

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2025-512361

(P2025-512361A)

(43)公表日 令和7年4月17日(2025.4.17)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 403/04 (2006.01)	C 0 7 D 403/04	C S P 4 C 0 8 6
A 6 1 K 31/506 (2006.01)	A 6 1 K 31/506	4 H 0 1 1
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 0 1 N 43/653 (2006.01)	A 0 1 N 43/653	G
A 0 1 P 7/00 (2006.01)	A 0 1 P 7/00	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全124頁)		

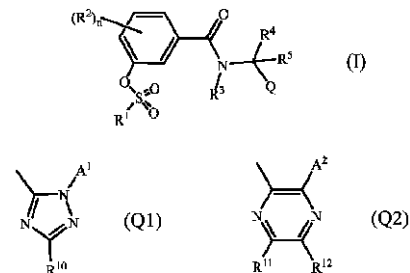
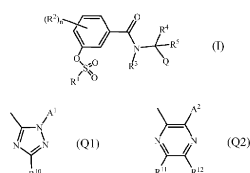
(21)出願番号	特願2024-560243(P2024-560243)	(71)出願人	391022452
(86)(22)出願日	令和5年4月13日(2023.4.13)		エフ エム シー コーポレーション
(85)翻訳文提出日	令和6年12月5日(2024.12.5)		FMC CORPORATION
(86)国際出願番号	PCT/US2023/018412		アメリカ合衆国 1 9 1 0 4 ペンシルベ
(87)国際公開番号	WO2023/200911		ニア州 フィラデルフィア ウォールナッ
(87)国際公開日	令和5年10月19日(2023.10.19)		トストリート 2 9 2 9
(31)優先権主張番号	63/330,809	(74)代理人	100127926
(32)優先日	令和4年4月14日(2022.4.14)		弁理士 結田 純次
(33)優先権主張国・地域又は機関	米国(US)	(74)代理人	100216105
(81)指定国・地域	AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV	(72)発明者	ジョージ・フィリップ・ラーム
	最終頁に続く		アメリカ合衆国ペンシルベニア州1 9 1 0 4 . フィラデルフィア . ウォールナッ
			ト・ストリート 2 9 2 9 . エフエムシー
			・コーポレーションーパテント・デパー
			最終頁に続く

(54)【発明の名称】 無脊椎有害生物を防除するための新規なスルホネートベンズアミド化合物

(57)【要約】

開示されているのは、式 (I) の化合物（それらの全ての幾何異性体及び立体異性体、N-オキシド、及び塩を含む）であり、

【化1】



式中、

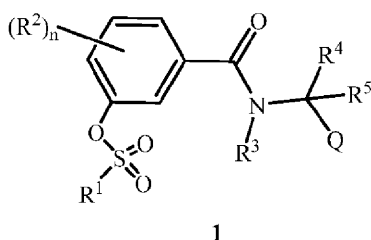
Qが、(Q¹)又は(Q²)であり、
R¹、R²、R³、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹及びA²が、本開示において定義される通りである。さらに開示されているのは、式 (I) の化合物を含む組成物、及び無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の
本開示の化合物又は組成物と接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法である。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

無脊椎有害生物を防除するための、式 1 から選択される化合物、その N-オキシド及び塩：

【化 1】



10

(式中、

R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で置換され；又は

R^1 が、1～3つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び3個以下の窒素原子から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各5員～6員芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

20

ただし、 R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである場合、 R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル以外であり；

R^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R^2 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

R^2 が、フェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び3個以下の窒素原子から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

30

R^2 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ であり；

R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

R^3 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $S(O)_pR^7$ 又は $SO_2NR^7R^8$ であり；

40

R^4 が、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^5 が、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；又は R^4 及び R^5 が、一緒になって、3～6員炭素環式環を形成することができ；

R^6 が、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の X^1 で任意選択的に置換され；又は

50

R^6 が、フェニル、又は炭素原子並びに 1 個の酸素、1 個の硫黄、及び 3 個以下の窒素原子から独立して選択される 1～3 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 員芳香族複素環、又は炭素原子及び 1～2 個の窒素原子から選択される環員を含有する 6 員芳香族複素環、又は炭素原子並びに 2 個以下の酸素、2 個以下の硫黄、及び 2 個以下の窒素原子から独立して選択される 1～5 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 3 員～6 員非芳香族複素環であり、ここで、各フェニル、5 員～6 員芳香族複素環又は 3 員～6 員非芳香族複素環が、1 つ以上の X^1 で任意選択的に置換され；又は

R^6 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ であり；

R^7 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

R^7 が、フェニル、又は炭素原子並びに 1 個の酸素、1 個の硫黄、及び 3 個以下の窒素原子から独立して選択される 1～3 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 員芳香族複素環、又は炭素原子及び 1～2 個の窒素原子から選択される環員を含有する 6 員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は 5 員～6 員芳香族複素環が、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^8 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、又は $C_2 \sim C_6$ アルキニルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、又はアルキニルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^9 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

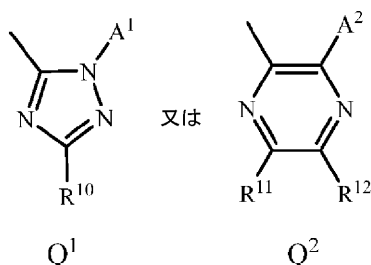
R^9 が、フェニル、又は炭素原子並びに 1 個の酸素、1 個の硫黄、及び 1～3 個の窒素から独立して選択される 1～3 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 員芳香族複素環、又は炭素原子及び 1～2 個の窒素原子から選択される環員を含有する 6 員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は 5 員～6 員芳香族複素環が、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

n が、0～4 であり；

p が、0～2 であり、

Q が、

【化 2】



であり、

A^1 及び A^2 が、炭素原子並びに 1 個の酸素、1 個の硫黄、及び 1～3 個の窒素から独立して選択される 1～3 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 員芳香族複素環、又は炭素原子及び 1～2 個の窒素原子から選択される環員を含有する 6 員芳香族複素環であり、ここで、各 5 員～6 員芳香族複素環が、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、ア

ルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、1～3つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び1～3個の窒素から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各5員～6員芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

又は

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ であり；

X^1 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、CHO、 CO_2H 、 $CO(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $CO_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $C(O)NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $C(O)N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $O(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $O(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ 、 $NHC(O)NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $NHC(O)N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $OC(O)(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $OCO_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ 、 $SO_2NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $SO_2N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $OS(O)_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $OS(O)_2(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ であり；又は

X^1 が、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル又は $C_4\sim C_8$ シクロアルキルアルキルであり；ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上のハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、CHO、 CO_2H 、 $CO(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $CO_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $C(O)NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $C(O)N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $O(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $O(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ 、 $NHC(O)NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $NHC(O)N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $OC(O)(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $OCO_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ 、 $SO_2NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $SO_2N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、又は $OS(O)_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $OS(O)_2(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ で任意選択的に置換され；又は

X^1 が、フェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び1～3個の窒素から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は5員～6員芳香族複素環が、1つ以上のハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、CHO、 CO_2H 、 $CO(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $CO_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $C(O)NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $C(O)N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $O(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $O(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ 、 $NHC(O)NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $NHC(O)N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、 $OC(O)(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $OCO_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ 、 $SO_2NH(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $SO_2N(C_1\sim C_4\text{アルキル})_2$ 、又は $OS(O)_2(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ 、 $OS(O)_2(C_1\sim C_4\text{ハロアルキル})$ で任意選択的に置換される)。

【請求項2】

R^1 が、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、又は $C_2\sim C_6$ アルキニルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、又はアルキニルが、1つ以上の R^6 で置換され；又は R^1 が、1～3つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニルであり；又は R^1 が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換されるピリミジンである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は
 R^2 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各 $C_1 \sim C_6$ アルキルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は
 R^2 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換される、請求項 1 又は請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項 5】

R^4 が、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項 1 又は請求項 1 ～ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R^5 が H である、請求項 1 又は請求項 1 ～ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル又はシクロアルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルから選択される 1 つ以上の置換基で任意選択的に置換される、請求項 1 又は請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項 8】

A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ で任意選択的に置換されるピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンであり；

30

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである、請求項 1 又は請求項 1 ～ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

40

【請求項 9】

Q が Q^1 である、請求項 1 又は請求項 1 ～ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

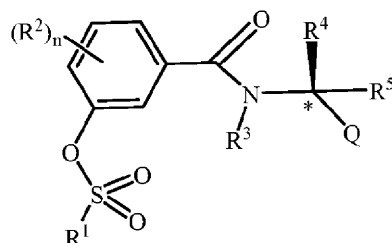
Q が Q^2 である、請求項 1 又は請求項 1 ～ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

式 1 の化合物が、式 1'：

50

【化 3】



式 1'

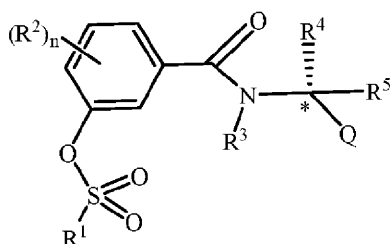
10

式 1' の化合物である、請求項 1 又は実施形態 1 ～ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 12】

式 1 の化合物が、式 1'' :

【化 4】



式 1''

20

式 1'' の化合物である、請求項 1 又は実施形態 1 ～ 11 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 13】

R¹ が、C₁ ～ C₆ アルキルであり、ここで、各アルキルが、1 つ以上の R⁶ で置換され；又は

30

R¹ が、1 ～ 3 つの R⁶ で任意選択的に置換されるフェニルであり；又は

R¹ が、1 つ以上の R⁶ で任意選択的に置換されるピリミジンであり；

R² が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R² が、C₁ ～ C₆ アルキルであり、ここで、各 C₁ ～ C₆ アルキルが、1 つ以上の R⁶ で任意選択的に置換され；又は

R² が、C(O)R⁷、C(O)OR⁷、C(O)NR⁷R⁸、NR⁷R⁸、OR⁷、S(O)ₚR⁷、SO₂NR⁷R⁸、又は OS(O)₂R⁹ であり；

R³ が、水素、C₁ ～ C₆ アルキル、C₂ ～ C₆ アルケニル、C₂ ～ C₆ アルキニル、又は C₃ ～ C₆ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1 つ以上の R⁶ で任意選択的に置換され；

40

R⁴ が、1 つ以上の R⁶ で任意選択的に置換される C₁ ～ C₆ アルキルであり；

R⁵ が水素であり；

R⁶ が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、CN、C(O)R⁷、C(O)OR⁷、C(O)NR⁷R⁸、NR⁷R⁸、OR⁷、NHC(O)NR⁷R⁸、OC(O)R⁷、OC(O)OR⁷、S(O)ₚR⁷、SO₂NR⁷R⁸、OS(O)₂R⁹ であり、又は

R⁶ が、C₁ ～ C₆ アルキル又は C₃ ～ C₇ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル又はシクロアルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ ～ C₄ アルキル、C₁ ～ C₄ ハロアルキル、C₁ ～ C₄ アルコキシ、C₁ ～ C₄ ハロアルコキシ、C₁ ～ C₄ アルキルアミノ、C₁ ～ C₄ ジアルキルアミノ、C₁ ～ C₄ アルキルチオ、C₁ ～ C₄ ハロアルキルチオ、C₁ ～ C₄ アルキルスルフィニル、C₁ ～ C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁ ～

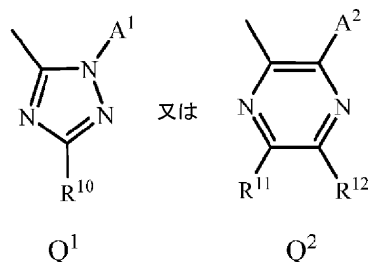
50

C₄ アルキルスルフィニル、C₁～C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ アルキルスルホニル又はC₁～C₄ ハロアルキルスルホニルから選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

R⁷、R⁸及びR⁹が、水素、C₁～C₄ アルキル又はC₁～C₄ ハロアルキルであり；

Qが、

【化5】



10

であり、

A¹及びA²が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ、C₁～C₄ ハロアルコキシ、C₁～C₄ アルキルアミノ、C₁～C₄ ジアルキルアミノ、C₁～C₄ アルキルチオ、C₁～C₄ ハロアルキルチオ、C₁～C₄ アルキルスルフィニル、C₁～C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ アルキルスルホニル又はC₁～C₄ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールであり；

20

R¹⁰、R¹¹及びR¹²が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ、C₁～C₄ ハロアルコキシ、C₁～C₄ アルキルアミノ、C₁～C₄ ジアルキルアミノ、C₁～C₄ アルキルチオ、C₁～C₄ ハロアルキルチオ、C₁～C₄ アルキルスルフィニル、C₁～C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ アルキルスルホニル又はC₁～C₄ ハロアルキルスルホニルである、請求項1に記載の化合物。

30

【請求項14】

式1の化合物（式中、

R¹が、C₁～C₆ アルキルであり、ここで、各アルキルが、1つ以上のR⁶で置換され；又は

R¹が、1～3つのR⁶で任意選択的に置換されるフェニルであり；

R²が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R²が、C₁～C₆ アルキルであり、ここで、各C₁～C₆ アルキルが、1つ以上のR⁶で任意選択的に置換され；又はR²が、C(O)R⁷、C(O)OR⁷、C(O)NR⁷R⁸、NR⁷R⁸、OR⁷、S(O)_pR⁷、SO₂NR⁷R⁸、又はOS(O)₂R⁹であり；

40

R³が、水素、C₁～C₆ アルキル、C₂～C₆ アルケニル、C₂～C₆ アルキニル、又はC₃～C₆ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上のR⁶で任意選択的に置換され；

R⁴が、1つ以上のR⁶で任意選択的に置換されるC₁～C₆ アルキルであり；

R⁵が水素であり；

R⁶が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、CN、C(O)R⁷、C(O)OR⁷、C(O)NR⁷R⁸、NR⁷R⁸、OR⁷、NHC(O)NR⁷R⁸、OC(O)R⁷、OC(O)OR⁷、S(O)_pR⁷、SO₂NR⁷R⁸、OS(O)₂R⁹であり、又は

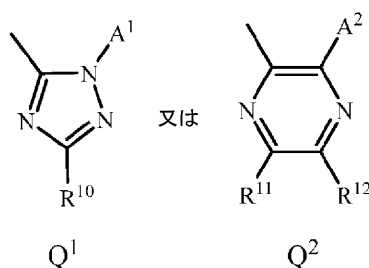
R⁶が、C₁～C₆ アルキル又はC₃～C₇ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル又はシクロアルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハ

50

ロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルから選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

R^7 、 R^8 及び R^9 が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；
Q が、

【化6】



であり、

A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールであり；

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである）。

【請求項15】

式1の化合物（式中、

R^1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、ここで、各アルキルが、1つ以上のハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネートで置換され；又は

R^1 が、1～3つのハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるフェニルであり；

R^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 C

$1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり；

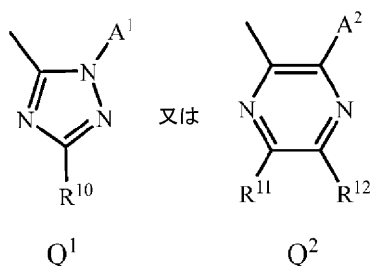
R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、又は $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^4 が、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

R^5 が水素であり；

Q が、

【化7】



であり、

A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールであり；

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである）。

【請求項16】

R^1 が、 CF_3 、又は1～3つのハロゲン、シアノ、 CF_3 、 OCH_3 又は OCF_3 で任意選択的に置換されるフェニルであり；

R^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、又は $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキルであり；

R^4 が、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

R^5 が水素であり；

Q が、

10

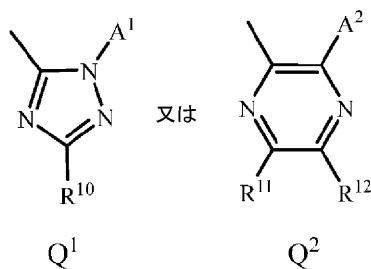
20

30

40

50

【化 8】



10

であり、

A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで任意選択的に置換される、ピリジン又はピリミジンであり；

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

前記化合物が、

3-[(フェニルスルホニル)オキシ]-N-[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド；

20

3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；

3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；

3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；

3-クロロ-5-[(フェニルスルホニル)オキシ]-N-[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]ベンズアミド；

30

3-[(フェニルスルホニル)オキシ]-N-[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]ベンズアミド；

3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1-ジフルオロメタンスルホネート；

(S) 3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；(-) 鏡像異性体；

(R) 3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；(+) 鏡像異性体；

40

3-クロロ-5-[[[1-(シクロプロピルメチル)[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；

3-[[[1-(シクロプロピルメチル)[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；

(S) 3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート；(-) 鏡像異性体；

50

(R) 3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート; (+) 鏡像異性体;

3-フルオロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート;

3-ブromo-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート;

1, 1'-[5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-1, 3-フェニレン]ビス(1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート);

3-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1-ジフルオロメタンスルホネート;

3-クロロ-5-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1-ジフルオロメタンスルホネート;

3-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート;

3-[[エチル[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート;

3-クロロ-5-[[エチル[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート;

3-[[[1-(1S)-1-[1-[6-(アミノカルボニル)-4-ピリミジニル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート; 及び

3-クロロ-5-[[メチル[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルバモイル]フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート

からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

請求項1又は請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤から選択される少なくとも1つのさらなる成分を含む組成物であって、任意選択的に、少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤をさらに含む、組成物。

【請求項19】

前記少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤が、アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロペン、アミドフルメト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス-メチル、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ピフェントリン、ピフェナゼート、ピストリフルロン、ボレート、ブプロフェジン、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、カルゾール、クロラントラニリプロール、クロルフェナビル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クロマフェノジド、クロフェンテジン、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリン、シクロキサプリド、シフルメトフェン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、

10

20

30

40

50

シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジエルドリン、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメヒポ、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンブックス、エトキサゾール、酸化フェンブタスズ、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルエンズルホン、フルオピラム、フルピラジフロン、フルバリネート、タウフルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホスチアゼート、ハロフェノジド、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、殺虫石鹸、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メペルフルトリン、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メチオカルブ、メトミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノクロトホス、モノフルオロトリン、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオン-メチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ピリミカルブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルギット、プロトリフェンビュート、ピフルブミド、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフエン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルプロホス、スルホキサフル、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタプ-ナトリウム、チオキサザフェン、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシン、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウイルス及び昆虫病原性真菌から選択される、請求項 18 に記載の組成物。

10

20

30

40

50

【請求項 20】

無脊椎有害生物を防除するための方法であって、前記無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の、請求項 1 又は請求項 1～19 のいずれか一項に記載の化合物と接触させることを含む方法。

【請求項 21】

処理前の種子の約 0.0001～1 重量%の量で請求項 1 に記載の化合物を含む、処理された種子。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

関連出願の相互参照

本出願は、2022 年 4 月 14 日に出願された米国仮特許出願第 63/330,809 号の利益を主張するものである。

【0002】

本開示は、農学的又は非農学的使用に好適な特定のスルホネートベンズアミド化合物、それらの N-オキシド、塩及び組成物、並びに農学的及び非農学的環境の両方において節足動物などの無脊椎有害生物を防除するためのそれらの使用方法に関する。

【背景技術】

【0003】

無脊椎有害生物を防除することは、高い収穫効率を達成するには、極めて重要である。生育中及び貯蔵される農作物に対する無脊椎有害生物による被害は、生産性を著しく低下させ、それによって、消費者に対してコスト上昇をもたらす原因となりうる。森林、温室作物、観賞植物、苗作物、貯蔵食品及び繊維製品、家畜、家庭用、芝、木材製品、並びに

公衆衛生及び動物衛生においても無脊椎有害生物の防除は重要である。これらの目的のために、多くの製品が市販されているが、効果がより高く、コストがより低く、毒性がより低く、環境的により安全であるか、又は異なった作用機構を有する新規な化合物が、依然として必要とされている。

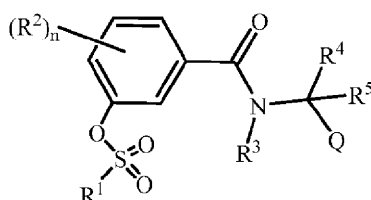
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0004】

本開示は、式1の化合物（それらの全ての幾何異性体及び立体異性体、N-オキシド、及び塩を含む）、及びそれらを含む組成物、並びに無脊椎有害生物を防除するためのそれらの使用に関する：

【化1】



1

式中、

R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で置換され；又は

R^1 が、1～3つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び3個以下の窒素原子から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各5員～6員芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

ただし、 R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである場合、 R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル以外であり；

R^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R^2 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

R^2 が、フェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び3個以下の窒素原子から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

R^2 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ であり；

R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

R^3 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $S(O)_pR^7$ 又は $SO_2NR^7R^8$ であり；

R^4 が、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アル

10

20

30

40

50

ケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；
 R^5 が、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；又は R^4 及び R^5 が、一緒になって、3～6員炭素環式環を形成することができ；

R^6 が、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の X^1 で任意選択的に置換され；又は

R^6 が、フェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び3個以下の窒素原子から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環、又は炭素原子並びに2個以下の酸素、2個以下の硫黄、及び2個以下の窒素原子から独立して選択される1～5個のヘテロ原子から選択される環員を含有する3員～6員非芳香族複素環であり、ここで、各フェニル、5員～6員芳香族複素環又は3員～6員非芳香族複素環が、1つ以上の X^1 で任意選択的に置換され；又は

R^6 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ であり；

R^7 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

R^7 が、フェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び3個以下の窒素原子から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は5員～6員芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^8 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、又は $C_2 \sim C_6$ アルキニルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、又はアルキニルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^9 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は

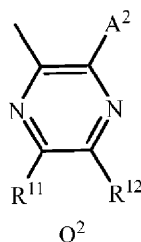
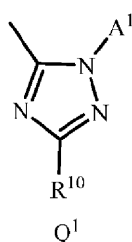
R^9 が、フェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び1～3個の窒素から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は5員～6員芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

n が、0～4であり；

p が、0～2であり；

Q が、 Q^1 又は Q^2 であり；

【化2】



A^1 及び A^2 が、炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び1～3個の窒素から独立

して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各5員～6員芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され； R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、1～3つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び1～3個の窒素から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各5員～6員芳香族複素環が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

又は

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2N_pR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ であり；

X^1 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、CHO、 CO_2H 、 $CO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $CO_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $C(O)NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $C(O)N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $O(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ 、 $NHC(O)NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $NHC(O)N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $OC(O)(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $OCO_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ 、 $SO_2NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $SO_2N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $OS(O)_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $OS(O)_2(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ であり；又は

X^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル又は $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキルであり；ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上のハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、CHO、 CO_2H 、 $CO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $CO_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $C(O)NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $C(O)N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $O(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ 、 $NHC(O)NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $NHC(O)N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $OC(O)(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $OCO_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ 、 $SO_2NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $SO_2N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、又は $OS(O)_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $OS(O)_2(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ で任意選択的に置換され；又は

X^1 が、フェニル、又は炭素原子並びに1個の酸素、1個の硫黄、及び1～3個の窒素から独立して選択される1～3個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5員芳香族複素環、又は炭素原子及び1～2個の窒素原子から選択される環員を含有する6員芳香族複素環であり、ここで、各フェニル又は5員～6員芳香族複素環が、1つ以上のハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、CHO、 CO_2H 、 $CO(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $CO_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $C(O)NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $C(O)N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $O(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ 、 $NHC(O)NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $NHC(O)N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、 $OC(O)(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $OCO_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $S(O)_p(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ 、 $SO_2NH(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $SO_2N(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})_2$ 、又は $OS(O)_2(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $OS(O)_2(C_1 \sim C_4 \text{ハロアルキル})$ で任意選択的に置換される。

【0005】

本開示はまた、式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つのさらなる成分を含む組成物を提供する。一実施形態において、本開示はまた、式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つのさらなる成分を含む、無脊椎有害生物を防除するための組成物であって、任意選択的に、少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤をさらに含む、組成物を提供する。

【0006】

本開示はまた、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、（例えば、本明細書に記載される組成物として）と接触させることを含む、方法を提供する。本開示はまた、無脊椎有害生物又はその環境が、生物学的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つのさらなる成分を含む組成物であって、任意選択的に、生物学的に有効な量の少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤をさらに含む、組成物と接触される、このような方法に関する。

10

【0007】

本開示はまた、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の上記の組成物のいずれかと接触させることを含み、環境が植物である、方法を提供する。

20

【0008】

本開示はまた、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の上記の組成物のいずれかと接触させることを含み、環境が動物である、方法を提供する。

【0009】

本開示はまた、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の上記の組成物のいずれかと接触させることを含み、環境が種子である、方法を提供する。

【0010】

本開示はまた、無脊椎有害生物から種子を保護するための方法であって、種子を、生物学的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、（例えば、本明細書に記載される組成物として）と接触させることを含む方法を提供する。本開示はまた、処理された種子（すなわち、式1の化合物と接触された種子）に関する。

30

【0011】

本開示はまた、作物植物の活力を増加させるための方法であって、作物植物、作物植物が成長する種子又は作物植物の場所（例えば、成長培地）を、生物学的に有効な量の式1の化合物（例えば、本明細書に記載される組成物として）と接触させることを含む方法を提供する。

【0012】

本開示はさらに、無脊椎寄生性有害生物から動物を保護するための方法であって、殺寄生生物的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、（例えば、本明細書に記載される組成物として）を動物に投与することを含む方法を提供する。本開示はまた、無脊椎有害生物からの動物の保護における、式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、（例えば、本明細書に記載される組成物として）の使用を提供する。

40

【発明を実施するための形態】

【0013】

本明細書で使用される際、「含む (comprises)」、「含む (comprising)」、「含む (includes)」、「含む (including)」、「有する (has)」、「有する (having)」、「含有する (contains)」、「

50

含有する (containing)」、「を特徴とする (characterized by)」という用語、又はそれらのいずれかの変化形は、明示されたいずれかの制限を受ける、非排他的包含を含むことが意図される。例えば、要素のリストを含む組成、混合物、プロセス又は方法は、必ずしもそれらの要素のみに限定されず、明確に列挙されていない又はこのような組成、混合物、プロセス又は方法に固有の他の要素を含み得る。

【0014】

「からなる (consisting of)」という移行句は、特定されていない、いずれの要素、工程又は成分も除外する。請求項における場合、そのようなものは、それに通常関連した不純物は別として、列挙されたものの以外の物質の包含に対して請求項を閉ざすであろう。「からなる」という語句が、前文の直後ではなく、請求項の本文の条項の中に現れている場合、それは、その条項に示された要素のみを限定し；他の要素は、全体として、その請求項から除外されない。

【0015】

「から本質的になる (consisting essentially of)」という移行句は、文字どおり開示されたものに加えて、物質、ステップ、特徴、成分、又は要素を含む組成又は方法を定義するために用いられ、ただし、これらのさらなる物質、ステップ、特徴、成分、又は要素は、特許請求される開示の基本的な且つ新規な特性に、実質的に影響を及ぼさないことを条件とする。「から本質的になる」という用語は、「含む」と「からなる」との中間を占める。

【0016】

本出願人が実施形態又はその一部を例えば「含む」などのオープンエンド用語で定義した場合、その記述は、(矛盾する記載がない限り)「から本質的になる」又は「からなる」の用語を使用するこのような実施形態も記述していると解釈するべきであることが容易に理解されるべきである。

【0017】

さらに、矛盾する明確な記載がない限り、「又は」は、包括的な「又は」を指し、排他的な「又は」を指すものではない。例えば、条件「A 又は B」は、以下のいずれか 1 つにより満たされる：A が真であり (又は存在し)、且つ B が偽である (又は存在しない)、A が偽であり (又は存在しない)、且つ B が真である (又は存在する) 及び A と B との両方が真である (又は存在する)。

【0018】

さらに、本開示の要素又は成分に先行する不定冠詞「1 つの (a)」及び「1 つの (an)」は、その要素又は成分の場合 (すなわち出現) の数に関して非限定的であるものとする。したがって、「1 つの (a)」又は「1 つの (an)」は、1 つ又は少なくとも 1 つを含むと読み取るべきであり、その要素又は成分の単数形は、その数が単数を意味することが明らかでない限り、複数も含む。

【0019】

本開示において言及される場合、「無脊椎有害生物」という用語は、有害生物として経済的に重要な節足動物、腹足類、線虫及び寄生蠕虫を含む。「節足動物」という用語は、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ、ヤスデ、ダンゴムシ及びコムカデ綱 (symphylla) を含む。「腹足類」という用語は、カタツムリ、ナメクジ及び他の柄眼目 (Stylommatophora) を含む。「線虫」という用語は、線形動物門 (Nematoda)、例えば、植食性線虫及び寄生蠕虫線虫寄生動物のメンバーを含む。「寄生蠕虫」という用語は、寄生虫、例えば、回虫 (線形動物門 (Nematoda))、犬糸状虫 (線形動物門 (Nematoda))、双腺綱 (Secernentea)、吸虫 (扁形動物門 (Platyhelminthes))、吸虫綱 (Trematoda)、鉤頭虫 (鉤頭虫門 (Acanthocephala))、及び条虫 (扁形動物門 (Platyhelminthes))、条虫綱 (Cestoda) の全てを含む。

【0020】

本開示に関して、「無脊椎有害生物防除」は、無脊椎有害生物発育の抑制 (死亡率、摂

10

20

30

40

50

食減少、及び／又は交配攪乱を含む）を意味し、関連する表現が、同様に定義される。

【0021】

「農学的」という用語は、食品及び繊維などの農作物の製造を指し、トウモロコシ又はコーン、ダイズ及び他のマメ科植物、イネ、穀物（例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦及びイネ）、葉野菜（例えば、レタス、キャベツ及び他の葉作物）、果菜（例えば、トマト、トウガラシ、ナス、アブラナ科植物（*crucifers*）及びウリ科植物（*cucurbits*））、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、綿、果樹（例えば、ナシ状果、核果及び柑橘類）、小果樹（例えば、ベリー及びサクランボ）並びに他の特殊農作物（例えば、キャノーラ、ヒマワリ及びオリーブ）の成長を含む。

【0022】

「非農学的」という用語は、園芸作物（例えば、畑で生育しない温室、苗床又は観賞植物）、住居用、農業用、商用及び工業用構造、芝（例えば、芝農場、牧草地、ゴルフコース、芝生、競技場など）、木材製品、貯蔵製品、植林業及び植生管理、公衆衛生（すなわちヒト）及び動物衛生（例えば、家畜化した動物、例えばペット、家畜及び家禽、野生生物などの飼育慣らされていない動物）用途などの農作物以外を指す。

【0023】

「作物の活力」という用語は、作物植物の成長又はバイオマス堆積の速度を指す。「活力の増加」は、非処理の対照作物植物と比較した作物植物における成長又はバイオマス堆積の増加を指す。「作物収穫高」という用語は、作物植物を収穫した後に得られる量及び質の両方に関する作物材料の収穫を指す。「作物収穫高の増加」は、非処理の対照作物植物と比較した作物収穫高の増加を指す。

【0024】

「生物学的に有効な量」という用語は、無脊椎有害生物による損傷から植物を保護するため又は他の所望の効果（例えば、植物活力の増加）のために、防除される無脊椎有害生物若しくはその環境又は植物、植物が成長する種子若しくは植物の場所（例えば、成長媒体）への施用（すなわち接触）時、所望の生物学的効果を発生するために十分な生物活性化合物（例えば、式1の化合物）の量を指す。

【0025】

非農学的用途は、殺寄生生物学的に有効な（すなわち、生物学的に有効な）量の本開示の化合物を、典型的に、動物用に配合された組成物の形態で、保護される動物に投与することによって、無脊椎寄生性有害生物から動物を保護することを含む。本開示及び特許請求の範囲において言及される際、「殺寄生生物学的」及び「殺寄生生物学的に」という用語は、有害生物からの動物の保護を提供するための、無脊椎寄生有害生物に対する観察可能な効果を指す。殺寄生生物学的効果は、典型的に、標的無脊椎寄生性有害生物の発生又は活性を減少させることに関する。有害生物に対するこのような効果としては、壊死、死亡、発育遅延、運動性の低下又は宿主動物上又は宿主動物内に留まる能力の低下、摂食の減少及び生殖の阻害が挙げられる。無脊椎寄生有害生物に対するこれらの効果は、動物の寄生生物の繁殖又は感染の防除（防止、減少又は排除を含む）を提供する。

【0026】

構造断片中の波線は、分子の残部への断片の結合点を示す。例えば、式1中の変数Qが、Q-1として定義される場合、Q-1中の結合を二等分する波線は、Q-1が、前記位置において式1の構造の残部に結合されることを意味する。

【0027】

上の説明における、単独、又は「アルキルチオ」又は「ハロアルキル」などの化合物用語で使用される、「アルキル」という用語には、直鎖状又は分枝状アルキル、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、又は各種のブチル、ペンチル若しくはヘキシル異性体が含まれる。「アルケニル」には、直鎖状又は分枝状アルケン、例えば、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、並びに各種のブテニル、ペンテニル、及びヘキセニル異性体が含まれる。「アルケニル」は、1, 2-プロパジエニル及び2, 4-ヘキサジエニルなどのポリエンも含む。「アルキニル」には、直鎖状又は分岐状のアルキン、

10

20

30

40

50

例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、並びに各種のブチニル、ペンチニル及びヘキシニル異性体が含まれる。「アルキニル」は、複数の三重結合、例えば2, 5-ヘキサジイニルを含む部分も含み得る。「アルキレン」は、直鎖状又は分枝状アルカンジイルを示す。「アルキレン」の例は、 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 及び各種のブチレン異性体を含む。「アルケニレン」は、1つのオレフィン結合を含有する直鎖状又は分枝状アルケンジイルを示す。「アルケニレン」の例は、 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 及び各種のブテニレン異性体を含む。「アルキニレン」は、1つの三重結合を含有する直鎖状又は分枝状アルキンジイルを示す。「アルキニレン」の例は、 $\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 及び各種のブチニレン異性体を含む。

10

【0028】

「アルキルアミノ」は、直鎖状又は分枝状アルキルで置換されたNH基を含む。「アルキルアミノ」の例は、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ 、及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHNH}$ を含む。「ジアルキルアミノ」の例は、 $(\text{CH}_3)_2\text{N}$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{N}$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$ を含む。「アルケニルアミン」は、直鎖状又は分枝状アルケンで置換されたNH基を含む。「アルケニルアミン」の例は、 $\text{CH}_2=\text{CHNH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}=\text{CHNH}$ 並びに各種のブテニルアミン、ペンテニルアミン及びヘキセニルアミン異性体を含む。「アルキニルアミン」は、直鎖状又は分枝状アルキンで置換されたNH基を含む。「アルキニルアミン」の例は、 $\text{HC}\equiv\text{CNH}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{NH}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}\equiv\text{CNH}$ 並びに各種のブチニルアミン、ペンチニルアミン及びヘキシニルアミン異性体を含む。

20

【0029】

「アルコキシ」には、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、並びに各種のブトキシ、ペントキシ、及びヘキシロキシ異性体が含まれる。「アルコキシアルキル」は、アルキル上のアルコキシ置換を示す。「アルコキシアルキル」の例は、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ を含む。

【0030】

「アルキルチオ」には、分枝状又は直鎖状アルキルチオ残基、例えば、メチルチオ、エチルチオ、並びに各種のプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオ、及びヘキシルチオ異性体が含まれる。「アルキルスルフィニル」は、アルキルスルフィニル基の両方の鏡像異性体を含む。「アルキルスルフィニル」の例は、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ 、並びに各種のブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、及びヘキシルスルフィニル異性体を含む。「アルキルスルホニル」の例は、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ 、並びに各種のブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、及びヘキシルスルホニル異性体を含む。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上のアルキルチオ置換を示す。「アルキルチオアルキル」の例は、 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ を含む。

30

40

【0031】

「アルキルカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$ 部分に結合した直鎖状又は分枝状アルキル部分を意味する。「アルキルカルボニル」の例は、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ 、及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$ を含む。「アルコキシカルボニル」の例は、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ 、並びに各種のブトキシカルボニル、ペントキシカルボニル及びヘキソキシカルボニル異性体を含む。

【0032】

「アルキルアミノカルボニル」という用語は、 $\text{C}(=\text{O})$ 基に結合し、それを通して連結する直鎖状又は分枝状アルキルアミノを示す。「アルキルアミノカルボニル」の例は、

50

$\text{CH}_3\text{NHC}(\text{=O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(\text{=O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(\text{=O})$ 及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(\text{=O})$ を含む。「ジアルキルアミノカルボニル」の例は、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{=O})$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(\text{=O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{=O})$ 及び $(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NC}(\text{=O})$ を含む。「アルケニルアミノカルボニル」という用語は、 $\text{C}(\text{=O})$ 基に結合し、それを通して連結する直鎖状又は分枝状アルケニルアミノを示す。「アルケニルアミノカルボニル」の例は、 $\text{CH}_2=\text{CHNHC}(\text{=O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{NHC}(\text{=O})$ 及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}=\text{CHNHC}(\text{=O})$ を含む。「アルキニルアミノカルボニル」という用語は、 $\text{C}(\text{=O})$ 基に結合し、それを通して連結する直鎖状又は分枝状アルキニルアミノを示す。「アルキニルアミノカルボニル」の例は、 $\text{HC}\equiv\text{CNHC}(\text{=O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}\equiv\text{CCH}_2\text{NHC}(\text{=O})$ 及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}\equiv\text{CNHC}(\text{=O})$ を含む。

10

【0033】

「シクロアルキル」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルを含む。「アルキルシクロアルキル」という用語は、シクロアルキル残基の上でのアルキル置換を示し、例えば、エチルシクロプロピル、 i -プロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチル、及び4-メチルシクロヘキシルを含む。「シクロアルキルアルキル」という用語は、アルキル部分上のシクロアルキル置換を示す。「シクロアルキルアルキル」の例は、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルメチル及び直鎖状又は分枝状アルキル基に結合された他のシクロアルキル部分を含む。「シクロアルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合されたシクロアルキル、例えばシクロペンチルオキシ及びシクロヘキシロキシを示す。「シクロアルキルアミノ」は、シクロアルキルで置換されたNH基を示す。「シクロアルキルアミノ」の例は、シクロプロピルアミノ及びシクロヘキシルアミノを含む。「シクロアルキルアミノカルボニル」は、 $\text{C}(\text{=O})$ 基に結合したシクロアルキルアミノを示し、例えばシクロペンチルアミノカルボニル及びシクロヘキシルアミノカルボニルを含む。

