

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2024-531177

(P2024-531177A)

(43)公表日 令和6年8月29日(2024.8.29)

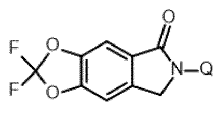
(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 491/048 (2006.01)	C 0 7 D 491/048	C S P 2 B 1 2 1
C 0 7 D 519/00 (2006.01)	C 0 7 D 519/00	3 0 1 4 H 0 1 1
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 2
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 0 1 M 1/20 (2006.01)	A 0 1 M 1/20	A
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全159頁)		

(21)出願番号	特願2024-508351(P2024-508351)	(71)出願人	520222106 シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト スイス 4 0 5 8 バーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 6 7
(86)(22)出願日	令和4年8月10日(2022.8.10)	(74)代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(85)翻訳文提出日	令和6年4月2日(2024.4.2)	(74)代理人	100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(86)国際出願番号	PCT/EP2022/072481	(74)代理人	100109070 弁理士 須田 洋之
(87)国際公開番号	WO2023/017094	(74)代理人	100119013 弁理士 山崎 一夫
(87)国際公開日	令和5年2月16日(2023.2.16)	(74)代理人	100111796 弁理士 服部 博信
(31)優先権主張番号	202111036124		
(32)優先日	令和3年8月10日(2021.8.10)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)		
(81)指定国・地域	AP(BW,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,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く		最終頁に続く

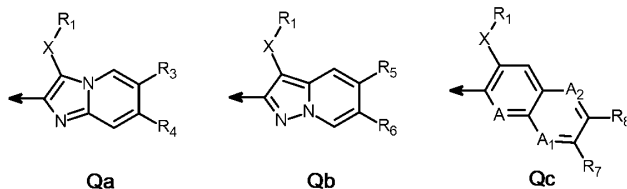
(54)【発明の名称】 殺有害生物剤としての2, 2-ジフルオロ-5H-[1, 3] ジオキソロ [4, 5-f] イソインドール-7-オン誘導体

(57)【要約】

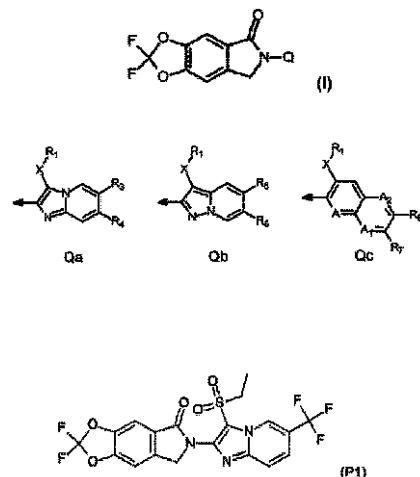
本発明は、式 (I)



(式中、QがQ a、Q b又はQ c



である) の2, 2-ジフルオロ-5H-[1, 3] ジオキソロ [4, 5-f] イソインドール-7-オン誘導体に関する。例示的な化合物は、例えば6-[3-エチル
スルホニル-6-(トリフルオロメチル) イミダゾ [1
, 2-a] ピリジン-2-イル]-2, 2-ジフルオロ
-5H-[1, 3] ジオキソロ [4, 5-f] イソイン
ドール-7-オン (化合物P 1)

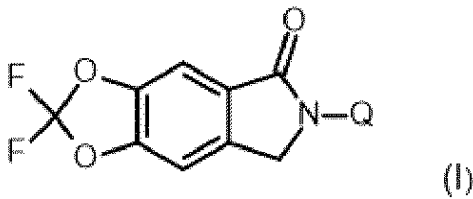


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】

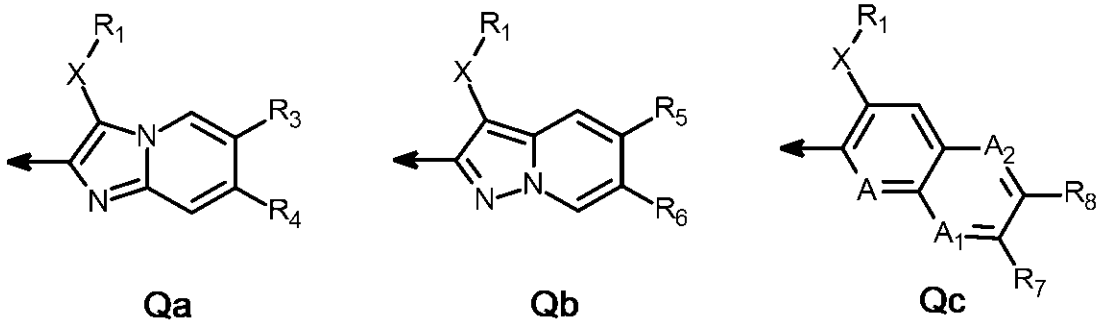


10

(式中、

Q は、式 Q a、Q b 及び Q c

【化 2】



20

(式中、矢印は、三環式環の窒素原子に対する結合点を示す)

からなる群から選択される基であり；

並びに、

A、A₁ 及び A₂ は、相互に独立して、CH 又は N であり；X は、S、SO、又は SO₂ であり；R₁ は、C₁～C₄アルキル又は C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；

R₃、R₄、R₅ 及び R₆ は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換された C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、-N(R₉R₁₀) 又は -N(R₉)C(=O)R₁₀ であり；

30

R₉ 及び R₁₀ は、相互に独立して、水素、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル又は C₃～C₆シクロアルキルであり；

R₇ 及び R₈ は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換された C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ又は -N(R₁₁)C(=O)R₁₂ であり；並びに

40

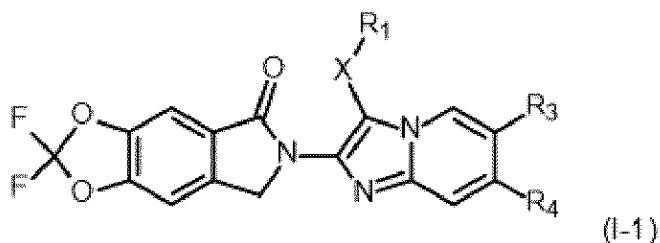
R₁₁ 及び R₁₂ は、相互に独立して、水素、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル又は C₃～C₆シクロアルキルである)。

【請求項 2】

式 I-1 の化合物：

50

【化 3】



(式中、X、R₁、R₃、R₄、R₉及びR₁₀は、請求項1における式Iに定義されているとおりである)により表される、請求項1に記載の式Iの化合物、又は、式I-1の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

10

【請求項3】

R₃及びR₄は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ又は-N(R₉)C(=O)R₁₀であり；並びに、R₉及びR₁₀は、相互に独立して、水素又はC₁～C₄アルキルであり；好ましくは、R₉及びR₁₀は、相互に独立して、水素又はメチルであり；より好ましくは、R₉は水素又はメチルであり、及び、R₁₀はメチルである、請求項1又は請求項2のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項4】

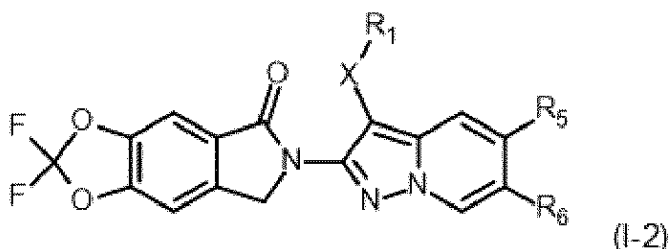
R₄は水素であり、及び、R₃は、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物；又は、R₃は水素であり、及び、R₄は、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である、式I-1の化合物。

30

【請求項5】

式I-2の化合物：

【化 4】



40

(式中、X、R₁、R₅、R₆、R₉及びR₁₀は、請求項1における式Iに定義されているとおりである)により表される、請求項1に記載の式Iの化合物、又は、式I-2の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

【請求項6】

R₅及びR₆は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、

50

C₁～C₆ハロアルコキシ又は-N(R₉)C(=O)R₁₀であり；並びに、R₉及びR₁₀は、相互に独立して、水素又はC₁～C₄アルキルであり；好ましくは、R₉及びR₁₀は、相互に独立して、水素又はメチルであり、より好ましくは、R₉は水素又はメチルであり、及び、R₁₀はメチルである、請求項1又は請求項5のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項7】

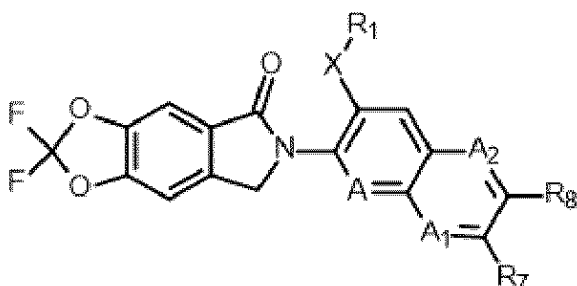
R₆は水素であり、及び、R₅は、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である、請求項1、請求項5又は請求項6のいずれか一項に記載の化合物；又は、R₅は水素であり、及び、R₆は、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である、式I-2の化合物。

10

【請求項8】

式I-3の化合物：

【化5】



(I-3)

20

(式中、A、A₁、A₂、X、R₁、R₇、R₈、R₁₁及びR₁₂は、請求項1における式Iに定義されているとおりである)により表される、請求項1に記載の式Iの化合物、又は、式I-3の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキッド。

30

【請求項9】

R₇及びR₈は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ又は-N(R₁₁)C(=O)R₁₂であり；並びに、R₁₁及びR₁₂は、相互に独立して、水素又はC₁～C₄アルキルであり；好ましくは、R₁₁及びR₁₂は、相互に独立して、水素又はメチルであり；より好ましくは、R₁₁は水素又はメチルであり、及び、R₁₂はメチルである、請求項1又は請求項8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

40

R₈は水素であり、及び、R₇は、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である、請求項1、請求項8又は請求項9のいずれか一項に記載の化合物；又は、R₇は水素であり、及び、R₈は、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である、式I-3の化合物。

【請求項11】

50

AはNである、請求項1、請求項8、請求項9又は請求項10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

A₁及びA₂は共にCHである、請求項1、請求項8、請求項9、請求項10又は請求項11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

A₁及びA₂は共にNである、請求項1、請求項8、請求項9、請求項10又は請求項11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

A₁はNであり、及び、A₂はCHであり；又は、A₁はCHであり、及び、A₂はNである、請求項1、請求項8、請求項9、請求項10又は請求項11のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項15】

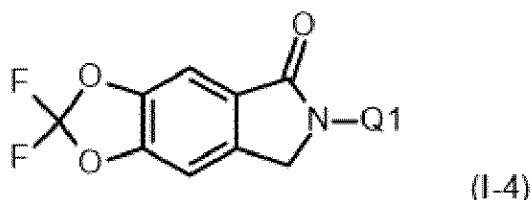
XはS又はSO₂であり；好ましくは、XはSO₂であり；及び、R₁はエチル又はシクロプロピルメチルであり；好ましくは、R₁はエチルである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項16】

式I-4の化合物：

【化6】

20

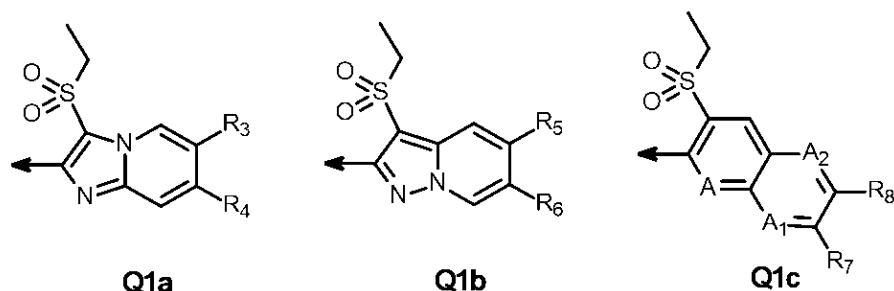


(式中、

Q1は、式Q1a、Q1b及びQ1c

【化7】

30



(式中、矢印は、三環式環の窒素原子に対する結合点を示す)

からなる群から選択される基であり；

40

並びに、A、A₁、A₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₁及びR₁₂は、請求項1における式Iに定義されているとおりである）により表される、請求項1に記載の式Iの化合物、又は、式I-4の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

【請求項17】

6-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサロ[4,5-f]イソインドール-7-オン(化合物P1)；

6-(3-エチルスルホニル-2-キノリル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサロ[4,5-f]イソインドール-7-オン(化合物P2)；

50

6-〔3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ〔1,5-a〕ピリジン-2-イル〕-2,2-ジフルオロ-5H-〔1,3〕ジオキソロ〔4,5-f〕イソインドール-7-オン(化合物P3);及び

6-(6-シクロプロピル-3-エチルスルホニル-ピラゾロ〔1,5-a〕ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-〔1,3〕ジオキソロ〔4,5-f〕イソインドール-7-オン(化合物P4)

からなる群から選択される、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項18】

請求項1～17のいずれか一項に記載の殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の式(I)の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド、並びに、任意に、助剤又は希釈剤を含む、組成物。

10

【請求項19】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項1～17のいずれか一項に記載の式(I)の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド、又は、請求項18に記載の組成物を適用するステップを含む、方法。

【請求項20】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられる場所を請求項18に記載の組成物で処理するステップを含む、方法。

20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、硫黄置換基を含有する殺有害生物的に活性な、特に殺虫的に活性な複素環式誘導体、その調製プロセス、これらの化合物を含む組成物、並びに、節足動物及び特に昆虫又は代表的なダニ目を含む動物有害生物を防除するためのその使用に関する。

【背景技術】

【0002】

硫黄含有置換基を有する複素環式芳香環化ジヒドロピロロン及びフタルイミド誘導体が、例えばJ. Org. Chem. 2003, 62, 8240、及び、Bull. Chem Soc. Chim. Belg. 1997, 106, 151といった文献に記載されている。しかしながら、これらの文献はいずれも殺有害生物効果を有することを記載していない。硫黄含有置換基を有する構造的に異なる殺有害生物活性複素環式誘導体が、例えば国際公開第2012/012086848号、国際公開第2013/018928号、国際公開第2019/131575号、及び、国際公開第2020/013147号に記載されている。

30

【0003】

意外なことに、硫黄含有置換基を有する一定の新規殺有害生物活性誘導体は、殺有害生物剤として好ましい特性を有することがここに見出された。

40

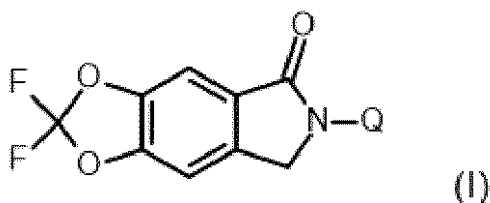
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0004】

本発明は従って、式Iの化合物

【化 1】

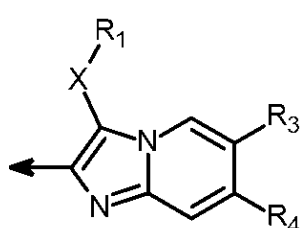


(式中、

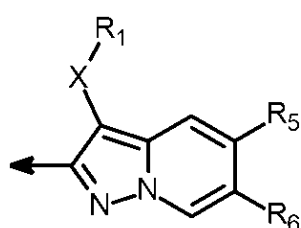
Q は、式 Q a、Q b 及び Q c

10

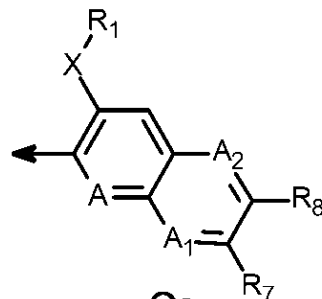
【化 2】



Qa



Qb



Qc

20

(式中、矢印は、三環式環の窒素原子に対する結合点を示す)

からなる群から選択される基であり；

並びに、

A、A₁ 及び A₂ は、相互に独立して、CH 又は N であり；X は、S、SO、又は SO₂ であり；R₁ は、C₁～C₄アルキル又は C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；

R₃、R₄、R₅ 及び R₆ は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換された C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、-N(R₉R₁₀) 又は -N(R₉)C(=O)R₁₀ であり；

30

R₉ 及び R₁₀ は、相互に独立して、水素、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル又は C₃～C₆シクロアルキルであり；

R₇ 及び R₈ は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換された C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ又は -N(R₁₁)C(=O)R₁₂ であり；並びに

R₁₁ 及び R₁₂ は、相互に独立して、水素、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル又は C₃～C₆シクロアルキルである)

40

を提供する。

【0005】

本発明はまた、式 I の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及び N-オキシドを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0006】

少なくとも 1 つの塩基性中心 (basic centre) を有する式 I の化合物は、例えば、酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉱酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸又はハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換される C₁～C₄アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽

50

和又は不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸又はクエン酸、又は例えば安息香酸との酸付加塩、又は有機スルホン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカン-又はアリールスルホン酸、例えばメタン-又は p -トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式Iの化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩又はマグネシウム塩、又はアンモニア又は有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-又はトリ-低級アルキルアミン、例えばエチル-、ジエチル-、トリエチル-又はジメチルプロピルアミン、又はモノ-、ジ-又はトリヒドロキシ-低級アルキルアミン、例えばモノ-、ジ-又はトリエタノールアミンを形成することができる。

10

【0007】

各事例において、本発明に係る式(I)の化合物は、遊離形態、N-オキシドとしての酸化型、又は、例えば農学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

【0008】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N-oxides”, A. Albin and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

20

【0009】

本発明に係る式Iの化合物はまた、塩形成の最中に形成され得る水和物をも含む。

【0010】

置換基それら自体がさらに置換されていると記載されている場合、これは、これらが、1個以上の同等又は異なる置換基、例えば1~4個の置換基を有していることを意味する。通常、3個以下のこのような任意の置換基が、同時に存在する。2個以下のこのような置換基が、同時に存在することが好ましい（すなわち、この基は、1又は2個の記載されている置換基で置換されている）。追加の置換基が、シクロアルキル又はフェニルなどのより大きな基である場合、このような任意の置換基の一方のみが存在していることがもっとも好ましい。例えばアルキルといった基が置換されていると記載されている場合、これは、例えばアルキルチオ中のアルキルといった他の基の一部である基を含む。

30

【0011】

本明細書において用いられるところ、「 $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合する1~n個の炭素原子を有する飽和直鎖又は分岐炭化水素基を指し、例えば、メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、 n -ヘキシル、 n -ペンチル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピル基のいずれか1つである。

40

【0012】

本明細書において用いられるところ、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合する1~n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基（上記のとおり）を指し、ここで、これらの基における水素原子のいくつか又はすべては、フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により置換されていてもよく、すなわち、例えば、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨ-

50

ドエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2, 2-ジフルオロプロピル、2, 3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、2-ブromoproピル、3-bromoproピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、3, 3, 3-トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(ブromomethyl)-2-bromoeチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-bromobuthil又はノナフルオロブチルのいずれか1つである。従って、用語「 $C_1 \sim C_2$ フルオロアルキル」は、1, 2, 3, 4又は5個のフッ素原子を有する $C_1 \sim C_2$ アルキル基を指し、例えば、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルのいずれか1つである。

10

【0013】

本明細書において用いられるところ、「 $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合する1~n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基（上記のとおり）を指し、すなわち、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、n-ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ又は1, 1-ジメチルエトキシのいずれか1つである。

20

【0014】

本明細書において用いられるところ、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルコキシ」という用語は、フッ素、塩素、臭素及び／又はヨウ素で部分的又は完全に置換されている上記の $C_1 \sim C_n$ アルコキシ基を指し、すなわち、例えば、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-bromoeチル、2-ヨードエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2, 2-ジフルオロプロポキシ、2, 3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2, 3-ジクロロプロポキシ、2-bromoproポキシ、3-bromoproポキシ、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ、3, 3, 3-トリクロロプロポキシ、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエトキシ、1-(クロロメチル)-2-クロロエトキシ、1-(ブromomethyl)-2-bromoeチル、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ又は4-bromobuthilのいずれか1つである。

30

【0015】

本明細書において用いられるところ、「 $C_1 \sim C_n$ シアノアルキル」という用語は、シアノ基で置換されている、1~n個の炭素原子（上記のとおり）を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し、例えば、シアノメチレン、シアノエチレン、1, 1-ジメチルシアノメチル、シアノメチル、シアノエチル、シアノイソプロピル及び1-ジメチルシアノメチルである。

40

【0016】

「 $C_1 \sim C_n$ シアノアルコキシ」という用語は、1~n個の炭素原子（上記のとおり）を有するが、酸素原子を介して結合している直鎖又は分岐飽和シアノアルキル基を指す。

【0017】

本明細書において用いられるところ、「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル」という用語は、シ

50

クロプロパン、シクロブタン、シクロプロパン、シクロペンタン及びシクロヘキサンなどの3～6員シクロイルキル(cycloalkyl)基を指す。

【0018】

「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル」などの用語に続く接尾辞「 $-C_1 \sim C_n$ アルキル」(ここで、 n は1～6の整数)は、本明細書において用いられるところ、 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキルで置換されている直鎖又は分岐飽和アルキル基を指す。 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ アルキルの一例は、例えば、シクロプロピルメチルである。

【0019】

本明細書において用いられるところ、シアノにより単置換された「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル」という用語は、シアノ基により置換された、3～6員シクロイルキル(cycloalkyl)基(上記のとおり)を指す。シアノにより単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルの一例は1-シアノシクロプロピルである。

10

【0020】

ハロゲンは、一般にフッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。これは、対応して、ハロアルキルなどの他の意味との組み合わせでハロゲンにも適用される。

【0021】

本発明に係る一定の実施形態が、以下に記載のとおり提供されている。

【0022】

実施形態1は、上記に定義されている、式Iの化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドを提供する。

20

【0023】

実施形態2は、実施形態1に係る化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドを提供し、ここで、QはQaであり、並びに、以下に記載されているX、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_9 及び R_{10} に係る好ましい値を有する。

【0024】

実施形態3は、実施形態1に係る化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドを提供し、ここで、QはQbであり、並びに、以下に記載されているX、 R_1 、 R_5 、 R_6 、 R_9 及び R_{10} に係る好ましい値を有する。

30

【0025】

実施形態4は、実施形態1に係る化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドを提供し、ここで、QはQcであり、並びに、以下に記載されているA、 A_1 、 A_2 、X、 R_1 、 R_7 、 R_8 、 R_{11} 及び R_{12} に係る好ましい値を有する。

【0026】

実施形態1～4に関して、X、 R_1 、A、 A_1 、 A_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 及び R_{12} の好ましい値は、いずれかのこれらの組み合わせで、以下に記載のとおりである。

【0027】

好ましくは、XはS又は SO_2 である。

40

【0028】

もっとも好ましくは、Xは SO_2 である。

【0029】

好ましくは、 R_1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又はシクロプロピル- $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

【0030】

より好ましくは、 R_1 はエチル又はシクロプロピルメチルである。

【0031】

もっとも好ましくは、 R_1 はエチルである。

50

【0032】

好ましくは、 R_3 及び R_4 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1\sim C_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ又は $-N(R_9)C(=O)R_{10}$ である。

【0033】

より好ましくは、 R_3 及び R_4 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である。

10

【0034】

さらにより好ましくは、 R_4 は水素であり、及び、 R_3 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ であり；又は

R_3 は水素であり、及び、 R_4 は、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である。

20

【0035】

もっとも好ましくは、 R_4 は水素であり、及び、 R_3 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ であり；又は

R_3 は水素であり、及び、 R_4 は、トリフルオロメチル、ハロゲン、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である。

30

【0036】

好ましくは、 R_5 及び R_6 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1\sim C_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ又は $-N(R_9)C(=O)R_{10}$ である。

【0037】

より好ましくは、 R_5 及び R_6 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である。

40

【0038】

さらにより好ましくは、 R_6 は水素であり、及び、 R_5 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ であり；又は

R_5 は水素であり、及び、 R_6 は、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロ

50

エチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である。

【0039】

もっとも好ましくは、 R_6 は水素であり、及び、 R_5 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ であり；又は

R_5 は水素であり、及び、 R_6 は、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である。

10

【0040】

好ましくは、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素又は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルである。

【0041】

より好ましくは、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素又はメチルである。

【0042】

もっとも好ましくは、 R_9 は水素又はメチルであり、及び、 R_{10} はメチルである。

20

【0043】

好ましくは、 A は CH 又は N である。

【0044】

もっとも好ましくは、 A は N である。

【0045】

好ましくは、 A_1 は CH 又は N である。

【0046】

好ましくは、 A_2 は CH 又は N である。

【0047】

また、 A_1 が CH であり、及び、 A_2 が N である場合が好ましい。

30

【0048】

また、 A_1 が N であり、及び、 A_2 が CH である場合が好ましい。

【0049】

A_1 及び A_2 が共に N である場合がさらに好ましい。

【0050】

もっとも好ましくは、 A_1 及び A_2 は共に CH である。

【0051】

好ましくは、 R_7 及び R_8 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ シアノアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ又は $-\text{N}(\text{R}_{11})\text{C}(=\text{O})\text{R}_{12}$ である。

40

【0052】

より好ましくは、 R_7 及び R_8 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である。

【0053】

さらにより好ましくは、 R_8 は水素であり、及び、 R_7 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2$

50

CF_3 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ であり；又は

R_7 は水素であり、及び、 R_8 は、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である。

【0054】

もっとも好ましくは、 R_8 は水素であり、及び、 R_7 は、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ であり；又は

R_7 は水素であり、及び、 R_8 は、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である。

【0055】

好ましくは、 R_{11} 及び R_{12} は、相互に独立して、水素又は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルである。

【0056】

より好ましくは、 R_{11} 及び R_{12} は、相互に独立して、水素又はメチルである。

【0057】

もっとも好ましくは、 R_{11} は水素又はメチルであり、及び、 R_{12} はメチルである。

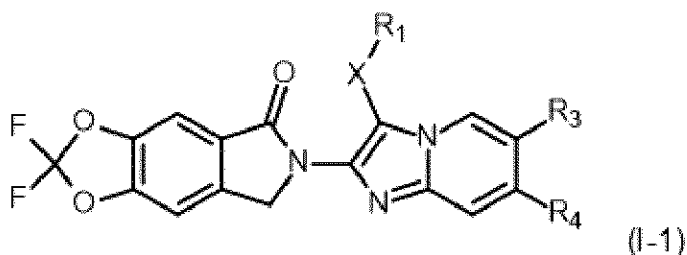
【0058】

本発明に係るさらなる実施形態が、以下に記載のとおり提供されている。

【0059】

式Iの化合物の好ましい群は、式I-1の化合物

【化3】



(式中、 X 、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_9 及び R_{10} は、上記の式Iに定義されているとおりである)、又は、式I-1の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドにより表される。

【0060】

式I-1の化合物の好ましい一群において、 R_1 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル又は $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル- $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルであり； X は S 又は SO_2 であり； R_3 及び R_4 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ シアノアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ又は $-\text{N}(\text{R}_9)\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ であり；並びに、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素又は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルであり；好ましくは、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素又はメチルであり；より好ましくは、 R_9 は水素又はメチルであり、及び、 R_{10} はメチルである。

【0061】

式Ⅰ－１の化合物の他の好ましい群において、 R_1 はエチル又はシクロプロピルメチルであり、好ましくは、 R_1 はエチルであり； X は S 又は SO_2 であり、好ましくは、 X は SO_2 であり；並びに、 R_3 及び R_4 は、相互に独立して、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、 $1, 1$ －ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である。

【００６２】

本明細書に記載の式Ⅰ－１の化合物、及び、式Ⅰ－１の化合物の好ましい実施形態のすべてにおいては、別段の規定がある場合を除き、 X 、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_9 及び R_{10} は、上記の式Ⅰに定義されているとおりである。

10

【００６３】

式Ⅰ－１の化合物の他の好ましい実施形態は、 R_1 がエチルであり；及び、 X が SO_2 であるものである。

【００６４】

また、 R_4 が水素であり、及び、 R_3 が、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、 $1, 1$ －ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式Ⅰ－１の化合物；又は、 R_3 が水素であり、及び、 R_4 が、トリフルオロメチル、 $1, 1$ －ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式Ⅰ－１の化合物が好ましい。

20

【００６５】

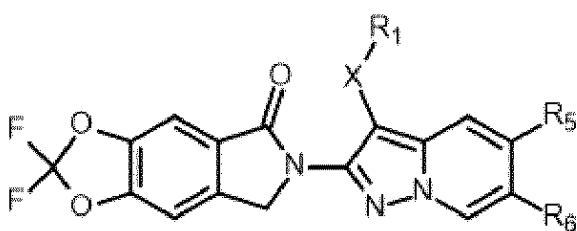
R_4 が水素であり、及び、 R_3 が、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、 $1, 1$ －ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、 1 －シアノシクロプロピル、 1 －シアノ－ 1 －メチル－エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式Ⅰ－１の化合物；又は、 R_3 が水素であり、及び、 R_4 が、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、 $1, 1$ －ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、 1 －シアノシクロプロピル、 1 －シアノ－ 1 －メチル－エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式Ⅰ－１の化合物がさらに好ましい。

30

【００６６】

式Ⅰの化合物の他の好ましい群は、式Ⅰ－２の化合物

【化４】



(I-2)

40

(式中、 X 、 R_1 、 R_5 、 R_6 、 R_9 及び R_{10} は、上記の式Ⅰに定義されているとおりである)、又は、式Ⅰ－２の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N －オキシドにより表される。

【００６７】

50

式 I-2 の化合物の好ましい一群において、 R_1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルであり； X は S 又は SO_2 であり； R_5 及び R_6 は、相互に独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ又は $-N(R_9)C(=O)R_{10}$ であり；並びに、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素又はメチルであり、より好ましくは、 R_9 は水素又はメチルであり、及び、 R_{10} はメチルである。

【0068】

式 I-2 の化合物の他の好ましい群において、 R_1 はエチル又はシクロプロピルメチルであり、好ましくは、 R_1 はエチルであり； X は S 又は SO_2 であり、好ましくは、 X は SO_2 であり； R_5 及び R_6 は、相互に独立して、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、1, 1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である。

【0069】

本明細書に記載の式 I-2 の化合物、及び、式 I-2 の化合物の好ましい実施形態のすべてにおいては、別段の規定がある場合を除き、 X 、 R_1 、 R_5 、 R_6 、 R_9 及び R_{10} は、上記の式 I に定義されているとおりである。

【0070】

式 I-2 の化合物の他の好ましい実施形態は、 R_1 がエチルであり；及び、 X が SO_2 であるものである。

【0071】

また、 R_6 が水素であり、及び、 R_5 が、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、1, 1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式 I-2 の化合物；又は、 R_5 が水素であり、及び、 R_6 が、トリフルオロメチル、1, 1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式 I-2 の化合物が好ましい。

【0072】

R_6 が水素であり、及び、 R_5 が、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、トリフルオロメチル、1, 1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式 I-2 の化合物；又は、 R_5 が水素であり、及び、 R_6 が、トリフルオロメチル、1, 1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式 I-2 の化合物がさらに好ましい。

【0073】

式 I の化合物の他の好ましい群は、式 I-3 の化合物

10

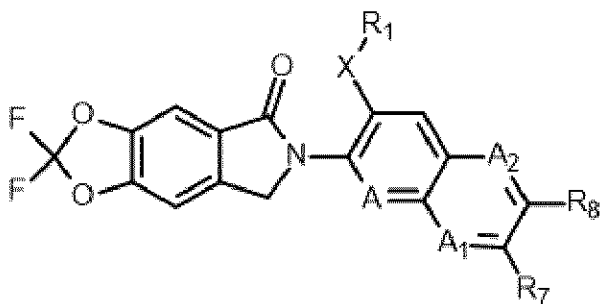
20

30

40

50

【化 5】



(I-3)

10

(式中、A、A₁、A₂、X、R₁、R₇、R₈、R₁₁及びR₁₂は、上記の式 I に定義されているとおりである)、又は、式 I-3 の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N-オキシドにより表される。

【0074】

式 I-3 の化合物の好ましい一群において、A は CH 又は N であり；A₁ は CH 又は N であり；A₂ は CH 又は N であり；R₁ は、C₁～C₄アルキル又は C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；X は S 又は SO₂であり；R₇及びR₈は、相互に独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、シアノで単置換された C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆シアノアルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、又は -N(R₁₁)C(=O)R₁₂であり；並びに、R₁₁及びR₁₂は、相互に独立して、水素又は C₁～C₄アルキルであり；好ましくは、R₁₁及びR₁₂は、相互に独立して、水素又はメチルであり；より好ましくは、R₁₁は水素又はメチルであり、及び、R₁₂はメチルである。

20

【0075】

式 I-3 の化合物の他の好ましい群において、A は CH 又は N であり、好ましくは、A は N であり；A₁ は CH 又は N であり；A₂ は CH 又は N であり；R₁ はエチル又はシクロプロピルメチルであり、好ましくは、R₁ はエチルであり；X は S 又は SO₂であり、好ましくは、X は SO₂であり；R₇及びR₈は、相互に独立して、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は -NCH₃C(O)CH₃である。

30

【0076】

本明細書に記載の式 I-3 の化合物、及び、式 I-3 の化合物の好ましい実施形態のすべてにおいては、別段の規定がある場合を除き、A、A₁、A₂、X、R₁、R₇、R₈、R₁₁及びR₁₂は、上記の式 I に定義されているとおりである。

【0077】

式 I-3 の化合物の他の好ましい実施形態は、R₁がエチルであり；及び、XがSO₂であるものである。

40

【0078】

また、R₈が水素であり、及び、R₇が、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は -NCH₃C(O)CH₃である式 I-3 の化合物；又は

R₇が水素であり、及び、R₈が、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN

50

、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である式Ⅰ-3の化合物が好ましい。

【0079】

R_8 が水素であり、及び、 R_7 が、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である式Ⅰ-3の化合物；又は

R_7 が水素であり、及び、 R_8 が、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 又は $-\text{NCH}_3\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ である式Ⅰ-3の化合物がさらに好ましい。

10

【0080】

本実施形態に係る化合物のさらに好ましい一群は、式Ⅰ-3の化合物、又は、式Ⅰ-3の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-3a)の化合物であり、ここで、AはCHである。

【0081】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、式Ⅰ-3の化合物、又は、式Ⅰ-3の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-3b)の化合物であり、ここで、AはNである。

20

【0082】

本実施形態に係る化合物のさらに他の好ましい群は、式Ⅰ-3の化合物、又は、式Ⅰ-3の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-3c)の化合物であり、ここで、 A_1 はCHであり、及び、 A_2 はNである。

【0083】

本実施形態に係る化合物のさらに好ましい群は、式Ⅰ-3の化合物、又は、式Ⅰ-3の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-3d)の化合物であり、ここで、 A_1 はNであり、及び、 A_2 はCHである。

【0084】

本実施形態に係る化合物のさらに好ましい群は、式Ⅰ-3の化合物、又は、式Ⅰ-3の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-3e)の化合物であり、ここで、 A_1 及び A_2 は共にNである。

30

【0085】

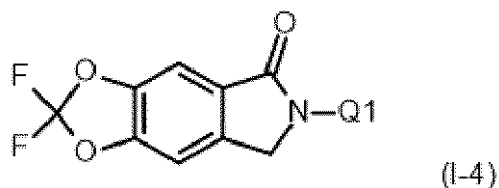
式Ⅰ-3の化合物、又は、式Ⅰ-3の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、本実施形態に係る式(Ⅰ-3f)の化合物が最も好ましく、ここで、 A_1 及び A_2 は共にCHである。

【0086】

式Ⅰの化合物の他の好ましい群は、式Ⅰ-4の化合物

【化6】

40

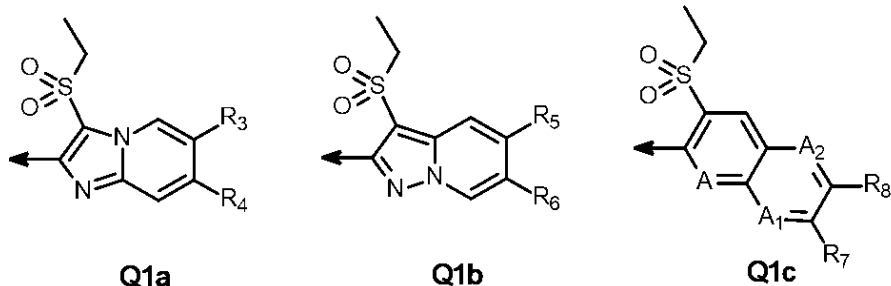


(式中、

Q_1 は、式 Q_1a 、 Q_1b 及び Q_1c

50

【化 7】



10

(式中、矢印は、三環式環の窒素原子に対する結合点を示す)

からなる群から選択される基であり；

並びに、A、A₁、A₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₁及びR₁₂は、上記の式Iに定義されているとおりである)、又は、式I-4の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドにより表される。

【0087】

本明細書に記載の式I-4の化合物、及び、式I-4の化合物の好ましい実施形態のすべてにおいては、別段の規定がある場合を除き、A、A₁、A₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₁及びR₁₂は、上記の式Iに定義されているとおりである。

20

【0088】

式I-4の化合物の好ましい一群は、式I-4の化合物、又は、式I-4の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(I-4a)の化合物であり、ここで、QはQ1aであり、R₄は水素であり、及び、R₃は、水素、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル、シアノで単置換されたC₃~C₆シクロアルキル、C₁~C₆シアノアルキル、C₁~C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、-N(R₉R₁₀)又は-N(R₉)C(=O)R₁₀であり；並びに、R₉及びR₁₀は、相互に独立して、水素、C₁~C₄アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₃~C₆シクロアルキルであり；又は

QはQ1aであり、R₃は水素であり、及び、R₄は、水素、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル、シアノで単置換されたC₃~C₆シクロアルキル、C₁~C₆シアノアルキル、C₁~C₆シアノアルコキシ、シアノ、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、-N(R₉R₁₀)又は-N(R₉)C(=O)R₁₀であり；並びに、R₉及びR₁₀は、相互に独立して、水素、C₁~C₄アルキル、C₁~C₆ハロアルキル又はC₃~C₆シクロアルキルである。

30

【0089】

R₄が水素であり、及び、R₃が、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である式I-4aの化合物；又は、R₃が水素であり、及び、R₄が、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、-OCHF₂、-OCH₂CHF₂、-OCH₂CF₃、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、-CHF₂、-OC(CH₃)₂CN、-NHC(O)CH₃又は-NCH₃C(O)CH₃である式I-4aの化合物がさらに好ましい。

40

【0090】

式I-4の化合物の他の好ましい群は、式I-4の化合物、又は、式I-4の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(I-4b)の化合物であり、ここで、QはQ1bであり、R₆は水素であり、及び、R₅は、水素、ハロゲン、C₁~C₄アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル、シアノで単置換されたC₃~C₆シ

50

クロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_9R_{10})$ 又は $-N(R_9)C(=O)R_{10}$ であり；並びに、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；又は

QはQ1bであり、 R_5 は水素であり、及び、 R_6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_9R_{10})$ 又は $-N(R_9)C(=O)R_{10}$ であり；並びに、 R_9 及び R_{10} は、相互に独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである。

10

【0091】

R_6 が水素であり、及び、 R_5 が、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式I-4bの化合物；又は、 R_5 が水素であり、及び、 R_6 が、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式I-4bの化合物がさらに好ましい。

20

【0092】

式I-4の化合物の他の好ましい群は、式I-4の化合物、又は、式I-4の化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(I-4c)の化合物であり、ここで、QはQ1cであり、 R_8 は水素であり、及び、 R_7 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ又は $-N(R_{11})C(=O)R_{12}$ であり；並びに、 R_{11} 及び R_{12} は、相互に独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；又は

QはQ1cであり、 R_7 は水素であり、及び、 R_8 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノで単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ又は $-N(R_{11})C(=O)R_{12}$ であり；並びに、 R_{11} 及び R_{12} は、相互に独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである。

30

【0093】

R_8 が水素であり、及び、 R_7 が、水素、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式I-4cの化合物；又は

40

R_7 が水素であり、及び、 R_8 が、トリフルオロメチル、1,1-ジフルオロエチル、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、トリフルオロメトキシ、 $-CHF_2$ 、 $-OC(CH_3)_2CN$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 又は $-NCH_3C(O)CH_3$ である式I-4cの化合物がさらに好ましい。

【0094】

本実施形態に係る化合物のさらに好ましい一群は、式I-I-4cの化合物、又は、式I-I-4cの化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(I-4c-1)の化合物であり、ここで、AはCHである。

50

【0095】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物、又は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-4c-2)の化合物であり、ここで、AはNである。

【0096】

本実施形態に係る化合物のさらに他の好ましい群は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物、又は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-4c-3)の化合物であり、ここで、A₁はCHであり、及び、A₂はNである。

【0097】

本実施形態に係る化合物のさらに好ましい群は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物、又は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-4c-4)の化合物であり、ここで、A₁はNであり、及び、A₂はCHである。

10

【0098】

本実施形態に係る化合物のさらに好ましい群は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物、又は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-4c-5)の化合物であり、ここで、A₁及びA₂は共にNである。

【0099】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物、又は、式Ⅰ-Ⅰ-4cの化合物の好ましい実施形態のいずれかのものである、式(Ⅰ-4c-6)の化合物であり、ここで、A₁及びA₂は共にCHである。

20

【0100】

本発明に係る化合物は、とりわけ、昆虫に対して植物を保護するための有利なレベルの生物学的活性、又は、農芸化学的有効成分として用いられるための優れた特性(例えば、高い生物学的活性、有利な活性範囲、高い安全性プロファイル、向上した物理化学的特性、又は、高い生分解性又は環境プロファイル)を含むいずれかの数の有益性を有し得る。特に、一定の式(Ⅰ)の化合物は、特にミツバチ、単生ミツバチ及びマルハナバチなどの受粉媒介者といった非標的節足動物に対して有利な安全性プロファイルを示し得ることが意外なことに見出された。もっとも具体的には、セイヨウミツバチ(*Apis mellifera*)である。

【0101】

他の態様において、本発明は、式(Ⅰ)、(Ⅰ-1)、(Ⅰ-2)、(Ⅰ-3)及び(Ⅰ-4)の化合物(上記)で実施形態において定義されている、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的若しくは殺軟体動物的に有効な量の式(Ⅰ)の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド、及び、任意に、助剤又は希釈剤を含む組成物を提供する。

30

【0102】

さらなる態様において、本発明は、有害生物、有害生物の生息地、又は、有害生物による攻撃を受けやすい植物に、式(Ⅰ)、(Ⅰ)、(Ⅰ-1)、(Ⅰ-2)、(Ⅰ-3)及び(Ⅰ-4)の化合物(上記)で実施形態のいずれかにおいて定義されている、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の式(Ⅰ)の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド、又は、上記に定義されている組成物を適用するステップを含む、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法を提供する。

40

【0103】

さらなる態様において、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、繁殖材料、又は、繁殖材料が植えられる場所を、上記に定義されている組成物で処理するステップを含む方法を提供する。

【0104】

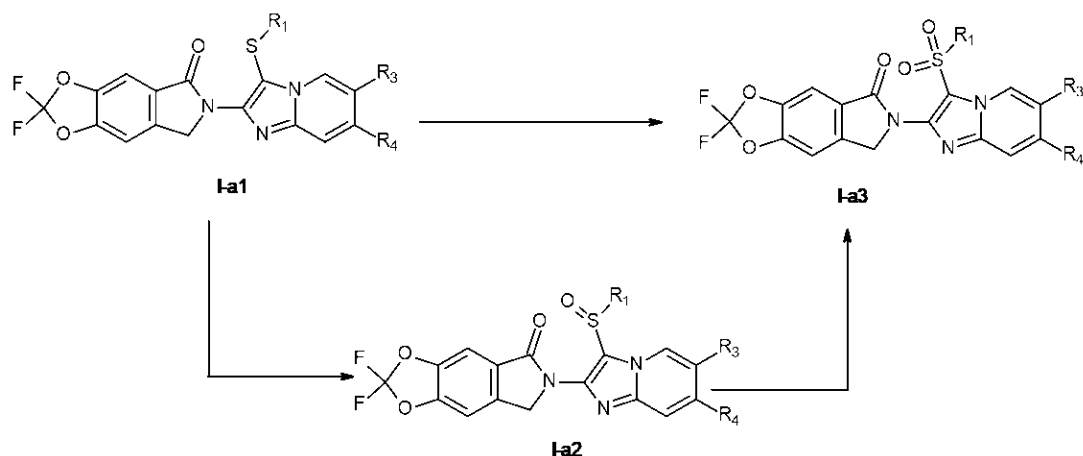
本発明に係る式Ⅰの化合物の調製プロセスは、基本的に当業者に公知の方法により実施される。より具体的には、式Ⅰの化合物のサブグループ(式中、XはSO(スルホキシド

