプロパン-2-イル) フェニル] -1H-1, 2, 3-トリアゾールが得られた。これは、それ以上精製することなく

50

、次の段階で使用した。

【0476】

HPLC-MS^{a)} : $\log P = 4.70$ 、質量 (m/z) = 600 [(M+H)]⁺。

【0477】

段階4 : 1-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}フェニル)メタンアミン

【0343】 濃アンモニア水溶液 (8.8 mL) とエタノール (15 mL) の混合物に、0℃で、4-{4-クロロ-3-[(メチルスルホニル)メチル]フェニル}-1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール (1.13 g) をエタノールに溶解させた溶液を滴下して加えた。その混合物を室温で一晩攪拌した。その反応溶液に1M水酸化ナトリウム水溶液を添加し、CH₂Cl₂で抽出した。その有機相をMgSO₄で脱水し、溶媒を減圧下で除去した。1.00 gの1-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}フェニル)メタンアミンが得られた。これは、それ以上精製することなく、次の段階で使用した。

【0478】

HPLC-MS^{a)} : $\log P = 2.21$ 、質量 (m/z) = 521 [(M+H)]⁺。

【0479】

段階5 : N-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド (I-T7-01)

【0344】 1-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}フェニル)メタンアミン (150 mg) とトリエチルアミン (0.12 mL) をCH₂Cl₂に溶解させた溶液に、0℃で、CH₂Cl₂に溶解させた塩化アセチル (23 μL) を滴下して加えた。その混合物を室温で一晩攪拌した。その溶液をCH₂Cl₂で希釈し、飽和NaHCO₃水溶液で洗浄した。その有機相をMgSO₄で脱水し、溶媒を減圧下で除去した。その残渣をHPLC (勾配 : H₂O/アセトニトリル) によるクロマトグラフィーで分離させた。24 mgのN-(2-クロロ-5-{1-[2,6-ジクロロ-4-(1,1,1,2,3,3,3-ヘptaフルオロプロパン-2-イル)フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}ベンジル)アセトアミド (I-T7-01) が得られた。

【0480】

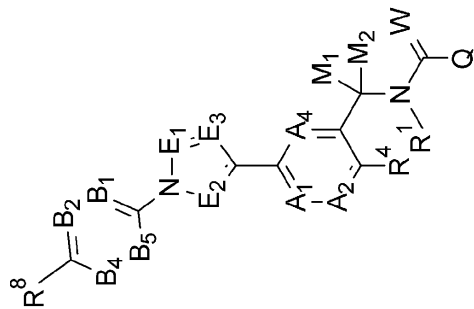
HPLC-MS^{a)} : $\log P = 3.94$ 、質量 (m/z) = 564 [(M+H)]⁺ ;
¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 9.16 (s, 1H), 8.47 (t, 1H), 8.21 (s, 2H), 7.88 (d, 1H), 7.83-7.81 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 4.38 (d, 2H), 1.95 (s, 3H)。

10

20

30

【表 1】



(Ia)

B₁はC-R⁶であり、B₅はC-R¹⁰であり、B₂、B₄、E₂、E₃及びA₁はCHであり、M₁はHであり、E₁はNである。

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
Ia-01	メチル	ヘプタフルオロイソプロピル	メチル	CH	CH	CH	F	H	H	O	エチル	4.19	520
Ia-02	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	CHF ₂	CH	CH	CH	H	H	H	O	メチル	3.93	544
Ia-03	SMe	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	メチル	3.76	540
Ia-04	メチル	ヘプタフルオロイソプロピル	メチル	CH	CH	CH	F	H	H	O	シクロプロピル	4.38	532
Ia-05	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	メチル	4.13	564
Ia-06	OCF ₃	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	メチル	4.42	596
Ia-07	SMe	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	メチル	3.9	558
Ia-08	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	エチル	4.13	542

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
Ia-09	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	ﾎﾞ	3.84	528
Ia-10	SMe	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	ﾎﾞ	4.29	572
Ia-11	SO ₂ Me	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	ﾎﾞ	3.38	590
Ia-12	SMe	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	ｼｸﾞﾛﾌ [°] ｾﾞ [°] ｵ	4.43	584
Ia-13	ﾎﾞ	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	ﾎﾞ	CH	CH	CH	F	H	H	O	ﾎﾞ	3.94	506
Ia-14	SO ₂ Me	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	ﾎﾞ	3.21	572
Ia-15	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	ﾎﾞ	3.93	546
Ia-16	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	ﾎﾞ	4.46	578
Ia-17	SOMe	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	ﾎﾞ	3.04	556
Ia-18	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	ｼｸﾞﾛﾌ [°] ｾﾞ [°] ｵ	4.08	591
Ia-19	OCF ₃	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	2.2.2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾎﾞ	4.77	664
Ia-20	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	Cl	Me	H	O	ﾎﾞ	4.72	578
Ia-21	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	2.2.2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾎﾞ	4.41	596
Ia-22	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	H	Me	H	O	ﾎﾞ	4.72	556
Ia-23	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	CHF ₂	CH	CH	CH	F	H	H	O	ﾎﾞ	4.27	576
Ia-24	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	Cl	Me	H	O	ｼｸﾞﾛﾌ [°] ｾﾞ [°] ｵ	5.25	602
Ia-25	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	ｼｸﾞﾛﾌ [°] ｾﾞ [°] ｵ	4.8	588
Ia-26	OCF ₃	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	ﾎﾞ	4.54	610
Ia-27	OCF ₃	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	Me	H	O	ﾎﾞ	5.08	624
Ia-28	ﾎﾞ	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	ﾎﾞ	CH	CH	CH	H	H	H	O	ﾎﾞ	4.12	5002
Ia-29	CF ₃	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	ﾎﾞ	4.66	610
Ia-30	Cl	へ [°] ｸﾞﾌｳｵﾍﾞｲﾝｸﾞ [°] ｾﾞ [°] ｵ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	ﾎﾞ	4.25	560

10

20

30

40

50

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
Ia-31	OCF ₃	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	シクロブ ⁷ 点 ⁷ ルカルボ ⁷ ニル	H	O	シクロブ ⁷ 点 ⁷ ル	5.86	690
Ia-32	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	メチル	H	O	エチル	5.19	592
Ia-33	SOMe	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	メチル	3.21	574
Ia-34	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	CHF ₂	CH	CH	CH	F	H	H	O	メチル	3.99	562
Ia-35	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	2,2,2-トリフルオロエチル	4.67	632
Ia-36	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	H	H	メチル	O	メチル	3.99	542
Ia-37	メチル	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	メチル	CH	CH	CH	H	H	H	O	メチル	3.81	488
Ia-38	OCF ₃	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	メチル	4.04	578
Ia-39	CHF ₂	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	エチル	4.18	558
Ia-40	OCF ₃	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	シクロブ ⁷ 点 ⁷ ル	4.69	622
Ia-41	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	シクロブ ⁷ 点 ⁷ ル	4.27	554
Ia-42	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	H	メチル	H	O	メチル	4.28	542
Ia-43	SOMe	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	シクロブ ⁷ 点 ⁷ ル	3.68	600
Ia-44	SO ₂ Me	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	シクロブ ⁷ 点 ⁷ ル	3.59	616
Ia-45	SOMe	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	エチル	3.52	588
Ia-46	SO ₂ Me	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	エチル	3.65	604
Ia-47	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	H	H	Me	O	エチル	4.32	556
Ia-48	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	H	H	Me	O	Me	3.99	542
Ia-49	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	Me	O	Me	4.13	560
Ia-50	Cl	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	Me	O	エチル	4.41	574
Ia-51	OCHF ₂	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.32	608
Ia-52	OCHF ₂	へ ⁷ タフルオロイ ⁷ フ ⁷ 点 ⁷ ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	シクロブ ⁷ 点 ⁷ ル	4.46	620

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a, 1}
la-75	Me	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	Me	4.13	522
la-76	Me	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	エチル	4.44	536
la-77	Cl	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	CF ₃	Me	H	O	Me	4.94	610
la-78	Cl	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	CF ₃	Me	H	O	エチル	5.38	624
la-79	CF ₃	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	Me	4.17	576
la-80	CF ₃	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	エチル	4.46	590
la-81	Cl	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	エチル	4.37	556
la-82	CF ₃	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	Me	4.02	580
la-83	CF ₃	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	エチル	4.28	594
la-84	Me	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	4.27	542
la-85	OCF ₃	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Cl	Me	H	O	Me	4.92	626
la-86	OCF ₃	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.88	626
la-87	OCF ₃	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Cl	Me	H	O	エチル	5.46	640
la-88	Cl	SO ₂ CF ₃	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	3.41	528
la-89	Br	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.51	622
la-90	Cl	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	Me	4.08	542
la-91	Br	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	4.26	608
la-92	Br	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	F	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	4.10	591
la-93	Me	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Me	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.51	536
la-94	Br	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	F	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.42	606
la-95	Me	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Me	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	4.18	522
la-96	CN	へブ [°] ｸﾞﾌﾞﾙﾎﾞﾛｲﾝﾌﾞ [°] ｾﾋﾞ [°] ｴ	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	Me	3.67	533

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
Ia-97	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	エチル	3.71	533
Ia-98	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	シクロプロピル	3.85	545
Ia-99	Br	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	Me	H	O	Me	4.72	622
Ia-100	Br	ヘプタフルオロイソプロピル	F	CH	CH	CH	Cl	Me	H	O	Me	4.51	606
Ia-101	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	エチル	3.95	547
Ia-102	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	H	H	H	O	Me	3.41	519
Ia-103	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	エチル	3.76	551
Ia-104	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	3.72	553
Ia-105	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	Me	3.5	537
Ia-106	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	4.32	578
Ia-107	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	シクロプロピル	3.9	563
Ia-108	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	アセチル	H	O	Me	5.14	606
Ia-109	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	エチル	H	O	Me	5.03	592
Ia-110	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CF	CH	CH	Cl	Me	H	O	Me	5.03	596
Ia-111	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CF	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.87	596
Ia-112	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	プロピル	H	O	Me	5.40	604
Ia-113	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	アリル	H	O	Me	5.21	604
Ia-114	CN	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.08	567
Ia-115	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.56	592
Ia-116	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	シクロプロピルメチル	H	O	Me	5.46	618
Ia-117	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	エトキシメチル	H	O	Me	5.27	620
Ia-118	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	ブチル	5.08	626

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a, 1}
Ia-119	Cl	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	CHF ₂	4.67	600
Ia-120	Cl	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	CF ₃	5.08	618
Ia-121	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	エチル	3.89	496
Ia-122	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Me	H	H	O	Me	3.53	482
Ia-123	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	エチル	3.79	500
Ia-124	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	F	H	H	O	Me	3.46	486
Ia-125	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	F	Me	H	O	Me	3.88	500
Ia-126	Cl	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	4-ヒ° ジン° ル	4.23	627
Ia-127	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	Me	3.76	502
Ia-128	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.07	516
Ia-129	Cl	1-CF ₃ -ジクマフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	Me	H	O	Me	4.24	516
Ia-130	Cl	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	Me	3.61	563
Ia-131	OCF ₃	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	Me	3.92	613
Ia-132	Cl	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	エチル	3.85	577
Ia-133	OCF ₃	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	エチル	4.23	627
Ia-134	Cl	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	Me	H	O	エチル	4.45	591
Ia-135	OCF ₃	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	Me	H	O	エチル	4.75	641
Ia-136	OCF ₃	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	Me	H	O	Me	4.33	627
Ia-137	Br	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	O	CH ₂ CN	4.33	633
Ia-138	CF ₃	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	エチル	3.94	611
Ia-139	CF ₃	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	Me	3.73	597
Ia-140	Cl	へフ° タフルヂマイノフ° ムヒ° ル	Cl	CH	CH	COMe	H	H	H	O	Me	3.95	558

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
Ia-141	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	エチル	4.44	594
Ia-142	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	Me	4.13	580
Ia-143	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	エチル	4.39	576
Ia-144	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	Me	4.07	562
Ia-145	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	Me	3.72	579
Ia-146	CF ₃	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	エチル	4.46	612
Ia-147	CF ₃	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	Me	4.15	598
Ia-148	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	エチル	4.32	578
Ia-149	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	Me	3.99	564
Ia-150	CF ₃	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	エチル	4.32	594
Ia-151	CF ₃	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	Me	3.99	580
Ia-152	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	エチル	4.27	560
Ia-153	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	Me	3.98	546
Ia-154	CHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	エチル	3.99	593
Ia-155	OCHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	Me	3.85	578
Ia-156	OCHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	Me	3.59	595
Ia-157	OCHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	エチル	4.23	610
Ia-158	OCHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	F	H	H	O	Me	3.94	596
Ia-159	OCHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CF	H	H	H	O	エチル	4.17	592
Ia-160	OCHF ₂	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	N	CH	Cl	H	H	O	エチル	3.87	609
Ia-161	CF ₃	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	COMe	H	H	H	O	Me	3.99	592
Ia-162	Cl	ヘプタフルオロイソプロピル	Cl	CH	CH	CH	Cl	H	H	S	Me	4.98	580