20

【0034】

「ハロゲン」という用語は、単独で又は「ハロアルキル」などの化合物用語内若しくは「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載において使用される場合、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で使用される場合又は「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載において使用される場合、前記アルキルは、同じであるか又は異なり得るハロゲン原子で部分的に又は完全に置換され得る。「ハロアルキル」又は「ハロゲンで置換されたアルキル」の例は、 $\text{F}_3\text{C}-$ 、 ClCH_2- 、 CF_3CH_2- 及び CF_3CCl_2- を含む。「ハロシクロアルキル」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」、「ハロアルキルカルボニル」、「ハロアルコキシカルボニル」、「ハロアルキルアミノカルボニル」、「ハロジアルキルアミノカルボニル」などの用語は、「ハロアルキル」の用語と同様に定義される。「ハロアルコキシ」の例は、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、及び $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ を含む。「ハロアルキルチオ」の例は、 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ 、及び $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ を含む。「ハロアルキルスルフィニル」の例は、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、及び $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$ を含む。「ハロアルキルスルホニル」の例は、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、及び $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$ を含む。

30

40

【0035】

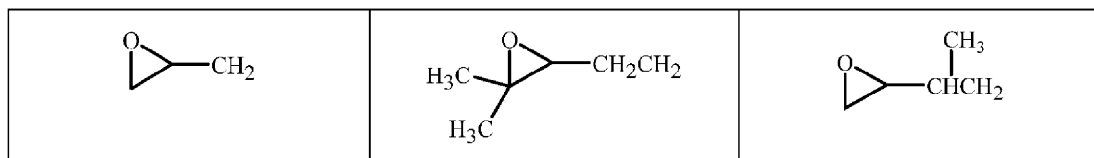
本明細書で使用される化学略語 $\text{S}(\text{O})$ 及び $\text{S}(\text{=O})$ は、スルフィニル部分を表す。本明細書で使用される化学略語 SO_2 、 $\text{S}(\text{O})_2$ 及び $\text{S}(\text{=O})_2$ は、スルホニル部分を表す。本明細書で使用される化学略語 $\text{C}(\text{O})$ 及び $\text{C}(\text{=O})$ は、カルボニル部分を表す。本明細書で使用される化学略語 $\text{C}(\text{S})$ 及び $\text{C}(\text{=S})$ は、チオカルボニル部分を表す。本明細書で使用される化学略語 CO_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ 及び $\text{C}(\text{=O})\text{O}$ は、オキシカルボニル部分を表す。「CHO」は、ホルミルを意味する。

【0036】

50

「オキシラニルアルキル」は、直鎖状又は分枝状アルキル基上のオキシラン置換を示す。「オキシラニルアルキル」の例は、限定はされないが、以下を含む。

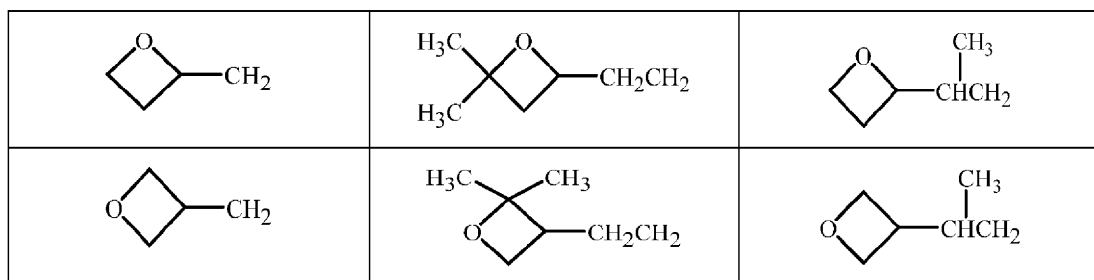
【化 3】



【0037】

「オキシタニルアルキル」は、直鎖状又は分枝状アルキル基上のオキシタン置換を示す。「オキシタニルアルキル」の例は、限定はされないが、以下を含む。

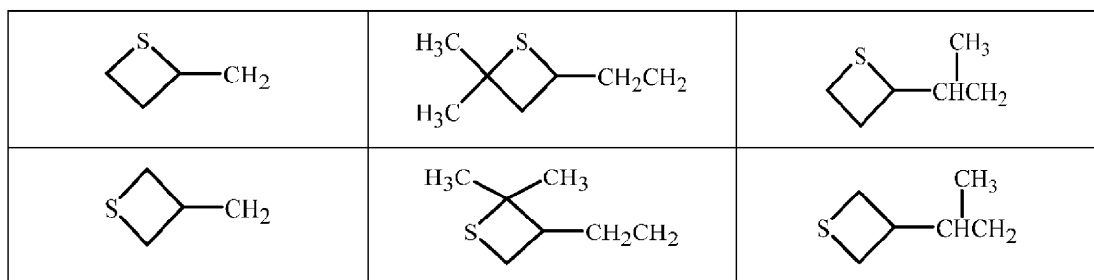
【化 4】



【0038】

「チエタニルアルキル」は、直鎖状又は分枝状アルキル基上のチエタン置換を示す。「チエタニルアルキル」の例は、限定はされないが、以下を含む。

【化 5】



【0039】

置換基の中の炭素原子の合計数は、「 $C_i \sim C_j$ 」の接頭表記によって示されるが、ここで i 及び j は、1～9の数である。例えば、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからブチルスルホニルまでを表し； C_2 アルコキシアルキルは、 CH_3OCH_2- を表し； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $CH_3CH(OCH_3)-$ 、 $CH_3OCH_2CH_2-$ 、又は $CH_3CH_2OCH_2-$ を表し； C_4 アルコキシアルキルは、合計で4個の炭素原子を含むアルコキシ基で置換されたアルキル基の各種の異性体を表し、例としては、 $CH_3CH_2CH_2OCH_2-$ 、及び $CH_3CH_2OCH_2CH_2-$ が挙げられる。

【0040】

ある化合物が、前記置換基の数が1を超えることが可能であることを示す下付文字を担持する置換基で置換される場合、前記置換基（それらが1を超える場合）は、独立して、定義された置換基の群、例えば、 $([R^3]_m)$ 、 m は、0、1、又は2）から選択される。ある基が、水素であることが可能な置換基、例えば $(R^2$ 又は $R^{12})$ を含有する場合、すなわち、この置換基が水素と見なされる場合、これは、前記基が非置換であるこ

10

20

30

40

50

とと等価であることが認められる。可変基がある位置に任意選択的に結合していることが示されている場合、例えば、 m が0であり得る (R^3)_m、すなわち水素は、たとえ可変基の定義において列挙されていなくてもその位置にあり得る。基の上の1つ以上の位置が「置換されていない」又は「非置換である」と記載される場合、水素原子は、任意の自由原子価を占めるように結合される。

【0041】

特記されない限り、式1の成分としての「環」又は「環系」（例えば Q^1 ）は、炭素環式又は複素環式である。「環系」という用語は、2つ以上の縮合環を示す。「二環式環系」及び「縮合二環式環系」という用語は、「オルト縮合」、「架橋二環式」又は「スピロ二環式」であり得る、2つの縮合環からなる環系を示す。「オルト縮合二環式環系」は、2つの構成環が、共通の2つの隣接する原子を有する環系を示す。「架橋二環式環系」は、1つ以上の原子のセグメントを、環の非隣接環員に結合することによって形成される。「スピロ二環式環系」は、2個以上の原子のセグメントを、環の同じ環員に結合することによって形成される。「縮合ヘテロ二環式環系」という用語は、少なくとも1つの環原子が炭素でない縮合二環式環系を示す。「環員」という用語は、環又は環系の主鎖を形成する原子又は他の部分（例えば、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)$ 又は $S(O)_2$ ）を指す。

10

【0042】

「炭素環式環」、「炭素環」又は「炭素環式環系」という用語は、環主鎖を形成する原子が炭素のみから選択される環又は環系を示す。「複素環式環」、「複素環」又は「複素環系」という用語は、環主鎖を形成する少なくとも1つの原子が炭素でない、例えば、窒素、酸素又は硫黄である環又は環系を示す。典型的に、複素環式環は、4個以下の窒素、2個以下の酸素及び2個以下の硫黄を含有する。特記されない限り、炭素環式環又は複素環式環は、飽和又は不飽和環であり得る。「飽和」は、単結合によって互いに連結した炭素原子からなる主鎖を有する環を指し、特記されない限り、残りの原子価は、水素原子によって占有される。特記されない限り、「不飽和環」は、部分的に不飽和又は完全に不飽和であり得る。「完全不飽和環」という表現は、環中の原子間の結合が、原子価結合法に従って単結合又は二重結合であり、さらに、環中の原子間の結合が、重複する二重結合なし（すなわち、 $C=C=C$ 又は $C=C=N$ なし）で可能な限り多くの二重結合を含む、原子の環を意味する。「部分的に不飽和の環」という用語は、二重結合を介して隣接する環員に結合された少なくとも1つの環員を含み、存在するいくつかの二重結合（すなわち、その部分的に不飽和の形態で）より多く、隣接する環員間にいくつかの非重複二重結合を概念上潜在的に受け入れる（すなわち、その完全に不飽和の対応する形態で）環を示す。

20

30

【0043】

特記されない限り、複素環及び環系は、炭素又は窒素上での水素の置換により、いずれかの利用可能な炭素又は窒素によって結合され得る。

【0044】

「芳香族」は、各環原子が本質的に同一平面にあり、環平面に対して垂直である p 軌道を有し、ヒュッケル則に従って $(4n+2)$ π 電子 (n は、正の整数である) が環と関連することを示す。「芳香環系」という用語は、環系の少なくとも1つの環が芳香族である炭素環式又は複素環式環系を示す。完全不飽和炭素環式環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「芳香環」又は芳香族炭素環式環とも呼ばれる。

40

「芳香族炭素環式環系」という用語は、環系の少なくとも1つの環が芳香族である炭素環式環系を示す。完全不飽和複素環式環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「芳香族複素環」又は芳香族複素環式環とも呼ばれる。「芳香族複素環式環系」という用語は、環系の少なくとも1つの環が芳香族である複素環式環系を示す。「非芳香環系」という用語は、完全飽和、並びに又は完全不飽和であり得、ただし、環系の環のいずれも芳香族でない炭素環式又は複素環式環系を示す。「非芳香族炭素環式環系」という用語は、環系中のいずれの環も芳香族でない炭素環式環を示す。「非芳香族複素環式環系」という用語は、環系中のいずれの環も芳香族でない複素環式環系を示す。

50

【0045】

複素環式環に関連する「任意選択的に置換される」という用語は、非置換であるか、又は非置換の類似体によって保持されている生物活性を消失させることがない、少なくとも1つの非水素置換基を有する基を指す。本明細書で使用される場合、特記されない限り、以下の定義が適用されるものとする。「任意選択的に置換される」という用語は、「置換若しくは非置換の」という語句、又は「(非)置換の」という用語と同義的に使用される。特記されない限り、任意選択的に置換される基は、その基のそれぞれの置換可能な位置に置換基を有してよく、それぞれの置換は互いに独立している。

【0046】

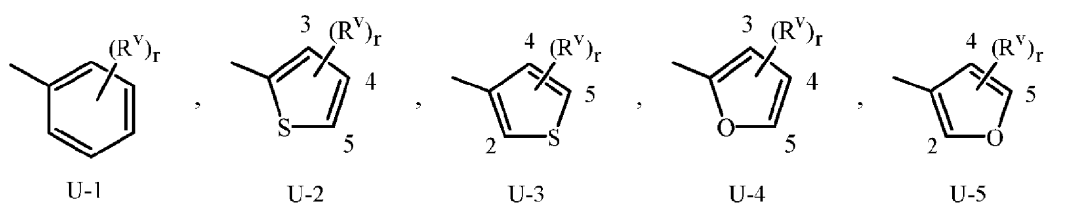
例えば R^1 などの置換基が、5員又は6員窒素含有複素環式環である場合、特に記載のない限り、利用可能な炭素又は窒素環原子を介して式1の残部に結合されていてもよい。上記のように、 R^1 が、概要において定義される置換基の群から選択される1～3つの置換基で任意選択的に置換される(とりわけ)フェニルであり得る。1～3つの置換基で任意選択的に置換されるフェニルの一例は、提示1においてU-1として示される環であり、ここで、 R^v が、 R^1 について概要に定義される X^1 であり、 r が、0～5の整数である。

【0047】

上記のように、 R^1 は、(とりわけ)飽和又は不飽和であり得、概要において定義される置換基の群から選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換される5員又は6員複素環式環であり得る。1つ以上の置換基で任意選択的に置換される5員又は6員の不飽和芳香族複素環式環の例は、 R^v が、 R^1 について概要において定義される任意の置換基(すなわち、 R_6)であり、 r が0～4の整数であり、各U基の利用可能な位置の数によって制限される、提示1に示される環U-2～U-61を含む。U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42及びU-43は、1つの利用可能な位置しか有さず、これらのUグループについて、 r は整数0又は1に限定され、 r が0であることは、Uグループが非置換であり、水素が $(R^v)_r$ によって示される位置に存在することを意味する。

【化6】

提示1



10

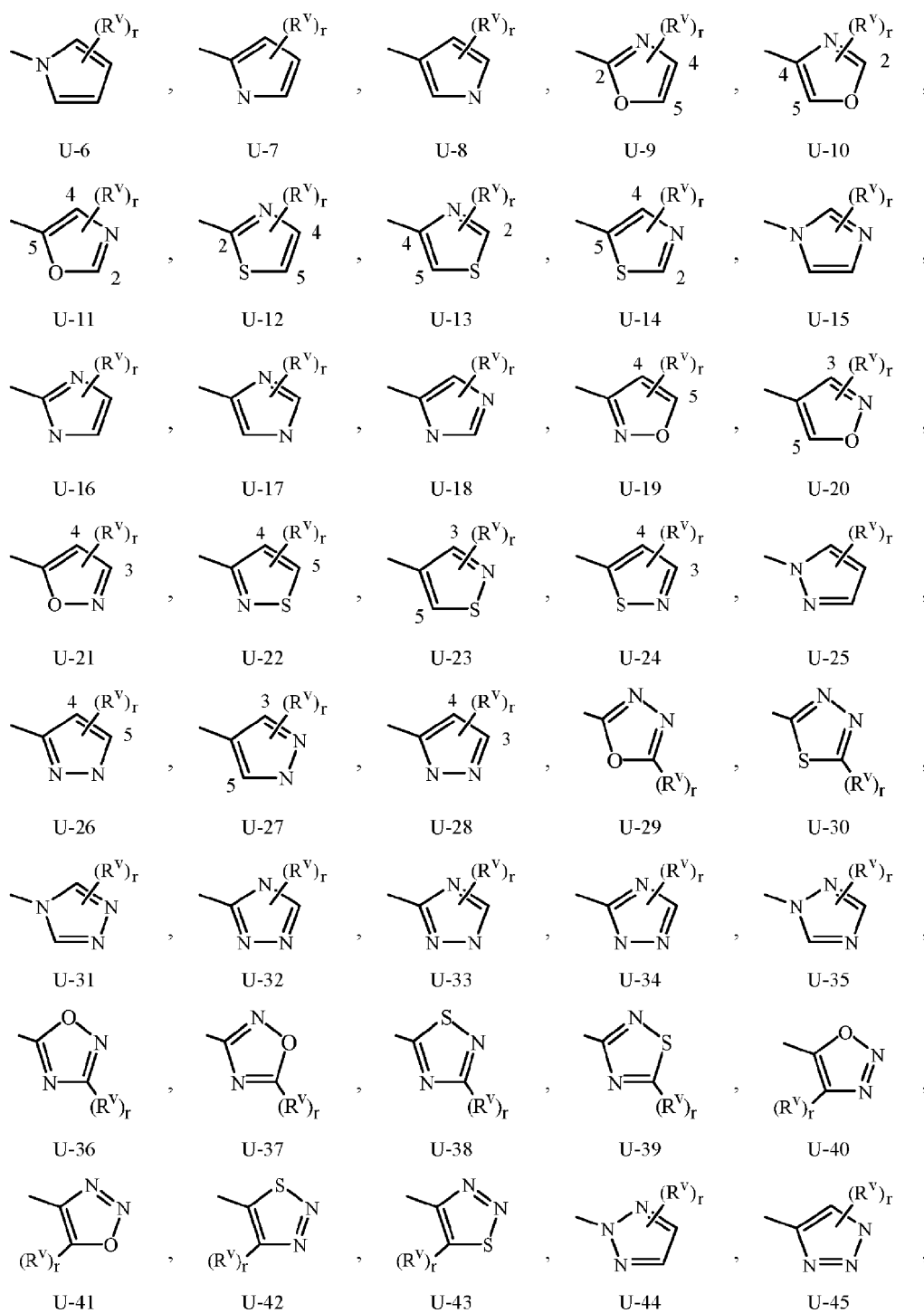
20

30

40

50

【化 7】



10

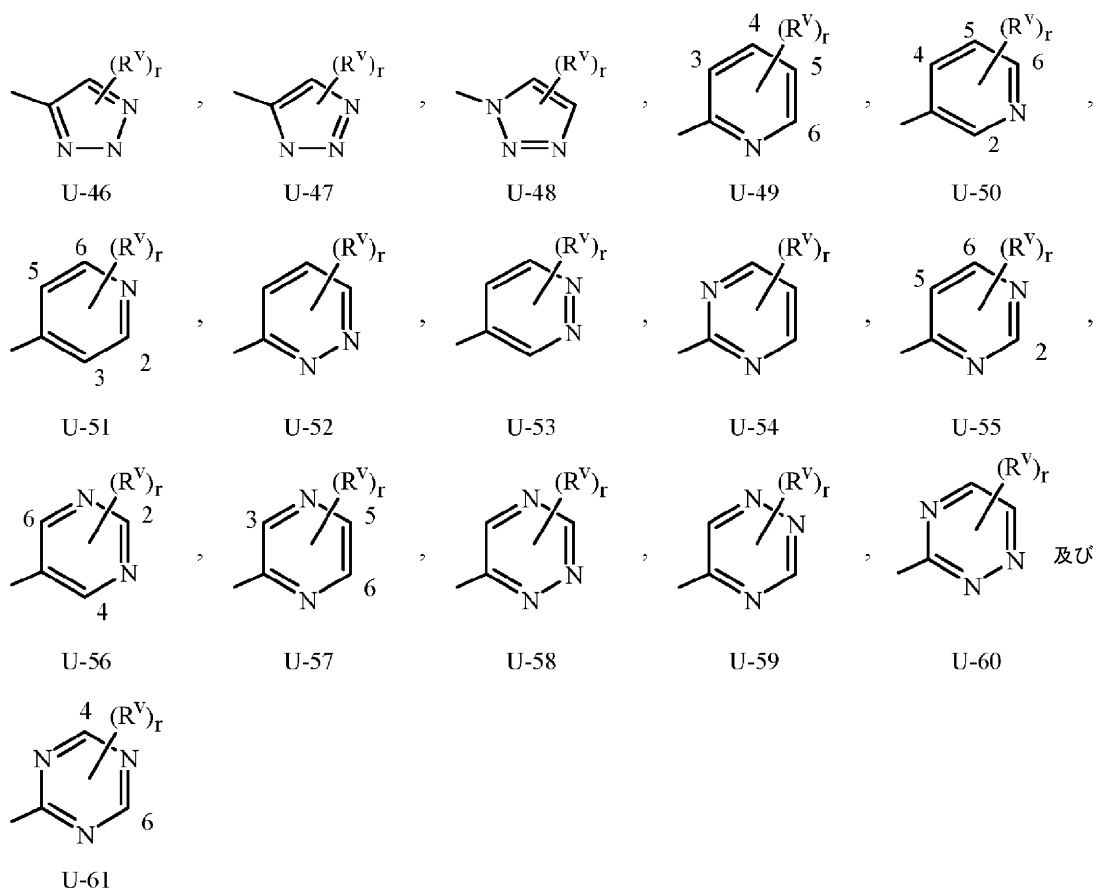
20

30

40

50

【化 8】



10

20

【0048】

例えば R^1 などの置換基が、 R^1 について概要において定義される置換基の群から選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換される5員又は6員の飽和又は不飽和非芳香族複素環である場合、複素環の1つ又は2つの炭素環員は任意選択的にカルボニル部分の酸化形態であり得ることに留意されたい。

30

【0049】

5員又は6員飽和又は非芳香族不飽和複素環の例は、提示2に示される環T-1～T-35を含む。T基上の結合点がフローティングとして示されている場合、T基は、水素原子の置換によって、T基の任意の利用可能な炭素又は窒素を介して式1の残部に結合することができることに留意されたい。 R^V に対応する任意の置換基は、水素原子を置換することによって任意の利用可能な炭素又は窒素に結合することができる。これらのT環について、 r は、典型的には0～4の整数であり、各T基上の利用可能な位置の数によって制限される。

【0050】

芳香族及び非芳香族複素環式環及び環系の調製を可能とする多種多様な合成方法が、当技術分野において公知である。詳しい総説については、以下の文献を参照されたい：Comprehensive Heterocyclic Chemistry (A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984) の8巻セット、並びに、Comprehensive Heterocyclic Chemistry II (A. R. Katritzky, C. W. Rees, and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996) の12巻セット。

40

【0051】

50

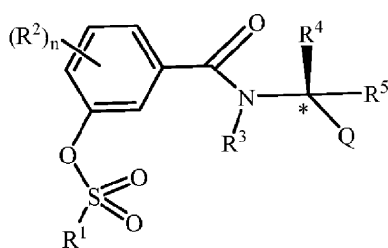
本開示の化合物は、1つ以上の立体異性体として存在可能である。立体異性体とは、同一の構成を有しているが、それらの原子の空間配置が異なっている異性体であって、鏡像異性体、ジアステレオマー、*cis-trans*異性体（幾何異性体とも呼ばれる）、及びアトロプ異性体が含まれる。アトロプ異性体は、単結合の回りでの束縛回転から生じるものであって、その回転の障壁が高いために、それらの異性体種を単離することが可能である。当業者のよく理解するところであろうが、1つの立体異性体が、他の立体異性体よりも高濃度にするか、又は他の立体異性体から分離するとき、反応性がより高くてもよく、及び／又は有利な効果を示してもよい。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

10

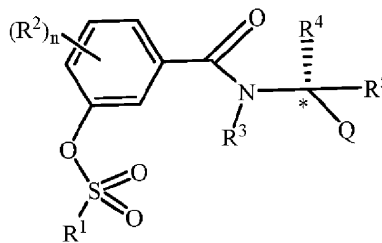
【0052】

本開示の化合物は、立体異性体の混合物又は個々の立体異性体として存在し得る。例えば、式1の2つの可能な鏡像異性体は、式1'及び式1''として示され、これらの式は、アスタリスク(*)によりR⁴を有する中心として特定される不斉中心を含む。式1'の化合物は、R⁴を有する中心における(−)鏡像異性体を指し、式1''の化合物は、R⁴を有する中心における(+)鏡像異性体を指す。

【化9】



式1'



式1''

20

【0053】

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

30

【0054】

本開示は、例えば、式1'及び1''の鏡像異性体を等量含む、ラセミ混合物を含む。さらに、本開示は、式1の鏡像異性体中のラセミ混合物と比較して富化された化合物を含む。式1の化合物の実質的に純粋な鏡像異性体、例えば式1'及び1''もまた含まれる。

40

【0055】

鏡像異性体的に富化させた場合、一方の鏡像異性体が、他のものよりも多い量で存在し、その濃縮の程度は、鏡像異性体過剰率(「ee」)の表現で定義することが可能であるが、それは、 $(2x - 1) \cdot 100\%$ として定義され、ここで、xは、その混合物の中で多い方の鏡像異性体のモル分率である(例えば、20%の「ee」は、60:40の鏡像異性体の比率に相当する)。本開示の組成物は、活性がより高い異性体の、好ましくは少なくとも50%の鏡像異性体過剰率；より好ましくは少なくとも75%の鏡像異性体過剰率；さらにより好ましくは少なくとも90%の鏡像異性体過剰率；最も好ましくは少なくとも94%の鏡像異性体過剰率を有する。特に注目すべきは、活性がより高い異性体の鏡像異性体的に純粋な実施形態である。本開示は、例えば、式1'及び1''の鏡像異性体を等

50

量含む、ラセミ混合物を含む。さらに、本開示は、式 1' 及び 1'' のラセミ混合物と比較して式 1' の鏡像異性体が富化された混合物を含む。本開示は、式 1' の実質的に純粋な鏡像異性体も含む。

【0056】

本開示の一実施形態は、1' 対 1'' の比率が、少なくとも 75 : 25 (1' の 50 % の鏡像異性体過剰率) である、式 1' 及び式 1'' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0057】

本開示の一実施形態は、1' 対 1'' の比率が、少なくとも 90 : 10 (1' の 80 % の鏡像異性体過剰率) である、式 1' 及び式 1'' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0058】

本開示の一実施形態は、1' 対 1'' の比率が、少なくとも 95 : 5 (1' の 90 % の鏡像異性体過剰率) である、式 1' 及び式 1'' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

10

【0059】

本開示の一実施形態は、1' 対 1'' の比率が、少なくとも 98 : 2 (1' の 96 % の鏡像異性体過剰率) である、式 1' 及び式 1'' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0060】

本開示の一実施形態は、1' 対 1'' の比率が、少なくとも 99 : 1 (1' の 98 % の鏡像異性体過剰率) である、式 1' 及び式 1'' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0061】

本開示の一実施形態は、1' 対 1'' の比率が、実質的に 100 : 0 である、式 1' 及び式 1'' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

20

【0062】

本開示の一実施形態は、式 1ⁱ の化合物を含む。

【0063】

さらに、本開示は、式 1'' 及び 1' のラセミ混合物と比較して式 1ⁱ 鏡像異性体が豊富化された混合物を含む。本開示は、式 1'' の実質的に純粋な鏡像異性体も含む。

【0064】

1'' 対 1' の比率が、少なくとも 75 : 25 (1'' の 50 % の鏡像異性体過剰率) である、本開示の一実施形態は、式 1'' 及び式 1' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0065】

1'' 対 1' の比率が、少なくとも 90 : 10 (1'' の 80 % の鏡像異性体過剰率) である、本開示の一実施形態は、式 1'' 及び式 1' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

30

【0066】

1'' 対 1ⁱ の比率が、少なくとも 95 : 5 (1'' の 90 % の鏡像異性体過剰率) である、本開示の一実施形態は、式 1'' 及び式 1' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0067】

1'' 対 1' の比率が、少なくとも 98 : 2 (1'' の 96 % の鏡像異性体過剰率) である、本開示の一実施形態は、式 1'' 及び式 1' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

【0068】

1'' 対 1' の比率が、少なくとも 99 : 1 (1'' の 98 % の鏡像異性体過剰率) である、本開示の一実施形態は、式 1'' 及び式 1' の化合物の立体異性体の混合物を含む。

40

【0069】

本開示の一実施形態は、式 1'' 及び式 1' の化合物の立体異性体の混合物を含む、1'' 対 1' の比率が、実質的に 100 : 0 である。

【0070】

本開示の一実施形態は、式 1'' の化合物を含む。

【0071】

当業者は、全ての窒素含有複素環が N-オキシドを形成できるわけではなく、なぜなら、その窒素が、酸化されてオキシドとなるには、利用可能な孤立電子対を必要とするためであることを理解するであろう。当業者は、N-オキシドを形成し得るそれらの窒素含有

50

複素環を認識するであろう。当業者は、第三級アミンがN-オキシドを形成し得ることも認識するであろう。複素環及び第三級アミンのN-オキシドを調製するための合成方法は、ペルオキシ酸、例えば過酢酸及び3-クロロ過安息香酸(MCPBA)、過酸化水素、アルキルヒドロペルオキシド、例えばt-ブチルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム並びにジオキシラン、例えばジメチルジオキシランを用いて、複素環及び第三級アミンを酸化させることも含めて、当業者に周知である。N-オキシドを調製するためのこれらの方法は、文献に広く記述され、総説されており、例えば以下の文献を参照されたい：T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp. 748-750 (S. V. Ley, Ed., Pergamon Press); M. Tisler and B. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp. 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp. 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; 及び G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp. 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

10

20

30

40

50

【0072】

当業者は、環境内及び生理学的条件下で、化合物の塩が、それらに相当する非塩の形態とは平衡関係にあるため、塩は、その非塩の形態と、生物学的実用性を共有していることを認識している。したがって、式1の化合物の多種多様な塩が、無脊椎有害生物を防除するのに有用である。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸又は吉草酸などの、無機酸又は有機酸との酸付加塩が挙げられる。式1の化合物が、カルボン酸又はフェノールなどの酸性部分を含む場合、塩としてはさらに、ピリジン、トリエチルアミン若しくはアンモニア、又はアミド、水素化物、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム、若しくはバリウムの水酸化物又は炭酸塩などの、有機又は無機の塩基を用いて形成されたものが含まれる。したがって、本開示は、式1から選択される化合物、それらのN-オキシド及び好適な塩を含む。

【0073】

式1から選択される化合物、それらの立体異性体、互変異性体、N-オキシド及び塩は、典型的には、2つ以上の形態で存在し、したがって、式1は、式1が表す化合物の全ての結晶性及び非晶質形態を含む。非晶質の形態は、固体である実施形態、例えばワックス及びゴム、さらに液体である実施形態、例えば溶液及び熔融物を含む。結晶性の形態は、実質的に単結晶タイプを表す実施形態及び多形の混合物（すなわち複数の結晶性タイプ）を表す実施形態を含む。「多形」という用語は、種々の結晶性の形態で結晶化し得る、化合物の特定の結晶性の形態を指し、これらの形態は、結晶格子中での種々の分子の配列及び／又は配座を有する。複数の多形は、同一の化学組成を有することできるが、それらはまた、その格子中に弱く又は強く結合され得る共結晶された水又は他の分子の存否によって組成が異なり得る。多形は、結晶の形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度及び生物学的利用能のような化学的、物理的及び生物学的性質の面で異なり得る。当業者は、式1によって表される化合物の特定の多形が、式1によって表されるものと同じ化合物の他の多形又は多形の混合物と比較して、有利な効果（例えば、有用な配合を調製する際の適合性、改良された生物学的性能）を示し得ることを理解す

るであろう。式 1 によって表される化合物の特定の多形の調製及び単離は、例えば、選択された溶媒及び温度を使用する結晶化など、当業者に公知の方法によって達成することができる。本開示の化合物は、1 つ以上の結晶性の多形として存在し得る。本開示は、個々の多形及び多形の混合物（1 つの多形が他の多形と比較して富化された混合物を含む）の両方を含む。多形についての包括的な説明に関しては、次の文献を参照されたい：R. H i l f i k e r, E d., P o l y m o r p h i s m i n t h e P h a r m a c e u t i c a l I n d u s t r y, W i l e y - V C H, W e i n h e i m, 2 0 0 6。

【0074】

概要に記載される本開示の実施形態は、以下に記載のものを含む。以下の実施形態において、式 1 は、その立体異性体、N-酸化物及び塩を含み、「式 1 の化合物」という記載は、実施形態においてさらに定義されない限り、概要において規定された置換基の定義を含む。

10

【0075】

実施形態 1. 式 1 の化合物（式中、 R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、又は $C_2 \sim C_6$ アルキニルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、又はアルキニルが、1 つ以上の R^6 で置換され；又は R^1 が、1 ～ 3 つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニルであり；又は R^1 が、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換されるピリミジンである）。

【0076】

実施形態 1 a. R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_2 \sim C_6$ アルケニルであり、ここで、各アルキル、又はアルケニルが、1 つ以上の R^6 で置換される、実施形態 1 に記載の式 1 の化合物。

20

【0077】

実施形態 1 b. R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各 $C_1 \sim C_6$ アルキルが、1 つ以上の R^6 で置換される、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0078】

実施形態 1 c. R^1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、ここで、各 $C_1 \sim C_4$ アルキルが、1 つ以上のハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネートで置換される、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

30

【0079】

実施形態 1 d. R^1 が、1 ～ 3 つのハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるフェニルである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

40

【0080】

実施形態 1 d. R^1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、ここで、各 $C_1 \sim C_4$ アルキルが、1 つ以上のハロゲンで置換される、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0081】

実施形態 1 e. R^1 が、F、Cl、 OCH_3 、CN、 CO_2CH_3 で置換される CH_2 である、上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0082】

50

実施形態 1 f. R^1 が、 CF_3 、 CHF_2 、又は CH_2F である、実施形態 1 ~ 1 d のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0083】

実施形態 1 f. R^1 が、 CF_3 である、実施形態 1 ~ 1 d 又は 1 f のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0084】

実施形態 1 g. R^1 が、1 ~ 3 つのハロゲン、シアノ、 CF_3 、 OCH_3 又は OCF_3 で任意選択的に置換されるフェニルで任意選択的に置換されるフェニルである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0085】

実施形態 1 h. CH_3 、 F 、 Cl 、 Br 、 OCH_3 、 CN 、 NO_2 、 CF_3 、又は OCF_3 で任意選択的に置換されるフェニルである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0086】

実施形態 1 i. R^1 が、1 ~ 3 つのハロゲン、シアノ、 CF_3 、 OCH_3 又は OCF_3 で任意選択的に置換されるピリミジンである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0087】

実施形態 1 j. R^1 が、 CH_3 、 F 、 Cl 、 Br 、 OCH_3 、 CN 、 NO_2 、 CF_3 、又は OCF_3 で任意選択的に置換されるピリミジンである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0088】

実施形態 2. R^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は R^2 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各 $C_1 \sim C_6$ アルキルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は R^2 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ である、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0089】

実施形態 2 a. R^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである、上記の実施形態のいずれかのいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0090】

実施形態 2 b. R^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシである、上記の実施形態のいずれかのいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0091】

実施形態 2 c. R^2 が、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、シアノ、 CF_3 、又は OCF_3 である、上記の実施形態のいずれかのいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0092】

実施形態 2 d. R^2 が、メタ位にある、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0093】

実施形態 3. R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換される、上記の実

10

20

30

40

50

施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0094】

実施形態 3 a . R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、又は $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換される、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0095】

実施形態 3 b . R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、又は $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキルである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

10

【0096】

実施形態 3 c . R^3 が、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルシクロアルキルである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0097】

実施形態 3 d . R^3 が H である、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0098】

実施形態 4 . R^4 が、H 又は 1 つ以上の R^6 で任意選択的に置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルである、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0099】

実施形態 4 a . R^4 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである、実施形態 1 ～ 3 d のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

20

【0100】

実施形態 4 b . R^4 が $C_1 \sim C_3$ アルキルである、上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0101】

実施形態 4 c . R^4 が Me である、上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0102】

実施形態 4 d . R^4 が H である、上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

30

【0103】

実施形態 5 . R^5 が H である、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0104】

実施形態 6 . R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル又はシクロアルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルから選択される 1 つ以上の置換基で任意選択的に置換される、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

40

【0105】

実施形態 6 a . R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル又はシクロアルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルから選択される 1 つ以上の置換基で任意選択的に置換される、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

50

【0106】

実施形態6b. R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各アルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルから選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換される、上記の実施形態のいずれかに記載の式1の化合物。

【0107】

実施形態6b. R^6 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルから選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換されるシクロアルキルである、実施形態1～6aのいずれかに記載の式1の化合物。

【0108】

実施形態7. A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ で任意選択的に置換されるピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンであり；

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである、上記の実施形態のいずれか1つに記載の式1の化合物。

【0109】

実施形態7a. A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換される、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールであり；

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである、上記の実施形態のいずれか1つに記載の式1の化合物。

【0110】

実施形態 7 b . A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで任意選択的に置換される、ピリジン又はピリミジンであり；
 R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素である、上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0111】

実施形態 7 c . Q が Q^1 である、上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

【0112】

実施形態 7 d . Q が Q^2 である、上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物。

10

【0113】

実施形態 7 e . A^1 が、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールである、実施形態 1 ～ 5 c のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0114】

実施形態 7 f . A^1 が、ピリジン、又はピリミジンである、実施形態 1 ～ 5 c 及び 5 e のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0115】

実施形態 7 g . A^1 がピリジンである、実施形態 1 ～ 5 c 及び 5 e ～ 5 f のいずれかに記載の式 1 の化合物。

20

【0116】

実施形態 7 h . A^1 がピリミジンである、実施形態 1 ～ 5 c 及び 5 e ～ 5 f のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0117】

実施形態 7 i . A^2 が、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールである、実施形態 1 ～ 5 c のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0118】

実施形態 7 j . A^2 が、ピリジン又はピリミジンである、実施形態 1 ～ 5 c 及び 5 i のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0119】

実施形態 7 k . A^2 がピリジンである、実施形態 1 ～ 5 c 及び 5 i ～ 5 j のいずれかに記載の式 1 の化合物。

30

【0120】

実施形態 7 l . A^2 がピリミジンである、実施形態 1 ～ 5 c 及び 5 i ～ 5 k のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0121】

実施形態 8 . 式 1 の化合物が、式 1' の化合物である、上記の実施形態のいずれかに記載の式 1 の化合物。

【0122】

実施形態 8 a . 式 1 の化合物が、式 1'' の化合物である、実施形態 1 ～ 7 l のいずれかに記載の式 1 の化合物。

40

【0123】

実施形態 S 1 . 式 1 の化合物が、式 1' の化合物である、実施形態 1 ～ 8 a のいずれか 1 つに記載の化合物。

【0124】

実施形態 S 2 . 式 1 の化合物が、式 1'' の化合物である、実施形態 1 ～ 8 a のいずれか 1 つに記載の化合物。

【0125】

実施形態 S 3 . 式 1' の化合物及び式 1'' の化合物からなる組成物であって、式 1' の化合物対式 1'' の化合物の比率が、60 : 40 超である、組成物。

50

【0126】

実施形態S3a. 式1'の化合物対式1"の化合物の比率が、80:20超である、実施形態S3に記載の組成物。

【0127】

実施形態S3b. 式1'の化合物対式1"の化合物の比率が、90:10超である、実施形態S3に記載の組成物。

【0128】

実施形態S3c. 式1'の化合物対式1"の化合物の比率が、99:1超である、実施形態S3に記載の組成物。

【0129】

実施形態S4. 式1"の化合物及び式1'の化合物からなる組成物であって、式1"の化合物対式1'の化合物の比率が、60:40超である、組成物。

【0130】

実施形態X. 無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の式1の化合物と接触させることを含む方法。

【0131】

実施形態X1. 環境が、土壌又は植物の茎葉である、請求項Xに記載の方法。

【0132】

実施形態X2. 式1の化合物が、式1'の化合物である、実施形態X又はX1に記載の方法。

【0133】

実施形態X2. 式1の化合物が、式1"の化合物である、実施形態X又はX1に記載の方法。

【0134】

上記の実施形態1～X2及び本明細書に記載される任意の他の実施形態を含む本開示の実施形態は、任意の方法で組み合わせることができ、実施形態の変数の説明は、式1の化合物だけでなく、式1の化合物を調製するのに有用な出発化合物及び中間化合物にも関する。さらに、上記の実施形態1～X2、及び本明細書に記載される任意の他の実施形態、並びにそれらの任意の組合せを含む本開示の実施形態は、本開示の組成物及び方法に関する。

【0135】

実施形態A1～Cの組合せが以下によって例示される：

【0136】

実施形態A1. 式1の化合物（式中、
 R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各アルキルが、1つ以上の R^6 で置換され；又は
 R^1 が、1～3つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニルであり；又は
 R^1 が、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換されるピリミジンであり；
 R^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は
 R^2 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各 $C_1 \sim C_6$ アルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；又は
 R^2 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、又は $OS(O)_2R^9$ であり；
 R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；
 R^4 が、H又は1つ以上の R^6 で任意選択的に置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；
 R^5 が水素であり；
 R^6 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、CN、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)O$

10

20

30

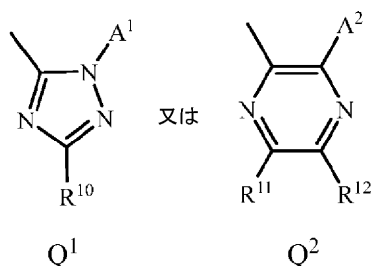
40

50

R^7 、 $S(O)_p R^7$ 、 $SO_2 NR^7 R^8$ 、 $OS(O)_2 R^9$ であり、又は
 R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル
 又はシクロアルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハ
 ロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルア
 ミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル
 チオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim$
 C_4 アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル
 スルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルから選択される1つ以上の置換基で任
 意選択的に置換され；
 R^7 、 R^8 及び R^9 が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；
 Q が、

10

【化10】



20

であり、
 A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアル
 キル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、
 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、
 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アル
 キルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホ
 ニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるピリジン、ピリミ
 ジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールであり；
 R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$
 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アル
 キルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロ
 アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、
 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$
 アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである）。

30

【0137】

実施形態A2.