50

）及び／又は SO_2 （スルホン）である）は、酸化剤の中でも、例えば、メタクロロ過安息香酸（mCPBA）、過酸化水素、オキソン、過ヨウ素酸ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウム又は次亜塩素酸tert-ブチルなどの試薬が用いられる、対応する式Iのスルフィド化合物（式中、XはSである）の酸化反応により入手し得る（スキーム1a、1b及び2）。

スキーム1a：

【化8】

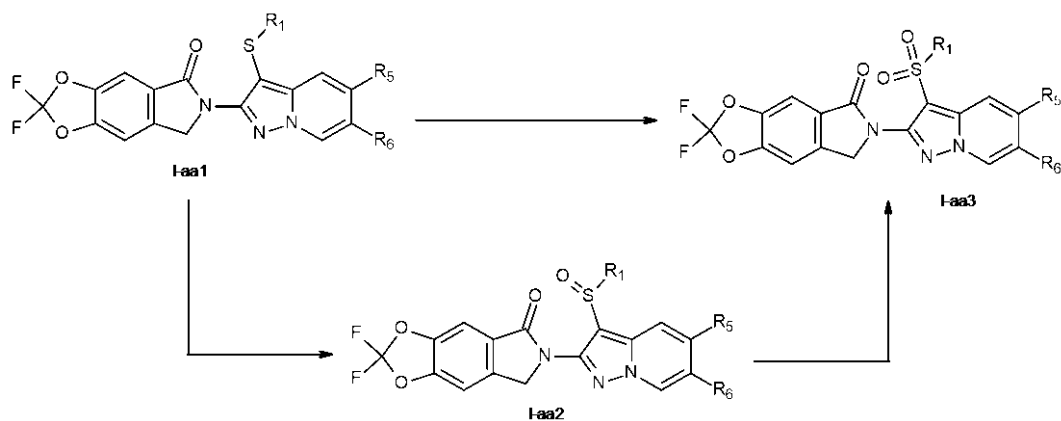


10

20

スキーム1b：

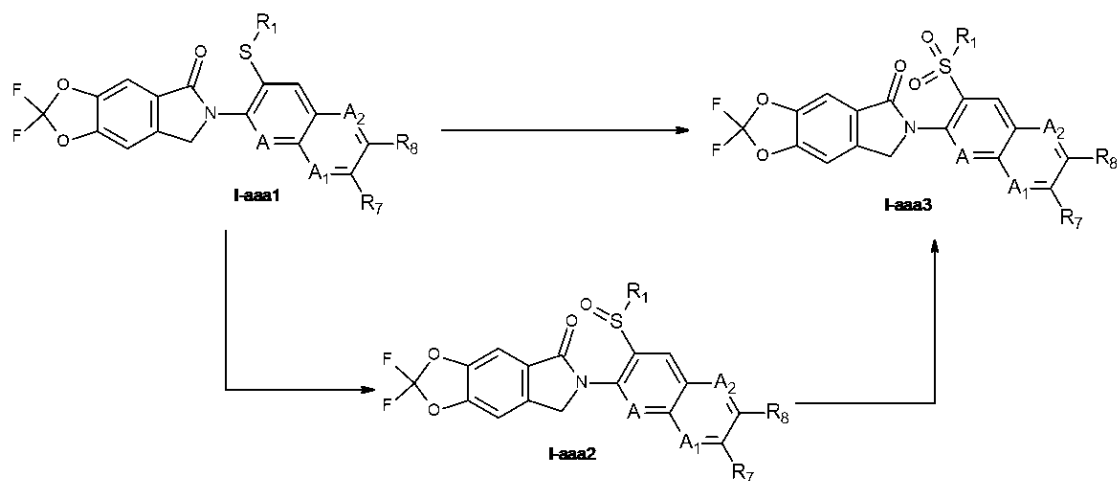
【化9】



30

スキーム2：

【化10】



40

50

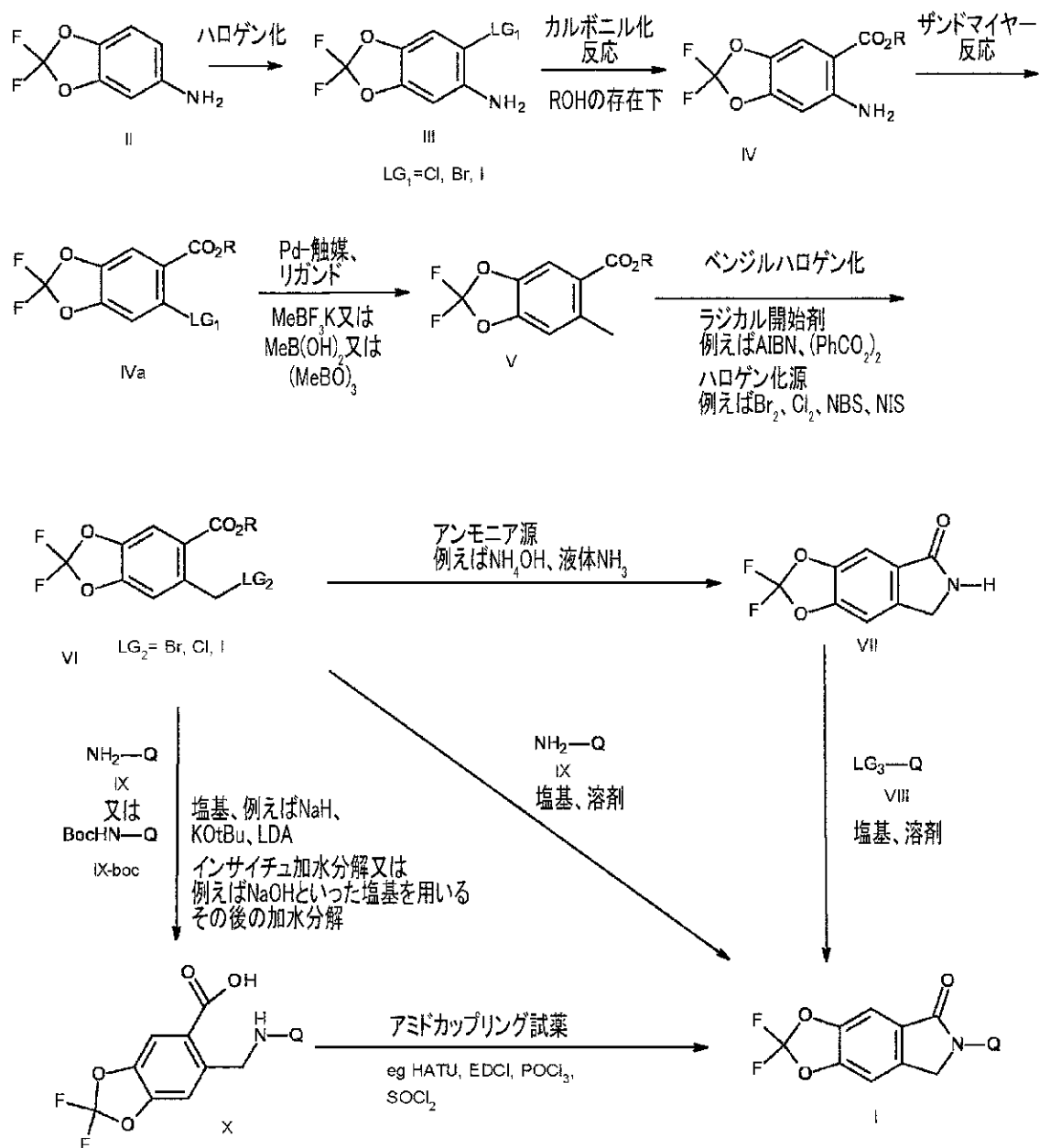
この酸化反応は一般に、溶剤の存在下で実施される。この反応において用いられる溶剤の例としては、ジクロロメタン及びクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素；メタノール及びエタノールなどのアルコール；酢酸；水；並びに、これらの混合物が挙げられる。この反応において用いられる酸化剤の量は、一般に、スルホキシド化合物Ⅰを生成するための１モルのスルフィド化合物Ⅰを基準として、１～３モル、好ましくは、１～１．２モルであり、及び、好ましくは、スルホン化合物Ⅰを生成するための１モルのスルフィド化合物Ⅰを基準として、２～２．２モルの酸化剤である。このような酸化反応は、例えば国際公開第２０１３／０１８９２８号において開示されている。

【０１０５】

式Ⅰの化合物（式中、Ｑは上記の式Ⅰで定義されているとおりである）は、式ⅤⅠⅠの化合物及び式ⅤⅠⅠⅠの化合物（式中、Ｑは式Ⅰで定義されているとおりであり、及び、 LG_3 はハロゲン（又は、トリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）である）を、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又は水素化ナトリウムなどの塩基の存在下、例えばテトラヒドロフラン、ジオキサン、 N,N -ジメチルホルムアミド、 N,N -ジメチルアセタミド又はアセトニトリルなどの適切な溶剤中、 $0\sim150^{\circ}C$ の温度、任意にマイクロ波の照射下で反応させることにより調製し得る（スキーム３）。或いは、式Ⅰの化合物（式中、Ｑは、上記式Ⅰに定義されているとおりである）は、式ⅤⅠⅠの化合物及び式ⅤⅠⅠⅠの化合物（式中、Ｑは、上記式Ⅰに定義されているとおりであり、及び、 LG_3 はハロゲン（又は、トリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）である）、好ましくは、ブ
ロモ又はヨードである）を、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又はカリウム
 t -ブトキシドなどの塩基の存在下、銅触媒、例えばヨウ化銅（Ⅰ）といった金属触媒の存在下、任意に、リガンド、例えばジアミンリガンド（例えば N,N' -ジメチルエチレンジアミン又はトランス-シクロヘキシルジアミン）又はジベンジリデンアセトン（ dba ）又は
１，１０-フェナントロリンの存在下に、 $30\sim180^{\circ}C$ の温度、任意に、マイクロ波の照射下で、又は、例えば酢酸パラジウム（Ⅱ）、ビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウム（０）（ $Pd(dba)_2$ ）又はトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（ $Pd_2(dba)_3$ （任意に、クロロホルム付加物の形態）といったパラジウム触媒、又は、例えば
 $t-BuBrettPhosPdG_3[(2-ジ-
t-ブチルホスフィノ-3,6-ジメトキシ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)-2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]$ パラジウム（Ⅱ）
メタンスルホン酸若しくは
 $BrettPhosPdG_3[(2-ジ-シクロヘキシルホスフィノ-3,6-ジメトキシ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)-2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]$ パラジウム（Ⅱ）メタンスル
ホン酸などのパラジウム触媒の存在下、及び、任意に、リガンド、例えば
 $SPhos$ 、 $t-BuBrettPhos$ 又はキサントホスの存在下に、 $60\sim120^{\circ}C$ の温度で、任意に、マイクロ波の照射下で、反応させることにより調製し得る。上記の反応は、トルエン、ジメチルホルムアミドDMF、 N -メチルピロリドンNMP、ジメチルスルホキシドDMSO、ジオキサン、テトラヒドロフランTHFなどの溶剤の存在下で実施し得、例えば、国際公開第２０１２０３１００４号、国際公開第２００９０４２９０７号、及び、
Synthetic Communications 2011, 41: 67-72といった文献に記載されている。

スキーム３：

【化 1 1】



10

20

30

【0106】

或いは、式 I の化合物（式中、Q は上記の式 I で定義されているとおりである）は、式 VI の化合物（式中、LG₂ は、例えば Br、Cl 又は I（好ましくはブromo）といった脱離基であり、並びに、R は、C₁～C₆アルキル、ベンジル又はフェニル基である）及び式 IX の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）を、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又は水素化ナトリウム、N, N-ジイソプロピルエチルアミン又は KOTBu などの塩基の存在下、及び、エタノール、メタノール、ジオキサン、トルエン、DMF、DMA、DMSO、THF などの溶剤の存在下、0～150℃の温度、任意にマイクロ波の照射下で反応させることにより調製し得る。このような反応は、求核置換、及び、その後の環化を介して進行し、例えば国際公開第2009042907号といった文献においても報告されている。

40

【0107】

或いは、式 I の化合物（式中、Q は上記の式 I で定義されているとおりである）は、式 X の化合物（式中、Q は、式 I に定義されているとおりである）を、例えばオキシ塩化リンの存在下、任意に、トルエン又はキシレンなどの溶剤又は希釈剤の存在下に、0～18

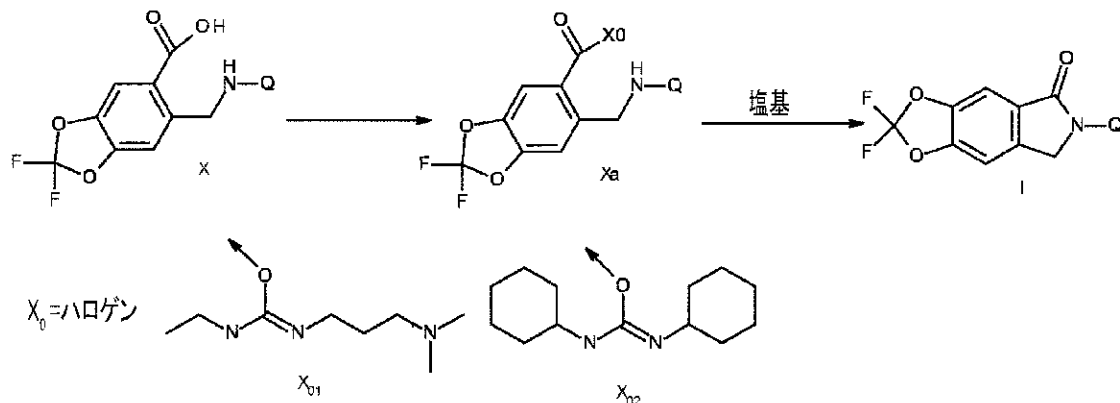
50

0℃、好ましくは20～120℃の温度で環化することにより調製可能である。

【0108】

スキーム4：

【化12】



10

20

30

40

50

式Iの化合物（式中、Qは上記の式Iに定義されているとおりである）はまた、トリエチルアミン、N，N-ジイソプロピル-エチルアミン又はピリジンなどの塩基の存在下、任意に、触媒（4-ジメチルアミノピリジンDMA Pなど）の存在下、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、N，N-ジメチル-ホルムアミド、N，N-ジメチルアセタミド、アセトニトリル、酢酸エチル又はトルエンなどの不活性溶剤中、0～50℃の温度における、式Xa（式中、Qは上記の式Iに定義されているとおりであり、並びに、ここで、X0はハロゲン、好ましくは塩素であり、又は、X0はX01若しくはX02である）の環化によって調製可能である（スキーム4）。ピリジン及びトリエチルアミンなどの一定の塩基は、塩基及び溶剤の両方として好都合に採用し得る。

【0109】

式Xaの化合物（式中、Qは、上記式Iに定義されているとおりであり、並びに、ここで、X0はハロゲン、好ましくは塩素であり、又は、X0はX01又はX02である）は、当業者に公知の方法、及び、例えばTetrahedron, 2005, 61(46), 10827-10852に記載の方法による式Xの化合物（Qは上記式Iに定義されているとおりである）の活性化によって調製可能である。活性化種Xa（式中、Qは上記式Iに定義されているとおりであり、並びに、ここで、X0はハロゲン、好ましくは塩素である）の形成が好ましい。例えば、化合物Xa（式中、X0がハロゲン、好ましくは塩素である）は、触媒量のN，N-ジメチルホルムアミドDMFの存在下、塩化メチレンCH2Cl2又はテトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、20～100℃、好ましくは25℃の温度における、例えば塩化オキサリル(COCl)2又は塩化チオニルSOCl2によるXの処理によって形成される。或いは、例えば1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドEDC又はジシクロヘキシルカルボジイミドDCCによる式Xの化合物の処理で、ピリジン又はテトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、任意に、トリエチルアミンなどの塩基の存在下に、50～180℃の温度で、活性化種Xa（式中、X0は、それぞれX01又はX02である）が生成される。

【0110】

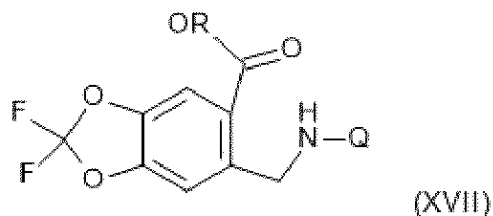
式VIIの化合物は、式VIの化合物（式中、LG2は、例えばBr、Cl又はI（好ましくは、プロモ）といった脱離基であり、並びに、Rは、C1～C6アルキル、ベンジル又はフェニル基である）を、アンモニア又は例えばNH4OHといったアンモニアの代用物と、エタノール、メタノール、ジオキサン、トルエン、DMF、DMA、DMSO及びTHFなどの溶剤の存在下に、0～150℃の温度、任意に、マイクロ波の照射下で反応させることにより調製可能である。

【0111】

式Xの化合物（式中、Qは上記の式Iで定義されているとおりである）は、式IXのA

ミノ化合物（又は、式 IX-boc の化合物、及び、次いで、反応後における BOC 官能基の脱保護）（式中、 Q は式 I で定義されているとおりである）による式 VI の化合物（式中、 LG_2 は、例えば Br 、 Cl 又は I （好ましくはブromo）といった脱離基であり、並びに、 R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）の求核置換反応、これに続く、式 XVII の中間体エステル（式中、 Q は上記の式 I で定義されているとおりであり、及び、 R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）のインサイチュ加水分解により調製可能である。

【化 13】



10

【0112】

インサイチュで生成された加水分解されていない式 XVII のエステル化合物は単離し得ると共に、例えば NaOH 、 LiOH 、 $\text{Ba}(\text{OH})_2$ といった好適な塩基の存在下における鹼化反応を介して転換して式 X のカルボン酸をも形成可能である。式 VI の化合物の式 X の化合物への転換は、とりわけ、水素化ナトリウム、 KOtBu 、ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミドなどの塩基の存在下、及び、ジオキサン、 DMF 、 DMA 、 DMSO 、 THF などの溶剤の存在下に、 $-30 \sim 150^\circ\text{C}$ の温度で実施可能である。式 VI の化合物（式中、 LG_2 は、例えば Br 、 Cl 又は I （好ましくはブromo）といった脱離基であり、並びに、 R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）は、式 V の化合物（式中、 R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）のラジカルにより誘起されるベンジルハロゲン化により調製可能である。このような反応は当業者に周知であり、とりわけ、 Br_2 、 NBS 、 Cl_2 、 NIS などの求電子性ハロゲン化試薬の存在下、及び、例えば AIBN （アゾビスイソブチロニトリル）、過酸化ベンゾイルといったラジカル開始剤の存在下、又は、光化学条件下、及び、 $20^\circ\text{C} \sim$ 溶剤の沸点の範囲の温度、及び、トルエン、キシレン、アセトニトリル、ヘキサン、ジクロロエタン又は四塩化炭素などの溶剤の存在下で実施され得る。このような反応はウォールチーグラウー臭素化の名称で知られており、例えば *Synthesis*, 2015, 47, 1280-1290、及び、*J. Am. Chem. Soc.*, 1963, 85 (3), pp 354-355 といった文献において報告されている。

20

30

【0113】

式 V の化合物（式中、 R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）は、式 IVa の化合物（式中、 LG_1 は、ハロゲン Br 、 Cl 、 I 、好ましくは Cl であり、及び、 R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）を、他のメチルホウ酸同等物、とりわけ、トリメチルボロキシン又はメチルトリフルオロホウ酸カリウムとの反応を例えば含むスズキ反応により調製され得る。この反応は、炭酸ナトリウム、リン酸三カリウム又はフッ化セシウムのような塩基の存在下、例えばジオキサン、アセトニトリル、 N 、 N -ジメチルホルムアミド、1,2-ジメトキシエタンと水との混合物若しくはジオキサン／水混合物若しくはトルエン／水混合物のような溶剤又は溶剤混合物中、好ましくは不活性雰囲気下において、パラジウム系触媒、例えばテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）、（1,1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン）ジクロロパラジウムジクロロメタン（1:1 錯体）又はクロロ（2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル）[2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]パラジウム（II）（ XPhos パラダサイクル）により触媒され得る。反応温度は、好ましくは室温～反応混合物の沸点の範囲であることが可能であり、又は、反応はマイクロ波の照射下で行われ得る。このようなスズキ反応

40

50

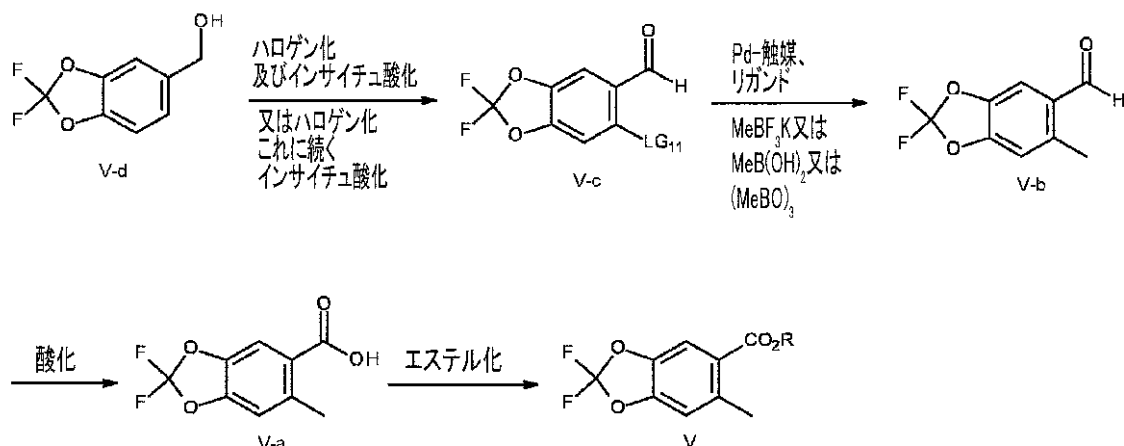
は、当業者に周知であり、例えば *J. Organomet. Chem.* 576, 1999, 147-168 においてレビューされている。

【0114】

或いは、式 V の化合物（式中、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）は、スキーム 3 a に従って調製可能である。

スキーム 3 a

【化 1 4】



10

20

【0115】

スキーム 3 a において、式 V の化合物（式中、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）は、例えば硫酸又はルイス酸、例えば $Sc(OTf)_3$ 又は $FeCl_3$ といった酸触媒の存在下における、式 V-a の化合物と R-OH（式中、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）との反応を含む、エステル化反応を介して、式 V-a の化合物から調製可能である。このような反応は当業者に周知であり、フィッシャーエステル化反応の名称で知られており、例えば、*Org. Chem.*, 2006, 71, 3332-3334、*Chem. Commun.*, 1997, 351-352、及び、*Synthesis*, 2008, 3407-3410 といった文献中において報告されている。このようなエステル化反応はまた、式 III の化合物を $TMSCN_2$ と反応させて式 V の化合物（式中、R はメチルである）を形成することにより実施可能であり、*Angew. Chem. Int. Ed.* 2007, 46, 7075 に報告されている。式 V-a の化合物は、式 V-b の化合物の酸化反応により調製可能である。このような反応は当業者に周知である。このような変換を促進させる試薬の例としては、金属水酸化物又は Ag_2O （トレンス試薬の名称で知られている）の存在下における、オキシソ、 $KMnO_4$ 、 $NaClO_2$ （ピニック酸化の名称で知られている）、 $AgNO_3$ が挙げられる。このような反応は文献において公知であり、及び、例えば *Acta Chem. Scand.* 1973, 27: 888-890; *Tetrahedron* 1981, 37 (11): 2091-2096; *Ber. Deut. Chem. Gesell.*, 15 (1882), pp. 1635-1639; *Org. Synth.* 1953, 33, 94 に記載されている。式 V-b の化合物は、式 IV a の化合物の式 V の化合物への転換に係るスキーム 3 に記載されているものと同様の手法を介して、式 V-c の化合物から調製可能である。式 V-c の化合物は、とりわけ、ヨウ素、臭素、塩素、N-クロロスクシンイミド、N-ブモスクシンイミドなどのハロゲン化試薬を用いる、ハロゲン化及びインサイチュ酸化反応を介して、式 V-d の化合物から調製可能である。或いは、ハロゲン化を行うことが可能であると共に、その後のステップにおいて、酸化反応を、酸化試薬を用いて式 V-d の化合物から 2 ステップで式 V-c の化合物を形成することで実行することが可能である。式 V-d の化合物は、CAS 登録番号 72768-97-9 で文献において公知である。

30

40

【0116】

50

式ⅠⅤaの化合物（式中、 LG_1 は、ハロゲンBr、Cl、I、好ましくは、Clであり、及び、Rは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）は、ハロゲン化水素酸 $H-LG_1$ 及び銅塩 $Cu-LG_1$ （式中、 LG_1 は、ハロゲン、例えばBr、Cl又はI（好ましくはCl）である）の存在下、ザンドマイヤータイプ反応条件下において、式ⅠⅤの化合物（式中、Rは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）と亜硝酸tert-ブチル $t-BuONO$ 、亜硝酸イソアミル又は亜硝酸ナトリウムなどの亜硝酸塩とを反応させることにより調製可能である（スキーム3）。この変換は、アセトニトリル、又は、1,2-ジクロロエタンのようなハロゲン化溶剤、又は、水などの不活性溶剤中、 $0 \sim 150^\circ C$ の温度、好ましくは、室温～反応混合物の沸点の範囲の温度で行われることが好ましい。式ⅠⅤの化合物（式中、Rは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）は、パラジウム触媒（例えば：酢酸パラジウム（ⅠⅠ））などの金属触媒の存在下、アルコール（ROH）溶剤（任意に、共溶剤の存在下）（式中、Rは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）、及び、任意に、ホスフィンリガンドの存在下、及び、任意に、塩基の存在下、 $0 \sim 180^\circ C$ の温度において、式ⅠⅠⅠの化合物を一酸化炭素（CO）（通常は加圧下）と反応させる、カルボニル化反応を含む、例えば国際公開第2016/020286号に見出される方法により、式ⅠⅠⅠの化合物（式中、 LG_1 はハロゲン、好ましくはBr、Cl又はIである）から調製可能である。式ⅠⅠⅠの化合物（式中、 LG_1 はハロゲン、好ましくはBr、Cl又はIである）は、例えば、式ⅠⅠの化合物と、N-クロロスクシンイミド（NCS）、N-ブromo-ハロスクシンイミド（NBS）又はN-ヨードスクシンイミド（NIS）などのハロゲン化試薬、又は、代わりに塩素、臭素又はヨウ素とを反応させる、ハロゲン化反応により調製可能である。このようなハロゲン化反応は、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、酢酸、エーテル、アセトニトリル又はN,N-ジメチルホルムアミドなどの不活性溶剤中、 $20 \sim 200^\circ C$ の温度、好ましくは、室温～ $100^\circ C$ の温度で実施される。

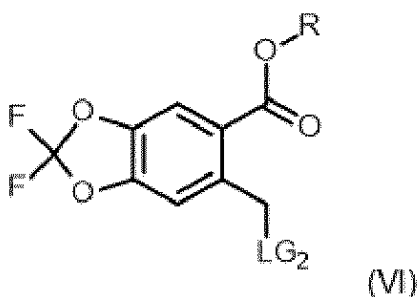
10

20

【0117】

式ⅤⅠの化合物

【化15】



30

（式中、 LG_2 は、例えばBr、Cl又はIといった脱離基であり、及び、Rは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）は新規であり、本発明に係る式Ⅰの化合物の調製のために特別に開発されたものであり、従って、本発明のさらなる目的を表す。式Ⅰの化合物の置換基の好ましさ及び好ましい実施形態も式ⅤⅠの化合物に関して有効である。好ましくは、 LG_2 はブromo又はクロロであり；さらにより好ましくは、 LG_2 はブromoである。好ましくは、Rは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；さらにより好ましくは、Rはメチル又はエチルである。

40

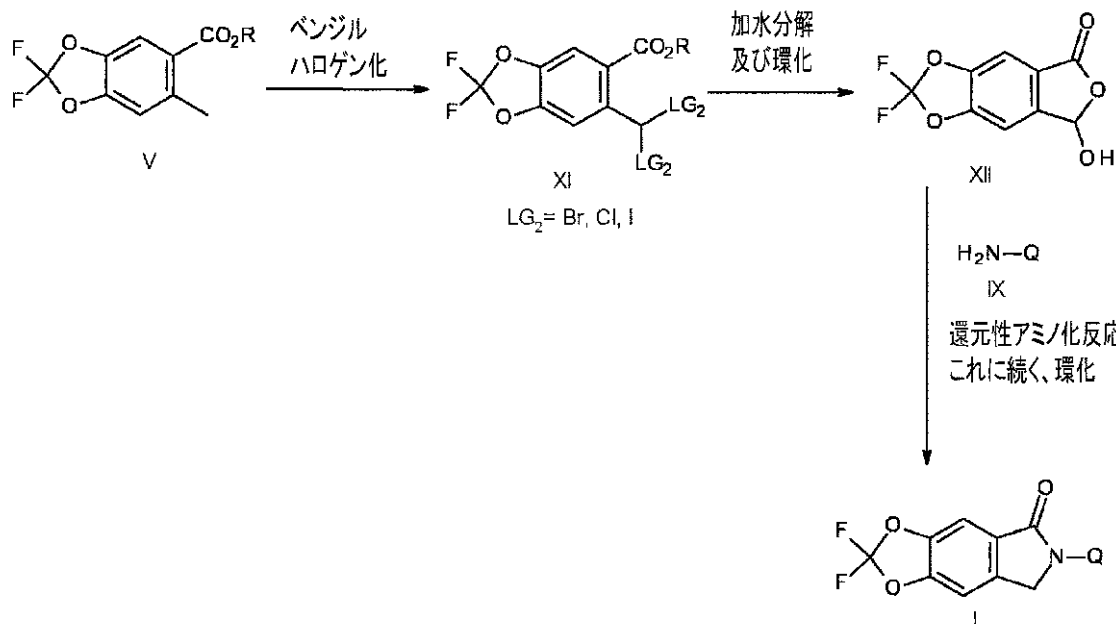
【0118】

或いは、式Ⅰの化合物（式中、Qは上記の式Ⅰで定義されているとおりである）は、スキーム5に従って調製可能である。

スキーム5：

50

【化 1 6】



10

【0119】

20

スキーム 5 において、式 I の化合物（式中、Q は上記の式 I で定義されているとおりである）は、式 X の化合物（式中、Q は上記の式 I で定義されているとおりである）から、上記のスキーム 4 に記載されている方法により調製可能である（スキーム 6）。式 X の化合物は、式 XII の化合物と式 IX の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）とを、還元性アミノ化条件下で反応させることにより調製可能である（スキーム 6）。この反応は、とりわけ、例えばシアノ水素化ホウ素ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムといった還元剤の存在下、及び、任意に、トリフルオロ酢酸、ギ酸、酢酸等などの酸の存在下、及び、0℃～溶剤の沸点の範囲の温度で実施可能である。この反応は、エタノール、メタノール、ジオキサン又はテトラヒドロフランなどの不活性溶剤の存在下で実施可能である。式 XII の化合物から式 I の化合物への 2 ステップ転換を含むこのような反応は、例えば *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* 26 (2016) 5947-5950 といった文献に記載されている。

30

【0120】

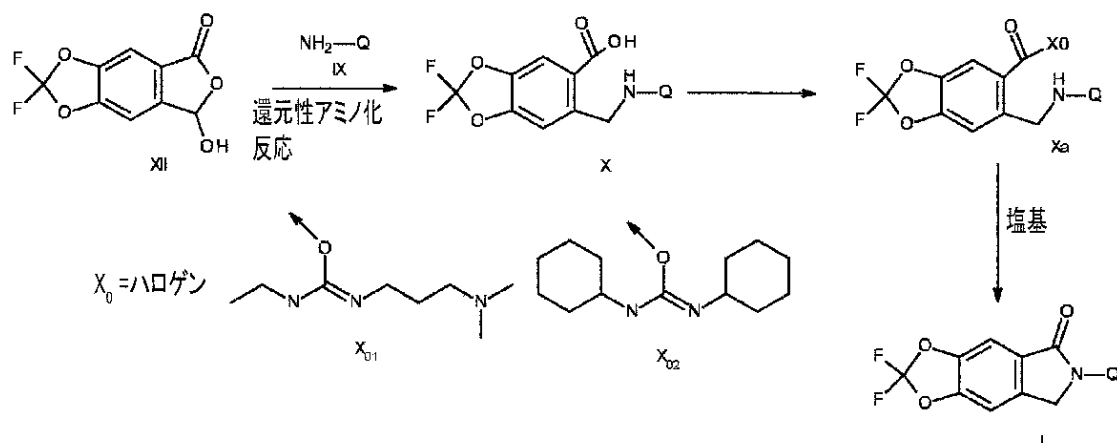
式 XII の化合物は、式 XI の化合物（式中、 LG_2 は、クロロ、ブロモ又はヨード、好ましくは、ブロモであり、及び、R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）から、加水分解、及び、その後の分子内環化反応によって調製可能である。この反応は、塩基性条件下で金属水酸化物を用いて、例えば、*Synlett* 1992, (6), 531-533 に報告されているとおり、ジオキサン、テトラヒドロフラン又は水などの溶剤の存在下、及び、20～150℃の範囲の温度で水性水酸化ナトリウムを用いて、又は、*Tetrahedron* 62 (2006) 9589-9602 に報告されているとおり、水性酸性条件下で、例えば、水、ジオキサン、又は、ジクロロエタンなどのハロゲン化溶剤などの溶剤の存在下で、酢酸、塩酸又は硫酸を用いて、実施可能である。式 XI の化合物（式中、 LG_2 は、クロロ、ブロモ又はヨード、好ましくはブロモであり、及び、R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）は、式 V の化合物から式 VI の化合物への転換についてスキーム 3 に記載されているものと類似の方法により、式 V の化合物（式中、R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニル基である）から調製可能である。

40

スキーム 6：

50

【化 1 7】



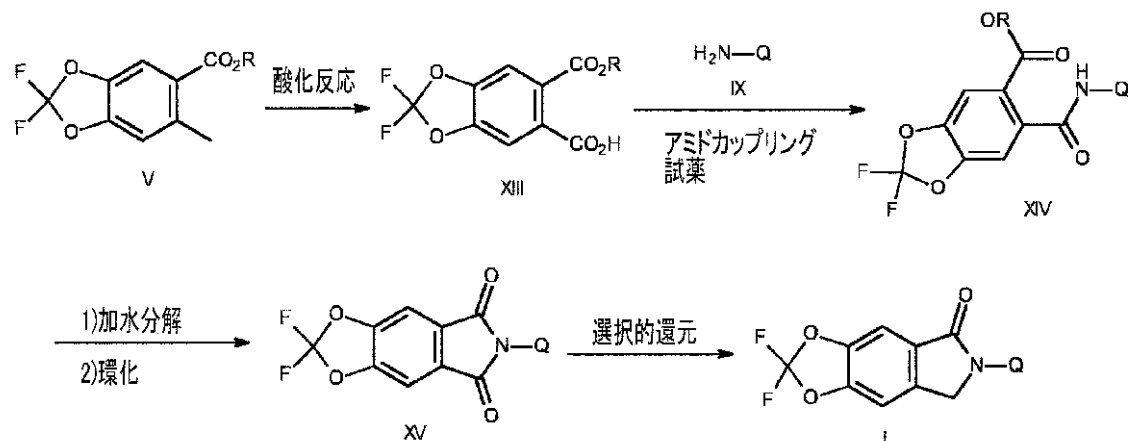
10

【0 1 2 1】

或いは、上記の式 I の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）は、上記の式 X V の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）から、カルボニル官能基の選択的還元を介して調製可能である（スキーム 7）。

スキーム 7：

【化 1 8】



20

30

【0 1 2 2】

この反応は、例えば NaBH_4 、 LiAlH_4 、パラジウム炭素といった還元剤の存在下、水素の存在下、又は、例えば NaBH_4 、続いて、トリエチルシランといった 2 種の還元剤の組合せの存在下で実施可能である。このような反応は、例えば米国特許出願公開第 2 0 1 0 0 1 6 0 3 0 3 号明細書に記載されている。上記の式 X V の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）は、上記の式 X I V の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）から、式 X の化合物の式 I の化合物への転換についてスキーム 4 に記載されているとおり、加水分解反応、及び、その後の環化反応により調製可能である。式 X I V の化合物（式中、Q は上記の式 I で定義されているとおりであり、及び、R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）は、式 X I I I の化合物（式中、R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）と、式 I X の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）とを、スキーム 4 に既に記載されているアミド化反応により反応させることにより調製可能である。式 X I I I の化合物（式中、R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）は、式 V の化合物（式中、R は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）のベンジル酸化により調製可能である。この反応は、 KMnO_4 、 nBu_4MnO_4 、 $\text{K}_2\text{S}_2\text{O}_8$ などの酸化性試薬の存在下、酸素の存在下において、又は、光化学条件下で、酸素の存在下、及び、 $20^\circ\text{C} \sim$ 溶剤

40

50

の沸点の範囲の温度において実施可能である。この反応は、アセトニトリル、酢酸エチル、DMSO、ジクロロエタンなどの不活性溶剤の存在下で実施可能である。このような反応は、例えば *Synthesis*, 2017, 49, 4007-4016、*Synthesis*, 2006, 1757-1759、及び、*IOSR Journal of Applied Chemistry*, 2014, 7, 16-27 といった文献において公知である。

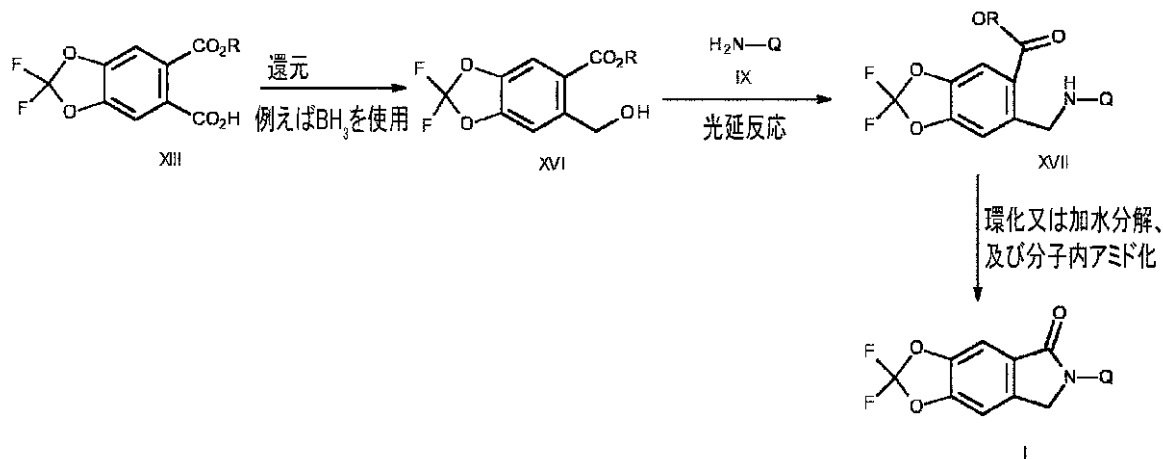
【0123】

或いは、式 I の化合物（式中、Q は上記の式 I において定義されているとおりである）は、式 XVI の化合物（式中、Q は上記の式 I において定義されているとおりであり、及び、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）の環化反応により調製可能である（スキーム 8）。

10

スキーム 8：

【化 19】



20

【0124】

反応は、カリウム *tert*-ブトキシド、リチウムジイソプロピルアミド、水素化ナトリウム及び類似する他のものなどの塩基の存在下、及び、 $-20^\circ\text{C} \sim$ 溶剤の沸点の範囲の温度、及び、テトラヒドロフラン、ジオキサン、DMF などの不活性溶剤の存在下で実施可能である。このような反応は、*Synlett* 2006 (4): 591-594 に報告されている。式 XVI の化合物（式中、Q は上記の式 I において定義されているとおりであり、及び、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）は、式 XV の化合物（式中、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）と、式 IX の化合物（式中、Q は式 I で定義されているとおりである）とを、光延条件下で反応させることにより調製可能である。このような反応は当業者に周知であると共に、とりわけ、トリフェニルホスフィン、トリブチルホスフィン又はポリマー担持トリフェニルホスフィンなどのホスフィン試薬の存在下、及び、ジエチルアゾジカルボキシレート、ジイソプロピルアゾジカルボキシレートなどのアゾジカルボキシレート試薬の存在下、及び、 $0^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度、及びアセトニトリル、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、トルエンなどの不活性溶剤の存在下で実施可能である。このような反応は、例えば *Synthesis*, 1981 (1), 1-28 において報告されている。式 XVI の化合物（式中、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）は、式 XII の化合物（式中、R は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである）と還元剤とを反応させることにより調製可能である。反応は、還元試薬、例えば、とりわけ、水素化アルミニウムリチウム (DIBAL-H)、又は、ジボラン、ボランテトラヒドロフランなどのボランなどの金属水素化物を、 $0^\circ\text{C} \sim 150^\circ\text{C}$ の温度、及び、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどの不活性溶剤の存在下で用いることにより実施可能である。このような反応は、*Tetrahedron Letters*, 1982, 23, 2475-2478 に報告されている。

30

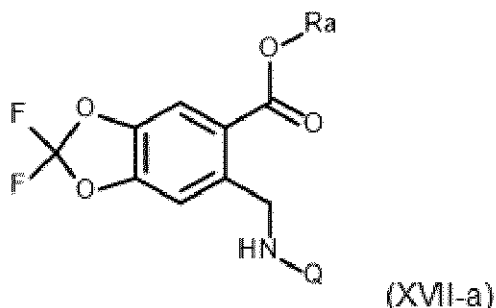
40

50

【0125】

式XVII-aの化合物

【化20】



10

(式中、

Qは上記の式Iに定義されているとおりであり、及び、 R_a は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル又はフェニルである)は新規であり、特に、本発明に係る式Iの化合物の調製のために開発され、従って、さらなる本発明の目的を表す。式Iの化合物の置換基の好ましさ及び好ましい実施形態も式XVII-aの化合物に関しても有効である。好ましくは、 R_a は水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；さらにより好ましくは、 R_a は、水素、メチル又はエチルである。

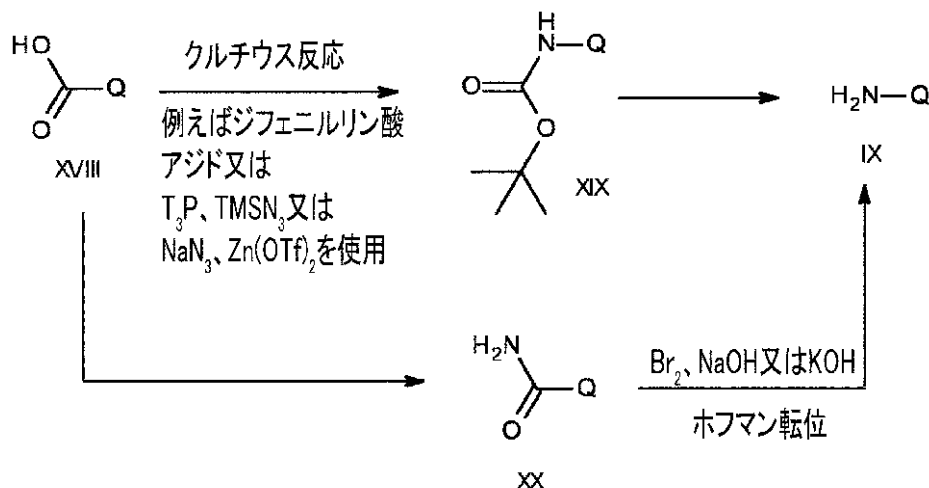
20

【0126】

式IXの化合物(式中、Qは式Iで定義されているとおりである)は、式XIXの化合物(式中、Qは式Iで定義されているとおりである)のtert-ブチル基の脱保護反応により調製され得る(スキーム9)。