10

20

30

40

実施例	R ⁶	R ⁸	R ¹⁰	A ₁	A ₂	A ₄	R ⁴	R ¹	M ₂	W	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
Ia-163	Cl	ヘブ°タフルオロイノブ°ロヒ°ル	Cl	CH	CH	CH	Cl	Me	H	S	Me	5.36	594
Ia-164	Cl	ヘブ°タフルオロイノブ°ロヒ°ル	Cl	CH	CH	CH	Br	H	H	O	Me	4.23	608
Ia-165	Cl	ヘブ°タフルオロイノブ°ロヒ°ル	Cl	CH	CH	CH	Br	Me	H	O	Me	4.78	622
Ia-166	Cl	ヘブ°タフルオロイノブ°ロヒ°ル	Cl	CH	CH	CH	Br	H	H	O	エチル	4.57	622
Ia-167	Cl	ヘブ°タフルオロイノブ°ロヒ°ル	Cl	CH	CH	CH	Br	Me	H	O	エチル	5.25	636

Me = メチル

10

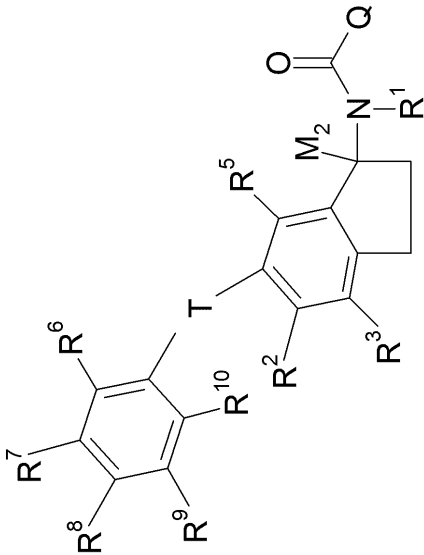
20

30

40

50

【表 2】

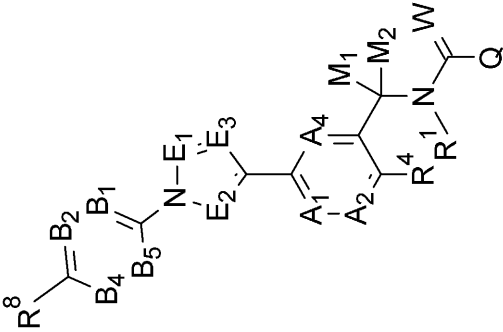


(I-Tc)

R⁸はヘプタフルオロイソプロピルであり、R²、R³、R⁵、R⁷及びR⁹はHである。TはT3であり、その際、R¹¹=Hである。

実施例	R ⁶	R ¹⁰	R ¹	M ₂	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
I-Tc-01	OCF ₃	Cl	H	H	エチル	4.84	618
I-Tc-02	CF ₃	Cl	H	H	エチル	4.63	602
I-Tc-03	OCHF ₂	Cl	H	H	エチル	4.35	600

【表 3】

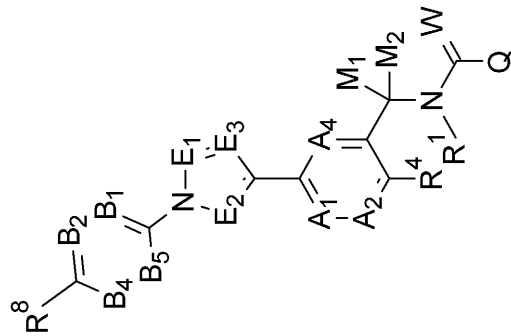


(I-T2)

B₁はC-R⁶であり、B₅はC-R¹⁰であり、R⁸はヘプタフルオロイソプロピルであり、B₂、B₄、E₁、E₂、A₁、A₂及びA₄はCHであり、M₁及びM₂はHであり、E₃はNであり、WはOである。

実施例	R ⁶	R ¹⁰	R ⁴	R ¹	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a, 1}
I-T2-01	Cl	Cl	F	H	Me	3,59	546
I-T2-02	Cl	Cl	Me	H	Me	3,59	542
I-T2-03	Cl	Cl	F	H	エチル	3,83	560
I-T2-04	Cl	Cl	F	H	シクロプロピル	4,03	572
I-T2-05	Cl	Cl	Me	H	エチル	3,89	556

【表 4】

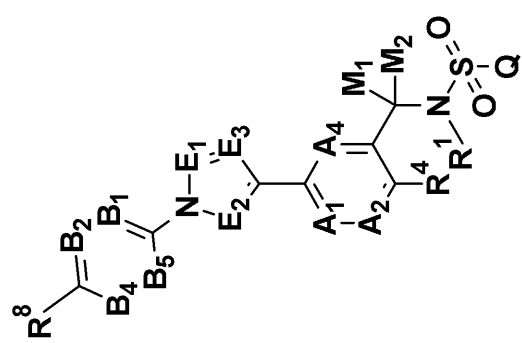


(I-T7)

B₁はC-R⁶であり、B₅はC-R¹⁰であり、R⁸はヘプタフルオロイソプロピルであり、B₂、B₄、E₂、A₁、A₂及びA₄はCHであり、M₁及びM₂はHであり、E₁及びE₃はNであり、WはOである。

実施例	R ⁶	R ¹⁰	R ⁴	R ¹	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
I-T7-01	Cl	Cl	Cl	H	Me	3,94	563
I-T7-02	Cl	Cl	Cl	H	エチル	4,23	577
I-T7-03	Cl	Cl	Cl	H	シクロプロピル	4,37	589

【表 5】



(Ic)

B₁はC-R⁶であり、B₅はC-R¹⁰であり、R⁸はヘプタフルオロイソプロピルであり、B₂、B₄、E₂、E₃、A₁、A₂及びA₄はCHであり、M₁及びM₂はHであり、E₁はNである。

実施例	R ⁶	R ¹⁰	R ⁴	R ¹	Q	logP ^a	質量 [m/z] ^{a,1}
Ic-01	Cl	Cl	Cl	H	Me	4,43	598
Ic-02	Cl	Cl	Cl	H	エチル	4,65	614
Ic-03	Cl	Cl	Cl	Me	エチル	5,21	628
Ic-04	Cl	Cl	Cl	Me	Me	4,91	614
Ic-05	Cl	Cl	Cl	H	フェニル	5,17	662

【0481】

¹⁾ 別途示されていない限り、示されている質量は、最も高い強度を有する [M+H]⁺ イオンの同位体パターンのピークである。

【0482】

²⁾ 示されている質量は、最も高い強度を有する [M-H]⁻ イオンの同位体パターンのピークである。

【0483】

10

20

30

40

50

a) $\log P$ 値の測定及び質量検出に関する注記： 与えられている $\log P$ 値の測定は、「EEC Directive 79/831 Annex V. A8」に従い、逆相カラム (C18) での HPLC (高性能液体クロマトグラフィー) によって実施した。Agilent 1100 LC システム； 50×4.6 Zorbax Eclipse Plus C18 1.8 ミクロン； 移動相 A：アセトニトリル (0.1% ギ酸)； 移動相 B：水 (0.09% ギ酸)； 4.25 分間で 10% アセトニトリルから 95% アセトニトリルまでの直線勾配、次いで、さらに 1.25 分間、95% アセトニトリル； オープン温度 55℃； 流量：2.0 mL/分。質量の検出は、Agilent MSD システムを用いて実施する。

【0484】

10

選択された実施例の NMR データ

NMR ピークリスト法

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

【0485】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

δ_1 (強度₁) ; δ_2 (強度₂) ; . . . ; δ_i (強度_i) ; . . . ; δ_n (強度_n) 。

【0486】

20

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

【0487】

^1H NMR スペクトルの化学シフトを較正するためには、テトラメチルシランを使用するか、及び／又は、特にスペクトルが DMSO 中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用する。従って、NMR ピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0488】

30

^1H NMR ピークのリストは、従来の ^1H —NMR のプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMR の慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【0489】

さらに、それらは、従来の ^1H NMR のプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体 (これも、同様に、本発明によって提供される) のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

【0490】

溶媒及び／又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 ^1H NMR ピークの本発明者らによるリストは、標準的な溶媒のピーク、例えば、DMSO- D_6 中の DMSO のピーク及び水のピーク (これらは、通常、平均して高い強度を有している) を示している。

40

【0491】

目標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、平均して、目標化合物 (例えば、90% を超える純度を有する目標化合物) のピークよりも低い強度を有している。

【0492】

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

【0493】

50

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

【0494】

^1H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「R e s e a r c h D i s c l o s u r e D a t a b a s e N u m b e r 564025」の中に見いだすことができる。