R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各アルキルが、1つ以上の R^6 で置換さ
 れ；又は

40

R^1 が、1～3つの R^6 で任意選択的に置換されるフェニルであり；

R^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロであり；又は

R^2 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ここで、各 $C_1 \sim C_6$ アルキルが、1つ以上の R^6
 で任意選択的に置換され；又は

R^2 が、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7 R^8$ 、 $NR^7 R^8$ 、 OR^7 、 $S(O)$
 $(O)_p R^7$ 、 $SO_2 NR^7 R^8$ 、又は $OS(O)_2 R^9$ であり；

R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は
 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又は
 シクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^4 が、H又は1つ以上の R^6 で任意選択的に置換される $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^5 が水素であり；

50

R^6 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 CN 、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)OR^7$ 、 $C(O)NR^7R^8$ 、 NR^7R^8 、 OR^7 、 $NHC(O)NR^7R^8$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 $S(O)_pR^7$ 、 $SO_2NR^7R^8$ 、 $OS(O)_2R^9$ であり、又は

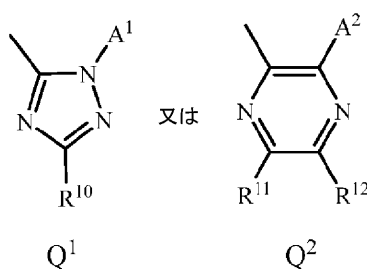
R^6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり、ここで、各アルキル又はシクロアルキルが、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルから選択される 1 つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

10

R^7 、 R^8 及び R^9 が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；

Q が、

【化 1 1】



20

であり、

A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールであり；

30

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである、実施形態 A 1 に記載の式 1 の化合物。

【0138】

実施形態 A 3．式 1 の化合物（式中、

40

R^1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、ここで、各アルキルが、1 つ以上のハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネートで置換され；又は

R^1 が、1 ～ 3 つのハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アル

50

ルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるフェニルであり；

R^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり；

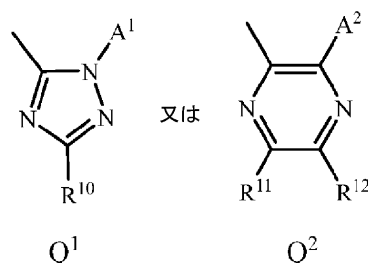
R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、又は $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキルであり、ここで、各アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキルが、1つ以上の R^6 で任意選択的に置換され；

R^4 が、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

R^5 が水素であり；

Qが、

【化12】



であり、

A^1 及び A^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルで任意選択的に置換されるピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、又はチアゾールであり；

R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである）。

【0139】

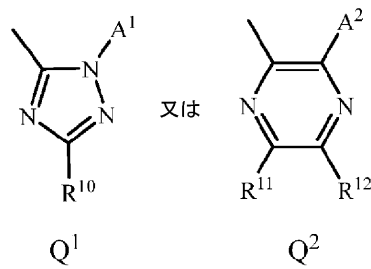
実施形態 A4．式1の化合物（式中、

R^1 が、 CF_3 、又は1～3つのハロゲン、シアノ、 CF_3 、 OCH_3 若しくは OCF_3 で任意選択的に置換されるフェニルであり；

R^2 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり；

R^3 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、又は $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキルであり；

R⁴ が、C₁～C₃アルキルであり；
 R⁵ が水素であり；
 Q が、
 【化 1 3】



10

であり、
 A¹ 及び A² が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ又はC₁～C₄ハロアルコキシで任意選択的に置換される、ピリジン又はピリミジンであり；
 R¹⁰、R¹¹ 及び R¹² が水素である）。

【0140】

実施形態 B．式 1 の化合物が、式 1' である、実施形態 A～A 3 のいずれか 1 つに記載の化合物。

20

【0141】

実施形態 C．式 1 の化合物が、式 1'' である、実施形態 A～A 3 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【0142】

本開示の特定の実施形態は、表 1 に示されるものからなる群から選択される化合物を含む。

【0143】

【表 1】

表 1

30

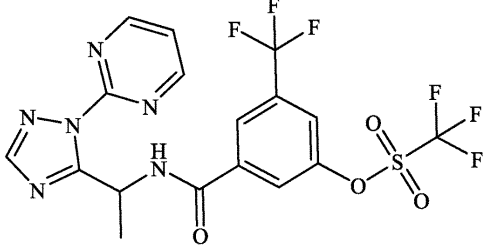
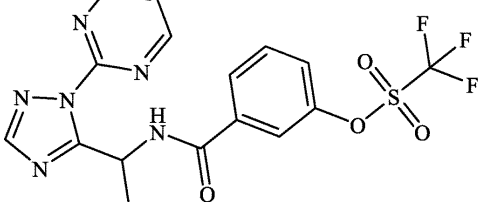
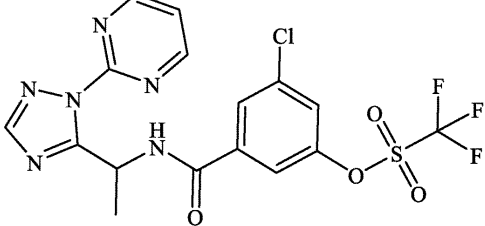
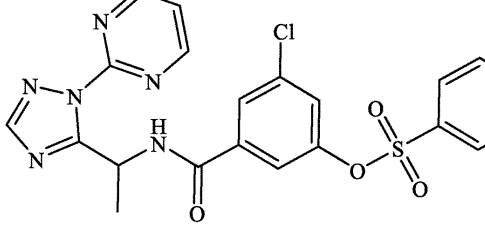
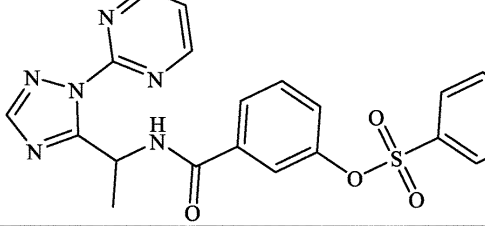
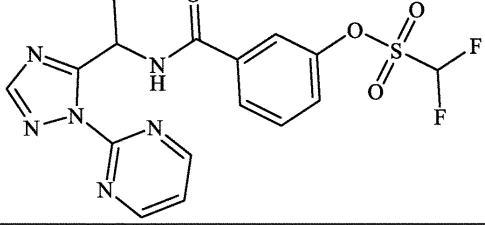
化合物	構造	化学名
1		3-[(フェニルスルホニル)オキシ]-N-[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド

【0144】

40

50

【表 2】

2		3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4- トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カル ボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェ ニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネ ート
3		3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4- トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カル ボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロ メタンスルホネート
4		3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)- 1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチ ル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1- トリフルオロメタンスルホネート
5		3-クロロ-5-[(フェニルスルホニル)オキシ]-N-[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H- 1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]ベン ズアミド
6		3-[(フェニルスルホニル)オキシ]-N- [1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリ アゾール-5-イル]エチル]ベンズアミド
7		3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4- トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カル ボニル]フェニル 1,1-ジフルオロメタ ンスルホネート

10

20

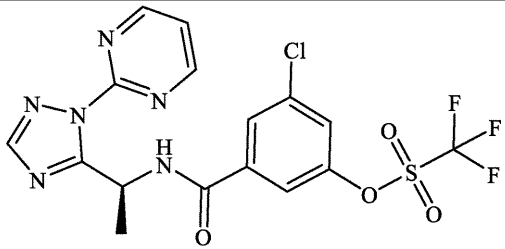
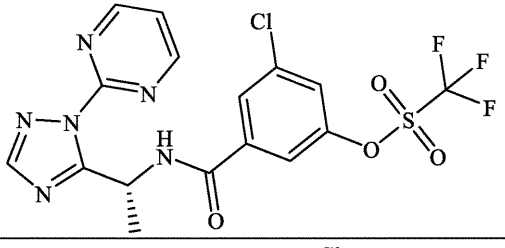
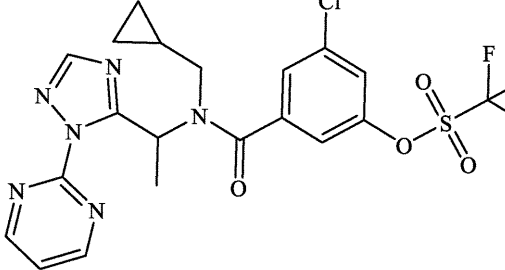
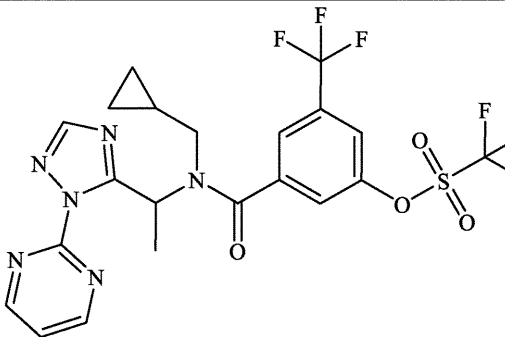
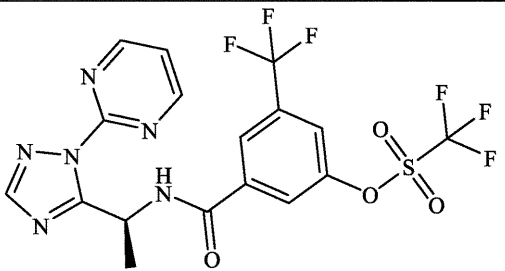
30

40

【 0 1 4 5 】

50

【表 3】

8		3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート; (-)鏡像異性体
9		3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート; (+)鏡像異性体
10		3-クロロ-5-[[[(シクロプロピルメチル)[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート
11		3-[[[(シクロプロピルメチル)[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート
12		3-[[[(1S)-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート; (-)鏡像異性体

【0146】

10

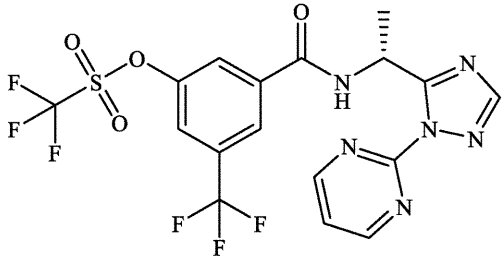
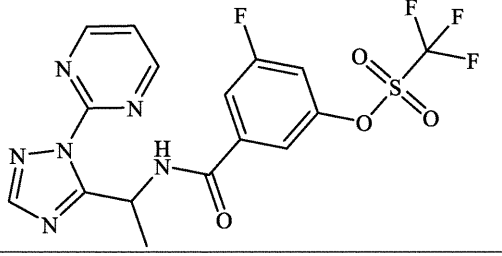
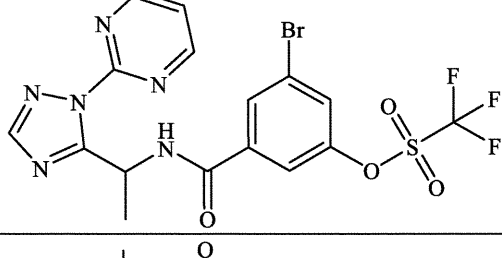
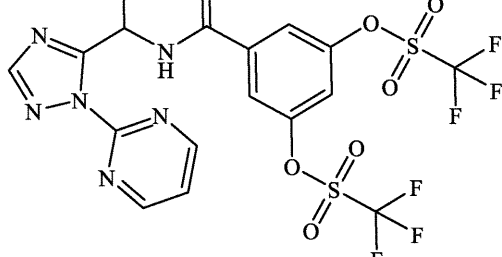
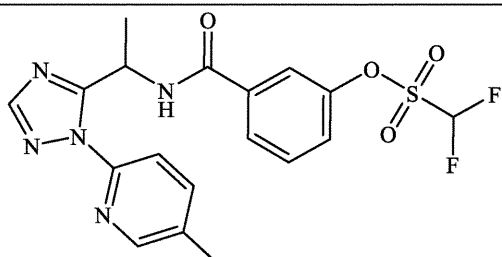
20

30

40

50

【表 4】

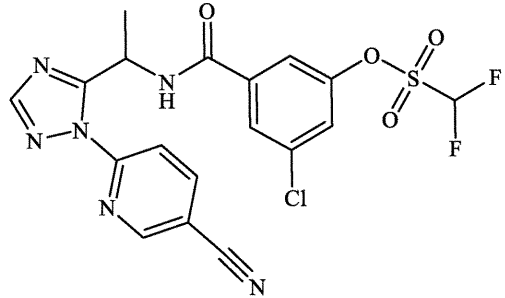
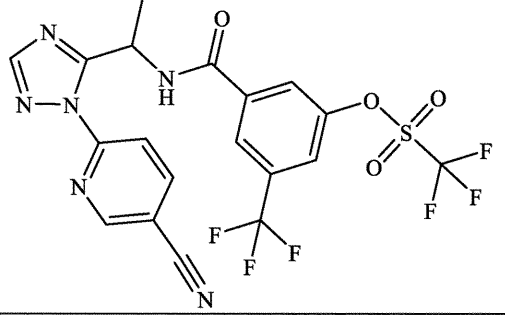
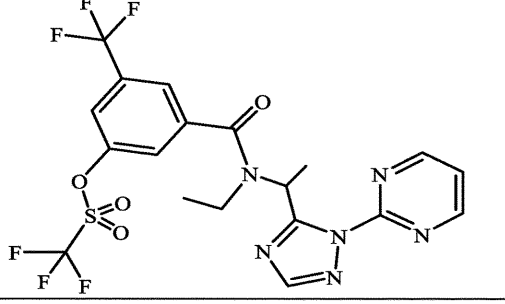
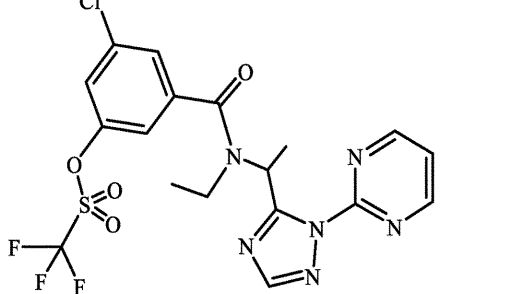
13		(R)-3-[[[1-[1-(2-ピリジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート; (+)鏡像異性体
14		3-フルオロ-5-[[[1-[1-(2-ピリジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート
15		3-ブromo-5-[[[1-[1-(2-ピリジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート
16		1,1'-[5-[[[1-[1-(2-ピリジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-1,3-フェニレン] ビス (1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート)
17		3-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1-ジフルオロメタンスルホネート

10

20

30

【表 5】

18		3-クロロ-5-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1-ジフルオロメタンスルホネート
19		3-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート
27		3-[[エチル[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート
50		3-クロロ-5-[[エチル[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート

【 0 1 4 8 】

10

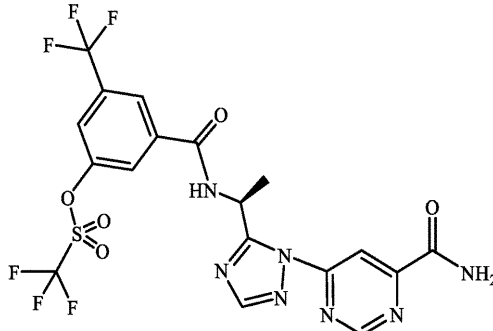
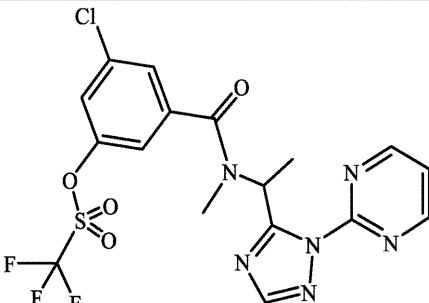
20

30

40

50

【表 6】

71		3-[[[(1S)-1-[1-[6-(アミノカルボニル)-4-ピリミジニル]-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート
72		3-クロロ-5-[[メチル[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルバモイル]フェニル 1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート

10

20

【0149】

実施形態 Y 1. 上記の実施形態のいずれか 1 つに記載の式 1 の化合物並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つのさらなる成分を含む組成物であって、任意選択的に、少なくとも 1 つのさらなる生物活性化合物又は薬剤をさらに含む、組成物。

【0150】

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

30

40

50

、N-[1, 1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1, 1-ジメチル-2-(メチルスルフィニル)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1, 1-ジメチル-2-(メチルスルホニル)エチル]-7-フルオロ-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-(1-メチルシクロプロピル)-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、N-[1-(ジフルオロメチル)シクロプロピル]-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオン-メチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ピリミカルブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルギット、プロトリフェンビュート、ピフルブミド、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフエン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルプロホス、スルホキサフロル、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テトラクロラントラニリプロール、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ-ナトリウム、チオキサザフェン、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシン、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウイルス及び昆虫病原性真菌からなる群から選択される、実施形態 Y 1 に記載の組成物。

10

20

【0151】

実施形態 Y 3 . 少なくとも 1 つのさらなる生物活性化合物又は薬剤が、アバメクチン、アセタミプリド、アクリナトリン、アフィドピロペン、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ビフェントリン、ブプロフェジン、カルバリル、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シペルメトリン、アルファーシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジェルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エトキサゾール、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルエンシルホン、フルピプロール、フルピラジフロン、フルバリネート、ホルメタネート、ホスチアゼート、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、ルフェヌロン、メペルフルトリン、メタフルミゾン、メチオカルブ、メトミル、メトプレン、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノフルオロトリン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピフルブミド、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリミノストロビン、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルホキサフロル、テブフェノジド、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ-ナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシン、バチルス・チューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) の全ての株及び核多角体病ウイルスの全ての株からなる群から選択される、実施形態 Y 2 に記載の組成物。

30

40

【0152】

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

50

成物。

【0153】

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

【0154】

実施形態 Y 6 . 実施形態 Y 1 ~ Y 3 のいずれか 1 つに記載の組成物を含む土壌灌注配合物。

【0155】

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

【0156】

実施形態 Y 8 . 実施形態 Y 1 ~ Y 3 のいずれか 1 つに記載の組成物、1 つ以上の食品材料、任意選択的に誘引剤、及び任意選択的に湿潤剤を含むベイト組成物。

【0157】

実施形態 Y 9 . 無脊椎有害生物を防除するためのトラップデバイスであって、実施形態 Y 8 に記載のベイト組成物及び前記ベイト組成物を収容するように構成されるハウジングを含み、ここで、ハウジングが、無脊椎有害生物が通過するのを可能にするようにサイズ決めされた少なくとも 1 つの開口部を有し、それによって、無脊椎有害生物が、ハウジングの外部の位置から前記ベイト組成物にアクセス可能であり、ハウジングが、無脊椎有害生物について可能な若しくは公知の活動の場所に又はその近くに配置されるようにさらに構成される、トラップデバイス。

【0158】

実施形態 Y 10 . 実施形態 Y 1 ~ Y 3 のいずれかに記載の組成物を含む組成物であって、ダスト、粉末、顆粒、ペレット、プリル、トローチ、錠剤、及び充填フィルムから選択される固体組成物である、組成物。

【0159】

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

【0160】

実施形態 Y 12 . 点滴灌漑システム、植え付け時の畝、手持ち式噴霧器、背負式噴霧器、ブーム噴霧器、地面用噴霧器 (ground sprayer)、空中散布、無人航空機、又は種子処理において使用するための、実施形態 Y 1 ~ Y 3 のいずれか 1 つに記載の組成物を含む液体又は乾燥配合物。

【0161】

実施形態 Y 13 . 前記配合物が、極微量で噴霧される、実施形態 Y 12 に記載の液体又は乾燥配合物。

【0162】

注目すべきは、本開示の化合物が、好ましい代謝及び／又は土壌残留パターンによって特徴付けられ、様々な農学的及び非農学的無脊椎有害生物を防除する活性を示すことである。

【0163】

特に注目すべきは、無脊椎有害生物防除スペクトル及び経済的重要性のため、無脊椎有害生物を防除することによる、無脊椎有害生物によって引き起こされる被害又は損傷からの農作物の保護が、本開示の実施形態であることである。本開示の化合物は、植物におけるそれらの好ましい転流特性又は組織性のため、式 1 の化合物又はこの化合物を含む組成物と直接接触されない葉又は他の植物部分も保護する。

【0164】

また、本開示の実施形態として注目すべきは、上記の実施形態のいずれか、並びに本明細書に記載される任意の他の実施形態に記載の化合物、及びそれらの任意の組合せ、並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つのさらなる成分を含む組成物であって、任意選択的に、少なくとも 1 つのさらなる生物活性化

10

20

30

40

50

合物又は薬剤をさらに含む、組成物である。

【0165】

本開示の実施形態としてさらに注目すべきは、上記の実施形態のいずれか、並びに本明細書に記載される任意の他の実施形態に記載の化合物、及びそれらの任意の組合せ、並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つのさらなる成分を含む、無脊椎有害生物を防除するための組成物であって、任意選択的に、少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤をさらに含む、組成物である。本開示の実施形態は、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の、上記の実施形態のいずれかに記載の化合物（例えば、本明細書に記載される組成物として）と接触させることを含む方法をさらに含む。

10

【0166】

本開示の実施形態はまた、土壌灌注液体配合物の形態の、上記の実施形態のいずれかに記載の化合物を含む組成物を含む。本開示の実施形態は、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、土壌を、生物学的に有効な量の、上記の実施形態のいずれかに記載の化合物を含む土壌灌注としての液体組成物と接触させることを含む方法をさらに含む。

【0167】

本開示の実施形態はまた、無脊椎有害生物を防除するための噴霧組成物であって、生物学的に有効な量の、上記の実施形態のいずれかに記載の化合物及び噴射剤を含む、噴霧組成物を含む。本開示の実施形態は、無脊椎有害生物を防除するためのベイト組成物であって、生物学的に有効な量の、上記の実施形態のいずれかに記載の化合物、1つ以上の食品材料、任意選択的に誘引剤、及び任意選択的に湿潤剤を含む、ベイト組成物をさらに含む。本開示の実施形態はまた、無脊椎有害生物を防除するためのデバイスであって、前記ベイト組成物及び前記ベイト組成物を収容するように構成されるハウジングを含み、ここで、ハウジングが、無脊椎有害生物が通過するのを可能にするようにサイズ決めされた少なくとも1つの開口部を有し、それによって、無脊椎有害生物が、ハウジングの外部の位置から前記ベイト組成物にアクセス可能であり、ハウジングが、無脊椎有害生物について可能な若しくは公知の活動の場所に又はその近くに配置されるようにさらに構成される、デバイスを含む。

20

【0168】

本開示の実施形態はまた、無脊椎有害生物から種子を保護するための方法であって、種子を、生物学的に有効な量の上記の実施形態のいずれかに記載の化合物と接触させることを含む方法を含む。

30

【0169】

本開示の実施形態はまた、無脊椎寄生性有害生物から動物を保護するための方法であって、殺寄生生物的に有効な量の、上記の実施形態のいずれかに記載の化合物を動物に投与することを含む方法を含む。

【0170】

本開示の実施形態はまた、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、（例えば、本明細書に記載される組成物として）と接触させることを含み、ただし、方法が、治療によるヒト又は動物の身体の医療処置の方法でない、方法を含む。

40

【0171】

本開示はまた、無脊椎有害生物又はその環境が、生物学的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、並びに界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つのさらなる成分を含む組成物であって、任意選択的に、生物学的に有効な量の少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤をさらに含む、組成物と接触され、ただし、方法が、治療によるヒト又は動物の身体の医療処置の方法でない、このような方法に関する。

【0172】

本開示の実施形態は、本明細書に開示される組成物を植栽領域上に分散させるための、

50

無人航空機（UAV）の使用も含む。いくつかの実施形態において、植栽領域は、作物を含む領域である。いくつかの実施形態において、作物は、単子葉植物又は双子葉植物から選択される。いくつかの実施形態において、作物は、イネ、コーン、大麦、ソバ、小麦、野菜、タバコ、茶樹、果樹及びサトウキビから選択される。いくつかの実施形態において、本明細書に開示される組成物は、極微量での噴霧のために配合される。ドローンによって施用される製品は、噴霧担体として水又は油を使用することができる。ドローン散布に使用される典型的な噴霧量（製品を含む）は、世界的に、5.0リットル／ha～100リットル／ha（約0.5～10gpa）である。これは、超低噴霧量（ULV）から低噴霧量（LV）までの範囲を含む。一般的ではないが、1.0リットル／ha（0.1gpa）などのさらに低い噴霧量を使用する状況もあり得る。

10

【0173】

式1の化合物は、スキーム1～6に記載される以下の方法及び変形のうちの1つ以上によって調製され得る。以下の式1～13の化合物中の置換基の定義は、特記されない限り、概要において上に定義される通りである。式1a及び1bの化合物は、式1の化合物のサブセットである。式の各サブセットの置換基は、特記されない限り、その親の式について定義される通りである。周囲温度又は室温は、約20～25℃として定義される。

【0174】

式1の化合物は、スキーム1に示される方法によって調製され得る。R1、R2、R3、R4、R5、n及びQの値は、既に定義される通りである。スキーム1の方法において、式2のカルボン酸が、公知のアミドカップリング試薬によって促進される縮合によって、式3のアミンと反応される。この方法において有用なカップリング試薬としては、限定されないが、T3P（1-プロパンホスホン酸環状無水物）、DIC/HOBt（ジイソプロピルカルボキシイミド／ヒドロキシベンゾトリアゾール）、HATU（1-〔ビス（ジメチルアミノ）メチレン〕-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスフェート）、CDI（カルボニルジイミダゾール）、及びEDC（エチル-3-（3-ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド）が挙げられる。カップリング試薬は、典型的に、トリエチルアミン、ピリジン、4-（ジメチルアミノ）ピリジン及びN,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下で使用される。典型的な反応条件は、ジクロロメタン又はテトラヒドロフランなどの無水非プロトン性溶媒を含み、反応は、一般に、室温と溶媒の還流温度との間の温度で実行される。これらの反応は、当技術分野において十分に実証され、実施例1～3において実証される。

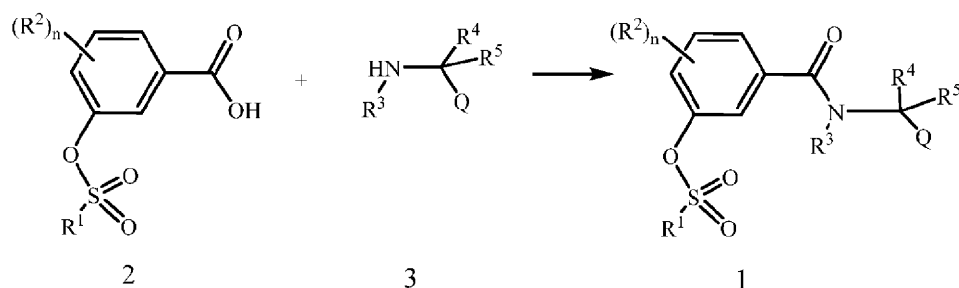
20

30

【0175】

スキーム1

【化14】



40

式1の化合物はまた、スキーム2に示される2工程方法によって調製され得る。この方法において、式2の酸が、式4の化合物（式中、LGが、好適な脱離基である）に転化され、次に、式3のアミンと反応されて、式1の化合物を生じる。化合物（式中、LGが、クロロ（酸塩化物）である）は、この方法において非常に一般的に使用される。酸塩化物とアミンとのカップリングは、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、及び塩化メチレンを含む多種多様な溶媒中で行われ得る。反応はまた、トリエチルアミン、ピリジン、ピコリン、4-（ジメチルアミノ）ピリジン及びN,N-ジイソプロピルエチルアミンなど

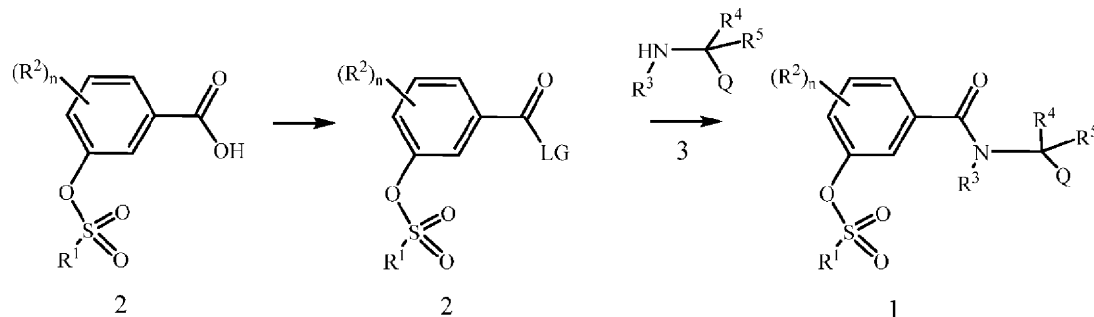
50

の塩基の存在下で行われる。酸塩化物は、塩化チオニル又は塩化オキサリルによる処理などの周知の方法によって、対応する酸から容易に入手可能である。代替的な有用な脱離基は、カルボン酸スルホネートであり、これは、アルキル若しくはアリアルスルホニルクロリド又はスルホン酸無水物による処理によって式 2 の酸から調製されて、中間体スルホネートを形成し得、次に、これは、酸塩化物について記載される塩基の存在下で、式 3 のアミンと直接反応されて、直接式 1 の化合物を生じる。

【0176】

スキーム 2

【化 15】

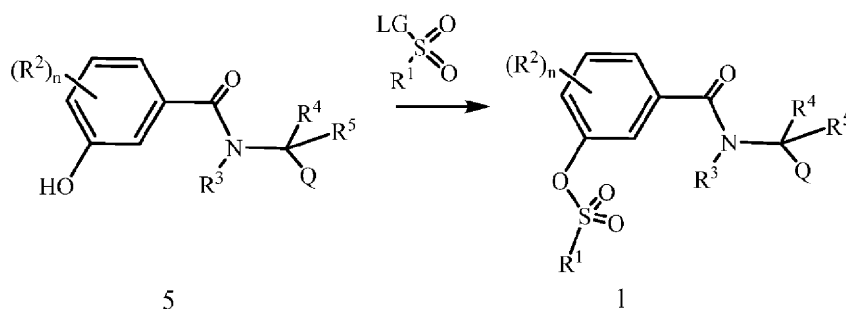


式 1 の化合物は、スキーム 3 に示される方法によって調製され得る。この方法において、式 5 の 3-ヒドロキシベンズアミドが、トリエチルアミン、ピリジン、ピコリン、コリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン及び N,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下で、スルホニルクロリド又はスルホン酸無水物などのスルホン化試薬で処理される。典型的な反応条件は、ジクロロメタン又はテトラヒドロフランなどの無水非プロトン性溶媒を含む。反応は、一般に、0℃と室温との間の温度で実行される。

【0177】

スキーム 3

【化 16】



式 1 のサブセットである式 1 a の化合物（式中、Q が、中心のトリアゾール環を含有する）は、スキーム 4 に示される方法によって調製され得る。この方法において、式 6 の化合物が、1,1-ジメトキシ-N,N-ジメチルメタンアミンと反応されて、式 7 の中間体ジメチルアミノイミドを形成する。この反応は、典型的に、溶媒の還流温度までの温度で、非プロトン性溶媒、例えば、塩化メチレン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、及びトルエン中で行われる。次に、式 7 の化合物は、式 8 のヒドラジンで直接処理されて、式 1 a のトリアゾールが得られる。この反応は、一般に、酢酸中で行われ、室温から 100℃ の温度で、共溶媒を含み得る。この方法は、国際公開第 2017/192385 号パンフレットに記載されている。

【0178】

スキーム 4

10

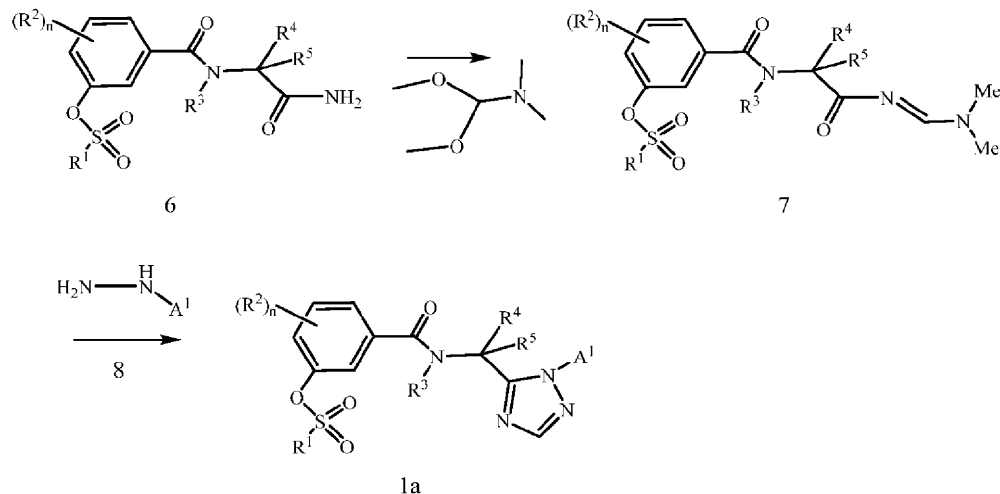
20

30

40

50

【化 1 7】



10

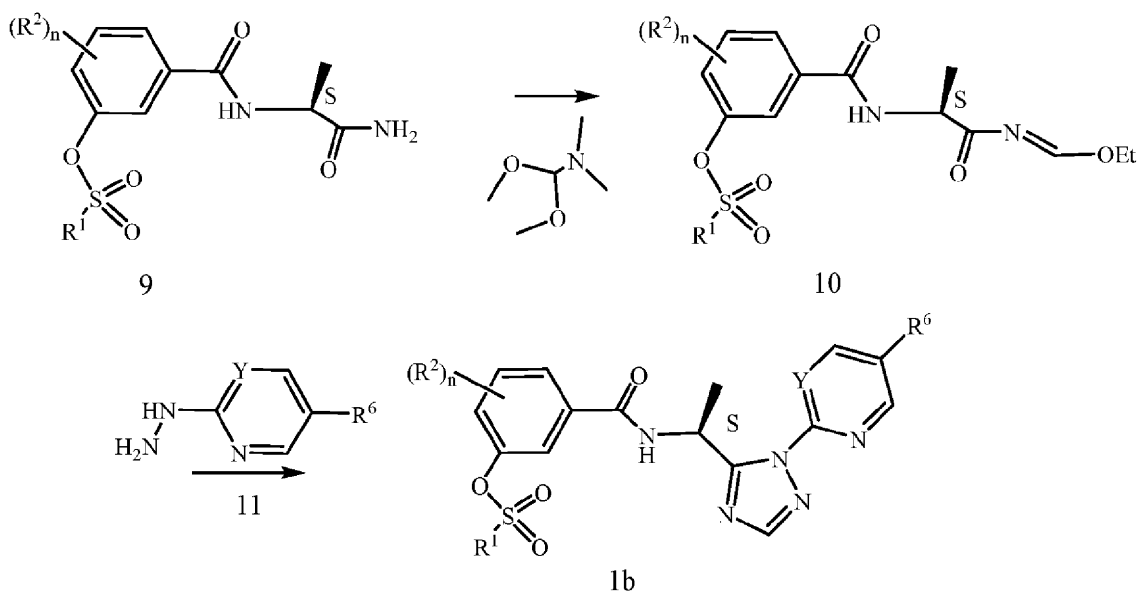
20

S-アラニン及びピリジン又はピリミジントリアゾールから誘導される生成物を含有する、式 1 の好ましいサブセットである式 1 b の化合物は、スキーム 5 に示される方法によって調製され得る。この方法の手順は、スキーム 4 において記載されるものと同じであり、ここで、式 9 の中間体は、S-アラニン断片から誘導され、ヒドラジンは、式 1 1 の置換ピリジン又はピリミジンである。

【0 1 7 9】

スキーム 5

【化 1 8】



30

40

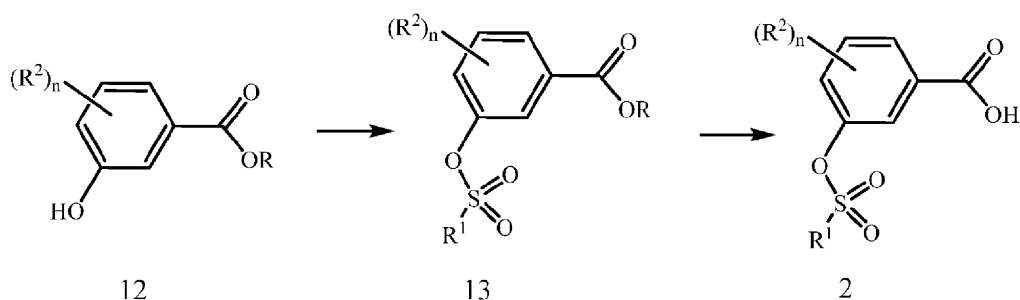
式 2 の中間体は、スキーム 6 に示される方法によって調製され得る。この方法において、式 1 2 の 3-ヒドロキシベンゾエートは、トリエチルアミン、ピリジン、ピコリン、コリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン及び N,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下で、スルホニルクロリド又はスルホン酸無水物などのスルホン化試薬で処理される。好ましいスルホン化試薬は、トリフルオロメタンスルホン酸無水物である。典型的な反応条件は、ジクロロメタン又はテトラヒドロフランなどの無水非プロトン性溶媒を含む。反応は、一般に、0℃と室温との間の温度で実行される。次に、式 1 3 のエステルは、標準条件下で、水酸化ナトリウム又は水酸化リチウムなどの塩基により加水分解され得、これは、酸性化により、式 2 の酸を生じる。