スキーム9：

【化21】



30

【0127】

この反応は、トリフルオロ酢酸、塩酸又は硫酸及び他のものなどの酸触媒の存在下で実施可能である。式IXの化合物(式中、Qは式Iで定義されているとおりである)は、好適な塩基t-BuOHの存在下、及び、カップリング剤の存在下、任意に、ルイス酸の存在下、及び、不活性溶剤の存在下、 $50^\circ\text{C} \sim$ 溶剤の沸点の温度における、式XVII-aの化合物(式中、Qは式Iで定義されているとおりである)と、有機アジドとの反応により調製され得る。この反応は、 T_3P などのカップリング剤の存在下で、又は、 SOCl_2 、若しくは、塩化オキサリル、若しくは、式Xの化合物の式Xaの化合物への転換に係るスキーム6に記載されている他のカップリング剤によるカルボン酸の活性化を介して実施可能である。有機アジドの例としては、 TMSN_3 、アジ化ナトリウム又はトシルアジドが挙げられ、及び、好適な溶剤はトルエン、キシレン、THF又はアセトニトリルであり

50

得る。好適なルイス酸の例としては、とりわけ、 $Zn(OTf)_2$ 、 $Sc(OTf)_2$ 、又は $Cu(OTf)_2$ が挙げられ得る。式XIXの化合物はまた、式XVIIIIの化合物と、ジフェニルホスホリルアジドとを、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及び類似する他のものなどの有機塩基の存在下、並びに、tert-ブタノールの存在下、及び、例えば、とりわけ、ジクロロメタン、ジクロロエタン、又は、テトラヒドロフランなどの環式エーテルなどのハロゲン化溶剤といった不活性溶剤中、及び、50℃～溶剤の沸点の範囲の温度で反応させることにより調製可能である。カルボン酸をアミンに変換するこのような反応は、クルチウス反応の名称で当業者に周知であり、Org. Lett., 2005, 7, 4107-4110; Journal of Medicinal Chemistry, 49(12), 3614-3627; 2006, J. Am. Chem. Soc., 1972, 94(17), pp 6203-6205において報告されている。式IXの化合物（式中、Qは式Iで定義されているとおりである）はまた、式XXの化合物（式中、Qは式Iで定義されているとおりである）から、ホフマン転位反応により調製され得る。この反応は、例えば水性水酸化ナトリウム若しくは水酸化カリウムなどの金属水酸化物、又は、DBU（1, 8-ジアザビシクロ（5.4.0）ウンデセー７－エン）などの有機塩基といった塩基の存在下、及び、塩素、臭素又はN-ブロモ-ハロスクシンイミドなどの求電子性ハロゲン化試薬の存在下、及び、20℃～溶剤の沸点の範囲の温度で実施可能である。このような反応は、ホフマン転位の名称で公知であると共に、例えばChem. Ber. 1881, 14, 2725といった文献において報告されている。式XXの化合物（式中、Qは式Iで定義されているとおりである）は、スキーム4に記載されているカルボン酸活性化剤の存在下における、式XVIIIIの化合物と、例えば NH_4OH 、 NH_3 といったアンモニア、又は、他のアンモニア代替物との反応により調製可能である。

10

20

【0128】

式XVIIIIの化合物（式中、QはQaであり、ここで、 R_3 、 R_4 、X及び R_1 は式Iに定義されているとおりである）のサブグループは、式XVIIII-aの化合物（スキーム8）として定義可能である。このような式XVIIII-aの化合物は、文献において公知であるか、又は、これらは、例えば国際公開第2017/061497号及び国際公開第2018/052136号に記載されているものと同様の方法及び条件を用いて、スキーム8に従って調製可能である。

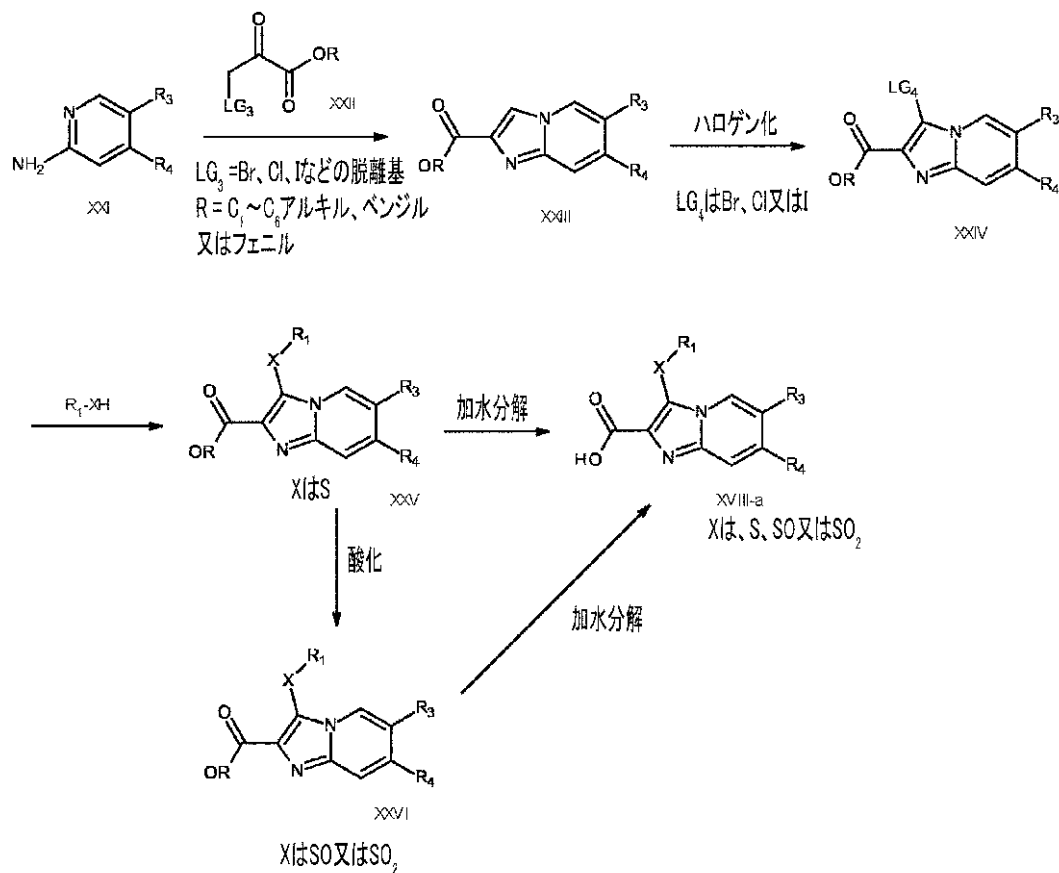
30

スキーム8：

40

50

【化 2 2】



10

20

【0129】

式XVIIIIの化合物（式中、QはQbであり、ここで、R₅、R₆、X及びR₁は式Iに定義されているとおりである）のサブグループは、式XVIIII-bの化合物（スキーム9a）と定義可能である。このような式XVIIII-bの化合物は、文献において公知であるか、又は、これらは、例えば、国際公開第2019162174A1号に記載されているものと同様の方法及び条件を用いて、スキーム9aに従って調製可能である。

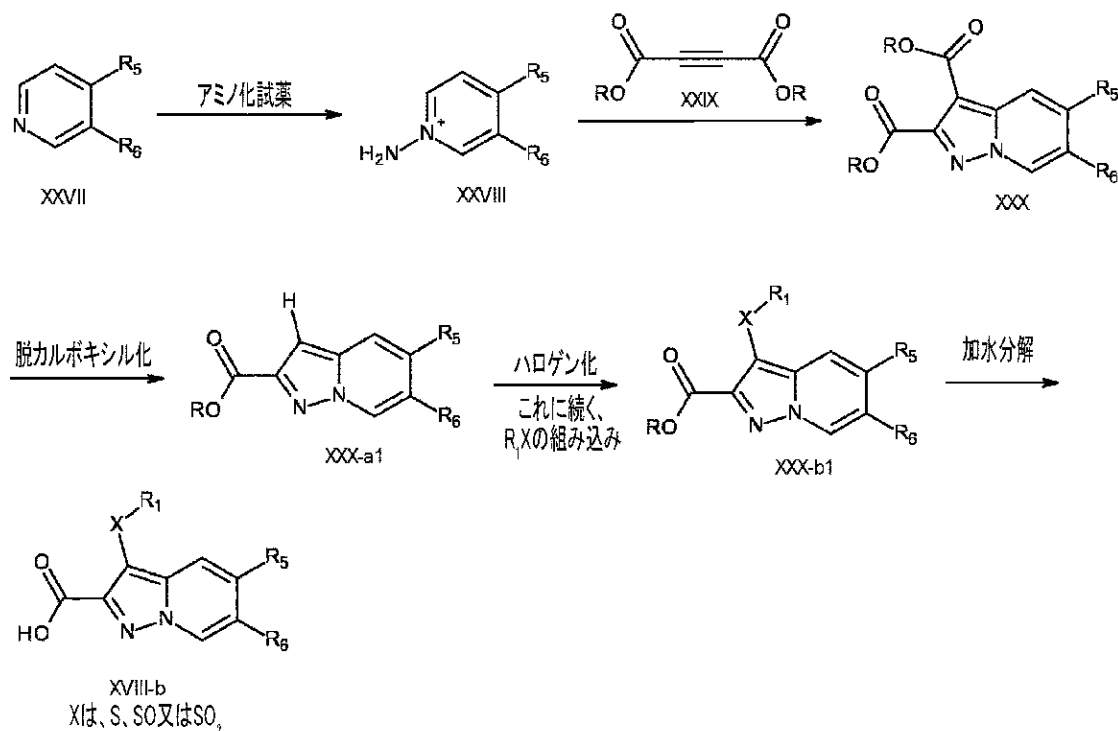
スキーム9a：

30

40

50

【化 2 3】



10

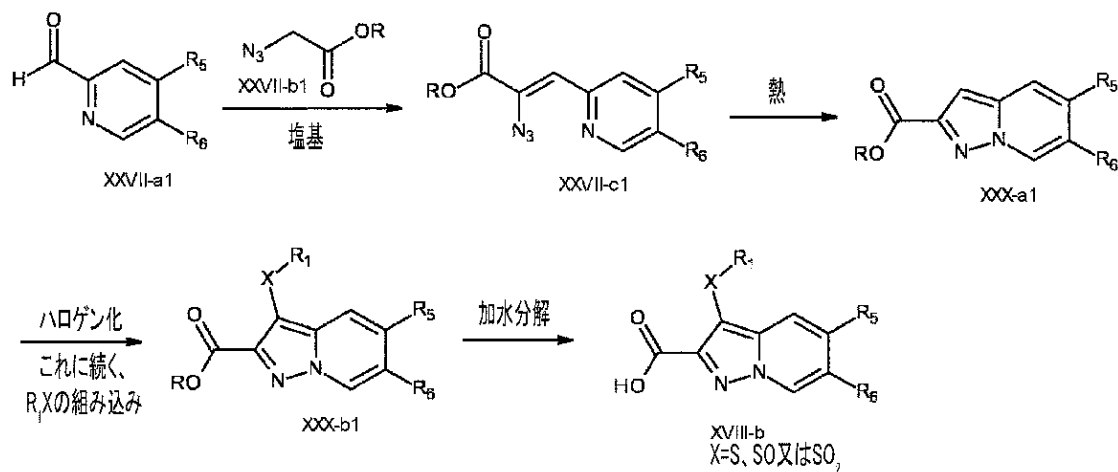
20

【0130】

或いは、式XVII-bの化合物（式中、R₁、X、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりである）は、例えば国際公開第2009095253A1号といった文献に記載されているものと同様の方法及び条件を用いてスキーム9bに従うことにより調製可能である。

スキーム9b：

【化 2 4】



30

40

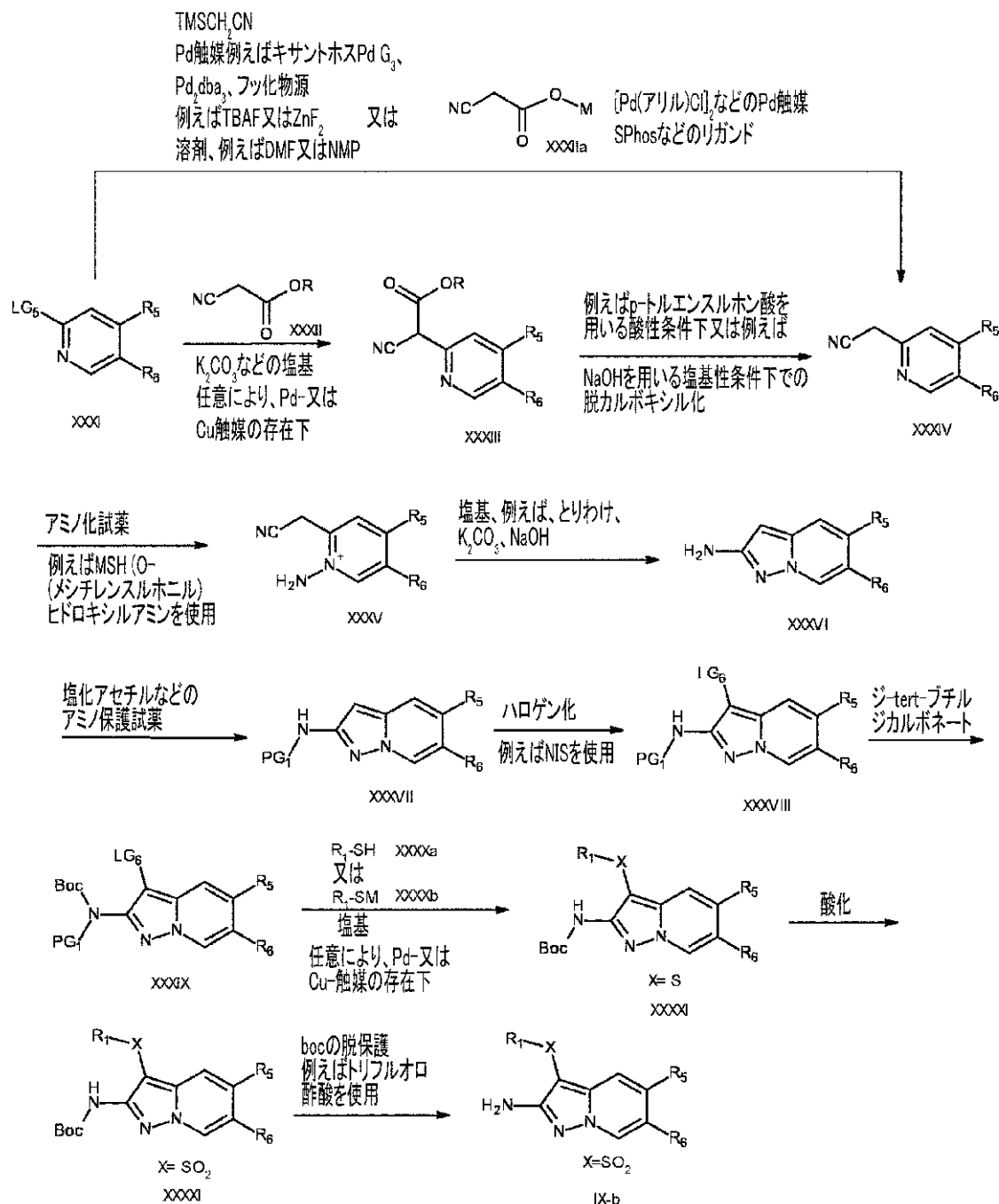
【0131】

式IXの化合物（式中、QはQbであり、ここで、R₅、R₆及びR₁は式Iに定義されているとおりであり、及び、XはSO₂である）のサブグループは、式IX-bの化合物（式中、R₁、R₅及びR₆は式Iに定義されているとおりであり、並びに、XはSO₂である）（スキーム9c）として定義可能である。このような式IX-bの化合物（式中、R₁、R₅及びR₆は式Iに定義されているとおりであり、並びに、XはSO₂である）は、スキーム9cに従って調製可能である。

スキーム9c：

50

【化 2 5】



10

20

30

40

50

【0132】

スキーム 9 c において、式 IX-b の化合物（式中、 R_5 、 R_6 及び R_1 は式 I に定義されているとおりであり、並びに、 X は SO_2 である）は、式 XXXXI の化合物（式中、 R_5 、 R_6 及び R_1 は式 I に定義されているとおりであり、並びに、 X は SO_2 である）から、tert-ブトキシカルボニル基の脱保護を介して調製可能である。このような反応は、他の酸触媒、とりわけ、トリフルオロ酢酸、塩酸などの酸触媒の存在下、及び、任意に、とりわけ、ジクロロメタン、トルエン、トリフルオロトルエンなどの溶剤の存在下で実施可能である。式 XXXXI の化合物（式中、 R_5 、 R_6 及び R_1 は式 I に定義されているとおりであり、並びに、 X は SO_2 である）は、スキーム 1 a に記載のものと同様の手法に従うことにより、式 XXXXI の化合物（式中、 R_5 、 R_6 及び R_1 は式 I に定義されているとおりであり、並びに、 X は S である）の酸化を介して調製可能である。式 XXXXI の化合物（式中、 R_5 、 R_6 及び R_1 は式 I に定義されているとおりであり、並びに、 X は S である）は、任意に、例えば炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムといったアルカリ金

属炭酸塩、又は、水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、又は、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物、又は、ナトリウム若しくはカリウム *tert*-ブトキシドなどの好適な塩基の存在下、不活性溶剤中、好ましくは 25 ~ 120 °C の温度における、

式 $XXXXa$ の試薬

$R_1-SH (XXXXa)$

又はその塩（式中、 R_1 は式 I に定義されているとおりである）による、式 $XXXXIX$ の化合物（式中、 R_5 及び R_6 は、式 I に定義されているとおりであり、 PG_1 は、例えばアセチル、ベンジル、ベンゾイルといったアミノ保護基であり、及び、 LG_6 は脱離基、好ましくは Cl 、 Br 又は I である）の置換反応又はクロスカップリング反応により調製可能である。用いられる溶剤の例としては、テトラヒドロフラン THF 、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル及び 1, 4-ジオキサンなどのエーテル、トルエン及びキシレンなどの芳香族炭化水素、アセトニトリルなどのニトリル、又は、 N , N -ジメチルホルムアミド、 N , N -ジメチルアセタミド、 N -メチル-2-ピロリドン NMP 又はジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶剤が挙げられる。

式 $XXXXa$ の化合物の塩の例としては、以下の式の化合物

$R_1-S-M (XXXXb)$

（式中、 R_1 は上記に定義されているとおりであり、及び、 M は、例えば、ナトリウム又はカリウムである）が挙げられる。式 $XXXXa$ の化合物からの式 $XXXXb$ の化合物のこのような調製プロセスは、例えば、国際公開第 16 / 091731 号に見出すことが可能である。

【0133】

或いは、 $R_1-SH (XXXXa)$ 又は $R_1-SM (XXXXb)$ を用いる式 $XXXXIX$ の化合物から式 $XXXXIX$ の化合物を形成するこの反応は、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）などのパラジウム触媒の存在下、キサントホスなどのホスフィンリガンドの存在下、 N , N -ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下、及び、例えばキシレンといった不活性溶剤の存在下、100 ~ 160 °C、好ましくは 140 °C の温度で、*Tetrahedron* 2005, 61, 5253-5259 に記載されているとおり実施可能である。式 $XXXXIX$ の化合物への式 $XXXXIX$ の化合物の転換の最中、アミノ保護基 PG_1 は、上記の反応条件下で開裂されるか、又は、その後に、当業者に周知である好適な試薬を用いて開裂可能であり、例えばアセチル保護基は、他の塩基、とりわけ、 $NaOH$ 、 KOH 、 Cs_2CO_3 、 K_2CO_3 を用いる塩基性条件下で開裂可能である。

【0134】

式 $XXXXIX$ の化合物（式中、 R_5 及び R_6 は、式 I に定義されているとおりであり、 PG_1 は、例えばアセチル、ベンジル、ベンゾイルといったアミノ保護基であり、並びに、 LG_6 は脱離基、好ましくは Cl 、 Br 又は I である）は、任意に、とりわけ、トリエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン塩基の存在下、及び、とりわけ、ジクロロメタン、アセトニトリル、トルエン、テトラヒドロフランなどの溶剤の存在下における、式 $XXXXVII$ の化合物（式中、 R_5 及び R_6 は、式 I に定義されているとおりであり、 PG_1 は、例えばアセチル、ベンジル、ベンゾイルといったアミノ保護基であり、並びに、 LG_6 は脱離基、好ましくは Cl 、 Br 又は I である）及び *tert*-ブチルデカルボネート（*tert-butyl decarbonate*）の反応により調製可能である。式 $XXXXVII$ の化合物（式中、 R_5 及び R_6 は、式 I に定義されているとおりであり、 PG_1 は、例えばアセチル、ベンジル、ベンゾイルといったアミノ保護基であり、並びに、 LG_6 は脱離基、好ましくは Cl 、 Br 又は I である）は、式 $XXXXVII$ の化合物（式中、 R_5 及び R_6 は、式 I に定義されているとおりであり、並びに、 PG_1 は、例えばアセチル、ベンジル、ベンゾイルといったアミノ保護基である）と、とりわけ、 N -クロロスクシンイミド、 N -ブロモスクシンイミド、 N -ヨードスクシンイミドなどの好適なハロゲン化試薬とを、とりわけ、ジクロロメタン、アセトニトリル、テトラヒ

10

20

30

40

50

ドロフラン、DMFなどの溶剤の存在下において反応させることにより調製可能である。このような反応は当業者に周知である。式XXXVIIの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりであり、並びに、PG₁は、例えばアセチル、ベンジル、ベンゾイルといったアミノ保護基である）は、式XXXVの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりである）と、好適なアミノ保護基試薬とを、例えば、ピリジンの存在下で塩化アセチルを用いて反応させることにより調製可能である。

【0135】

式XXXVの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりである）は、式XXXIVの化合物と、とりわけ、ヒドロキシルアミン-オースルホン酸、O-（メシチルスルホニル）ヒドロキシルアミンなどのアミノ化試薬との、式XXXVの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりである）を形成するN-アミノ化反応、これに続く、とりわけ、水素化ナトリウム、KOH、NaOH、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの塩基の存在下、及び、とりわけ、ジクロロメタン、ジクロロエタン、メタノール、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドなどの溶剤の存在下における式XXXVの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりである）の分子内環化を含む、2ステップで式XXXIVの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりである）から調製可能である。このような2ステップ反応は、例えばTetrahedron Letters（2014），55（43），5963-5966に記載されているとおり、文献に報告されている。

【0136】

式XXXIVの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりである）は、金属触媒の存在下におけるアセトニトリルアニオン均等物との反応で、式XXXIの化合物（式中、R₅及びR₆は、式Iに定義されているとおりであり、並びに、LG₅は、ハロゲン（又は、トリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）である）から調製可能である。多様なアセトニトリルアニオン均等物をこのような反応において用いることが可能である。その例は、Mitiga ef. al.（Chem. Lett. 1984，15 11）に記載されているとおり、スティル反応条件下で式（XXXI）の化合物とカップリング可能であるトリ-*n*ブチルスタンニルアセトニトリル、又は、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）、キサントホスPd G3（〔（4，5-ビス（ジフェニルホスフィノ）-9，9-ジメチルキサンテン）-2-（2'-アミノ-1，1'-ビフェニル）〕パラジウム（II）メタンスルホネート）などのパラジウム触媒、及び、例えばキサントホス又はP（*i*-Bu）₃といったリガンド、例えばZnF₂といったフッ化物源の存在下、DMFなどの双極性非プロトン性溶剤中、80～120℃の温度における、トリメチルシリルアセトニトリルである。このような反応は、文献において充分な先例がある（例えばHartwig ef. al.を参照のこと（J. Am. Chem. Soc. 2002，124，9330、及び、J. Am. Chem. Soc. 2005，127，15824）（スキーム9c）。シアノ酢酸カリウム又はシアノ酢酸ナトリウムなどの金属シアノ酢酸塩もまた、アセトニトリルアニオン均等物として使用可能であり、及び、とりわけ、〔Pd₂（dba）₃〕（トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0））、〔Pd（アリル）Cl〕₂（アリルパラジウム（II）クロリドダイマーなどのパラジウム触媒の存在下、とりわけ、SPhos、キサントホス又はP（*i*-Bu）₃又はP（tert-ブチル）₃などのリガンドの存在下でカップリング反応を生じさせる。このような反応は、文献において公知であり、例えばAngew. Chem. Int. Ed. 2011，50，4470-4474に記載されている。

【0137】

式XXXIの化合物から式XXXIVの化合物を調製するさらに他の方法を以下に示す（スキーム9c-1）。

スキーム9c-1：

10

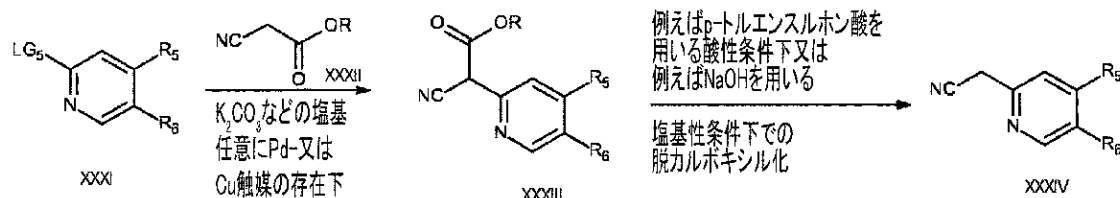
20

30

40

50

【化 2 6】



【0138】

炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又は水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド又はエトキシド、カリウム *tert*-ブトキシドなどの塩基の存在下、任意に、パラジウム（例えば $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ を含む）又は銅（例えば CuI を含む）触媒下、例えばトルエン、ジオキサン、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルアセタミド、*N*-メチル-2-ピロリドン *NM* *P* 又はジメチルスルホキシド *DMSO* などの適切な溶剤中、任意に、例えばテトラブチルアンモニウムブロミド又はトリエチルベンジル塩化アンモニウム *TEBAC* などの相間移動触媒 *PTC* の存在下、室温～180℃の温度における、式 *XXXI* の化合物（式中、*R*₅ 及び *R*₆ は、式 *I* に定義されているとおりであり、並びに、*LG*₅ は、ハロゲン（又は、トリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）である）と、式 *XXXII* の試薬（式中、*R* は *C*₁～*C*₆ アルキルである）との反応は、式 *XXXIII* の化合物（式中、*R*₅ 及び *R*₆ 上記の式 *I* に記載されているとおりであり、並びに、*R* は *C*₁～*C*₆ アルキルである）をもたらし得る。同様の化学が、例えば *Synthesis* 2010, No. 19, 3332-3338 に記載されている。

【0139】

式 *XXXIV* の化合物（式中、*R*₅ 及び *R*₆ は、上記の式 *I* に記載されているとおりである）は、当業者に公知である条件下（例えば以下のものなどの条件を使用：メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン又はジオキサン中の水性水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化リチウム、室温又は還流以下の条件；これに続く、標準的な水性酸条件下、又は、例えば、*HCl* 若しくはパラトルエンスルホン酸の存在下における酸性条件下での反応混合物の酸性化

）における、式 *XXXIII* の化合物（式中、*R*₅ 及び *R*₆ 上記の式 *I* に記載されているとおりであり、並びに、*R* は *C*₁～*C*₆ アルキルである）の鹼化／脱カルボキシル化により調製され得る。或いは、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルアセタミド、*N*-メチル-2-ピロリドン又はジメチルスルホキシド *DMSO* などの溶剤中、任意に、追加の水の存在下における、例えば塩化リチウム又は塩化ナトリウム由来の好ましくは塩素アニオンといったハロゲン化物アニオンによる式 *XXXIII* の化合物の処理でも、式 *XXXIV* の化合物を生成し得る。このような変換（クラブコ-脱アルキル化／脱カルボキシル化）に係る反応温度は、20℃～反応混合物の沸点の範囲であることが好ましく、又は、この反応は、マイクロ波の照射下で実施され得る。同様の化学が、例えば *Synthesis* 2010, No. 19, 3332-3338 に記載されている。

【0140】

或いは、式 *IX-b* の化合物（式中、*R*₅、*R*₆ 及び *R*₁ は式 *I* に定義されているとおりであり、並びに、*X* は *SO*₂ である）は、スキーム 9 d に従って調製可能である。スキーム 9 d において、式 *IX-b* の化合物（式中、*R*₅、*R*₆ 及び *R*₁ は式 *I* に定義されているとおりであり、並びに、*X* は *SO*₂ である）は、式 *XXXXIII* の化合物（式中、*R*₅ 及び *R*₆ は式 *I* に定義されているとおりである）から、式 *IX-b* の化合物への式 *XXXXVII* の化合物の転換についてスキーム 9 c において記載されているものと同様の手法に従って調製可能である。

スキーム 9 d：

10

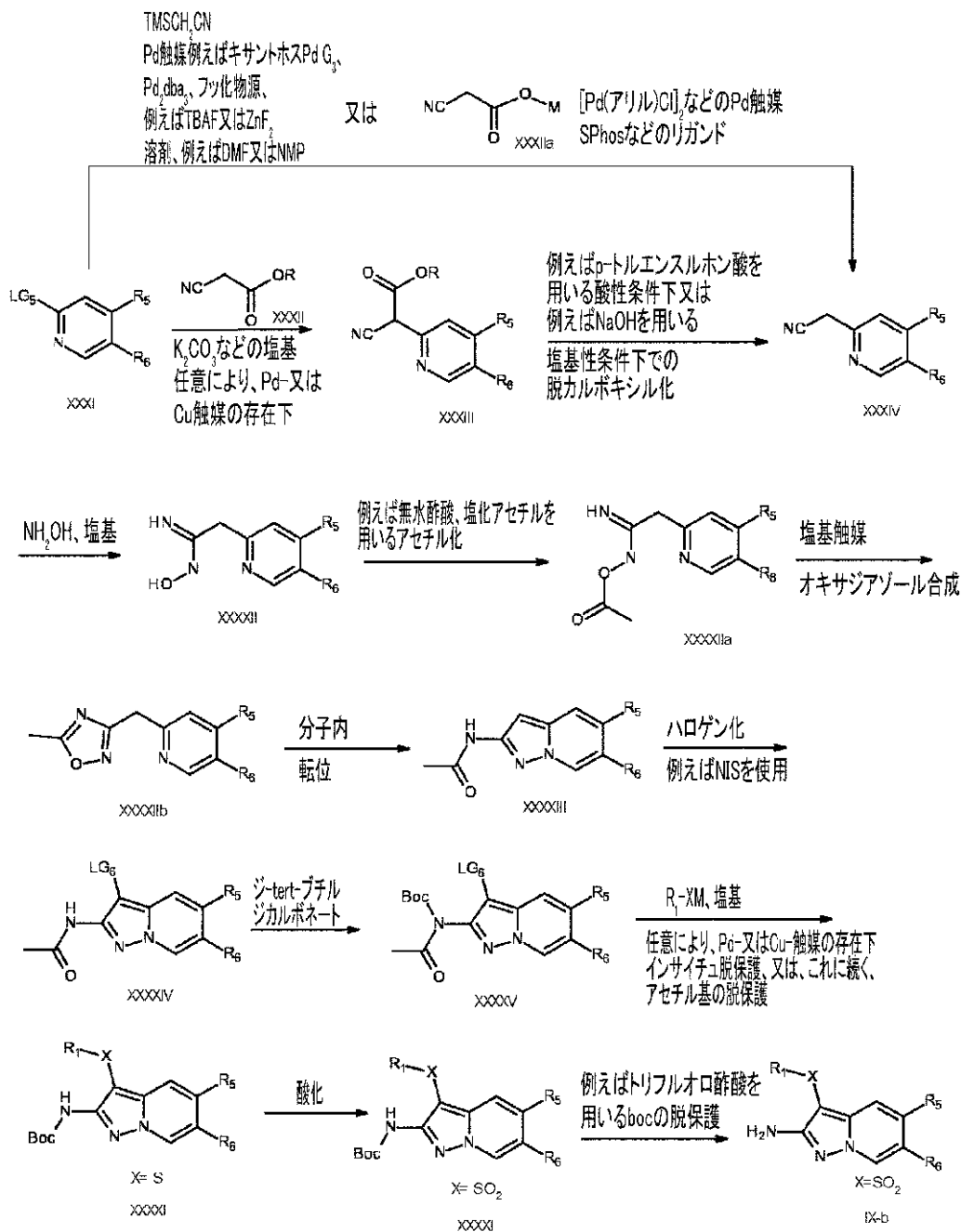
20

30

40

50

【化 2 7】



10

20

30

40

50

【0141】

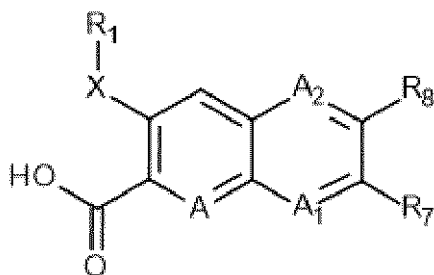
式 XXXIII の化合物（式中、 R_5 及び R_6 は式 I に定義されているとおりである）は、式 XXXIII の化合物を形成するヒドロキシルアミンとの反応、式 XXXIIIa の化合物を形成するアセチル化反応、式 XXXIIIb の化合物を形成する塩基触媒オキサジアゾール合成、及び、最後に、式 XXXIII の化合物への分子内環化／転位を含む4ステップ法を介して、式 XXXIV の化合物（式中、 R_5 及び R_6 は式 I に定義されているとおりである）から調製可能である。このような反応は、例えば国際公開第2012146657号、国際公開第2012146659号、又は、*Tetrahedron Letters*（2017），58（3），202-205に記載されている文献に報告されている。式 XXXIV の化合物は、式 XXXI の化合物からスキーム9cに記載されているとおり調製可能である。

【0142】

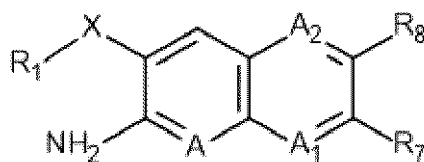
式 IX の化合物（式中、 Q は Qc であり、ここで、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A 、 A_1 及び A_2 は式 I に定義されているとおりである）のサブグループは、式 IX-c の化合物（式

中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A 、 A_1 及び A_2 は、式Ⅰに定義されているとおりである）と定義可能である。式ⅠX-cの化合物は、式XVⅠⅠⅠの化合物（式中、 Q は Q_c であり、ここで、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A 、 A_1 及び A_2 は式Ⅰに定義されているとおりである）のサブグループである式XVⅠⅠⅠ-cの化合物から、スキーム9に従って調製可能である。式XVⅠⅠⅠ-cの化合物は、文献において公知であるか、又は、これらは、例えば、国際公開第2016/142326A1号及び国際公開第2016091731A1号に記載されているものと同様の方法に従って調製可能である。

【化28】



XVIII-c



IX-c

10

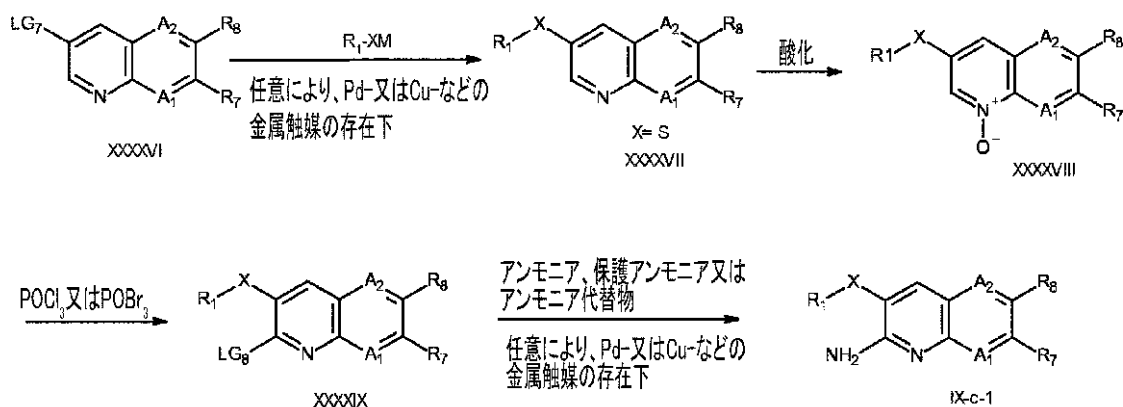
【0143】

式ⅠXの化合物（式中、 Q は Q_c であり、ここで、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式Ⅰに定義されているとおりであり、並びに、 A は N である）のサブグループは、式ⅠX-c-1の化合物（式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式Ⅰに記載されているとおりである）と定義可能である。式ⅠX-c-1の化合物は、スキーム9eに従って調製可能である。

20

スキーム9e：

【化29】



30

【0144】

式ⅠX-c-1の化合物（式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式Ⅰに記載されているとおりである）は、任意に、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又はカリウムtert-ブトキシドなどの塩基の存在下、及び、任意に、金属触媒、例えばヨウ化銅（Ⅰ）、銅粉末、硫酸銅といった銅触媒の存在下、及び、任意に、例えばジアミンリガンド（例えば N, N' -ジメチルエチレンジアミン又はトランス-シクロヘキシルジアミン）若しくはジベンジリデンアセトン（dba）若しくは1,10-フェナントロリンといったリガンドの存在下、30～180℃の温度、任意にマイクロ波の照射下、密閉条件、又は、例えば酢酸パラジウム（Ⅱ）、ビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウム（0）（Pd(dba)₂）若しくはトリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）（Pd₂(dba)₃、任意にクロロホルム付加物の形態）、若しくは、例え

40

50

ば $t\text{-}Bu\text{BrettPhosPd}$ G3 [(2-ジ- $t\text{-}Bu$ チルホスフィノ-3, 6-ジメトキシ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル) - 2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム(II)メタンスルホネート若しくは $BrettPhosPd$ G3 [(2-ジ-シクロヘキシルホスフィノ-3, 6-ジメトキシ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル) - 2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム(II)メタンスルホネートといったパラジウムプレ触媒といったパラジウム触媒、及び、任意に、例えば $SPhos$ 、 $t\text{-}BuBrettPhos$ 又はキサントホスといったリガンドの存在下、60~120℃の温度、任意にマイクロ波の照射下において、式 $XXXXIX$ の化合物(式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式 I に記載されているとおりであり、及び、ここで、 LG_8 は、ハロゲン、好ましくは、ブromo又はクロロである)と、アンモニア、水性アンモニア又はアンモニア代替物、例えば NH_4OH (又は、 $t\text{-}Bu$ チルカルバメートのような保護されたアンモニアを用い、次いで、生成物の形成後にこれを脱保護することにより)とを反応させることにより調製可能である。上記の反応は、トルエン、ジメチルホルムアミド DMF 、 N -メチルピロリジン NMP 、ジメチルスルホキシド $DMSO$ 、ジオキサン、テトラヒドロフラン THF などの溶剤の存在下を実施し得、例えば *Tetrahedron* (1987), 43 (21), 4931-46、*Organic Letters* (2013), 15 (14), 3734-3737、*Organic Letters* (2015), 17 (23), 5934-5937、及び、国際公開第2004035549A1号といった文献に記載されている。

10

20

【0145】

式 $XXXXIX$ の化合物(式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式 I に記載されているとおりであり、並びに、ここで、 LG_3 はハロゲン、好ましくは、ブromo又はクロロである)は、式 $XXXXVII$ の化合物(式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式 I に記載されているとおりである)と、 $POCl_3$ 、 $POBr_3$ 又はトリクロロアセトニトリルなどのハロゲン化試薬とを、ヘテロアリール N -オキシドをハロ官能基化誘導体に変換可能である他のハロゲン化試薬、とりわけ、トリフェニルホスフィンの存在下で反応させることにより調製可能である。このような反応は文献において周知であり、例えば *Tetrahedron Letters* (2014), 55 (51), 7130-7132、*Tetrahedron* (2005), 61 (38), 9042-9051、及び、*European Journal of Organic Chemistry* (2016), 2016 (8), 1606-1611において記載されている。式 $XXXXVII$ の化合物(式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式 I に記載されているとおりである)は、式 $XXXXVI$ の化合物(式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式 I に記載されているとおりである)と、他の酸化試薬、とりわけ、尿素- H_2O_2 、 $m\text{-}CPBA$ などの酸化試薬とを、とりわけ、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、ジクロロエタンなどの溶剤の存在下で反応させることにより調製可能である。このような反応は文献において周知であり、例えば *Organic Letters* (2018), 20 (8), 2346-2350、*Dalton Transactions* (2014), 43 (21), 8054-8061、及び、*Chemische Berichte* (1992), 125 (8), 1965-6において記載されている。式 $XXXXVI$ の化合物(式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式 I に記載されているとおりである)は、式 $XXXXV$ の化合物(式中、 R_7 、 R_8 、 X 、 R_1 、 A_1 及び A_2 は式 I に記載されているとおりであり、並びに、ここで、 LG_7 は、ハロゲン(又は、トリフレートなどの擬ハロゲン脱離基)である)から、式 $XXXXI$ の化合物への式 $XXXXIX$ の化合物の転換に係るスキーム9cに記載の手法に従って調製可能である。