【表 6】

実施例 Ia-01: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.049(2.7);8.044(6.0);8.043(5.5);7.979(2.8);7.975(6.4);7.973(5.7);7.586(0.4);7.572(2.1);7.567(2.0);7.555(2.3);7.549(2.6);7.531(9.4);7.516(1.5);7.510(1.5);7.503(0.9);7.156(0.8);7.150(2.0);7.129(2.5);7.125(2.1);7.109(0.7);7.104(1.7);6.738(0.9);5.453(1.6);5.447(6.3);4.411(5.1);4.396(4.7);2.235(0.9);2.229(2.2);2.216(2.4);2.210(6.4);2.197(2.7);2.191(6.8);2.172(6.5);2.164(2.6);2.148(174.3);2.120(18.6);2.115(40.0);2.107(2.9);2.101(1.2);2.095(0.6);1.971(3.7);1.964(13.8);1.958(40.1);1.952(112.4);1.946(175.7);1.940(202.0);1.934(130.9);1.927(59.8);1.915(1.1);1.781(0.6);1.774(1.0);1.768(1.2);1.762(0.8);1.756(0.4);1.443(1.4);1.437(3.3);1.272(0.7);1.222(0.4);1.204(0.7);1.186(0.4);1.105(2.5);1.099(8.1);1.092(1.3);1.086(4.8);1.080(16.0);1.074(1.0);1.067(2.4);1.061(7.3);0.152(0.4);0.146(1.1);0.027(0.5);0.006(78.2);0.000(287.3);-0.009(9.9);-0.013(1.4);-0.0136(1.3);-0.0144(1.2);-0.015(1.1);-0.016(1.0);-0.0166(0.9);-0.0173(0.8);-0.018(0.7);-0.019(0.7);-0.0195(0.7);-0.0203(0.6);-0.021(0.6);-0.022(0.5);-0.0225(0.5);-0.0232(0.4);-0.024(0.4);-0.0247(0.4);-0.0254(0.4);-0.026(0.4);-0.027(0.4);-0.0276(0.4);-0.0283(0.3);-0.029(0.3);-0.144(0.4);-0.150(1.1)	
実施例 Ia-02: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.879(1.0);8.662(4.5);8.361(1.9);8.345(5.6);8.323(2.5);8.314(1.7);8.071(1.0);7.976(0.7);7.956(2.3);7.601(0.8);7.568(1.4);7.550(4.6);7.404(0.3);7.388(1.1);7.368(1.8);7.349(0.9);7.182(0.5);7.170(1.7);7.150(1.3);7.039(0.9);6.905(2.1);6.771(1.0);4.305(1.1);4.293(4.0);4.279(3.4);3.317(308.1);2.675(2.7);2.670(3.7);2.666(2.8);2.506(456.7);2.501(589.0);2.497(449.3);2.404(0.4);2.332(2.8);2.328(3.8);2.324(2.9);1.897(4.6);1.890(16.0);0.146(0.3);0.008(3.0);0.000(61.6)	10
実施例 Ia-03: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.606(0.7);8.535(3.9);8.334(0.9);8.313(1.2);8.278(4.0);8.077(1.0);7.753(1.9);7.546(1.3);7.530(3.4);7.483(1.8);7.371(1.0);7.362(0.4);7.352(1.7);7.332(1.0);7.150(1.3);7.131(1.1);4.288(3.0);4.273(2.9);3.320(68.0);3.316(57.8);2.675(0.6);2.670(0.8);2.666(0.6);2.506(103.7);2.501(138.8);2.497(99.0);2.332(0.6);2.328(0.8);2.323(0.6);1.891(16.0);0.000(0.8)	
実施例 Ia-04: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.518(0.5);8.505(0.8);8.491(0.4);8.462(3.0);8.170(3.1);7.631(0.9);7.614(1.2);7.604(0.7);7.596(0.8);7.583(4.4);7.243(0.8);7.219(1.0);7.197(0.7);4.338(2.0);4.325(2.0);3.318(72.3);2.675(0.4);2.670(0.6);2.506(73.2);2.501(96.1);2.497(72.8);2.332(0.4);2.328(0.6);2.118(16.0);1.988(0.9);1.644(0.4);1.637(0.4);1.625(0.8);1.613(0.5);1.606(0.5);1.175(0.4);0.708(1.0);0.700(1.9);0.696(1.8);0.689(1.7);0.677(1.1);0.672(2.0);0.665(0.9);0.657(1.1);0.652(1.7);0.645(0.8);0.000(21.9)	
実施例 Ia-05: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.090(4.6);7.849(4.8);7.734(7.5);7.599(2.7);7.443(0.5);7.439(0.4);7.423(2.7);7.418(3.3);7.414(4.6);7.393(0.6);7.261(15.4);5.955(0.7);5.300(0.5);4.567(4.2);4.552(4.1);2.034(16.0);2.007(0.5);1.601(0.5);1.576(16.5);1.541(0.5);1.255(0.8);0.070(1.5);0.000(4.5)	
実施例 Ia-06: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.619(4.9);8.339(0.6);8.317(5.7);8.203(2.5);8.200(2.5);7.930(2.3);7.613(0.8);7.606(0.7);7.600(1.0);7.592(2.5);7.579(1.2);7.574(1.5);7.257(1.1);7.232(1.5);7.211(1.1);4.318(3.1);4.304(3.1);3.321(164.7);3.319(163.4);2.671(1.7);2.506(222.5);2.502(281.2);2.497(201.9);2.328(1.6);1.889(16.0);1.481(1.0);1.467(1.0);1.298(0.4);1.259(0.5);1.235(1.6);1.216(0.4);1.182(0.3);1.150(0.6);1.134(0.6);0.146(0.4);0.008(3.0);0.000(80.6);-0.008(3.1);-0.149(0.4)	20
実施例 Ia-07: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.527(4.6);8.326(0.6);8.313(1.3);8.298(0.6);8.259(4.8);7.753(2.4);7.611(0.7);7.606(0.8);7.599(0.7);7.587(2.6);7.573(2.2);7.482(2.3);7.241(0.9);7.216(1.3);7.195(0.9);5.753(0.6);4.314(2.8);4.300(2.8);3.322(123.4);2.675(0.7);2.671(0.9);2.666(0.6);2.524(2.3);2.510(53.8);2.506(110.3);2.502(153.8);2.497(103.1);2.493(49.3);2.447(0.4);2.333(0.6);2.328(0.8);2.324(0.7);1.908(1.2);1.891(16.0);1.259(0.4);1.236(3.2);1.154(0.3);0.854(0.4);0.008(1.6);0.000(44.9);-0.008(1.6)	
実施例 Ia-08: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.045(5.1);7.786(5.3);7.775(0.4);7.665(8.1);7.426(1.4);7.409(4.3);7.337(1.5);7.318(2.3);7.303(0.4);7.297(1.2);7.193(16.0);7.154(1.7);7.135(1.5);5.695(0.6);4.430(4.4);4.416(4.3);2.235(1.5);2.216(4.5);2.197(4.7);2.178(1.6);1.545(15.4);1.357(0.7);1.186(0.8);1.152(5.4);1.134(10.4);1.115(5.0);0.000(3.5);-0.070(3.3)	
実施例 Ia-09: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.259(0.4);8.117(4.3);8.047(4.7);7.859(4.4);7.735(7.3);7.497(1.4);7.483(3.6);7.408(1.3);7.389(2.1);7.369(1.1);7.263(10.7);7.225(1.6);7.206(1.3);5.801(0.5);4.489(3.9);4.475(3.8);2.072(0.3);2.051(16.0);1.612(7.7);1.255(0.5);0.000(5.6)	
実施例 Ia-10: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.579(0.5);8.514(9.0);8.486(1.7);8.481(1.7);8.314(0.6);8.276(0.6);8.241(10.4);8.223(1.3);8.078(0.8);8.065(0.4);8.034(2.5);7.752(5.4);7.715(1.8);7.697(2.4);7.685(1.9);7.667(2.3);7.639(0.5);7.624(1.5);7.620(1.5);7.606(2.6);7.602(2.8);7.580(6.3);7.562(5.0);7.480(4.7);7.239(2.0);7.215(2.7);7.194(1.9);4.323(5.8);4.309(5.8);3.364(0.6);3.318(156.5);2.675(1.3);2.670(1.5);2.505(206.1);2.501(277.9);2.497(195.0);2.463(0.9);2.328(1.5);2.324(1.3);2.203(2.3);2.184(7.2);2.165(7.5);2.146(2.5);2.073(11.1);1.042(7.9);1.023(16.0);1.004(7.4);0.000(35.3)	30
実施例 Ia-11: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.610(4.6);8.515(2.4);8.510(2.5);8.356(5.0);8.345(0.7);8.331(1.2);8.317(0.6);8.243(2.4);8.239(2.3);7.629(0.6);7.623(0.8);7.617(0.8);7.611(1.0);7.598(1.9);7.580(1.3);7.259(1.1);7.234(1.4);7.213(1.0);4.321(2.9);4.307(2.9);3.368(14.4);3.317(67.3);2.679(0.4);2.674(0.5);2.670(0.7);2.666(0.5);2.506(84.2);2.501(109.9);2.497(80.2);2.328(0.7);2.324(0.5);2.073(1.5);1.889(16.0);0.008(1.8);0.000(44.1);-0.008(1.7)	
実施例 Ia-12: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.572(1.6);8.530(2.2);8.516(4.0);8.505(16.0);8.313(1.3);8.269(1.6);8.233(14.7);8.076(2.4);8.033(0.6);7.752(6.9);7.622(4.3);7.614(3.9);7.604(5.7);7.593(2.9);7.587(2.2);7.580(2.5);7.482(6.6);7.251(3.5);7.229(4.0);7.226(4.2);7.205(3.0);4.340(8.9);4.327(8.8);3.317(306.1);2.675(2.2);2.670(2.9);2.666(2.2);2.523(7.4);2.505(387.9);2.501(527.4);2.497(377.3);2.332(2.1);2.328(3.0);2.324(2.4);1.654(0.9);1.642(1.8);1.634(2.1);1.623(3.7);1.611(2.3);1.603(2.2);1.592(1.0);1.289(0.4);0.720(1.1);0.708(4.6);0.701(9.0);0.696(8.1);0.690(7.3);0.684(5.1);0.672(8.7);0.665(3.9);0.657(5.0);0.652(7.5);0.645(3.8);0.633(1.3);0.146(0.4);0.008(2.6);0.000(77.3);-0.008(3.2);-0.151(0.4)	
実施例 Ia-13: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 19.977(0.7);8.053(8.6);7.985(8.8);7.589(1.3);7.582(2.1);7.577(2.7);7.559(2.6);7.547(1.7);7.530(11.3);7.513(1.9);7.152(2.7);7.128(3.1);7.106(2.4);6.814(1.0);4.400(6.7);4.386(6.8);4.143(0.5);4.126(0.5);2.889(3.2);2.772(3.0);2.473(2.4);2.468(5.0);2.463(7.1);2.459(5.3);2.160(1173.1);2.116(58.2);2.108(11.5);2.101(7.4);2.095(4.1);1.964(37.8);1.958(96.7);1.952(539.0);1.946(985.4);1.940(1339.5);1.934(945.6);1.928(503.1);1.919(66.6);1.781(3.5);1.775(6.2);1.769(8.3);1.762(5.9);1.756(3.6);1.718(0.9);1.437(8.7);1.384(1.2);1.270(16.0);1.228(2.3);1.187(1.0);0.882(3.8);0.859(3.8);0.841(2.5);0.146(17.0);0.008(127.2);0.000(3330.2);-0.008(170.6);-0.150(16.5)	40
実施例 Ia-14: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.622(4.7);8.514(2.1);8.509(2.2);8.375(4.8);8.364(0.6);8.350(1.0);8.336(0.5);8.245(2.0);8.241(2.0);7.562(1.2);7.542(4.0);7.387(0.9);7.368(1.8);7.349(0.9);7.169(1.4);7.150(1.2);4.294(3.1);4.279(3.1);3.368(13.9);3.317(59.3);3.316(57.0);2.674(0.5);2.670(0.7);2.666(0.5);2.523(1.9);2.510(41.5);2.505(83.8);2.501(111.3);2.496(81.4);2.492(40.1);2.332(0.5);2.328(0.7);2.323(0.5);1.889(16.0);0.146(0.6);0.008(4.8);0.000(121.1);-0.009(4.7);-0.150(0.6)	
実施例 Ia-15: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.101(0.4);8.725(0.5);8.593(4.7);8.339(0.6);8.326(1.3);8.313(0.9);8.294(4.8);8.269(0.9);8.154(0.3);8.077(7.4);7.854(0.4);7.611(0.9);7.605(0.7);7.598(0.9);7.587(1.9);7.569(1.4);7.253(1.2);7.231(1.4);7.228(1.5);7.207(1.1);4.320(3.3);4.306(3.1);4.057(0.9);4.039(2.7);4.021(2.8);4.003(0.9);3.321(18.5);2.507(25.7);2.502(33.3);2.498(24.3);1.989(11.6);1.894(16.0);1.236	