【0 1 8 0】

50

スキーム 6

【化 1 9】



10

式 1 の化合物を調製するための上述のいくつかの試薬及び反応条件は、それらの中間体中に存在するある種の官能基と両立しない可能性があることが認識される。これらの場合、合成への一連の保護／脱保護の採用又は官能基の相互転換は、所望の反応生成物を得ることを補助するであろう。保護基の使用及び選択は、化学合成に精通する者には明らかであろう（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M., *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991 を参照されたい）。当業者は、ある場合には、個々のスキームに示される試薬の導入後、詳細に説明されていないさらなる日常的な合成工程が、式 1 の化合物の合成を完了させるのに必要となり得ることを認識するであろう。これもまた、当業者の認識するところであろうが、式 1 の化合物を調製するために提示されたスキームによって示唆されるもの以外の順序で、上述のスキームで説明された工程を組み合わせて実施することが必要となり得る。

20

【0181】

式 3 の中間体の調製は、国際公開第 2017/192385 号パンフレット、国際公開第 2019/197468 号パンフレット、国際公開第 2020/193341 号パンフレット、国際公開第 2020/201079 号パンフレット、国際公開第 2021/083936 号パンフレット、国際公開第 2021/013720 号パンフレット、国際公開第 2021/013719 号パンフレット、2021/2021/037614 号パンフレット、国際公開第 2021/165195 号パンフレット、及び国際公開第 2021/068179 号パンフレットに記載されている。

30

【0182】

式 1 の化合物を調製するための上述のいくつかの試薬及び反応条件は、それらの中間体中に存在するある種の官能基と両立しない可能性があることが認識される。これらの場合、合成への一連の保護／脱保護の採用又は官能基の相互転換は、所望の反応生成物を得ることを補助するであろう。保護基の使用及び選択は、化学合成に精通する者には明らかであろう（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M., *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991 を参照されたい）。当業者は、ある場合には、個々のスキームに示される試薬の導入後、詳細に説明されていないさらなる日常的な合成工程が、式 1 の化合物の合成を完了させるのに必要となり得ることを認識するであろう。これもまた、当業者の認識するところであろうが、式 1 の化合物を調製するために提示された順序によって示唆されるもの以外の順序で、上述のスキームで説明された工程を組み合わせて実施することが必要となり得る。

40

【0183】

当業者がさらに認識するところであろうが、本明細書に記載される式 1 の化合物及び中間体を、各種の求電子性反応、求核性反応、ラジカル反応、有機金属反応、酸化反応、及び還元反応にかけて、置換基を加えたり、又は既存の置換基を変性したりすることも可能である。

50

【 0 1 8 4 】

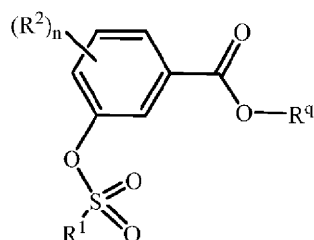
さらなる詳述なしに、先の説明を用いる当業者であれば、本発明を最大限に利用することができると考えられる。したがって、以下の合成実施例は、単に例示として解釈されるものであり、何ら本開示を限定するものではない。以下の合成実施例における工程は、合成変換全体におけるそれぞれの工程のための手順を説明するものであり、それぞれの工程のための出発物質は、必ずしも、その手順が他の実施例又は工程で記述されている、特定の調製操作によって調製される必要はない。周囲温度又は室温は、約 20～25℃として定義される。パーセンテージは、クロマトグラフの溶媒混合物の場合を除いて又は特記されない限り、重量基準である。クロマトグラフの溶媒混合物の場合の部及びパーセンテージは、特記されない限り、体積基準である。¹H NMR スペクトルは、テトラメチルシランから低磁場側の ppm で報告され、「s」は一重線を意味し、「d」は二重線を意味し、「t」は三重線を意味し、「q」は四重線を意味し、「m」は多重線を意味し、「dd」は二重線の二重線を意味し、「brs」は、幅広の一重線を意味する。

10

【 0 1 8 5 】

本開示の化合物の調製において有用な中間体の例は、表 A 1～A 18 に示される。

【 化 2 0 】



20

【 0 1 8 6 】

【 表 7 】

表 A1 R ^q が H である		表 A2 R ^q が Me である		表 A3 R ^q が Et である	
R ¹	R ²	R ¹	R ²	R ¹	R ²
CH ₂ Cl	H	CH ₂ Cl	H	R ¹	R ²
CH ₂ CH ₂ Cl	H	CH ₂ CH ₂ Cl	H	CH ₂ Cl	H
CF ₂ H	H	CF ₂ H	H	CH ₂ CH ₂ Cl	H
CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ H	H
CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H
CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ CF ₃	H
CH ₂ CN	H	CH ₂ CN	H	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H

30

40

【 0 1 8 7 】

50

【表 8】

CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	CH ₂ CN	H
CH ₂ OCH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
CH ₂ SCH ₃	H	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	H
CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	CH ₂ SCH ₃	H
CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	H
CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H
CH ₂ (CH=CH ₂)	H	CH ₂ (CH=CH ₂)	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H
c-Pr	H	c-Pr	H	CH ₂ (CH=CH ₂)	H
c-Bu	H	c-Bu	H	c-Pr	H
c-Pent	H	c-Pent	H	c-Bu	H
c-Hex	H	c-Hex	H	c-Pent	H
CH ₂ (c-Pr)	H	CH ₂ (c-Pr)	H	c-Hex	H
CH ₂ (c-Bu)	H	CH ₂ (c-Bu)	H	CH ₂ (c-Pr)	H
CH ₂ (c-Pent)	H	CH ₂ (c-Pent)	H	CH ₂ (c-Bu)	H
CH ₂ (c-Hex)	H	CH ₂ (c-Hex)	H	CH ₂ (c-Pent)	H
CH ₂ Ph	H	CH ₂ Ph	H	CH ₂ (c-Hex)	H
CH ₂ CH ₂ Ph	H	CH ₂ CH ₂ Ph	H	CH ₂ Ph	H
CH ₂ (2-F-Ph)	H	CH ₂ (2-F-Ph)	H	CH ₂ CH ₂ Ph	H
CH ₂ (2-F-Ph)	H	CH ₂ (2-F-Ph)	H	CH ₂ (2-F-Ph)	H
CH ₂ (2-Br-Ph)	H	CH ₂ (2-Br-Ph)	H	CH ₂ (2-F-Ph)	H
CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	H	CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	H	CH ₂ (2-Br-Ph)	H
CH ₂ (2-CN-Ph)	H	CH ₂ (2-CN-Ph)	H	CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	H
CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	H	CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	H	CH ₂ (2-CN-Ph)	H
CH ₂ (3-F-Ph)	H	CH ₂ (3-F-Ph)	H	CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	H
CH ₂ (3-F-Ph)	H	CH ₂ (3-F-Ph)	H	CH ₂ (3-F-Ph)	H
CH ₂ (3-Br-Ph)	H	CH ₂ (3-Br-Ph)	H	CH ₂ (3-F-Ph)	H
CH ₂ (3-CF ₃ -Ph)	H	CH ₂ (3-CF ₃ -Ph)	H	CH ₂ (3-Br-Ph)	H
CH ₂ (3-CN-Ph)	H	CH ₂ (3-CN-Ph)	H	CH ₂ (3-CF ₃ -Ph)	H
CH ₂ (3-NO ₂ -Ph)	H	CH ₂ (3-NO ₂ -Ph)	H	CH ₂ (3-CN-Ph)	H
CH ₂ (4-F-Ph)	H	CH ₂ (4-F-Ph)	H	CH ₂ (3-NO ₂ -Ph)	H
CH ₂ (4-Cl-Ph)	H	CH ₂ (4-Cl-Ph)	H	CH ₂ (4-F-Ph)	H
CH ₂ (4-Br-Ph)	H	CH ₂ (4-Br-Ph)	H	CH ₂ (4-Cl-Ph)	H
CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	H	CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	H	CH ₂ (4-Br-Ph)	H
CH ₂ (4-CN-Ph)	H	CH ₂ (4-CN-Ph)	H	CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	H
CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	H	CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	H	CH ₂ (4-CN-Ph)	H

10

20

30

40

【 0 1 8 8 】

【表 9】

Ph	H	Ph	H	CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	H
2-F-Ph	H	2-F-Ph	H	Ph	H
2-Cl-Ph	H	2-Cl-Ph	H	2-F-Ph	H
2-CN-Ph	H	2-CN-Ph	H	2-Cl-Ph	H
2-CF ₃ -Ph	H	2-CF ₃ -Ph	H	2-CN-Ph	H
2-OCH ₃ -Ph	H	2-OCH ₃ -Ph	H	2-CF ₃ -Ph	H
2-OCF ₃ -Ph	H	2-OCF ₃ -Ph	H	2-OCH ₃ -Ph	H
3-F-Ph	H	3-F-Ph	H	2-OCF ₃ -Ph	H
3-Cl-Ph	H	3-Cl-Ph	H	3-F-Ph	H
3-CN-Ph	H	3-CN-Ph	H	3-Cl-Ph	H
3-CF ₃ -Ph	H	3-CF ₃ -Ph	H	3-CN-Ph	H
3-OCH ₃ -Ph	H	3-OCH ₃ -Ph	H	3-CF ₃ -Ph	H
3-OCF ₃ -Ph	H	3-OCF ₃ -Ph	H	3-OCH ₃ -Ph	H
4-F-Ph	H	4-F-Ph	H	3-OCF ₃ -Ph	H
4-Cl-Ph	H	4-Cl-Ph	H	4-F-Ph	H
4-CN-Ph	H	4-CN-Ph	H	4-Cl-Ph	H
4-CF ₃ -Ph	H	4-CF ₃ -Ph	H	4-CN-Ph	H
4-OCH ₃ -Ph	H	4-OCH ₃ -Ph	H	4-CF ₃ -Ph	H
4-OCF ₃ -Ph	H	4-OCF ₃ -Ph	H	4-OCH ₃ -Ph	H

【0189】

表 A 4～表 A 6 は、R² が -5-F であることを除いて、それぞれ表 A 1～表 A 3 と同じように構成される。

【0190】

表 A 7～表 A 9 は、R² が 5-Cl であることを除いて、それぞれ表 A 1～表 A 3 と同じように構成される。

【0191】

表 A 10～表 A 12 は、R² が 5-Br であることを除いて、それぞれ表 A 1～表 A 3 と同じように構成される。

【0192】

表 A 13～表 A 15 は、R² が 5-CF₃ であることを除いて、それぞれ表 A 1～表 A 3 と同じように構成される。

【0193】

表 A 16～表 A 18 は、R² が -5-OCF₃ であることを除いて、それぞれ表 A 1～表 A 3 と同じように構成される。

【0194】

さらなる詳述なしに、先の説明を用いる当業者であれば、本開示を最大限に利用することができると考えられる。

【実施例】

【0195】

合成実施例 1

3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル 1,1,1-

トリフルオロメタンスルホネート（化合物２）の調製

工程Ａ：メチル３－（トリフルオロメチル）－５－（トリフルオロメチルスルホニルオキシ）ベンゾエートの調製

ジクロロメタン（２０ｍｌ）中のメチル３－トリフルオロメチル－５－ヒドロキシオキシベンゾエート（０．５ｇ、２．２７ｍｍｏｌ）の攪拌溶液に、２，４，６－コリジン（０．３６ｍｌ、２．７２ｍｍｏｌ）、４－ジメチルアミノピリジン（５５ｍｇ、０．４５ｍｍｏｌ）及びトリフルオロメタンスルホン酸無水物（０．４５ｍｌ、２．７２ｍｍｏｌ）を０℃で加え、混合物を室温で１時間攪拌した。反応の進行を、ＴＬＣ（５０％のＥｔＯＡｃ／石油エーテル）によって監視した。混合物を氷冷水（５０ｍｌ）でクエンチし、酢酸エチル（２×５０ｍｌ）で抽出した。組み合わされた有機層を、塩水溶液（２５ｍｌ）で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を、３５℃で、減圧下で蒸発させて、粗化合物を得て、それをシリカゲルカラムに充填した。１０％の酢酸エチル／石油エーテルによるカラムの溶出により、表題化合物（０．５ｇ、６２．５％の収率）を淡黄色の液体として得た。¹H-NMR（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ₃）：δ＝８．３５（ｓ，１Ｈ），８．１３（ｓ，１Ｈ），７．７２（ｓ，１Ｈ），４．００（ｓ，３Ｈ）。MS（EI）：m/z 352

10

【０１９６】

工程Ｂ：３－（トリフルオロメチル）－５－（トリフルオロメチルスルホニルオキシ）安息香酸の調製

テトラヒドロフラン（１２ｍｌ）及び水（４ｍｌ）中の工程Ａからの化合物（０．５ｇ、１．４２ｍｍｏｌ）の攪拌溶液に、水酸化リチウム水和物（０．０８９ｇ、２．１３ｍｍｏｌ）を０℃で加え、混合物を室温で１５分間攪拌した。反応の進行を、ＴＬＣ（１００％の酢酸エチル）によって監視した。溶媒を蒸発させ、混合物を、１ＮのＨＣｌ（約ｐＨ＝２）で酸性化させ、酢酸エチル（２×５０ｍｌ）で抽出した。組み合わされた有機層を、塩水（５０ｍｌ）で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させて、粗化合物を得て、それを、分取ＨＰＬＣによって精製して、表題化合物（２００ｍｇ、４１．６％の収率）をオフホワイトの固体として得た。MS（EI）：m/z 337（M-H，１００）。

20

【０１９７】

工程Ｃ：３－[[[１－[１－（２－ピリミジニル）－１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル]エチル]アミノ]カルボニル]－５－（トリフルオロメチル）フェニル１，１，１－トリフルオロメタンスルホネートの調製

30

ジクロロメタン（８ｍｌ）中の実施例１の工程Ｂからの化合物（０．１５０ｇ、１．０８ｍｍｏｌ）の攪拌溶液に、１－（２－ピリミジン－２－イル－１，２，４－トリアゾール－３－イル）エタンアミン（化合物４、０．２４７ｇ、１．３０ｍｍｏｌ）及びトリエチルアミン（０．３ｍｌ、２．１７ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。次に、プロパンホスホン酸無水物（Ｔ３Ｐ、１．３８ｍｌ、２．１７ｍｍｏｌ）を加え、混合物を室温で１６時間攪拌した。反応の進行を、ＴＬＣ（１００％の酢酸エチル）によって監視した。反応物を、氷水（３０ｍｌ）でクエンチし、ジクロロメタン（２×５０ｍｌ）で抽出した。組み合わされた有機抽出物を、塩水（３０ｍｌ）で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させて、粗生成物を得て、それを、分取ＨＰＬＣによって精製して、表題化合物（５０ｍｇ、２２．６％の収率）として得た。¹H-NMR（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ₃）：δ＝９．５１－９．５０（ｄ，１Ｈ），８．９８－８．９７（ｄ，２Ｈ），８．２９（ｓ，１Ｈ），８．２４（ｓ，１Ｈ），８．１７（ｓ，１Ｈ），８．１５（ｓ，１Ｈ），７．６３－７．６０（ｔ，１Ｈ），６．０３－６．００（ｔ，１Ｈ），１．６６－１．６５（ｄ，３Ｈ）。MS（EI）：m/z 511（M+1，１００）

40

中間体１－（２－ピリミジン－２－イル－１，２，４－トリアゾール－３－イル）エタンアミンの調製は、国際公開第２０１７／１９２３８５号パンフレットに見出され得る。

【０１９８】

合成実施例２

50

3-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)]-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート(化合物19)の調製

工程A: 3-[[[1-[1-(5-シアノ-2-ピリジニル)]-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1,1,1-トリフルオロメタンスルホネートの調製

ジクロロメタン(10ml)中の実施例1の工程Bからの3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニルオキシ)安息香酸(0.250g、1.16mmol)の攪拌溶液に、6-[5-(1-アミノエチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル]-3-ピリジンカルボニトリル(0.393g、1.16mmol)及びトリエチルアミン(0.48ml、3.50mmol)を0℃で加えた。次に、プロパンホスホン酸無水物(T3P、1.48ml、2.33mmol)を加え、混合物を室温で16時間攪拌した。反応の進行を、TLC(70%のEtOAc/石油エーテル)によって監視した。反応物を、氷水(50ml)でクエンチし、ジクロロメタン(2×50ml)で抽出した。組み合わされた有機抽出物を、塩水(50ml)で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させて、粗生成物を得て、それを、分取HPLCによって精製して、表題化合物(56mg、10%の収率)として得た。¹H NMR(400MHz, CDCl₃): δ=8.87-8.86(s, 1H), 8.18-8.17(m, 2H), 8.10(s, 1H), 8.01(s, 1H), 7.96(s, 1H), 7.68(s, 1H), 7.55-7.53(d, 1H), 6.45-6.41(t, 1H), 1.73-1.72(d, 3H). MS(EI): m/z 535(M+1, 100)

10

20

[0199]

合成実施例3

3-[[[1-(シクロプロピルメチル)[1-[1-(2-ピリミジニル)]-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1,1,1-トリフルオロメタンスルホネート(化合物11)

工程A: 3-[[[1-(シクロプロピルメチル)[1-[1-(2-ピリミジニル)]-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1,1,1-トリフルオロメタンスルホネートの調製

ジクロロメタン(10ml)中の実施例1の工程Bからの3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニルオキシ)安息香酸(0.2g、0.59mmol)の攪拌溶液に、N-(シクロプロピルメチル)-α-メチル-1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-メタンアミン(0.173g、0.71mmol)及びトリエチルアミン(0.24ml、1.77mmol)を0℃で加えた。次に、プロパンホスホン酸無水物(0.75ml、1.18mmol)を加え、反応物を室温で16時間攪拌した。反応の進行を、TLC(100%のEtOAc)によって監視した。反応物を、氷水(100ml)でクエンチし、ジクロロメタン(2×50ml)で抽出した。組み合わされた有機抽出物を、塩水(50ml)で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させて、粗生成物を得て、それを、Combiflashによって精製して、表題化合物(60mg、18%の収率)を淡黄色の粘着性の液体として得た。¹H NMR(400MHz, CDCl₃): δ=8.84(bs, 2H), 8.12(s, 1H), 7.53(d, 2H), 7.36(bs, 2H), 6.69(bs, 1H), 3.01(bs, 2H), 1.87-1.86(d, 3H), 0.90-0.86(m, 1H), 0.42-0.37(m, 2H), 0.04-0.02(m, 2H). MS(EI): m/z 565(M+1, 100)

30

40

中間体N-(シクロプロピルメチル)-α-メチル-1-(2-ピリミジニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-メタンアミンの調製は、国際公開第2017/192385号パンフレットに見出され得る。

[0200]

50

合成実施例 4

鏡像異性体分離 3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート(化合物8; (-)鏡像異性体)及び3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート(化合物9; (+)鏡像異性体)

手順: 実施例1からの3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネート(化合物2)の鏡像異性体を分離し、以下の方法を用いたキラル超臨界流体クロマトグラフィー(SFC)によって特性決定した。

SFC方法条件:

カラム: CHIRALPAK IC (4.6 * 250 mm) 5 µm

共溶媒: メタノール中0.5%のDEA

総流量: 3 g / 分

共溶媒の%: 10

ABPR: 1500 s i

温度: 30 °C

SFC精製により、以下が得られた:

ピーク1 (RT値: キラルHPLCにおいて1.98): 110 mg; ¹H-NMR、MS及び旋光度が、3-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]-5-(トリフルオロメチル)フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネートの(-)鏡像異性体と一致する。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 8.93-8.92 (d, 2H), 8.11 (s, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.67-7.65 (d, 2H), 7.43-7.41 (t, 1H), 6.48-6.42 (m, 1H), 1.72-1.71 (d, 3H).

MS (EI): m/z 511.23 (M+1).

[α] = -101.2 (C=0.2%, MeOH)

ピーク2 (RT値: キラルHPLCにおいて2.55): 110 mg; ¹H-NMR、MS及び旋光度が、3-クロロ-5-[[[1-[1-(2-ピリミジニル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル]エチル]アミノ]カルボニル]フェニル1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホネートの(+)鏡像異性体と一致する。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 8.93-8.92 (d, 2H), 8.11-8.06 (d, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.67-7.64 (t, 2H), 7.43-7.4 (t, 1H), 6.47-6.43 (m, 1H), 1.72-1.7 (d, 3H).

MS (EI): m/z 511.19 (M+1).

[α] = +84.32 (C=0.2%, MeOH)

[0201]

本明細書に記載の手順及び当技術分野で公知の方法により、以下の表1~120の化合物を調製することができる。以下の表では以下の略語を使用する。Meは、メチルを意味し、OMeは、メトキシを意味し、Etは、エチルを意味し、OEtは、エトキシを意味し、n-Prは、n-プロピルを意味し、i-Prは、イソプロピルを意味し、c-Prは、シクロプロピルを意味し、n-Buは、n-ブチルを意味し、s-Buは、sec-ブチルを意味し、t-Buは、第三級ブチルを意味し、c-Buは、シクロブチルを意味し、Phは、フェニルを意味し、CNは、シアノを意味する。

表1

10

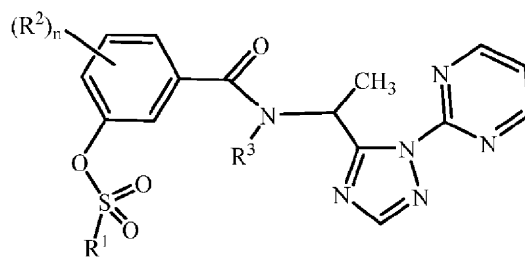
20

30

40

50

【化 2 1】



10

式中、 R^3 が H である。

【 0 2 0 2】

【表 1 0】

R1	R2
CH ₂ Cl	H
CH ₂ CH ₂ Cl	H
CF ₂ H	H
CF ₃	H
CH ₂ CF ₃	H
CH ₂ CH ₂ CF ₃	H
CH ₂ CN	H
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
CH ₂ OCH ₃	H
CH ₂ SCH ₃	H
CH ₂ SO ₂ CH ₃	H
CH ₂ CO ₂ CH ₃	H
CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H
CH ₂ (CH=CH ₂)	H
c-Pr	H
c-Bu	H
c-Pent	H
c-Hex	H

20

30

【 0 2 0 3】

40

50

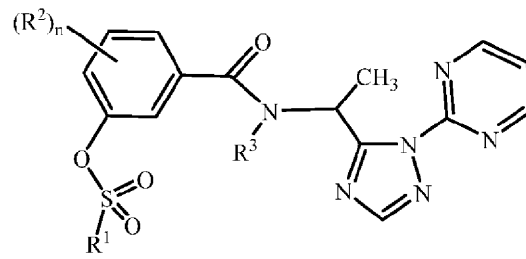
【表 1 1】

R1	R2	
CH2(c-Pr)	H	
CH2(c-Bu)	H	
CH2(c-Pent)	H	
CH2(c-Hex)	H	
CH2Ph	H	
CH2CH2Ph	H	
CH2(2-F-Ph)	H	10
CH2(2-F-Ph)	H	
CH2(2-Br-Ph)	H	
CH2(2-CF3-Ph)	H	
CH2(2-CN-Ph)	H	
CH2(2-NO2-Ph)	H	
CH2(4-F-Ph)	H	
CH2(4-Cl-Ph)	H	
CH2(4-Br-Ph)	H	
CH2(4-CF3-Ph)	H	
CH2(4-CN-Ph)	H	20
CH2(4-NO2-Ph)	H	
Ph	H	
2-F-Ph	H	
2-Cl-Ph	H	
2-CN-Ph	H	
2-CF3-Ph	H	
2-OCH3-Ph	H	
2-OCF3-Ph	H	
3-F-Ph	H	
3-Cl-Ph	H	30
3-CN-Ph	H	
3-CF3-Ph	H	
3-OCH3-Ph	H	
3-OCF3-Ph	H	
4-F-Ph	H	
4-Cl-Ph	H	
4-CN-Ph	H	
4-CF3-Ph	H	
4-OCH3-Ph	H	
4-OCF3-Ph	H	40

【0 2 0 4】

表 2

【化 2 2】

式中、 R^3 が Me である。

10

【 0 2 0 5】

20

30

40

50

【表 1 2】

R1	R2	
CH ₂ Cl	H	
CH ₂ CH ₂ Cl	H	
CF ₂ H	H	
CF ₃	H	
CH ₂ CF ₃	H	
CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	10
CH ₂ CN	H	
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	
CH ₂ OCH ₃	H	
CH ₂ SCH ₃	H	
CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ (CH=CH ₂)	H	20
c-Pr	H	
c-Bu	H	
c-Pent	H	
c-Hex	H	
CH ₂ (c-Pr)	H	
CH ₂ (c-Bu)	H	
CH ₂ (c-Pent)	H	
CH ₂ (c-Hex)	H	30
CH ₂ Ph	H	
CH ₂ CH ₂ Ph	H	
CH ₂ (2-F-Ph)	H	
CH ₂ (2-F-Ph)	H	
CH ₂ (2-Br-Ph)	H	
CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (2-CN-Ph)	H	
CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	H	40

【 0 2 0 6 】

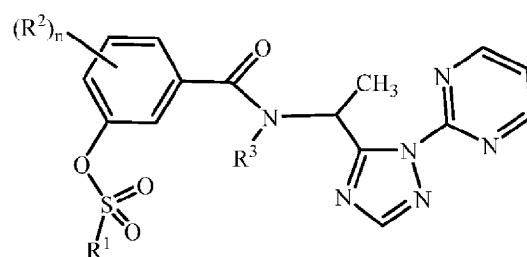
【表 1 3】

CH ₂ (4-F-Ph)	H	
CH ₂ (4-Cl-Ph)	H	
CH ₂ (4-Br-Ph)	H	
CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (4-CN-Ph)	H	
CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	H	
Ph	H	10
2-F-Ph	H	
2-Cl-Ph	H	
2-CN-Ph	H	
2-CF ₃ -Ph	H	
2-OCH ₃ -Ph	H	
2-OCF ₃ -Ph	H	
3-F-Ph	H	
3-Cl-Ph	H	20
3-CN-Ph	H	
3-CF ₃ -Ph	H	
3-OCH ₃ -Ph	H	
3-OCF ₃ -Ph	H	
4-F-Ph	H	
4-Cl-Ph	H	
4-CN-Ph	H	
4-CF ₃ -Ph	H	30
4-OCH ₃ -Ph	H	
4-OCF ₃ -Ph	H	

【0207】

表 3

【化 2 3】



40

式中、R³がi-Prである。

【0208】

50

【表 1 4】

R1	R2	
CH ₂ Cl	H	
CH ₂ CH ₂ Cl	H	
CF ₂ H	H	
CF ₃	H	
CH ₂ CF ₃	H	
CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	10
CH ₂ CN	H	
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	
CH ₂ OCH ₃	H	
CH ₂ SCH ₃	H	
CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ (CH=CH ₂)	H	20
c-Pr	H	
c-Bu	H	
c-Pent	H	
c-Hex	H	
CH ₂ (c-Pr)	H	
CH ₂ (c-Bu)	H	
CH ₂ (c-Pent)	H	
CH ₂ (c-Hex)	H	30
CH ₂ Ph	H	
CH ₂ CH ₂ Ph	H	
CH ₂ (2-F-Ph)	H	

【0 2 0 9】

40

50

【表 1 5】

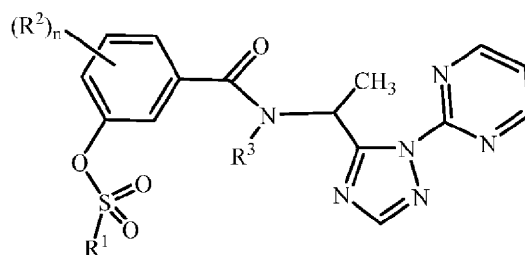
CH ₂ (2-F-Ph)	H	
CH ₂ (2-Br-Ph)	H	
CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (2-CN-Ph)	H	
CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	H	
CH ₂ (4-F-Ph)	H	
CH ₂ (4-Cl-Ph)	H	10
CH ₂ (4-Br-Ph)	H	
CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (4-CN-Ph)	H	
CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	H	
Ph	H	
2-F-Ph	H	
2-Cl-Ph	H	
2-CN-Ph	H	20
2-CF ₃ -Ph	H	
2-OCH ₃ -Ph	H	
2-OCF ₃ -Ph	H	
3-F-Ph	H	
3-Cl-Ph	H	
3-CN-Ph	H	
3-CF ₃ -Ph	H	
3-OCH ₃ -Ph	H	30
3-OCF ₃ -Ph	H	
4-F-Ph	H	
4-Cl-Ph	H	
4-CN-Ph	H	
4-CF ₃ -Ph	H	
4-OCH ₃ -Ph	H	
4-OCF ₃ -Ph	H	

40

【0 2 1 0】

表 4

【化 2 4】



式中、 R^3 が CH_2 (c-Pr) である。

10

【0 2 1 1】

【表 1 6】

R1	R2
CH ₂ Cl	H
CH ₂ CH ₂ Cl	H
CF ₂ H	H
CF ₃	H
CH ₂ CF ₃	H
CH ₂ CH ₂ CF ₃	H
CH ₂ CN	H
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
CH ₂ OCH ₃	H
CH ₂ SCH ₃	H
CH ₂ SO ₂ CH ₃	H
CH ₂ CO ₂ CH ₃	H
CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H
CH ₂ (CH=CH ₂)	H
c-Pr	H
c-Bu	H
c-Pent	H
c-Hex	H
CH ₂ (c-Pr)	H
CH ₂ (c-Bu)	H
CH ₂ (c-Pent)	H
CH ₂ (c-Hex)	H
CH ₂ Ph	H
CH ₂ CH ₂ Ph	H
CH ₂ (2-F-Ph)	H
CH ₂ (2-F-Ph)	H

20

30

40

【0 2 1 2】

50

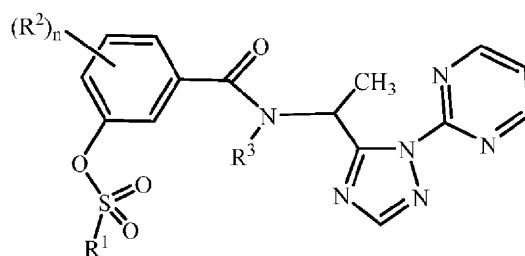
【表 1 7】

CH ₂ (2-Br-Ph)	H	
CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (2-CN-Ph)	H	
CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	H	
CH ₂ (4-F-Ph)	H	
CH ₂ (4-Cl-Ph)	H	
CH ₂ (4-Br-Ph)	H	10
CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (4-CN-Ph)	H	
CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	H	
Ph	H	
2-F-Ph	H	
2-Cl-Ph	H	
2-CN-Ph	H	
2-CF ₃ -Ph	H	20
2-OCH ₃ -Ph	H	
2-OCF ₃ -Ph	H	
3-F-Ph	H	
3-Cl-Ph	H	
3-CN-Ph	H	
3-CF ₃ -Ph	H	
3-OCH ₃ -Ph	H	
3-OCF ₃ -Ph	H	30
4-F-Ph	H	
4-Cl-Ph	H	
4-CN-Ph	H	
4-CF ₃ -Ph	H	
4-OCH ₃ -Ph	H	
4-OCF ₃ -Ph	H	

【0 2 1 3】

表 5

【化 2 5】



式中、 R^3 が CH_2Ph である。

【0214】

【表18】

R1	R2	
CH ₂ Cl	H	
CH ₂ CH ₂ Cl	H	
CF ₂ H	H	
CF ₃	H	10
CH ₂ CF ₃	H	
CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	
CH ₂ CN	H	
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	
CH ₂ OCH ₃	H	
CH ₂ SCH ₃	H	
CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	20
CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	
CH ₂ (CH=CH ₂)	H	
c-Pr	H	
c-Bu	H	
c-Pent	H	
c-Hex	H	
CH ₂ (c-Pr)	H	
CH ₂ (c-Bu)	H	30
CH ₂ (c-Pent)	H	
CH ₂ (c-Hex)	H	

【0215】

40

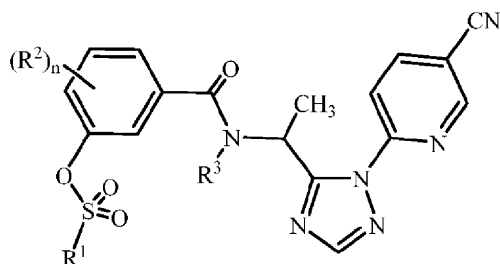
50

【表 1 9】

CH ₂ Ph	H	
CH ₂ CH ₂ Ph	H	
CH ₂ (2-F-Ph)	H	
CH ₂ (2-F-Ph)	H	
CH ₂ (2-Br-Ph)	H	
CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (2-CN-Ph)	H	
CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	H	10
CH ₂ (4-F-Ph)	H	
CH ₂ (4-Cl-Ph)	H	
CH ₂ (4-Br-Ph)	H	
CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	H	
CH ₂ (4-CN-Ph)	H	
CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	H	
Ph	H	
2-F-Ph	H	20
2-Cl-Ph	H	
2-CN-Ph	H	
2-CF ₃ -Ph	H	
2-OCH ₃ -Ph	H	
2-OCF ₃ -Ph	H	
3-F-Ph	H	
3-Cl-Ph	H	
3-CN-Ph	H	
3-CF ₃ -Ph	H	30
3-OCH ₃ -Ph	H	
3-OCF ₃ -Ph	H	
4-F-Ph	H	
4-Cl-Ph	H	
4-CN-Ph	H	
4-CF ₃ -Ph	H	
4-OCH ₃ -Ph	H	
4-OCF ₃ -Ph	H	40

【 0 2 1 6 】
表 6 ～ 表 1 0

【化 2 6】



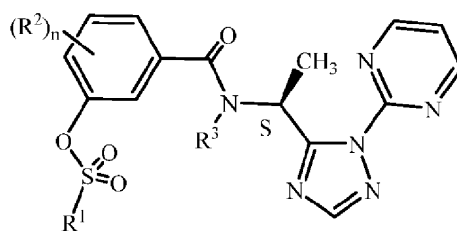
10

表 6 ～表 1 0 は、表 1 ～表 5 中の構造が、表 6 ～表 1 0 についての上記の構造で置き換えられることを除いて、それぞれ表 1 ～表 5 と同じように構成される。

【 0 2 1 7】

表 1 1 ～表 1 5

【化 2 7】



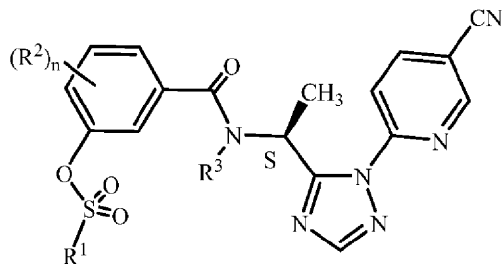
20

表 1 1 ～表 1 5 は、表 1 ～表 5 中の構造が、表 1 1 ～表 1 5 についての上記の構造で置き換えられることを除いて、それぞれ表 1 ～表 5 と同じように構成される。

【 0 2 1 8】

表 1 6 ～表 2 0

【化 2 8】



30

表 1 6 ～表 2 0 は、表 1 ～表 5 中の構造が、表 1 6 ～表 2 0 についての上記の構造で置き換えられることを除いて、それぞれ表 1 ～表 5 と同じように構成される。

【 0 2 1 9】

表 2 1 ～表 4 0 は、 R^2 が 5-F であることを除いて、それぞれ表 1 ～表 2 0 と同じように構成される。

【 0 2 2 0】

表 4 1 ～表 6 0 は、 R^2 が 5-Cl であることを除いて、それぞれ表 1 ～表 2 0 と同じように構成される。

【 0 2 2 1】

表 6 1 ～表 8 0 は、 R^2 が 5-CF₃ であることを除いて、それぞれ表 1 ～表 2 0 と同じように構成される。

【 0 2 2 2】

表 8 1 ～表 1 0 0 は、 R^2 が 5-OCF₃ であることを除いて、それぞれ表 1 ～表 2 0

50

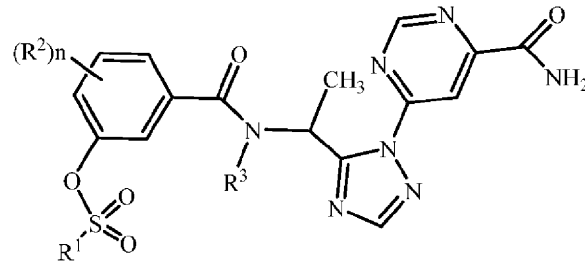
と同じように構成される。

【0223】

表101～表120は、 R^2 が5-Brであることを除いて、それぞれ表1～表20と同じように構成される。

【0224】

【化29】

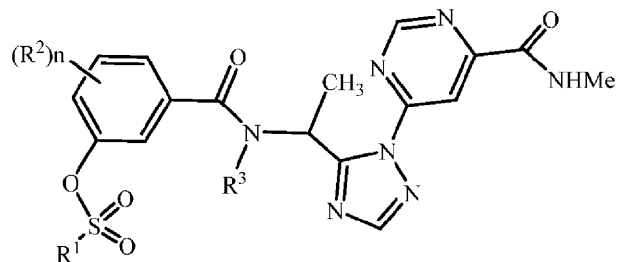


10

表121～表125は、表1～表5中の構造が、表121～表125についての上記の構造で置き換えられることを除いて、それぞれ表1～表5と同じように構成される。

【0225】

【化30】

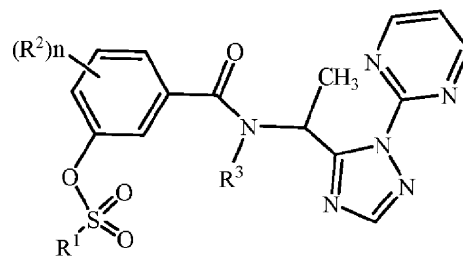


20

表126～表130は、表1～表5中の構造が、表126～表130についての上記の構造で置き換えられることを除いて、それぞれ表1～表5と同じように構成される。

【0226】

【化31】



30

表131～表135は、表1～表5中の構造が、表131～表135についての上記の構造で置き換えられることを除いて、それぞれ表1～表5と同じように構成される。

【0227】

表136～表140は、 R^2 が5-Fであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0228】

表141～表145は、 R^2 が5-Clであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0229】