30

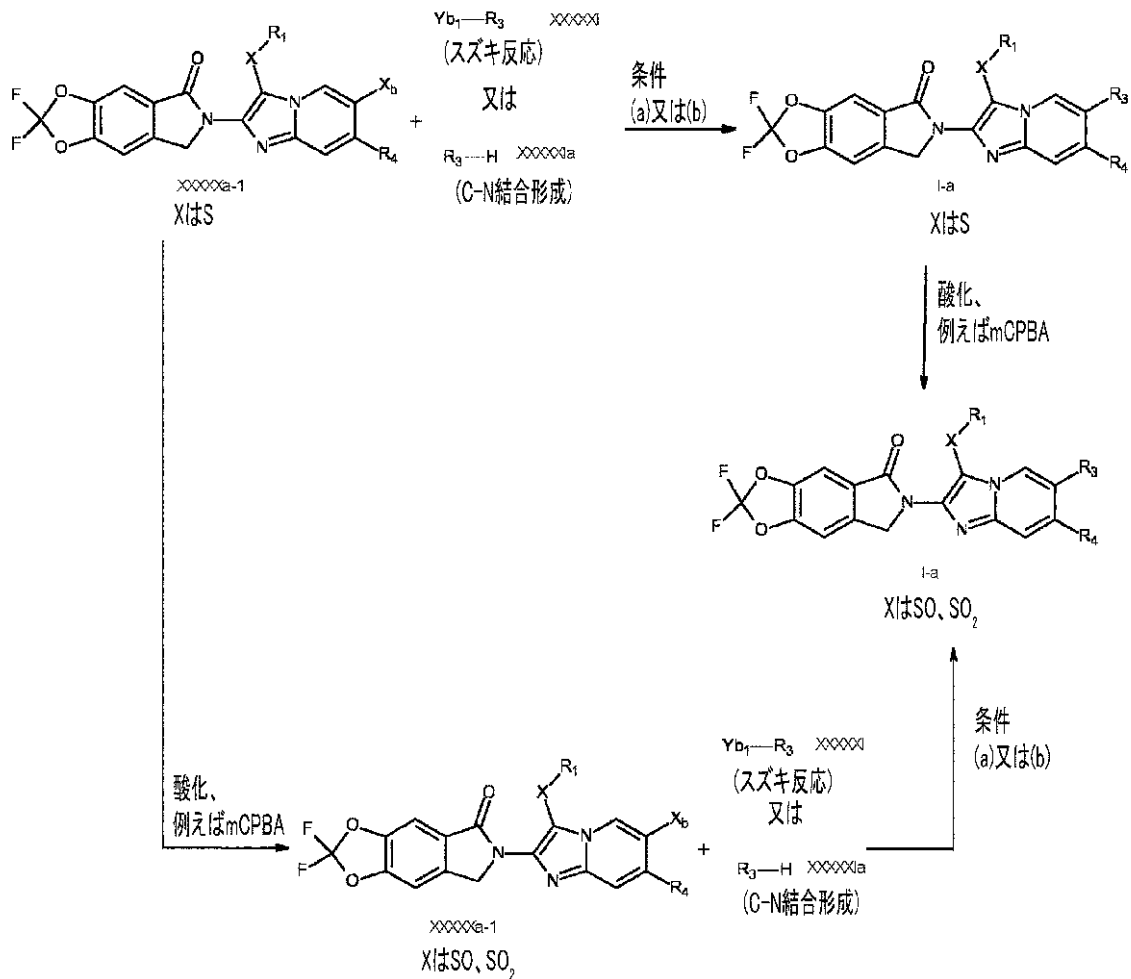
40

【0146】

式 I の化合物(式中、 Q は Qa であり、並びに、 R_1 、 X 、 R_3 及び R_4 は、上記の式 I に定義されているとおりである)は、式 I-a の化合物と定義可能である。このような式 I-a の化合物は、スキーム10に従って調製可能である。

50

スキーム 10 :
【化 30】



(a) スズキ反応: Pd 触媒 (例えば Pd(PPh₃)₄ または Pd(dppf)Cl₂)、塩基 (例えば Na₂CO₃)、溶剤 (例えば 1,2-ジメチルエタン/水)、25~180℃。

(b) C-N 結合形成: 任意の塩基 (例えば K₂CO₃ または Cs₂CO₃)、任意の銅またはパラジウム触媒の存在、任意の添加剤

(N,N'-ジメチルエチレンジアミンなど)、任意のリガンド (キザントホスなど)、溶剤 (例えば ジオキサン、ピリジン または N,N'-ジメチルホルムアミド DMF)、25~180℃。

【0147】

スキーム 10 における特定の状況において、R₃ が -N(R₉)C(=O)R₁₀ (式中、R₉ 及び R₁₀ は式 I に定義されているとおりである) である場合、式 I-a の化合物 (式中、R₁、R₃ 及び R₄ は式 I に定義されているとおりであり、並びに、X は SO または SO₂ である) は、式 XXXXX a-1 の化合物 (式中、R₁ 及び R₄ は式 I に定義されているとおりであり、並びに、ここで、X は SO または SO₂ であり、並びに、X_b は、例えば、塩素、臭素又はヨウ素 (好ましくは、塩素又は臭素) といった脱離基であり、又は、トリフルオロメタンスルホン酸などのアールー若しくはアルキルスルホネートである) から、HN(R₉)C(=O)R₁₀ (式中、R₉ 及び R₁₀ は式 I に定義されているとおりである) への試薬 R₃-H (XXXXXX I a) 均等物を伴う反応 (C-N 結合形成) により調製され得る。このような反応は、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウムなどの塩基の存在下、トルエン、ジメチルホルムアミド DMF、N-メチルピロリジン NMP、ジメチルスルホキシド DMSO、ジオキサン、テトラヒドロフラン THF 等などの不活性溶剤中、任意に、例えば酢酸パラジウム (II)、ビス (ジベンジリデンアセトン) パラジウム (0) (Pd(dba)₂) 若しくはトリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) (Pd₂(dba)₃、任意に、クロロホルム付加物の形態)、又は、例えば tert-BuBrettPhosPd G3 [(2-ジ-tert-ブチルホスフィ

ノ-3, 6-ジメトキシ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル)-2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II) メタンスルホネート若しくは BrettPhos Pd G3 [(2-ジーシクロヘキシルホスフィノ-3, 6-ジメトキシ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル)-2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II) メタンスルホネートなどのパラジウムプレ触媒といった触媒の存在下、及び、任意に、例えば SPhos 、 $t\text{-BuBrettPhos}$ 又はキサントホスといったリガンドの存在下、60~120℃の温度、任意にマイクロ波の照射下において行われる。

【0148】

スキーム10における特定の状況において、 R_3 が-N(R_9R_{10}) (式中、 R_9 及び R_{10} は式Iに定義されているとおりである) である場合、式I-aの化合物 (式中、 R_1 、 R_3 及び R_4 は式Iに定義されているとおりであり、並びに、 X はSO又はSO₂である) は、式XXXXXa-1の化合物 (式中、 R_1 及び R_4 は式Iに定義されているとおりであり、並びに、ここで、 X はSO又はSO₂であり、並びに、 X_b は、例えば、塩素、臭素又はヨウ素 (好ましくは、塩素又は臭素) といった脱離基であり、又は、トリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートである) から、HN(R_9R_{10}) 又はその塩 (ハロゲン化水素酸塩、好ましくは塩酸塩若しくは臭化水素酸塩、又は、トリフルオロ酢酸塩、又は、いずれかの他の均等物塩など) (式中、 R_9 及び R_{10} は式Iに定義されているとおりである) への試薬 $R_3\text{-H}$ (XXXXXIa) 均等物を伴う反応 (C-N結合形成) により調製され得る。このような反応は通例、アルコール、アミド、エステル、エーテル、ニトリル及び水などの不活性溶剤中、特に好ましくは、メタノール、エタノール、2, 2, 2-トリフルオロエタノール、プロパノール、イソプロパノール、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセタミド、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、水又はこれらの混合物中、0~150℃の温度、任意にマイクロ波の照射下、又は、オートクレーブを用いる加圧条件下、任意に、銅粉末、ヨウ化銅 (I) 若しくは硫酸銅 (任意に、水和物の形態) 又はこれらの混合物などの銅触媒の存在下、任意に、例えばジアミンリガンド (例えばN, N'-ジメチルエチレンジアミン又はトランス-シクロヘキシルジアミン) 又はジベンジリデンアセトン (dba) 又は1, 10-フェナントロリンといったリガンドの存在下、及び、任意に、リン酸カリウムなどの塩基の存在下で行われる。

【0149】

試薬HN(R_9R_{10}) 又はHN(R_9)COR₁₀ (式中、 R_9 及び R_{10} は式Iに定義されているとおりである) は、公知であるか、市販されているか、又は、当業者に公知の方法により調製され得る。

【0150】

或いは、式I-aの化合物 (式中、 R_1 、 R_3 及び R_4 は式Iに定義されているとおりであり、並びに、 X はSO若しくはSO₂である) は、例えば、式XXXXXa-1の化合物 (式中、 R_1 及び R_4 は式Iに定義されているとおりであり、並びに、ここで、 X はSO又はSO₂であり、並びに、 X_b は、例えば、塩素、臭素又はヨウ素 (好ましくは、塩素又は臭素) といった脱離基であり、又は、トリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートである) と式 (XXXXXI) の化合物 (式中、 R_3 は式Iに定義されているとおりであり、及び、 Y_{b1} は、例えばB(OH)₂又はB(OR_{b1})₂ (ここで、 R_{b1} は、C₁~C₄アルキル基であることが可能であり、又は、2つの基OR_{b1}が、ホウ素原子と一緒にあって、5員環 (例えばボロン酸ピナコールエステル) を形成していることが可能である) などのホウ素由来官能基であることが可能である) とを反応させるステップを含むスズキ反応によって調製され得る。この反応は、炭酸ナトリウム、リン酸三カリウム又はフッ化セシウムのような塩基の存在下、例えばジオキサン、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド、1, 2-ジメトキシエタンと水との混合物若しくはジオキサン/水の混合物若しくはトルエン/水の混合物といった溶剤又は溶剤混合物、好ましくは、不活性雰囲気下で、例えばテトラキス (トリフェニル-ホス

フィン)パラジウム(0)、(1, 1'ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン)ジクロロパラジウム-ジクロロメタン(1:1錯体)又はクロロ(2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル)[2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)]パラジウム(II)(XPhosパラダサイクル)といったパラジウム系触媒により触媒され得る。反応温度は、好ましくは、室温～反応混合物の沸点の範囲であることが可能であり、又は、この反応は、マイクロ波の照射下で実施され得る。このようなスズキ反応は当業者に周知であり、例えば、J. Organomet. Chem. 576, 1999, 147-168においてレビューされている。

【0151】

好適な酸化剤による、式XXXXXa-1の化合物(式中、XはSO又はSO₂である)への式XXXXXa-1の化合物(式中、R₁及びR₄は式Iに定義されているとおりであり、並びに、ここで、XはSであり、並びに、X_bは、例えば、塩素、臭素又はヨウ素(好ましくは、塩素又は臭素)といった脱離基であり、又は、トリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートである)の酸化は、スキーム1aにおいて上記に既述の条件下で達成され得る。

10

【0152】

多数の式(XXXXXI)及び(XXXXXIa)の化合物が市販されているか、又は、当業者により調製可能である。

【0153】

或いは、式Iの化合物(式中、XはSO又はSO₂である)は、ステップの順番を変更すること(すなわち、鈴木又はC-N結合形成を介したXXXXXa-1(XはSである)からI-a(XはSである)のシーケンスを実行し、これに続いて、I-a(XはSO又はSO₂である)を形成する酸化ステップを実行すること)により上記のものと同一の化学を伴って、式XXXXXa-1の化合物(式中、XはSである(スルフィド))から調製され得る。

20

【0154】

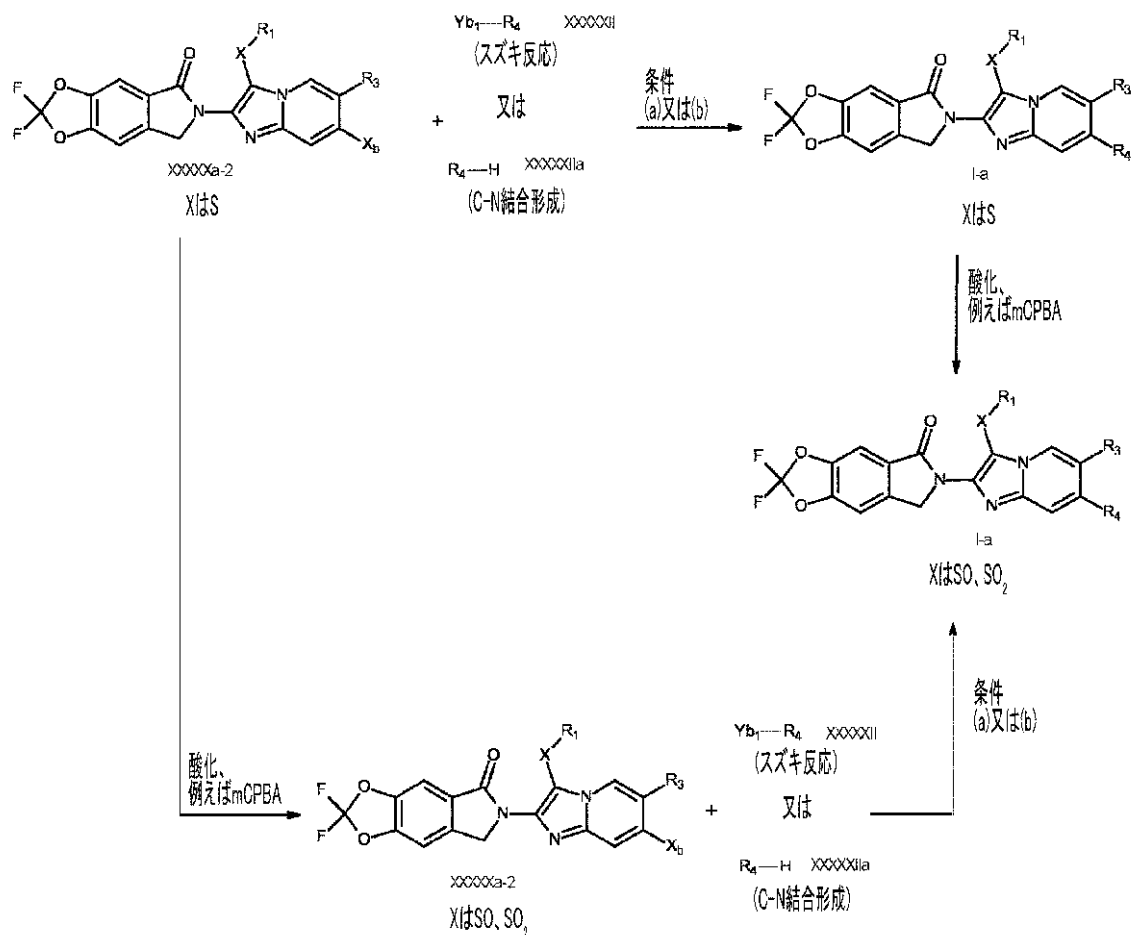
或いは、式I-aの化合物(式中、R₁、X、R₃及びR₄は、上記の式Iに定義されているとおりである)は、スキーム11に従って調製され得る。
スキーム11:

30

40

50

【化 3 1】



(a) スズキ反応: Pd触媒(例えばPd(PPh₃)₄又はPd(dppf)Cl₂)、塩基(例えばNa₂CO₃)、溶剤(例えば1,2-ジメトキシエタン/水)、25~180℃。

(b) C-N結合形成: 任意の塩基(例えばK₂CO₃又はCs₂CO₃)、任意の銅又はパラジウム触媒の存在、任意の添加剤(N,N'-ジメチルエチレンジアミンなど)、任意のリガンド(キサントホスなど)、溶剤(例えばジオキサン、ピリジン又はN,N'-ジメチルホルムアミドDMF)、25~180℃。

【0155】

式XXXXXXa-1の化合物から式I-aの化合物をもたらすスキーム10において既述の化学は、式XXXXXXa-2の化合物(式中、既述のすべての置換基の定義は有効なままである)からの式I-aの化合物の調製に係るもの(スキーム11)と同様に適用可能である。

【0156】

式Iの化合物(式中、QはQbであり、並びに、R₁、X、R₅及びR₆は、上記の式Iに定義されているとおりである)は、式I-aの化合物と定義可能である。このような式I-aの化合物は、スキーム12及び13に従って調製可能である。式I-aの化合物の調製についてスキーム10及びスキーム11に記載の化学は、スキーム12及びスキーム13における式I-aの化合物の調製と同様に適用可能である。

スキーム12:

10

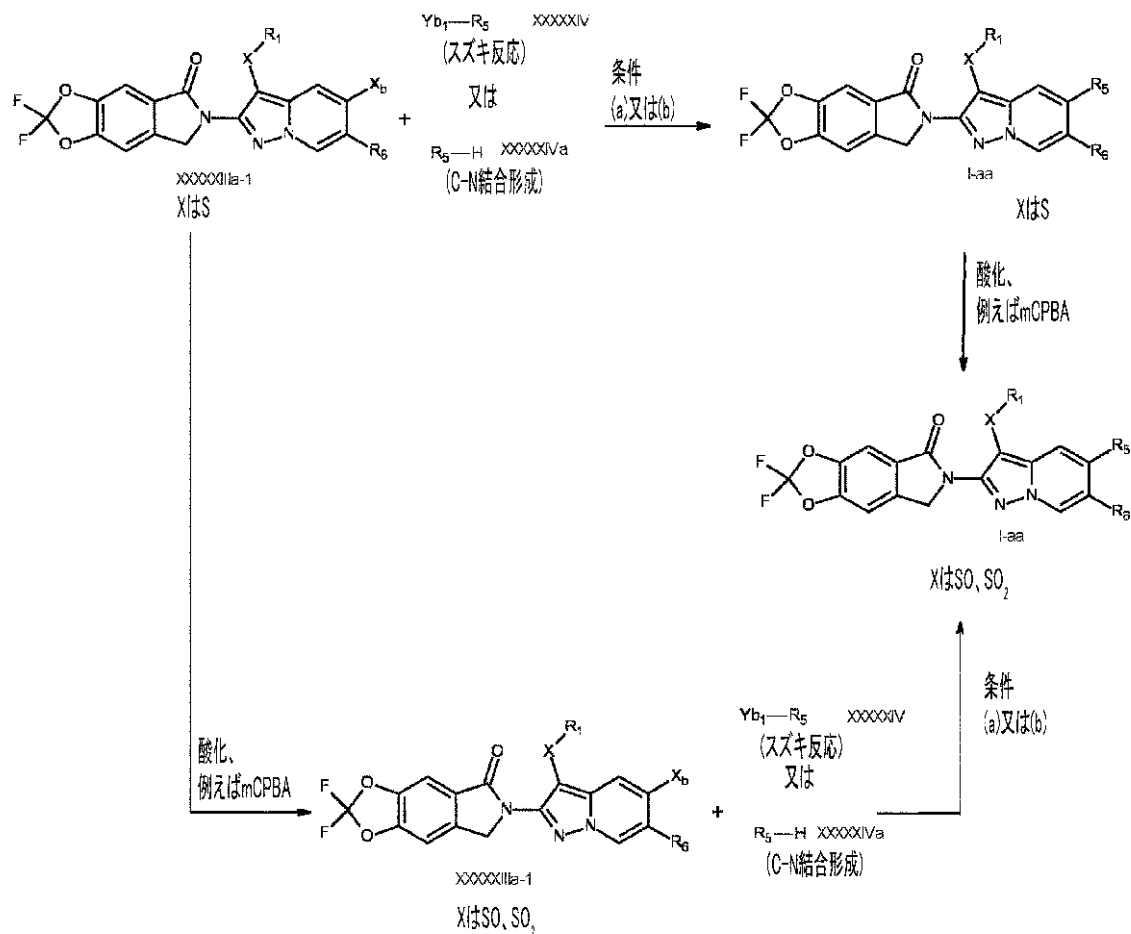
20

30

40

50

【化 3 2】



(a) Suzuki reaction: Pd catalyst (e.g., Pd(PPh₃)₄ or Pd(dppf)Cl₂), base (e.g., Na₂CO₃), solvent (e.g., 1,2-dimethoxyethane/water), 25~180°C.

(b) C-N bond formation: any base (e.g., K₂CO₃ or Cs₂CO₃), any copper or palladium catalyst, any additive (N,N'-dimethylethylenediamine, etc.), any ligand (xantphos, etc.), solvent (e.g., dioxane, pyridine or N,N'-dimethylformamide), 25~180°C.

スキーム 13：

10

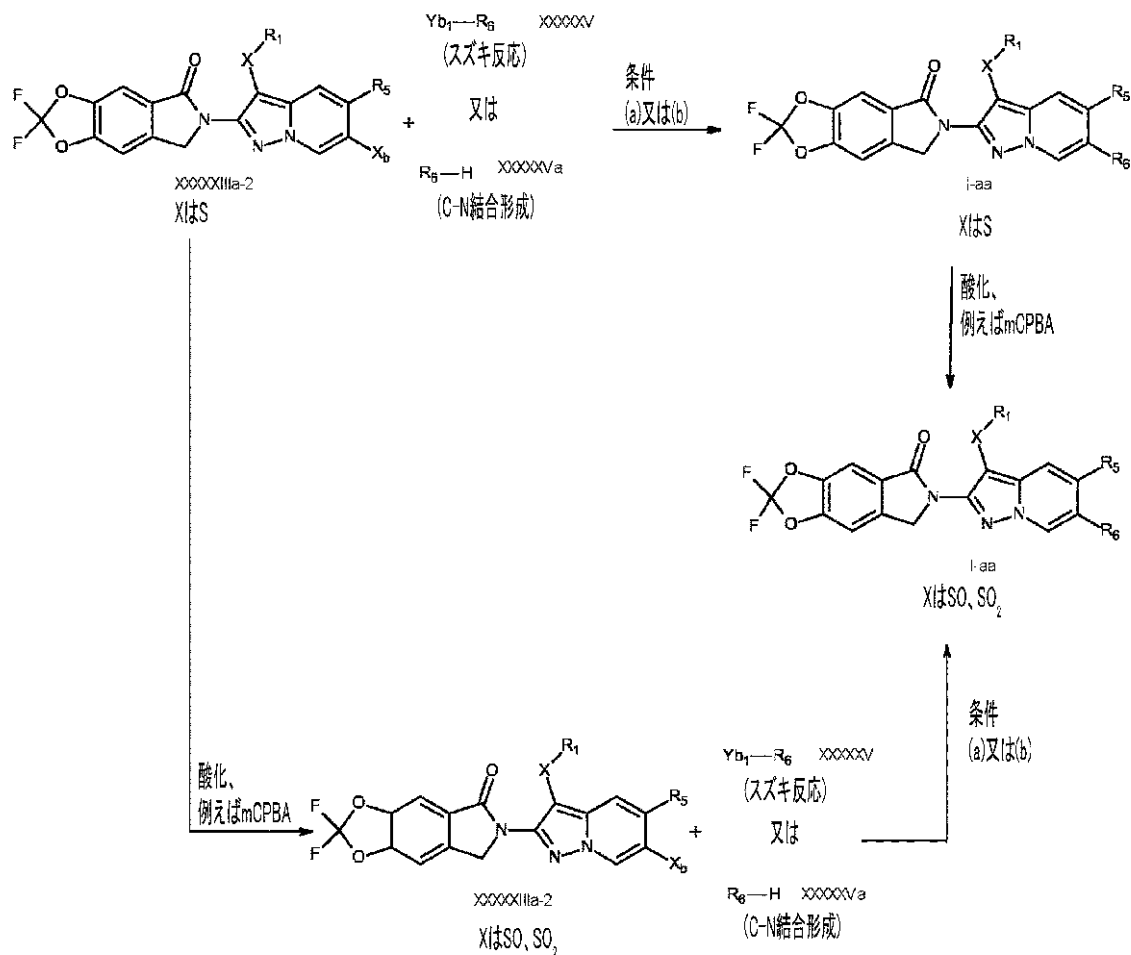
20

30

40

50

【化 3 3】



(a) スズキ反応: Pd触媒(例えばPd(PPh₃)₄)又はPd(dppf)Cl₂、塩基(例えばNa₂CO₃)、溶剤(例えば1,2-ジメトキシエタン/水)、25~180℃。

(b) C-N結合形成: 任意の塩基(例えばK₂CO₃又はCs₂CO₃)、任意の銅又はパラジウム触媒の存在、任意の添加剤(N,N'-ジメチルエチレンジアミンなど)、任意のリガンド(キサントホスなど)、溶剤(例えばジオキサン、ピリジン又はN,N-ジメチルホルムアミドDMF)、25~180℃。

【0157】

式Iの化合物(式中、QはQcであり、並びに、R₁、X、A、A₁、A₂、R₇及びR₈は、上記の式Iに定義されているとおりである)は、式I-aaaの化合物と定義可能である。このような式I-aaaの化合物は、スキーム14及び15に従って調製可能である。式I-aの化合物の調製についてスキーム10及びスキーム11に記載の化学は、スキーム14及びスキーム15における式I-aaaの化合物の調製と同様に適用可能である。

スキーム14:

10

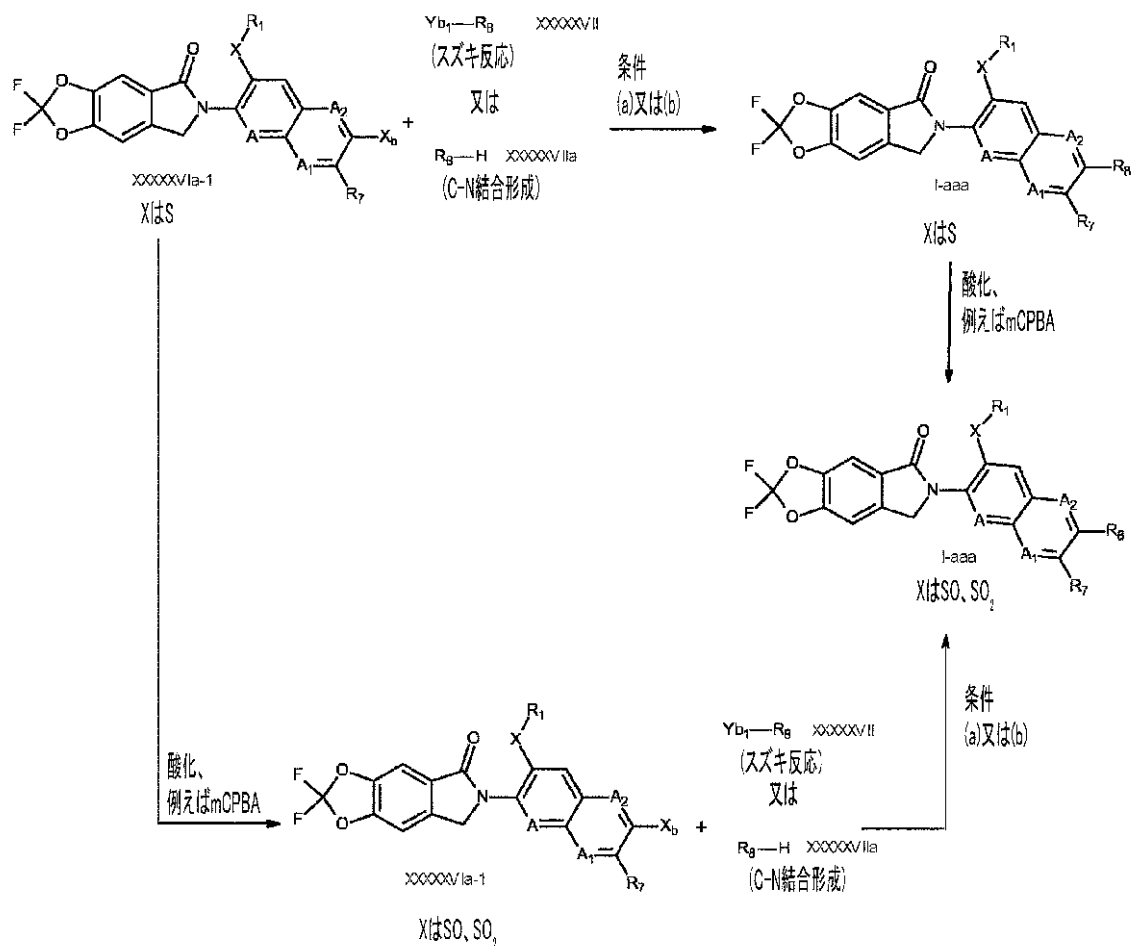
20

30

40

50

【化 3 4】



(a)スズキ反応: Pd触媒(例えばPd(PPh₃)₂又はPd(dppf)Cl₂)、塩基(例えばNa₂CO₃)、溶剤(例えば1,2-ジメトキシエタン/水)、25~180℃。

(b) C-N結合形成: 任意の塩基(例えばK₂CO₃又はCs₂CO₃)、任意の銅又はパラジウム触媒の存在、任意の添加剤(N,N'-ジメチルエチレンジアミンなど)、任意のリガンド(キサントホスなど)、溶剤(例えばジオキサン、ピリジン又はN,N-ジメチルホルムアミドDMF)、25~180℃。

スキーム 15 :

10

20

30

40

50

しながら、ほとんどの場合、不活性溶媒又は希釈剤又はこれらの混合物を加えることが有利である。反応が塩基の存在下で行われる場合、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチルモルホリン又はN,N-ジエチルアニリンなどの過剰に用いられる塩基は、溶媒又は希釈剤としても働き得る。

【0160】

反応は、約 -80°C ～約 $+140^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは約 -30°C ～約 $+100^{\circ}\text{C}$ の温度範囲、多くの場合、室温から約 $+80^{\circ}\text{C}$ の範囲で行われるのが有利である。

【0161】

従来の方法で、本発明に係る他の置換基によって式Iの出発化合物の1つ以上の置換基を置換することによって、並びに、酸化、アルキル化、還元、アシル化などの反応及び当業者に公知である他の方法による化合物の後変性によって、式Iの化合物はそれ自体公知である方法で他の式Iの化合物に転換可能である。

10

【0162】

それぞれ好適な反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば1つの反応工程において、1つの置換基を本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であるか、又は複数の置換基は、同じ反応工程において、本発明に係る他の置換基で置換され得る。

【0163】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。従って、例えば、式Iの化合物の酸付加塩は、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩は、好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

20

【0164】

式Iの化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物又は好適なイオン交換試薬による処理によって遊離化合物Iの酸付加塩に、及び例えば好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって塩基による塩に慣例的な方法で転化され得る。

【0165】

式Iの化合物の塩は、例えば、塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、従って反応混合物から沈殿する好適な溶媒中において、例えば塩酸塩などの無機酸塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、式Iの化合物の他の塩、酸付加塩、例えば他の酸付加塩にそれ自体公知の方法で転化され得る。

30

【0166】

手順又は反応条件に応じて、塩形成特性を有する式Iの化合物が、遊離形態又は塩の形態で得られる。

【0167】

式Iの化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態若しくは塩形態において、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対及び相対配置に応じて、及び／又は分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば対掌体及び／若しくはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態において、或いは鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物又はラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の1つの形態で又はこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能なすべての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記及び下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

40

【0168】

式Iの化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ混合物は、いずれの出発材料及び手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態又は塩形態において、例えば分別結晶化、蒸留及び／又はクロマトグラフィーにより、成分の物理化学的差異に基づいて純粋なジアステレオマー又はラセミ体に公知の方法で分離され得る。

【0169】

同様の方法で得られるラセミ体などの鏡像異性体混合物は、公知の方法により、例えば光学活性溶媒からの再結晶化により、キラル吸着剤におけるクロマトグラフィー、例えば

50

好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィ（HPLC）により、例えば1つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂により、又はジアステレオマー塩への転化により、例えば塩基性最終生成物ラセミ体をカルボン酸、例えばショウノウ酸、酒石酸又はリンゴ酸又はスルホン酸、例えばカンファースルホン酸などの光学活性酸と反応させ、このように得られるジアステレオマー混合物を例えば異なる溶解度に基づく分別結晶によって分離して、好適な物質、例えば塩基性物質の作用により、所望の鏡像異性体がそれから放出され得るジアステレオマーを得ることにより、光学対掌体に分解され得る。

【0170】

純粋なジアステレオマー又は鏡像異性体は、本発明に従い、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的合成の一般に知られている方法、例えば立体化学特性を有する出発材料を用いて、本発明に係る方法を行うことによって得られる。

【0171】

N-オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で式Iの化合物を好適な酸化剤、例えばH₂O₂/尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J. Med. Chem., 32(12), 2561-73, 1989又は国際公開第2000/15615号といった文献から公知である。

【0172】

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれ生物学的により有効な異性体、例えば鏡像異性体又はジアステレオマー又は異性体混合物、例えば鏡像異性体混合物又はジアステレオマー混合物を単離又は合成することが有利である。

【0173】

式Iの化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態又は塩形態において、必要に応じて水和物の形態において得ることもでき、及び/又は他の溶媒、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

【0174】

以下の表A-1～A-3、B-1～B-3、C-1～C-3、D-1～D-3、E-1～E-3及びF-1～F-3に係る式Iの化合物は、上記の方法に従って調製可能である。以下に続く実施例は、本発明を例示すると共に、式Ia-Qa～Ib-Qcの化合物形態の好ましい式Iの化合物を示すことを意図している。

【0175】

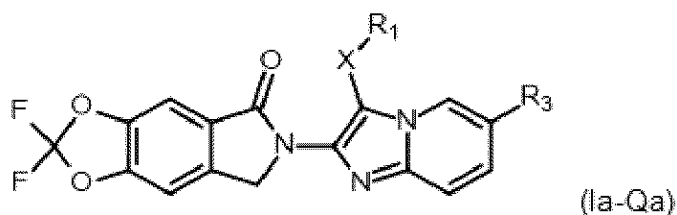
以下の表は、本発明の特定の化合物を示す。

【0176】

以下の表A-1～A-3は本発明の特定の化合物を示す。

【0177】

【化36】

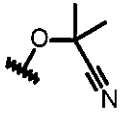


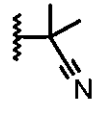
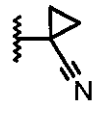
表A-1は、式Ia-Qaの14種の化合物A-1.001～A-1.014を提供するものであり、ここで、XはSであり、R₁はエチルであり、及び、R₃は表Mに定義されているとおりである。

【0178】

【表 1】

表 M: R₃の置換基定義

項目	R ₃
1	H
2	CF ₂ CH ₃
3	CF ₃
4	OCHF ₂
5	-N(CH ₃)COCH ₃
6	-NHCOCH ₃
7	-OCH ₂ CHF ₂
8	-OCH ₂ CF ₃
9	

項目	R ₃
10	
11	
12	
13	OCF ₃
14	CHF ₂

10

20

【0179】

表A-2は、式Ia-Qaの14種の化合物A-2.001~A-2.014を提供するものであり、ここで、XはSOであり、R₁はエチルであり、及び、R₃は表Mに定義されているとおりである。

【0180】

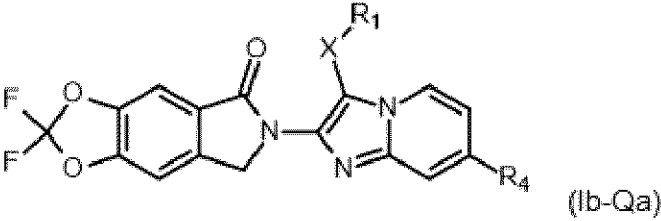
表A-3は、式Ia-Qaの14種の化合物A-3.001~A-3.014を提供するものであり、ここで、XはSO₂であり、R₁はエチルであり、及び、R₃は表Mに定義されているとおりである。

【0181】

以下の表B-1~B-3は、本発明のさらなる特定の化合物を示す。

【0182】

【化37】



30

40

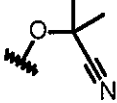
表B-1は、式Ib-Qaの14種の化合物B-1.001~B-1.014を提供するものであり、ここで、XはSであり、R₁はエチルであり、及び、R₄は表Nに定義されているとおりである。

【0183】

50

【表 2】

表 N: R₄の置換基定義

項目	R ₄	項目	R ₄
1	H	10	
2	CF ₂ CH ₃	11	
3	CF ₃	12	
4	OCHF ₂	13	OCF ₃
5	-N(CH ₃)COCH ₃	14	CHF ₂
6	-NHCOCH ₃		
7	-OCH ₂ CHF ₂		
8	-OCH ₂ CF ₃		
9			

【0184】

表B-2は、式Ib-Qaの14種の化合物B-2.001~B-2.014を提供するものであり、ここで、XはSOであり、R₁はエチルであり、及び、R₄は表Nに定義されているとおりである。

【0185】

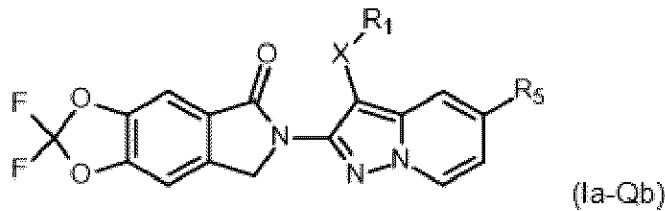
表B-3は、式Ib-Qaの14種の化合物B-3.001~B-3.014を提供するものであり、ここで、XはSO₂であり、R₁はエチルであり、及び、R₄は表Nに定義されているとおりである。

【0186】

以下の表C-1~C-3は、本発明のさらなる特定の化合物を示す。

【0187】

【化38】



表C-1は、式Ia-Qbの14種の化合物C-1.001~C-1.014を提供するものであり、ここで、XはSであり、R₁はエチルであり、及び、R₅は表Oに定義されているとおりである。

【0188】

10

20

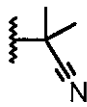
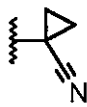
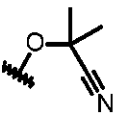
30

40

50

【表 3】

表 O: R₅の置換基定義

項目	R ₅	項目	R ₅
1	H	11	
2	CF ₂ CH ₃	12	
3	CF ₃	13	OCF ₃
4	OCHF ₂	14	CHF ₂
5	-N(CH ₃)COCH ₃	15	F
6	-NHCOCH ₃	16	Cl
7	-OCH ₂ CHF ₂	17	Br
8	-OCH ₂ CF ₃	18	I
9			
10			

【0189】

表C-2は、式Ia-Qbの18種の化合物C-2. 001~C-2. 018を提供するものであり、ここで、XはSOであり、R₁はエチルであり、及び、R₅は表Oに定義されているとおりである。

【0190】

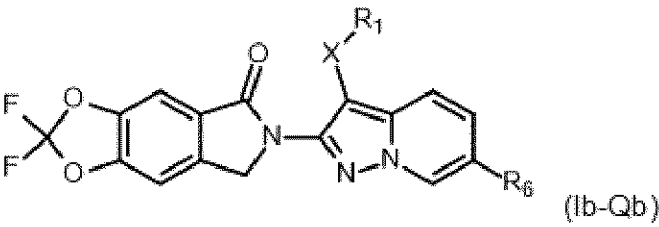
表C-3は、式Ia-Qbの18種の化合物C-3. 001~C-3. 018を提供するものであり、ここで、XはSO₂であり、R₁はエチルであり、及び、R₅は表Oに定義されているとおりである。

【0191】

以下の表D-1~D-3は、本発明のさらなる特定の化合物を示す。

【0192】

【化39】

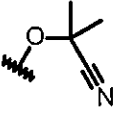


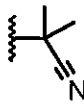
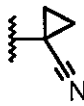
表D-1は、式Ib-Qbの14種の化合物D-1. 001~D-1. 014を提供するものであり、ここで、XはSであり、R₁はエチルであり、及び、R₆は表P1に定義されているとおりである。

【0193】

【表 4】

表 P1: R₆ の置換基定義

項目	R ₆
1	H
2	CF ₂ CH ₃
3	CF ₃
4	OCHF ₂
5	-N(CH ₃)COCH ₃
6	-NHCOCH ₃
7	-OCH ₂ CHF ₂
8	-OCH ₂ CF ₃
9	
10	

項目	R ₆
11	
12	
13	OCF ₃
14	CHF ₂
15	F
16	Cl
17	Br
18	I

10

20

【0194】

表 D-2 は、式 I b-Q b の 18 種の化合物 D-2. 001~D-2. 018 を提供するものであり、ここで、X は SO であり、R₁ はエチルであり、及び、R₆ は表 P 1 に定義されているとおりである。

【0195】

表 D-3 は、式 I b-Q b の 18 種の化合物 D-3. 001~D-3. 018 を提供するものであり、ここで、X は SO₂ であり、R₁ はエチルであり、及び、R₆ は表 P 1 に定義されているとおりである。

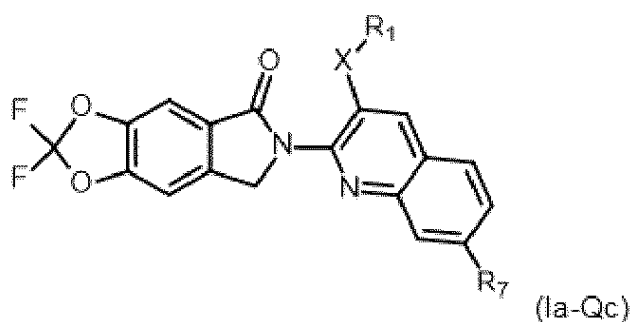
30

【0196】

以下の表 E-1~E-3 は、本発明のさらなる特定の化合物を示す。

【0197】

【化 40】



40

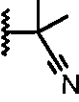
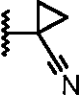
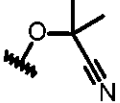
表 E-1 は、式 I a-Q c の 14 種の化合物 E-1. 001~E-1. 014 を提供するものであり、ここで、X は S であり、R₁ はエチルであり、及び、R₇ は表 Q に定義されているとおりである。

【0198】

50

【表 5】

表 Q: R₇ の置換基定義

項目	R ₇	項目	R ₇
1	H	10	
2	CF ₂ CH ₃	11	
3	CF ₃	12	
4	OCHF ₂	13	OCF ₃
5	-N(CH ₃)COCH ₃	14	CHF ₂
6	-NHCOCH ₃		
7	-OCH ₂ CHF ₂		
8	-OCH ₂ CF ₃		
9			

【0199】

表 E-2 は、式 I a-Q c の 14 種の化合物 E-2.001~E-2.014 を提供するものであり、ここで、X は SO であり、R₁ はエチルであり、及び、R₇ は表 Q に定義されているとおりである。

【0200】

表 E-3 は、式 I a-Q c の 14 種の化合物 E-3.001~E-3.014 を提供するものであり、ここで、X は SO₂ であり、R₁ はエチルであり、及び、R₇ は表 Q に定義されているとおりである。

【0201】

以下の表 F-1~F-3 は、本発明のさらなる特定の化合物を示す。

【0202】

【化 41】

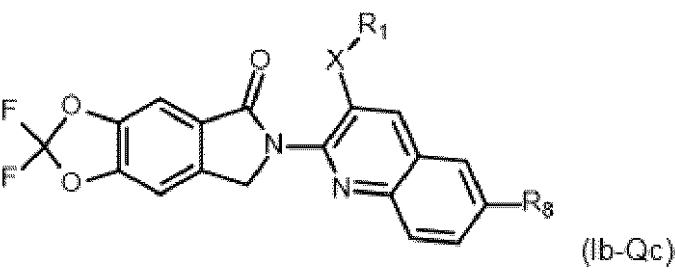


表 F-1 は、式 I b-Q c の 14 種の化合物 F-1.001~F-1.014 を提供するものであり、ここで、X は S であり、R₁ はエチルであり、及び、R₈ は表 R に定義されているとおりである。

【0203】

10

20

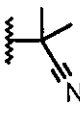
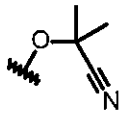
30

40

50

【表 6】

表 R: R₈ の置換基定義

項目	R ₈	項目	R ₈
1	H	10	
2	CF ₂ CH ₃	11	
3	CF ₃	12	
4	OCHF ₂	13	OCF ₃
5	-N(CH ₃)COCH ₃	14	CHF ₂
6	-NHCOCH ₃		
7	-OCH ₂ CHF ₂		
8	-OCH ₂ CF ₃		
9			

【0204】

表 F-2 は、式 I b-Q c の 14 種の化合物 F-2.001~F-2.014 を提供するものであり、ここで、X は SO であり、R₁ はエチルであり、及び、R₈ は表 R に定義されているとおりである。

【0205】

表 F-3 は、式 I b-Q c の 14 種の化合物 F-3.001~F-3.014 を提供するものであり、ここで、X は SO₂ であり、R₁ はエチルであり、及び、R₈ は表 R に定義されているとおりである。

【0206】

本発明に係る式 I の化合物は、低い施用量でも有害生物防除の分野で予防的に及び／又は治療的に有益な有効成分であり、これは、非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類及び植物によって良好な耐容性を示される。本発明に係る有効成分は、昆虫又はダニ目 (Acarina) の代表例などの通常の感受性の動物有害生物だけでなく、耐性がある動物有害生物のすべて又は個々の发育段階に対しても作用する。本発明に係る有効成分の殺虫性又は殺ダニ性活性は、直接的に顕在化 (すなわち、直ぐに、又は、例えば脱皮中といった一定時間の経過後のみに生じる有害生物の殺処分) されるか、又は、間接的に顕在化 (例えば、産卵量及び／又は孵化率の低減、少なくとも 50~60% の殺処分割合 (死亡率) に相当する良好な活性) されることが可能である。