(0.5);1.193(3.1);1.176(6.0);1.158(3.0);0.008(0.5);0.000(9.7);-0.008(0.4)	
実施例 la-16: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.016(7.1);7.775(7.3);7.665(11.5);7.524(4.2);7.370(0.7);7.348(4.5);7.341(7.4);7.320(0.9);7.194(16.0);5.900(1.2);4.504(6.4);4.489(6.3);2.221(1.8);2.202(5.4);2.183(5.6);2.164(2.0);1.565(12.7);1.215(0.3);1.186(2.8);1.152(0.5);1.146(0.5);1.131(6.2);1.112(11.6);1.093(5.7);0.000(4.8);-0.070(4.2)	10
実施例 la-17: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.770(4.5);8.381(4.6);8.367(0.6);8.352(1.0);8.337(0.6);8.313(0.4);8.283(2.3);8.279(2.4);8.157(2.2);7.572(1.3);7.553(4.5);7.399(0.9);7.380(1.8);7.361(0.9);7.187(1.5);7.168(1.3);5.754(2.5);4.297(3.4);4.283(3.4);3.317(161.2);2.675(14.7);2.506(156.0);2.501(201.9);2.497(150.4);2.328(1.2);2.086(0.6);1.892(16.0);0.146(0.3);0.008(3.1);0.000(72.1);-0.149(0.3)	
実施例 la-18: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.811(0.4);8.617(0.6);8.516(0.4);8.418(10.0);8.360(0.7);8.313(0.9);8.285(10.2);8.103(0.7);8.070(16.0);7.662(8.2);6.759(0.5);5.753(1.4);4.991(0.8);4.976(0.8);4.758(0.7);4.025(0.4);3.615(0.5);3.599(0.7);3.584(0.5);3.448(0.3);3.413(13.6);3.317(224.8);2.675(1.7);2.670(2.4);2.666(1.8);2.523(5.9);2.510(148.2);2.506(301.0);2.501(397.7);2.497(287.3);2.492(138.5);2.393(0.5);2.381(1.1);2.373(1.3);2.362(2.1);2.350(1.3);2.343(1.3);2.332(2.2);2.328(2.6);2.324(1.8);2.184(0.4);1.676(0.4);1.651(0.6);1.554(0.4);1.535(1.1);1.481(5.3);1.467(5.3);1.369(0.8);1.355(2.6);1.336(1.1);1.318(0.4);1.310(1.0);1.298(1.5);1.280(1.8);1.259(2.1);1.235(7.6);1.226(2.2);1.216(1.9);1.182(1.3);1.172(0.9);1.150(3.7);1.142(0.9);1.134(3.7);1.123(1.0);1.107(1.8);1.095(2.5);1.088(4.7);1.080(3.3);1.068(4.4);1.049(2.8);1.042(4.5);1.035(5.1);1.031(5.2);1.023(3.4);1.011(1.3);0.994(0.7);0.986(0.6);0.976(0.7);0.968(0.4);0.915(0.6);0.866(0.4);0.854(0.8);0.835(0.5);0.146(1.7);0.008(13.0);0.000(364.0);-0.009(13.2);-0.150(1.7)	
実施例 la-19: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 19.945(0.4);8.765(2.1);8.751(3.8);8.738(2.0);8.592(14.8);8.313(3.5);8.298(16.0);8.204(8.3);7.933(7.3);7.639(2.2);7.634(2.7);7.626(2.3);7.620(3.3);7.613(3.5);7.602(6.2);7.585(4.2);7.285(4.1);7.261(5.1);7.239(3.6);6.630(0.4);4.440(0.4);4.384(9.5);4.370(9.4);3.985(0.4);3.891(0.6);3.534(0.7);3.505(0.7);3.476(0.5);3.395(3.7);3.367(11.7);3.338(20.0);3.319(939.7);2.675(6.8);2.670(9.3);2.666(6.7);2.586(0.6);2.523(32.0);2.510(590.7);2.506(1161.7);2.501(1511.1);2.497(1105.7);2.493(550.5);2.403(0.5);2.332(6.7);2.328(9.1);2.324(6.6);1.297(0.8);1.236(0.8);1.183(4.3);0.856(0.5);0.146(1.9);0.008(16.9);0.000(428.7);-0.009(15.7);-0.149(2.0)	
実施例 la-20: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.086(0.9);8.077(1.3);7.851(0.9);7.834(1.3);7.742(1.5);7.733(2.0);7.456(2.0);7.405(1.9);7.402(1.8);7.266(10.9);7.235(0.5);5.301(0.4);4.772(2.2);4.635(1.4);3.026(6.2);2.199(4.6);2.146(2.8);1.658(14.3);1.427(16.0);1.255(0.7);0.000(2.6)	20
実施例 la-21: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.037(6.5);7.781(6.7);7.667(10.7);7.441(1.7);7.421(2.5);7.406(3.7);7.347(1.8);7.328(3.3);7.309(1.6);7.195(16.0);7.142(2.2);7.123(1.9);6.232(0.7);4.473(5.5);4.458(5.3);3.109(1.8);3.082(5.4);3.055(5.5);3.029(1.9);1.602(2.3);1.578(15.8);1.186(1.0);0.000(9.7);-0.070(3.3)	
実施例 la-22: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.115(1.7);7.860(1.5);7.740(1.0);7.734(1.6);7.465(0.3);7.444(0.5);7.370(0.5);7.268(5.6);5.302(0.4);4.641(1.5);4.584(0.8);4.131(0.3);4.113(0.3);2.996(1.6);2.958(3.3);2.456(0.3);2.437(1.1);2.419(1.1);2.400(0.4);2.045(1.4);1.714(16.0);1.427(2.1);1.277(0.5);1.259(1.1);1.255(0.9);1.242(0.5);1.229(0.9);1.211(1.8);1.202(0.6);1.192(0.9);1.184(1.0);1.165(0.5);0.070(1.0);0.000(1.1)	
実施例 la-23: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.630(0.6);8.306(0.6);4.328(0.4);4.314(0.4);4.056(1.3);4.038(3.9);4.021(3.9);4.003(1.3);3.318(7.4);2.506(12.4);2.502(16.0);2.498(12.1);2.181(0.5);2.162(0.5);1.989(16.0);1.193(4.3);1.175(8.4);1.157(4.2);1.043(0.5);1.024(1.1);1.005(0.5);0.008(0.3);0.000(8.4)	
実施例 la-24: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.081(5.1);8.065(4.9);7.836(5.1);7.817(5.0);7.741(11.0);7.736(10.5);7.520(0.4);7.449(8.0);7.430(0.5);7.407(4.4);7.396(8.6);7.355(0.3);7.334(3.4);7.261(42.8);6.989(0.3);5.299(7.6);4.825(7.9);4.786(8.7);3.214(2.5);3.188(16.0);3.086(0.8);3.066(15.4);1.878(0.3);1.867(0.7);1.858(0.9);1.847(1.4);1.835(1.0);1.827(0.8);1.815(0.4);1.672(0.5);1.660(0.8);1.651(1.1);1.641(1.6);1.629(1.1);1.622(1.0);1.609(0.8);1.572(27.0);1.541(0.5);1.451(0.5);1.427(10.1);1.423(4.5);1.411(3.4);1.388(0.7);1.383(0.6);1.333(3.6);1.307(4.0);1.292(4.7);1.285(5.3);1.255(15.6);1.236(2.6);1.212(0.8);1.190(7.6);1.163(0.4);1.099(0.5);1.066(3.8);1.057(6.1);1.049(6.2);1.039(4.1);1.011(0.4);0.896(1.0);0.880(2.1);0.857(3.3);0.849(3.4);0.837(3.5);0.830(2.9);0.820(1.2);0.795(0.4);0.775(1.2);0.766(2.5);0.759(2.6);0.747(2.7);0.739(2.2);0.730(0.8);0.008(1.0);0.000(23.1);-0.008(0.9)	30
実施例 la-25: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.088(5.0);7.843(5.1);7.734(8.3);7.593(3.1);7.440(0.4);7.414(7.3);7.394(0.4);7.264(14.9);7.255(0.9);6.145(0.9);5.300(1.0);4.594(4.6);4.579(4.5);1.622(16.0);1.422(0.5);1.412(1.5);1.401(1.0);1.390(1.5);1.379(1.0);1.370(0.9);1.359(0.5);1.291(1.2);1.256(0.8);1.222(0.8);1.021(0.8);1.011(2.7);1.003(3.2);1.000(2.7);0.993(2.8);0.983(1.0);0.788(0.9);0.779(2.5);0.771(2.6);0.759(2.7);0.752(2.2);0.741(0.8);0.000(5.7);-0.009(0.5)	
実施例 la-26: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.601(8.2);8.313(0.9);8.298(8.5);8.265(1.1);8.252(2.1);8.237(1.1);8.201(4.4);8.197(4.5);7.927(3.9);7.613(1.0);7.608(1.3);7.601(1.2);7.595(1.7);7.587(1.7);7.574(3.6);7.557(2.2);7.255(2.1);7.231(2.7);7.209(1.9);4.327(5.3);4.313(5.2);3.318(200.9);2.675(1.5);2.670(2.1);2.666(1.6);2.523(5.7);2.506(255.4);2.501(338.7);2.497(250.8);2.332(1.4);2.328(2.0);2.324(1.5);2.199(2.1);2.180(6.8);2.161(7.0);2.142(2.3);2.073(3.3);1.480(0.4);1.467(0.5);1.234(0.7);1.181(0.6);1.169(1.4);1.150(0.5);1.134(0.6);1.043(7.9);1.024(16.0);1.005(7.5);0.847(0.4);0.146(0.4);0.008(3.1);0.000(85.4);-0.008(3.2);-0.150(0.4)	
実施例 la-27: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.678(2.1);8.632(4.8);8.343(2.2);8.324(5.1);8.199(4.2);7.926(3.7);7.669(0.4);7.662(0.4);7.654(0.5);7.647(0.4);7.641(0.4);7.636(0.4);7.622(0.7);7.616(0.8);7.610(0.8);7.602(1.1);7.595(0.9);7.589(0.8);7.583(0.8);7.477(0.6);7.464(0.6);7.417(1.2);7.413(1.3);7.400(1.3);7.395(1.2);7.318(0.5);7.293(0.8);7.273(1.6);7.249(1.7);7.227(1.2);4.629(3.0);4.582(6.6);3.319(50.3);3.007(16.0);2.833(6.5);2.676(0.4);2.671(0.6);2.667(0.4);2.511(34.3);2.507(71.1);2.502(96.4);2.498(73.4);2.452(1.3);2.434(3.9);2.423(1.9);2.415(4.1);2.405(1.8);2.397(1.5);2.387(0.6);2.334(0.4);2.329(0.6);2.325(0.4);2.074(8.1);1.482(0.3);1.468(0.3);1.235(0.6);1.038(4.3);1.019(10.5);1.001(7.6);0.983(1.8);0.008(1.9);0.000(53.6);-0.008(2.5)	
実施例 la-28: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.085(7.9);8.009(8.4);7.584(0.3);7.532(13.2);7.518(2.6);7.498(2.8);7.379(2.3);7.359(4.5);7.340(2.2);7.181(2.6);7.162(2.1);6.749(0.7);4.370(7.5);4.355(7.3);2.279(0.5);2.272(0.3);2.232(2.5);2.213(7.4);2.194(7.7);2.175(2.9);2.134(10.7.6);2.121(51.9);2.107(2.6);2.101(1.7);2.095(0.9);2.079(0.3);2.035(0.4);1.964(7.8);1.958(19.1);1.952(100.0);1.946(181.0);1.940(243.4);1.934(170.0);1.927(90.6);1.780(0.5);1.774(1.0);1.768(1.3);1.762(0.9);1.756(0.5);1.285(0.4);1.270(1.0);1.121(0.3);1.112(8.2);1.104(0.8);1.093(1.6.0);1.074(7.7);1.050(0.5);0.146(2.1);0.008(15.7);0.000(422.6);-0.008(20.9);-0.150(2.1)	40
実施例 la-29: ¹ H-NMR(601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.206(3.5);8.146(7.2);8.101(6.4);8.056(3.6);7.579(3.8);7.575(4.1);7.520(2.1);7.516(1.8);7.506(2.8);7.503(2.6);7.441(5.3);7.427(3.7);6.743(0.9);4.446(7.1);4.436(7.1);2.245(2.3);2.232(7.0);2.219(7.2);2.207(2.4);2.120(115.6);2.057(0.9);2.053(1.6);2.049(2.2);2.045(1.5);2.041(0.8);1.962(9.9);1.954(25.3);1.950(33.2);1.946(165.7);1.942(278.1);1.938(387.6);1.934(259.7);1.930(131.1);1.832(0.9);1.827(1.5);1.823(2.2);1.819(1.5);1.815(0.7);1.285(0.4);1.271(0.9);1.107(8.0);1.095(16.0);1.082(7.7);0.097(0.6);0.005(5.8);0.000(142.9);-0.006(5.6);-0.100(0.6)	