表146～表150は、 R^2 が5-CF₃であることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

40

50

【0230】

表151～表155は、 R^2 が5-OCF₃であることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0231】

表156～表160は、 R^2 が5-Brであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0232】

表161～表165は、 R^2 が5-Fであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0233】

表166～表170は、 R^2 が5-Clであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0234】

表171～表175は、 R^2 が5-CF₃であることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0235】

表176～表180は、 R^2 が5-OCF₃であることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0236】

表181～表185は、 R^2 が5-Brであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0237】

表186～表190は、 R^2 が5-Fであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0238】

表191～表195は、 R^2 が5-Clであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0239】

表196～表200は、 R^2 が5-CF₃であることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0240】

表201～表205は、 R^2 が5-OCF₃であることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0241】

表206～表210は、 R^2 が5-Brであることを除いて、それぞれ表126～表130と同じように構成される。

【0242】

配合／実用化

本開示の化合物は、一般に、担体として機能する、界面活性剤、固体希釈剤、及び液状希釈剤からなる群から選択される、少なくとも1つのさらなる成分と共に、組成物、すなわち配合物の中の無脊椎有害生物防除有効成分として使用されるであろう。その配合物又は組成物の成分は、その有効成分の物理的性質、施用形態、並びに土壌のタイプ、水分及び温度などの環境因子に合わせて選択される。

【0243】

有用な配合物は、液体組成物及び固体組成物の両方を含む。液体組成物は、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物及び／又はサスポエマルジョンを含む）を含み、これらは、任意選択的にゲルに増粘することができる。水性液体組成物の一般的なタイプは、可溶性濃縮物、懸濁液濃縮物、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物及びサスポエマルジョンを含む。非水性液体組成物の一般的なタ

10

20

30

40

50

イブは、乳化性濃縮物、微乳化性濃縮物、分散性濃縮物及び油分散体である。

【0244】

固体組成物の一般的なタイプは、ダスト、粉末、顆粒、ペレット、プリル、トローチ、錠剤、充填フィルム（種子コーティングを含む）などであり、これらは、水分散性（「湿潤性」）又は水溶性であり得る。フィルム形成性溶液又は流動性懸濁液から形成されるフィルム及びコーティングは、種子処理に特に有用である。有効成分を、（マイクロ）カプセル化し、さらに加工して、懸濁液又は固形配合物とすることが可能であり；或いは、有効成分の配合物全体を、カプセル化する（又は「オーバーコートする」）ことが可能である。カプセル化することで、有効成分の放出を制御したり、遅らせたりすることができる。乳化性顆粒は、乳化性濃縮配合物及び乾燥顆粒配合物の両方の利点を兼ね備えている。高強度組成物は、主にさらなる配合のための中間体として使用される。

10

【0245】

噴霧可能な配合物は、典型的に、噴霧前に適切な媒体中で伸展される。このような液体及び固体の配合物は、噴霧媒体、通常は水であるが、時には、別の好適な媒体、例えば、芳香族、又はパラフィン系炭化水素、又は植物油の中に容易に希釈されるように配合されている。噴霧量は、1ヘクタール当たり約1～数千リットルの範囲であり得るが、より典型的には1ヘクタール当たり約10～数百リットルの範囲である。噴霧可能な配合物は、空中散布若しくは地上散布による葉面処理のため、又は植物の生育培地に施用するために、水、又は別の好適な媒体とタンク混合することができる。液体及び乾燥配合物は、点滴灌漑システムに直接注入するか、又は植え付け時に畝内に計量注入することができる。液体及び固体配合物は、作物及び他の望ましい植生の種子上に、植え付け前に種子処理として施用し、浸透性吸収によって成長中の根及び他の地下植物部分及び／又は葉を保護することができる。

20

【0246】

限定されないが、作物を含む圃場などの標的領域にわたって本明細書に開示される組成物を分配する一方法は、ドローンの使用によるものである。化学製品で圃場を処理するためなどの、農学的用途におけるドローン又は無人航空機（UAV）の使用は、急速に拡大している。化学製品の容器は、UAV及びUAVに取り付けられた材料分配システムに結合され、UAVが、処理される領域上で操縦される一方、化学製品が分配される。

【0247】

配合物には、典型的に、下記の概略範囲内で、有効成分、希釈剤、及び界面活性剤の有効量を含むが、それらの合計が100重量パーセントとなるようにする。

30

【0248】

【表20】

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

40

【0249】

50

固体希釈剤としては、例えば、粘土、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイト、カオリン、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖類（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、マイカ、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウム及び炭酸水素ナトリウム、硫酸ナトリウムが挙げられる。典型的な固体希釈剤が、次の文献に記載されている：Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey。

【0250】

液体希釈剤としては、例えば、水、N，N－ジメチルアルカンアミド（例えば、N，N－ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N－アルキルピロリドン（例えば、N－メチルピロリジノン）、アルキルホスフェート（例えば、トリエチルホスフェート）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、パラフィン（例えば、白色鉱油、ノルマルパラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱芳香族脂肪族、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、ケトン、例えば、シクロヘキサノン、2－ヘプタノン、イソホロン及び4－ヒドロキシ－4－メチル－2ペンタノン、アセテート、例えば、酢酸イソアミル、酢酸ヘキシル、酢酸ヘプチル、酢酸オクチル、酢酸ノニル、酢酸トリデシル及び酢酸イソボルニル、アルキル化乳酸エステルなどの他のエステル、二塩基性エステル、アルキル及びアリールベンゾエート、γ－ブチロラクトン並びに直鎖状、分枝状、飽和又は不飽和であり得るアルコール、例えばメタノール、エタノール、n－プロパノール、イソプロピルアルコール、n－ブタノール、イソブチルアルコール、n－ヘキサノール、2－エチルヘキサノール、n－オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾール及びベンジルアルコールが挙げられる。液体希釈剤は、飽和及び不飽和脂肪酸（典型的には、C₆～C₂₂）のグリセロールエステル、例えば、植物種子及び果実油（例えば、オリーブ、ヒマシ、亜麻仁、ゴマ、コーン（トウモロコシ）、ピーナッツ、ヒマワリ、グレープシード、サフラワー、綿実、ダイズ、ナタネ、ココナッツ及びパーム核の油）、動物由来の脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油）及びこれらの混合物も含む。液体希釈剤は、アルキル化脂肪酸（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）も含み、ここで、脂肪酸は、植物及び動物供給源からのグリセロールエステルの加水分解によって得られ得、蒸留によって精製可能である。典型的な液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950に記載されている。

【0251】

本開示の固体及び液体組成物は、多くの場合、1つ以上の界面活性剤を含む。界面活性剤（「表面活性剤」としても知られている）は、液体に添加されると、一般に液体の表面張力を変更し、ほとんどの場合、低下させる。界面活性剤分子の中の親水性及び親油性の基の性質に応じて、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤、又は消泡剤として有用となり得る。

【0252】

界面活性剤は、非イオン性、アニオン性又はカチオン性に分類され得る。本組成物のために有用な非イオン性界面活性剤としては、限定されないが、アルコールアルコキシレート、例えば、天然及び合成のアルコール（分枝状であっても、又は直鎖状であってもよい）をベースとし、そしてアルコールと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又はそれらの混合物とから調製されるアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミド、及びエトキシ化アルカノールアミド；アルコキ

シル化トリグリセリド、例えば、エトキシ化したダイズ油、ヒマシ油、及びナタネ油；アルキルフェノールアルコキシレート、例えば、オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレート、及びドデシルフェノールエトキシレート（フェノールと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又はそれらの混合物とから調製）；エチレンオキシド、又はプロピレンオキシドから調製したブロックポリマー、及びその末端ブロックがプロピレンオキシドから調製された、リバースブロックポリマー；エトキシ化脂肪酸；エトキシ化脂肪族エステル及び油；エトキシ化メチルエステル；エトキシ化トリステリルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又はそれらの混合物から調製したものを含む）；脂肪酸エステル、グリセロールエステル、ラノリンベースの誘導体、ポリエトキシレートエステル、例えば、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシ化ソルビトール脂肪酸エステル、及びポリエトキシ化グリセロール脂肪酸エステル；その他のソルビタン誘導体、例えば、ソルビタンエステル；ポリマー性界面活性剤、例えば、ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキド P E G（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフト若しくは 形ポリマー、及び星形ポリマー；ポリエチレングリコール（P E G）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコンベースの界面活性剤；並びに糖類誘導体、例えば、スクロースエステル、アルキルポリグリコシド、及びアルキル多糖類が挙げられる。

10

【0253】

有用なアニオン性界面活性剤としては、限定されないが、アルキルアリールスルホン酸及びその塩；カルボキシ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホン酸誘導体；リグニン及びリグノスルホネートなどのリグニン誘導体；マレイン酸又はコハク酸又はその無水物；オレフィンスルホネート、アルコールアルコキシレートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシレートのリン酸エステル及びステリルフェノールエトキシレートのリン酸エステルなどのリン酸エステル；タンパク質ベースの界面活性剤；サルコシン誘導体；ステリルフェノールエーテルスルフェート；油及び脂肪酸のスルフェート及びスルホネート；エトキシ化アルキルフェノールのスルフェート及びスルホネート；アルコールのスルフェート；エトキシ化アルコールのスルフェート；N，N－アルキルタウレートなどのアミン及びアミドのスルホネート；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン並びにドデシル及びトリデシルベンゼンのスルホネート；縮合ナフタレンのスルホネート；ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホネート；分留石油のスルホネート；スルホスクシナメート；並びにスルホスクシネート及びその誘導体、例えば、ジアルキルスルホスクシネート塩が挙げられる。

20

30

【0254】

有用なカチオン性界面活性剤としては、限定されないが、アミド及びエトキシ化アミド；N－アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミン及びジプロピレントラミンなどのアミン；並びにエトキシ化アミン、エトキシ化ジアミン及びプロポキシ化アミン（アミン及びエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド又はそれらの混合物から調製される）；アミンアセテート及びジアミン塩などのアミン塩；第4級塩、エトキシ化第4級塩及びジ第4級塩などの第4級アンモニウム塩；並びにアルキルジメチルアミノオキシド及びビス－（2－ヒドロキシエチル）－アルキルアミノオキシドなどのアミノオキシドが挙げられる。

40

【0255】

また、本発明の組成物に有用であるものは、非イオン性界面活性剤及びアニオン性界面活性剤の混合物又は非イオン性界面活性剤及びカチオン性界面活性剤の混合物である。非イオン性、アニオン性及びカチオン性界面活性剤並びにそれらの推奨される用途は、McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.；

50

Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; 及び A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987 を含む様々な公開文献に開示されている。

【0256】

本開示の組成物は、当業者に配合助剤として知られている配合助剤及び添加剤（そのうちのいくつかは、固体希釈剤、液体希釈剤又は界面活性剤としても機能すると考えられる）も含有し得る。このような配合助剤及び添加剤は、pH（緩衝剤）、加工中の発泡（ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤）、有効成分の沈降（懸濁剤）、粘性（チキソトロピック増粘剤）、容器内の微生物増殖（抗菌剤）、製品の凍結（不凍剤）、色（染料／顔料分散体）、洗い落とし（フィルム形成剤又は展着剤）、蒸発（蒸発遅延剤）及び他の配合物特性を制御し得る。フィルム形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマー及びワックスが挙げられる。配合助剤及び添加剤の例としては、McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; 及び PCT 公開、国際公開第 03/024222 号パンフレットに記載されているものが挙げられる。

【0257】

式 1 の化合物及び他のいずれの有効成分も、典型的に、有効成分を溶媒に溶解するか、又は液体若しくは乾燥希釈剤中で粉碎することによって本組成物に組み込まれる。乳化性濃縮物を含む溶液は、成分を単に混合することによって調製することができる。乳化性濃縮物として使用することを意図した液体組成物の溶媒が水と混和しない場合、水で希釈する際に活性含有溶媒を乳化するために、典型的に乳化剤が添加される。2,000 μm までの粒径を有する有効成分スラリーは、媒体ミルを用いて湿式粉碎し、3 μm 未満の平均粒径を有する粒子を得ることができる。水性スラリーは、完成した懸濁液濃縮物（例えば、米国特許第 3,060,084 号明細書を参照されたい）にすることができるか、又はさらに噴霧乾燥によって処理して水分散性顆粒を形成することができる。乾燥配合物は、通常、2~10 μm の範囲の平均粒径を生じる乾燥粉碎プロセスを必要とする。ダスト及び粉末は、ブレンド及び通常、粉碎（ハンマーミル又は流体エネルギーミルなど）により調製することができる。顆粒及びペレットは、予め形成された粒状担体に活性物質を噴霧するか、又は凝集技術によって調製することができる。Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp. 147-48、Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 及び以下、国際公開第 91/13546 号パンフレットを参照されたい。ペレットは、米国特許第 4,172,714 号明細書の記載に従って調製することができる。水分散性及び水溶性顆粒は、米国特許第 4,144,050 号明細書、米国特許第 3,920,442 号明細書及び独国特許第 3,246,493 号明細書に教示されるように調製することができる。錠剤は、米国特許第 5,180,587 号明細書、米国特許第 5,232,701 号明細書及び米国特許第 5,208,030 号明細書に教示されるように調製することができる。フィルムは、英国特許第 2,095,558 号明細書及び米国特許第 3,299,566 号明細書に教示されるように調製することができる。

【0258】

配合の技術に関するさらなる情報については、Pesticide Chemistr

y and Bioscience中のT. S. Woods, "The Formulator's Toolbox—Product Forms for Modern Agriculture", The Food—Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds, Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120~133を参照されたい。さらには、以下の文献も参照されたい：米国特許第3, 235, 361号明細書、第6列第16行～第7列第19行、及び実施例10～41；米国特許第3, 309, 192号明細書、第5列第43行～第7列第62行、及び実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167、及び169～182；米国特許第2, 891, 855号明細書、第3列第66行～第5列第17行、及び実施例1～4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96；Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；及びDevelopments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000。

10

20

【0259】

以下の実施例において、全ての配合物は、従来の方法で調製される。化合物の番号は、索引表Aでの化合物を指す。さらなる詳述なしに、先の説明を用いる当業者であれば、本開示を最大限に利用できると考えられる。したがって、以下の実施例は、単に例示として構成されるものであり、何ら本開示を限定するものではない。パーセンテージは、特に明記しない限り、重量基準である。

【0260】

実施例A

高強度濃縮物

化合物2 98.5%

シリカエアロゲル 0.5%

合成非晶質微細シリカ 1.0%

30

【0261】

実施例B

湿潤性粉末

化合物2 65.0%

ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル 2.0%

リグニンスルホン酸ナトリウム 4.0%

ケイアルミン酸ナトリウム 6.0%

モンモリロナイト（焼成された） 23.0%

40

【0262】

実施例C

顆粒

化合物1 10.0%

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

【0263】

実施例D

押出し加工ペレット

化合物3 25.0%

無水硫酸ナトリウム 10.0%

50

粗製リグニンスルホン酸カルシウム 5.0 %
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム 1.0 %
カルシウム／マグネシウムベントナイト 59.0 %
【0264】

実施例 E

乳化性濃縮物

化合物 2 10.0 %
ポリオキシエチレンソルビトールヘキソレエート 20.0 %
C6～C10 脂肪酸メチルエステル 70.0 %
【0265】

10

実施例 F

マイクロエマルジョン

化合物 19 5.0 %
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー 30.0 %
アルキルポリグリコシド 30.0 %
モノオレイン酸グリセリル 15.0 %
水 20.0 %
【0266】

実施例 G

種子処理

化合物 2 20.00 %
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー 5.00 %
モンタン酸ワックス 5.00 %
リグニンスルホン酸カルシウム 1.00 %
ポリオキシエチレン／ポリオキシプロピレンブロックコポリマー 1.00 %
ステアリルアルコール (POE 20) 2.00 %
ポリオルガノシラン 0.20 %
着色剤赤色色素 0.05 %
水 65.75 %
【0267】

20

30

実施例 H

肥料スティック

化合物 1 2.5 %
ピロリドン-スチレンコポリマー 4.8 %
トリスチリルフェニル 16-エトキシレート 2.3 %
タルク 0.8 %
トウモロコシデンプン 5.0 %
緩効性肥料 36.0 %
カオリン 38.0 %
水 10.6 %
【0268】

40

実施例 I

懸濁液濃縮物

化合物 4 35 %
ブチルポリオキシエチレン／ポリプロピレンブロックコポリマー 4.0 %
ステアリン酸／ポリエチレングリコールコポリマー 1.0 %
スチレンアクリルポリマー 1.0 %
キサンタンガム 0.1 %
プロピレングリコール 5.0 %
シリコーン系消泡剤 0.1 %

50

1, 2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン 0.1%

水 53.7%

【0269】

実施例 J

水中のエマルション

化合物 10 10.0%

ブチルポリオキシエチレン／ポリプロピレンブロックコポリマー 4.0%

ステアリン酸／ポリエチレングリコールコポリマー 1.0%

スチレンアクリルポリマー 1.0%

キサンタンガム 0.1%

10

プロピレングリコール 5.0%

シリコン系消泡剤 0.1%

1, 2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン 0.1%

芳香族石油系炭化水素 20.0

水 58.7%

【0270】

実施例 K

油分散体

化合物 19 25%

ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレエート 15%

20

有機変性ベントナイト粘土 2.5%

脂肪酸メチルエステル 57.5%

【0271】

実施例 L

サスポエマルション

化合物 2 10.0%

イミダクロブリド 5.0%

ブチルポリオキシエチレン／ポリプロピレンブロックコポリマー 4.0%

ステアリン酸／ポリエチレングリコールコポリマー 1.0%

スチレンアクリルポリマー 1.0%

30

キサンタンガム 0.1%

プロピレングリコール 5.0%

シリコン系消泡剤 0.1%

1, 2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン 0.1%

芳香族石油系炭化水素 20.0%

水 53.7%

【0272】

本開示の化合物は、広範囲の無脊椎有害生物に対する活性を示す。これらの有害生物は、例えば、植物の茎葉、根、土壌、収穫された作物又は他の食物、建築構造物又は動物の外皮などの様々な環境に生育する無脊椎動物を含む。これらの有害生物は、例えば、茎葉（葉、茎、花及び果実を含む）、種子、木材、紡績繊維、又は動物の血液若しくは組織を摂食し、それによって、例えば、生育中及び貯蔵される農作物、森林、温室作物、観賞植物、苗作物、貯蔵食品若しくは繊維製品、又は家屋若しくはその構造部若しくはその構成部に損傷又は被害を引き起こすか、又は動物衛生若しくは公衆衛生に有害である無脊椎動物を含む。当業者は、全ての化合物が、全ての有害生物の全ての成長段階に対して同等に有効であるわけではないことを理解するであろう。

40

【0273】

したがって、これらの本化合物及び組成物は、農作物を植食性無脊椎有害生物から保護するために農学的に有用であり、他の園芸作物及び植物を植食性無脊椎有害生物から保護するために非農学的にも有用である。この実用性は、遺伝子工学（すなわち、遺伝子導入

50

）によって導入された遺伝物質を含有するか、又は変異生成によって修飾されて、有利な形質をもたらす作物及び他の植物（すなわち、農学的及び非農学的の両方）を保護することを含む。このような形質の例としては、除草剤に対する耐性、植食性有害生物（例えば、昆虫、ダニ、アブラムシ、クモ、線虫、カタツムリ、植物病原性真菌、細菌及びウイルス）に対する耐性、向上した植物の成長、高温又は低温、低い又は高い土壌水分、及び高い塩分などの悪い生育条件に対する向上した耐性、増加した開花又は結果、より高い収穫高、より早い成熟、収穫産物のより高い品質及び／若しくは栄養価、又は収穫産物の向上した貯蔵又は加工特性が挙げられる。トランスジェニック植物は、複数の形質を発現させるように修飾され得る。遺伝子工学又は変異生成によってもたらされた形質を含有する植物の例としては、YIELD GARD（登録商標）、KNOCKOUT（登録商標）、STARLINK（登録商標）、BOLLGARD（登録商標）、NuCOTN（登録商標）及びNEWLEAF（登録商標）、INVICTA RR2 PRO（商標）などの殺虫性バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）毒素を発現するコーン、綿、ダイズ及びジャガイモの品種、並びにROUNDUP READY（登録商標）、LIBERTY LINK（登録商標）、IMI（登録商標）、STS（登録商標）及びCLEARFIELD（登録商標）などのコーン、綿、ダイズ及びナタネの除草剤耐性品種、並びにN-アセチルトランスフェラーゼ（GAT）を発現してグリホサート除草剤に対する耐性をもたらす作物、又はHRA遺伝子を含有してアセト乳酸合成酵素（ALS）を阻害する除草剤に対する耐性をもたらす作物が挙げられる。本化合物及び組成物は、遺伝子工学によって導入された又は変異生成によって修飾された形質により向上された効果を示し、それによって、形質の表現型発現若しくは有効性を向上させるか、又は本化合物及び組成物の無脊椎有害生物防除有効性を高め得る。特に、本化合物及び組成物は、無脊椎有害生物に毒性のあるタンパク質又は他の天然産物の表現型発現により向上された効果を示して、これらの有害生物の、相加作用以上の防除をもたらし得る。

10

20

【0274】

本開示の組成物は、任意選択的に、植物栄養素、例えば、窒素、リン、カリウム、硫黄、カルシウム、マグネシウム、鉄、銅、ホウ素、マンガン、亜鉛、及びモリブデンから選択される少なくとも1つの植物栄養素を含む肥料組成物も含み得る。注目すべきは、窒素、リン、カリウム、硫黄、カルシウム及びマグネシウムから選択される少なくとも1つの植物栄養素を含む少なくとも1つの肥料組成物を含む組成物である。少なくとも1つの植物栄養素をさらに含む本開示の組成物は、液体又は固形分の形態であり得る。注目すべきは、顆粒、小さい棒又は錠剤の形態の固体配合物である。肥料組成物を含む固体配合物は、本開示の化合物又は組成物と肥料組成物とを配合成分と共に混合し、次に、造粒又は押出し成形などの方法によって配合物を調製することによって調製され得る。或いは、固体配合物は、揮発性溶媒中の本開示の化合物又は組成物の溶液又は懸濁液を、寸法的に安定な混合物、例えば、顆粒、小さい棒又は錠剤の形態の予め調製された肥料組成物に噴霧し、次に、溶媒を蒸発させることによって調製され得る。

30

【0275】

非農学的使用は、作物植物の圃場以外の領域における無脊椎有害生物防除を指す。本化合物及び組成物の非農学的使用は、貯蔵された穀物、マメ類及び他の食物、並びに衣類及び絨毯などの布地における無脊椎有害生物の防除を含む。本化合物及び組成物の非農学的使用は、観賞植物、森林、庭、道端及び鉄道敷設用地、並びに芝生、ゴルフ場及び牧草地などの芝における無脊椎有害生物防除も含む。本化合物及び組成物の非農学的使用は、ヒト及び／又はコンパニオンアニマル、農場、牧場、動物園の動物又は他の動物によって占有され得る家屋及び他の建物における無脊椎有害生物防除も含む。本化合物及び組成物の非農学的使用は、建物に使用される木材又は他の構造材料に被害を及ぼし得るシロアリなどの有害生物の防除も含む。

40

【0276】

本化合物及び組成物の非農学的使用は、寄生性であるか又は感染症を伝播する無脊椎有

50

害生物を防除することによって、ヒト及び動物衛生を保護することを含む。動物寄生生物の防除は、宿主動物の身体の表面（例えば、肩、腋の下、腹部、大腿部の内側部分）に寄生する外部寄生生物及び宿主動物の身体の内側（例えば、胃、腸、肺、静脈、皮下、リンパ組織）に寄生する内部寄生生物を防除することを含む。外部に寄生する有害生物又は病害を伝播する有害生物は、例えば、ツツガムシの幼虫、マダニ、シラミ、蚊、ハエ、ダニ及びノミを含む。内部寄生生物は、犬糸状虫、鉤虫及び寄生蠕虫を含む。本開示の化合物及び組成物は、動物における寄生生物による寄生又は感染の全身的及び／又は非全身的防除に好適である。本開示の化合物及び組成物は、外部寄生生物又は病害伝播有害生物に対処するのに特に好適である。本開示の化合物及び組成物は、農業用使役動物、例えば、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、水牛、ウサギ、めんどり、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ及びハチ；ペット動物及び家庭動物、例えば、イヌ、ネコ、ペットの鳥及び観賞魚；並びにいわゆる実験動物、例えば、ハムスター、モルモット、ラット及びマウスに寄生する寄生生物に対処するのに好適である。これらの寄生生物に対処することによって、致死率及び成績低下（肉、ミルク、羊毛、皮、卵、ハチミツなどに関して）が低減され、そのため、本開示の化合物を含む組成物の施用は、動物のより経済的で簡単な畜産を可能にする。

10

20

30

40

50

【0277】

農学的又は非農学的無脊椎有害生物の例としては、鱗翅目（*Lepidoptera*）、例えば、ヤガ科（*Noctuidae*）のヨトウムシ、ネキリムシ、シャクトリムシ、及びタバコガ（例えば、ピンクステムボラー（*Sesamia inferens*）Walker）、コーンスタークボラー（セサミア・ノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioides*）Lefebvre）、南部ヨトウムシ（スポドプテラ・エリダニア（*Spodoptera eridania*）Cramer）、ツマジロクサヨトウ（ツマジロクサヨトウ（*Spodoptera frugiperda*）J. E. Smith）、シロイチモジヨトウガの幼虫（シロイチモジヨトウ（*Spodoptera exigua*）Huebner）、コットンリーフワーム（エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）Boisduval）、イエローストリップヨトウムシ（スポドプテラ・オルニトガリ（*Spodoptera ornithogalli*）Guenee）、ブラックネキリムシ（タマナヤガ（*Agrotis ipsilon*）Hufnagel）、ベルベットビーンイモムシ（アンチカルシア・ゲムマタリス（*Anticarsia gemmatalis*）Huebner）、グリーンフルーツワーム（リトファン・アンテナタ（*Lithophane antennata*）Walker）、キャベツヨトウムシ（ヨトウガ（*Barathra brassicae*）Linnaeus）、ダイズシャクトリムシ（プソイドプルシア・インクルデンス（*Pseudoplusia includens*）Walker）、キャベツシャクトリムシ（イラクサギンウワバ（*Trichoplusia ni*）Huebner）、タバコバドワーム（ニセアメリカタバコガ（*Heliothis virescens*）Fabricius）の卵、幼虫及び成虫；メイガ科（*Pyrallidae*）の穿孔性害虫、繭を作る虫、ウェブワーム、コーンワーム、アオムシ及び食葉性の虫（例えば、ヨーロッパアワノメイガ（アワノメイガ（*Ostrinia nubilalis*）Huebner）、ネーブルオレンジワーム（アミエロイス・トランシテラ（*Amyelois transitella*）Walker）、コーンルートウェブワーム（クランブス・カリギノセルス（*Crambus caliginosellus*）Clemens）、ソッドウェブワーム（メイガ科（*Pyrallidae*）：ツトガ亜科（*Crambinae*））、例えば、ソッドワーム（ヘルペトグランマ・リカルシサリス（*Herpetogramma licarsialis*）Walker）、サトウキビステムボラー（チロ・インフスカテルラス（*Chilo infuscatellus*）Snellen）、トマトスモールボラー（ネオロイシノデス・エレガンタリス（*Neoleucinodes elegantalis*）Guenee）、グリーンハマキムシ（コブノメイガ（*Cnaphalocrocis medinalis*））、グレープリーフフォル

ダー（デスマ・フネラリス（*Desmia funeralis*）Huebner）、
 メロンワーム（ディアファニア・ニチダリス（*Diaphania nitidalis*）
 Stoll）、キャベツセンタースクラブ（ヘルラ・ヒドラリス（*Helluala hydralis*）
 Guenee）、イエローステムボラー（サンカメイチュウ（*Scirpophaga incertulas*）
 Walker）、アーリーシュートボラー（スシルポファガ・インフスカテラス（*Scirpophaga infuscatellus*）
 Snellen）、ホワイトステムボラー（スシルポファガ・インノタタ（*Scirpophaga innotata*）
 Walker）、トップシュートボラー（スシルポファガ・ニベラ（*Scirpophaga nivella*）
 Fabricius）、ダークヘッドライスボラー（チロ・ポリクリス（*Chilo polyc
 hrysus*）Meyrick）、ストライプドライスボラー（ニカメイガ（*Chilo suppressalis*）
 Walker）、キャベツクラスターイモムシ（ケブカ
 ノメイガ（*Crocidolomia binotalis*）English）；ハマ
 キガ科（*Tortricidae*）のハマキムシ、ブッドワーム、シードワーム、及びフ
 ルーツワーム（例えば、コドリング（コドリング（*Cydia pomonella*）
 Linnaeus）、グレープベリーモス（パラロベシア・ビテアナ（*Endopiza
 viteana*）Clemens）、ナシヒメシンクイ（ナシヒメシンクイ（*Grapho
 litata molesta*）Busck）、ミカンセコドリング（クリプトフレビア
 ・ロイコトレタ（*Cryptophlebia leucotreta*）Meyrick）、シトラスボラー（エクジトロファ・アウランチアナ（*Ecdytolopha a
 urantiana*）Lima）、赤色縞ハマキムシ（アルギロテニア・ベルチナナ（*A
 rgyrotaenia velutinana*）Walker）、斜め縞ハマキムシ（
 コリストネウラ・ロサセアナ（*Choristoneura rosaceana*）Harris）、薄茶
 リンゴガ（エピフィアス・ポスティフィッタナ（*Epiphyas postvittana*）
 Walker）、ヨーロップグレープベリーモス（ブドウホソハ
 マキ（*Eupoecilia ambiguella*）Huebner）、アップルブ
 ドモス（パンデミス・ピルサナ（*Pandemis pyrusana*）Kearfoot）、雑食性
 ハマキムシ（プラチノタ・スツルタナ（*Platynota stultana*）Walsingham）、
 縞のある果樹ハマキガ（パンデミス・セラサナ（*Pandemis cerasana*）
 Huebner）、リンゴブラウンハマキガ（パンデミス・ヘパラナ（*Pandemis
 heparana*）Denis & Schiffermueller）；及び多くの
 他の経済的に重要な鱗翅目（*Lepidoptera*）（例えば、コナガ（コナガ（*Pl
 utella xylostella*）Linnaeus）、ワタキバガの幼虫（ベクチ
 ノホラ・ゴッシピエラ（*Pectinophora gossypiella*）Saunders）、マイマイガ（
 マイマイガ（*Lymantria dispar*）Linnaeus）、モモフルーツボラー（カルポシナ・ニポネンシス（*Carposina n
 iponensis*）Walsingham）、モモツイグボラー（アナルシア・リ
 ネアテラ（*Anarsia lineatella*）Zeller）、ジャガイモキバガ
 の幼虫（ジャガイモガ（*Phthorimaea operculella*）Zeller）、スポテッド
 テニフォームハモグリムシ（リソコレティス・ブランカルデラ（*Lit
 hocolletis blancardella*）Fabricius）、アジアリン
 ゴハモグリムシ（リソコレティス・リンゴニエラ（*Lithocolletis rin
 gonella*）Matsumura）、イネハマキムシ（レロデア・エウファラ（*L
 erodea eufala*）Edwards）、リンゴハモグリムシ（ロイコプテラ・
 シテラ（*Leucoptera scitella*）Zeller）；チャバネゴキブ
 リ科（*Blattellidae*）及びゴキブリ科（*Blattidae*）のゴキブリを
 含むゴキブリ目（*Blattodea*）（例えば、トウヨウゴキブリ（トウヨウゴキブリ
 （*Blatta orientalis*）Linnaeus）、アジアゴキブリ（ブラッ
 テラ・アサヒナイ（*Blatella asahinai*）Mizukubo）、ドイツ

10

20

30

40

50

ゴキブリ (チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) Linnaeus)、チャオビゴキブリ (スペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) Fabricius)、ワモンゴキブリ (ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*) Linnaeus)、トビイロゴキブリ (ペリプラネタ・ブルネア (*Periplaneta brunnea*) Burmeister)、マデイラゴキブリ (ロイコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*) Fabricius)、クロゴキブリ (ペリプラネタ・フリギノサ (*Periplaneta fuliginosa*) Service)、コワモンゴキブリ (ペリプラネタ・オーストララシアエ (*Periplaneta australasiae*) Fabr.)、ロブスターゴキブリ (ナウホエタ・シネレア (*Nauphoeta cinerea*) Olivier) 及びスームスゴキブリ (シンプロセ・パレンス (*Symptloce pallens*) Stephens) の卵、若虫及び成虫；ヒゲナガゾウムシ科 (*Anthribidae*)、マメゾウムシ科 (*Bruchidae*)、及びゾウムシ科 (*Curculionidae*) のゾウムシを含む鞘翅目 (*Coleoptera*) (例えば、ワタミハナゾウムシ (メキシコワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*) Boheman)、イネミズゾウムシ (リソルホプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhopterus oryzophilus*) Kuschel)、グラナリアコクゾウムシ (シトフィラス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*) Linnaeus)、ココクゾウムシ (シトフィラス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*) Linnaeus)、スズメノカタビラゾウムシ (リストロノツス・マキュリコリス (*Listronotus maculicollis*) Dietz)、ブルーグラスゾウムシ (スフェノフォルス・パルウルス (*Sphenophorus parvulus*) Gyllenhal)、シバオサゾウムシ (スフェノフォルス・ベナタス・ベスチタス (*Sphenophorus venatus vestitus*))、デンバーゾウムシ (スフェノフォルス・シカトリストリツス (*Sphenophorus cicatristriatus*) Fahraeus) の卵、食葉性、食果実性、食根性、食種子性並びに食小胞状組織性幼虫及び成虫；ハムシ科 (*Chrysomelidae*) のノミハムシ、ウリハムシ、ネクイムシ、ハムシ、イモハムシ及びハモグリムシ (例えば、コロラドハムシ (コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) Say)、ウェスタンコーンルートワーム (ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*) LeConte)；コガネムシ科 (*Scarabaeidae*) のコガネムシ及び他の甲虫 (例えば、マメコガネ (マメコガネ (*Popillia japonica*) Newman)、セマダラコガネ (セマダラコガネ (*Anomala orientalis*) Waterhouse、セマダラコガネ (*Exomala orientalis*) (Waterhouse) Baraud)、北部コガネカブト (シクロセファラ・ボレアリス (*Cyclocephala borealis*) Arrow)、南部コガネカブト (シクロセファラ・イマキュラタ (*Cyclocephala immaculata*) Olivier又はC. ルリダ (*C. lurida*) Bland)、フンコロガシ及び地虫 (マグソコガネ属 (*Aphodius* spp.))、クソコガネの1種 (アタエニウス・スプレツルス (*Ataenius spretulus*) Haldeman)、アオコフキコガネ (コチニス・ニチダ (*Cotinis nitida*) Linnaeus)、アカビロウドコガネ (アカビロウドコガネ (*Maladera castanea*) Arrow)、コフキコガネ (フィロファガ属 (*Phyllophaga* spp.)) 及びヨーロッパコガネムシ (リオトウス・マジヤリス (*Rhizotrogus majalis*) Razoumowsky)；カツオブシムシ科 (*Dermeestidae*) のカツオブシムシ；コメツキムシ科 (*Elateridae*) のコメツキムシの幼虫；キクイムシ科 (*Scolytidae*) のキクイムシ及びゴミムシダマシ科 (*Tenebrionidae*) のコクヌストモドキが挙げられる。

【0278】

10

20

30

40

50

さらに、農学的及び非農学的有害生物としては、以下が挙げられる： クギヌキハサミムシ科 (Forficulidae) のハサミムシ (例えば、ヨーロッパハサミムシ (フォルフィキュラ・オーリキュラリア (Forficula auricularia) Linnaeus)、ブラックハサミムシ (チェリソチェス・モリオ (Chelisoches morio) Fabricius)) を含む革翅目 (Dermaptera) の卵、成虫及び幼虫；半翅目 (Hemiptera)、例えば、メクラカメムシ科 (Miridae) のカスミカメムシ、セミ科 (Cicadidae) のセミ、ヨコバイ科 (Cicadellidae) のヨコバイ (例えば、ミドリヒメヨコバイ属 (Empoasca spp.))、トコジラミ科 (Cimicidae) のトコジラミ (例えば、シメックス・レクチュラリウス (Cimex lectularius) Linnaeus)、ビワハゴロモ科 (Fulgoridae) 及びウンカ科 (Delphacidae) のウンカ、ツノゼミ科 (Membracidae) のツノゼミ、ヒラズキジラミ科 (Liviidae) 、キジラミ科 (Psyllidae) 、及びトガリキジラミ科 (Triozidae) のキジラミ、コナジラミ科 (Aleyrodidae) のコナジラミ、アブラムシ科 (Aphididae) のアブラムシ、ネアブラムシ科 (Phylloxeridae) のネアブラムシ、コナカイガラムシ科 (Pseudococcidae) のコナカイガラムシ、カタカイガラムシ科 (Coccidae) 、マルカイガラムシ科 (Diaspididae) 及びワタフキカイガラムシ科 (Margarodidae) のカイガラムシ、グンバイムシ科 (Tingidae) グンバイムシ、カメムシ科 (Pentatomidae) のカメムシ、ナガカメムシ科 (Lygaeidae) のアメリカコバネナガカメムシ (例えば、毛深いアメリカコバネナガカメムシ (ブリサス・ロイコプテルス・ヒルツス (Blissus leucopterus hirtus) Montandon) 及び南部アメリカコバネナガカメムシ (ブリサス・インスラリス (Blissus insularis) Barber)) 及び他のシードバグ、アワフキムシ科 (Cercopidae) のアワフキムシ、ヘリカメムシ科 (Coreidae) のヘリカメムシ、並びにホシカメムシ科 (Pyrrhocoridae) のアカホシカメムシ及びコットンステイナーの卵、幼体、成虫及び若虫。