【0207】

上記の動物有害生物の例は以下のとおりである：

ダニ目 (Acarina) から、例えば、

アカリツス属 (Acalitus spp)、アカルス属 (Aculus spp)、アカリカルス属 (Acaricalus spp)、アセリア属 (Aceria spp)、アシプトコナダニ (Acarus siro)、キララマダニ属 (Amblyomma spp.)、ナガヒメダニ属 (Argas spp.)、ウシマダニ属 (Boophilus spp.)、ブレビパルパス属 (Brevipalpus spp.)、ブリオビア属 (Bryobia spp)、カリピトリメルス属 (Calipitrimerus spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (Chorioptes spp.)、ワクモ (Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス属 (Dermatop

hagoiides spp)、エオテトラニカス属 (Eotetranychus spp)、エリオフィエス属 (Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属 (Hemitarsonemus spp)、イボマダニ属 (Hyalomma spp.)、タネガタマダニ属 (Ixodes spp.)、オリゴニクス属 (Olygonychus spp)、カズキダニ属 (Ornithodoros spp.)、ポリファゴタルソネ・ラタス (Polyphagotarsonella latus)、パノニクス属 (Panonychus spp.)、ミカンサビダニ (Phyllocoptruta oleivora)、フィトネムス属 (Phytonemus spp)、ポリファゴタロソネムス属 (Polyphagotarsonemus spp)、キュウセンヒゼンダニ属 (Psoroptes spp.)、コイタマダニ属 (Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス属 (Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属 (Sarcoptes spp.)、ステネオタルソネムス属 (Steneotarsonemus spp)、ホコリダニ属 (Tarsonemus spp.) 及びテトラニクス属 (Tetranychus spp.) ;

10

シラミ目 (Anoplura) から、例えば、
ブタジラミ属 (Haematopinus spp.)、リノグナツス属 (Linognathus spp.)、ペディクルス属 (Pediculus spp.)、ペムフィグス属 (Pemphigus spp.) 及びフィロキセラ属 (Phylloxera spp.) ;

20

鞘翅目 (Coleoptera) から、例えば、
アグリオテス属 (Agriotes spp.)、アンフィマロン・マジャレ (Amphimallon majale)、セマダラコガネ (Anomala orientalis)、アントノムス属 (Anthrenus spp.)、マグソコガネ属 (Aphodius spp)、アスチラス・アトロマクラタス (Astylus atromaculatus)、アテニウス属 (Ataenius spp)、アトマリア・リネアリス (Atomaria linearis)、カエトクネマ・チビアリス (Chaetocnema tibialis)、セロトマ属 (Cerotoma spp)、コノデルス属 (Conoderus spp)、コスモポリテス属 (Cosmopolites spp.)、コチニス・ニチダ (Cotinis nitida)、クルクリオ属 (Curculio spp.)、シクロセファラ属 (Cyclocephala spp)、デルメステス属 (Dermestes spp.)、ジアブロチカ属 (Diabrotica spp.)、アブデルスツノカブトムシ (Diloboderus abderus)、エピラクナ属 (Epilachna spp.)、エレムヌス属 (Eremnus spp.)、ヘテロニクス・アラトル (Heteronychus arator)、コーヒーノミキクイムシ (Hypothenemus hampei)、ラグリア・フィロサ (Lagria villosa)、コロラドハムシ (Leptinotarsa decemlineata)、リッソルホプトルス属 (Lissorhoptrus spp.)、リオゲニス属 (Liogenys spp)、マエコラスピス属 (Maecolaspis spp)、アカビロウドコガネ (Maladera castanea)、メガセリス属 (Megascelis spp)、メリゲテス・アエネウス (Meligethes aeneus)、メロロンタ属 (Melolontha spp.)、マイオクロウス・アルマツス (Myochrous armatus)、オリカエフィルス属 (Orycaephilus spp.)、オチオリンクス属 (Otiorynchus spp.)、フィロファガ属 (Phyllophaga spp)、フリクチヌス属 (Phlyctinus spp.)、ポピリア属 (Popillia spp.)、プシリオデス属 (Psylliodes spp.)、リソマツス・アウブチリス (Rhyssomatus aubtilis)、リゾペルタ属 (Rhizophorthera spp.)、コガネムシ科 (Scarabaeidae)、シトフィルス属 (Sitophilus spp.)、シトトルガ属 (Sitotroga spp.)、ソマチカス属 (Somaticus spp)、スフェノフォラス属 (Sphenophorus spp)、ス

30

40

50

テルネクスブ・シグナツス (*Sternechus subsignatus*)、ゴミムシダマシ属 (*Tenebrio spp.*)、トリボリウム属 (*Tribolium spp.*) 及びトロゴデルマ属 (*Trogoderma spp.*) ;

双翅目 (*Diptera*) から、例えば、

ヤブカ属 (*Aedes spp.*)、ハマダラカ属 (*Anopheles spp.*)、アンテリゴナ・ソカタ (*Antherigona soccata*)、オリーブミバエ (*Bactrocea oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属 (*Bradysia spp.*)、クロバエ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス属 (*Ceratitis spp.*)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia spp.*)、イエカ属 (*Culex spp.*)、クテレブラ属 (*Cuterebra spp.*)、ダクス属 (*Dacus spp.*)、デリア属 (*Delia spp.*)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイエバエ属 (*Fannia spp.*)、ガストロフィラス属 (*Gastrophilus spp.*)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツエツエバエ属 (*Glossina spp.*)、ヒフバエ属 (*Hypoderma spp.*)、ヒッポボスカ属 (*Hyppobosca spp.*)、リリオミザ属 (*Liriomyza spp.*)、キンバエ属 (*Lucilia spp.*)、メラナグロミザ属 (*Melanagromyza spp.*)、イエバエ属 (*Musca spp.*)、ヒツジバエ属 (*Oestrus spp.*)、オルセオリア属 (*Orseolia spp.*)、キモグリバエ (*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属 (*Phorbia spp.*)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis spp.*)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella spp.*)、キノコバエ属 (*Sciara spp.*)、サシバエ属 (*Stomoxys spp.*)、アブ属 (*Tabanus spp.*)、タニア属 (*Tannia spp.*) 及びガガンボ属 (*Tipula spp.*) ;

半翅目 (*Hemiptera*) から、例えば、

アカントコリス・スカブラトル (*Acanthocoris scabrator*)、アクロステルナム属 (*Acrosternum spp.*)、ウススジカスミカメムシ (*Adelphocoris lineolatus*)、アンブリペルタ・ニチダ (*Amblypelta nitida*)、バチコエリア・タラシナ (*Bathycoelia thalassina*)、ブリサス属 (*Blissus spp.*)、トコジラミ属 (*Cimex spp.*)、クラビグララ・トメントシコリス (*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属 (*Creontiades spp.*)、ジスタンチエラ・テオブロマ (*Distantiella theobroma*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジスデルクス属 (*Dysdercus spp.*)、エデッサ属 (*Edessa spp.*)、ユーキスツス属 (*Euschistus spp.*)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、エウリガステル属 (*Eurygaster spp.*)、クサギカメムシ (*Halymorpha halys*)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリスサ属 (*Leptocorisa spp.*)、メクラカメムシ属 (*Lygus spp.*)、マルガロデス属 (*Margarodes spp.*)、ムルガンチア・ヒストリオニク (*Murgantia histrionica*)、ネオメガロトムス属 (*Neomegalotomus spp.*)、タバコカスミカメムシ (*Nesidiocoris tenuis*)、ネザラ属 (*Nezara spp.*)、ニシウス・シムランス (*Nysius simulans*)、オエバルス・インスラリス (*Oebalus insularis*)、ピエスマ属 (*Piesma spp.*)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus spp.*)、ロドニウス属 (*Rhodnius spp.*)、サーベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノフ

アラ属 (*Scotinophara* spp.)、チアンタ属 (*Thyanta* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ヴァチガ・イルデンス (*Vatiga illudens*) ;

アシルトシウム・ピスム (*Acyrthosium pisum*)、アダルゲス属 (*Adalgas* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ (*Agalliana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ (*Agonoscena targionii*)、アレウロジクス属 (*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属 (*Aleurocanthus* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロッコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ (*Aleyrodes brassicae*)、フタテンミドリヨコバイ (*Amarasca biguttula*)、アムリトズス・アトキンソニ (*Amritodus atkinsoni*)、アノニジエラ属 (*Aonidiella* spp.)、アリマキ科 (*Aphididae*)、ワタアブラムシ属 (*Aphis* spp.)、アスピジオツス属 (*Aspidiotus* spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、バクテリセラ・コッケレリ (*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属 (*Bemisia* spp.)、ブラキカウズス属 (*Brachycaudus* spp.)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属 (*Cacopsylla* spp.)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavariella aegopodii* Scop.)、セロプラスタ属 (*Ceroplaster* spp.)、クリソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*)、オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyospermi*)、シカデラ属 (*Cicadella* spp.)、シロオオヨコバイ (*Cofana spectra*)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus* spp.)、シカデュリナ属 (*Cicadulina* spp.)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ジアレウロデス属 (*Dialeurodes* spp.)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサフィス属 (*Dysaphis* spp.)、エンポアスカ属 (*Empoasca* spp.)、リンゴワタムシ (*Eriosoma larigerum*)、エリスロネウラ属 (*Erythroneura* spp.)、ガスカルジア属 (*Gascardia* spp.)、グリカスピス・ブリンブレコンベイ (*Glycaspis brimblecombei*)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudobrassicae*)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus* spp.)、ヒペロミズス・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨコバイ (*Idioscopus clypealis*)、ヤコビアスカ・リビカ (*Jacobiasca lybica*)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax* spp.)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes* spp.)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis erysimi*)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロシフム属 (*Macrosiphum* spp.)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva* spp.)、メタカルファ・プルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズス (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus* spp.)、ネオトキシプテラ属 (*Neotoxoptera* sp.)、ツマグロヨコバイ属 (*Nephotettix* spp.)、ニラパルバタ属 (*Nilaparvata* spp.)、ナシミドリオオアブラムシ (*Nippolachnus piri* Mats.)、オドナスピス・ルタエ (*Odonaspis ruthae*)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (*Oregma lanigera* Zehnter.)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrionea cock*

erelli)、パルラトリア属 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus* spp.)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella* spp.)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera* spp.)、プラノコッカス属 (*Planococcus* spp.)、シューダウラカスピス属 (*Pseudaulacaspis* spp.)、シュードコッカス属 (*Pseudococcus* spp.)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis seriatus*)、プシラ属 (*Psylla* spp.)、ブルビナリア・エチオピカ (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズピジオツス属 (*Quadraspidiotus* spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*Rhopalosiphum* spp.)、サイセチア属 (*Saissetia* spp.)、スカホイデウス属 (*Scaphoideus* spp.)、スチザフィス属 (*Schizaphis* spp.)、シトビオン属 (*Sitobion* spp.)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス (*Spissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ (*Tarophagus Proserpina*)、トキソプテラ属 (*Toxoptera* spp.)、トリアレウロデス属 (*Trialeurodes* spp.)、トリジスカス・スポロボリ (*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属 (*Trionymus* spp.)、ミカントガリキジラミ (*Trioza erytreae*)、ニセヤノネカイガラムシ (*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ (*Zygina flammigera*)、ジギニジア・スクテラリス (*Zyginidia scutellaris*) ;

膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えば、

ヒメハキリアリ属 (*Acromyrmex*)、アルゲ属 (*Arge* spp.)、ハキリアリ属 (*Atta* spp.)、セフス属 (*Cephus* spp.)、ジプリオン属 (*Diprion* spp.)、マツハバチ科 (*Diprionidae*)、シマトウヒハバチ (*Gilpinia polytoma*)、ホプロカンパ属 (*Hoplocampa* spp.)、ケアリ属 (*Lasius* spp.)、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、ネオジプリオン属 (*Neodiprion* spp.)、シュウカクアリ属 (*Pogonomyrmex* spp.)、スレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、ソレノプシス属 (*Solenopsis* spp.) 及びベスパ属 (*Vespa* spp.) ;

等翅目 (*Isoptera*) から、例えば、

コプトテルメス属 (*Coptotermes* spp.)、コルニテルネス・クムランス (*Cornitermes cumulans*)、インシシテルメス属 (*Incisitermes* spp.)、マクロテルメス属 (*Macrotermes* spp.)、マストテルメス属 (*Mastotermes* spp.)、ミクロテルメス属 (*Microtermes* spp.)、ヤマトシロアリ属 (*Reticulitermes* spp.) ; ソレノプシス・ゲミナテ (*Solenopsis geminata*)

鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えば、

アクレリス属 (*Accleris* spp.)、アドキソフィエス属 (*Adoxophyes* spp.)、アエゲリア属 (*Aegeria* spp.)、アグロティス属 (*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミロイス属 (*Amylois* spp.)、アンチカルシア・ゲマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルチップス属 (*Archips* spp.)、アルギレスチア属 (*Argyresthia* spp.)、アルギロタエニア属 (*Argyrotaenia* spp.)、アウトグラファ属 (*Autographa* spp.)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberielia*)、アフリカズイム (*Busseola fusca*)、スジマラダメイガ (

Cadra cautella)、モモシンクイガ (*Carposina nipponensis*)、チロ属 (*Chilo* spp.)、コリストネウラ属 (*Choristoneura* spp.)、クリソテウチア・トピアリア (*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマキ (*Clysia ambiguelia*)、クナファロクロシス属 (*Cnaphalocrocis* spp.)、クネファシア属 (*Cnephasia* spp.)、コチリス属 (*Cochylis* spp.)、コレオフォラ属 (*Coleophora* spp.)、コリアス・レスビア (*Colias lesbia*)、ワタアカキリバ (*Cosmophila flava*)、クラムブス属 (*Crambus* spp.)、ケブカノメイガ (*Crocidolomia binotalis*)、クリプトフレビア・ロイコトレタ (*Cryptophlebia leucotreta*)、シダリマ・ペルスペクタリス (*Cydalima perspectalis*)、シジア属 (*Cydia* spp.)、ジアファニア・ペルスペクタリス (*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属 (*Diatraea* spp.)、ジパロプシス・カスタネア (*Diparopsis castanea*)、エアリアス属 (*Earias* spp.)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属 (*Ephestia* spp.)、エピノチア属 (*Epinotia* spp.)、エスチグメネ・アクレア (*Estigmene acrea*)、エチエラ・ジンキネラ (*Etiella zinckinella*)、ユーコスマ属 (*Eucosma* spp.)、ブドウホソハマキ (*Eupoecilia ambiguelia*)、ユープロクチス属 (*Euproctis* spp.)、ユークソア属 (*Euxoa* spp.)、フェルチア・ジャクリフェリア (*Feltia jaculiferia*)、グラホリタ属 (*Grapholita* spp.)、ヘディア・ヌビフェラナ (*Hedya nubiferana*)、ヘリオthis属 (*Heliothis* spp.)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、ヘルペトグラマ属 (*Herpetogramma* spp.)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコベルシセラ (*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ (*Lasmopalpus lignosellus*)、レウコプテラ・シテラ (*Leucoptera scitella*)、リトコレチス属 (*Lithocolletis* spp.)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*)、ロキソステゲ・ビフィダリス (*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属 (*Lymantria* spp.)、リオネチア属 (*Lyonetia* spp.)、マラコソマ属 (*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ (*Manduca sexta*)、ミチムナ属 (*Mythimna* spp.)、ノクツア属 (*Noctua* spp.)、オペロフテラ属 (*Operophtera* spp.)、オルニオデス・インディカ (*Orniodes indica*)、アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属 (*Pammene* spp.)、パンデミス属 (*Pandemis* spp.)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属 (*Pieris* spp.)、コナガ (*Plutella xylostella*)、プレイス属 (*Prays* spp.)、シュードブルシア属 (*Pseudoplusia* spp.)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga* spp.)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、スパルガノチス属 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、シレプタ・デロガテ (*Sylepta derogate*)、シナンテドン属 (*Synanthedon* spp.)、タウメトポエア

属 (*Thaumetopoea* spp.)、トルトリックス属 (*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*) 及びスガ属 (*Yponomeuta* spp.) ;

食毛目 (*Mallophaga*) から、例えば、
ダマリネア属 (*Damalinea* spp.) 及びケモノハジラミ属 (*Trichodectes* spp.) ;

直翅目 (*Orthoptera*) から、例えば、
ゴキブリ属 (*Blatta* spp.)、チャバネゴキブリ属 (*Blattella* spp.)、ケラ属 (*Gryllotalpa* spp.)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属 (*Locusta* spp.)、ネオ
10 クルチラ・ヘキサダクチラ (*Neocurtilla hexadactyla*)、ワモンゴキブリ属 (*Periplaneta* spp.)、スカブテリスカス属 (*Scapt
eriscus* spp) 及びコオロギ属 (*Schistocerca* spp.) ;

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) から、例えば、
リボセリス属 (*Liposcelis* spp.) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、
ナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)、イヌノミ属 (*Ctenoceph
halides* spp.) 及びケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheo
pis*) ;

総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えば、
カリオトリプス・ファセオリ (*Calliothrips phaseoli*)、ハナア
ザミウマ属 (*Frankliniella* spp.)、ヘリオトリプス属 (*Helio
thrips* spp)、ヘルシノトリプス属 (*Hercinothrips* spp.
)、パルテノトリプス属 (*Parthenothrips* spp)、シルトトリプス・
アウランティ (*Scirtothrips aurantii*)、ダイズアザミウマ (*S
ericothrips variabilis*)、タエニオトリプス属 (*Taenio
thrips* spp.)、アザミウマ属 (*Thrips* spp) ;

シミ目 (*Thysanura*) から、例えば、セイヨウシミ (*Lepisma sac
charina*) 。

【0208】

本発明に係る有効成分は、特に植物、特に有用な植物及び農業、園芸及び森林における
観賞植物又はこのような植物の果実、花、葉、莖、塊莖又は根などの器官において発生す
る上記のタイプの有害生物を防除、すなわち抑制又は破壊するのに使用され得、場合によ
っては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままで
ある。

【0209】

好適な標的作物は、特に、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロ
コシ又はソルガムなどの穀物；テンサイ又は飼料用ビートなどのビート；果実、例えばリ
ンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ又は液果類、例えばイチゴ
、ラズベリー又はブラックベリーなどの仁果類、核果類又は柔らかい果物；インゲンマメ
、レンズマメ、エンドウマメ又はダイズなどのマメ科作物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オ
リーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオ又はアメリカホドイモ (*ground nut*)
などの油脂作物；カボチャ、キュウリ又はメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻又は
ジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ又はタンジェリンなどの
柑橘類の果物；ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、
トマト、ジャガイモ又はピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモン又はショウノウなど
のクスノキ科 (*Lauraceae*) の植物；及びさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナ
ス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物及びラテックス植物
である。

【0210】

本発明の組成物及び／又は方法は、花、灌木、闊葉樹及び常緑樹を含むいずれかの観賞用及び／又は野菜作物でも用いられ得る。

【0211】

例えば、本発明は、以下の観賞用種：アゲラタム属の種 (*Ageratum* spp.)、アロンソア属の種 (*Alonsoa* spp.)、アネモネ属の種 (*Anemone* spp.)、アニソドンテアカプセニシス (*Anisodonteacapsensis*)、アンテミス属の種 (*Anthemis* spp.)、アンチルリヌム属の種 (*Antirrhinum* spp.)、アステル属の種 (*Aster* spp.)、ベゴニア属の種 (*Begonia* spp.) (例えば、*B. エラチオール* (*B. elatio* 10
r)、*B. セムペルフロレンス* (*B. semperflorens*)、*B. チュベレウス* (*B. tubereux*))、ブーゲンビレア属の種 (*Bougainvillea* spp.)、ブラキコメ属の種 (*Brachycome* spp.)、ブラシカ属の種 (*Brassica* spp.) (観賞用)、カルセオラリア属の種 (*Calceolaria* spp.)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ニチニチソウ (*Catharanthus roseus*)、カンナ属の種 (*Canna* spp.)、ヤグルマギク属の種 (*Centaurea* spp.)、キク属の種 (*Chrysanthemum* spp.)、シネラリア属の種 (*Cineraria* spp.) (*C. マリチメ* (*C. maritime*))、コレオプシス属の種 (*Coreopsis* spp.)、クラッスラコッキネア (*Crassula coccinea*)、タバコソウ (*Cuphea ignea*)、ダリア属の種 (*Dahlia* spp.)、デルフィニウム属 20
の種 (*Delphinium* spp.)、ケマンソウ (*Dicentra spectabilis*)、ドロテアンツス属の種 (*Dorotheantus* spp.)、トルコギキョウ (*Eustoma grandiflorum*)、レンギョウ属の種 (*Forsythia* spp.)、フクシア属の種 (*Fuchsia* spp.)、ゼラニウムグナファリウム (*Geranium gnaphalium*)、ガーベラ属の種 (*Gerbera* spp.)、センニチコウ (*Gomphrena globosa*)、ヘリオトロピウム属の種 (*Heliotropium* spp.)、ヘリアンツス属の種 (*Helianthus* spp.)、ハイビスカス属の種 (*Hibiscus* spp.)、ホルテンシア属の種 (*Hortensia* spp.)、ハイドランジア属の種 (*Hydrangea* spp.)、ヒポエステスフィロスタシア (*Hypoestes phyllostachya*)、インパチエンス属の種 (*Impatiens* spp.) (アフリカハウセンカ (*I. Walleriana*))、イレシネス属の種 (*Iresine* spp.)、カランコエ属の種 (*Kalanchoe* spp.)、ランタナ (*Lantana camara*)、ハナアオイ (*Lavatera trimestris*)、カエンキセワタ (*Leonotis leonurus*)、ユリ属の種 (*Lilium* spp.)、メセンムリアンテマム属の種 (*Mesembryanthemum* spp.)、ミムラス属の種 (*Mimulus* spp.)、ヤグルマハッカ属の種 (*Monarda* spp.)、ネメシア属の種 (*Nemesia* spp.)、タゲテス属の種 (*Tagetes* spp.)、ダイアンサス属の種 (*Dianthus* spp.) (カーネーション)、カンナ属の種 (*Canna* spp.)、オキザリス属の種 (*Oxalis* spp.)、ベリス属の種 (*Bellis* spp.)、ペラルゴニウム属の種 (*Pelargonium* spp.) (アイビーゼラニウム (*P. peltatum*))、モンテンジクアオイ (*P. Zonale*)、スミレ属の種 (*Viola* spp.) (パンジー)、ペチュニア属の種 (*Petunia* spp.)、フロックス属の種 (*Phlox* spp.)、プレクトランツス属の種 (*Plecthranthus* spp.)、ポインセチア属の種 (*Poinsettia* spp.)、バルテノキス属の種 (*Parthenocissus* spp.) (アメリカヅタ (*P. quinquefolia*))、ツタ (*P. tricuspidata*)、プリムラ属の種 (*Primula* spp.)、キンボウゲ属 (*Ranunculus* spp.)、ツツジ属の種 (*Rhododendron* spp.)、バラ属の種 (*Rosa* spp.) (バラ)、ルドベ 50

キア属の種 (*Rudbeckia* spp.)、アフリカスミレ属の種 (*Saintpaulia* spp.)、サルビア属の種 (*Salvia* spp.)、スカエボラアエモラ (*Scaevola aemola*)、シザンサスウィセトネンシス (*Schizanthus wisetonensis*)、セダム属の種 (*Sedum* spp.)、ナス属の種 (*Solanum* spp.)、スルフィニア属の種 (*Surfinia* spp.)、タゲテス属の種 (*Tagetes* spp.)、ニコチニア属の種 (*Nicotinia* spp.)、バーベナ属の種 (*Verbena* spp.)、ヒャクニチソウ属の種 (*Zinnia* spp.) 及び他の花壇用植物のいずれかにおいて用いられ得る。

【0212】

例えば、本発明は、以下の野菜種：ネギ属の種 (*Allium* spp.) (ニンニク (*A. sativum*)、タマネギ (*A. cepa*)、エシャロット (*A. oschaninii*)、リーキ (*A. Porrum*)、ワケギ (*A. ascalonicum*)、ネギ (*A. fistulosum*)、チャービル (*Anthriscus cerefolium*)、セロリ (*Apium graveolus*)、アスパラガス (*Asparagus officinalis*)、ビート (*Beta vulgaris*)、ブラシカ属の種 (*Brassica* spp.) (ヤセイカンラン (*B. Oleracea*)、ハクサイ (*B. Pekinensis*)、カブ (*B. rapa*)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ヒヨコマメ (*Cicer arietinum*)、エンダイブ (*Cichorium endivia*)、チコルム属の種 (*Cichorium* spp.) (チコリー (*C. intybus*)、エンダイブ (*C. endivia*))、スイカ (*Citrillus lanatus*)、ククミス属の種 (*Cucumis* spp.) (サフラン (*C. sativus*)、メロン (*C. melo*))、ククルビタ属の種 (*Cucurbita* spp.) (ペポカボチャ (*C. pepo*)、西洋カボチャ (*C. maxima*))、シアナラ属の種 (*Cyanara* spp.) (アーティチョーク (*C. scolymus*)、カルドン (*C. cardunculus*))、ニンジン (*Daucus carota*)、フェンネル (*Foeniculum vulgare*)、オトギリソウ属の種 (*Hypericum* spp.)、レタス (*Lactuca sativa*)、トマト属の種 (*Lycopersicon* spp.) (トマト (*L. esculentum*)、トマト (*L. lycopersicum*))、ハッカ属の種 (*Mentha* spp.)、バジル (*Ocimum basilicum*)、パセリ (*Petroselinum crispum*)、インゲンマメ属の種 (*Phaseolus* spp.) (ムシトリスミレ (*P. vulgaris*)、ベニバナインゲン (*P. coccineus*))、エンドウ (*Pisum sativum*)、ダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マンネンロウ属の種 (*Rosemarinus* spp.)、サルビア属の種 (*Salvia* spp.)、キバナバラモンジン (*Scorzonera hispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleracea*)、バレイアネラ属の種 (*Valerianella* spp.) (ノヂシャ (*V. locusta*)、*V. エリオカルパ* (*V. eriocarpa*)) 及びソラマメ (*Vicia faba*) のいずれかにおいて用いられ得る。

【0213】

好ましい観賞用種としては、セントポーリア、ペゴニア、ダリア、ガーベラ、アジサイ、クマツヅラ、バラ属 (*Rosa*)、カランコエ属 (*Kalanchoe*)、ポインセチア、アスター、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、キンケイギク属 (*Coreopsis*)、ヒエンソウ属 (*Delphinium*)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda*)、フロックス属 (*Phlox*)、ルドベキア属 (*Rudbeckia*)、セダム属 (*Sedum*)、ペチュニア、ビオラ属 (*Viola*)、ホウセンカ、ゼラニウム、キク属 (*Chrysanthemum*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、フクシア、サルビア、セイヨウアジサイ、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリソウ、ミント、シシトウガラシ、トマト及びキュウリが挙げられる。

【0214】

本発明に係る有効成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る有効成分は、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜におけるもの)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおけるもの) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネにおけるもの) の防除に特に好適である。

10

【0215】

本発明に係る有効成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る有効成分は、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜におけるもの)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおけるもの) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネにおけるもの) の防除に特に好適である。

20

【0216】

さらなる態様において、本発明はまた、植物寄生性線虫 (内部寄生性一、半内部寄生性一及び外部寄生性線虫)、特に、根こぶ線虫、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) 及び他のメロイドギネ属 (*Meloidogyne*) の種；シスト形成線虫、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及び他のグロボデラ属 (*Globodera*) の種；ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*)、及び他のシストセンチュウ属 (*Heterodera*) の種；シードガル (*Seed gall*) 線虫、アングイナ属 (*Anguina*) の種；クキセンチュウ及びハガレセンチュウ、アフエレンコイデス属 (*Aphelenchoides*) の種；刺毛線虫 (*Sting nematode*)、ベロノライムスロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) 及び他のベロノライムス属 (*Belonolaimus*) の種；マツザイ線虫、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 及び他のブルサフェレンクス属 (*Bursaphelenchus*) の種；ワセンチュウ、クリコネマ (*Criconema*) 種、クリコネメラ (*Criconemella*) 種、クリコネモイデス (*Criconemoides*) 種、メソクリコネマ (*Mesocriconema*) 種；茎及び鱗茎線虫、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、クキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) 及び他のジチレンクス属 (*Ditylenchus*) の種；キリセンチュウ、ドリコドルス (*Dolichodorus*) 種；ラセンセンチュウ、ヘリオコチレンクスムルチシンクツス (*Heliocotylenchus multicinctus*) 及び他のヘリコチ

30

40

50

レンクス属 (*Helicotylenchus*) の種；サヤセンチュウ及びサヤワセンチュウ (*Sheath and sheathoid nematode*)、ヘミシクリオホラ属 (*Hemicycliophora*) 種及びヘミクリコネモイデス属 (*Hemicriconemoides*) 種；ヒルスマンニエラ属 (*Hirshmanniella*) の種；ヤリセンチュウ、ホプロアイムス属 (*Hoploaimus*) の種；ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (*Nacobbus*) の種；ハリセンチュウ、ロンギドルスエロンガツス (*Longidorus elongatus*) 及び他のロンギドルス属 (*Longidorus*) の種；ピンセンチュウ、ネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus*) の種；ネグサレセンチュウ、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、ブラチレンクスクルビタツス (*Pratylenchus curvittatus*)、ブラチレンクスグーデイ (*Pratylenchus goodeyi*) 及び他のネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus*) の種；ネモグリセンチュウ、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 及び他のネモグリセンチュウ属 (*Radopholus*) の種；ニセフクロセンチュウ、ロチレンクスロボツス (*Rotylenchus robustus*)、トチレンクスレニホルミス (*Rotylenchus reniformis*) 及び他のロチレンクス (*Rotylenchus*) 種；スクテロネマ属 (*Scutellonema*) の種；ユミハリ線虫、トリコドルスピリミチプス (*Trichodorus primitivus*) 及び他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) の種、パラトリトリコドルス属 (*Paratr*
ichodorus) の種；イシュクセンチュウ、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコルヒンクスドウビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) 及び他のチレンコルヒンクス属 (*Tylenchorhynchus*) の種；ミカンネセンチュウ、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) の種；オオハリセンチュウ、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) の種などの植物寄生性線虫；並びに、スバングイナ属の種 (*Subanguina* spp.)、ヒブソペリネ属の種 (*Hypsoperine* spp.)、マクロポストニア属の種 (*Macroposthonia* spp.)、メリニウス属の種 (*Melinius* spp.)、プンクトデラ属の種 (*Punctodera* spp.) 及びキニスルス属の種 (*Quinisulcius* spp.) などの他の植物寄生性線虫種による植物及びその一部に対する損害を防止する方法に関し得る。

10

20

30

【0217】

本発明の化合物はまた、軟体動物に対しても活性を有し得る。その例としては、例えば、スクミリングガイ科 (*Ampullariidae*)；アリオン属 (*Arion*) (*コウラクロナメクジ* (*A. ater*)、*A. サーカムスクリプツス* (*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス* (*A. hortensis*)、*A. ルーフアス* (*A. rufus*))；オナジマイマイ科 (*Bradybaenidae*) (*ブラジバエナフルチウム* (*Bradybaena fruticum*))；オウシュウマイマイ属 (*Cepaea*) (*ニワノオウシュウマイマイ* (*C. hortensis*)、*モリマイマイ* (*C. Nemoralis*))；オクロジナ (*ochlodina*)；デロセラス属 (*Dero*
ceras) (*D. アグレスチス* (*D. agrestis*)、*D. エムピリコルム* (*D. empiricorum*)、*D. ラエヴェ* (*D. laeve*)、*D. レチクラツム* (*D. reticulatum*))；ディスクス属 (*Discus*) (*D. ロツンダツス* (*D. rotundatus*))；ユーオムファリア属 (*Euomphalia*)；ガルバ属 (*Galba*) (*G. トルククラタ* (*G. trunculata*))；ヘリセリア属 (*Helicel*
lia) (*H. イタラ* (*H. itala*)、*H. オブヴィア* (*H. obvia*))；マイマイ科 (*Helicidae*) (*ヘリシゴナルブストルム* (*Helicigona arbustorum*))；ヘリコディスクス属 (*Helicodiscus*)；ヘリクス属 (*Helix*) (*H. アペルタ* (*H. aperta*))；リマックス属 (*L*
imax) (*L. シネレオニゲル* (*L. cinereoniger*)、*キイロナメクジ* (*L*

40

50

．*flavus*）、チャコウラナメクジ（*L. marginatus*）、マダラコウラナメクジ（*L. maximus*）、*L. テネルス*（*L. tenellus*））；モノアライガイ属（*Lymnaea*）；ミラックス属（*Milax*）（ニワコウラナメクジ（*M. gagates*）、*M. マルギナツス*（*M. marginatus*）、*M. ソウエルビイ*（*M. sowerbyi*））；オベアス属（*Opeas*）；リンゴガイ属（*Pomacea*）（スクミリンゴガイ（*P. canaliculata*））；ミジンマイマイ属（*Valonia*）及びザニトイデス属（*Zanitooides*）が挙げられる。

【0218】

「作物」という用語は、例えば、毒素産生細菌、特にバチルス属（*Bacillus*）の細菌に由来する公知のような1つ又は複数の選択的に作用する毒素を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。

【0219】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌（*Bacillus cereus*）又はバチルス・ポピリエ（*Bacillus popilliae*）に由来する殺虫タンパク質；又は δ -エンドトキシン、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1又はCry9Cなど、バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する殺虫タンパク質又は植物性殺虫タンパク質（Vip）、例えばVip1、Vip2、Vip3又はVip3A；又は細菌コロニー形成線虫、例えばフォトラブダス・ルミネセンス（*Photobacterium luminescens*）、キセノラブダス・ネマトフィルス（*Xenorhabdus nematophilus*）などのフォトラブダス属（*Photobacterium spp.* 又はキセノラブダス属（*Xenorhabdus spp.*）の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素及び他の昆虫に特有の神経毒素など、動物によって産生される毒素；ストレプトマイセス属（*Streptomyces*）毒素など、真菌によって産生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチン又はユキノハナレクチンなどの植物レクチン；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サポリン又はブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質（RIP）；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

【0220】

本発明に関して、 δ -エンドトキシンは、例えば、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1又はCry9C又は植物性殺虫タンパク質（Vip）、例えばVip1、Vip2、Vip3又はVip3A、また、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素及び改変毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組み換えにより産生される（例えば、国際公開第02/15701号を参照されたい）。切断毒素、例えば切断Cry1Abが公知である。改変毒素の場合、天然毒素の1つ又は複数のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が、毒素に挿入され、例えばCry3A055の場合、カテプシン-G-認識配列が、Cry3A毒素に挿入される（国際公開第03/018810号を参照されたい）。

【0221】

このような毒素又はこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の

例は、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書及び国際公開第03/052073号に開示されている。

【0222】

このようなトランスジェニック植物の調製の方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。Cry I型のデオキシリボ核酸及びそれらの調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書及び国際公開第90/13651号から公知である。

10

【0223】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、甲虫（鞘翅目（Coleoptera））、双翅昆虫（双翅目（Diptera））及び蛾（鱗翅目（Lepidoptera））において特に一般的に見られる。

【0224】

殺虫剤耐性（insecticidal resistance）をコードし、1つ又は複数の毒素を発現する1つ又は複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、YieldGard（登録商標）（Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Rootworm（登録商標）（Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Plus（登録商標）（Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry9C毒素を発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（Cry1Fa2毒素及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るための酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ（PAT）を発現するトウモロコシ品種）；NuCOTN 33B（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）；Bollgard I（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）；Bollgard II（登録商標）（Cry1Ac及びCry2Ab毒素を発現するワタ品種）；VipCot（登録商標）（Vip3A及びCry1Ab毒素を発現するワタ品種）；NewLeaf（登録商標）（Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種）；NatureGard（登録商標）、AgriSure（登録商標）GT Advantage（GA21グリホサート耐性形質）、AgriSure（登録商標）CB Advantage（Bt11アワノメイガ（CB）形質）及びProtecta（登録商標）である。

20

30

【0225】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS（Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France）製のBt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ（アワノメイガ（Ostrinia nubilalis））及びセサミア・ノナグリオイデス（Sesamia nonagrioides））による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt11トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

40

【0226】

2. Syngenta Seeds SAS（Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France）製のBt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ（アワノメイガ（Ostrinia nubilalis））及びセサミア・ノナグリオイデス（Sesamia nonagrioides））

50

による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。B t 1 7 6 トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素 P A T も遺伝子組み換えにより発現する。

【0227】

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製のMIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。改変Cry3A毒素のトランスジェニック発現により、耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン-G-プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾されたCry3A055である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第03/018810号に記載されている。

10

【0228】

4. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のMON 863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON 863は、Cry3Bb1毒素を発現し、特定の鞘翅目 (Coleoptera) 昆虫に対する耐性を有する。

【0229】

5. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のIPC 531ワタ、登録番号C/ES/96/02。

【0230】

20

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue TESCO, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅目 (Lepidoptera) 昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry1F及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。

【0231】

7. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のNK603×MON 810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え品種NK603及びMON 810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK603×MON 810トウモロコシは、除草剤Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属 (Agrobacterium sp.) 菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSPS及びヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目 (Lepidoptera) に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) から得られるCry1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

30

【0232】

昆虫耐性植物のトランスジェニック作物は、BATS (Zentrum fuer Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>) にも記載されている。

40

【0233】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい) など、選択的作用を有する抗病原性物質を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特

50

許出願公開第0392225号明細書、国際公開第95/33818号及び欧州特許出願公開第0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を産生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。

【0234】

作物は、真菌（例えば、フザリウム属（*Fusarium*）、炭疽病又はフィトフトラ属（*Phytophthora*））、細菌（例えば、シュードモナス属（*Pseudomonas*））又はウイルス（例えば、ジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊疽ウイルス、キュウリモザイクウイルス）病原体に対する耐性を高めるためにも改良され得る。

【0235】

作物は、ダイズシスト線虫などの線虫に対する高い抵抗性を有するものも含む。

10

【0236】

非生物的ストレスに耐性である作物は、例えば、NF-YB又は当技術分野において公知である他のタンパク質の発現により、干ばつ、高塩分、高温、低温、霜又は光線に対する高い耐性を有するものを含む。

【0237】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、例えばウイルス性KP1、KP4又はKP6毒素；スチルベンシンターゼ；ビベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる「病原性関連タンパク質」（PRP；例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい）；微生物によって産生される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質又は複素環式抗生物質（例えば、国際公開第95/33818号を参照されたい）又は植物病原体防御に関与するタンパク質又はポリペプチド因子（国際公開第03/000906号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」）が挙げられる。

20

【0238】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品及び貯蔵室の保護及び原料（木材及び織物など）、床仕上げ材及び建築物の保護及び衛生分野において、特に上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜及び生産性家畜の保護である。

【0239】

本発明は、有害生物（蚊及び他の病原媒介動物など；http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/も参照されたい）を防除する方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除する方法は、本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材にブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井又は床面などの表面のIRS（屋内残留噴霧）施用が、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、このような組成物を網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の不織布又は布帛材料などの基材に施用することが想定されている。

30

【0240】

一実施形態において、このような有害生物を防除する方法は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面又は基材に与えるように、殺有害生物的に有効な量の本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材に施用する工程を含む。このような施用は、本発明の殺有害生物組成物をブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬することによって行われ得る。例として、壁、天井又は床面などの表面におけるIRS施用は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面に与えるように、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の布帛材料などの基材における有害生物の残存性防除のためにこのような組成物を施用することが想定されている。

40

【0241】

処理される不織布、布帛又は網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザ

50

ル、麻布若しくは羊毛などの天然繊維又はポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成繊維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005113886号又は国際公開第2007/090739号から公知である。

【0242】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、すべての観賞用樹木並びにあらゆる種類の果樹及び堅果の成る木の樹幹注入／幹処理の分野である。

【0243】

樹幹注入／幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（Lepidoptera）及び鞘翅目（Coleoptera）の木材穿孔性（wood-boring）昆虫、特に以下の表A及びBに列挙される木材穿孔性昆虫（woodborer）に対して特に好適である。

【0244】

【表7】

表 A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	宿主又は外寄生される作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アオナガタマムシ (<i>Agrilus planipennis</i>)	セイヨウトネリコ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	アノプルラ・グラブリペンニス (<i>Anoplua glabripennis</i>)	広葉樹
キクイムシ科 (Scolytidae)	サクキクイムシ (<i>Xylosandrus crassiusculus</i>)	広葉樹
	クスノキオオキクイムシ (<i>X. mutilatus</i>)	広葉樹
	マツノキクイムシ (<i>Tomicus piniperda</i>)	針葉樹

【0245】

【表 8】

表 B. 経済的に重要な在来木材穿孔性昆虫の例

科	種	宿主又は外寄生される作物
タ マ ム シ 科 (Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス (<i>Agrilus anxius</i>)	カバノキ
	アグリルス・ポリツス (<i>Agrilus politus</i>)	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ(<i>Agrilus sayi</i>)	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス (<i>Agrilus vittaticollis</i>)	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、 サービスベリー、サンザシ
	クリソボトリス・フェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>)	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカ エデ、サクラ、クリ、スグリ、ニレ、サ ンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウ トチノキ、リンデン、カエデ、ナナカマ ド、オーク、ペカン、セイヨウナシ、モ モ、カキ、プラム、ポプラ、マルメロ、 アメリカハナズオウ、サービスベリ ー、スズカケノキ、クルミ、ヤナギ
	テキサニア・カンペストリス (<i>Texania campestris</i>)	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、ス ズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	ゴエス・プルベルレンツス (<i>Goes pulverulentus</i>)	ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall)、ヤ ナギ、クロガシワ、アメリカキレハガ シワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、ス ズカケノキ
	ゴエス・チグリヌス(<i>Goes tigrinus</i>)	オーク
	ネオクリツス・アクミナツス (<i>Neoclytus acuminatus</i>)	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オー ク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、 イースタンホップホーンビーム (Eastern hophornbeam)、ハナミズ キ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイ ラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリカ サイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカハ リグワ、サッサfras、ライラック、マ ウンテン・マホガニー、セイヨウナ シ、サクラ、プラム、モモ、リンゴ、ニ レ、シナノキ、モミジバフウ
	ネオプチコデス・トリリネツス (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、 ネットリーフハックベリー(Netleaf hackberry)

10

20

30

40

50

	オベレア・オセラータ(<i>Obera ocellata</i>)	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイヨウナシ、スグリ、ブラックベリー (Blackberry)
	オベレア・トリプンクタータ(<i>Obera tripunctata</i>)	ハナミズキ、ガマズミ属(<i>Viburnum</i>)、ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ
	オンシデレス・シングラータ(<i>Oncideres cingulata</i>)	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワーウッド、シナノキ、アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属(<i>Eucalyptus</i>)、オーク、エノキ、カエデ、果樹
	サペルダ・カルカラタ(<i>Saperda calcarata</i>)	ポプラ
	ストロフィオナ・ニテンス(<i>Strophiona nitens</i>)	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルス・コロンビアンヌス(<i>Corthylus columbianus</i>)	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ
	デンドロクトヌス・フロンタリス(<i>Dendroctonus frontalis</i>)	マツ
	ドリオコエテス・ベツラエ(<i>Dryocoetes betulae</i>)	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ
	モナルトルム・ファスシアツム(<i>Monarthrum fasciatum</i>)	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ
	フロエオトリブス・リミナリス(<i>Phloeotribus liminaris</i>)	モモ、サクラ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド
	シュードピチオフトルス・プレイノス(<i>Pseudopityophthorus pruinosis</i>)	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム (Chickasaw plum)、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネ・シムランズ(<i>Paranthrene simulans</i>)	オーク、アメリカグリ
	サンニナ・ウロセリフォルミス(<i>Sannina uroceriformis</i>)	カキ
	シナンテドン・エキシチオサ(<i>Synanthedon exitiosa</i>)	モモ、プラム、ネクタリン、サクラ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ
	シナンテドン・ピクテペス(<i>Synanthedon pictipes</i>)	モモ、プラム、サクラ、ブナ、アメリカザクラ

10

20

30

40

50

	シナンテドン・ルブロファスシア (<i>Synanthedon rubrofascia</i>)	アメリカヌマミズキ
	シナンテドン・シツラ (<i>Synanthedon scitula</i>)	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属 (<i>Viburnum</i>)、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ
	ビタセア・ポリスチフォルミス (<i>Vitacea polistiformis</i>)	ブドウ

10

【0246】

本発明は、例えば、甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ (ground pearl)、ヤスデ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、マダニ、アワフキムシ、サウザンキンクバグ (southern chinch bug) 及び地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。本発明は、卵、幼虫、若虫及び成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

20

【0247】

特に、本発明は、地虫 (コガネカブト属 (*Cyclocephala* spp.)) (例えば、マスクドコガネムシ (masked chafer)、*C. lurida*)、リゾトログス属 (*Rhizotrogus* spp.) (例えば、ヨーロピアンコガネムシ、*R. majalis*)、コチヌス属 (*Cotinus* spp.) (例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida*)、ポピリア属 (*Popillia* spp.) (例えば、マメコガネ (Japanese beetle)、*P. japonica*)、フィロファガ属 (*Phyllophaga* spp.) (例えば、コガネムシ (May/June beetle))、アテニウス属 (*Ataenius* spp.) (例えば、ブラック・ターフグラス・アテニウス (Black turfgrass ataenius)、*A. spretulus*)、マラデラ属 (*Maladera* spp.) (例えば、アカビロウドコガネ、*M. castanea*) 及びトマルス属 (*Tomarus* spp.) など)、ワタフキカイガラムシ (マルガロデス属 (*Margarodes* spp.))、ケラ (タウニー (tawny)、サウザン (southern) 及び短翅型; スカプテリスクス属 (*Scapteriscus* spp.))、ケラ (*Gryllotalpa africana*) 及びレザージャケット (leather jacket) (ヨーロピアンクレーンフライ (European crane fly)、ガガンボ属 (*Tipula* spp.)) を含む、芝草の根を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

30

40

【0248】

本発明は、ヨトウムシ (ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) 及び一般的なヨトウムシ (common armyworm) (プセウダレチア・ユニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*) など)、ネキリムシ、ゾウムシ (スフェノホルス属 (*Sphenophorus* spp.))、シバオサゾウムシ (*S. venatus verstitus*) 及び *S. parvulus*) など) 及びソッドウェブワーム (sod webworm) (クラムプス属 (*Crambus* spp.)) 及び熱帯ソッドウェブワーム (tropical sod webworm)、ケナシクロオビクロノメイガ (*Herpetogramma phaeo*

50

pteralis) など) を含む、藁に住む芝草の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

【0249】

本発明は、ヒメコガネナガカメムシ (Sawzan Kink Bug、Blissus insularis) など)、ギョウギシバ (Bermudagrass) のダニ (Eriophyes cynodonensis)、アフリカヒゲシバ (Rhodesgrass) のコナカイガラムシ (チガヤシロオカイガラムシ (Antonina graminis))、2本線のあるアフキムシ (two-lined spittlebug) (プロサピア・ビシンクタ (Propsapia bicincta))、ヨコバイ、ネキリムシ (ヤガ科 (Noctuidae)) 及びムギミドリアブラムシを含む、地上に生息し、芝草の葉を餌とする昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

10

【0250】

本発明は、芝生にアリ塚を作製するアカヒアリ (Solenopsis invicta) など、芝草の他の有害生物を防除するのにも使用され得る。

【0251】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ (hard tick)、ヒメダニ (soft tick)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエ及び舐性 (licking) のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ及びノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

20

【0252】

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目 (Anoplurida) のうち、ブタジラミ属 (Haematopinus spp.)、ホソジラミ属 (Linognathus spp.)、ペディクルス属 (Pediculus spp.) 及びケジラミ属 (Phtirus spp.)、ソレノポテス属 (Solenopotes spp.)。

【0253】

ハジラミ目 (Mallophagida) のうち、トリメノポン属 (Trimenopon spp.)、タンカクハジラミ属 (Menopon spp.)、トリノトン属 (Trinoton spp.)、ボビコラ属 (Bovicola spp.)、ウェルネツキエラ属 (Werneckiella spp.)、レピケントロン属 (Lepikentron spp.)、ダマリナ属 (Damalina spp.)、トリコデクテス属 (Trichodectes spp.) 及びフェリコラ属 (Felicola spp.)。

30

【0254】

双翅目 (Diptera) 並びにその亜目であるネマトセリナ亜目 (Nematocerina) 及び短角亜目 (Brachycerina) のうち、例えばヤブカ属 (Aedes spp.)、ハマダラカ属 (Anopheles spp.)、イエカ属 (Culex spp.)、ブヨ属 (Simulium spp.)、ツノマユブヨ属 (Eusimulium spp.)、サシチョウバエ属 (Phlebotomus spp.)、ルツォミヤ属 (Lutzomyia spp.)、キュリコイデス属 (Culicoides spp.)、メクラアブ属 (Chrysops spp.)、ヒボミトラ属 (Hybomitra spp.)、キイロアブ属 (Atylotus spp.)、アブ属 (Tabanus spp.)、ゴマフアブ属 (Haematopota spp.)、フィリポミア属 (Philipomyia spp.)、ブラウラ属 (Braula spp.)、イエバエ属 (Musca spp.)、トゲアシメマトイ属 (Hydrotaea spp.)、サシバエ属 (Stomoxys spp.)、ヘマトビア属 (Haematobia spp.)、モレリア属 (Morellia spp.)、ヒメイエバエ属 (Fannia spp.)、ツエツエバエ属 (Glossina spp.)、オオクロバエ属 (Calliphora spp.)、キンバエ属 (Lucilia spp.)