10

20

30

40

50

实施例 la-30: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.578(9.3);8.313(0.5);8.276(9.6);8.264(1.5);8.250(2.6);8.236(1.3);8.076(15.2);7.609(1.1);7.604(1.4);7.598(1.3);7.591(1.8);7.584(2.0);7.572(4.0);7.555(2.6);7.251(2.3);7.227(3.0);7.205(2.1);4.326(6.1);4.312(6.1);3.317(174.7);2.671(1.3);2.501(222.5);2.328(1.4);2.203(2.3);2.184(7.2);2.165(7.5);2.146(2.5);1.398(12.0);1.043(8.0);1.024(16.0);1.005(7.5);0.000(44.9)	
实施例 la-31: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.620(0.3);8.606(7.0);8.314(0.4);8.299(0.5);8.283(7.3);8.199(4.0);8.195(3.9);7.926(3.5);7.630(0.9);7.624(1.0);7.618(1.1);7.610(1.3);7.603(1.2);7.597(1.1);7.591(1.0);7.419(1.6);7.413(1.6);7.401(1.7);7.396(1.6);7.285(1.9);7.263(2.1);7.259(2.3);7.250(0.7);7.238(1.8);7.232(0.7);7.182(0.5);7.164(0.4);5.754(8.2);5.063(8.2);4.991(0.3);4.341(0.6);4.329(0.5);3.456(0.7);3.444(0.7);3.439(0.8);3.426(0.7);3.318(100.6);2.675(0.8);2.671(1.0);2.667(0.7);2.524(3.0);2.511(64.5);2.506(131.7);2.502(174.8);2.497(126.8);2.493(61.9);2.422(0.9);2.409(1.8);2.405(2.0);2.398(1.5);2.392(3.6);2.385(1.4);2.379(2.0);2.374(2.1);2.361(1.0);2.333(0.8);2.329(1.0);2.324(0.8);2.300(2.0);2.182(0.4);1.535(0.4);1.481(0.6);1.467(0.6);1.356(2.4);1.236(0.8);1.151(0.5);1.135(0.5);1.074(2.0);1.056(4.0);1.044(0.5);1.039(2.1);1.025(0.7);1.011(0.5);1.006(0.7);0.983(16.0);0.975(11.1);0.963(8.9);0.956(3.0);0.940(0.7);0.797(0.4);0.008(2.0);0.000(55.1);-0.008(2.1)	10
实施例 la-32: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.074(0.7);8.066(1.0);7.833(0.7);7.823(1.0);7.741(1.1);7.733(1.6);7.446(0.9);7.433(0.6);7.399(1.5);7.261(6.9);7.207(0.4);4.779(1.6);4.638(1.0);3.042(1.9);3.017(3.4);2.462(0.7);2.444(0.8);2.378(0.4);2.360(0.4);1.573(7.9);1.427(16.0);1.255(0.6);1.237(0.9);1.219(1.8);1.200(0.9);1.184(0.6);1.165(1.1);1.147(0.5);0.000(1.6)	
实施例 la-33: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.760(0.5);8.750(4.6);8.360(5.1);8.340(0.7);8.328(1.2);8.313(1.0);8.283(2.4);8.278(2.5);8.157(2.4);7.636(0.9);7.630(0.8);7.623(1.0);7.610(1.9);7.593(1.4);7.272(1.1);7.248(1.4);7.226(1.0);5.753(1.7);4.322(3.1);4.308(3.1);3.368(0.7);3.317(106.7);2.679(14.8);2.506(141.9);2.501(182.0);2.497(133.0);2.333(0.8);2.328(1.1);2.324(0.8);1.891(16.0);1.236(1.3);0.008(1.8);0.000(47.4);-0.008(1.9)	
实施例 la-34: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.850(0.8);8.645(0.9);8.333(1.2);8.323(1.7);8.076(0.4);8.062(0.5);7.976(0.5);7.956(0.5);7.660(0.5);7.645(0.5);7.607(0.5);7.540(0.4);7.258(0.4);7.235(0.4);6.902(0.4);4.321(0.9);4.314(0.9);4.308(0.8);4.056(1.3);4.039(3.9);4.021(4.0);4.003(1.3);3.319(7.0);2.506(15.0);2.502(19.8);2.498(15.7);1.989(16.0);1.896(3.1);1.890(3.5);1.193(4.3);1.176(8.4);1.158(4.2);0.000(4.4)	
实施例 la-35: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.083(9.5);7.839(9.9);7.737(16.0);7.573(5.1);7.569(5.4);7.460(1.3);7.455(1.1);7.439(5.1);7.434(5.2);7.425(8.7);7.405(2.0);7.264(30.2);6.399(1.4);4.618(8.7);4.603(8.5);3.171(2.6);3.145(8.1);3.118(8.2);3.092(2.8);1.627(14.8);1.284(0.4);1.255(1.3);1.216(0.4);1.201(0.3);0.000(7.1)	20
实施例 la-36: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.748(4.1);8.606(7.5);8.545(1.2);8.525(1.5);8.508(3.3);8.487(3.9);8.466(0.9);8.441(0.4);8.318(7.6);8.299(4.5);8.211(0.4);8.079(12.3);8.015(2.2);7.989(1.7);7.968(2.2);7.879(1.3);7.856(1.0);7.632(2.4);7.601(4.2);7.563(1.3);7.544(1.5);7.531(2.2);7.512(2.7);7.486(3.2);7.429(0.9);7.424(1.5);7.418(0.8);7.413(1.2);7.408(1.9);7.402(1.2);7.388(2.5);7.369(4.7);7.350(2.5);7.338(0.7);7.318(3.4);7.302(12.6);7.283(2.5);7.264(0.7);7.229(3.7);7.212(3.0);5.754(5.1);4.990(1.1);4.978(2.0);4.969(1.5);4.960(2.4);4.942(2.5);4.923(2.5);4.904(2.3);4.886(1.3);4.868(0.4);3.922(2.2);3.600(0.4);3.318(264.9);2.671(2.0);2.506(251.6);2.501(324.7);2.497(237.8);2.328(1.9);1.989(0.5);1.649(1.3);1.642(1.7);1.636(1.8);1.627(2.8);1.620(2.6);1.612(2.9);1.598(2.2);1.580(1.0);1.567(0.5);1.535(1.4);1.481(3.0);1.467(3.0);1.432(0.4);1.405(13.4);1.388(13.2);1.356(6.8);1.347(8.6);1.338(7.3);1.330(8.2);1.299(0.7);1.259(1.1);1.236(4.2);1.216(1.2);1.175(0.8);1.150(2.1);1.142(0.6);1.135(2.0);1.124(0.7);1.107(0.7);1.069(16.0);1.013(0.3);0.995(0.4);0.975(0.4);0.854(0.6);0.836(0.4);0.808(0.6);0.789(0.8);0.771(0.5);0.686(2.0);0.669(6.0);0.655(10.6);0.635(13.7);0.620(7.6);0.607(3.1);0.146(0.6);0.008(5.4);0.000(126.8);-0.008(4.9);-0.149(0.6)	
实施例 la-37: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.091(12.1);8.015(12.8);7.584(0.4);7.533(16.0);7.521(4.1);7.502(4.2);7.381(3.7);7.362(6.9);7.343(3.5);7.185(3.8);7.166(3.1);6.805(0.9);4.359(11.0);4.344(11.0);2.281(0.5);2.139(108.1);2.122(78.1);2.107(2.7);2.101(1.7);2.095(1.0);2.083(0.6);2.069(0.5);1.991(0.3);1.964(7.1);1.958(17.6);1.952(97.1);1.946(176.4);1.940(238.5);1.934(166.8);1.927(95.7);1.780(0.6);1.774(1.0);1.768(1.4);1.762(1.1);1.756(0.6);1.301(0.3);1.285(0.5);1.271(1.1);0.146(1.8);0.022(0.4);0.008(12.5);0.000(388.1);-0.008(18.1);-0.150(1.9)	30
实施例 la-38: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.636(4.3);8.361(0.5);8.346(1.0);8.337(5.0);8.313(0.7);8.202(2.0);8.198(2.1);7.928(1.8);7.551(1.1);7.535(3.7);7.387(1.0);7.366(1.6);7.347(0.9);7.169(1.3);7.150(1.4);4.292(2.9);4.278(2.9);3.323(80.3);3.318(78.7);2.675(0.5);2.671(0.7);2.666(0.5);2.524(1.7);2.510(44.1);2.506(90.2);2.502(119.4);2.497(85.8);2.493(41.3);2.333(0.5);2.328(0.7);2.324(0.5);1.890(16.0);0.008(0.4);0.000(12.3);-0.008(0.4)	
实施例 la-39: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.873(1.2);8.654(8.5);8.352(1.4);8.336(9.0);8.322(4.6);8.294(1.3);8.279(2.3);8.265(1.3);8.070(1.1);7.977(0.7);7.955(4.2);7.597(1.0);7.563(2.5);7.544(8.3);7.404(0.3);7.387(2.0);7.368(3.5);7.350(1.8);7.163(3.0);7.145(2.5);7.040(1.7);6.905(3.8);6.770(1.9);4.302(6.9);4.288(6.3);3.361(0.4);3.317(385.4);2.891(1.0);2.731(0.9);2.670(3.9);2.666(3.1);2.569(0.4);2.506(457.4);2.501(598.8);2.497(460.2);2.425(0.4);2.404(0.3);2.328(3.8);2.196(2.3);2.177(7.2);2.165(1.7);2.158(7.4);2.139(2.6);1.508(0.5);1.236(1.4);1.055(8.0);1.036(1.6);1.017(7.5);0.146(1.6);0.008(13.0);0.000(325.6);-0.150(1.6)	
实施例 la-40: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.260(0.7);8.789(0.6);8.672(0.8);8.598(14.5);8.543(2.1);8.530(3.8);8.516(2.0);8.460(0.6);8.354(0.9);8.314(1.1);8.293(15.3);8.200(8.1);8.197(8.0);7.927(7.3);7.620(8.3);7.604(7.4);7.589(2.9);7.268(2.7);7.244(4.9);7.221(2.8);5.754(16.0);4.963(1.0);4.346(9.4);4.332(9.3);3.358(0.6);3.317(268.2);2.675(2.3);2.671(3.0);2.666(2.3);2.506(376.9);2.502(487.0);2.497(360.9);2.399(5.6);2.328(2.8);1.652(1.3);1.640(1.9);1.633(2.1);1.621(3.6);1.609(2.4);1.602(2.1);1.590(1.0);1.535(1.0);1.481(1.9);1.467(1.9);1.413(1.0);1.371(0.4);1.337(0.4);1.299(0.4);1.279(0.4);1.259(0.7);1.235(2.3);1.216(0.7);1.171(0.5);1.150(1.4);1.135(1.4);1.124(0.6);1.107(0.6);1.056(0.4);0.994(0.4);0.975(0.4);0.721(1.2);0.709(4.8);0.702(9.0);0.697(8.1);0.691(7.3);0.685(5.2);0.672(8.4);0.665(4.1);0.658(5.3);0.652(7.4);0.646(3.7);0.633(1.3);0.146(0.6);0.008(6.0);0.000(143.1);-0.150(0.6)	40
实施例 la-41: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.264(0.3);8.121(9.8);8.051(0.3);7.859(9.9);7.736(16.0);7.497(8.5);7.480(3.9);7.412(2.4);7.393(4.2);7.372(2.1);7.261(27.6);7.242(3.5);7.223(2.8);5.919(1.3);4.517(8.4);4.503(8.3);1.570(32.7);1.404(0.6);1.393(1.3);1.384(1.6);1.373(2.8);1.362(1.8);1.353(1.5);1.342(0.8);1.255(0.6);1.053(1.5);1.043(5.2);1.035(5.8);1.032(5.1);1.025(5.3);1.015(1.6);0.797(1.7);0.788(4.7);0.780(4.9);0.768(5.0);0.761(4.1);0.751(1.3);0.070(0.5);0.000(6.0)	
实施例 la-42: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.249(0.3);8.118(7.4);8.047(0.3);7.864(3.2);7.858(4.8);7.740(5.1);7.732(7.5);7.520(0.9);7.500(1.1);7.489(1.2);7.470(1.7);7.454(2.5);7.444(1.1);7.425(1.5);7.405(0.7);7.392(1.3);7.373(2.3);7.354(1.2);7.341(1.5);7.261(32.9);7.182(1.5);7.163(1.2);7.115(0.9);7.096(0.8);5.299(1.5);4.629(7.0);4.576(4.3);4.149(0.7);4.131(2.1);4.113(2.1);4.095(0.7);2.986(8.7);2.967(16.0);2.189(9.3);2.180(15.8);2.045(9.0);1.756(0.5);1.633(0.7);1.601(3.2);1.582(3.3);1.541(2.1);1.525(0.5);1.512(0.4);1.427(2.1);1.414(0.8);1.403(0.3);1.398(0.4);1.348(1.5);1.333(1.1);1.307(0.5);1.293(1.4);1.284(1.7);1.277(3.4);1.259(7.8);1.241(3.2);1.222(1.2);1.213(0.4);1.188(0.4);0.897(0.4);0.880(0.7);0.862(0.4);0.854(0.4);0.835(0.3);0.008(0.5);0.000(14.5);-0.009(0.6)	50