10

20

30

40

50

【0279】

農学的及び非農学的有害生物としては、以下も挙げられる：ダニ目 (Acarı) (ダニ)、例えば、ハダニ科 (Tetranychidae) のハダニ及びアカダニ (例えば、ヨーロッパアカダニ (リングハダニ (Panonychus ulmi) Koch)、ナミハダニ (ハダニ (Tetranychus urticae) Koch)、マクダニエルダニ (テトラニクス・マクダニエリ (Tetranychus mcdanieli) McGregor)) ；ヒメハダニ科 (Tenuipalpidae) のヒメハダニ (例えば、オンシツヒメハダニ (ブドウヒメハダニ (Brevipalpus lewisii) McGregor)) ；フシダニ科 (Eriophyidae) のサビダニ及びフシダニ並びに他の食葉性ダニ並びにヒト及び動物衛生において重要なダニ、すなわち、トリハダダニ科 (Epidermoptidae) のチリダニ、ニキビダニ科 (Demodicidae) のニキビダニ、ニクダニ科 (Glycyphagidae) のコナダニ；カタダニとして一般的に知られているマダニ科 (Ixodidae) のマダニ (例えば、シカダニ (クロアシマダニ (Ixodes scapularis) Say)、オーストラリアまひダニ (イクソデス・ホロシクルス (Ixodes holocyclus) Neumann)、アメリカイヌダニ (アメリカイヌカクマダニ (Dermacentor variabilis) Say)、ローンスターダニ (アメリカキララマダニ (Amblyomma americanum) Linnaeus)) 及びヒメダニとして一般的に知られているヒメダニ科 (Argasidae) のマダニ (例えば、回帰熱ダニ (オルニトドロス・ツリカタ (Ornithodoros turicata))、一般家禽ダニ (アルガス・ラジアツス (Argas radiatus))) ；キュウセンダニ科 (Psoroptidae) 、シラミダニ科 (Pyemotidae) 、及びヒゼンダニ科 (Sarcoptidae) のヒゼンダニ及び疥癬虫の卵、幼虫、若虫及び成虫；バッタ、

ワタリバッタ及びコオロギ（例えば、移動性バッタ（例えば、メラノプラス・サングイニ
 ペス（*Melanoplus sanguinipes*）Fabricius、M. ディ
 ファレンシャリス（*M. differentialis*）Thomas）、アメリカバッ
 タ（例えば、シストセルカ・アメリカーナ（*Schistocerca america
 na*）Drury）、砂漠ワタリバッタ（サバクトビバッタ（*Schistocerca
 gregaria*）Forsk.）、移動性ワタリバッタ（トノサマバッタ（*Locu
 sta migratoria*）Linnaeus）、ブッシュワタリバッタ（ゾノセラ
 ス属（*Zonocerus* spp.））、イエコオロギ（アセタ・ドメスティクス（*Ac
 heta domesticus*）Linnaeus）、ケラ（例えば、黄褐色ケラ（ス
 カプテリスクス・ビシナス（*Scapteriscus vicinus*）Scudde
 r）及び南部ケラ（スカプテリスクス・ボレリイ（*Scapteriscus bore
 llii*）Gigliotto）を含む直翅目（Orthoptera）の卵、成虫
 及び幼体；ハモグリムシ（例えば、リリオミザ属（*Liriomyza* spp.）、例
 えば、マメ野菜ハモグリムシ（トマトハモグリバエ（*Liriomyza sativa
 e*）Blanchard）、小虫、ミバエ（ミバエ科（*Tephritidae*））、
 キモグリ（例えば、オスシネラ・フリット（*Oscinella frit*）Linna
 eus）、土壌中蛆虫、イエバエ（例えば、イエバエ（*Musca domestica*
 ）Linnaeus）、小イエバエ（例えば、ヒメイバエ（*Fannia canic
 ularis*）Linnaeus、F. フェモラリス（*F. femoralis*）Ste
 in）、サシバエ（例えば、サシバエ（*Stomoxys calcitrans*）Li
 nnaeus）、フェースフライ、ノサシバエ、クロバエ（例えば、オビキンバエ属（*C
 hrysomya* spp.）、ホルミア属（*Phormia* spp.））、及び他の
 キンバエ有害生物、ウマバエ（例えば、アブ属（*Tabanus* spp.））、ヒツジ
 バエ（例えば、ウマバエ属（*Gastrophilus* spp.）、オエストルス属（*Oestrus*
 spp.））、ウシバエ（例えば、ヒフバエ属（*Hypoderma*
 spp.））、メクラアブ（例えば、クリソップス属（*Chrysops* spp.））、
 ヒツジシラミバエ（例えば、メロファグス・オビヌス（*Melophagus ovi
 nus*）Linnaeus）及び他の短角亜目（Brachycera）、蚊（例えば、
 ヤブカ属（*Aedes* spp.）、ハマダラカ属（*Anopheles* spp.）、
 イエカ属（*Culex* spp.））、ブヨ（例えば、プロシムリウム属（*Prosim
 ulium* spp.）、シムリウム属（*Simulium* spp.））、ヌカカ、ス
 ナバエ、クロバネキノコバエ、及び他の長角亜目（Nematocera）を含む双翅目
 （Diptera）の卵、
 成虫及び幼体；ネギアザミウマ（ネギアザミウマ（*Thrips tabaci*）Lin
 deman）、ヒラズハナアザミウマ（フランクリニエラ属（*Frankliniell
 a* spp.））、及び他の食葉性アザミウマを含む総翅目（Thysanoptera
 ）の卵、成虫及び幼体；フロリダオオアリ（カムポノツス・フロリダヌス（*Campon
 otus floridanus*）Buckley）、アカオオアリ（カムポノツス・フ
 ェルギネウス（*Camponotus ferrugineus*）Fabricius）、
 クロオオアリ（カムポノツス・ペンシルバニクス（*Camponotus penns
 ylvanicus*）De Geer）、シロアシアリ（テクノミルメックス・アルビペ
 ス（*Technomyrmex albipes*）fr. Smith）、オオアタマアリ
 （フェイドール属（*Pheidole* sp.））、ゴーストアリ（タビノマ・メラノセ
 ファルム（*Tapinoma melanocephalum*）Fabricius）；
 イエヒメアリ（モノモリウム・ファラオニス（*Monomorium pharaoni
 s*）Linnaeus）、チビヒアリ（ワスマニア・アウロプンクタータ（*Wasman
 nia auropunctata*）Roger）、ヒアリ（ソレノプシス・ゲミナタ（*Solenopsi
 s geminata*）Fabricius）、アカヒアリ（ソレノ
 プシス・インビクタ（*Solenopsis invicta*）Buren）、アルゼン
 チンアリ（イリドミルメックス・フミリス（*Iridomyrmex humilis*）

10

20

30

40

50

Mayr)、クレイジーアリ(パラトレキナ・ロングコルニス(*Paratrechina longicornis*) Latreille)、ペイブメントアリ(テトラモリウム・カエスピウム(*Tetramorium caespitum*) Linnaeus)、トウモロコシ畑アリ(ラシウス・アリエヌス(*Lasius alienus*) Foerster)及び臭いのあるイエアリ(タピノマ・セシル(*Tapinoma sessile*) Say)を含むアリ科(Formicidae)のアリを含む膜翅目(Hymenoptera)の昆虫有害生物。ハチ(クマバチを含む)、スズメバチ、イエロージャケツ、カリバチ、及びハバチ(ネオジプリオン属(*Neodiprion* spp.) ;セフス属(*Cephus* spp.))を含む他の膜翅目(Hymenoptera) ;シロアリ科(Termitidae)のシロアリ(例えば、マクロテルメス属(*Macrotermes* sp.)、オドントテルメス・オベサス(*Odontotermes obesus*) Rambur)、レイビシロアリ科(Kalotermitidae)(例えば、クリプトテルメス属(*Cryptotermes* sp.))、及びミゾガシラシロアリ科(Rhinotermitidae)(例えば、レチクリテルメス属(*Reticulitermes* sp.)、コプトテルメス属(*Coptotermes* sp.)、ヘテロテルメス・テヌイス(*Heterotermes tenuis*) Hagen)、東部地下シロアリ(レチクリテルメス・フラビペス(*Reticulitermes flavipes*) Kollar)、西部地下シロアリ(レチクリテルメス・ヘスペルス(*Reticulitermes hesperus*) Banks)、イエシロアリ(コプトテルメス・ホルモサヌス(*Coptotermes formosanus*) Shiraki)、ウエストインディアンドライウッドシロアリ(インシシテルメス・イミグランス(*Incisitermes immigrans*) Snyder)、パウダーポストシロアリ(クリプトテルメス・ブレビス(*Cryptotermes brevis*) Walker)、ドライウッドシロアリ(インシシテルメス・スナイデリ(*Incisitermes snyderi*) Light)、南東部地下シロアリ(レチクリテルメス・バージニカス(*Reticulitermes virginicus*) Banks)、西部ドライウッドシロアリ(アメリカカンザイシロアリ(*Incisitermes minor*) Hagen)、樹上シロアリ、例えば、ナスティテルメス属(*Nasutitermes* sp.)及び経済的に重要な他のシロアリを含むシロアリ目(Isoptera)の昆虫有害生物 ;シミ目(Thysanura)、例えば、セイヨウシミ(セイヨウシミ(*Lepisma saccharina*) Linnaeus)及びマダラシミ(テルモビア・ドメスチカ(*Thermobia domestica*) Packard)の昆虫有害生物 ;食毛目(Mallophaga)であって、アタマジラミ(アタマジラミ(*Pediculus humanus capitis*) De Geer)、コロモジラミ(ペジクルス・フマヌス(*Pediculus humanus*) Linnaeus)、ニワトリジラミ(メナカンタス・ストラミネウス(*Menacanthus stramineus*) Nitsch)、犬刺咬シラミ(イヌハジラミ(*Trichodectes canis*) De Geer)、綿毛状シラミ(ゴニオコテス・ガリナエ(*Goniocotes gallinae*) De Geer)、ヒツジジラミ(sheep body louse)(ヒツジハジラミ(*Bovicola ovis*) Schrank)、ウシジラミ(ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*) Nitsch)、ハナナガウシジラミ(ウシホソジラミ(*Linognathus vituli*) Linnaeus)並びに人及び動物を攻撃する他の吸血性及び刺咬性寄生性シラミを含む昆虫有害生物 ;オリエンタルラットノミ(ケオプスネズミノミ(*Xenopsylla cheopis*) Rothschild)、ネコノミ(ネコノミ(*Ctenocephalides felis*) Bouche)、イヌノミ(イヌノミ(*Ctenocephalides canis*) Curtis)、ニワトリノミ(セラトフィラス・ガリナエ(*Ceratophyllus gallinae*) Schrank)、吸着ノミ(エキドノファガ・ガリナセア(*Echidnophaga gallinacea*) Westwood)、ヒト

10

20

30

40

50

ノミ（ヒトノミ（*Pulex irritans*）Linnaeus）並びに哺乳動物及び鳥類に侵入する他のノミを含むノミ目（*Siphonoptera*）の昆虫有害生物。包含されるさらなる節足動物有害生物としては、以下が挙げられる：真正クモ目（*Ara neae*）のクモ、例えば、ドクイトグモ（ロクススセレス・レクルーサ（*Loxosceles reclusa*）Gertsch & Mulaik）及びクロゴケグモ（ラトロデクツス・マクタンズ（*Latrodectus mactans*）Fabricius）、並びにゲジ目（*Scutigeromorpha*）のムカデ、例えば、イエムカデ（スクチゲラ・コレオプトラタ（*Scutigera coleoptrata*）Linnaeus）。

【0280】

10

貯蔵された穀物の無脊椎有害生物の例としては、ナガシンクイムシ（プロステファヌス・トルンカツス（*Prostephanus truncatus*））、キクイムシ（リゾペルタ・ドミニカ（*Rhyzopertha dominica*））、ココクゾウムシ（シトフィラス・オリザエ（*Stiophilus oryzae*））、トウモロコシゾウムシ（シトフィルス・ゼアマイス（*Stiophilus zeamais*））、ササゲゾウムシ（カロソブルーカス・マキュラタス（*Callosobruchus maculatus*））、コクヌストモドキ（トリボリウム・カスターネウム（*Tribolium castaneum*））、グラナリアコクゾウムシ（シトフィラス・グラナリウス（*Stiophilus granarius*））、ノシメマダラメイガ（プロディア・インタープンクテラ（*Plodia interpunctella*））、地中海コクヌストモドキ（エフェスチア・クエーニエラ（*Ephestia kuhnii*））及びカクムネチビヒラタムシ又はサビカクムネヒラタムシ（サビカクムネヒラタムシ（*Cryptolestis ferrugineus*））が挙げられる。

20

【0281】

本開示の化合物は、限定されないが、経済的に重要な農業有害生物（すなわち、ネコブセンチュウ属（*Meloidogyne*）のネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ属（*Pratylenchus*）のネグサレセンチュウ、ユミハリセンチュウ属（*Trichodorus*）のユミハリセンチュウなど）並びに動物及びヒト衛生有害生物（すなわち、ウマにおける普通円虫（*Strongylus vulgaris*）、イヌにおける犬回虫（*Toxocara canis*）、ヒツジにおける捻転胃虫（*Haemonchus contortus*）、イヌにおける犬糸状虫（*Dirofilaria immitis* Leidy）、ウマにおける葉状条虫（*Anoplocephala perfoliata*）、反すう動物における肝蛭虫（*Fasciola hepatica* Linnaeus）などの全ての経済的に重要な吸虫、条虫、及び回虫）などの円虫目（*Strongylida*）、回虫目（*Ascaridida*）、ギョウチュウ目（*Oxyurida*）、桿線虫目（*Rhabditiida*）、旋尾線虫目（*Spirurida*）、及びエノブルス目（*Enoplida*）の経済的に重要なメンバーを含む線形動物（*Nematoda*）、条虫綱（*Cestoda*）、吸虫綱（*Trematoda*）、及び鉤頭虫門（*Acanthocephala*）の分類のメンバーに対して活性を有し得る。

30

【0282】

40

本開示の化合物は、鱗翅目（*Lepidoptera*）の有害生物（例えば、アラバマ・アルギラセア（*Alabama argillacea*）Huebner（コットンリーフワーム）、アルキプス・アルギロスピラ（*Archips argyrospila*）Walker（フルーツツリーリーフローラー）、A. ロサナ（*A. rosana*）Linnaeus（ヨーロップリーフローラー）及び他のアルキプス属（*Archips*）種、ニカメイガ（*Chilo suppressalis*）Walker（ライスステムボラー）、クナファロクロシス・メジナリス（*Cnaphalocrosis medinalis*）Guenee（ライスリーフローラー）、克蘭プス・カリギノセルス（*Crambus caliginosellus*）Clemens（コーンルートウェブワーム）、克蘭プス・テテレルス（*Crambus teterrellus*）Zin

50

cken (ブルーグラスウェブワーム)、コドリング (*Cydia pomonella*) Linnaeus (コドリング)、エアリアス・インストラナ (*Earias insulana*) Boisduval (スパイニーボウルワーム)、エアリアス・ビッテラ (*Earias vittella*) Fabricius (スポテッドボウルワーム)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) Huebner (オオタバコガ)、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) Boddie (アメリカタバコガの幼虫)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) Fabricius (ニセアメリカタバコガ)、ヘルペトグランマ・リカルシサリス (*Herpetogramma licarsialis*) Walker (ソッドウェブワーム)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*) Denis & Schiffermuellet (グレープベリーモス)、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*) Saunders (ワタアカミムシガの幼虫)、フィロクニスティス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*) Stainton (ミカンハモグリバエ)、オオモンシロチョウ (*Pieris brassicae*) Linnaeus (オオモンシロチョウ)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) Linnaeus (モンシロチョウ)、コナガ (*Plutella xylostella*) Linnaeus (コナガ)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) Huebner (シロイチモンジヨトウ)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) Fabricius (ハスモンヨトウ、クラスターイモムシ)、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) J. E. Smith (ツマジロクサヨトウ)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*) Huebner (キャベツシャクトリムシ) 及び トマトキバガ (*Tuta absoluta*) Meyrick (トマトハモグリバエ) に対して特に高い活性を示す。

10

20

30

40

50

【0283】

本開示の化合物はまた、以下を含む半翅目 (Hemiptera) のメンバーに対してかなりの活性を有し得る：エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum*) Harris (エンドウヒゲナガアブラムシ)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*) Koch (ササゲアブラムシ)、マメクロアブラムシ (*Aphis fabae*) Scopolii (マメクロアブラムシ)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) Glover (ワタアブラムシ、メロンアブラムシ)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*) De Geer (リンゴアブラムシ)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*) Patch (スパイレアアブラムシ)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*) Kaltenbach (フォックスグローブアブラムシ)、イチゴケナガアブラムシ (*Chaetosiphon fragaefolii*) Cockerell (イチゴアブラムシ)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*) Kurdjumov / Mordvilko (ロシアコムギアブラムシ)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*) Passerini (バラ色リンゴアブラムシ)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*) Hausmann (リンゴワタムシ)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*) Geoffroy (ミリーブラムアブラムシ)、リパフィス・プソイドブラシカ (*Lipaphis pseudobrassicae*) Davis (ニセダイコンアブラムシ)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*) Walker (穀物アブラムシ)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*) Thomas (ジャガイモアブラムシ)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) Sulzer (モモジャガイモアブラムシ、モモアカアブラムシ)、レタスヒゲナガアブラムシ (*Nasonovia ribisnigri*) Mosley (レタスアブラムシ)、ペンフィガス属 (*Pemphigus* spp.) (根アブラムシ及びコブアブラムシ)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum m*

aidis) Fitch (トウモロコシアブラムシ)、ムギクビレアブラムシ (Rhopalosiphum padi) Linnaeus (バードチェリー-オートアブラムシ)、シザフィス・グラミナム (Schizaphis graminum) Rondani (ムギミドリアブラムシ)、シトビオン・アベナエ (Sitobion avenae) Fabricius (イングリッシュグレインアブラムシ)、テリオアフィス・マクラタ (Therioaphis maculata) Buckton (スポテッドアルファルファアブラムシ)、コミカンアブラムシ (Toxoptera aurantii) Boyer de Fonscolombe (黒ミカンアブラムシ)、及びトキシプロテラ・シトリシズス (Toxoptera citricidus) Kirkaldy (茶ミカンアブラムシ) ; アデルゲス属 (Adelges spp.) (カサアブラムシ) ; フィロキセラ・デバスタトリクス (Phylloxera devastatrix) Pergande (ペカンフィロキセラ) ; タバココナジラミ (Bemisia tabaci) Gennadius (タバココナジラミ、サツマイモコナジラミ)、シルバーリーフコナジラミ (Bemisia argentifolii) Bellows & Perring (シルバーリーフコナジラミ)、ミカンコナジラミ (Dialeurodes citri) Ashmead (ミカンコナジラミ) 及びオンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum) Westwood (オンシツコナジラミ) ; ジャガイモヒメヨコバイ (Empoasca fabae) Harris (ジャガイモヒメヨコバイ)、ヒメトビウンカ (Laodelphax striatellus) Fallen (スモラーブラウンプラントホッパー)、マクロステス・クアドリリネアツス (Macrostelus quadrilineatus) Forbes (アスターリーフホッパー)、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps) Uhler (グリーンライスリーフホッパー)、クロスジツマグロヨコバイ (Nephotettix nigropictus) Stal (ライスリーフホッパー)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens) Stal (ブラウンプラントホッパー)、トウモロコシウンカ (Peregrinus maidis) Ashmead (コーンプラントホッパー)、セジロウンカ (Sogatella furcifera) Horvath (ホワイバックドプラントホッパー)、タゴソデス・オリジコルス (Tagosodes orizicolus) Muir (ライスデルファシッド)、ティフロシバ・ポマリア (Typhlocyba pomaria) McAtee (ホワイアツプルリーフホッパー)、エリトロネウラ属 (Erythroneura spp.) (ブドウリーフホッパー) ; マギシダダ・セプテンデシム (Magicidada septendecim) Linnaeus (周期ゼミ) ; イセリアカイガラムシ (Icerya purchasi) Maskell (ワタフキカイガラムシ)、クアドラスピディオツス・ペルニシオサス (Quadraspidiotus perniciosus) Comstock (サンノゼカイガラムシ) ; ミカンコナカイガラムシ (Planococcus citri) Risso (ミカンコナカイガラムシ) ; シュードコッカス属 (Pseudococcus spp.) (他のコナカイガラムシ複合体) ; カコプシラ・ピリコラ (Cacopsylla pyricola) Foerster (セイヨウナシキジラミ)、トリオザ・ジオスピリ (Triozia diospyri) Ashmead (カキキジラミ)。

【0284】

本開示の化合物はまた、以下を含む半翅目 (Hemiptera) のメンバーに対して活性を有する：アクロステルナム・ヒラレ (Acrosternum hilare) Say (アオカメムシ)、アナサ・トリスチス (Anasa tristis) De Geer (ヘリカメムシ)、ブリサス・ロイコプテラス・ロイコプテラス (Blissus leucopterus leucopterus) Say (アメリカコバネナガカメムシ)、シメックス・レクチュラリウス (Cimex lectularius) Linnaeus (トコジラミ) コリツカ・ゴッシピイ (Corythuca gossypii) Fabricius (コットンレースバグ)、シルトペルチス・モデスタ (Cyrtos

10

20

30

40

50

peltis modesta) *Distant* (トマトバグ)、*Dysdercus suturellus* *Herrich-Schaeffer* (コットンステイナー)、*Euchistus servus* *Say* (ブラウンカメムシ)、*Euchistus variolarius* *Palisot de Beauvois* (ワンスポットドカメムシ)、*Graptosthetus* spp. (シードバグの複合体)、*Halymorpha halys* *Stal* (ブラウン大理石様カメムシ)、*Leptoglossus corculus* *Say* (リーフフーティッドパインシードバグ)、*Lygus lineolaris* *Palisot de Beauvois* (ミドリメクラガメ)、*Nezara viridula* *Linnaeus* (ミナミアオカメムシ)、*Oebalus pugnax* *Fabricius* (ライスカメムシ)、*Oncopeltus fasciatus* *Dallas* (ラージミルクウィードバグ)、*Pseudatomoscelis seriatus* *Reuter* (コットンフリーホッパー)。本開示の化合物によって防除される他の昆虫目としては、総翅目 (*Thysanoptera*) (例えば、*Frankliniella occidentalis* *Pergande* (ミカンキイロアザミウマ)、*Scirtothrips citri* *Moulton* (ミカンアザミウマ)、*Sericothrips variabilis* *Beach* (ダイズアザミウマ)、及び *Thrips tabaci* *Lindeman* (ネギアザミウマ)；並びに鞘翅目 (*Coleoptera*) (例えば、*Leptinotarsa decemlineata* *Say* (コロラドハムシ)、*Epilachna varivestis* *Mulsant* (インゲンテントウ) 及び *Agriotes* 属 (アトウス属 (*Athous*) 又は *Limonius* 属 (コメツキムシの幼虫) が挙げられる。

10

20

30

40

50

【0285】

注目すべきは、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) を防除するための本開示の化合物の使用である。注目すべきは、コナガ (*Plutella xylostella*) を防除するための本開示の化合物の使用である。注目すべきは、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) を防除するための本開示の化合物の使用である。

【0286】

本開示の化合物は、作物植物の活力を増加させるためにも有用である。本方法は、作物植物 (例えば、葉、花、果実若しくは根) 又は作物植物が成長する種子を、所望の植物活力効果を達成するために十分な量 (すなわち生物学的に有効な量) の式1の化合物と接触させることを含む。典型的に、式1の化合物は、配合された組成物で施用される。式1の化合物は、多くの場合、作物植物又はその種子に直接施用されるが、作物植物の位置、すなわち作物植物の環境、特に式1の化合物が作物植物に移行するのに十分近接した環境の部分に施用することも可能である。本方法に関連する位置は、最も一般的には、植物が栽培される成長培地 (すなわち植物に栄養分を供給する培地)、典型的に土壌を含む。したがって、作物植物の活力を増加させるための作物植物の処理は、作物植物、作物植物が成長する種子又は作物植物の位置を、生物学的に有効な量の式1の化合物と接触させることを含む。

【0287】

作物活力の増加により、以下の観察される効果の1つ以上をもたらすことができる：

(a) 優れた種子発芽、作物出芽及び作物の立ち (*crop stand*) によって示される最適な作物生育；(b) 急速且つ強健な葉の成長 (例えば、葉面積指数によって測定

）、植物の高さ、分蘖の数（例えば、イネの場合）、根の量及び作物の成長部分の全乾重量によって示される作物の成長の向上；（c）開花までの時間、開花期間、花の数、総バイオマス蓄積（すなわち収量）及び／又は生産物の果実又は穀物等級の市場性（すなわち収量品質）によって示される、作物収量の向上；（d）植物病害の感染及び節足動物、線虫又は軟体動物有害生物の感染に耐性を示すか、又は予防する作物の能力の向上；並びに（e）極端な温度、最適ではない水分又は植物毒性化学物質に暴露されるなどの環境ストレスに耐性を示す作物の能力の向上。

【0288】

本開示の化合物は、植物の環境における植食性無脊椎有害生物を死滅させるか又は他の形でその摂食を防止することによって、非処理の植物と比較して、処理された植物の活力を増加させることができる。このような植食性無脊椎有害生物の防除がない場合、有害生物は、植物組織若しくは樹液を消費するか、又はウイルスなどの植物病原体を媒介することによって植物の活力を低下させる。また植食性無脊椎有害生物が存在しない場合でも、本開示の化合物は、植物の代謝を変性することによって植物の活力を増加させることができる。一般に、作物植物の活力は、植物が非理想的環境、すなわち植物が理想的環境で示すであろう完全な遺伝的潜在能力を達成するために不利な1つ以上の態様を含む環境で栽培される場合、本開示の化合物で植物を処理することによって最も著しく増加するであろう。

10

【0289】

注目すべきは、植食性無脊椎有害生物を含む環境で成長する作物植物の活力を増加させる本発明の方法である。植食性無脊椎有害生物を含まない環境で成長する作物植物の活力を増加させる本発明の方法も注目される。作物植物の成長を支持するために理想的ではない量の水分を含む環境で成長する作物植物の活力を増加させる本発明の方法も注目される。注目すべきは、作物がイネである作物植物の活力を増加させる本発明の方法である。作物がトウモロコシ（コーン）である作物植物の活力を増加させる本発明の方法も注目される。作物がダイズである作物植物の活力を増加させる本発明の方法も注目される。

20

【0290】

本開示の化合物は、殺虫剤、殺真菌剤、殺線虫剤、殺真菌剤、殺ダニ剤、除草剤、除草剤毒性緩和剤、成長調節剤、例えば、昆虫脱皮阻害剤及び発根促進剤、化学止血剤、半化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激剤、他の生物活性化合物又は昆虫病原性細菌、ウイルス若しくは真菌類を含む1つ以上の他の生物活性化合物若しくは薬剤と混合して、さらに広い農学的及び非農学的実用性のスペクトルを与える多成分殺虫剤を形成することができる。したがって、本開示はまた、生物学的に有効な量の式1の化合物、界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つのさらなる成分、及び少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤を含む組成物に関する。本開示の混合物に関して、他の生物活性化合物若しくは薬剤を式1の化合物を含む本発明の化合物と一緒に配合してプレミックスを形成することができるか、又は他の生物活性化合物若しくは薬剤を式1の化合物を含む本発明の化合物とは別に配合して、2つの配合物を施用前に（例えば、噴霧タンク内で）一緒に組み合わせるか若しくは代わりに連続して施用することも可能である。

30

40

【0291】

本開示の化合物と一緒に配合され得るこのような生物活性化合物又は薬剤の例は、殺虫剤、例えば、アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アクリナトリン、アシノナビル、アフィドピロペン（〔（3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS）-3-〔（シクロプロピルカルボニル）オキシ〕-1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b-デカヒドロ-6, 12-ジヒドロキシ-4, 6a, 12b-トリメチル-11-オキソ-9-（3-ピリジニル）-2H, 11H-ナフト〔2, 1-b〕ピラノ〔3, 4-e〕ピラン-4-イル〕シクロプロパンカルボキシレート）、アミドフルメト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス-メチル、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベンスピリモキサン、ピフェントリン

50

、カップービフェントリン、ビフェナゼート、ビストリフルロン、ボレート、プロフラニ
 リド、ブプロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、カルゾー
 ル、クロラントラニリブロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロロプラレ
 トリン、クロルピリホス、クロルピリホス-e、クロルピリホス-メチル、クロマフェノ
 ジド、クロフェンテジン、クロロプラレトリン、クロチアニジン、シアントラニリブロー
 ル（3-ブromo-1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-N-〔4-シアノ-2-メチル
 -6-〔（メチルアミノ）カルボニル〕フェニル〕-1H-ピラゾール-5-カルボキサ
 ミド）、シクラニリブロール（3-ブromo-N-〔2-ブromo-4-クロロ-6-〔（1
 -シクロプロピルエチル）アミノ〕カルボニル〕フェニル〕-1-（3-クロロ-2-ピ
 リジニル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド）、シクロプロトリン、シクロキサ
 プリド（（5S, 8R）-1-〔（6-クロロ-3-ピリジニル）メチル〕-2, 3, 5
 , 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-9-ニトロ-5, 8-エポキシ-1H-イミダゾ〔1, 2
 -a〕アゼピン）、シエノピラフェン、シフルメトフェン、シフルトリン、ベーターシフ
 ルトリン、シアロジアミド、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリ
 ン、シベルメトリン、アルファシベルメトリン、ゼーターシベルメトリン、シロマジ
 ン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジクロロメゾチアズ、ジエ
 ルドリ
 ン、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメヒポ、ジメトエート、ジプロピリダズ、ジ
 ノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エマメクチンベンゾエート、エンドスル
 ファン、エスフェンバレート、エチプロール、エトフェンブロックス、イブシロン-メ
 トフルトリン、エトキサゾール、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェ
 ノチオ
 カルブ、フェノキシカルブ、フェンブロパトリン、フェンバレート、フィプロニル、フ
 ロメトキン（2-エチル-3, 7-ジメチル-6-〔4-（トリフルオロメトキシ）フェ
 ノキシ〕-4-キノリニルメチルカルボネート）、フロニカミド、フルアザインドリジ
 ン、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フル
 フェノキシストロビン（メチル（ α E）-2-〔〔2-クロロ-4-（トリフルオロメチ
 ル）フェノキシ〕メチル〕- α -（メトキシメチレン）ベンゼンアセテート）、フル
 エンス
 ルホン（5-クロロ-2-〔（3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテン-1-イル）スル
 ホニル〕チアゾール）、フルヘキサホン、フルオピラム、フルピプロール（1-〔2, 6
 -ジクロロ-4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-5-〔（2-メチル-2-プロペ
 ン-1-イル）アミノ〕-4-〔（トリフルオロメチル）スルフィニル〕-1H-ピラゾ
 ール-3-カルボニトリル）、フルピラジフロン（4-〔〔（6-クロロ-3-ピリジ
 ニル）メチル〕（2, 2-ジフルオロエチル）アミノ〕-2（5H）-フラノン）、フルピ
 リミン、フルバリネート、タウフルバリネート、フルキサメタミド、ホノホス、ホル
 メ
 タネート、ホスチアゼート、ガンマーシハロトリン、ハロフェノジド、ヘプタフルト
 リン（〔2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-（メトキシメチル）フェニル〕メチル2, 2
 -ジメチル-3-〔（1Z）-3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロペン-1-イル〕シ
 クロプロパンカルボキシレート）、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒドラ
 メチ
 ノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、殺虫石鹸、イソフェンホス、イソシ
 クロセ
 ラム、カップーテフルトリン、ラムダーシハロトリン、ルフェヌロン、マラチオン、メ
 ペ
 ルフルトリン（〔2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-（メトキシメチル）フェニル〕
 メチル（1R, 3S）-3-（2, 2-ジクロロエテニル）-2, 2-ジメチルシクロ
 プ
 ロパンカルボキシレート）、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メ
 チ
 ダチオン、メチオカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシクロル、メトフル
 トリン、メト
 キシフェノジド、イブシロン-メトフルトリン、イブシロン-モムフルオロトリ
 ン、モノ
 クロトホス、モノフルオロトリン（〔2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-（メト
 キシ
 メチル）フェニル〕メチル3-（2-シアノ-1-プロペン-1-イル）-2, 2-ジ
 メチ
 ルシクロプロパンカルボキシレート）、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、ノ
 バル
 ロン、ノビフルムロン、オキサミル、オキサゾスルフィル、パラチオン、パラ
 チ
 オン-メチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミ
 ドン、ピ
 リミカルブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルギット、プロトリ
 フェ
 ンブト、ピフルブミド

(1, 3, 5-トリメチル-N-(2-メチル-1-オキソプロピル)-N-[3-(2-メチルプロピル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド)、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン(メチル(αE)-2-[[[2-(2, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-6-(トリフルオロメチル)-4-ピリミジニル]オキシ]メチル)-α-(メトキシメチレン)ベンゼンアセテート)、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフエン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロピジオン、スピロテトラマト、スルプロホス、スルホキサフロル(N-[メチルオキシド[1-[6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジニル]エチル]-λ⁴-スルファニリデン]シアナミド)、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、カップ-テフルトリン、テルブホス、テトラクロラントラニリプロール、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン([2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)フェニル]メチル2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート)、テトラニリプロール、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ-ナトリウム、チオキサザフェン(3-フェニル-5-(2-チエニル)-1, 2, 4-オキサジアゾール)、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム(2, 4-ジオキソ-1-(5-ピリミジニルメチル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2H-ピリド[1, 2-a]ピリミジニウム内塩)、トリフルムロン、チクロピラゾフロール、ゼータ-シペルメトリン、バチルス・チューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis*)デルタエンドトキシン、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウイルス又は昆虫病原性真菌である。

【0292】

注目すべきは、アバメクチン、アセトアミプリド、アクリナトリン、アシノナピル、アフィドピロペン、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ピフェントリン、ブプロフェジン、ブロフラニリド、カズサホス、カルバリル、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロロプラレトリン、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ゼータ-シペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジエルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、イプシロン-メトフルトリン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンブロックス、エトキサゾール、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン、フルキサメタミド、フロニカミド、フルベンジアミド、フルエンズルホン、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルフェンズルホン、フルピプロール、フルピリミン、フルピラジフロン、フルバリネート、ホルメタネート、ホスチアゼート、ガンマーシハロトリン、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、イソシクロセラム、カップ-テフルトリン、ラムダーシハロトリン、ルフェヌロン、メベルフルトリン、メタフルミゾン、メチオジカルブ、メトミル、メトブレン、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノフルオロトリン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピフルブミド、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリミノストロビン、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルホキサフロル、テブフェノジド、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ-ナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、チクロピラゾフロール、ゼータ-シペルメトリン、バチルス・チューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis*)デルタエンドトキシン、バチルス・チューリングゲンシス(*Bacillus*

t h u r i n g i e n s i s) の全ての株及びヌクレオポリヘドロシスウイルスの全ての株などの殺虫剤である。

【0293】

本開示の化合物と混合するための生物学的薬剤の一実施形態としては、昆虫病原性細菌、例えば、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 及びバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) のカプセル化デルタエンドトキシン、例えば、CellCap (登録商標) プロセスによって調製されたMVP (登録商標) 及びMVPII (登録商標) バイオインセチサイド (CellCap (登録商標)、MVP (登録商標) 及びMVPII (登録商標) は Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USAの商標である) ; 昆虫病原性真菌、例えば、グリーンマスカージン (*green muscardine*) 菌 ; 並びに昆虫病原性ウイルス (天然由来及び遺伝子組換えの両方)、例えば、バクロウイルス、ヌクレオポリヘドロウイルス (NPV)、例えば、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) ヌクレオポリヘドロウイルス (HzNPV)、アナグラファ・ファルシフェラ (*Anagrapha falcifera*) ヌクレオポリヘドロウイルス (AfNPV) ; 並びに顆粒病ウイルス (GV)、例えば、コドリング (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (CpGV) が挙げられる。

【0294】

本開示の化合物と混合するための生物学的薬剤の一実施形態は、(i) アクチノマイセス属 (*Actinomycetes*)、アグロバクテリウム属 (*Agrobacterium*)、アルスロバクター属 (*Arthrobacter*)、アルカリゲネス属 (*Alcaligenes*)、オーレオバクテリウム属 (*Aureobacterium*)、アゾバクター属 (*Azobacter*)、バチルス属 (*Bacillus*)、ベイエリンキア属 (*Beijerinckia*)、ブラディリゾビウム属 (*Bradyrhizobium*)、ブレビバチルス属 (*Brevibacillus*)、バークホルデリア属 (*Burkholderia*)、クロモバクテリウム属 (*Chromobacterium*)、クロストリジウム属 (*Clostridium*)、クラビバクター属 (*Clavibacter*)、コマモナス属 (*Comamonas*)、コリネバクテリウム属 (*Corynebacterium*)、クルトバクテリウム属 (*Curtobacterium*)、エンテロバクター属 (*Enterobacter*)、フラボバクテリウム属 (*Flavobacterium*)、グルコノバクター属 (*Glucanobacter*)、ハイドロゲノファーガ属 (*Hydrogenophaga*)、クレブシエラ属 (*Klebsiella*)、メチロバクテリウム属 (*Methylobacterium*)、パエニバチルス属 (*Paenibacillus*)、パストリア属 (*Pasteuria*)、フォトラブダス属 (*Photorhabdus*)、フィロバクテリウム属 (*Phyllobacterium*)、シュードモナス属 (*Pseudomonas*)、リゾビウム属 (*Rhizobium*)、セラチア属 (*Serratia*)、スフィンゴバクテリウム属 (*Sphingobacterium*)、ステノトロホモナス属 (*Stenotrophomonas*)、ストレプトマイセス属 (*Streptomyces*)、バリオボラックス属 (*Variovorax*)、又はゼノラブダス属 (*Xenorhabdus*) の細菌、例えば、バチルス・アミロリケファシエンシス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、セレウス菌 (*Bacillus cereus*)、バチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*)、バチルス・リケニホルミス (*Bacillus, licheniformis*)、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、バチルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、枯草菌 (*Bacillus subtilis*)、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、ブラディリゾビウム・ジャポニクム (*Bradyrhizobium japonicum*)、クロモバクテリウム・スブツガ (*Chromobacterium subtsugae*)、パストリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*)、パストリア・ペネトランス (*Pasteuria penet*

rans)、パスツリア・ユーセジ(Pasteuria usage)、蛍光菌(Pseudomonas fluorescens)、及びストレプトマイセス・リジクス(Streptomyces lydicus)の細菌；(ii)真菌、例えば、緑きょう病菌；(iii)バキュロウイルス、核多角体病ウイルス、例えば、アメリカタバコガ(Helicoverpa zea)核多角体病ウイルス、アナグラファ・ファルシフェラ(Anagrapha falcifera)核多角体病ウイルス；顆粒病ウイルス、例えば、コドリガ(Cydia pomonella)顆粒病ウイルスを含むウイルスの1つ又は組合せを含む。