40

50

.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、ヴォールファールトニクバエ属 (*Wohlfahrtia* spp.)、ニクバエ属 (*Sarcophaga* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、ウシバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ウマバエ属 (*Gasterophilus* spp.)、シラミバエ属 (*Hippobosca* spp.)、シカシラミバエ属 (*Lipoptena* spp.) 及びヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)。

【0255】

ノミ目 (*Siphonapterida*) のうち、例えばヒトノミ属 (*Pulex* spp.)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp.)、ネズミノミ属 (*Xenopsylla* spp.)、ナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)。

10

【0256】

異翅目 (*Heteropterida*) のうち、例えばトコジラミ属 (*Cimex* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、パンストロギルス属 (*Panstrongylus* spp.)。

【0257】

ゴキブリ目 (*Blattarida*) のうち、例えばトウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 及びスペラ属 (*Supella* spp.)。

20

【0258】

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) 並びにマダニ亜目 (*Metastigmata*) 及び中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えばナガヒメダニ属 (*Argas* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属 (*Otobius* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、キララマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)、チマダニ属 (*Haemophysalis* spp.)、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニスス属 (*Dermanyssus* spp.)、ライリエチア属 (*Raillietia* spp.)、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.) 及びバロア属 (*Varroa* spp.)。

30

【0259】

ダニ目 (*Actinedida*) (前気門類 (*Prostigmata*)) 及びカイチュウ目 (*Acaridida*) (コナダニ亜目 (*Astigmata*)) のうち、例えばアカラピス属 (*Acarapis* spp.)、ツメダニ属 (*Cheyletiella* spp.)、オルニソケイレチア属 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属 (*Myobia* spp.)、ヒツジツメダニ属 (*Psorergates* spp.)、ニキビダニ属 (*Demodex* spp.)、ツツガムシ属 (*Trombicula* spp.)、リストロホルス属 (*Listrophorus* spp.)、コナダニ属 (*Acarus* spp.)、チロファグス属 (*Tyrophagus* spp.)、ゴミコナダニ属 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属 (*Hypolectes* spp.)、プテロリクス属 (*Pterolichus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (*Chorioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ属 (*Otodectes* spp.)、ヒゼンダニ属 (*Sarcoptes* spp.)、ショウセンコウヒゼンダニ属 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属 (*Cytodites* spp.) 及びラミノシオプテス属 (*Laminosioptes* spp.)。

40

【0260】

50

本発明に係る組成物は、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙及び厚紙、皮革、床仕上げ材及び建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのにも好適である。

【0261】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム (*Xestobium rufovillosum*)、プチリヌスペクチコルニス (*Ptilinus specticornis*)、デンドロビウム・ベルチネクス (*Dendrobium pertinex*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Priobium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテルギコリス (*Minthesrugicollis*)、キシルボルス属種 (*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシンス (*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種 (*Sinoxylon spec.*) 及びチビタケナガシクイムシ (*Dinoderus minutus*) などの甲虫並びにさらにコルリキバチ (*Sirex juvencus*)、モミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas taignus*) 及びウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*) などの膜翅類の昆虫 (hymenopteran) 並びにカロテルメス・フラヴィコリス (*Kaloterme flavicollis*)、ニシインドカンザシロアリ (*Cryptotermes brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ (*Heterotermes indicola*)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス (*Reticulitermes santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス (*Reticulitermes lucifugus*)、ムカシシロアリ (*Maotermes darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*) 及びイエシロアリ (*Coptotermes formosanus*) などのシロアリ並びにセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) などのシミ。

【0262】

本発明に係る化合物は、未変性の形態で殺有害生物剤として使用可能であるが、これらは、一般に、種々の方法でキャリア、溶剤及び表面活性物質などの配合助剤を用いて組成物に配合される。配合物は、例えば、散粉粉末、ゲル、水和剤、水分散性顆粒、水分散性錠剤、発泡性ペレット、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、水中油型エマルジョン、油性フロアブル、水性分散体、油性分散体、サスポエマルジョン、カプセル懸濁液、乳化性顆粒、可溶性液体、水溶性濃縮物 (キャリアとして水又は水和性の有機溶剤を含む)、含浸ポリマーフィルムの形態又は例えば the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010) から公知である他の形態といった種々の物理的形態であり得る。このような配合物は、直接用いられるか又は使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量元素、生物学的生体、油又は溶剤により行うことが可能である。

10

20

30

40

50

【0263】

配合物は、例えば、微細固形分、顆粒、溶液、分散体又はエマルジョンの形態で組成物を得るために、有効成分を配合助剤と混合することにより調製可能である。有効成分は、微細固形分、鉱油、植物性油若しくは動物性油、植物性変性油若しくは動物性変性油、有機溶剤、水、表面活性物質又はこれらの組み合わせなどの他の補助剤とも配合可能である。

【0264】

有効成分は、きわめて微細なマイクロカプセル中にも含まれ得る。マイクロカプセルは、多孔性キャリア中に有効成分を含有する。これにより、有効成分を、制御された量（例えば、緩効性）で環境中に放出させることが可能である。マイクロカプセルは、通常、0.1～500ミクロンの直径を有する。これらは、有効成分をカプセル重量基準で約25～95重量%の量で含有する。有効成分は、一塊の固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微細な粒子の形態又は好適な溶液の形態であり得る。封入メンブランは、例えば、天然若しくは合成ゴム、セルロース、スチレン／ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン又は化学変性ポリマー及びキサントゲン酸デンプン又は当業者に公知である他のポリマーを含むことが可能である。代わりに、きわめて微細なマイクロカプセルは、基剤の固体マトリックス中に微細粒子の形態で有効成分を含有して形成され得るが、マイクロカプセル自体は、封入されていない。

【0265】

本発明に係る組成物の調製に好適である配合助剤は、それら自体公知である。液体キャリアとしては、水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、ブチレンカーボネート、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、アビエチン酸ジエチレングリコール、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 α -ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 γ -ブチロラクトン、グリセロール、グリセロールアセテート、グリセロールジアセテート、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクタールアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、プロピル乳酸塩、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N-メチル-2-ピロリドンなどの高分子量アルコール等が用いられ得る。

【0266】

好適な固体キャリアは、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、石灰岩、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿殻、コムギ粉、ダイズ粉、軽石、木粉、粉碎したクルミの殻、リグニン及び同様の物質である。

【0267】

多数の表面活性物質は、固体及び液体配合物の両方において、特に使用前にキャリアで希釈可能である配合物で有利に用いられ得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、ノニオン性又は高分子であり得、これらは、乳化剤、湿潤剤若しくは懸濁剤として又は他の目的のために用いられ得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ジエタノールアンモニウムラウリルスルフェートなどのアルキルスルフェートの塩；ドデシルベンゼン
スルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネートの塩；ノニルフェノールエト
キシレートなどのアルキルフェノール／アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアル
コールエトキシレートなどのアルコール／アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸
ナトリウムなどのセッケン；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナ
フタレンスルホネートの塩；ジ（２－エチルヘキシル）スルホコハク酸ナトリウムなどの
スルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレアートなどのソルビトールエ
ステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第４級アミン、ポリエチレングリコ
ールステアレートなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及
びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びにモノー及びジ－アルキルホスフェ
ートエステルの塩；並びに例えばMcCutcheon's Detergents and
Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., R
idgewood New Jersey (1981)に記載のさらなる物質が挙げられ
る。

10

20

【0268】

有害生物防除配合物において用いられ得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整剤、懸濁剤、染料、抗酸化剤、発泡剤、吸光剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤又はpH調整剤及び緩衝剤、腐食抑制剤、芳香剤、湿潤剤、取り込み増強剤、微量元素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤並びに液体及び固体肥料が挙げられる。

【0269】

本発明に係る組成物は、植物性油又は動物性油、鉱油、このような油のアルキルエステル又はこのような油及び油誘導体の混合物を含む添加剤を含むことが可能である。本発明に係る組成物における油添加剤の量は、一般に、適用される混合物に基づいて0.01～10%である。例えば、油添加剤は、噴霧混合物が調製された後、噴霧タンク中に所望の濃度で添加することが可能である。好ましい油添加剤は、鉱油又は例えばナタネ油、オリーブ油若しくはヒマワリ油といった植物性油、乳化植物油、例えばメチル誘導体といった植物性油のアルキルエステル又は魚油若しくは牛脂などの動物性油を含む。好ましい油添加剤は、C₈～C₂₂脂肪酸のアルキルエステル、特にC₁₂～C₁₈脂肪酸のメチル誘導体であり、例えばラウリン酸、パルミチン酸及びオレイン酸のメチルエステル（それぞれラウリン酸メチル、パルミチン酸メチル及びオレイン酸メチル）を含む。多くの油誘導体は、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

30

40

【0270】

本発明の組成物は、一般に、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の本発明の化合物と、1～99.9重量%の配合助剤（これは、0～25重量%の表面活性物質を含むことが好ましい）とを含む。商業用の製品は、濃縮物として配合されることが好ましいことがあり得るが、エンドユーザーは、通常、希釈配合物を利用することとなる。

【0271】

適用量は、幅広い範囲内で様々であり、土壌の性質、適用方法、作物植物、防除される

50

有害生物、主な気象条件並びに適用方法、適用時期及び標的作物によって左右される他の要因に応じる。一般的なガイドラインのとおり、化合物は、 $1 \sim 2000 \text{ l} / \text{ha}$ 、特に $10 \sim 1000 \text{ l} / \text{ha}$ の量で適用され得る。

【0272】

好ましい配合物は、以下の組成（重量％）を有することが可能である。

乳化性濃縮物：

有効成分： $1 \sim 95 \%$ 、好ましくは $60 \sim 90 \%$

表面活性薬剤： $1 \sim 30 \%$ 、好ましくは $5 \sim 20 \%$

液体キャリア： $1 \sim 80 \%$ 、好ましくは $1 \sim 35 \%$

【0273】

粉剤：

有効成分： $0.1 \sim 10 \%$ 、好ましくは $0.1 \sim 5 \%$

固体キャリア： $99.9 \sim 90 \%$ 、好ましくは $99.9 \sim 99 \%$

【0274】

懸濁液濃縮物：

有効成分： $5 \sim 75 \%$ 、好ましくは $10 \sim 50 \%$

水： $94 \sim 24 \%$ 、好ましくは $88 \sim 30 \%$

表面活性薬剤： $1 \sim 40 \%$ 、好ましくは $2 \sim 30 \%$

【0275】

水和剤：

有効成分： $0.5 \sim 90 \%$ 、好ましくは $1 \sim 80 \%$

表面活性薬剤： $0.5 \sim 20 \%$ 、好ましくは $1 \sim 15 \%$

固体キャリア： $5 \sim 95 \%$ 、好ましくは $15 \sim 90 \%$

【0276】

顆粒：

有効成分： $0.1 \sim 30 \%$ 、好ましくは $0.1 \sim 15 \%$

固体キャリア： $99.5 \sim 70 \%$ 、好ましくは $97 \sim 85 \%$

【0277】

以下の例は、本発明をさらに例示するが、限定するものではない。

【0278】

【表9】

水和剤	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	—
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	—	5 %
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	—	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7～8 mol のエチレンオキシド)	—	2 %	—
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

【0279】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である水和剤を得る。

【0280】

10

20

30

40

50

【表 1 0】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	—
カオリン	65 %	40 %	—
タルカム	—	—	20 %

【0 2 8 1】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得る。

【0 2 8 2】

【表 1 1】

乳化性濃縮物	
有効成分	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4~5 molのエチレンオキシド)	3 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %
ひまし油ポリグリコールエーテル(35 molのエチレンオキシド)	4 %
シクロヘキサノン	30 %
キシレン混合物	50 %

【0 2 8 3】

植物の保護に使用可能である、いずれかの必要とされる希釈度のエマルジョンは、水で希釈することによりこの濃縮物から入手が可能である。

【0 2 8 4】

【表 1 2】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	—	—
カオリン	—	94 %	—
無機充填剤	—	—	96 %

【0 2 8 5】

直ちに使用可能な粉剤は、複合物をキャリアと混合し、この混合物を好適なミル中において粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣にも用いることができる。

【0 2 8 6】

【表 1 3】

押出し顆粒	
有効成分	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

【0 2 8 7】

複合物を補助剤と混合及び粉碎し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで空気流中において乾燥させる。

【0288】

【表14】

被覆顆粒	
有効成分	8 %
ポリエチレングリコール(mol. wt. 200)	3 %
カオリン	89 %

10

【0289】

ミキサ中において、微細に粉碎した複合物を、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉塵を発生させないコーティングされた顆粒がこれにより得られる。

【0290】

【表15】

懸濁液濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15 mol のエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコーン油(75 %水中エマルジョンの形態)	1 %
水	32 %

20

【0291】

微細に粉碎した複合物を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、水で希釈することにより、いずれかの所望の希釈度の懸濁液を得ることが可能である。このような希釈を用いて、生存している植物並びに植物繁殖材料を、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生に対して処理及び保護することが可能である。

30

【0292】

【表16】

種子処理用のフロアブル濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノール PO/EO	2 %
10~20 モルの EO を含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(20%水溶液の形態)	0.5 %
モノアゾ顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(75 %水中エマルジョンの形態)	0.2 %
水	45.3 %

40

【0293】

微細に粉碎した複合物を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、水で希釈することにより、いずれかの所望の希釈度の懸濁液を得ることが可能である。このような希釈を用いて、生存している植物並びに植物繁殖材料を、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生に対して処理及び保護することが可能である。

50

【0294】

緩効性カプセル懸濁液

28部の複合物を2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート／ポリメチレンポリフェニルイソシアネート混合物（8：1）と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化する。このエマルジョンに5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の有効成分を含有する。中型カプセルの直径は、8～15ミクロンである。得られる配合物を、この目的に好適である装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

10

【0295】

配合タイプとしては、エマルジョン濃縮物（EC）、懸濁液濃縮物（SC）、サスポエマルジョン（SE）、カプセル懸濁液（CS）、水分散性顆粒（WG）、乳化性顆粒（EG）、エマルジョン、油中水型（EO）、エマルジョン、水中油型（EW）、マイクロエマルジョン（ME）、油分散体（OD）、油混和性フロアブル（OF）、油混和性液体（OL）、可溶性濃縮物（SL）、超低体積懸濁液（SU）、超低体積液体（UL）、工業用濃縮物（TK）、分散性濃縮物（DC）、水和剤（WP）、可溶性顆粒（SG）又は農業的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物が挙げられる。

20

【実施例】

【0296】

調製例：

「Mp」は融点（℃）を意味する。フリーラジカルはメチル基を表す。¹H NMR計測値はBruker 400MHz分光計で記録し、化学シフトはTMS標準を基準としたppmで示されている。スペクトルは明記のとおり重溶媒中において計測した。以下のLCMS方法のいずれか1つを用いて化合物の特徴付けを行った。各化合物について得た固有のLCMS値は、保持時間（「Rt」、分で記録）、及び、実測の分子イオン（M+H）⁺又は（M+H）⁻であった。

30

【0297】

LCMS法：

方法1：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、フルスキャン、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：41V、ソース温度：150℃、脱溶剤温度：500℃、コーンガス流：50L/Hr、脱溶剤ガス流：1000L/Hr、質量範囲：110～800Da）及びWaters製H-クラスUPLC：クォータナリーポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオードアレイ検出器を備える、Waters製質量分光計（SQDシングル四重極型質量分光計）で記録した。カラム：Acquity UPLC HSS T3 C18、1.8μm、30×2.1mm、温度：40℃、DAD波長範囲（nm）：200～400、溶剤勾配：A=水+5%アセトニトリル+0.1% HC(O)OH、B=アセトニトリル+0.05% HC(O)OH：勾配：0分 10%B；0.～0.2分 10～50%B；0.2～0.7分 50～100%B；0.7～1.3分 100%B；1.3～1.4分 100～10%B；1.4～1.6分 10%B；流量（mL/min）0.6。

40

【0298】

方法2：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、MS2 Scan、キャピラリ：4.00kV、フラグメンタ：100V、脱溶媒和温度：350℃、ガス流：11L/min、ネブライザガス：45psi、質量範囲：110～1000Da）及びAgilent製1200 Series HPLC：クォータナリーポンプ

50

、被加熱カラムコンパートメント及びダイオードアレイ検出器を備えるAgilent Technologies製質量分光計（6410トリプル四重極型質量分析計）で記録した。カラム：KINETEX EVO C18、2.6 μ m、50×4.6mm、温度：40℃、DAD波長範囲（nm）：210～400、溶剤勾配：A＝水＋5％アセトニトリル＋0.1％ HC(O)OH、B＝アセトニトリル＋0.1％ HC(O)OH：勾配：0分 10％B、90％A；0.9～1.8分 100％B；1.8～2.2分 100～10％B；2.2～2.5分 10％B；流量（mL/min）1.8。

【0299】

方法3：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽極及び陰極性スイッチ）、キャピラリ：0.8kV、コーン範囲：25V、抽出器：V（QDa検出器に対する抽出器電圧無し）ソース温度：120℃、脱溶剤温度：600℃、コーンガス流：50L/h、脱溶剤ガス流：1000L/h、質量範囲：110～850Da）及びWaters製Acquity UPLC：Quaternary solvent manager、被加熱カラムコンパートメント、ダイオードアレイ検出器を備えるWaters製質量分光計（Acquity QDa質量分光計）で記録した。カラム：Waters製UPLC HSS T3、1.8 μ m、30×2.1mm、温度：40℃、PDA波長範囲（nm）：230～400、溶剤勾配：A＝水＋0.1％ギ酸：アセトニトリル：95：5v/v、B＝アセトニトリル＋0.05％ギ酸：勾配：0分～1.0分、10％B～90％A；1.0分～4.50分 10％～100％B；4.51分～5.30分、100％B、0％A；5.31分～5.50分 100％～10％B；5.51分～6.00分、10％B、90％A；流量（mL/min）0.6。

【0300】

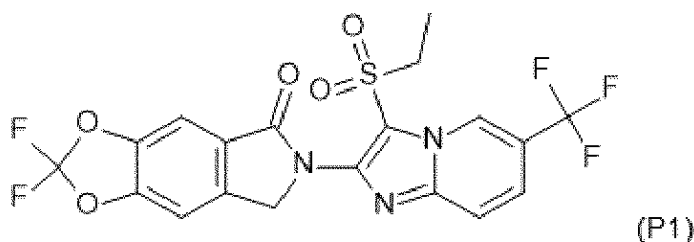
方法4：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、MS2 Scan、キャピラリ：7.00kV、フラグメンタ：120V、脱溶媒和温度：350℃、ガス流：11L/min、ネブライザガス：40psi、質量範囲：110～1000Da）及びAgilent製1200 Series HPLC：クォータナリーポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオードアレイ検出器を備えるAgilent Technologies製質量分光計（6410トリプル四重極型質量分析計）で記録した。カラム：KINETEX EVO C18、2.6 μ m、50×4.6mm、温度：40℃、検出器VWD波長：254nm、溶剤勾配：A＝水＋5％アセトニトリル＋0.1％ HC(O)OH、B＝アセトニトリル＋0.1％ HC(O)OH：勾配：0分 10％B、90％A；0.9～1.8分 100％B；1.8～2.2分 100～10％B；2.2～2.5分 10％B；流量（mL/min）1.8。

【0301】

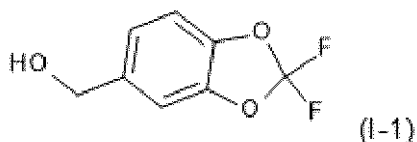
実施例P1：6－[3－エチルスルホニル－6－（トリフルオロメチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン－2－イル]－2,2－ジフルオロ－5H－[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール－7－オン（化合物P1）の調製

【化42】



ステップA1：（2,2－ジフルオロ－1,3－ベンゾジオキソール－5－イル）メタノール（中間体I－1）の調製

【化 4 3】



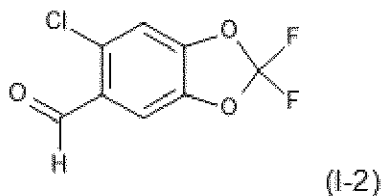
2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルバルデヒド (CAS 656-42-8) (15 g、76.56 mmol) のメタノール (75 mL) 中の 0℃に冷却した溶液に、水素化ホウ素ナトリウム (4.57 g、114.84 mmol) をゆっくりと添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌した。完了した後、反応塊を減圧中で濃縮し、塩化アンモニウム水溶液で失活させ、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧中で濃縮して、(2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル) メタノールを無色の液体として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.91 (br s, 1H), 4.69 (br s, 2H), 7.03-7.09 (m, 2H), 7.14 (s, 1H).

10

【0302】

ステップ A 2: 6-クロロ-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルバルデヒド (中間体 I-2) の調製

【化 4 4】



20

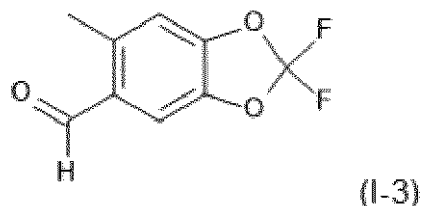
(2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル) メタノール (上記のとおり調製した中間体 I-1) (10 g、50.49 mmol) のアセトニトリル (60 mL) 中の溶液に、N-クロロスクシンイミド (17.20 g、126.24 mmol) を添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌した。完了した後、反応塊を減圧中で濃縮し、シクロヘキサンで倍散し、ブフナー漏斗でろ過し、ろ液を減圧中で濃縮した。粗化合物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0~30% 酢酸エチル) により精製して、純粋な 6-クロロ-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルバルデヒドを無色の液体として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 7.22 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 10.41 (s, 1H).

30

【0303】

ステップ A 3: 2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルバルデヒド (中間体 I-3) の調製

【化 4 5】



40

6-クロロ-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルバルデヒド (上記のとおり調製した中間体 I-2) (1 g、4.30 mmol) のトルエン (10 mL) 中の溶液に、メチルボロン酸 (1.14 g、17.22 mmol)、続いて、炭酸カ

50

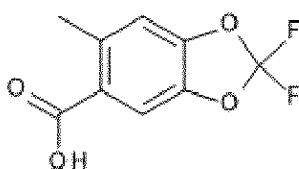
リウム (1.78 g、12.92 mmol) の水 (3 mL) 中の溶液を、窒素でパージしながら、10 分間かけて添加した。1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン-パラジウム (II) ジクロリドジクロロメタン錯体 (0.18 g、0.21 mmol) を添加し、反応混合物 90 °C で 15 時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、減圧中で濃縮した。反応塊を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、続いて、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0 ~ 30 % 酢酸エチル) により精製して、2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルバルデヒドを茶色の油として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 2.72 (s, 3H), 6.99 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 10.27 (s, 1H).

10

【0304】

ステップ A 4: 2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボン酸 (中間体 I-4) の調製

【化 4 6】



(I-4)

20

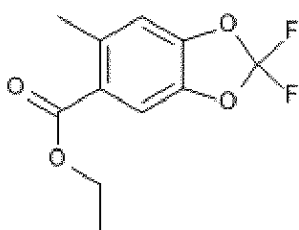
硝酸銀 (0.57 g、3.22 mmol) の水 (6.8 mL) 中の溶液に、水酸化ナトリウム (0.33 g、8.06 mmol) の水 (6.8 mL) 中の溶液を、室温で滴下した。この反応混合物に、2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルバルデヒド (上記のとおり調製した中間体 I-3) (0.34 g、1.61 mmol) を 20 分の時間をかけて数回に分けて添加した。反応混合物を室温で 2 時間攪拌した。完了した後、反応混合物をセライトでろ過し、ろ液を 2 N 塩酸水溶液で酸性化した。形成した固体をろ過し、冷水で洗浄し、減圧中で乾燥させて、2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボン酸を白色の固体として得た。LCMS (方法 2): Rt = 1.42 分間、m/z = 215 (M-H)⁻。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 2.54 (s, 3H), 7.41 (s, 1H), 7.77 (s, 1H).

30

【0305】

ステップ A 5: エチル 2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート (中間体 I-5) の調製

【化 4 7】



(I-5)

40

2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボン酸 (上記のとおり調製した中間体 I-4) (0.23 g、1.01 mmol) のエタノール (10 mL) 中の溶液を、室温で 15 分間攪拌した。この反応塊に、硫酸 (0.02 mL、0.40 mmol) を滴下した (発熱が観察された)。反応混合物を 60 °C で 12 時間加熱した。完了した後、反応塊を減圧中で濃縮し、重炭酸ナトリウム水溶液で中和し、生成物を酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し

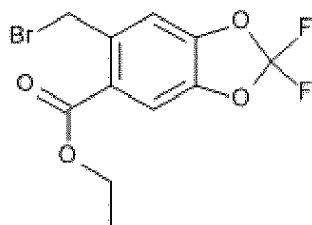
50

、減圧中で濃縮してエチル 2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレートを得た。粗生成物を、そのまま次のステップに用いた。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.41 (t, 3H), 2.64 (s, 3H), 4.37 (q, 2H), 6.97 (s, 1H), 7.67 (s, 1H)。

【0306】

ステップ A 6: エチル 6-(プロモメチル)-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート (中間体 I-6) の調製

【化 48】



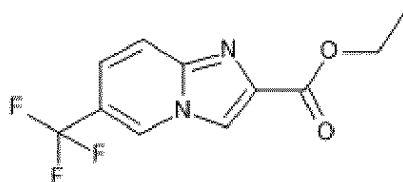
(I-6)

エチル 2, 2-ジフルオロ-6-メチル-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート (上記のとおり調製した中間体 I-5) (0.25 g、0.97 mmol) のベンゾトリフルオリド (3 mL) 中の溶液に、N-ブロモスクシンイミド (0.196 g、1.06 mmol) 及びアゾビスイソブチロニトリル (0.016 g、0.097 mmol) を室温で添加した。反応混合物を 90 °C で 3 時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、減圧中で濃縮した。粗生成物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0~30% 酢酸エチル) により精製して、エチル 6-(プロモメチル)-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレートをガム状の塊として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.39-1.47 (m, 3H), 4.38-4.45 (m, 2H), 4.97 (s, 2H), 7.20 (s, 1H), 7.71 (s, 1H)。

【0307】

ステップ B 1: エチル 6-(トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-2-カルボキシレート (中間体 I-7) の調製

【化 49】



(I-7)

5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-アミン (4.0 g、25 mmol) のエタノール (40 mL) 中の溶液に、エチル 3-ブromo-2-オキソプロパノエート (3.7 mL、30 mmol) 及び重炭酸ナトリウム (4.1 g、49 mmol) を室温で添加した。反応塊を 85 °C で 4 時間加熱した。完了した後、反応塊を氷冷水に添加し、形成した固体をブフナー漏斗でろ過してエチル 6-(トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-2-カルボキシレートを得た。この材料をそのまま次のステップにおいて用いた。LCMS (方法 2): Rt = 1.35 分間、m/z = 259 (M+H)⁺。

【0308】

ステップ B 2: エチル 3-クロロ-6-(トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-2-カルボキシレート (中間体 I-8) の調製

10

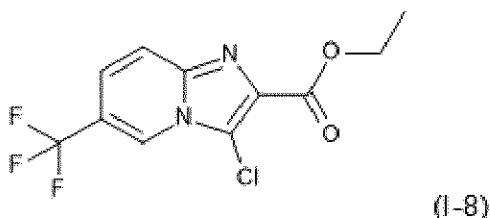
20

30

40

50

【化 5 0】



エチル 6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(上記のとおり調製した中間体 I-7)(8.5 g、33 mmol)の N,N-ジメチルホルムアミド(85 mL)中の溶液に、1-クロロピロリジン-2,5-ジオン(5.3 g、40 mmol)を室温で添加した。反応塊を 40℃で 4 時間加熱した。完了した後、反応塊を氷冷水で失活させ、形成した固体をブフナー漏斗でろ過し、減圧中で乾燥させて、エチル 3-クロロ-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレートを固体として得た。LCMS(方法 2): $R_t = 1.45$ 分間、 $m/z = 293$ ($M+H$)⁺。

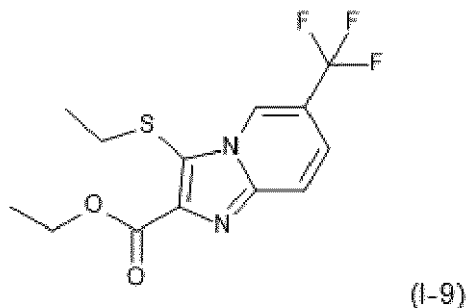
10

【0309】

ステップ B3: エチル 3-エチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(中間体 I-9)の調製

20

【化 5 1】



30

エチル 3-クロロ-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(上記のとおり調製した中間体 I-8)(6.0 g、21 mmol)の N,N-ジメチルホルムアミド(60 mL)中の 0℃に冷却した溶液に、ソジオチオエタン(2.1 g、25 mmol)を室温で添加した。反応塊を室温で 5 時間攪拌した。完了した後、反応塊を氷冷水に添加し、形成した固体をブフナー漏斗でろ過し、減圧中で乾燥させてエチル 3-エチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレートを得た。この材料をそのまま次のステップにおいて用いた。LCMS(方法 2): $R_t = 1.49$ 分間、 $m/z = 319$ ($M+H$)⁺。

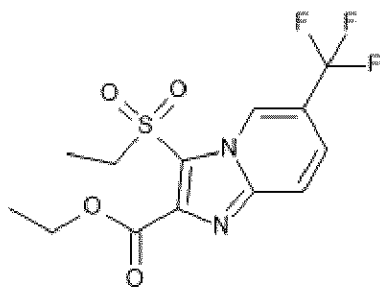
40

【0310】

ステップ B4: エチル 3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(中間体 I-10)の調製

50

【化 5 2】



(I-10)

10

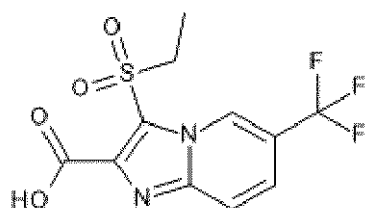
エチル 3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(上記のとおり調製した中間体 I-9)(6.5 g、20 mmol)のエタノール(65 mL)中の 0℃に冷却した溶液に、3-クロロ過安息香酸(11 g、45 mmol、70 質量%)を添加した。反応混合物を 0℃で 4 時間攪拌した。反応塊を水(50 mL)で希釈し、2 N 水酸化ナトリウム水溶液で塩基性化した。水性相を酢酸エチル(2×50 mL)で抽出した。組み合わせた有機層を塩水(20 mL)で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧中で濃縮した。粗生成物を combiflash(シリカゲル、シクロヘキサン中の 30~40% 酢酸エチル)により精製してエチル 3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレートを得た。LCMS(方法 2): Rt=1.43 分間、m/z=351 (M+H)⁺。

20

【0311】

ステップ B5: 3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸(中間体 I-11)の調製

【化 5 3】



(I-11)

30

エチル 3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(上記のとおり調製した中間体 I-10)(4.2 g、12 mmol)のテトラヒドロフラン(42 mL)中の溶液に、水酸化リチウム水和物(1.00 g、24 mmol)の水(17 mL)中の溶液を、0~5℃で添加した。反応混合物を室温で 4 時間攪拌した。反応混合物を 2 N 塩酸水溶液で酸性化し、形成した固体をブフナー漏斗でろ過し、減圧中で乾燥させて 3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸を得た。この材料をそのまま次のステップにおいて用いた。LCMS(方法 2): Rt=0.37 分間、m/z=323 (M+H)⁺。¹H NMR(400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 1.27 (t, 3H), 3.77 (q, 2H), 7.95 (dd, 1H), 8.10 (d, 1H), 9.34 (s, 1H)。

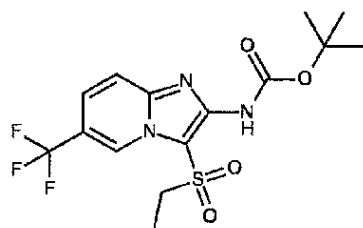
40

【0312】

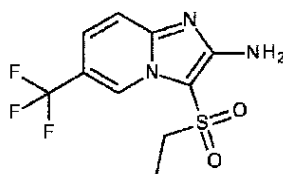
ステップ B6: tert-ブチル N-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]カルバメート(中間体 I-12)及び 3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-アミン(中間体 I-13)の調製

50

【化 5 4】



(I-12) 及び



(I-13)

3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸(上記のとおり調製した中間体I-11)(4.1g、13mmol)のtert-ブタノール(8.2mL)中の溶液に、トリエチルアミン(2.1g、120mmol)を室温で添加し、反応塊を90℃で10分間加熱した。次いで、これに、ジフェニルリン酸アジド(5.7g、20mmol)を15分間かけて滴下し、反応混合物をさらに、90℃で40分間撹拌した。反応塊を室温に冷却し、氷冷水(100mL)及び塩水(50mL)で失活させ、生成物を酢酸エチル(3×100mL)で抽出した。組み合わせた有機層を、ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をcombiflash(シリカゲル、シクロヘキサン中の酢酸エチル)により精製して、純粋なtert-ブチルN-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]カルバメート及び3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-アミンをそれぞれ得た。

【0313】

tert-ブチルN-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]カルバメート(中間体I-12):LCMS(方法2):Rt=1.49分間、m/z=392(M-H)⁻。¹H NMR(400MHz, DMSO-d₆)δ ppm:1.21-1.34(m, 3H), 1.48(s, 9H), 3.74(d, 2H), 7.85-7.94(m, 2H), 9.05(s, 1H), 9.60(s, 1H)。

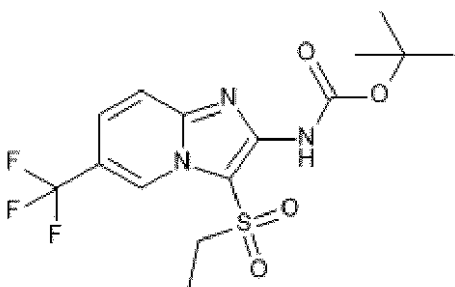
【0314】

3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-アミン(中間体I-13):LCMS(方法2):Rt=1.22分間、m/z=294(M+H)⁺。¹H NMR(400MHz, DMSO-d₆)δ ppm:1.17(t, 3H), 3.42(q, 2H), 6.37(s, 2H), 7.56(d, 1H), 7.71(dd, 1H), 8.77(s, 1H)。

【0315】

ステップB7:tert-ブチルN-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]カルバメート(中間体I-12)の調製

【化 5 5】



(I-12)

3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン 50

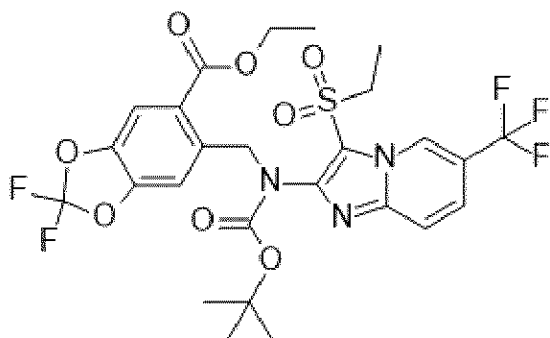
－２－アミン（上記のとおり調製した中間体Ⅰ－１３）（１ｇ、３．２３ｍｍｏｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１０ｍＬ）中の０℃に冷却した溶液に水素化ナトリウム（０．３１０ｇ、７．１２ｍｍｏｌ）を添加し、反応混合物を０℃で３０分間攪拌した。ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルｔｅｒｔ－ブチルカーボネート（０．９４ｍＬ、３．８８ｍｍｏｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３ｍＬ）中の溶液を０℃で添加し、混合物を室温で一晩攪拌した。完了した後、反応混合物を氷水で失活させ、生成物を酢酸エチル（３×５０ｍＬ）で抽出し、組み合わせた有機層を水及び塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をｃｏｍｂｉｆｌａｓｈ（シリカゲル、シクロヘキサン中の１０～７０％酢酸エチル）により精製して、ｔｅｒｔ－ブチルＮ－[３－エチルスルホニル－６－（トリフルオロメチル）イミダゾ[１，２－ａ]ピリジン－２－イル]カルバメートを白色の固体として得た。ＬＣＭＳ（方法２）：Ｒ_t＝１．５１分間、 m/z ＝３９２（ $M-H$ ）－。

10

【０３１６】

ステップＣ－１：エチル６－[[ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－[３－エチルスルホニル－６－（トリフルオロメチル）イミダゾ[１，２－ａ]ピリジン－２－イル]アミノ]メチル]－２，２－ジフルオロ－１，３－ベンゾジオキソール－５－カルボキシレート（中間体Ⅰ－１４）の調製

【化５６】



(I-14)

20

ｔｅｒｔ－ブチルＮ－[３－エチルスルホニル－６－（トリフルオロメチル）イミダゾ[１，２－ａ]ピリジン－２－イル]カルバメート（上記のとおり調製した中間体Ⅰ－１２）（０．３ｇ、０．７２４ｍｍｏｌ）のアセトニトリル（１０ｍＬ）中の溶液に、エチル６－（ブロモメチル）－２，２－ジフルオロ－１，３－ベンゾジオキソール－５－カルボキシレート（上記のとおり調製した中間体Ⅰ－６）（０．２９５ｇ、０．８６９ｍｍｏｌ）及び炭酸セシウム（０．４７２ｇ、１．４４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。反応混合物を５０℃で３時間加熱し、次いで、水で希釈し、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を水で２回洗浄し、次いで、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をｃｏｍｂｉｆｌａｓｈ（シリカゲル、シクロヘキサン中の１０～５０％酢酸エチル）により精製して、エチル６－[[ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－[３－エチルスルホニル－６－（トリフルオロメチル）イミダゾ[１，２－ａ]ピリジン－２－イル]アミノ]メチル]－２，２－ジフルオロ－１，３－ベンゾジオキソール－５－カルボキシレートをガムとして得た。ＬＣＭＳ（方法１）：Ｒ_t＝１．３４分間、 m/z ＝６５８．４１（ $M+N$ ）＋。