実施例 I-Tc-01: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.400(0.4);8.136(7.9);8.091(7.9);7.966(3.9);7.962(3.9);7.749(3.6);7.488(2.8);7.471(9.1);7.297(3.1);7.276(2.4);6.623(1.2);6.602(1.2);5.421(0.8);5.401(2.1);5.382(2.1);5.361(0.7);3.008(0.6);2.999(0.7);2.986(0.7);2.977(0.7);2.968(1.2);2.959(1.2);2.946(1.2);2.937(1.2);2.889(1.0);2.869(1.9);2.848(1.5);2.829(1.0);2.808(0.6);2.533(0.6);2.524(0.7);2.513(1.2);2.505(1.3);2.493(1.2);2.482(1.4);2.473(1.3);2.462(1.0);2.454(0.7);2.260(0.4);2.248(0.5);2.230(1.5);2.221(1.3);2.211(3.7);2.202(3.7);2.192(3.9);2.183(3.9);2.173(2.1);2.152(91.9);2.127(0.3);2.113(0.3);2.106(0.4);1.963(2.2);1.957(5.2);1.951(29.6);1.945(53.8);1.939(72.8);1.933(50.2);1.927(25.8);1.860(0.6);1.838(1.6);1.828(0.6);1.818(1.6);1.807(1.5);1.797(0.7);1.786(1.5);1.774(0.3);1.767(0.6);1.765(0.7);1.437(5.4);1.143(0.6);1.134(8.1);1.124(1.3);1.115(16.0);1.106(0.8);1.096(7.5);0.146(1.4);0.008(15.3);0.000(266.5);-0.009(13.3);-0.150(1.4)
実施例 I-Tc-02: ¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.201(6.2);8.130(9.0);8.064(9.2);8.051(7.0);7.488(4.1);7.471(13.0);7.296(4.3);7.276(3.6);6.609(2.1);6.591(2.2);5.419(1.1);5.399(3.0);5.379(3.0);5.360(1.1);4.068(0.6);4.050(0.6);3.682(1.3);3.008(0.9);3.000(1.0);2.985(1.1);2.977(1.2);2.967(1.9);2.960(2.0);2.945(1.9);2.938(1.9);2.889(1.3);2.869(2.7);2.848(2.2);2.828(1.6);2.807(0.9);2.532(0.8);2.523(0.9);2.513(1.6);2.504(1.9);2.493(1.8);2.482(2.0);2.473(1.9);2.462(1.5);2.246(0.6);2.228(1.9);2.219(2.0);2.209(4.4);2.200(4.7);2.190(4.9);2.181(5.2);2.143(17.1.5);2.128(14.4);1.971(4.3);1.951(66.5);1.945(111.5);1.939(142.2);1.935(104.1);1.933(112.1);1.927(66.5);1.859(0.7);1.838(1.9);1.817(2.1);1.807(2.0);1.786(1.9);1.767(1.3);1.271(1.2);1.221(0.7);1.204(1.3);1.186(0.7);1.131(8.3);1.112(16.0);1.094(8.1);0.859(0.3);0.146(2.6);0.052(0.4);0.000(467.1);-0.015(38.9);-0.150(2.5)
実施例 I-Tc-03: ¹ H-NMR(601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 19.951(0.4);8.114(4.6);8.059(4.8);7.827(2.5);7.572(2.5);7.483(1.6);7.471(5.8);7.291(1.7);7.278(1.5);6.917(1.5);6.796(3.0);6.675(1.5);6.616(0.7);5.410(0.5);5.397(1.3);5.384(1.3);5.370(0.4);2.993(0.4);2.967(0.6);2.961(0.7);2.952(0.7);2.947(0.7);2.877(0.5);2.863(1.1);2.849(0.9);2.836(0.7);2.822(0.4);2.520(0.4);2.514(0.4);2.507(0.6);2.501(0.7);2.494(0.7);2.486(0.8);2.480(0.7);2.473(0.4);2.467(0.5);2.234(0.4);2.221(0.9);2.209(2.5);2.196(3.7);2.184(2.6);2.171(1.1);2.152(35.3);2.148(31.9);1.963(1.0);1.955(2.3);1.947(19.8);1.943(35.4);1.939(52.0);1.934(35.7);1.930(18.5);1.843(0.4);1.829(1.1);1.822(0.5);1.815(1.0);1.808(0.9);1.801(0.4);1.794(0.8);1.780(0.3);1.437(16.0);1.128(4.7);1.115(9.3);1.103(4.5);0.096(0.8);0.005(5.0);0.000(170.2);-0.100(0.8)

10

20

【0495】

生物学的結果

30

ネコノミ (Ctenocephalides felis) - 成体ネコノミを用いたインビトロ接触試験

【0345】 試験管にコーティングするために、9 mg の活性成分を、最初に、1 mL のアセトン p. a. に溶解させ、次いで、アセトン p. a. を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び揺動させる（揺動回転 30 rpm で 2 時間）ことによって 250 μL の該溶液を 25 mL 容ガラス管の内壁及び底面に均一に分配させる。900 ppm の活性成分溶液及び 44.7 cm² の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5 μg/cm² の面積基準薬量が達成される。

【0496】

【0346】 溶媒を蒸発させた後、該管に 5～10 匹の成体ネコノミ (Ctenocephalides felis) を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室温及び周囲湿度で、水平位でインキュベートする。48 時間経過した後、効力を求める。この目的のために、該管を垂直に立て、トントンと叩いてネコノミを該管の底に落とす。該管の底で動かないままにいるか又は動きがギクシャクとしているネコノミは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

40

【0497】

【0347】 この試験において、ある物質が、5 μg/cm² の施用量で少なくとも 80% の効力を達成すれば、その物質は、ネコノミ (Ctenocephalides felis) に対して良好な効力を示す。100% の効力は、全てのネコノミが死んだか又は死にかけていることを意味する。0% の効力は、損傷を受けたネコノミが無かったこ

50

とを意味する。

【0498】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=500\text{g}/\text{ha}$)の施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-05、Ia-07、Ia-08、Ia-10、Ia-13、Ia-15、Ia-16、Ia-20、Ia-23、Ia-25、Ia-30、Ia-32、Ia-51、Ia-52、Ia-56、Ia-60、Ia-63、Ia-64、Ia-65、Ia-66、Ia-69、Ia-71、Ia-73、Ia-75、Ia-76、Ia-79、Ia-80、Ia-82、Ia-83、Ia-90、Ia-93、Ia-95、Ia-104、Ia-107、Ia-108、Ia-113、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-130、Ia-131、Ia-134、Ia-136、Ia-137、Ia-139、Ia-142、Ia-147、Ia-149、Ia-158、Ia-162、I-T2-04、I-Tc-03。

10

【0499】

[0348] この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=500\text{g}/\text{ha}$)の施用量で、90%の効力を示す： Ia-53。

【0500】

[0349] この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=500\text{g}/\text{ha}$)の施用量で、80%の効力を示す： Ia-54、Ia-67。

20

【0501】

[0350] この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=500\text{g}/\text{ha}$)の施用量で、70%の効力を示す： Ia-55。

【0502】

クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus) - 成体クリイロコイタマダニを用いたインビトロ接触試験

[0351] 試験管にコーティングするために、9mgの活性成分を、最初に、1mLのアセトンp. a. に溶解させ、次いで、アセトンp. a. を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び揺動させる（揺動回転30rpmで2時間）ことによって250μLの該溶液を25mL容ガラス管の内壁及び底面に均一に分配させる。900ppmの活性成分溶液及び44.7cm²の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ の面積基準薬量が達成される。

30

【0503】

[0352] 溶媒を蒸発させた後、該管に5~10匹の成体クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus) を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室温及び周囲湿度で、暗所において水平位でインキュベートする。48時間経過した後、効力を求める。この目的のために、トントンと叩いてクリイロコイタマダニを該管の床面に落とし、5分を超えない時間、ホットプレート上で45~50℃でインキュベートする。該管の底で動かないままにいるか又は這い上がることによって熱を意図的に避けることができないような動きがギクシャクとしているクリイロコイタマダニは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

40

【0504】

[0353] この試験において、ある物質が、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で少なくとも80%の効力を達成すれば、その物質は、クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus) に対して良好な活性を示す。100%の効力は、全てのクリイロコイタマダニが死んだか又は死にかけていることを意味する。0%の効力は、損傷を受けたクリイロコイタマダニが無かったことを意味する。

【0505】

[0354] この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=500\text{g}/\text{ha}$)の施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-04、Ia-05、Ia-10、Ia-11、Ia-13、Ia-15、Ia-16、Ia-

50

19、Ia-23、Ia-29、Ia-30、Ia-51、Ia-52、Ia-53、Ia-54、Ia-55、Ia-65、Ia-66、Ia-66、Ia-75、Ia-76、Ia-79、Ia-80、Ia-82、Ia-83、Ia-90、Ia-93、Ia-104、Ia-115、Ia-139、Ia-141、Ia-146、Ia-147、Ia-157、Ia-162、I-Tc-01、I-Tc-03。

【0506】

【0355】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=500\text{g}/\text{ha}$) の施用量で、80%の効力を示す： Ia-08、Ia-20、Ia-22、Ia-25、Ia-26、Ia-28、Ia-32、Ia-37、Ia-38、Ia-40、Ia-57、Ia-63、Ia-67、Ia-68、Ia-95、Ia-108、Ia-116、Ia-142、Ia-143、I-Tc-02。

10

【0507】

【0356】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $1\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=100\text{g}/\text{ha}$) の施用量で、100%の効力を示す： Ia-56、Ia-96。

【0508】

【0357】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $1\mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($=100\text{g}/\text{ha}$) の施用量で、80%の効力を示す： Ia-69。

【0509】

アンブリオンマ・ヘバラエウム (Amblyomma hebraeum) 試験

20

溶媒： ジメチルスルホキシド

【0358】 活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0510】

【0359】 マダニ (アンブリオンマ・ヘバラエウム (Amblyomma hebraeum)) の幼虫を孔があけてあるプラスチック製ビーカーの中に配置し、所望濃度に1分間浸漬する。そのマダニを濾紙に載せてペトリ皿内に移し、人工気象室 (climate-controlled cabinet) 内に保存する。

【0511】

30

【0360】 42日間経過した後、殺虫率 (%) を求める。100%は、全てのマダニが死んだことを意味し、0%は、死んだマダニが無かったことを意味する。

【0512】

【0361】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-13。

【0513】

オウシマダニ (Boophilus microplus) - 浸漬試験

被験動物： オウシマダニ (Boophilus microplus) Parkhurst系統 (SP-抵抗性)

溶媒： ジメチルスルホキシド

40

【0362】 10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドに溶解させる。適切な配合物を製造するために、活性成分の該溶液をいずれの場合にも水で希釈して所望の濃度とする。

【0514】

【0363】 この活性成分配合物をピペットで管の中に入れる。8~10匹の充血した成体雌オウシマダニ (Boophilus microplus) を孔を有するさらなる管の中に移す。その管を活性成分の該配合物の中に浸漬し、全てのマダニを完全に濡らす。当該液体が流れ落ちた後、マダニをプラスチック製皿の中のフィルターディスクに移し、人工気象室 (climate-controlled room) の中に保存する。

【0515】

50

〔0364〕 その効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室（climate-controlled cabinet）の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが無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。

【0516】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-13、Ia-23、Ia-51、Ia-53、Ia-65、Ia-75、Ia-79、Ia-84、Ia-90、Ia-95、Ia-106、Ia-115、Ia-145、I-T2-04。

10

【0517】

〔0365〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、95%の効力を示す： Ia-66、Ia-93。

【0518】

〔0366〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： Ia-15、Ia-96。

【0519】

〔0367〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： Ia-28、Ia-83、Ia-91、Ia-142、Ia-162。

20

【0520】

〔0368〕 オウシマダニ（Boophilus microplus）-注入試験
溶媒： ジメチルスルホキシド

〔0369〕 活性化合物の適切な調製物を製造するために、10mgの活性化合物を0.5mLの溶媒と混合させ、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0521】

〔0370〕 充血した5匹の成体雌オウシマダニ（Boophilus microplus）の腹部に1μLの該活性成分溶液を注入する。その動物をシャーレの中に移し、人工気象室（climate-controlled room）の中で維持する。

【0522】

30

〔0371〕 その効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室（climate-controlled cabinet）の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが無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。

【0523】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20μgの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-02、Ia-04、Ia-05、Ia-07、Ia-08、Ia-10、Ia-11、Ia-12、Ia-13、Ia-15、Ia-16、Ia-18、Ia-19、Ia-20、Ia-22、Ia-23、Ia-25、Ia-26、Ia-28、Ia-29、Ia-30、Ia-32、Ia-35、Ia-37、Ia-38、Ia-40、Ia-41、Ia-42、Ia-51、Ia-52、Ia-53、Ia-54、Ia-55、Ia-56、Ia-57、Ia-59、Ia-60、Ia-61、Ia-63、Ia-64、Ia-65、Ia-66、Ia-67、Ia-68、Ia-69、Ia-71、Ia-72、Ia-73、Ia-74、Ia-75、Ia-76、Ia-77、Ia-79、Ia-80、Ia-82、Ia-83、Ia-84、Ia-88、Ia-90、Ia-91、Ia-93、Ia-95、Ia-96、Ia-98、Ia-104、Ia-106、Ia-107、Ia-108、Ia-113、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-130、Ia-131、Ia-132、Ia-133、Ia-134、Ia-136、Ia-137、Ia-139、Ia

40

50

－141、Ia－142、Ia－143、Ia－144、Ia－145、Ia－146、Ia－147、Ia－148、Ia－149、Ia－150、Ia－151、Ia－152、Ia－155、Ia－157、Ia－158、Ia－159、Ia－162、Ic－01、I-T2－04、I-Tc－01、I-Tc－02、I-Tc－03。

【0524】

〔0372〕 ネコノミ (Ctenocephalides felis)－経口試験
 溶媒： ジメチルスルホキシド

〔0373〕 活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させる。クエン酸塩を添加したウシ血液で希釈して、所望の濃度とする。

10

【0525】

〔0374〕 頂部と底部がガーゼで閉じられているチャンバーの中に、餌を与えていない約20匹の成体ネコノミ (Ctenocephalides felis)を入れる。下端部がパラフィルムで閉じられている金属製円筒を該チャンバーの上に配置する。該円筒は、血液／活性成分配合物を含んでおり、これは、パラフィルム膜を通してネコノミによって摂取され得る。

【0526】

〔0375〕 2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのネコノミが死んだことを意味し、0%は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0527】