【0295】

特に注目すべきは、他の無脊椎有害生物防除有効成分が、異なる化学的分類に属するか、又は式1の化合物と異なる作用部位を有する、このような組合せである。特定の例において、同様の防除スペクトルを有するが、作用部位が異なる少なくとも1つの他の無脊椎有害生物防除有効成分との組合せは、耐性管理に特に有利である。したがって、本開示の組成物は、類似の防除スペクトルを有するが、異なる化学的分類に属するか、又は異なる作用部位を有する少なくとも1つのさらなる無脊椎有害生物防除有効成分の生物学的に有効な量をさらに含むことができる。これらのさらなる生物活性化合物又は薬剤としては、限定されないが、アセチルコリンエステラーゼ(ACHE)阻害剤、例えば、カルバメートメトミル、オキサミル、チオジカルブ、トリアザメート、及び有機ホスフェートクロルピリホス；GABA作動性クロライドチャネルアンタゴニスト、例えば、シクロジエンジエドリン及びエンドスルファン、並びにフェニルピラゾールエチプロール及びフィプロニル；ナトリウムチャネル調節剤、例えば、ピレスロイドピフェントリン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、シベルメトリン、デルタメトリン、ジメフルトリン、エスフェンバレレート、メトフルトリン及びプロフルトリン；ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)アゴニスト、例えば、ネオニコチノイドアセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ニチアジン、チアクロプリド、及びチアメトキサム、及びスルホキサフル；ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)アロステリック活性化剤、例えば、スピノシンスピネトラム及びスピノサド；クロライドチャネル活性化剤、例えば、アベルメクチンアバメクチン及びエマメクチン；幼若ホルモン模倣物、例えば、ジオフェノラン、メトプレン、フェノキシカルブ及びピリプロキシフェン；選択的な同翅類摂食遮断薬、例えば、ピメトロジン及びフロニカミド；ダニ成長抑制剤、例えば、エトキサゾール；ミトコンドリアATPシンターゼの阻害剤、例えば、プロパルギット；プロトン勾配の途絶による酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナピル；ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)チャネル遮断薬、例えば、ネライストキシン類似体カルタップ；キチン生合成の阻害剤、例えば、ベンゾイル尿素フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン及びトリフルムロン、及びブプロフェジン；双翅類脱皮攪乱物質、例えば、シロマジン；エクジソン受容体アゴニスト、例えば、ジアシルヒドラジンメトキシフェノジド及びテブフェノジド；オクトパミン受容体アゴニスト、例えば、アミトラズ；ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害剤、例えば、ヒドラメチルノン；ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害剤、例えば、ピリダベン；電位依存性ナトリウムチャネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロン酸及びテトラミン酸スピロジクロフェン、スピロメシフェン及びスピロテトラマト；ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害剤、例えば、β-ケトニトリルシエノピラフェン及びシフルメトフェン；リアノジン受容体調節剤、例えば、アントラニル酸ジアミドクロラントラニリプロール、シアントラニリプロール及びシアントラニリプロール、ジアミド、例えば、フルベンジアミド、及びリアノジン受容体リガンド、例えば、リアノジン；生物学的活性に関与する標的部位が未知であるか若しくは特性決定されていない化合物、例えば、アザジラクチン、ピフェナゼート、ピリダリル、ピリフルキナゾン及びトリフルメゾピリム；昆虫中腸膜の微生物攪乱物質、例えば、バチルス・チューリングェンシス(Bacillus thuringiensis)及びそれらが産生するデルタエンド

10

20

30

40

50

トキシン及びバチルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*) ;
並びに核多角体病ウイルス (NPV) 及び他の天然若しくは遺伝子組換え殺虫性ウイルス
を含む生物学的薬剤が挙げられる。

【0296】

本開示の化合物と配合され得る生物活性化合物又は薬剤のさらなる例は、以下である：
殺真菌剤、例えば、アシベンゾラルーS-メチル、アルジモルフ、アメトクトラジン、ア
ミノピリフェン、アミスルブロム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、
ベナラキシル（ベナラキシルーMを含む）、ベノダニル、ベノミル、ベンチアバリカルブ
（ベンチアバリカルブーイソプロピルを含む）、ベンゾビンジフルピル、ベトキサジン、
ビナバクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピキサフェン、ブラストサイジン- S、ボ
スカリド、ブロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、カルボキシシン、カルプロパ
ミド、カプタホール、カプタン、カルベンダジム、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾ
リネート、水酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、クモキシストロビン、シアゾファミド、シ
フルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ジクロベンチアゾク
ス、ジクロフルアニド、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカル
ブ、ジフェノコナゾール、ジフルメトリム、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジモキシス
トロビン、ジニコナゾール（ジニコナゾール- Mを含む）、ジノカップ、ジピメチロン
、ジチアノン、ジチオラン、ドデモルフ、ドジン、エコナゾール、エタコナゾール、エジ
フェンホス、エノキサストロビン（エネステロブリンとしても知られている）、エポキシ
コナゾール、エタボキサム、エチリモール、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナ
ミドン、フェナミンストロビン、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フ
ェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンピコキサミド、フェンプロ
ピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、水酸化トリフ
ェニルスズ、フェルバム、フェリムゾン、フロメトキン、フロリルピコキサミド、フルオ
ピモミド、フルアジナム、フルジオキソニル、フルフェノキシストロビン、フルインダピ
ル、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、フルオキサピプロリン、フルオキサス
トロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルチアニル、フル
トラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、フサライド（フタリ
ドとしても知られている）、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、ヘキサコナ
ゾール、ヒメキサゾール、グアザチン、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジ
ンアルベシル酸塩、イミノクタジン三酢酸塩、インピルフルキサム、ヨージカルブ、イブ
コナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イブフルフェノキン、イソフェタミド、イ
プロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソフルシプラム、イソプロチオラン
、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、クレソキシム-メチル、ランコトリオ
ン、マンコゼブ、マンジプロパミド、マデストロビン、マネブ、マパニピリン、メフェ
ントリフルコナゾール、メプロニル、メブチルジノカップ、メタラキシル（メタラキシル
- M / メフェノキサムを含む）、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メチラム、メトミ
ノストロビン、メチルテトラプロール、メトラフェノン、ミクロブタニル、ナフチチン、
ネオ-アソジン（メタンアルソン酸鉄）、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、オリ
ザストロビン、オキサジキシル、オキサチアピプロリン、オキソリン酸、オキシポコナゾ
ール、オキシカルボキシシン、オキシテトラサイクリン、ペンコナゾール、ペンシクロン、
ペンフルフェン、ペンチオピラド、ペルフラゾエート、亜リン酸（その塩、例えば、ホセ
チルーアルミニウムを含む）、ピコキシストロビン、ピペラリン、ポリオキシシン、プロベ
ナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネ
ブ、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフルメトフェン (*Ad e p i d y n* (登録商標))、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラプロポイン
、ピラオキシストロビン、ピラジフルミド、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリブタカル
ブ、ピリダクロメチル、ピリフェノックス、ピリオフェノン、ペリソオキサゾール、ピリ
メタニル、ピリフェノックス、ピロールニトリン、ピロキロン、キンコナゾール、キノメ
チオネート、キノフメリン、キノキシフェン、キントゼン、シルチオフアム、セダキサン

10

20

30

40

50

、シメコナゾール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクロフタラム、テクナゼン、テルビナフィン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオファネート、チオファネートーメチル、チラム、チアジニル、トルクロホスーメチル、トルプロカルブ、トリフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアリモール、トリアゾキシド、三塩基性硫酸銅、トリクロピリカルブ、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルミゾール、トリモブラミドトリシクラゾール、トリフロキシストロビン、トリホリン、トリチコナゾール、ウニコナゾール、バリダマイシン、バリフェナレート（バリフェナールとしても知られている）、ピンクロゾリン、ジネブ、ジラム、ゾキサミド及び1-[4-[4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル]-2-チアゾリル]-1-ピペリジニル]-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン；抗線虫剤、例えば、フルオピラム、スピロテトラマト、チオジカルブ、ホスチアゼート、アバメクチン、イプロジオン、フルエンズルホン、二硫化ジメチル、チオキサザフェン、1,3-ジクロロプロペン（1,3-D）、メタム（ナトリウム及びカリウム）、ダゾメット、クロロピクリン、フェナミホス、エトプロホス、カズサホス、テルブホス、イミシアホス、オキサミル、カルボフラン、チオキサザフェン、バチルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）及びパスツール・ニシザワエ（*Pasteuria nishizawae*）；殺菌剤、例えば、ストレプトマイシン；殺ダニ剤、例えば、アミトラズ、キノメチオナト、クロロベンジレート、シヘキサチン、ジコホル、ジエノクロル、エトキサゾール、フェナザキン、酸化フェンブタスズ、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾクス、プロパルギット、ピリダベン及びテブフェンピラド。

10

20

【0297】

特定の例において、本開示の化合物と他の生物活性（特に、無脊椎有害生物防除）化合物又は薬剤（すなわち、有効成分）との組合せは、向上した効果をもたらし得る。効果的な有害生物防除を確実にしながらも、環境中に放出される有効成分の量を減少させることは常に望ましいことである。増強された無脊椎有害生物防除が、農学的に満足できるレベルの無脊椎有害生物防除を与える施用量で生じる場合、このような組合せは、作物生産コストの削減及び環境負荷の低減に関して有利となることが可能である。

【0298】

本開示の化合物及びその組成物は、無脊椎有害生物に毒性のあるタンパク質（バチルス・チューリゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）デルタエンドトキシンなど）を発現するように遺伝的に形質転換された植物に施用され得る。このような施用は、より幅広いスペクトルの植物保護を提供し得、抵抗性管理に有利であり得る。発現された毒素タンパク質と組み合わせられた本開示の外部から施用される無脊椎有害生物防除化合物は、向上した効果を提供し得る。

30

【0299】

これらの農業保護剤（すなわち殺虫剤、殺真菌剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、除草剤及び生物薬剤）についての一般的な参考文献としては、The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2003及びThe BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2001が挙げられる。

40

【0300】

本開示の化合物は、限定されないが、殺虫性効果を付与する遺伝子的に得られる転写産物の下方制御、干渉、抑制又はサイレンシングによって、特定の標的の量に影響を与える、DNA、RNA、及び／又は化学修飾ヌクレオチドを含むポリヌクレオチドと組み合わせられるか又は配合され得る。

50

【0301】

これらの様々な混合パートナーの1つ以上が使用される実施形態に関して、式1の化合物に対するこれらの様々な混合パートナーの重量比（合計）は、典型的に、約1：3000～約3000：1である。注目すべきは、約1：300～約300：1の重量比（例えば、約1：30～約30：1の比）である。当業者ならば、所望の生物活性スペクトルを得るのに必要な、有効成分の生物学的に有効な量を、単純な実験で容易に決定することができる。これらのさらなる成分を含むことによって、式1の化合物単独によって防除されるスペクトルよりも広く、防除される無脊椎有害生物のスペクトルを拡げることが可能となるということは明らかであろう。

【0302】

無脊椎有害生物は、本開示の1つ以上の化合物を、典型的に、組成物の形態で、農学的及び／又は非農学的寄生場所を含む有害生物の環境に、保護されるべき領域に、又は防除されるべき有害生物に直接、生物学的に有効な量で施用することによって、農学的及び非農学的用途において防除される。

【0303】

したがって、本開示は、農学的及び／又は非農学的用途における無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の本開示の化合物の1つ以上、又は少なくとも1つのこのような化合物を含む組成物又は少なくとも1つのこのような化合物及び生物学的に有効な量の少なくとも1つのさらなる生物活性化合物若しくは薬剤を含む組成物と接触させることを含む方法を含む。本開示の化合物及び生物学的に有効な量の少なくとも1つのさらなる生物活性化合物又は薬剤を含む好適な組成物の例は、さらなる活性化合物が、本開示の化合物と同じ顆粒上に存在するか、又は本開示の化合物のものと別の顆粒上に存在する顆粒状組成物を含む。

【0304】

無脊椎有害生物から農作物を保護するために、本開示の化合物又は組成物との接触を達成するために、化合物又は組成物は、典型的に、植え付けの前に作物の種子に、作物植物の茎葉（例えば、葉、茎、花、果実）に、又は作物を植え付ける前若しくは後に土壌若しくは他の成長培地に施用される。

【0305】

接触方法の一実施形態は、噴霧によるものである。或いは、本開示の化合物を含む顆粒状組成物は、植物の茎葉又は土壌に施用され得る。本開示の化合物はまた、植物を、液体配合物の土壌灌注、土壌への顆粒状配合物、苗床箱処理又は移植体の浸漬として施用される本開示の化合物を含む組成物と接触させることによって、植物の摂取を介して有効に送達され得る。注目すべきは、土壌灌注液体配合物の形態の本開示の組成物である。無脊椎有害生物を防除するための方法であって、無脊椎有害生物又はその環境を、生物学的に有効な量の本開示の化合物又は生物学的に有効な量の本開示の化合物を含む組成物と接触させることを含む方法も注目される。さらに注目すべきは、環境が土壌であり、組成物が土壌灌注配合物として土壌に施用されるこの方法である。さらに注目すべきは、本開示の化合物が、寄生場所への局所的な施用によっても有効であることである。他の接触方法は、直接及び残存噴霧、空中噴霧、ゲル、種子粉衣、マイクロカプセル化、浸透摂取、ベイト、耳標、ポーラス、噴霧器、燻蒸器、エアロゾル、ダスト及び他の多くによる本開示の化合物又は組成物の施用を含む。接触方法の一実施形態は、本開示の化合物又は組成物を含む寸法的に安定した肥料顆粒、棒又は錠剤である。本開示の化合物はまた、無脊椎動物防除デバイス（例えば、昆虫ネット）の構成用材料に含浸され得る。

【0306】

本開示の化合物は、全ての植物、植物部分及び種子を処理するのに有用である。植物及び種子の品種及び栽培品種は、従来の繁殖及び育種方法又は遺伝子工学的的方法によって得ることができる。遺伝子組換え植物又は種子（遺伝子導入植物又は種子）とは、異種遺伝子（導入遺伝子）が植物又は種子のゲノムに安定的に組み込まれたものである。植物ゲノム内の特定の位置によって定義される導入遺伝子を形質転換又はトランスジェニックイベ

10

20

30

40

50

ントと呼ぶ。

【0307】

本開示に従って処理することができる遺伝子組換え植物及び種子栽培品種は、1つ以上の生物的ストレス（線虫、昆虫、ダニ、真菌などの有害生物）又は非生物的ストレス（干ばつ、低温、土壌塩分など）に対して耐性があるもの又は他の望ましい特性を含むものを含む。植物及び種子は、例えば、除草剤耐性、昆虫抵抗性、改良されたオイルプロファイル又は干ばつ耐性の特徴を示すように遺伝子組換えすることができる。単一の遺伝子形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含む有用な遺伝子組換え植物及び種子が、表Zに列挙される。表Zに列挙される遺伝子組換えについてのさらなる情報は、以下のデータベースから得ることができる：

10

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

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

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

【0308】

以下の表Zでは以下の略語を使用する。tol. は、耐性であり、res. は、抵抗性であり、SUは、スルホニル尿素であり、ALSは、アセト乳酸合成酵素であり、HPPDは、4-ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼであり、NAは、該当なしである

20

【0309】

30

40

50

【表 2 1】

表 Z

作物	イベント名	イベントコード	形質	遺伝子	
アルファルファ	J101	MON-00101-8	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
アルファルファ	J163	MON-00163-7	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
キャノーラ*	23-18-17 (Event 18)	CGN-89465-2	高ラウリン酸油	te	
キャノーラ*	23-198 (Event 23)	CGN-89465-2	高ラウリン酸油	te	10
キャノーラ*	61061	DP-061061-7	グリホサート耐性	gat4621	
キャノーラ*	73496	DP-073496-4	グリホサート耐性	gat4621	
キャノーラ*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
キャノーラ*	GT73 (RT73)	MON-00073-7	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
キャノーラ*	HCN10 (Topas 19/2)	NA	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	HCN28 (T45)	ACS-BN008-2	グルホシネート耐性	pat (syn)	20
キャノーラ*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BN007-1	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	MON88302	MON-88302-9	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
キャノーラ*	MPS961	NA	フィチン酸塩分解	phyA	
キャノーラ*	MPS962	NA	フィチン酸塩分解	phyA	
キャノーラ*	MPS963	NA	フィチン酸塩分解	phyA	
キャノーラ*	MPS964	NA	フィチン酸塩分解	phyA	
キャノーラ*	MPS965	NA	フィチン酸塩分解	phyA	
キャノーラ*	MS1 (B91-4)	ACS-BN004-7	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	MS8	ACS-BN005-8	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	OXY-235	ACS-BN011-5	オキシニル耐性	bxn	30
キャノーラ*	PHY14	NA	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	PHY23	NA	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	PHY35	NA	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	PHY36	NA	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	RF1 (B93-101)	ACS-BN001-4	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	グルホシネート耐性	bar	
キャノーラ*	RF3	ACS-BN003-6	グルホシネート耐性	bar	
インゲンマメ	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	病害抵抗性	ac1 (センス及びアンチセンス)	
ブリンジャル (ナス)	EE-1		昆虫抵抗性	cry1Ac	40

【 0 3 1 0 】

【表 2 2】

カーネーション	11 (7442)	FLO-07442-4	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	10
カーネーション	11363 (1363A)	FLO-11363-1	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	1226A (11226)	FLO-11226-8	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	123.2.2 (40619)	FLO-40619-7	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	
カーネーション	123.2.38 (40644)	FLO-40644-4	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	
カーネーション	123.8.12	FLO-40689-6	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	123.8.8 (40685)	FLO-40685-1	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	1351A (11351)	FLO-11351-7	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	1400A (11400)	FLO-11400-2	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	15	FLO-00015-2	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	
カーネーション	16	FLO-00016-3	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	20
カーネーション	4	FLO-00004-9	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)	
カーネーション	66	FLO-00066-8	SU 耐性; 老化の遅延	surB; acc	
カーネーション	959A (11959)	FLO-11959-3	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	988A (11988)	FLO-11988-7	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	26407	IFD-26497-2	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
カーネーション	25958	IFD-25958-3	SU 耐性; 改変された花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)	
チコリ	RM3-3	NA	グルホシネート耐性	bar	
チコリ	RM3-4	NA	グルホシネート耐性	bar	
チコリ	RM3-6	NA	グルホシネート耐性	bar	
綿	19-51a	DD-01951A-7	ALS 除草剤耐性	S4-HrA	30
綿	281-24-236	DAS-24236-5	グルホシネート耐性; 昆虫抵抗性	pat (syn); cry1F	
綿	3006-210-23	DAS-21023-5	グルホシネート耐性; 昆虫抵抗性	pat (syn); cry1Ac	
綿	31707	NA	オキシニル 耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac	
綿	31803	NA	オキシニル 耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac	
綿	31807	NA	オキシニル 耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac	
綿	31808	NA	オキシニル 耐性; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac	
			昆虫抵抗性		

【0 3 1 1】

【表 2 3】

綿	42317	NA	オキシニル耐性 ; 昆虫抵抗性	bxn; cry1Ac	
綿	BNLA-601	NA	昆虫抵抗性	cry1Ac	
綿	BXN10211	BXN10211-9	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10215	BXN10215-4	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10222	BXN10222-2	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10224	BXN10224-4	オキシニル耐性	bxn; cry1Ac	
綿	COT102	SYN-IR102-7	昆虫抵抗性	vip3A(a)	
綿	COT67B	SYN-IR67B-1	昆虫抵抗性	cry1Ab	
綿	COT202		昆虫抵抗性	vip3A	10
綿	Event 1	NA	昆虫抵抗性	cry1Ac	
綿	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	昆虫抵抗性	cry1Ab-Ac	
綿	GHB119	BCS-GH005-8	昆虫抵抗性	cry2Ae	
綿	GHB614	BCS-GH002-5	グリホサート耐性	2mepsps	
綿	GK12	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab-Ac	
綿	LL 綿 25	ACS-GH001-3	グルホシネート耐性	bar	
綿	MLS 9124	NA	昆虫抵抗性	cry1C	
綿	MON1076	MON-89924-2	昆虫抵抗性	cry1Ac	
綿	MON1445	MON-01445-2	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
綿	MON15985	MON-15985-7	昆虫抵抗性	cry1Ac; cry2Ab2	
綿	MON1698	MON-89383-1	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	20
綿	MON531	MON-00531-6	昆虫抵抗性	cry1Ac	
綿	MON757	MON-00757-7	昆虫抵抗性	cry1Ac	
綿	MON88913	MON-88913-8	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
綿	Nqwe Chi 6 Bt	NA	昆虫抵抗性	NA?	
綿	SKG321	NA	昆虫抵抗性	cry1A; CpTI	
綿	T303-3	BCS-GH003-6	昆虫抵抗性 ; グル ホシネート耐性	cry1Ab; bar	
綿	T304-40	BCS-GH004-7	昆虫抵抗性 ; グル ホシネート耐性	cry1Ab; bar	
綿	CE43-67B		昆虫抵抗性	cry1Ab	30
綿	CE46-02A		昆虫抵抗性	cry1Ab	
綿	CE44-69D		昆虫抵抗性	cry1Ab	
綿	1143-14A		昆虫抵抗性	cry1Ab	
綿	1143-51B		昆虫抵抗性	cry1Ab	
綿	T342-142		昆虫抵抗性	cry1Ab	
綿	PV-GHGT07 (1445)		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
綿	EE-GH3		グリホサート耐性	mepsps	
綿	EE-GH5		昆虫抵抗性	cry1Ab	
綿	MON88701	MON-88701-3	ジカンバ及びグルホ シネート耐性	改変 dmo; bar	
綿	OsCr11		抗アレルギー	改変 Cry j	40

【 0 3 1 2 】

【表 2 4】

ハイコスカグサ	ASR368	SMG-36800-2	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ユーカリ	20-C		耐塩性	codA	
ユーカリ	12-5C		耐塩性	codA	
ユーカリ	12-5B		耐塩性	codA	
ユーカリ	107-1		耐塩性	codA	
ユーカリ		1/9/2001	耐塩性	codA	
ユーカリ		2/1/2001	耐塩性	codA	
ユーカリ			耐寒性	des9	
垂麻	FP967	CDC-FL001-2	ALS 除草剤耐性	als	10
レンズマメ	RH44		イミダゾリノン耐性	als	
トウモロコシ	3272	SYN-E3272-5	改変 α -アミラーゼ	amy797E	
トウモロコシ	5307	SYN-05307-1	昆虫抵抗性	ecry3.1Ab	
トウモロコシ	59122	DAS-59122-7	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	676	PH-000676-7	グルホシネート耐性; 受粉調節	pat; dam	
トウモロコシ	678	PH-000678-9	グルホシネート耐性; 受粉調節	pat; dam	
トウモロコシ	680	PH-000680-2	グルホシネート耐性; 受粉調節	pat; dam	
トウモロコシ	98140	DP-098140-6	グリホサート耐性; ALS 除草剤耐性	gat4621; zm-hra	20
トウモロコシ	Bt10	NA	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1Ab; pat	
トウモロコシ	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1Ab; bar	
トウモロコシ	BVLA430101	NA	フィチン酸塩分解	phyA2	
トウモロコシ	CBH-351	ACS-ZM004-3	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry9C; bar	
トウモロコシ	DAS40278-9	DAS40278-9	2,4-D 耐性	aad-1	
トウモロコシ	DBT418	DKB-89614-9	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1Ac; pinII; bar	
トウモロコシ	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	グルホシネート耐性	bar	30
トウモロコシ	GA21	MON-00021-9	グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	GG25		グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	GJ11		グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	FI117		グリホサート耐性	mepsps	
トウモロコシ	GAT-ZM1		グルホシネート耐性	pat	
トウモロコシ	LY038	REN-00038-3	増加したリシン	cordapA	
トウモロコシ	MIR162	SYN-IR162-4	昆虫抵抗性	vip3Aa20	
トウモロコシ	MIR604	SYN-IR604-5	昆虫抵抗性	mcry3A	
トウモロコシ	MON801 (MON80100)	MON801	昆虫抵抗性; グリ ホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	40

【0 3 1 3】

【表 2 5】

トウモロコシ	MON802	MON-80200-7	昆虫抵抗性; グリ ホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	10
トウモロコシ	MON809	PH-MON-809-2	昆虫抵抗性; グリ ホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON810	MON-00810-6	昆虫抵抗性; グリ ホサート耐性	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	10
トウモロコシ	MON832	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON863	MON-00863-5	昆虫抵抗性	cry3Bb1	20
トウモロコシ	MON87427	MON-87427-7	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON87460	MON-87460-4	干ばつ耐性	cpdB	20
トウモロコシ	MON88017	MON-88017-3	昆虫抵抗性; グリ ホサート耐性	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON89034	MON-89034-3	昆虫抵抗性	cry2Ab2; cry1A.105	20
トウモロコシ	MS3	ACS-ZM001-9	グルホシネート耐性; 受粉調節	bar; バルナーゼ	
トウモロコシ	MS6	ACS-ZM005-4	グルホシネート耐性; 受粉調節	bar; バルナーゼ	20
トウモロコシ	NK603	MON-00603-6	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	T14	ACS-ZM002-1	グルホシネート耐性	pat (syn)	30
トウモロコシ	T25	ACS-ZM003-2	グルホシネート耐性	pat (syn)	
トウモロコシ	TC1507	DAS-01507-1	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1Fa2; pat	30
トウモロコシ	TC6275	DAS-06275-8	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	mocry1F; bar	
トウモロコシ	VIP1034		昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	vip3A; pat	30
トウモロコシ	43A47	DP-043A47-3	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	40416	DP-040416-8	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	30
トウモロコシ	32316	DP-032316-8	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	4114	DP-004114-3	昆虫抵抗性; グル ホシネート耐性	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	30
メロン	メロン A	NA	成熟/老化の遅延	sam-k	
メロン	メロン B	NA	成熟/老化の遅延	sam-k	40
パパイヤ	55-1	CUH-CP551-8	病害抵抗性	prsv cp	
パパイヤ	63-1	CUH-CP631-7	病害抵抗性	prsv cp	40
パパイヤ	Huanong No. 1	NA	病害抵抗性	prsv rep	

【0 3 1 4】

【表 2 6】

パパイヤ ペチュニア	X17-2 Petunia-CHS	UFL-X17CP-6 NA	病害抵抗性 改質された製品品質	prsv cp CHS suppression	
プラム キャノーラ**	C-5 ZSR500	ARS-PLMC5-6 NA	病害抵抗性 グリホサート耐性	ppv cp cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
キャノーラ**	ZSR502	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
キャノーラ**	ZSR503	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	10
ポプラ ポプラ	Bt poplar Hybrid poplar	NA NA	昆虫抵抗性 昆虫抵抗性	cry1Ac; API cry1Ac; API	
ポプラ ポプラ	trg300-1 trg300-2		高セルロース 高セルロース	AaXEG2 AaXEG2	
ジャガイモ ジャガイモ キャノーラ**	1210 amk 2904/1 kgs ZSR500	NA NA NA	昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 グリホサート耐性	cry3A cry3A cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
キャノーラ**	ZSR502	NA	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	20
ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ ジャガイモ	ATBT04-27 ATBT04-30 ATBT04-31 ATBT04-36 ATBT04-6 BT06 BT10 BT12 BT16 BT17 BT18 BT23 EH92-527-1	NMK-89367-8 NMK-89613-2 NMK-89170-9 NMK-89279-1 NMK-89761-6 NMK-89812-3 NMK-89175-5 NMK-89601-8 NMK-89167-6 NMK-89593-9 NMK-89906-7 NMK-89675-1 BPS-25271-9	昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 昆虫抵抗性 加工デンプン/炭水化物	cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A cry3A gbss (アンチセンス)	
ジャガイモ	HLMT15-15	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	HLMT15-3	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	HLMT15-46	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	RBMT15-101	NMK-89653-6	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp	40

【 0 3 1 5 】

【表 2 7】

ジャガイモ	RBMT21-129	NMK-89684-1	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2	
ジャガイモ	RBMT21-152	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2	
ジャガイモ	RBMT21-350	NMK-89185-6	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2	
ジャガイモ	RBMT22-082	NMK-89896-6	昆虫抵抗性及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ジャガイモ	RBMT22-186	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	10
ジャガイモ	RBMT22-238	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ジャガイモ	RBMT22-262	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性; グリホサート耐性	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ジャガイモ	SEMT15-02	NMK-89935-9	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	SEMT15-07	NA	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp	
ジャガイモ	SEMT15-15	NMK-89930-4	昆虫抵抗性及び病害抵抗性	cry3A; pvy cp	20
ジャガイモ	SPBT02-5	NMK-89576-1	昆虫抵抗性	cry3A	
ジャガイモ	SPBT02-7	NMK-89724-5	昆虫抵抗性	cry3A	
イネ	7Crp#242-95-7		抗アレルギー	7crp	
イネ	7Crp#10	NA	抗アレルギー	7crp	
イネ	GM Shanyou 63	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab; cry1Ac	
イネ	Huahui-1/TT51-1	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab; cry1Ac	
イネ	LL イネ 06	ACS-OS001-4	グルホシネート耐性	bar	
イネ	LL イネ 601	BCS-OS003-7	グルホシネート耐性	bar	
イネ	LL イネ 62	ACS-OS002-5	グルホシネート耐性	bar	
イネ	Tarom molaii + cry1Ab	NA	昆虫抵抗性	cry1Ab (切断型)	30
イネ	GAT-OS2		グルホシネート耐性	bar	
イネ	GAT-OS3		グルホシネート耐性	bar	
イネ	PE-7		昆虫抵抗性	Cry1Ac	
イネ	7Crp#10	NA	抗アレルギー	7crp	
イネ	KPD627-8		高トリプトファン	OASA1D	
イネ	KPD722-4		高トリプトファン	OASA1D	
イネ	KA317		高トリプトファン	OASA1D	
イネ	HW5		高トリプトファン	OASA1D	
イネ	HW1		高トリプトファン	OASA1D	
イネ	B-4-1-18		直立葉半矮性	Δ OsBRI1	
イネ	G-3-3-22		半矮性	OSGA2ox1	40

【 0 3 1 6 】

【表 28】

イネ	AD77		病害抵抗性	DEF	
イネ	AD51		病害抵抗性	DEF	
イネ	AD48		病害抵抗性	DEF	
イネ	AD41		病害抵抗性	DEF	
イネ	13pNasNaatAprt1		鉄欠乏耐性	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT	
イネ	13pAprt1		鉄欠乏耐性	APRT	
イネ	gHvNAS1- gHvNAAT-1		鉄欠乏耐性	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B	10
イネ	gHvIDS3-1		鉄欠乏耐性	HvIDS3	
イネ	gHvNAAT1		鉄欠乏耐性	HvNAAT-A; HvNAAT-B	
イネ	gHvNAS1-1		鉄欠乏耐性	HvNAS1	
イネ	NIA-OS006-4		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS005-3		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS004-2		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS003-1		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS002-9		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	NIA-OS001-8		病害抵抗性	WRKY45	
イネ	OsCr11		抗アレルギー	改変 Cry j	
イネ	17053		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	20
イネ	17314		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
バラ	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	改変された花色	5AT; bp40 (f3'5'h)	
バラ	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	改変された花色	5AT; bp40 (f3'5'h)	
ダイズ	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	NA	変性油/脂肪酸	gm-fad2-1 (サイレ ンシング遺伝子座)	
ダイズ	A2704-12	ACS-GM005-3	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	A2704-21	ACS-GM004-2	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	A5547-127	ACS-GM006-4	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	A5547-35	ACS-GM008-6	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	CV127	BPS-CV127-9	イミダゾリノン耐性	csr1-2	30
ダイズ	DAS68416-4	DAS68416-4	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	DP305423	DP-305423-1	変性油/脂肪酸; ALS 除草剤耐性	gm-fad2-1 (サイレ ンシング遺伝子座); gm-hra	
ダイズ	DP356043	DP-356043-5	変性油/脂肪酸; グ リホサート耐性	gm-fad2-1 (サイレ ンシング遺伝子座); gat4601	
ダイズ	FG72	MST-FG072-3	グリホサート及び HPPD 耐性	2mepsps; hppdPF W336	
ダイズ	GTS 40-3-2 (40- 3-2)	MON-04032-6	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	GU262	ACS-GM003-1	グルホシネート耐性	pat	
ダイズ	MON87701	MON-87701-2	昆虫抵抗性	cry1Ac	40

【0317】

【表 2 9】

ダイズ	MON87705	MON-87705-6	変性油/脂肪酸; グリホサート耐性	fatb1-A (センス及びアンチセンス); fad2-1A (センス及びアンチセンス); cp4 epsps (aroA:CP4)	10
ダイズ	MON87708	MON-87708-9	ジカンバ及びグリホサート耐性	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON87769	MON-87769-7	変性油/脂肪酸; グリホサート耐性	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON89788	MON-89788-1	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	W62	ACS-GM002-9	グルホシネート耐性	bar	20
ダイズ	W98	ACS-GM001-8	グルホシネート耐性	bar	
ダイズ	MON87754	MON-87754-1	高油分	dgat2A	
ダイズ	DAS21606	DAS-21606	アリールオキシアルカノエート及びグルホシネート耐性	改変 aad-12; pat	
ダイズ	DAS44406	DAS-44406-6	アリールオキシアルカノエート、グリホサート及びグルホシネート耐性	改変 aad-12; 2mepsps; pat	30
ダイズ	SYHT04R	SYN-0004R-8	メノトリオン耐性	改変 avhppd	
ダイズ	9582.814.19.1		昆虫抵抗性及びグルホシネート耐性	cry1Ac, cry1F, PAT	
カボチャ	CZW3	SEM-0CZW3-2	病害抵抗性	cmv cp, zymv cp, wmv cp	
カボチャ	ZW20	SEM-0ZW20-7	病害抵抗性	zymv cp, wmv cp	40
テンサイ	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
テンサイ	H7-1	KM-000H71-4	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
テンサイ	T120-7	ACS-BV001-3	グルホシネート耐性	pat	
テンサイ	T227-1		グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	
サトウキビ	NXI-1T		干ばつ耐性	EcbetA	
ヒマワリ	X81359		イミダゾリノン耐性	als	
ピーマン	PK-SP01	NA	病害抵抗性	cmv cp	
タバコ	C/F/93/08-02	NA	オキシニル耐性	bxn	
タバコ	Vector 21-41	NA	減少したニコチン	NtQPT1 (アンチセンス)	
トマト	1345-4	NA	成熟/老化の遅延	acc (切断型)	
トマト	35-1-N	NA	成熟/老化の遅延	sam-k	
トマト	5345	NA	昆虫抵抗性	cry1Ac	40
トマト	8338	CGN-89322-3	成熟/老化の遅延	accd	

【0318】

【表 3 0】

トマト	B	SYN-0000B-6	成熟/老化の遅延	pg (センス又はアンチセンス)	10
トマト	Da	SYN-0000DA-9	成熟/老化の遅延	pg (センス又はアンチセンス)	
ヒマワリ	X81359		イミダゾリノン耐性	als	
トマト	Da Dong No 9	NA	改質された製品	NA	
トマト	F (1401F, h38F, 11013F, 7913F)	SYN-0000F-1	成熟/老化の遅延	pg (センス又はアンチセンス)	
トマト	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	成熟/老化の遅延	pg (センス又はアンチセンス)	
トマト	Huafan No 1	NA	成熟/老化の遅延	抗 efe	
トマト	PK-TM8805R (8805R)	NA	病害抵抗性	cmv cp	
小麦	MON71800	MON-71800-3	グリホサート耐性	cp4 epsps (aroA:CP4)	

* アルゼンチン、** ポーランド、# ナス

20

【0319】

遺伝子組換え植物及び種子を本開示の化合物で処理することにより、向上した効果を得ることができる。例えば、施用量の減少、活性スペクトルの拡大、生物学的／非生物学的ストレスに対する耐性の増加又は貯蔵安定性の向上は、遺伝子組換え植物及び種子への本開示の化合物の施用による単純な相加効果から期待されるよりも大きくなり得る。

【0320】

本開示の化合物はまた、無脊椎有害生物から種子を保護するための種子処理に有用である。本開示及び特許請求の範囲に関して、種子を処理することは、典型的に本開示の組成物として配合される生物学的に有効な量の本開示の化合物と種子を接触させることを意味する。この種子処理により、無脊椎土壌有害生物から種子が保護され、一般に、発芽した種子から発生する苗の土壌と接触する根及び他の植物部分も保護することができる。またこの種子処理は、発育中の植物内の本開示の化合物又は第2の有効成分の転流により、葉面の保護も提供することができる。種子処理は、特殊な形質を発現するように遺伝的に形質転換された植物が発芽する種子を含む、全ての種類の種子に施用することができる。代表的な例としては、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 毒素などの無脊椎有害生物に毒性のあるタンパク質を発現するもの又はグリホサートに対する耐性を与えるグリホサートアセチルトランスフェラーゼなどの除草剤耐性を発現するものが挙げられる。また、本開示の化合物による種子処理は、処理された種子から生育する植物の活力を増大させることができる。

30

【0321】

種子処理の1つの方法は、種子を播く前に、本開示の化合物を（すなわち配合された組成物として）種子に噴霧又はダスティングすることによる。種子処理用に配合された組成物は、一般にフィルム形成剤又は接着剤を含む。したがって、典型的に、本開示の種子コーティング組成物は、生物学的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド又は塩、及びフィルム形成剤又は接着剤を含む。種子は、流動性の懸濁液濃縮物を種子のタンブリングベッドに直接噴霧し、その後、種子を乾燥させることによってコーティングすることができる。或いは、湿潤粉末、溶液、サスポエマルション、乳化性濃縮物及び水中エマルションなどの他の配合物タイプを種子に噴霧することができる。このプロセスは、種子へのフィルムコーティングの適用に特に有用である。様々なコーティング機及びプロセスが当業者に利用可能である。好適なプロセスは、P. K o s t e r s e t a l . , S e e

40

50

d Treatment: Progress and Prospects, 1994 BCPC Monograph No. 57 及びそこに列挙されている参考文献に列挙されているものを含む。

【0322】

式1の化合物及びそれらの組成物は、単独で、及び他の殺虫剤及び殺真菌剤と組み合わせて、限定されないが、トウモロコシ又はコーン、ダイズ、綿、穀物（例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦及びイネ）、ジャガイモ、野菜及びナタネを含む作物の種子処理に特に有用である。