30

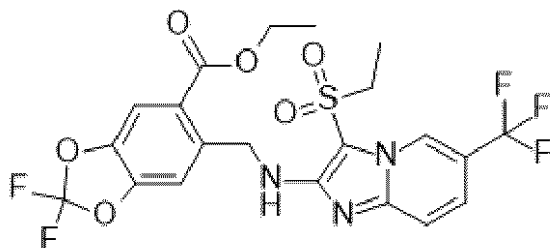
40

【０３１７】

ステップＣ－２：エチル６－[[[３－エチルスルホニル－６－（トリフルオロメチル）イミダゾ[１，２－ａ]ピリジン－２－イル]アミノ]メチル]－２，２－ジフルオロ－１，３－ベンゾジオキソール－５－カルボキシレート（中間体Ⅰ－１５）の調製

50

【化 5 7】



(I-15)

10

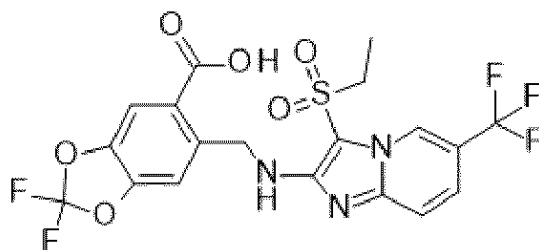
エチル 6-[[tert-ブトキシカルボニル-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボキシレート(上記のとおり調製した中間体 I-14)(0.431g、0.6442mmol)のトリフルオロ酢酸(3mL、38.6mmol)中の溶液を室温で3時間攪拌した。完了した後、反応塊を重炭酸ナトリウム水溶液で中和した。水性層を酢酸エチル(2回)で抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮してエチル 6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボキシレートを得た。粗生成物を、そのまま次のステップに用いた。LCMS(方法1): $R_t = 1.25$ 分間、 $m/z = 536$ (M+H)+。

20

【0318】

ステップ C-3: 6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボン酸(中間体 I-16)の調製

【化 5 8】



(I-16)

30

エチル 6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボキシレート(上記のとおり調製した中間体 I-15)(0.3g、0.532mmol)のテトラヒドロフラン(6mL)中の溶液に、水酸化リチウム一水和物(0.094g、2.129mmol)の水(2mL)中の溶液を10℃で添加した。反応混合物を室温で12時間攪拌した。完了した後、反応塊を減圧中で濃縮し、1N塩酸水溶液で酸性化し、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を水(2回)、続いて、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボン酸を得た。粗生成物を、そのまま次のステップに用いた。LCMS(方法1): $R_t = 1.13$ 分間、 $m/z = 508$ (M+H)+。

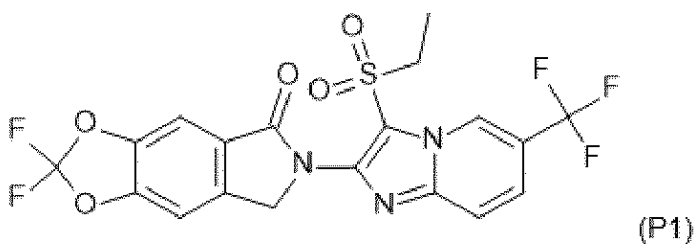
40

【0319】

ステップ C-4: 6-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ

50

〔４，５－ｆ〕 イソインドール－７－オン（化合物 Ｐ１）の調製
〔化５９〕



10

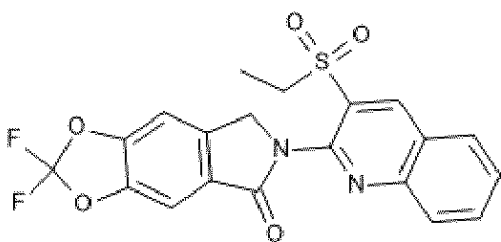
6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン-２-イル]アミノ]メチル]-２，２-ジフルオロ-１，３-ベンゾジオキソール-５-カルボン酸（上記のとおり調製した中間体Ⅰ-１６）（０．３９ｇ、０．７３０２mmol）のピリジン（２mL）中の０℃に冷却した溶液に、オキシ塩化リン（０．１３７５mL、１．４６０mmol）を添加した。混合物を室温とし、窒素雰囲気下で２時間攪拌した。反応塊を２N塩酸水溶液（１５mL）で酸性化し、生成物を酢酸エチル（２×３０mL）で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をcombiflash（シリカゲル、シクロヘキサン中の５０％酢酸エチル）により精製して、6-[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン-２-イル]-２，２-ジフルオロ-５H-〔１，３〕ジオキソロ〔４，５－ｆ〕イソインドール-７-オンを白色の固体として得た。LCMS（方法１）：R_t=１．１３分間、m/z=４９０（M+H）⁺。¹H NMR（４００MHz，CDCl₃）δ ppm：１．５５（t，３H），３．８９（q，２H），５．１０（s，２H），７．２９（s，１H），７．６２（s，１H），７．６８（dd，１H），７．８２（d，１H），９．２７（s，１H）。

20

〔０３２０〕

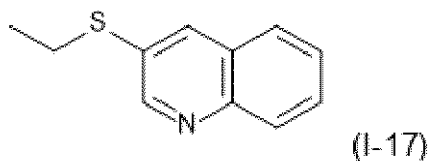
実施例 Ｐ２： 6-（３-エチルスルホニル-２-キノリル）-２，２-ジフルオロ-５H-〔１，３〕ジオキソロ〔４，５－ｆ〕イソインドール-７-オン（化合物 Ｐ２）の調製
〔化６０〕

30



ステップ－１： ３-エチルスルファニルキノリン（中間体Ⅰ-１７）の調製
〔化６１〕

40



窒素で１０分間脱気した３-ブロモキノリン（５．２ｇ、２５mmol）のトルエン（５２mL）中の溶液に、ソジオチオエタン（２．５ｇ、３０mmol）、N，N-ジイソプロピルエチルアミン（１５mL、８７mmol）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（１．５ｇ、１．６mmol）及び４，５-ビス（ジフェニルホスフィノ）-９，９-ジメチルキサンテン（１．６ｇ、２．７mmol）を添加した。反応混

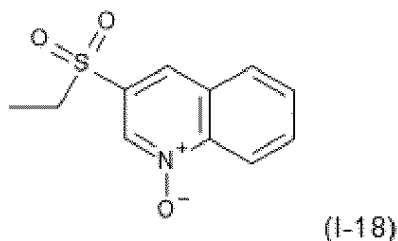
50

合物を再度、窒素でさらに５分間脱気し、次いで、１００℃で３時間加熱し、さらに８０℃で一晩加熱した。反応塊を水で失活させ、生成物を酢酸エチル（２回）で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗化合物を *combiflash*（シリカゲル、シクロヘキサン中の０～１５％酢酸エチル）により精製して、３－エチルスルファニルキノリンを油として得た。ＬＣＭＳ（方法１）：Ｒｔ＝１．０３分間、 $m/z = 190$ （ $M+H$ ）⁺。

【０３２１】

ステップ－２：３－エチルスルホニル－１－オキシド－キノリン－１－イウム（中間体Ⅰ－１８）の調製

【化６２】

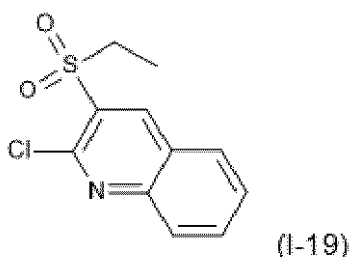


３－エチルスルファニルキノリン（上記のとおり調製した中間体Ⅰ－１７）（２．８ｇ、１５ｍｍｏｌ）のジクロロメタン（４０ｍＬ）中の溶液に、３－クロロ過安息香酸（１２ｇ、４７ｍｍｏｌ、７０質量％）を添加し、反応塊を室温で一晩攪拌した。反応塊を水で希釈し、次いで、飽和重炭酸ナトリウム溶液で塩基性化した。水性相をジクロロメタン（３×５０ｍＬ）で抽出し、組み合わせた有機層を塩水（３０ｍＬ）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を *combiflash*（シリカゲル、シクロヘキサン中の４０％酢酸エチル）により精製して３－エチルスルホニル－１－オキシド－キノリン－１－イウムを得た。ＬＣＭＳ（方法１）：Ｒｔ＝０．５５分間、 $m/z = 238$ （ $M+H$ ）⁺。

【０３２２】

ステップ－３：２－クロロ－３－エチルスルホニル－キノリン（中間体Ⅰ－１９）の調製

【化６３】

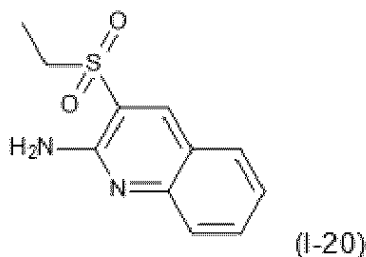


０℃に冷却した３－エチルスルホニル－１－オキシド－キノリン－１－イウム（上記のとおり調製した中間体Ⅰ－１８）（２．５９ｇ、１０．９３ｍｍｏｌ）に、塩化ホスホリル（２５．９３ｍＬ）を窒素雰囲気下で滴下した。反応混合物を室温に温め、窒素雰囲気下で２時間攪拌した。反応混合物を氷冷水に注ぎ入れ、生成物を酢酸エチル（３×６０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を *combiflash*（シリカゲル、シクロヘキサン中の０～４０％酢酸エチル）により精製して２－クロロ－３－エチルスルホニル－キノリンを得た。ＬＣＭＳ（方法１）：Ｒｔ＝１．０１分間、 $m/z = 256 / 258$ （ $M+H$ ）⁺。

【０３２３】

ステップ－４：３－エチルスルホニルキノリン－２－アミン（中間体Ⅰ－２０）の調製

【化 6 4】



2-クロロ-3-エチルスルホニルキノリン（上記のとおり調製した中間体 I-19）（2 g、7.82 mmol）のテトラヒドロフラン（12 mL）中の溶液に、E y e l a 容器中において、硫酸銅（II）（0.249 g、1.56 mmol）、銅（0.099 g、1.56 mmol）及び水酸化アンモニウム（13.71 g、117.3 mmol）を室温で添加した。E y e l a 容器を閉じ、混合物を 105℃で6時間攪拌した。完了してから、装置を室温に冷却し、圧力を注意深く開放した。反応塊を水で希釈し、生成物を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h（シリカゲル、シクロヘキサン中の50%酢酸エチル）により精製して、3-エチルスルホニルキノリン-2-アミンを固体として得た。LCMS（方法2）：Rt=0.48分間、m/z=237（M+H）⁺。

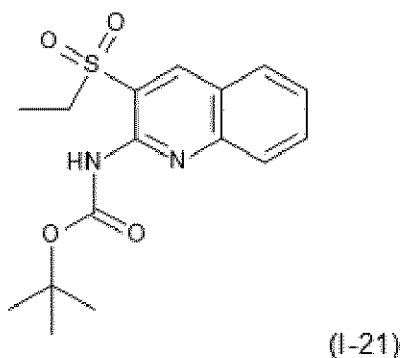
10

20

【0324】

ステップ-5：tert-ブチル N-（3-エチルスルホニル-2-キノリル）カルバメート（中間体 I-21）の調製

【化 6 5】



30

3-エチルスルホニルキノリン-2-アミン（上記のとおり調製した中間体 I-20）（1.20 g、5.08 mmol）の N,N-ジメチルホルムアミド（20 mL）中の溶液に、0℃で、水素化ナトリウム（0.467 g、11.7 mmol、60質量%）を添加した。0℃で30分間攪拌した後、tert-ブトキシカルボニル tert-ブチルカーボネート（1.33 g、6.09 mmol）の N,N-ジメチルホルムアミド（0.5 mL）中の溶液を0℃で添加した。反応混合物を室温に温め、3時間攪拌した。完了してから、反応塊を氷水で失活させ、生成物を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を c o m b i f l a s h（シリカゲル、シクロヘキサン中の40%酢酸エチル）により精製して、tert-ブチル N-（3-エチルスルホニル-2-キノリル）カルバメートを薄い黄色の固体として得た。LCMS（方法1）：Rt=1.06分間、m/z=281〔（M+H）⁺-56〕。

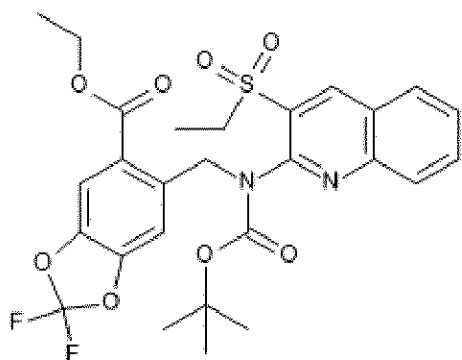
40

【0325】

ステップ-6：エチル 6-[[tert-ブトキシカルボニル-（3-エチルスルホニル-2-キノリル）アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール

50

－ 5 －カルボキシレート（中間体 I－22）の調製
【化 66】



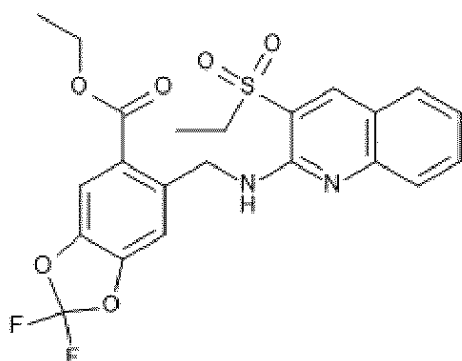
(I-22)

tert-ブチル N-（3-エチルスルホニル-2-キノリル）カルバメート（上記のとおり調製した中間体 I-21）（0.450 g、1.338 mmol）のアセトニトリル（20 mL）中の溶液に、エチル 6-（ブロモメチル）-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート（上記のとおり調製した中間体 I-6）（0.54 g、1.67 mmol）及び炭酸セシウム（0.65 g、2.00 mmol）を、窒素雰囲気下で添加した。混合物を 50℃で 3.5 時間加熱した。反応塊を水（50 mL）で希釈し、生成物を酢酸エチル（3×50 mL）で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、エチル 6-[[tert-ブトキシカルボニル-（3-エチルスルホニル-2-キノリル）アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレートをガムとして得た。粗生成物を、そのまま次のステップに用いた。LCMS（方法 1）：R_t=1.37 分間、m/z=479 [(M+H)⁺-100]。

【0326】

ステップ 7：エチル 6-[[（3-エチルスルホニル-2-キノリル）アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート（中間体 I-23）の調製

【化 67】



(I-23)

エチル 6-[[tert-ブトキシカルボニル-（3-エチルスルホニル-2-キノリル）アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート（上記のとおり調製した中間体 I-22）（0.855 g、1.48 mmol）のトリフルオロメチルベンゼン（10 mL）中の溶液に、トリフルオロ酢酸（1.79 mL、22.2 mmol）を 0℃で添加した。反応塊を室温で 10 時間攪拌した。完了した後、反応塊を減圧中で濃縮し、水（50 mL）で希釈し、重炭酸ナトリウム水溶液（30 mL）で失活させた。水性層を酢酸エチル（2×50 mL）で抽出し、組み合わせた有

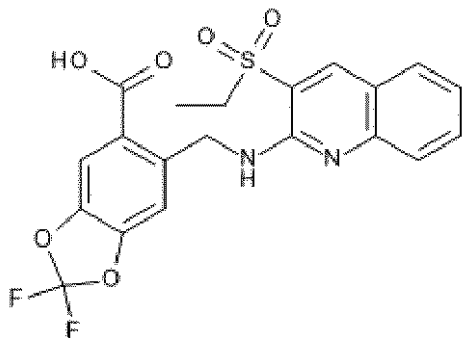
機層を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を *combiflash* (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0～30% 酢酸エチル) により精製して、エチル 6-[[(3-エチルスルホニル-2-キノリル) アミノ] メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサソール-5-カルボキシレート白色の固体として得た。LCMS (方法 1) : $R_t = 1.35$ 分間、 $m/z = 479$ ($M+H$)⁺。

【0327】

ステップ-8 : 6-[[(3-エチルスルホニル-2-キノリル) アミノ] メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサソール-5-カルボン酸 (中間体 I-24) の調製

10

【化 68】



(I-24)

20

エチル 6-[[(3-エチルスルホニル-2-キノリル) アミノ] メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサソール-5-カルボキシレート (上記のとおり調製した中間体 I-23) (0.49 g、1.024 mmol) のテトラヒドロフラン (10 mL) 中の溶液に、水酸化リチウム-水和物 (0.1809 g、4.096 mmol) の水 (3.5 mL) 中の溶液を室温で添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌した。追加の水酸化リチウム-水和物 (0.042 g、1.024 mmol) を添加し、攪拌をさらに 18 時間継続した。完了した後、反応塊を減圧中で濃縮し、1 N 塩酸水溶液で酸性化し、生成物を酢酸エチル (2×50 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を水 (50 mL)、続いて、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、6-[[(3-エチルスルホニル-2-キノリル) アミノ] メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサソール-5-カルボン酸をオフホワイトの固体として得た。粗生成物を、そのまま次のステップに用いた。LCMS (方法 1) : $R_t = 1.10$ 分間、 $m/z = 451$ ($M+H$)⁺。

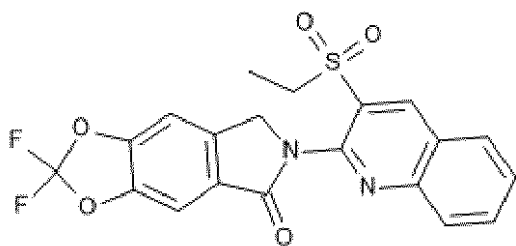
30

【0328】

ステップ-9 : 6-(3-エチルスルホニル-2-キノリル)-2, 2-ジフルオロ-5H-[1, 3]ジオキサロ[4, 5-f]イソインドール-7-オン (化合物 P2) の調製

40

【化 69】



(P2)

6-[[(3-エチルスルホニル-2-キノリル) アミノ] メチル]-2, 2-ジフル

50

オロ-1, 3-ベンゾジオキサール-5-カルボン酸（上記のとおり調製した中間体 I-24）（0.40 g、0.894 mmol）のピリジン（2 mL）中の溶液に、0℃で、オキシ塩化リン（0.168 mL、1.79 mmol）を添加した。反応混合物を、0～10℃で40分間、窒素雰囲気下で攪拌した。反応塊を氷冷水（60 mL）で失活させ、生成物を酢酸エチル（2×25 mL）で抽出した。組み合わせた有機層を塩水（30 mL）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗化合物を combiflash（シリカゲル、シクロヘキサン中の0～30%酢酸エチル）により精製して、6-（3-エチルスルホニル-2-キノリル）-2, 2-ジフルオロ-5H-[1, 3]ジオキサロ[4, 5-f]イソインドール-7-オンを白色の固体として得た。LCMS（方法1）：Rt=1.07分間、m/z=433（M+H）⁺。¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）δ ppm: 1.38（t, 3H）, 3.55（q, 2H）, 5.09（s, 2H）, 7.25（s, 1H）, 7.60（s, 1H）, 7.78（td, 1H）, 7.96（ddd, 1H）, 8.09（d, 1H）, 8.14（d, 1H）, 9.02（s, 1H）。

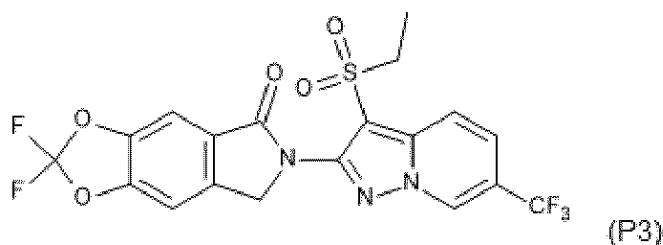
10

【0329】

実施例 P3：6-〔3-エチルスルホニル-6-（トリフルオロメチル）ピラゾロ〔1, 5-a〕ピリジン-2-イル〕-2, 2-ジフルオロ-5H-[1, 3]ジオキサロ[4, 5-f]イソインドール-7-オン（化合物 P3）の調製

【化70】

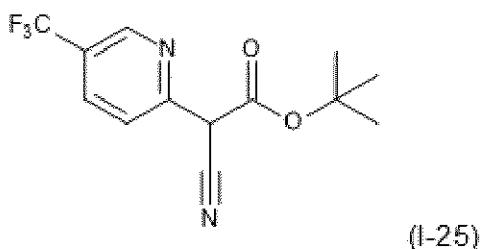
20



ステップ-1：tert-ブチル 2-シアノ-2-〔5-（トリフルオロメチル）-2-ピリジル〕アセテート（中間体 I-25）の調製

【化71】

30



2-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン（10.0 g、55.1 mmol）のジメチルスルホキシド（50 mL）中の攪拌溶液に、炭酸カリウム（11.4 g、82.6 mmol）、続いて、tert-ブチル 2-シアノアセテート（9.33 g、66.1 mmol）を室温で添加した。反応塊を100℃で5時間攪拌した。完了した後、反応塊を氷冷水で失活させ、10分間攪拌した。形成した沈殿物をブフナー漏斗でろ過し、n-ペンタンで洗浄し、減圧中で乾燥させて、tert-ブチル 2-シアノ-2-〔5-（トリフルオロメチル）-2-ピリジル〕アセテートを黄色の固体として得た。LCMS（方法1）：Rt=1.09分間、m/z=285（M-H）⁻。

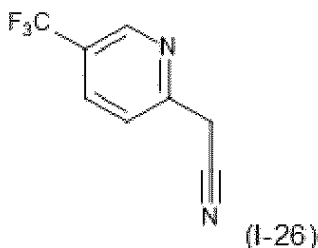
40

【0330】

ステップ-2：2-〔5-（トリフルオロメチル）-2-ピリジル〕アセトニトリル（中間体 I-26）の調製

50

【化 7 2】



tert-ブチル 2-シアノ-2-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル] アセテート (上記のとおり調製した中間体 I-25) (10.00 g、34.94 mmol) のアセトニトリル (100 mL) 中の攪拌溶液に、4-メチルベンゼンスルホン酸 (3.04 g、17.47 mmol) を室温で添加した。反応塊を 87℃ で 1 時間攪拌した。混合物を氷冷水 (100 mL) で失活させ、生成物を酢酸エチル (2×100 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗化合物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 20% 酢酸エチル) により精製して、2-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル] アセトニトリルを黄色の結晶として得た。LCMS (方法 1) : Rt = 1.00 分間、m/z = 187 (M+H)⁺。

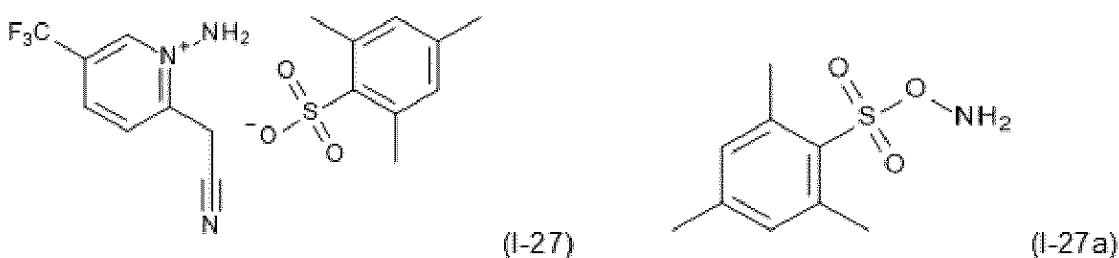
10

【0331】

20

ステップ 3 : 2-[1-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-1-イウム-2-イル] アセトニトリル ; 2, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホネート (中間体 I-27) の調製

【化 7 3】



30

エチル N-(メシチルスルホニル) オキシアセトイミデート (5.0 g、17.52 mmol) の 1, 4-ジオキサン (15 mL) 中の溶液に、0℃ で、過塩素酸 (2.147 mL、21.34 mmol) を滴下し、反応混合物を 0℃ で 30 分間攪拌した。氷冷水を反応塊に添加し、次いで、これをジクロロメタン (2×25 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過して、アミノ 2, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホネート (I-27a) の溶液を得た。この新たに調製したアミノ 2, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホネート (I-27a) のジクロロメタン (50 mL) 中の溶液に、2-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル] アセトニトリル (上記のとおり調製した中間体 I-26) (2.17 g、11.66 mmol) を室温で滴下した。反応塊を室温で 16 時間攪拌した。完了した後、混合物を、2-[1-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-1-イウム-2-イル] アセトニトリル ; 2, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホネートのジクロロメタン中の溶液として、そのまま次のステップに用いた。LCMS (方法 1) : Rt = 0.99 分間、m/z = 202 (M)⁺。

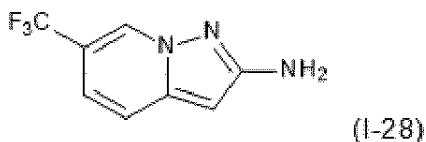
40

【0332】

ステップ 4 : 6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-アミン (中間体 I-28) の調製

50

【化 7 4】



2-〔1-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-1-イウム-2-イル〕アセトニトリル；2，4，6-トリメチルベンゼンスルホネート（上記のとおり調製した中間体 I-27）（7 g、17.44 mmol）のジクロロメタン（50 mL）中の攪拌溶液に、メタノール（35 mL）及び炭酸カリウム（4.820 g、34.88 mmol）を室温で添加した。反応塊を室温で4時間攪拌し、次いで、氷冷水で失活させ、有機層を分離した。水性層を酢酸エチル（2×80 mL）で抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗化合物を combiflash（シリカゲル、シクロヘキサン中の0～30%酢酸エチル）により精製して、6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ〔1，5-a〕ピリジン-2-アミンを固体として得た。LCMS（方法1）：Rt=0.97分間、m/z=202 (M+H)⁺。

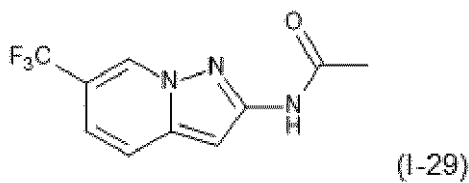
10

【0333】

ステップ5：N-〔6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ〔1，5-a〕ピリジン-2-イル〕アセトアミド（中間体 I-29）の調製

【化 7 5】

20



6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ〔1，5-a〕ピリジン-2-アミン（上記のとおり調製した中間体 I-28）（2.58 g、12.83 mmol）のピリジン（25 mL）中の溶液に、0℃で、塩化アセチル（1.86 mL、25.65 mmol）を滴下し、反応混合物を0～10℃で1時間、窒素雰囲気下に攪拌した。反応塊を水及び酢酸エチルで希釈し、次いで、有機層を分離した。水性層を酢酸エチル（2×50 mL）で抽出し、組み合わせた有機層を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗化合物を combiflash（シリカゲル、シクロヘキサン中の0～40%酢酸エチル）により精製してN-〔6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ〔1，5-a〕ピリジン-2-イル〕アセトアミドを得た。LCMS（方法1）：Rt=0.99分間、m/z=244 (M+H)⁺。

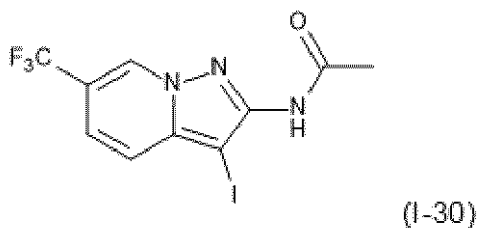
30

【0334】

ステップ6：N-〔3-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ〔1，5-a〕ピリジン-2-イル〕アセトアミド（中間体 I-30）の調製

【化 7 6】

40



N-〔6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ〔1，5-a〕ピリジン-2-イル〕アセトアミド（上記のとおり調製した中間体 I-29）（2.63 g、10.83 mmol）

50

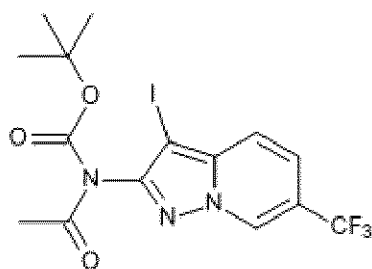
のアセトニトリル（26.3 mL）中の溶液に、1-ヨードピロリジン-2,5-ジオン（2.92 g、12.99 mmol）を数回に分けて添加し、反応塊を室温で1.5時間撹拌した。完了した後、反応塊を水で希釈し、生成物を酢酸エチル（2回）で抽出した。組み合わせた有機層をチオ硫酸ナトリウム溶液、続いて、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、N-[3-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]アセトアミドを固体として得た。粗生成物を、そのまま次のステップに用いた。LCMS（方法1）：R_t=1.01分間、m/z=370 (M+H)⁺。

【0335】

ステップ-7：tert-ブチルN-アセチル-N-[3-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]カルバメート（中間体I-31）の調製

10

【化77】



(I-31)

20

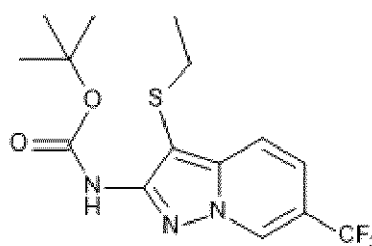
N-[3-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]アセトアミド（上記のとおり調製した中間体I-30）（3.77 g、10.23 mmol）のアセトニトリル（35 mL）中の溶液に、0℃で、4-ジメチルアミノピリジン（0.127 g、1.02 mmol）、続いて、ジ-tert-ブチルジカルボネート（2.76 g、12.27 mmol）を添加した。混合物を室温で2時間撹拌した。反応塊を減圧中で濃縮し、氷冷水で失活させ、生成物を酢酸エチル（3×50 mL）で抽出した。組み合わせた有機層を飽和重炭酸塩溶液の溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をcombiflash（シリカゲル、シクロヘキサン中の0~30%酢酸エチル）により精製して、tert-ブチルN-アセチル-N-[3-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]カルバメートを黄色の固体として得た。LCMS（方法1）：R_t=1.21分間、m/z=370 [(M+H)⁺-100]。

30

【0336】

ステップ-8：tert-ブチルN-[3-エチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]カルバメート（中間体I-32）の調製

【化78】



(I-32)

40

tert-ブチルN-アセチル-N-[3-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]カルバメート（上記のとおり調製した中間体I

50

ー 31) (4.41 g、9.40 mmol) の無水 1, 4-ジオキサン (40 mL) 中の溶液に、N-エチル-N-イソプロピル-プロパン-2-アミン (4.18 mL、24.44 mmol) 及び (5-ジフェニル-ホスファニル-9, 9-ジメチル-キサンテン-4-イル)-ジフェニル-ホスファン (0.435 g、0.752 mmol) を、室温で、窒素でパージしながら、5 分間かけて添加した。トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) (0.602 g、0.658 mmol) を添加し、溶液を窒素でさらに 5 分間脱気し、次いで、ソジオチオエタン (1.63 g、18.80 mmol) を窒素雰囲気下で添加し、反応混合物を 105 °C で 5 時間撹拌した。反応塊を酢酸エチルで希釈し、セライトでろ過し、残渣を酢酸エチルで洗浄した。ろ液を水、続いて、塩水で洗浄し、有機層を分離した。水性層を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗化合物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0~20% 酢酸エチル) により精製して、tert-ブチル N-[3-エチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリジン-2-イル]カルバメートをガムとして得た。LCMS (方法 1): Rt = 1.23 分間、m/z = 306 [(M+H)⁺ - 56]。

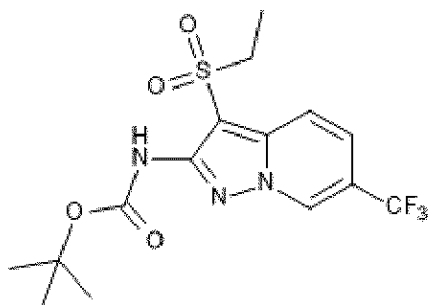
10

【0337】

ステップ-9: tert-ブチル N-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリジン-2-イル]カルバメート (中間体 I-33) の調製

20

【化 79】



(I-33)

30

tert-ブチル N-[3-エチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリジン-2-イル]カルバメート (上記のとおり調製した中間体 I-32) (3.21 g、8.88 mmol) のアセトニトリル (30 mL) 中の溶液に、0 °C で、3-クロロ過安息香酸 (4.82 g、19.5 mmol、70 質量%) を添加した。混合物を 0~10 °C で 1.5 時間撹拌した。反応塊を減圧中で濃縮した (水浴温度を 25 °C 未満に維持した)。残渣を水 (60 mL) で希釈し、2 N 水酸化ナトリウム水溶液で塩基性化した。水性相を酢酸エチル (2×50 mL) で抽出し、組み合わせた有機層を塩水 (60 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧中で濃縮した。粗化合物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0~30% 酢酸エチル) により精製して、tert-ブチル N-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリジン-2-イル]カルバメートをオフホワイトの固体として得た。粗生成物を、そのまま次のステップに用いた。LCMS (方法 1): Rt = 1.14 分間、m/z = 338 [(M+H)⁺ - 56]。

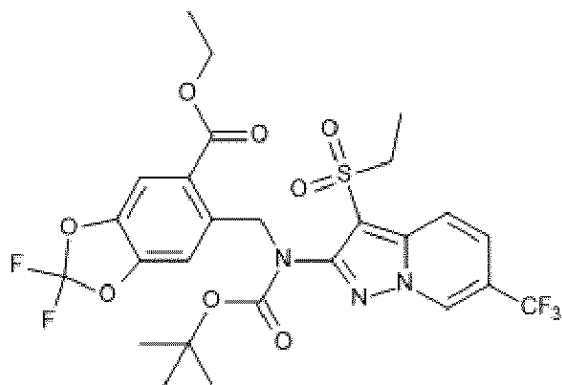
40

【0338】

ステップ-10: エチル 6-[[tert-ブトキシカルボニル-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1, 5-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサール-5-カルボキシレート (中間体 I-34) の調製

50

【化 8 0】



(I-34)

10

tert-ブチル N- [3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル] カルバメート (上記のとおり調製した中間体 I-33) (0.60 g、1.52 mmol) のアセトニトリル (10 mL) 中の溶液に、炭酸セシウム (0.746 g、2.28 mmol) 及びエチル 6-(ブromoメチル)-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート (上記のとおり調製した中間体 I-6) (0.616 g、1.90 mmol) を室温で添加した。混合物を 50 °C で 3.5 時間加熱し、次いで、氷冷水 (30 mL) で失活させ、生成物を酢酸エチル (3 × 50 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、エチル 6- [[tert-ブトキシカルボニル- [3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル] アミノ] メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレートをガムとして得た。LCMS (方法 2) : Rt = 1.66 分間、m/z = 536 [(M + H)⁺ - 100]。

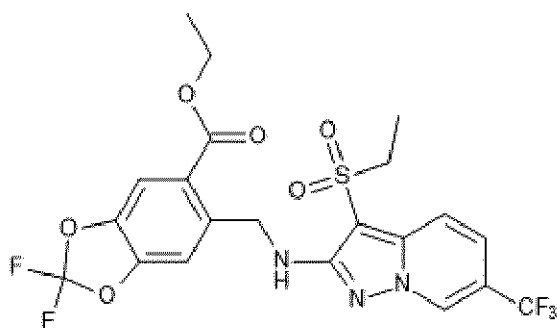
20

【0339】

ステップ 11 : エチル 6- [[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル] アミノ] メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート (中間体 I-35) の調製

30

【化 8 1】



(I-35)

40

エチル 6- [[tert-ブトキシカルボニル- [3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル] アミノ] メチル]-2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキソール-5-カルボキシレート (上記のとおり調製した中間体 I-34) (1.22 g、1.92 mmol) のトリフルオロメチルベンゼン (10 mL) 中の溶液に、0 °C で、トリフルオロ酢酸 (2.32 mL、28.8 mmol) を添加し、混合物を室温で 12 時間攪拌した。反応塊を減圧中で濃縮し、水 (50 mL) で希釈し、重炭酸ナトリウム水溶液 (20 mL) で中和した。水性層を酢酸エチル (2 × 50 mL) で抽出し、組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥さ

50

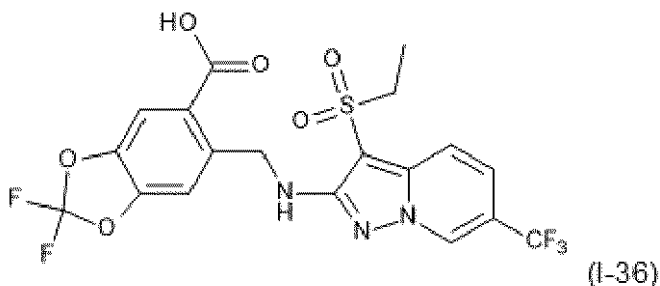
せ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を *combiflash* (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0～30% 酢酸エチル) により精製して、エチル 6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボキシレートを得た。LCMS (方法 1): $R_t = 1.22$ 分間、 $m/z = 536$ ($M+H$)⁺。

【0340】

ステップ-12: 6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボン酸 (中間体 I-36) の調製

10

【化 82】



20

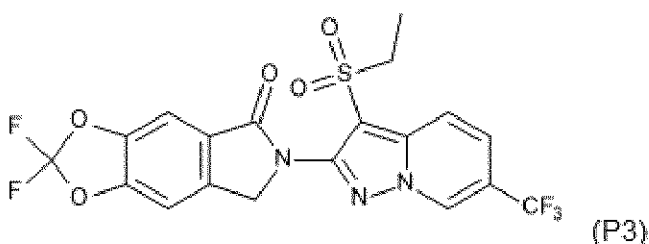
エチル 6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボキシレート (上記のとおり調製した中間体 I-35) (0.751 g、1.403 mmol) のテトラヒドロフラン (10 mL) 中の溶液に、水酸化リチウム-水和物 (0.123 g、2.80 mmol) の水 (3.5 mL) 中の溶液を、室温で一晩かけて添加した。追加の水酸化リチウム-水和物 (0.123 g、2.80 mmol) を添加し、攪拌を室温でさらに 6 時間継続した。完了した後、反応塊を減圧中で濃縮し、1 N 塩酸水溶液で酸性化し、生成物を酢酸エチル (2×30 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を水 (20 mL)、続いて、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を *combiflash* (シリカゲル、シクロヘキサン中の 80% 酢酸エチル) により精製して 6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボン酸を得た。LCMS (方法 1): $R_t = 1.10$ 分間、 $m/z = 508$ ($M+H$)⁺。

30

【0341】

ステップ-13: 6-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン (化合物 P3) の調製

【化 83】



40

6-[[[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル]アミノ]メチル]-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジ옥ソール-5-カルボン酸 (上記のとおり調製した中間体 I-36) (0.332 g、0.

50

654 mmol) のピリジン (1.66 mL) 中の溶液に、0 °C で、オキシ塩化リン (0.12 mL、1.309 mmol) を添加し、反応塊を 0 ~ 10 °C で 25 分間、窒素雰囲気下で攪拌した。混合物を氷冷水 (60 mL) で失活させ、生成物を酢酸エチル (3 × 25 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を塩水 (30 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を combiflash (シリカゲル、シクロヘキサン中の 0 ~ 30 % 酢酸エチル) により精製して、6- [3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ [1, 5-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1, 3]ジオキソロ [4, 5-f]イソインドール-7-オンをオフホワイトの固体として得た。LCMS (方法 1) : Rt = 1.23 分間、m/z = 490 (M+H) +。 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm : 1.43 (t, 3H), 3.66 (q, 2H), 5.01 (s, 2H), 7.24 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.83 (s, 1H) .