20

〔0376〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%効力を示す： Ia－01、Ia－02、Ia－04、Ia－05、Ia－07、Ia－08、Ia－10、Ia－11、Ia－12、Ia－13、Ia－15、Ia－16、Ia－18、Ia－19、Ia－20、Ia－22、Ia－23、Ia－25、Ia－26、Ia－28、Ia－29、Ia－30、Ia－32、Ia－35、Ia－37、Ia－38、Ia－40、Ia－41、Ia－42、Ia－51、Ia－52、Ia－53、Ia－54、Ia－55、Ia－56、Ia－57、Ia－59、Ia－60、Ia－61、Ia－63、Ia－64、Ia－65、Ia－66、Ia－67、Ia－68、Ia－69、Ia－71、Ia－72、Ia－73、Ia－74、Ia－75、Ia－76、Ia－77、Ia－79、Ia－80、Ia－82、Ia－83、Ia－84、Ia－88、Ia－90、Ia－91、Ia－93、Ia－95、Ia－96、Ia－98、Ia－104、Ia－106、Ia－107、Ia－108、Ia－113、Ia－115、Ia－116、Ia－117、Ia－128、Ia－130、Ia－131、Ia－132、Ia－133、Ia－134、Ia－136、Ia－137、Ia－139、Ia－141、Ia－142、Ia－143、Ia－144、Ia－145、Ia－146、Ia－147、Ia－148、Ia－149、Ia－150、Ia－151、Ia－152、Ia－155、Ia－157、Ia－158、Ia－159、Ia－162、Ic－01、Ic－04、I-T2－04、I-Tc－01、I-Tc－02、I-Tc－03。

30

【0528】

40

ヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) 試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

〔0377〕 活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0529】

〔0378〕 約20匹のヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) のL1幼虫を、馬肉の挽肉及び所望濃度の活性化合物調製物を含んでいる被験容器の中に移す。

【0530】

〔0379〕 2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのヒツジ

50

キンバエ幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだヒツジキンバエ幼虫が無かったことを意味する。

【0531】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-02、Ia-04、Ia-05、Ia-07、Ia-08、Ia-10、Ia-11、Ia-12、Ia-13、Ia-15、Ia-16、Ia-18、Ia-19、Ia-20、Ia-22、Ia-23、Ia-25、Ia-26、Ia-28、Ia-29、Ia-30、Ia-32、Ia-35、Ia-37、Ia-38、Ia-40、Ia-41、Ia-42、Ia-51、Ia-52、Ia-53、Ia-54、Ia-55、Ia-56、Ia-57、Ia-59、Ia-60、Ia-61、Ia-63、Ia-64、Ia-65、Ia-66、Ia-67、Ia-68、Ia-69、Ia-71、Ia-72、Ia-73、Ia-74、Ia-75、Ia-76、Ia-77、Ia-79、Ia-80、Ia-82、Ia-83、Ia-84、Ia-88、Ia-90、Ia-91、Ia-93、Ia-95、Ia-96、Ia-98、Ia-104、Ia-106、Ia-107、Ia-108、Ia-113、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-128、Ia-130、Ia-131、Ia-132、Ia-133、Ia-134、Ia-136、Ia-137、Ia-139、Ia-141、Ia-142、Ia-143、Ia-144、Ia-145、Ia-146、Ia-147、Ia-148、Ia-149、Ia-150、Ia-151、Ia-152、Ia-155、Ia-157、Ia-158、Ia-159、Ia-162、Ic-01、Ic-04、I-T2-04、I-Tc-01、I-Tc-02、I-Tc-03。

【0532】

[0380]

イエバエ (Musca domestica) 試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

[0381] 活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0533】

[0382] 砂糖溶液と所望濃度の活性成分配合物で処理されたスポンジを含んでいる容器に、10匹の成体イエバエ (Musca domestica) を生息させる。

【0534】

[0383] 2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのイエバエが死んだことを意味し、0%は、死んだイエバエが無かったことを意味する。

【0535】

[0384] この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-02、Ia-04、Ia-05、Ia-07、Ia-10、Ia-11、Ia-12、Ia-13、Ia-15、Ia-16、Ia-18、Ia-19、Ia-23、Ia-25、Ia-26、Ia-28、Ia-29、Ia-30、Ia-35、Ia-37、Ia-38、Ia-40、Ia-41、Ia-51、Ia-52、Ia-53、Ia-54、Ia-55、Ia-56、Ia-57、Ia-59、Ia-60、Ia-63、Ia-64、Ia-65、Ia-66、Ia-67、Ia-68、Ia-69、Ia-71、Ia-72、Ia-73、Ia-74、Ia-75、Ia-76、Ia-79、Ia-80、Ia-82、Ia-83、Ia-84、Ia-90、Ia-91、Ia-93、Ia-95、Ia-104、Ia-106、Ia-107、Ia-108、Ia-113、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-128、Ia-130、Ia-131、Ia-132、Ia-133、Ia-134、Ia-136、Ia-137、Ia-139、Ia-141、Ia-142、Ia-143、Ia-144、Ia-145、Ia-146、Ia-147、Ia-1

48、Ia-149、Ia-150、Ia-151、Ia-152、Ia-155、Ia-157、Ia-158、Ia-159、Ia-162、Ic-04。

【0536】

【0385】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： Ia-20、Ia-98、Ic-01。

【0537】

【0386】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： Ia-08、Ia-42、Ia-61。

【0538】

【0387】 サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita) 試験 10

溶媒： 125.0重量部のアセトン

【0388】 活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0539】

【0389】 容器に、砂、活性化合物溶液、サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita) の卵／幼虫の懸濁液及びレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、植物が成長する。根では、こぶが形成される。

【0540】

【0390】 14日間経過した後、こぶの形成によって殺線虫効力(%)を求める。100%は、こぶが見られなかったことを意味し；0%は、処理された植物のこぶの数が処理されていない対照のこぶの数に相当することを意味する。 20

【0541】

【0391】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、100%の効力を示す： Ia-08、Ia-34、Ia-102、Ia-125。

【0542】

【0392】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、90%の効力を示す： Ia-15、Ia-42、Ia-105、Ia-141。 30

【0543】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 噴霧試験

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

【0393】 活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0544】

【0394】 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 (Brassica pekinensis) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。 40

【0545】

【0395】 6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0546】

【0396】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/h aの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-11、Ia-13、Ia- 50

134、Ia-136、Ia-152。

【0547】

〔0397〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/h
aの施用量で、90%の効力を示す： Ia-15、Ia-23、Ia-34、Ia-6
5、Ia-76、Ia-79、Ia-80、Ia-84、Ia-90、Ia-105、I
a-135、Ia-138、Ia-142、Ia-145、Ia-147、Ia-149
、Ia-154、Ia-155、Ia-156、Ia-159。

【0548】

〔0398〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/h
aの施用量で、70%の効力を示す： Ia-58、Ia-66。

10

【0549】

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

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

〔0399〕 活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記
重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の
乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を
乳化剤を含有している水で希釈する。

【0550】

20

〔0400〕 ハクサイ (Brassica pekinensis) の葉のディスク
に所望濃度の活性化合物調製物を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (mustard
beetle) (Phaedon cochleariae) の幼虫を寄生させる。

【0551】

〔0401〕 7日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのマスター
ドビートル幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだマスタードビートル幼虫が無かつ
たことを意味する。

【0552】

〔0402〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/h
aの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-02、Ia-04、Ia-
05、Ia-06、Ia-07、Ia-08、Ia-09、Ia-10、Ia-11、I
a-12、Ia-13、Ia-15、Ia-16、Ia-18、Ia-19、Ia-20
、Ia-21、Ia-22、Ia-23、Ia-24、Ia-26、Ia-27、Ia-
28、Ia-29、Ia-32、Ia-34、Ia-37、Ia-38、Ia-39、I
a-40、Ia-41、Ia-42、Ia-43、Ia-44、Ia-45、Ia-47
、Ia-49、Ia-51、Ia-52、Ia-53、Ia-54、Ia-55、Ia-
56、Ia-57、Ia-58、Ia-59、Ia-60、Ia-62、Ia-63、I
a-64、Ia-65、Ia-66、Ia-67、Ia-68、Ia-69、Ia-70
、Ia-71、Ia-72、Ia-73、Ia-73、Ia-74、Ia-75、Ia-
76、Ia-77、Ia-78、Ia-82、Ia-83、Ia-84、Ia-85、I
a-86、Ia-87、Ia-88、Ia-89、Ia-90、Ia-91、Ia-92
、Ia-93、Ia-94、Ia-95、Ia-97、Ia-98、Ia-99、Ia-
100、Ia-101、Ia-102、Ia-103、Ia-104、Ia-105、I
a-106、Ia-107、Ia-108、Ia-109、Ia-110、Ia-111
、Ia-112、Ia-113、Ia-114、Ia-115、Ia-116、Ia-1
17、Ia-119、Ia-120、Ia-123、Ia-124、Ia-128、Ia
-130、Ia-131、Ia-132、Ia-133、Ia-134、Ia-135、
Ia-136、Ia-137、Ia-138、Ia-139、Ia-141、Ia-14
2、Ia-143、Ia-144、Ia-145、Ia-146、Ia-147、Ia-
148、Ia-149、Ia-150、Ia-151、Ia-152、Ia-153、I

30

40

50

a-154、Ia-155、Ia-156、Ia-157、Ia-158、Ia-159、Ia-160、Ia-162、Ia-163、Ia-164、Ia-165、Ia-166、Ia-167、Ic-01、Ic-02、Ic-04、Ic-05、Ic-03、I-T2-01、I-T2-03、I-T2-04、I-T7-01、I-T7-02、I-T7-03。

【0553】

〔0403〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/h aの施用量で、83%の効力を示す： Ia-80。

【0554】

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

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

〔0404〕 活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0555】

〔0405〕 トウモロコシ (*Zea mays*) の葉のディスクに所望濃度の活性成分配合物を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (armyworm) (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫を寄生させる。

【0556】

〔0406〕 7日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのツマジロクサヨトウ幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだツマジロクサヨトウ幼虫が無かったことを意味する。

【0557】

〔0407〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/h aの施用量で、100%の効力を示す： Ia-01、Ia-02、Ia-04、Ia-05、Ia-06、Ia-08、Ia-09、Ia-10、Ia-13、Ia-15、Ia-16、Ia-18、Ia-19、Ia-20、Ia-21、Ia-23、Ia-24、Ia-25、Ia-26、Ia-27、Ia-28、Ia-29、Ia-30、Ia-32、Ia-34、Ia-35、Ia-38、Ia-39、Ia-40、Ia-49、Ia-50、Ia-51、Ia-52、Ia-53、Ia-54、Ia-55、Ia-56、Ia-57、Ia-58、Ia-59、Ia-60、Ia-61、Ia-63、Ia-64、Ia-65、Ia-66、Ia-67、Ia-69、Ia-71、Ia-72、Ia-73、Ia-74、Ia-75、Ia-76、Ia-77、Ia-79、Ia-80、Ia-81、Ia-82、Ia-83、Ia-84、Ia-85、Ia-86、Ia-87、Ia-89、Ia-90、Ia-91、Ia-92、Ia-93、Ia-94、Ia-95、Ia-96、Ia-99、Ia-100、Ia-101、Ia-103、Ia-104、Ia-105、Ia-106、Ia-107、Ia-108、Ia-109、Ia-110、Ia-111、Ia-112、Ia-113、Ia-114、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-119、Ia-120、Ia-128、Ia-130、Ia-131、Ia-132、Ia-133、Ia-134、Ia-135、Ia-136、Ia-137、Ia-138、Ia-139、Ia-141、Ia-142、Ia-143、Ia-144、Ia-145、Ia-146、Ia-147、Ia-148、Ia-149、Ia-150、Ia-151、Ia-152、Ia-154、Ia-155、Ia-156、Ia-157、Ia-158、Ia-159、Ia-160、Ia-162、Ia-164、Ia-165、Ia-166、Ia-167、Ic-01、Ic-02、Ic-04、Ic-05、Ic-03、I-Tc-01、I-Tc-02、I-Tc-03、I-T7-01、I-T7-02、I-T7-03。

10

20

30

40

50

【0558】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g/h aの施用量で、83%の効力を示す： I a-07、I a-12、I a-37、I a-47、I a-68、I a-88、I a-123、I a-163、I-T2-04。

【0559】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 g/h aの施用量で、83%の効力を示す： I a-43。

【0560】

ナミハダニ (Tetranychus urticae) - 噴霧試験 ; OP抵抗性

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

【0408】 活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0561】

【0409】 全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が発生しているインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) の葉のディスクに、所望濃度の活性化化合物調製物を噴霧する。

【0562】

【0410】 6日間経過した後、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無かったことを意味する。