【0323】

式1の化合物と配合されて、種子処理に有用な混合物を提供し得る他の殺虫剤としては、アバメクチン、アセタミプリド、アクリナトリン、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、ベンスルタップ、ピフェントリン、プロプロフェジン、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ガンマーシハロトリン、ラムダーシハロトリン、シベルメトリン、アルファシベルメトリン、ゼーターシベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジエルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エトキサゾール、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルベンジアミド、フルフェノクスロン、フルバリネート、ホルメタネート、ホスチアゼート、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、ルフェヌロン、メタフルミゾン、メチオカルブ、メトミル、メトブレン、メトキシフェノジド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルホキサフルル、テブフェノジド、テトラメトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップーナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) の全ての株及び核多角体病ウイルスの全ての株が挙げられる。

【0324】

式1の化合物と配合されて、種子処理に有用な混合物を提供し得る殺真菌剤としては、アミスルブロム、アゾキシストロビン、ボスカリド、カルベンダジム、カルボキシシン、シモキサニル、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジメトモルフ、フルアジナム、フルジオキシニル、フルキンコナゾール、フルオピコリド、フルオキサストロビン、フルトリアホール、フルキサピロキサド、イプロコナゾール、イプロジオン、メタラキシル、メフェノキサム、メトコナゾール、ミクロブタニル、パクロブトラゾール、ペンフルフェン、ピコキシストロビン、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、セダキサン、シルチオファム、テブコナゾール、チアベンダゾール、チオファネートーメチル、チラム、トリフロキシストロビン及びトリチコナゾールが挙げられる。

【0325】

種子処理に有用な式1の化合物を含む組成物は、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*) (例えば、菌株GB34) 及びバチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) (例えば、分離株1582)、根粒菌接種材料／増量剤、イソフラボノイド及びリポキトオリゴ糖などの細菌をさらに含み得る。

【0326】

処理された種子は、典型的に、種子100kg当たり約0.1g～1kg（すなわち、処理前の種子の約0.0001～1重量%）の量で本開示の化合物を含む。種子処理用に配合された流動性懸濁液は、典型的に、約0.5～約70%の有効成分、約0.5～約30%のフィルム形成接着剤、約0.5～約20%の分散剤、0～約5%の増粘剤、0～約

10

20

30

40

50

5 %の顔料及び／又は染料、0～約2 %の消泡剤、0～約1 %の保存料並びに0～約75 %の揮発性液体希釈剤を含む。

【0327】

本開示の化合物は、無脊椎有害生物によって消費されるか、又はトラップ、ベイトステーションなどのデバイス内で使用されるベイト組成物へと組み込まれ得る。このようなベイト組成物は、(a)有効成分、すなわち、生物学的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシド、又は塩；(b)1つ以上の食品材料；任意選択的に(c)誘引剤、及び任意選択的に(d)1つ以上の保湿剤を含む顆粒の形態であり得る。注目すべきは、約0.001～5 %の有効成分、約40～99 %の食品材料及び／又は誘引剤；及び任意選択的に約0.05～10 %の保湿剤を含む顆粒又はベイト組成物であって、非常に低い施用量で、特に、直接接触によってよりもむしろ摂食によって致死である有効成分の用量で土壌無脊椎有害生物を防除するのに有効である、顆粒又はベイト組成物である。いくつかの食品材料は、食品源及び誘引剤の両方として機能することができる。食品材料は、炭水化物、タンパク質及び脂質を含む。食品材料の例は、野菜粉、砂糖、デンプン、動物脂、植物油、酵母エキス及び乳固形分である。誘引剤の例は、果実若しくは植物エキス、香料、又は他の動物若しくは植物成分などの、着香剤及び香味剤、フェロモン又は標的無脊椎有害生物を誘引することが知られている他の薬剤である。保湿剤、すなわち、水分保持剤の例は、グリコール及び他のポリオール、グリセリン及びソルビトールである。注目すべきは、アリ、シロアリ及びゴキブリからなる群から選択される少なくとも1つの無脊椎有害生物を防除するのに使用されるベイト組成物（及びこのようなベイト組成物を用いる方法）である。無脊椎有害生物を防除するためのデバイスは、本発明のベイト組成物及びベイト組成物を収容するように構成されるハウジングを含むことができ、ここで、ハウジングが、無脊椎有害生物が通過するのを可能にするようにサイズ決めされた少なくとも1つの開口部を有し、それによって、無脊椎有害生物が、ハウジングの外部の位置からベイト組成物にアクセス可能であり、ハウジングが、無脊椎有害生物について可能な若しくは公知の活動の場所に又はその近くに配置されるようにさらに構成される。

10

20

【0328】

本開示の化合物は、他の補助剤なしで施用され得るが、ほとんどの場合、施用は、好適な担体、希釈剤、及び界面活性剤と共に、及び場合により、想定される最終用途に応じて食品と組み合わせて、1つ以上の有効成分を含む配合物の施用である。一施用方法は、本開示の化合物の水分散体又は精製油溶液を噴霧することを含む。噴霧油、噴霧油濃縮物、展着剤(spreader sticker)、補助剤、他の溶媒、及びピペロニルブトキシドとの組合せは、多くの場合、化合物有効性を向上させる。非農学的使用について、このような噴霧は、ポンプによって、又は加圧容器、例えば、加圧エアロゾル噴霧缶からそれを放出することによって、缶、ボトル又は他の容器などの噴霧容器から施用され得る。このような噴霧組成物は、例えば、噴霧、ミスト、フォーム、煙霧又は霧といった様々な形態をとることができる。したがって、このような噴霧組成物は、場合により、噴射剤、発泡剤などをさらに含み得る。注目すべきは、生物学的に有効な量の本開示の化合物又は組成物及び担体を含む噴霧組成物である。このような噴霧組成物の一実施形態は、生物学的に有効な量の本開示の化合物又は組成物及び噴射剤を含む。代表的な噴射剤としては、限定されないが、メタン、エタン、プロパン、ブタン、イソブタン、ブテン、ペンタン、イソペンタン、ネオペンタン、ペンテン、ヒドロフルオロカーボン、クロロフルオロカーボン、ジメチルエーテル、及び上記のものの混合物が挙げられる。注目すべきは、個別に又は組み合わせて、蚊、ブヨ、サシバエ、メクラアブ、アブ、カリバチ、イエロージャケツト、スズメバチ、マダニ、クモ、アリ、ブユなどからなる群から選択される少なくとも1つの無脊椎有害生物を防除するのに使用される噴霧組成物（及び霧容器から分配されるこのような噴霧組成物を用いる方法）である。

30

40

【0329】

本開示の一実施形態は、本開示の殺有害生物性組成物（界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤と配合された式1の化合物又は式1の化合物と少なくとも1つの他の殺有害生物

50

剤との配合混合物)を水で希釈すること、任意選択的に補助剤を添加して希釈組成物を形成すること及び無脊椎有害生物又はその環境を有効量の前記希釈組成物と接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法に関する。

【0330】

十分な濃度の本発明の殺有害生物性組成物を水で希釈することによって形成した噴霧組成物は、無脊椎有害生物の防除に十分な有効性を発揮するが、別々に配合した補助剤製品を噴霧タンク混合物に添加することも可能である。これらのさらなる補助剤は、「噴霧補助剤」又は「タンク混合補助剤」として一般的に知られており、殺有害生物剤の性能を向上させるか、又は噴霧混合物の物理的特性を変化させるために噴霧タンク内で混合されるいずれの物質も含む。補助剤は、界面活性剤、乳化剤、石油ベースの作物油、作物由来種子油、酸性化剤、緩衝剤、増粘剤又は消泡剤であり得る。補助剤は、有効性(例えば、生物学的利用能、付着性、浸透性、被覆の均一性及び保護の耐久性)の向上又は不適合、発泡、ドリフト、蒸発、揮発及び分解に関連する噴霧施用の問題を最小限に抑えるか又は排除するために使用される。最適な性能を得るために、補助剤は、有効成分、配合物及び標的(例えば、作物、昆虫有害生物)の特性に関して選択される。

10

【0331】

噴霧補助剤の中でも、作物油を含む油、作物油濃縮物、植物油濃縮物及びメチル化種子油濃縮物は、場合により、より均一な及び均質な噴霧堆積物を促進することによって、殺有害生物剤の有効性を向上させるために最も一般的に使用される。油又は他の水不混和性の液体によって潜在的に引き起こされる植物毒性が懸念される状況において、本開示の組成物から調製される噴霧組成物は、一般に、油性の噴霧補助剤を含有しないであろう。しかしながら、油性の噴霧補助剤によって引き起こされる植物毒性が商業的に重要でない状況において、本発明の組成物の組成物から調製される噴霧組成物は、無脊椎有害生物の防除、並びに耐雨性を潜在的にさらに増加させることができる油性の噴霧補助剤も含有し得る。

20

【0332】

「作物油」として特定される製品は、典型的に、95~98%のパラフィン又はナフサベースの石油及び乳化剤として機能する1~2%の1つ以上の界面活性剤を含有する。「作物油濃縮物」として特定される製品は、典型的に、80~85%の乳化性の石油ベースの油及び15~20%の非イオン性界面活性剤からなる。「植物油濃縮物」として正確に特定される製品は、典型的に、80~85%の植物油(すなわち、最も一般的には綿、亜麻仁、ダイズ又はヒマワリからの、種子油又は果実油)及び15~20%の非イオン性界面活性剤からなる。補助剤性能は、植物油を、典型的に植物油に由来する脂肪酸のメチルエステルで置き換えることによって向上させることができる。メチル化種子油濃縮物の例としては、MSO(登録商標) Concentrate(UAP-Loveland Products, Inc.)及びPremium MSO Methylated Spray Oil(Helena Chemical Company)が挙げられる。

30

【0333】

噴霧混合物に添加される補助剤の量は、一般に、約2.5体積%を超えず、より典型的に、その量は、約0.1~約1体積%である。噴霧混合物に添加される補助剤の施用量は、一般に、1ヘクタール当たり約1~5Lである。噴霧補助剤の代表的な例としては、Adigor(登録商標)(Syngenta)47%のメチル化ナタネ油液体炭化水素、Silwet(登録商標)(Helena Chemical Company)ポリアルキレンオキシド変性ヘプタメチルトリシロキサン及びAssist(登録商標)(BASF)83%のパラフィンベース鉱油中17%の界面活性剤ブレンドが挙げられる。

40

【0334】

非農学的用途は、動物、特に、脊椎動物、より特定の、恒温脊椎動物(例えば、哺乳動物又は鳥類)及び最も特に、哺乳動物を、殺寄生生物的に有効な(すなわち、生物学的に有効な)量の本開示の化合物、典型的に、動物用に配合された組成物の形態で、保護される動物に投与することによって、無脊椎寄生性有害生物から保護することを含む。した

50

がって、注目すべきは、動物を保護するための方法であって、殺寄生生物的に有効な量の
本開示の化合物を動物に投与することを含む方法である。本開示及び特許請求の範囲にお
いて言及される際、「殺寄生生物」及び「殺寄生生物的に」という用語は、有害生物か
らの動物の保護を提供するための、無脊椎寄生有害生物に対する観察可能な効果を指す。
殺寄生生物の効果は、典型的に、標的無脊椎寄生性有害生物の発生又は活性を減少させる
ことに関する。有害生物に対するこのような効果としては、壊死、死亡、発育遅延、運動
性の低下又は宿主動物上又は宿主動物内に留まる能力の低下、摂食の減少及び生殖の阻害
が挙げられる。無脊椎寄生有害生物に対するこれらの効果は、動物の寄生生物の繁殖又は
感染の防除（防止、減少又は排除を含む）を提供する。殺寄生生物的に有効な量の本開示
の化合物を、保護される動物に投与することによって防除される無脊椎寄生性有害生物の
例としては、外部寄生生物（節足動物、ダニ目など）及び内部寄生生物（寄生蠕虫、例え
ば、線虫、吸虫、条虫、鉤頭虫など）が挙げられる。特に、本開示の化合物は、以下を含
む外部寄生生物に対して有効である：ハエ、例えば、ノサシバエ (*Haematobia*
(*Hyperosia*) *irritans*) (ノサシバエ)、サシバエ (*Stomoxys*
calcitrans) (サシバエ)、シムリウム属 (*Simulium* spp.)
(ブヨ)、ツェツェバエ属 (*Glossina* spp.) (ツェツェバエ)、ヒドロ
タエア・イリタンス (*Hydrotaea irritans*) (ヘッドフライ)、ムス
カ・アウツムナリス (*Musca autumnalis*) (フェースフライ)、イエバ
エ (*Musca domestica*) (イエバエ)、モレリア・シンプレックス (*Morellia simplex*) (スウェットフライ)、アブ属 (*Tabanus* sp.
(ウマバエ)、ヒポデルマ・ボビス (*Hypoderma bovis*)、ヒポデ
ルマ・リネアツム (*Hypoderma lineatum*)、ヒロズキンバエ (*Lucilia sericata*)、ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) (グ
リーンブローフライ)、オオクロバエ属 (*Calliphora* spp.) (ブロー
フライ)、プロトフォルミア属 (*Protophormia* spp.)、オエストルス
・オビス (*Oestrus ovis*) (ヒツジバエ)、サシバエ属 (*Culicoides* spp.) (小虫)、ヒッポボスカ・エキン (*Hippobosca equine*)、ガストロフィルス・インステスチナリス (*Gastrophilus instestinalis*)、ガストロフィルス・ハエモロイダリス (*Gastrophilus haemorrhoidalis*) 及びガストロフィルス・ナスリス (*Gastrophilus nasalis*) ; シラミ、例えば、ボビコラ (ダマリニア) ボビス (*Bovicola (Damalinia) bovis*)、ボビコラ・エキ (*Bovicola equi*)、ハエマトピヌス・アシニ (*Haematopinus asini*)、フェリ
コラ・スブロストラツス (*Felicola subrostratus*)、ヘテロドキ
スス・スピニゲル (*Heterodoxus spiniger*)、リグノナツス・セト
ス (*Lignonathus setosus*) 及びイヌハジラミ (*Trichodectes canis*) ; ヒツジシラミバエ、例えば、メロファグス・オビヌス (*Melophagus ovinus*) ; ダニ、例えば、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、サルコプテス・スカベイ (*Sarcoptes scabiei*)、ウシシヨクヒヒゼンダニ (*Chorioptes bovis*)、デモデクス・エキ (*Demodex equi*)、ケイルエチエラ属 (*Cheyletiella* spp.)、ノトエドレス・カチ (*Notoedres cati*)、ツツガムシ属 (*Trombicula* spp.) 及びオトデクテス・シアノチス (*Otodectes cyanotis*) (ミミダニ) ; マダニ、例えば、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、キララマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、カクマ
ダニ属 (*Dermacentor* spp.)、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.) 及びチマダニ属 (*Haemaphysalis* spp.) ; 並びにノミ、例えば、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) (ネコノミ) 及びイヌノミ (*Ctenocephalides canis*) (イヌノミ)。

10

20

30

40

50

【0335】

獣医学分野における非農学的用途は、従来の手段により、例えば、錠剤、カプセル剤、ドリンク、灌注調製物、粒状物、ペースト、ボラス、フィードスルー手順、若しくは坐剤の形態での経腸投与により；又は非経口投与、例えば、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内を含む）若しくは埋込物により；経鼻投与により；例えば、浸漬若しくは液浸、噴霧、洗浄、粉末によるコーティング、又は動物の小領域への施用の形態における、及び本開示の化合物又は組成物を含む物品、例えば、首輪、耳標、テイルバンド、肢バンド若しくは端綱を介した局所投与による。

【0336】

典型的に、本開示による殺寄生生物性組成物は、式1の化合物、そのN-オキシド又は塩と、意図される投与経路（例えば、経口、局所又は非経口投与、例えば、注射）に関して、及び標準的な慣例に従って選択される賦形剤及び助剤を含む1つ以上の薬学的又は獣医学的に許容される担体との混合物を含む。さらに、好適な担体は、pH及び水分含量に対する安定性などの考慮事項を含む、組成物中の1つ以上の有効成分との適合性に基づいて選択される。したがって、注目すべきは、寄生的に有効な量の本開示の化合物及び少なくとも1つの担体を含む、無脊椎寄生性有害生物から動物を保護するための組成物である。

10

【0337】

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

20

【0338】

溶液（吸収のための最も容易に利用可能な形態）、エマルジョン、懸濁液、ペースト、ゲル、カプセル剤、錠剤、ボラス、粉末、顆粒、ルーメン保持（*rumen-retention*）及び飼料／水／リックブロックの形態における経口投与について、本開示の化合物は、経口投与組成物に好適であると当技術分野において知られている結合剤／充填剤、例えば、糖（例えば、ラクトース、スクロース、マンニトール、ソルビトール）、デンプン（例えば、トウモロコシデンプン、小麦デンプン、コメデンプン、ジャガイモデンプン）、セルロース及び誘導体（例えば、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、エチルヒドロキシセルロース）、タンパク質誘導体（例えば、ゼイン、ゼラチン）、及び合成ポリマー（例えば、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン）と共に配合することができる。必要に応じて、滑沢剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム）、崩壊剤（例えば、架橋ポリビニルピロリジノン、寒天、アルギン酸）及び染料又は顔料を加えることができる。ペースト及びゲルはまた、多くの場合、組成物が口腔と接触を続け、容易に排出されないように補助する接着剤（例えば、アカシア、アルギン酸、ベントナイト、セルロース、キサンタンガム、コロイド状ケイ酸アルミニウムマグネシウム）を含有する。

30

40

【0339】

殺寄生生物性組成物が、飼料濃縮物の形態である場合、担体は、典型的に、高性能飼料、飼料穀物又はタンパク質濃縮物から選択される。このような飼料濃縮物含有組成物は、殺寄生生物性有効成分に加えて、動物衛生若しくは成長を促進し、殺のために動物からの肉の質を改善するか又は他の形で畜産にとって有用な添加剤を含み得る。これらの添加剤は、例えば、ビタミン、抗生物質、化学療法剤、静菌剤、静真菌剤、抗コクシジウム剤及びホルモンを含み得る。

【0340】

本開示の化合物は、経口投与及び摂取からの全身アベイラビリティを実現する好ましい薬物動態学的及び薬力学的特性を有することが発見されてきた。したがって、保護される

50

動物による摂取の後、血流中の殺寄生生物的に有効な濃度の、本開示の化合物が、処理された動物を、吸血有害生物、例えば、ノミ、マダニ及びシラミから保護する。したがって、注目すべきは、経口投与（すなわち、殺寄生生物的に有効な量の本開示の化合物に加えて、経口投与に好適な結合剤及び充填剤並びに飼料濃縮物担体から選択される1つ以上の担体を含む）のための形態の、無脊椎寄生有害生物から動物を保護するための組成物である。

【0341】

局所投与用の配合物は、典型的に、粉末、クリーム、懸濁液、噴霧、エマルション、フォーム、ペースト、エアロゾル、軟膏剤、軟膏又はゲルの形態である。より典型的に、局所製剤は、使用前に希釈される濃縮物の形態であり得る水溶性溶液である。局所投与に好適な殺寄生生物性組成物は、典型的に、本開示の化合物及び1つ以上の局所的に好適な担体を含む。ライン又はスポットとしての動物の外面への局所的な殺寄生生物性組成物の施用（すなわち、「スポットオン」処理）において、有効成分は、動物の表面にわたって移動して、その外部表面積の大部分又は全てをカバーする。結果として、処理された動物は、動物の表皮に寄生する無脊椎有害生物、例えば、マダニ、ノミ及びシラミから特に保護される。したがって、局所局部的投与のための配合物は、多くの場合、皮膚にわたる有効成分の輸送及び／又は動物の表皮への浸透を促進する少なくとも1つの有機溶媒を含む。このような配合物中で担体として一般的に使用される溶媒としては、プロピレングリコール、パラフィン、芳香族化合物、エステル、例えば、ミリスチン酸イソプロピル、グリコールエーテル、並びにアルコール、例えば、エタノール及びn-プロパノールが挙げられる。

【0342】

有効な防除のために必要とされる施用量（すなわち、「生物学的に有効な量」）は、防除される無脊椎動物の種、有害生物の生活環、ライフステージ、そのサイズ、場所、時期、宿主作物又は動物、採食行動、繁殖行動、周囲湿度、温度などの要因に依存する。通常の場合で、1ヘクタール当たり約0.01~2kgの有効成分の施用量が、農学的生態系において有害生物を防除するのに十分であるが、0.0001kg/ヘクタール程度で十分であることがあり、又は8kg/ヘクタールも必要とされることがある。非農学的用途について、有効な使用量は、約1.0~50mg/平方メートルの範囲であるが、0.1mg/平方メートル程度で十分であることがあり、又は150mg/平方メートルも必要とされることがある。当業者は、所望のレベルの無脊椎有害生物防除に必要な生物学的に有効な量を容易に決定することができる。

【0343】

一般に、獣医学における使用のために、式1の化合物、そのN-オキシド又は塩が、無脊椎寄生有害生物から保護される動物に、殺寄生生物的に有効な量で投与される。殺寄生生物的に有効な量は、観察可能な効果を達成して、標的無脊椎寄生有害生物の出現又は活性を減少させるのに必要とされる有効成分の量である。当業者は、寄生的に有効な用量が、本開示の様々な化合物及び組成物、所望の寄生性効果及び期間、標的無脊椎有害生物種、保護される動物、施用方法などについて変化してもよく、特定の結果を達成するのに必要とされる量が、単純な実験によって決定され得ることを理解するであろう。

【0344】

恒温動物への経口投与について、本開示の化合物の1日投与量は、典型的に、約0.01mg/kg~約100mg/kg、より典型的に、約0.5mg/kg~約100mg/kg（動物体重）の範囲である。局所（例えば、皮膚）投与について、浸漬及び噴霧は、典型的に、約0.5ppm~約5000ppm、より典型的に、約1ppm~約3000ppmの本開示の化合物を含有する。

【0345】

本明細書に記載される方法によって調製される本開示の化合物は、索引表A中に示される。Meは、メチルを意味し、Etは、エチルを意味し、c-Prは、シクロプロピルを意味する。「Cmpd. No.」という略語は「化合物番号」を表し、「Ex.」とい

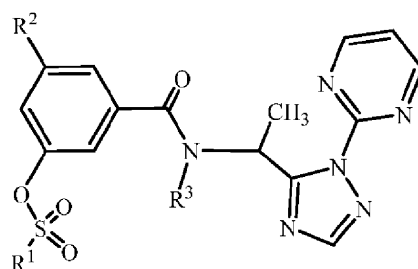
う略語は「実施例」を表し、その後にはどの実施例で化合物を調製したかを示す番号が付されている。「m. p.」という略語は「融点」を表す。構造断片中の波線又は「-」は、分子の残部への断片の結合点を示す。「MS」の欄に報告された数値は、最も高い同位体存在度を有する分子に H^+ （分子量1）が付加して形成された最も高い同位体存在度の正電荷親イオン（ $M+1$ ）又は H^+ （分子量1）の消失により形成された最も高い同位体存在度の負電荷イオン（ $M-1$ ）の分子量である。より低い存在度の1つ以上のより高い原子量同位体（例えば、 ^{37}Cl 、 ^{81}Br ）を含有する分子イオンの存在は報告されない。報告されたMSピークは、エレクトロスプレーイオン化（ESI）又は大気圧化学イオン化（APCI）を用いた質量分析によって観察された。

【0346】

10

索引表 A

【化32】



20

【0347】

30

40

50

【表 3 1】

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	M+1
1	Ph	CF ₃	H	519.38
2	CF ₃	CF ₃	H	510.99
3	CF ₃	H	H	443.36
4	CF ₃	Cl	H	477.25
5	Ph	Cl	H	485.32
6	Ph	H	H	451.3
7	CF ₂ H	H	H	425.25
8*	CF ₃	Cl	H	477.26
9**	CF ₃	Cl	H	477.26
10	CF ₃	Cl	CH ₂ (c-Pr)	531.4
11	CF ₃	CF ₃	CH ₂ (c-Pr)	565.47
12*	CF ₃	CF ₃	H	511.19
13**	CF ₃	CF ₃	H	511.19
14	CF ₃	F	H	461.31
15	CF ₃	Br	H	521.22
16	CF ₃	OSO ₂ CF ₃	H	591.28
20	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	535.13
21	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	H	535.14
22	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	501.19
23	CH ₂ (c-Pr)	Cl	H	463.1
24	2-Cl-Ph	CF ₃	H	553.2
25	3-Cl-5-Cl-Ph	CF ₃	H	587.22
26	3-CF ₃ -Ph	CF ₃	H	587.15
27	CF ₃	CF ₃	Et	539.21
28	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	525.21
29	CH ₂ (c-Pr)	CF ₃	H	497.26
30	CF ₃	Cl	CH ₂ Ph	567.21
31	CH ₂ SO ₂ Me	Cl	H	501.4
32	CH ₂ CO ₂ Et	CF ₃	H	529.19
33	CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	601.25
34	4-OMe-Ph	CF ₃	H	549.31
35	2-CF ₃ -Ph	CF ₃	H	587.26
36	4-CF ₃ -Ph	CF ₃	H	587.34

10

20

30

40

【 0 3 4 8 】

50

【表 3 2】

37	4-OCF ₃ -Ph	CF ₃	H	603.31
38	CF ₂ H	CF ₃	H	493.19
39	CF ₂ H	Cl	H	459.18
40	3-Cl-Ph	CF ₃	H	553.24
41	2-OMe-Ph	CF ₃	H	549.25
42	4-CN-Ph	CF ₃	H	544.24
43	3-Pyridyl	CF ₃	H	520.16
44	2-F-6-F-Ph	CF ₃	H	555.21
45	CF ₃	Me	H	457.26
46	CF ₃	NO ₂	H	488.2
47	CH ₂ Cl	Cl	H	457.14
48	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Me	569.23
49	CH ₂ CH ₂ OMe	Cl	H	467.16
50	CF ₃	Cl	Et	505.19
51	CH ₂ Cl	CF ₃	H	491.16
52	CH ₂ CF ₃	Cl	H	491.13
72	CF ₃	Cl	CH ₃	491.32

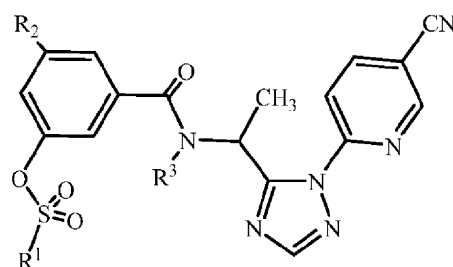
*化合物 8 及び 12 は、それぞれ(-)101.2 及び(-)92.6 の、0.2%、MeOH における旋光度を有する(-)鏡像異性体である。

**化合物 9 及び 13 は、それぞれ(+)84.32 及び(+)114.1 の、0.2%、MeOH における旋光度を有する(+)鏡像異性体である。

【0 3 4 9】

索引表 B

【化 3 3】



【0 3 5 0】

10

20

30

40

50

【表 3 3】

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	M+1
17	CF ₂ H	H	H	449.34
18	CF ₂ H	Cl	H	483.27
19	CF ₃	CF ₃	H	535.3
53	CH ₂ SO ₂ Me	Cl	H	525.12
54	CH ₂ Cl	CF ₃	H	515.17
55	CF ₃	OSO ₂ CF ₃	H	615.08
56	CF ₃	F	H	485.32
57	CH ₂ (c-Pr)	Cl	H	487.22
58	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	549.23
59	CH ₂ CO ₂ Et	CF ₃	H	553.2
60	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	H	559.23
61	CH ₂ (c-Pr)	CF ₃	H	521.21
62	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	H	525.22
63	CF ₂ H	CF ₃	H	517.18
64	CF ₂ H	Cl	H	483.17
65	CH ₂ CH ₂ OMe	Cl	H	491.27
66	CH ₂ Cl	Cl	H	481.2
67	CF ₃	Br	H	544.88

10

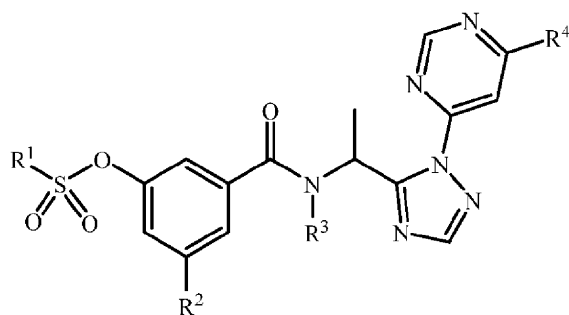
20

30

【0 3 5 1】

索引表 C

【化 3 4】



40

【0 3 5 2】

50

【表 3 4】

化 合 物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M+1
68*	CF ₃	CF ₃	H	CONH ₂	554.2
69**	CF ₃	CF ₃	H	CONHMe	568.27
70*	CF ₃	CF ₃	H	CONHMe	568.28
71***	CF ₃	CF ₃	H	CONH ₂	554.01

10

*化合物 68 及び 70 は、それぞれ(-)70.28 及び(-)72.52 の、0.2%、MeOH における旋光度を有する(-)鏡像異性体(R-鏡像異性体)である。

**化合物 69 は、(+)75.48 の、0.2%、MeOH における旋光度を有する(+)鏡像異性(S-鏡像異性体)である。

***化合物 71 は、それぞれ 70:30 の比率で、及び(+)26.28 の、0.2%、MeOH における旋光度を有する(+)及び(-)鏡像異性体の混合物である。

【0353】

20

以下の試験は、特定の有害生物に対する本開示の化合物の防除有効性を実証するものである。「防除有効性」は、有意に減少された摂食をもたらす無脊椎有害生物の発育の抑制（死亡率を含む）を表す。しかしながら、本発明の化合物によって与えられる有害生物防除は、これらの種に限定されない。化合物の説明については、索引表 A を参照されたい。

【0354】

生物学の実施例

試験 A ～ H についての配合及び噴霧方法

試験化合物を、10%のアセトン、90%の水及び300ppmのActivator 90（登録商標）非イオン性界面活性剤（Loveland Products, Loveland, Colorado, USA）を含有する溶液を用いて配合した。配合された化合物を、各試験ユニットの上部の1.27cm（0.5インチ）上に配置された微粒化ノズルによって1mLの液体中で施用した。試験化合物を、示される量で噴霧し、各試験を3回反復した。

30

【0355】

試験 A

接触及び／又は全身的手段によるコナガ（コナガ（*Plutella xylostella*）L.）の防除を評価するために、各試験ユニットは、10～12日齢のカラシナ植物を中に有する小型の開放容器からなっていた。

【0356】

試験化合物を配合し、上述されるように3回反復で、250、50、10及び2ppmで噴霧した。噴霧の後、試験ユニットを1時間乾燥させ、その後、それらに、30～50匹の若虫を外寄生させた。黒色の遮蔽キャップを各容器の上部に置いた。試験ユニットを、栽培箱中で、24～25℃及び70%の相対湿度で6日間保持した。次に、食害を、摂取された葉茎に基づいて視覚的に評価し、幼虫を死亡率について評価した。

40

【0357】

250ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、3、4、5、6、7、8、9、12、13、14、15、16、17、18、19、20、22、23、27、29、30、32、33、45、46、47、48、49、50、51、52、54、56、58、59、61、62、67、68、69、70、及び72。

50

【0358】

50 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、3、4、5、6、9、10、11、13、14、15、17、18、19、20、23、27、29、30、33、34、35、36、37、38、39、48、50、51、56、58、59、61、63、64、67、68、69、及び72。

【0359】

10 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、3、4、5、9、10、11、13、14、15、18、19、20、23、27、29、33、38、50、56、63、64、67、及び72。

10

【0360】

2 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、4、9、10、11、13、15、19、27、29、50、56、67、及び72。

【0361】

試験B

ツマジロクサヨトウ（ツマジロクサヨトウ（*Spodoptera frugiperda*）（J. E. Smith））の防除を評価するために、試験ユニットは、4～5日齢のコーン（トウモロコシ）植物を中に有する小型の開放容器からなっていた。これに、一片の昆虫餌の上で10～15日齢の幼虫を予め外寄生させた。

20

【0362】

試験化合物を配合し、上述されるように3回反復で、250、50、10、及び2 ppmで噴霧した。配合された試験化合物の噴霧の後、試験ユニットを、25℃及び70%の相対湿度で6日間にわたって栽培箱中に維持した。次に、食害を、摂取された葉茎に基づいて視覚的に評価し、幼虫を死亡率について評価した。

【0363】

250 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、3、4、5、6、9、13、14、15、16、17、18、19、20、27、33、48、50、51、56、67、及び72。

30

【0364】

50 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、4、5、9、10、11、13、14、15、17、18、19、27、33、37、38、39、48、50、56、61、62、63、67、及び72。

【0365】

10 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、4、9、10、11、13、15、18、19、27、50、67、及び72。

40

【0366】

2 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、13、及び19。

【0367】

試験C

接触及び／又は全身的手段によるコーンプラントホッパー（トウモロコシウンカ（*Perigrinus maidis*）（Ashmead））の防除を評価するために、試験ユニットは、3～4日齢のコーン（トウモロコシ）植物を中に有する小型の開放容器からなっていた。試験化合物の施用の前に、土壌の上に白砂を加えた。

【0368】

50

試験化合物を配合し、上述されるように3回反復で、250及び50ppmで噴霧した。配合された試験化合物の噴霧の後、試験ユニットを1時間乾燥させ、その後、それらに、約15～20匹の若虫（18～21日齢）を事後外寄生させた。黒色の遮蔽キャップを各試験ユニットの上部に置き、試験ユニットを、栽培箱中で、22～24℃及び50～70%の相対湿度で6日間保持した。次に、各試験ユニットを、昆虫死亡率について視覚的に評価した。

【0369】

250ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：3、4、9、10、11、13、27、50、及び72。

【0370】

50ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：9、10、11、13、及び72。

【0371】

試験D

接触及び／又は全身的手段によるモモアカアブラムシ（モモアカアブラムシ（*Myzus persicae*）（*Sulzer*））の防除を評価するために、試験ユニットは、12～15日齢のダイコン植物を中に有する小型の開放容器からなっていた。化合物の施用の前に、各試験ユニットに、試験植物の葉上に培養植物から切除した葉片上に30～40匹のアブラムシを置くことによって予め外寄生させた（カントリーフ法）。葉片が乾燥するにつれアブラムシは試験植物上へと移動した。予め外寄生させた後、試験ユニットの土壌を、砂の層で覆った。

【0372】

試験化合物を配合し、上述されるように3回反復で、250及び50ppmで噴霧した。配合された試験化合物の噴霧の後、各試験ユニットを1時間乾燥させ、次に、黒色の遮蔽キャップを上部に置いた。試験ユニットを、栽培箱中で、19～21℃及び50～70%の相対湿度で6日間保持した。次に、各試験ユニットを、昆虫死亡率について視覚的に評価した。

【0373】

250ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：4、9、11、13、50、及び72。

【0374】

50ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：4。

【0375】

試験E

接触及び／又は全身的手段によるワタアブラムシ（ワタアブラムシ（*Aphis gossypii*）（*Glover*））の防除を評価するために、試験ユニットは、5日齢のオクラ植物を中に有する小型の開放容器からなっていた。これに、カントリーフ法に従い、一片の葉の上に30～40匹の昆虫を予め外寄生させ、試験ユニットの土壌を、砂の層で覆った。

【0376】

試験化合物を配合し、上述されるように3回反復で、250、50、10、及び2ppmで噴霧した。噴霧の後、試験ユニットを、19℃及び70%の相対湿度で6日間にわたって栽培箱中に維持した。次に、各試験ユニットを、昆虫死亡率について視覚的に評価した。

【0377】

250ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：2、3、4、6、7、9、10、11、12、13、14、15、20、23、27、28、29、30、32、33、38、39、46、47、48、50、51、52、68、69、及び72。

【0378】

50 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：2、3、4、7、9、10、11、13、14、15、20、27、29、30、33、46、48、50、51、69、及び72。

【0379】

10 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：2、4、10、11、13、及び72。

【0380】

2 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、少なくとも80%の死亡率をもたらした：2、4、10、11、13、及び72。

10

【0381】

試験F

接触及び／又は全身的手段によるミカンキイロアザミウマ（ミカンキイロアザミウマ（*Frankliniella occidentalis*）*Pergande*）の防除を評価するために、各試験ユニットは、5～7日齢のソレイユビーン（*Soleil bean*）植物の中に有する小型の開放容器からなっていた。

【0382】

試験化合物を配合し、上述されるように3回反復で、250及び50 ppmで噴霧した。噴霧の後、試験ユニットを1時間乾燥させ、次に、22～27匹の成虫アザミウマを各ユニットに加え、次に、それに、遮蔽蓋で蓋をした。試験ユニットを25℃及び45～55%の相対湿度で7日間保持した。次に、各試験ユニットを、植物被害及び昆虫死亡率について視覚的に評価した。

20

【0383】

250 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、3、4、9、11、13、14、20、23、27、29、33、46、50、51、59、及び72。

【0384】

50 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、4、9、11、13、27、33、及び50。

30

【0385】

試験G

接触及び／又は全身的手段による新熱帯区褐色カメムシ（エウスキスタス・ヘロス（*Euschistus heros*）*Pergande*）の防除を評価するために、各試験ユニットは、1cmの新鮮なサヤマメ片を有するペトリ皿からなっていた。

【0386】

試験化合物を配合し、上述されるように3回反復で、250及び50 ppmで噴霧した。施用の前に、各ユニットに、10匹の未成熟の昆虫を外寄生させ、噴霧の後、試験ユニットを1時間乾燥させ、25℃及び45～55%の相対湿度で5日間保持した。次に、各試験ユニットを、昆虫死亡率について視覚的に評価した。

40

【0387】

250 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、3、4及び13。

【0388】

50 ppmで試験される式1の化合物のうち、以下が、非常に良好ないし優れたレベルの防除有効性（20%以下の食害）をもたらした：2、4及び13。

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2023/018412

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D403/04 A01N43/653
ADD.

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D A01N

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

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

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2021/165195 A1 (BAYER AG [DE]) 26 August 2021 (2021-08-26) claims 1, 12, 18 page 238, lines 15-17 page 206; compound I_46 pages 74-86 -----	1-21

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

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

30 May 2023

Date of mailing of the international search report

06/06/2023

Name and mailing address of the ISA/
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Gutke, Hans-Jürgen

10

20

30

40

50

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2023/018412

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2021165195 A1	26-08-2021	BR 112022016400 A2	25-10-2022
		CN 115551839 A	30-12-2022
		EP 4107151 A1	28-12-2022
		JP 2023513624 A	31-03-2023
		KR 20220143072 A	24-10-2022
		TW 202144328 A	01-12-2021
		US 2023148601 A1	18-05-2023
		UY 39087 A	30-09-2021
		WO 2021165195 A1	26-08-2021

フロントページの続き

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

F ターム (参考) 4C086 AA01 AA02 AA03 BC60 GA07 MA01 MA04 NA14 ZB37
4H011 AC01 AC04 BB09