【0563】

【0411】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g/h aの施用量で、100%の効力を示す： I a-01、I a-02、I a-04、I a-07、I a-10、I a-11、I a-12、I a-13、I a-15、I a-20、I a-23、I a-27、I a-28、I a-32、I a-34、I a-37、I a-39、I a-42、I a-44、I a-58、I a-59、I a-60、I a-63、I a-64、I a-65、I a-66、I a-67、I a-68、I a-71、I a-72、I a-73、I a-74、I a-75、I a-76、I a-79、I a-80、I a-81、I a-82、I a-84、I a-85、I a-87、I a-88、I a-90、I a-91、I a-92、I a-93、I a-95、I a-96、I a-99、I a-100、I a-104、I a-105、I a-106、I a-107、I a-109、I a-111、I a-115、I a-116、I a-119、I a-120、I a-134、I a-135、I a-136、I a-137、I a-141、I a-142、I a-145、I a-147、I a-149、I a-154、I a-156、I a-158、I a-160、I a-162、I a-163、I a-164、I a-166、I a-167、I c-01、I c-04、I-Tc-03。

【0564】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g/h aの施用量で、90%の効力を示す： I a-08、I a-09、I a-19、I a-22、I a-26、I a-43、I a-73、I a-83、I a-89、I a-98、I a-102、I a-108、I a-112、I a-113、I a-130、I a-138、I a-139、I a-144、I a-150、I a-157、I a-165、I-T7-01。

【0565】

【0412】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g/h aの施用量で、70%の効力を示す： I a-46、I a-61。

【0566】

10

20

30

40

50

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) 噴霧試験

溶媒： 14重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

〔0413〕 活性化合物の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒に溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、1000ppmの濃度で当該調製物溶液に添加する。

【0567】

〔0414〕 モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が重度に発生しているピーマン (*Capsicum annuum*) 植物を、所望濃度の該活性化合物調製物を噴霧することによって処理する。

【0568】

〔0415〕 6日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0569】

〔0416〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、4ppmの施用量で、85%の効力を示す： Ia-95。

【0570】

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

溶媒： 14重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

〔0417〕 活性化合物の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒に溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、1000ppmの濃度で当該調製物溶液に添加する。

【0571】

〔0418〕 全ての成育段階のナミハダニ (*greenhouse red spider mite*) (*Tetranychus urticae*) が重度に発生しているインゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*) を、所望濃度の該活性化合物調製物を噴霧することによって処理する。

【0572】

〔0419〕 7日間経過した後、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無かったことを意味する。

【0573】

〔0420〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、4ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-T2-04。

【0574】

〔0421〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、4ppmの施用量で、99%の効力を示す： Ia-51、Ia-53、Ia-55、Ia-57。

【0575】

アノフェレス (*Anopheles*) 試験 (ANPHGB 表面処理)

溶媒： アセトン+2000ppmのナタネ油メチルエステル (RME)

〔0422〕 活性化合物の適切な配合物を製造するために、該活性化合物を上記溶媒に溶解させる (2mg/mL)。その活性化合物配合物をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、乾燥後、その処理されたタイルの上に、ガンビエハマダラカ (*Anopheles gambiae*) 種の系統RSPH (homozygote kdr) の成体蚊を配置する。暴露時間は、30分間である。

10

20

30

40

50

【0576】

【0423】 処理された表面に接触させてから24時間経過した後、死亡率(%)を求める。100%は、全ての蚊が死んだことを意味し、0%は死んだ蚊が無かったことを意味する。

【0577】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： Ia-05、Ia-06、Ia-20、Ia-24、Ia-27、Ia-32、Ia-38、Ia-40、Ia-91、Ia-108、Ia-112、Ia-113、Ia-116、Ia-163。

【0578】

【0424】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： Ia-05、Ia-06、Ia-15、Ia-19、Ia-20、Ia-24、Ia-38、Ia-40、Ia-63、Ia-64、Ia-71、Ia-73、Ia-74、Ia-85、Ia-91、Ia-99、Ia-100、Ia-106、Ia-109、Ia-111、Ia-112、Ia-113、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-119、Ia-162、Ia-163。

【0579】

【0425】 アノフェレス (Anopheles) 試験 (ANPHFU 表面処理)

溶媒： アセトン+2000ppmのナタネ油メチルエステル (RME)

【0426】 活性化合物の適切な配合物を製造するために、該活性化合物を上記溶媒に溶解させる (2mg/mL)。その活性化合物配合物をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、乾燥後、その処理されたタイルの上に、ハマダラカ (Anopheles funestus) 種の系統 FUMOZ-R (Hunt et al., Med Vet Entomol. 2005 Sep; 19(3): 271-5) の成体蚊を配置する。暴露時間は、30分間である。

【0580】

【0427】 処理された表面に接触させてから24時間経過した後、死亡率(%)を求める。100%は、全ての蚊が死んだことを意味し、0%は死んだ蚊が無かったことを意味する。

【0581】

【0428】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： Ia-05、Ia-06、Ia-15、Ia-20、Ia-24、Ia-27、Ia-32、Ia-40、Ia-91、Ia-112、Ia-113、Ia-116、Ia-163。

【0582】

【0429】 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： Ia-05、Ia-06、Ia-15、Ia-20、Ia-24、Ia-27、Ia-32、Ia-40、Ia-53、Ia-55、Ia-63、Ia-64、Ia-73、Ia-84、Ia-85、Ia-99、Ia-100、Ia-106、Ia-109、Ia-110、Ia-112、Ia-113、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-130、Ia-136、Ia-162、Ia-163。

【0583】

【0430】 アエデス (Aedes) 試験 (AEDSAE 表面処理)

溶媒： アセトン+2000ppmのナタネ油メチルエステル (RME)

【0431】 活性化合物の適切な配合物を製造するために、該活性化合物を上記溶媒に溶解させる (2mg/mL)。その活性化合物配合物をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、乾燥後、その処理されたタイルの上に、ネッタイシマカ (Aedes aegypti) 種の系統 MONHEIM の成体蚊を配置する。暴露時間は、30分間である。

【0584】

〔0432〕 処理された表面に接触させてから24時間経過した後、死亡率(%)を求める。100%は、全ての蚊が死んだことを意味し、0%は死んだ蚊が無かったことを意味する。

【0585】

〔0433〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： Ia-05、Ia-06、Ia-08、Ia-09、Ia-15、Ia-19、Ia-20、Ia-22、Ia-24、Ia-26、Ia-27、Ia-30、Ia-32、Ia-38、Ia-40、Ia-42、Ia-47、Ia-91、Ia-108、Ia-112、Ia-113、Ia-116、Ia-163。

10

【0586】

〔0434〕 この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20mg/m²の施用量で、90-100%の効力を示す： Ia-05、Ia-06、Ia-15、Ia-19、Ia-20、Ia-22、Ia-24、Ia-26、Ia-27、Ia-30、Ia-31、Ia-32、Ia-40、Ia-42、Ia-53、Ia-55、Ia-57、Ia-63、Ia-64、Ia-71、Ia-74、Ia-73、Ia-79、Ia-84、Ia-85、Ia-91、Ia-99、Ia-100、Ia-104、Ia-106、Ia-108、Ia-109、Ia-110、Ia-111、Ia-112、Ia-113、Ia-115、Ia-116、Ia-117、Ia-119、Ia-120、Ia-129、Ia-130、Ia-136、Ia-162、Ia-163。

20

【0587】

除草活性に関する生物学的実施例〔0435〕 発生前作物における除草活性及び植物の耐性

〔0436〕 木質繊維製ポット内の砂壤土に単子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆する。次いで、その被覆土壌の表面に、乳剤(EC)として製剤された本発明の化合物を、0.2%の湿潤剤が添加された600~800L/haに相当する散布水量のエマルジョンとして施用する。処理後、ポットを温室内に置き、その被験植物にとって良好な生育条件下に維持する。3週間の試験期間の後、処理されていない対照と比較することにより、該被験植物に対するダメージを視覚的に評価する(除草活性(%): 100%の活性=植物の枯死、0%の活性=対照植物と同様)。ここで、例えば、化合物No. Ia-17、Ia-37、Ia-28及びIa-56は、1280g/haの施用量で、それぞれ、アオゲイトウ(*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)に対して100%の効力を示し、Ia-56以外は、サンシキスミレ(*Viola tricolor*) (VIOTR)に対しても100%の効力を示す。さらに、化合物No. Ia-17、Ia-37及びIa-28は、同じ施用量で、イヌカミツレ(*Matricaria inodora*) (MATIN)に対して80%以上の効力を示し、Ia-17及びIa-37は、ハコベ(*Stellaria media*) (STEME)に対しても80%以上の効力を示す。

30

【0588】

40

〔0437〕 発生後作物における除草活性及び植物の耐性

〔0438〕 木質繊維製ポット内の砂壤土に単子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆し、温室内で良好な生育条件下で栽培する。播種後2~3週間経過した後、被験植物を1葉期で処理する。当該植物の緑色の部分に、乳剤(EC)として製剤された本発明の化合物を、0.2%の湿潤剤が添加された600~800L/haに相当する散布水量のエマルジョンとして噴霧する。被験植物を温室内で最適な生育条件下に約3週間静置した後、当該調製物の効力について、処理されていない対照と比較して視覚的に評価する(除草効力(%): 100%の活性=植物の枯死、0%の活性=対照植物と同様)。例えば、化合物No. Ia-17、Ia-28及びIa-37は、1280g/haの施用量で、それぞれ、アオゲイトウ(*Amaranthus retro*

50

flexus) (AMARE) 及びサンシキスミレ (Viola tricolor) (VIOTR) に対して少なくとも100%の効力を示す。Ia-17は、この施用量で、さらに、イチビ (Abutilon theophrasti) (ABUTH)、イヌカミツレ (Matricaria inodora) (MATIN) 及びハコベ (Stellaria media) (STEME) に対しても80%以上の効力を示す。

フロントページの続き

- (51)Int.Cl. F I
A O 1 N 43/647 (2006.01) A O 1 N 43/647
- (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 100196483
 弁理士 川崎 洋祐
- (74)代理人 100203035
 弁理士 五味渕 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 ハースチネック, トビアス
 ドイツ国、4 0 2 2 3・デュッセルドルフ、フレーアー・シュトラッセ・2 0 2
- (72)発明者 マウエ, ミヒャエル
 ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ブルネンシュトラッセ・1 8 アー
- (72)発明者 ハーレンバッハ, ウェルナー
 ドイツ国、4 0 7 8 9・マンハイム、リヒテンベルガー・シュトラッセ・6 8
- (72)発明者 アールト, アレクサンダー
 ドイツ国、5 0 8 5 9・ケルン、アム・ハイトシュタム・4 7
- (72)発明者 フェルテン, ローベルト
 ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ヘーアシュトラッセ・1 7
- (72)発明者 フィッシャー, ライナー
 ドイツ国、4 0 7 8 9・マンハイム、ネリーザクスーシュトラッセ・2 3
- (72)発明者 シュワルツ, ハンスーゲオルグ
 ドイツ国、4 6 2 8 2・ドルステン、アウフ・デム・ベアーエンカンブ・8 2 ベー
- (72)発明者 ゲルゲンス, ウルリヒ
 ドイツ国、4 0 8 8 2・ラティンゲン、フェステル・シュトラッセ・3 7
- (72)発明者 イルク, ケルシュティン
 ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、ノイッサー・バール・3 2
- (72)発明者 レーミング, クラウス
 ドイツ国、5 1 3 7 5・レーパークーゼン、ローツィングシュトラッセ・3 5
- (72)発明者 ホルストマン, セバスチャン
 ドイツ国、5 1 3 8 1・レーパークーゼン、オーバー・デム・ホーフ・1 1
- (72)発明者 ポーツ, ダニエラ

- ドイツ国、5 2 3 9 1・フェットヴァイス、オストシュトラセ・1
(72)発明者 ケーベルリング, ヨハネス
ドイツ国、4 1 4 6 6・ノイス、アツァリエンシュトラセ・3 0
(72)発明者 タルベルク, アンドレアス
ドイツ国、4 2 7 8 1・ハーン、ジンターシュトラセ・8 6
(72)発明者 ディートリヒ, ハンスユルグ
ドイツ国、6 5 8 3 5・リーダーバッハ・アム・タウヌス、ボニファツィウスシュトラセ・1 ベー

審査官 早乙女 智美

- (56)参考文献 特表2 0 1 0－5 2 3 5 7 0 (JP, A)
国際公開第2 0 1 4／0 6 6 1 2 0 (WO, A1)
特表2 0 1 3－5 2 2 2 6 3 (JP, A)
国際公開第2 0 1 5／0 6 7 6 4 6 (WO, A1)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C 0 7 D
A 0 1 N
CAplus／REGISTRY (STN)