10

20

30

40

50

【0342】

【表 17】

表 P: 式(I)の化合物の例

No.	IUPAC 名	構造	LCMS			Mp (° C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (実測値)	方法	
P1	6-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.13	490	1	223-225
P2	6-(3-エチルスルホニル-2-キノリル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.07	433	1	150-153
P3	6-[3-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチル)ピラゾ[1,5-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.23	490	1	203-205
P4	6-(6-シクロプロピル-3-エチルスルホニル-ピラゾ[1,5-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.16	462	1	190-192
P5	6-[3-エチルスルホニル-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.19	490	3	240-242
P6	6-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾ[1,5-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.18	490	3	260-262
P7	6-[6-(1,1-ジフルオロエチル)-3-エチルスルホニル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.15	486	3	256-257

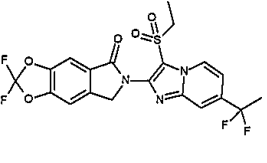
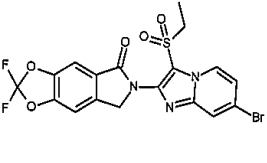
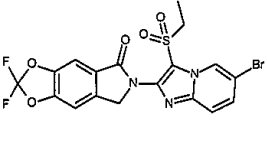
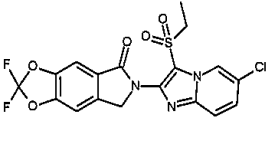
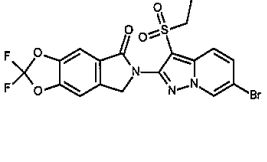
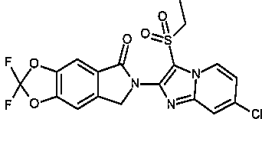
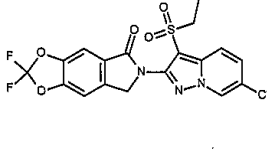
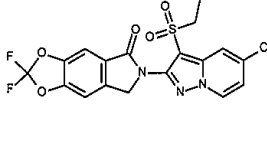
10

20

30

40

50

P8	6-[7-(1,1-ジフルオロエチル)-3-エチルスルホニル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.15	486	3	227 - 229
P9	6-(7-ブromo-3-エチルスルホニル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.17	500	3	262 - 264
P10	6-(6-ブromo-3-エチルスルホニル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.50	500	4	241 - 243
P11	6-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.07	456	1	228 - 230
P12	6-(6-ブromo-3-エチルスルホニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.10	500	1	
P13	6-(7-クロロ-3-エチルスルホニル-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.19	456	3	254 - 256
P14	6-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.50	456	4	175 - 177
P15	6-(5-クロロ-3-エチルスルホニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.07	456	1	238 - 240

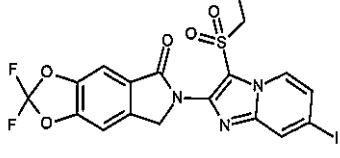
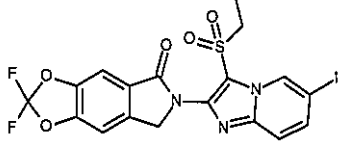
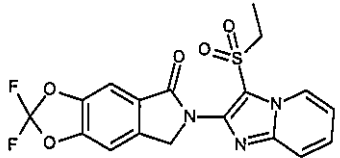
10

20

30

40

50

P16	6-(3-エチルスルホニル-7-ヨード-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.18	548	3	242 - 244
P17	6-(3-エチルスルホニル-6-ヨード-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.11	548	1	273 - 275
P18	6-(3-エチルスルホニルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-5H-[1,3]ジオキサソロ[4,5-f]イソインドール-7-オン		1.08	422	3	203 - 205

10

20

【0343】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的、殺ダニ的及び／又は殺菌・殺カビ的に有効な成分を加えることにより、相当な広範化、及び、流行している状況に対する適応が可能である。式Ⅰの化合物と、他の殺虫的、殺ダニ的及び／又は殺菌・殺カビ的有效成分との混合物はまた、より広い意味で、相乗的活性とも説明可能であるさらに意外な利点を有し得る。例えば、植物によるより優れた耐性、低い殺草性、異なる成長段階で昆虫を防除可能であること、又は、例えば粉碎若しくは混合の最中といったその製造の最中、その保管の最中若しくはその使用の最中におけるより良好な挙動である。

【0344】

ここで、有効成分に対する好適な添加物は、例えば、以下の分類の有効成分が代表的である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼虫ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイド及びバチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

30

【0345】

式Ⅰの化合物と有効成分との以下の混合物が好ましい（略記「TX」は、「本発明の表A-1～A-3、B-1～B-3、C-1～C-3、D-1～D-3、E-1～E-3、F-1～F-3、及び表Pに記載されている化合物からなる群から選択される1種の化合物」を意味する）：

40

石油（代替名）（628）から構成される物質群から選択される補助剤+TX；
 アバメクチン+TX、アセキノシル+TX、アセタミプリド+TX、アセトプロール+TX、
 アクリナトリン+TX、アシノナビル+TX、アフイドピロペン+TX、アフォキシ
 ラネル+TX、アラニカルブ+TX、アレトリン+TX、α-シベルメトリン+TX、アル
 ファメトリン+TX、アミドフルメト+TX、アミノカルブ+TX、アゾシクロチン+
 TX、ベンスルタップ+TX、ベンゾキシメート+TX、ベンズピリモキサン+TX、ベ
 ータシフルトリン+TX、ベータ-シベルメトリン+TX、ビフェナゼート+TX、ビフ
 エントリン+TX、ビナバクリル+TX、ビオアレトリン+TX、Sビオアレトリン+TX、
 ビオレスメトリン+TX、ビストリフルロン+TX、プロフラニリド+TX、プロフ
 ルトリネート+TX、プロモホス-エチル+TX、プロロフェジン+TX、プトカルボキ

50

シム+TX、カズサホス+TX、カルバリル+TX、カルボスルファン+TX、カルタ
ップ+TX、CAS番号：1632218-00-8+TX、CAS番号：180811
5-49-2+TX、CAS番号：2032403-97-5+TX、CAS番号：20
44701-44-0+TX、CAS番号：2128706-05-6+TX、CAS番
号：2095470-94-1+TX、CAS番号：2377084-09-6+TX、
CAS番号：1445683-71-5+TX、CAS番号：2408220-94-8
+TX、CAS番号：2408220-91-5+TX、CAS番号：1365070-
72-9+TX、CAS番号：2171099-09-3+TX、CAS番号：2396
747-83-2+TX、CAS番号：2133042-31-4+TX、CAS番号：
2133042-44-9+TX、CAS番号：1445684-82-1+TX、CA
S番号：1445684-82-1+TX、CAS番号：1922957-45-6+T
X、CAS番号：1922957-46-7+TX、CAS番号：1922957-47
-8+TX、CAS番号：1922957-48-9+TX、CAS番号：241570
6-16-8+TX、CAS番号：1594624-87-9+TX、CAS番号：15
94637-65-6+TX、CAS番号：1594626-19-3+TX、CAS番
号：1990457-52-7+TX、CAS番号：1990457-55-0+TX、
CAS番号：1990457-57-2+TX、CAS番号：1990457-77-6
+TX、CAS番号：1990457-66-3+TX、CAS番号：1990457-
85-6+TX、CAS番号：2220132-55-6+TX、CAS番号：1255
091-74-7+TX、CAS番号：RNA（コロラドハムシ（*Leptinotar
sa decemlineata*）-特異的組換え二本鎖干渉GS2）+TX、CAS番
号：2719848-60-7+TX、CAS番号：1956329-03-5+TX、
クロラントラニリプロール+TX、クロルダン+TX、クロルフェナピル+TX、クロロ
プラレトリン+TX、クロマフェノジド+TX、クレンピリン+TX、クロエトカルブ+
TX、クロチアニジン+TX、2-クロロフェニルNメチルカルバメート（CPMC）+
TX、シアノフェンホス+TX、シアントラニリプロール+TX、シクラニリプロール+
TX、シクロブトリフルラム+TX、シクロプロトリン+TX、シクロキサプリド+TX
、シエノピラフェン+TX、シエトピラフェン（又はエトピラフェン）+TX、シフルメ
トフェン+TX、シフルトリン+TX、シハロジアミド+TX、シハロトリン+TX、シ
ペルメトリン+TX、シフェノトリン+TX、シプロフラニリド+TX、シロマジン+T
X、デルタメトリン+TX、ジアフェンチウロン+TX、ジアリホス+TX、ジブロム+
TX、ジクロロメゾチアズ+TX、ジフロビダジン+TX、ジフルベンズロン+TX、ジ
ンプロピリダズ+TX、ジナクチン+TX、ジノカップ+TX、ジノテフラン+TX、ジ
オキサベンゾホス+TX、エマメクチン（又はエマメクチン安息香酸塩）+TX、エンペ
ントリン+TX、イブシロン-モンフルオロトリン+TX、イブシロン-メトフルトリン
+TX、エスフェンバレート+TX、エチオン+TX、エチプロール+TX、エトフェ
ンブロックス+TX、エトキサゾール+TX、ファミフル+TX、フェナザキン+TX
、フェンフルトリン+TX、フェンメゾジチアズ+TX、フェニトロチオン+TX、フェ
ノブカルブ+TX、フェノチオカルブ+TX、フェノキシカルブ+TX、フェンプロパト
リン+TX、フェンピロキシメート+TX、フェンスルホチオン+TX、フェンチオン+
TX、酢酸フェンチン+TX、フェンバレート+TX、フィプロニル+TX、フロメト
キン+TX、フロニカミド+TX、フルアクリピリム+TX、フルアザインドリジン+T
X、フルアズロン+TX、フルベンジアミド+TX、フルベンゾイミン+TX、フルクロ
ルジニリプロール+TX、フルシトリネート+TX、フルシクロクスロン+TX、フルシ
トリネート+TX、フルエンシルホン+TX、フルフェネリム+TX、フルフェンプロッ
クス+TX、フルフィプロール+TX、フルヘキサホン+TX、フルメトリン+TX、フル
オピラム+TX、フルペンチオフェノックス+TX、フルピラジフロン+TX、フルピ
リミン+TX、フルララネル+TX、フルバリネート+TX、フルキサメタミド+TX、
ホスチアゼート+TX、ガンマーシハロトリン+TX、グアジピル+TX、ハロフェノジ
ド+TX、ハルフェンプロックス+TX、ヘプタフルトリン+TX、ヘキシチアゾクス+

10

20

30

40

50

TX、ヒドラメチルノン+TX、イミシアホス+TX、イミダクロプリド+TX、イミブ
 ロトリン+TX、インダザピロキサメト+TX、インドキサカルブ+TX、ヨードメタン
 +TX、イブロジオン+TX、イソシクロセラム+TX、イソチオエート+TX、イベル
 メクチン+TX、カップービフェントリン+TX、カップーテフルトリン+TX、ラムダ
 ーシハロトリン+TX、レビメクチン+TX、ロチラネル+TX、ルフエヌロン+TX、
 メタフルミゾン+TX、メタアルデヒド+TX、メタム+TX、メトミル+TX、メトキ
 シフェノジド+TX、メトフルトリン+TX、メトルカルブ+TX、メキサカルベート+
 TX、ミルベメクチン+TX、モンフルオロトリン+TX、ニコロサミド+TX、ニコフ
 ルプロール+TX、ニテンピラム+TX、ニチアジン+TX、オメトエート+TX、オキ
 サミル+TX、オキサゾスルフィル+TX、パラチオンエチル+TX、ペルメトリン+TX
 X、フェノトリン+TX、ホスホカルブ+TX、ピペロニルブトキシド+TX、ピリミカ
 ルブ+TX、ピリミホスーエチル+TX、ピリミホスーメチル+TX、多角体ウイルス+
 TX、プラレトリン+TX、プロフェノホス+TX、プロフルトリン+TX、プロパルギ
 ット+TX、プロペタンホス+TX、プロボキスル+TX、プロチオホス+TX、プロト
 リフェンビュート+TX、ピフルブミド+TX、ピメトロジン+TX、ピラクロホス+TX
 X、ピラフルプロール+TX、ピリダベン+TX、ピリダリル+TX、ピリフルキナゾン
 +TX、ピリミジフェン+TX、ピリミノストロビン+TX、ピリプロール+TX、ピリ
 プロキシフェン+TX、レスメトリン+TX、サロラネル+TX、セラメクチン+TX、
 シラフルオフエン+TX、スピネトラム+TX、スピノサド+TX、スピロブディフェン
 +TX、スピロジクロフェン+TX、スピロメシフェン+TX、スピロピジオン+TX、
 スピロテトラマト+TX、スピドキサマト+TX、スルホキサフロール+TX、テブフェ
 ノジド+TX、テブフェンピラド+TX、テブピリミフォス+TX、テフルトリン+TX
 X、テメホス+TX、テトラクロラントラニリプロール+TX、テトラジホン+TX、テト
 ラメトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX、テトラナクチン+TX、テトラニリ
 プロール+TX、シーターシペルメトリン+TX、チアクロプリド+TX、チアメトキサ
 ム+TX、チオシクラム+TX、チオジカルブ+TX、チオフアノックス+TX、チオメ
 トン+TX、チオスルタップ+TX、チゴラネル+TX、チオールアントラニリプロール
 +TX、チオキサザフェン+TX、トルフェンピラド+TX、トキサフェン+TX、トラ
 ロメトリン+TX、トランスフルトリン+TX、トリアザメート+TX、トリアゾホス+
 TX、トリクロルホン+TX、トリクロロネート+TX、トリクロルホン+TX、トリフ
 ルエンフロナート+TX、トリフルメゾピリム+TX、チクロピラゾフロル+TX、ゼー
 ターシペルメトリン+TX、海藻抽出物及びメラッセ由来の発酵生成物+TX、海藻抽出
 物及び尿素を含むメラッセ由来の発酵生成物+TX、アミノ酸+TX、カリウム及びモリ
 ブデン及びEDTAキレート化マンガン+TX、海藻抽出物及び発酵植物生成物+TX、
 海藻抽出物及び植物ホルモンを含む発酵植物生成物+TX、ビタミン+TX、EDTAキ
 レート化銅+TX、亜鉛+TX、及び鉄+TX、アザジラクチン+TX、バチルス・アイ
 ザワイ (*Bacillus aizawai*) +TX、バチルス・キチノスポルス (*Ba
 cillus chitinosporus*) AQ746 (NRRL受入番号B-216
 18)+TX、バチルス・ファーマス (*Bacillus firmus*) +TX、バチ
 ルス・クルスタキ (*Bacillus kurstaki*) +TX、バチルス・マイコイ
 デス (*Bacillus mycoides*) AQ726 (NRRL受入番号B-216
 64)+TX、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*) (NRRL受
 入番号B-30087)+TX、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilu
 s*) AQ717 (NRRL受入番号B-21662)+TX、バチルス属の種 (*Bac
 illus sp.*) AQ178 (ATCC受入番号53522)+TX、バチルス属の種
 (*Bacillus sp.*) AQ175 (ATCC受入番号55608)+TX、バチ
 ルス属の種 (*Bacillus sp.*) AQ177 (ATCC受入番号55609)+
 TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) 不特定の+TX、
 バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ153 (ATCC受
 入番号55614)+TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtili*

10

20

30

40

50

s) AQ30002 (NRRL受入番号B-50421) +TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ30004 (NRRL受入番号B-50455) +TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ713 (NRRL受入番号B-21661) +TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ743 (NRRL受入番号B-21665) +TX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) AQ52 (NRRL受入番号B-21619) +TX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) BD#32 (NRRL受入番号B-21530) +TX、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspec. kurstaki*) BMP123+TX、ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) +TX、D-リモネン+TX、グラニューロウイルス+TX、ハーピン+TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体ウイルス+TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多角体ウイルス+TX、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) 核多角体ウイルス+TX、ヘリオチス・プンクチゲラ (*Heliothis punctigera*) 核多角体ウイルス+TX、メタリジウム属の種 (*Metarhizium spp.*) +TX、ムスコドル・アルプス (*Muscodora albus*) 620 (NRRL受入番号30547) +TX、ムスコドル・ロセウス (*Muscodora roseus*) A3-5 (NRRL受入番号30548) +TX、ニームツリー (*Neem tree*) 系生成物+TX、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) +TX、パエシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) +TX、パスツーリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) +TX、パスツーリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*) +TX、パスツーリア・ラモサ (*Pasteuria ramosa*) +TX、パスツーリア・ソルネイ (*Pasteuria thornei*) +TX、パスツーリア・ウスガエ (*Pasteuria usgae*) +TX、P-シメン+TX、コナガ (*Plutella xylostella*) グラニューロシスウイルス+TX、コナガ (*Plutella xylostella*) 核多角体ウイルス+TX、多角体ウイルス+TX、ピレトラム+TX、QRD420 (テルペノイドブレンド) +TX、QRD452 (テルペノイドブレンド) +TX、QRD460 (テルペノイドブレンド) +TX、キラヤ・サポナリア (*Quillaja saponaria*) +TX、ロドコッカス・グロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) AQ719 (NRRL受入番号B-21663) +TX、スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) 核多角体ウイルス+TX、ストレプトマイセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) (NRRL受入番号30232) +TX、ストレプトマイセス属の種 (*Streptomyces spp.*) (NRRL受入番号B-30145) +TX、テルペノイドブレンド+TX、及びベルチシリウム属の種 (*Verticillium spp.*) +TX；
 ベトキサジン [CCN] +TX、ジオクタン酸銅 (IUPAC名) (170) +TX、硫酸銅 (172) +TX、シプトリン [CCN] +TX、ジクロン (1052) +TX、ジクロロフェン (232) +TX、エンドタール (295) +TX、フェンチン (347) +TX、消石灰 [CCN] +TX、ナバム (566) +TX、キノクラミン (714) +TX、キノナミド (1379) +TX、シマジン (730) +TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) +TXからなる物質の群から選択される殺藻剤；
 アバメクチン (1) +TX、クルホメート (1011) +TX、シクロブトリフルラム+TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] +TX、エマメクチン (291) +TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) +TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] +TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] +TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] +TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] +TX、ピペラジン [CCN] +TX

、セラメクチン（代替名）[CCN] + TX、スピノサド（737）及びチオファネート（1435）+ TX からなる物質の群から選択される駆虫剤；

クロラロース（127）+ TX、エンドリン（1122）+ TX、フェンチオン（346）+ TX、ピリジン-4-アミン（IUPAC名）（23）及びストリキニン（745）+ TX からなる物質の群から選択される殺鳥剤；

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン（IUPAC名）（1222）+ TX、4-（キノキサリン-2-イルアミノ）ベンゼンスルホンアミド（IUPAC名）（748）+ TX、8-ヒドロキシキノリンスルフェート（446）+ TX、プロノポール（97）+ TX、ジオクタン酸銅（IUPAC名）（170）+ TX、水酸化銅（IUPAC名）（169）+ TX、クレゾール [CCN] + TX、ジクロロフェン（232）+ TX、ジピリチオン（1105）+ TX、ドジシン（1112）+ TX、フェナミノスルフ（1144）+ TX、ホルムアルデヒド（404）+ TX、ヒドラルガフェン（代替名）[CCN] + TX、カスガマイシン（483）+ TX、塩酸カスガマイシン水和物（483）+ TX、ニッケルビス（ジメチルジチオカルバメート）（IUPAC名）（1308）+ TX、ニトラピリン（580）+ TX、オクチリノン（590）+ TX、オキシリン酸（606）+ TX、オキシテトラサイクリン（611）+ TX、カリウムヒドロキシキノリンスルフェート（446）+ TX、プロベナゾール（658）+ TX、ストレプトマイシン（744）+ TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン（744）+ TX、テクロフタラム（766）+ TX、及びチオメルサル（代替名）[CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺菌剤；

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) GV（代替名）（12）+ TX、アグロバクテリウム・ラジオブクター (*Agrobacterium radiobacter*)（代替名）（13）+ TX、アムブリセイウス属の種 (*Amblyseius* spp.)（代替名）（19）+ TX、アナグラファ・ファルシフェラ (*Anagrapta falcifera*) NPV（代替名）（28）+ TX、アングルス・アトムス (*Anagrus atomus*)（代替名）（29）+ TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*)（代替名）（33）+ TX、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*)（代替名）（34）+ TX、ショクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*)（代替名）（35）+ TX、アウトグラファ・カリフォルニカ (*Autographa californica*) NPV（代替名）（38）+ TX、バチルス・ファーマス (*Bacillus firmus*)（代替名）（48）+ TX、バチルス・スフェリカス・ネイデ (*Bacillus sphaericus Neide*)（学名）（49）+ TX、バチルス・チューリングンシス・ベルリナー (*Bacillus thuringiensis Berliner*)（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*)（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングンシス亜種イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*)（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングンシス亜種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*)（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*)（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*)（学名）（51）+ TX、ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)（代替名）（53）+ TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (*Beauveria brongniartii*)（代替名）（54）+ TX、クリソペラ・カルネア (*Chrysoperla carnea*)（代替名）（151）+ TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*)（代替名）（178）+ TX、コドリंगा (*Cydia pomonella*) GV（代替名）（191）+ TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa*

10

20

30

40

50

sibirica) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabdus bacteriophora*) 及び H. メギディス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフス・カリギノス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、マメストラ・ブラッシカエ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィクス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリツム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンティ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) + TX、オリウス属の種 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチキャブシド核多核体病ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナーネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・カルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・グラッセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラビス (*Steinernema riobravense*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ属の種 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラムマ属の種 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及びバーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤；ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及びメチルブロミド (537) + TX からなる物質の群から選択される土壌滅菌剤；アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘンパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘンパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] 及びウレデパ (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される化学滅菌剤；(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテート及び (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール

10

20

30

40

50

(IUPAC名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (438) + TX、(Z) - イコサ - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (IUPAC名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オール及び4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC名) (544) + TX、アルファ - ムルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、ブレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルア (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、キュールア (代替名) (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、4 - メチルオクタン酸エチル (IUPAC名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、Gossypure (登録商標) (代替名; ヘキサデカ - 7, 11 - ジエン - 1 - イル - アセテート) の (Z, E) 及び (Z, Z) 異性体の 1 : 1 混合物 (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (589) + TX、オルフラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタルア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₁ (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₂ (代替名) (839) + TX、トリメドルア C (代替名) (839) 及びトランク - コール (trunc - call) (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン;

2 - (オクチルチオ) エタノール (IUPAC名) (591) + TX、ブトピロノキシル (933) + TX、ブトキシ (ポリプロピレングリコール) (936) + TX、アジピン酸ジブチル (IUPAC名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル (1047) + TX、コハク酸ジブチル (IUPAC名) (1048) + TX、ジエチルトルアミド [CCN] + TX、ジメチルカルベート [CCN] + TX、フタル酸ジメチル [CCN] + TX、エチルヘキサンジオール (1137) + TX、ヘキサアミド [CCN] + TX、メトキン - ブチル (1276) + TX、メチルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート

10

20

30

40

50

〔CCN〕及びピカリジン〔CCN〕+TXからなる物質の群から選択される昆虫忌避剤；

ビス（トリブチルスズ）オキシド（IUPAC名）（913）+TX、ブromoアセトアミド〔CCN〕+TX、ヒ酸カルシウム〔CCN〕+TX、クロエトカルブ（999）+TX、アセト亜ヒ酸銅〔CCN〕+TX、硫酸銅（172）+TX、フェンチン（347）+TX、リン酸第二鉄（IUPAC名）（352）+TX、メタアルデヒド（518）+TX、メチオカルブ（530）+TX、ニクロサミド（576）+TX、ニクロサミドオールアミン（576）+TX、ペンタクロロフェノール（623）+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド（623）+TX、タジムカルブ（1412）+TX、チオジカルブ（799）+TX、酸化トリブチルスズ（913）+TX、トリフェンモルフ（1454）+TX、トリメタカルブ（840）+TX、酢酸トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）及び水酸化トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）+TX、ピリプロール〔394730-71-3〕+TXからなる物質の群から選択される殺軟体動物剤；

AKD-3088（化合物コード）+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン（IUPAC／ケミカルアブストラクツ名）（1045）+TX、1,2-ジクロロプロパン（IUPAC／ケミカルアブストラクツ名）（1062）+TX、1,2-ジクロロプロパン及び1,3-ジクロロプロペン（IUPAC名）（1063）+TX、1,3-ジクロロプロペン（233）+TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド（IUPAC／ケミカルアブストラクツ名）（1065）+TX、3-（4-クロロフェニル）-5-メチルローダニン（IUPAC名）（980）+TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸（IUPAC名）（1286）+TX、6-イソペンテニルアミノプリン（代替名）（210）+TX、アバメクチン（1）+TX、アセトプロール〔CCN〕+TX、アラニカルブ（15）+TX、アルジカルブ（16）+TX、アルドキシカルブ（863）+TX、AZ60541（化合物コード）+TX、ベンクロチアズ〔CCN〕+TX、ベノミル（62）+TX、ブチルピリダベン（代替名）+TX、カズサホス（109）+TX、カルボフラン（118）+TX、二硫化炭素（945）+TX、カルボスルファン（119）+TX、クロロピクリン（141）+TX、クロルピリホス（145）+TX、クロエトカルブ（999）+TX、シクロブトリフルラム+TX、サイトカイニン（代替名）（210）+TX、ダゾメット（216）+TX、DBCP（1045）+TX、DCIP（218）+TX、ジアミダホス（1044）+TX、ジクロフェンチオン（1051）+TX、ジクリホス（代替名）+TX、ジメトエート（262）+TX、ドラメクチン（代替名）〔CCN〕+TX、エマメクチン（291）+TX、エマメクチン安息香酸塩（291）+TX、エプリノメクチン（代替名）〔CCN〕+TX、エトプロホス（312）+TX、二臭化エチレン（316）+TX、フェナミホス（326）+TX、フェンピラド（代替名）+TX、フェンスルホチオン（1158）+TX、ホスチアゼート（408）+TX、ホスチエタン（1196）+TX、フルフラール（代替名）〔CCN〕+TX、GY-81（開発コード）（423）+TX、ヘテロホス〔CCN〕+TX、ヨードメタン（IUPAC名）（542）+TX、イサミドホス（1230）+TX、イサゾホス（1231）+TX、イベルメクチン（代替名）〔CCN〕+TX、キネチン（代替名）（210）+TX、メカルホン（1258）+TX、メタム（519）+TX、メタム-カリウム（代替名）（519）+TX、メタム-ナトリウム（519）+TX、臭化メチル（537）+TX、メチルイソチオシアネート（543）+TX、ミルベマイシンオキシム（代替名）〔CCN〕+TX、モキシデクチン（代替名）〔CCN〕+TX、クワ暗斑病菌（*Myrothecium verrucaria*）組成物（代替名）（565）+TX、NC-184（化合物コード）+TX、オキサミル（602）+TX、ホレート（636）+TX、ホスファミドン（639）+TX、ホスホカルブ〔CCN〕+TX、セブホス（代替名）+TX、セラメクチン（代替名）〔CCN〕+TX、スピノサド（737）+TX、テルバム（代替名）+TX、テルブホス（773）+TX、テトラクロロチオフェン（IUPAC／

10

20

30

40

50

ケミカルアブストラクツ名) (1422) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノール [CCN] + TX、YI-5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [318290-98-1] + TX、フルオピラム + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤；

エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX からなる物質の群から選択される硝化阻害剤；

アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル (6) + TX、プロベナゾール (658) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤；

2-イソバレリルインダン-1, 3-ジオン (IUPAC名) (1246) + TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC名) (748) + TX、アルファークロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、アンツ- (880) + TX、三酸化二ヒ素 (882) + TX、炭酸バリウム (891) + TX、ビスチオセミ (912) + TX、プロディファコウム (89) + TX、プロマジオロン (アルファ-プロマジオロンを含む) + TX、プロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、クロラロース (127) + TX、クロロファシノン (140) + TX、コレカルシフェロール (代替名) (850) + TX、クマクロール (1004) + TX、クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (1009) + TX、ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジファシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン (357) + TX、フルオロアセトアミド (379) + TX、フルプロパダイン (1183) + TX、フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、ガンマ-HCH (430) + TX、HCH (430) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、リンダン (430) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) + TX、臭化メチル (537) + TX、ノルボルミド (1318) + TX、ホサセチム (1336) + TX、ホスフィン (IUPAC名) (640) + TX、リン [CCN] + TX、ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリヌロン (1371) + TX、シリロシド (1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム (735) + TX、ストリキニーネ (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン (851) 及びリン化亜鉛 (640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤；

2-(2-ブトキシエトキシ) エチルピペロニレート (IUPAC名) (934) + TX、5-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン (IUPAC名) (903) + TX、ファルネソール及びネロリドール (代替名) (324) + TX、MB-599 (開発コード) (498) + TX、MGK264 (開発コード) (296) + TX、ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタル (1343) + TX、プロピル異性体 (1358) + TX、S421 (開発コード) (724) + TX、セサメクス (1393) + TX、セサモリン (1394) 及びスルホキシド (1406) + TX からなる物質の群から選択される共力剤；

アントラキノ (32) + TX、クロラロース (127) + TX、ナフテン酸銅 [CCN] + TX、オキシ塩化銅 (171) + TX、ジアジノン (227) + TX、ジシクロペンタジエン (化学名) (1069) + TX、グアザチン (422) + TX、酢酸グアザチン (422) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ピリジン-4-アミン (IUPAC名) (23) + TX、チラム (804) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、ナフテン酸亜鉛 [CCN] 及びジラム (856) + TX からなる物質の群から選択される動物忌避剤；

イマニン (代替名) [CCN] 及びリバピリン (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺ウイルス剤；

10

20

30

40

50

酸化第二水銀（５１２）＋ＴＸ、オクチリノン（５９０）及びチオファネートーメチル（８０２）＋ＴＸからなる物質の群から選択される創傷保護剤；

１，１－ビス（４－クロロフェニル）－２－エトキシエタノール＋ＴＸ、２，４－ジクロロフェニルベンゼンスルホネート＋ＴＸ、２－フルオロ－Ｎ－メチル－Ｎ－１－ナフチルアセトアミド＋ＴＸ、４－クロロフェニルフェニルスルホン＋ＴＸ、アセトプロール＋ＴＸ、アルドキシカルブ＋ＴＸ、アミジチオン＋ＴＸ、アミドチオエート＋ＴＸ、アミトン＋ＴＸ、シュウ酸水素アミトン＋ＴＸ、アミトラズ＋ＴＸ、アラマイト＋ＴＸ、酸化第一ヒ素＋ＴＸ、アゾベンゼン＋ＴＸ、アゾトエート＋ＴＸ、ベノミル＋ＴＸ、ベノキサホス＋ＴＸ、ベンジルベンゾエート＋ＴＸ、ビキサフェン＋ＴＸ、プロフェンバレレート＋ＴＸ、プロモ－シクレン＋ＴＸ、プロモホス＋ＴＸ、プロモプロピレート＋ＴＸ、ブプロフェジン＋ＴＸ、ブトカルボキシム＋ＴＸ、ブトキシカルボキシム＋ＴＸ、ブチルピリダベン＋ＴＸ、多硫化カルシウム＋ＴＸ、カンフェクロール＋ＴＸ、カルバノレート＋ＴＸ、カルボフェノチオン＋ＴＸ、シミアゾール＋ＴＸ、チノ－メチオナート＋ＴＸ、クロルベンシド＋ＴＸ、クロルジメホルム＋ＴＸ、クロルジメホルムヒドロクロリド＋ＴＸ、クロルフェネトール＋ＴＸ、クロルフェンソン＋ＴＸ、クロロフェンスルフィド＋ＴＸ、クロロベンジラート＋ＴＸ、クロロメブホルム＋ＴＸ、クロロメチウロン＋ＴＸ、クロロプロピレート＋ＴＸ、クロルチオホス＋ＴＸ、シネリンⅠ＋ＴＸ、シネリンⅡ＋ＴＸ、シネリンⅢ＋ＴＸ、クロサンテル＋ＴＸ、クマホス＋ＴＸ、クロタミトン＋ＴＸ、クロトキシホス＋ＴＸ、クフラエブ＋ＴＸ、シアントエート＋ＴＸ、ＤＣＰＭ＋ＴＸ、ＤＤＴ＋ＴＸ、デメフィオン＋ＴＸ、デメフィオン－Ｏ＋ＴＸ、デメフィオン－Ｓ＋ＴＸ、デメトン－メチル＋ＴＸ、デメトン－Ｏ＋ＴＸ、デメトン－Ｏ－メチル＋ＴＸ、デメトン－Ｓ＋ＴＸ、デメトン－Ｓ－メチル＋ＴＸ、デメトン－Ｓ－メチルスルホン＋ＴＸ、ジクロフルアニド＋ＴＸ、ジクロルボス＋ＴＸ、ジクリホス＋ＴＸ、ジエノクロル＋ＴＸ、ジメホクス＋ＴＸ、ジネクス＋ＴＸ、ジネクス－ジクレキシム＋ＴＸ、ジノカップ－４＋ＴＸ、ジノカップ－６＋ＴＸ、ジノクトン＋ＴＸ、ジノペントン＋ＴＸ、ジノスルホン＋ＴＸ、ジノテルボン＋ＴＸ、ジオキサチオン＋ＴＸ、ジフェニルスルホン＋ＴＸ、ジスルフィラム＋ＴＸ、ＤＮＯＣ＋ＴＸ、ドフェナピン＋ＴＸ、ドラメクチン＋ＴＸ、エンドチオン＋ＴＸ、エピリノメクチン＋ＴＸ、エトエート－メチル＋ＴＸ、エトリムホス＋ＴＸ、フェナザフロル＋ＴＸ、酸化フェンブタスズ＋ＴＸ、フェノチオカルブ＋ＴＸ、フェンピラド＋ＴＸ、フェン－ピロキシメート＋ＴＸ、フェンピラザミン＋ＴＸ、フェンソン＋ＴＸ、フェントリファニル＋ＴＸ、フルベンジミン＋ＴＸ、フルシクロクスロン＋ＴＸ、フルエネチル＋ＴＸ、フルオルベンシド＋ＴＸ、ＦＭＣ １１３７＋ＴＸ、ホルメタネート＋ＴＸ、ホルメタネートヒドロクロリド＋ＴＸ、ホルムパラネート＋ＴＸ、ガンマー－ＨＣＨ＋ＴＸ、グリオジン＋ＴＸ、ハルフェンブロックス＋ＴＸ、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート＋ＴＸ、イソカルボホス＋ＴＸ、ジャスモリンⅠ＋ＴＸ、ジャスモリンⅡ＋ＴＸ、ジョドフェンホス＋ＴＸ、リンダン＋ＴＸ、マロノベン＋ＴＸ、メカルバム＋ＴＸ、メホスフォラン＋ＴＸ、メスルフェン＋ＴＸ、メタクリホス＋ＴＸ、臭化メチル＋ＴＸ、メトルカルブ＋ＴＸ、メキサカルベート＋ＴＸ、ミルベマイシンオキシム＋ＴＸ、ミパホクス＋ＴＸ、モノクロトホス＋ＴＸ、モルホチオン＋ＴＸ、モキシデクチン＋ＴＸ、ナレド＋ＴＸ、４－クロロ－２－（２－クロロ－２－メチル－プロピル）－５－〔（６－ヨード－３－ピリジル）メトキシ〕ピリダジン－３－オン＋ＴＸ、ニフルリジド＋ＴＸ、ニッコマイシン＋ＴＸ、ニトリラカルブ＋ＴＸ、ニトリラカルブ１：１塩化亜鉛錯体＋ＴＸ、オメトエート＋ＴＸ、オキシデプロホス＋ＴＸ、オキシジスルホトン＋ＴＸ、ｐｐ’－ＤＤＴ＋ＴＸ、パラチオン＋ＴＸ、ペルメトリン＋ＴＸ、フェンカプトン＋ＴＸ、ホサロン＋ＴＸ、ホスホラン＋ＴＸ、ホスファミドン＋ＴＸ、ポリクロロテルペン＋ＴＸ、ポリナクチン＋ＴＸ、プロクロノール＋ＴＸ、プロマシル＋ＴＸ、プロボキスル＋ＴＸ、プロチダチオン＋ＴＸ、プロトエート＋ＴＸ、ピレトリンⅠ＋ＴＸ、ピレトリンⅡ＋ＴＸ、ピレトリンⅢ＋ＴＸ、ピリダフェンチオン＋ＴＸ、ピリミデート＋ＴＸ、キナルホス＋ＴＸ、キンチオホス＋ＴＸ、Ｒ－１４９２＋ＴＸ、ホスグリシン＋ＴＸ、ロテノン＋ＴＸ、シュラダン＋ＴＸ、セブホス＋ＴＸ、セラメクチン＋ＴＸ、ソファミド＋ＴＸ、ＳＳＩ－

10

20

30

40

50

1 2 1 + T X、スルフィラム + T X、スルフラミド + T X、スルホテブ + T X、硫黄 + T X、ジフロビダジン + T X、タウフルバリネート + T X、TEPP + T X、テルバム + T X、テトラジホン + T X、テトラスル + T X、チアフェノックス + T X、チオカルボキシム + T X、チオフアノックス + T X、チオメトン + T X、チオキノックス + T X、ツリンギエンシン + T X、トリアミホス + T X、トリアラテン + T X、トリアゾホス + T X、トリアズロン + T X、トリフェノホス + T X、トリナクチン + T X、バミドチオン + T X、バニリプロール + T X、ベトキサジン + T X、ニオクタノン酸銅 + T X、硫酸銅 + T X、シブトリン + T X、ジクロン + T X、ジクロロフェン + T X、エンドタール + T X、フェンチン + T X、消石灰 + T X、ナバム + T X、キノクラミン + T X、キノンアミド + T X、シマジン + T X、酢酸トリフェニルスズ + T X、水酸化トリフェニルスズ + T X、クルホメート + T X、ピペラジン + T X、チオフアネート + T X、クロラロース + T X、フェンチオン + T X、ピリジン-4-アミン + T X、ストリキニン + T X、1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン + T X、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド + T X、8-硫酸ヒドロキシキノリン + T X、プロノポール + T X、水酸化銅 + T X、クレゾール + T X、ジピリチオン + T X、ドジチン + T X、フェナミノスルフ + T X、ホルムアルデヒド + T X、ヒドラルガフェン + T X、カスガマイシン + T X、カスガマイシンヒドロクロリド水和物 + T X、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート) + T X、ニトラピリン + T X、オクチリノン + T X、オキシリン酸 + T X、オキシテトラサイクリン + T X、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム + T X、プロベナゾール + T X、ストレプトマイシン + T X、ストレプトマイシンセスキスルフェート + T X、テクロフタラム + T X、チオメルサル + T X、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) GV + T X、アグロバクテリウム・ラジオブクター (*Agrobacterium radiobacter*) + T X、アムブリセイウス属の種 (*Amblyseius spp.*) + T X、アナグラファ・ファルシフェラ (*Anagrapta fallcifer*) NPV + T X、アングルス・アトムス (*Anagrus atomus*) + T X、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) + T X、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*) + T X、ショクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*) + T X、オートグラファ・カリフォルニカ (*Autographa californica*) NPV + T X、バチルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus* Neide) + T X、ベアウベリア・ブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) + T X、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) + T X、ツマアカオオヒメテントウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) + T X、コドリガ (*Cydia pomonella*) GV + T X、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) + T X、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) + T X、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) + T X、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) + T X、ヘテロルハブジチス・バクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) 及び H. メギジス (*H. megidis*) + T X、ヒポダミア・コンベルゲンス (*Hippodamia convergens*) + T X、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) + T X、マクロロフス・カリギノス (*Macrolophus caliginosus*) + T X、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV + T X、メタフィクス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) + T X、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリヅム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) + T X、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) + T X、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンティ (*N. lecontei*) NPV + T X、ヒメハナカメムシ属の種 (*Orius spp.*) + T X、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paeecilomyces fumosoroseus*) + T X、チリカブリダニ (*Phyto*

10

20

30

40

50

seiulus persimilis) + TX、ステイネルネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) + TX、ステイネルネマカルボ・カプサエ (*Steinernema carpocapsae*) + TX、ステイネルネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) + TX、ステイネルネマ・グラセリ (*Steinernema glaseri*) + TX、ステイネルネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) + TX、ステイネルネマ・リオブラビス (*Steinernema riobravis*) + TX、ステイネルネマ・スカプテリスキ (*Steinernema scapterisci*) + TX、ステイネルネマ属の種 (*Steinernema spp.*) + TX、トリコグラマ属の種 (*Trichogramma spp.*) + TX、チフロドロムス・オクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) + TX、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) + TX、アホレート + TX、ビスジル + TX、ブスルファン + TX、ジマチフ + TX、ヘメル + TX、ヘムパ + TX、メテパ + TX、メチオテパ + TX、メチルアホレート + TX、モルジド + TX、ペンフルロン + TX、テパ + TX、チオヘムパ + TX、チオテパ + TX、トレタミン + TX、ウレデパ + TX、(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートと (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - イコサ - 13 - エン - 10 - オン + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン + TX、4 - メチルノナン - 5 - オール及び 4 - メチルノナン - 5 - オン + TX、アルファームルチストリアチン + TX、ブレビコミン + TX、コドレルレ + TX、コドレモン + TX、クエルレ + TX、ジスパールア + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、ドミニカルア + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート + TX、オイゲノール + TX、フロンタリン + TX、グランドルア + TX、グランドルア I + TX、グランドルア II + TX、グランドルア III + TX、グランドルア IV + TX、ヘキサルア + TX、イプスジェノール + TX、イプセノール + TX、ジャボニルア + TX、リネアチン + TX、リトルア + TX、ルーブルア + TX、メドルア + TX、メガトモ酸 + TX、メチルオイゲノール + TX、ムスカルア + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オルフラルア + TX、オリクタールア + TX、オストラモン + TX、シグルア + TX、ソルジジン + TX、スルカトール + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート + TX、トリメドルア + TX、トリメドルア A + TX、トリメドルア B₁ + TX、トリメドルア B₂ + TX、トリメドルア C + TX、トランクーコール (*trunc-call*) + TX、2 - (オクチルチオ) - エタノール + TX、ブタピロノキシル + TX、プトキシ (ポリプロピレングリコール) + TX、ジブチルアジペート + TX、フタル酸ジブチル + TX、ジブチルコハク酸塩 + TX、ジエチルトルアミド + TX、ジメチルカルベート + TX、ジメチルフタレート + TX、エチルヘキサンジオール + TX、ヘキサミド + TX、メトキン - ブチル + TX、メチルネオデカンアミド + TX、オキサメート + TX、ピカリジン + TX、1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) - エタン + TX、1, 2 - ジクロロプロパンと 1, 3 - ジクロロプロペン + TX、1 - ブロモ - 2 - クロロエタン + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) 酢酸エチル + TX、2

10

20

30

40

50

, 2-ジクロロビニル 2-エチルスルフィニルエチルメチルリン酸塩+TX、2-(1,
 3-ジチオラン-2-イル)フェニルジメチルカルバメート+TX、2-(2-ブトキシ
 エトキシ)エチルチオシアネート+TX、2-(4,5-ジメチル-1,3-ジオキサラン
 -2-イル)フェニルメチルカルバメート+TX、2-(4-クロロ-3,5-キシリ
 ルオキシ)エタノール+TX、2-クロロビニルジエチルホスフェート+TX、2-イミ
 ダゾリドン+TX、2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン+TX、2-メチル(プ
 ロプ-2-イニル)アミノフェニルメチルカルバメート+TX、2-チオシアナトエチル
 ラウレート+TX、3-ブromo-1-クロロプロプ-1-エン+TX、3-メチル-1-
 フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバメート+TX、4-メチル(プロプ-2-
 イニル)アミノ-3,5-キシリルメチルカルバメート+TX、5,5-ジメチル-3-
 オキソシクロヘキサ-1-エニルジメチルカルバメート+TX、アセチオン+TX、アク
 リロニトリル+TX、アルドリン+TX、アロサミジン+TX、アリキシカルブ+TX、
 α-エクジソン+TX、リン化アルミニウム+TX、アミノカルブ+TX、アナバシン+
 TX、アチダチオン+TX、アザメチホス+TX、バチルス・チューリングエンシス(*B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s*)
 デルタエンドトキシシン+TX、バリウムヘ
 キサフルオロシリケート+TX、バリウムポリスルフィド+TX、バルトリン+TX、バ
 イエル22/190+TX、バイエル22408+TX、ベーターシフルトリン+TX、
 ベーターシペルメトリン+TX、バイオエタノメトリン+TX、ビオパーメトリン+TX
 、ビス(2-クロロエチル)エーテル+TX、ホウ砂+TX、プロムフェンビンホス+T
 X、ブromo-DDT+TX、ブフェンカルブ+TX、ブタカルブ+TX、ブタチオホス+
 TX、ブトネート+TX、ヒ酸カルシウム+TX、シアン化カルシウム+TX、二硫化炭
 素+TX、四塩化炭素+TX、カルタップヒドロクロリド+TX、セバジン+TX、クロ
 ルビシクレン+TX、クロルダン+TX、クロルデコン+TX、クロロホルム+TX、ク
 ロルピクリン+TX、クロルホキシム+TX、クロルプラゾホス+TX、c i s-レスメ
 トリン+TX、シスメトリン+TX、クロシトリン+TX、アセト亜ヒ酸銅+TX、ヒ酸
 銅+TX、オレイン酸銅+TX、クミトエート+TX、氷晶石+TX、C S 7 0 8 +TX
 、シアノフェンホス+TX、シアノホス+TX、シクレトリン+TX、シチオエート+T
 X、d-テトラメトリン+TX、D A E P +TX、ダゾメット+TX、デカルボフラン+
 TX、ジアミダホス+TX、ジカプトン+TX、ジクロロフェンチオン+TX、ジクレシ
 ル+TX、ジシクラニル+TX、ディルドリン+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-
 3-イルホスフェート+TX、ジロール+TX、ジメフルトリン+TX、ジメタン+TX
 、ジメトリン+TX、ジメチルビンホス+TX、ジメチラン+TX、ジノプロプ+TX、
 ジノサム+TX、ジノセブ+TX、ジオフェノラン+TX、ジオキサベンゾホス+TX、
 ジチクロホス+TX、D S P +TX、エクジステロン+TX、E I 1 6 4 2 +TX、E
 M P C +TX、E P B P +TX、エタホス+TX、エチオフエンカルブ+TX、ギ酸エチ
 ル+TX、エチレンジブロミド+TX、ジクロロエタン+TX、エチレンオキシド+TX
 、E X D +TX、フェンクロルホス+TX、フェネタカルブ+TX、フェニトロチオン+
 TX、フェノキサクリム+TX、フェンピリトリン+TX、フェンスルホチオン+TX、
 フェンチオン-エチル+TX、フルコフロン+TX、ホスメチラン+TX、ホスピレート
 +TX、ホスチエタン+TX、フラチオカルブ+TX、フレトリン+TX、グアザチン+
 TX、酢酸グアザチン+TX、ナトリウムテトラチオカルボネート+TX、ハルフェンブ
 ロックス+TX、H C H +TX、H E O D +TX、ヘプタクロール+TX、ヘテロホス+
 TX、H H D N +TX、シアン化水素+TX、ヒキンカルブ+TX、I P S P +TX、イ
 サゾホス+TX、イソベンザン+TX、イソドリル+TX、イソフェンホス+TX、イソ
 ラン+TX、イソプロチオラン+TX、イソキサチオン+TX、幼虫ホルモンI+TX、
 幼虫ホルモンII+TX、幼虫ホルモンIII+TX、ケレバン+TX、キノブレン+T
 X、ヒ酸鉛+TX、レプトホス+TX、リリムホス+TX、リチダチオン+TX、m-ク
 メニルメチルカルバメート+TX、リン化マグネシウム+TX、マジドクス+TX、メカ
 ルホン+TX、メナゾン+TX、塩化第一水銀+TX、メスルフェンホス+TX、メタム
 +TX、メタム-カリウム+TX、メタム-ナトリウム+TX、メタンフッ化スルホニル

10

20

30

40

50

+TX、メトクロトホス+TX、メトブレン+TX、メトトリン+TX、メトキシクロル
 +TX、メチルイソチオシアネート+TX、メチルクロロホルム+TX、塩化メチレン+
 TX、メトキサジアゾン+TX、ミレックス+TX、ナフトロホス+TX、ナフタレン+
 TX、NC-170+TX、ニコチン+TX、ニコチンスルフェート+TX、ニチアジン
 +TX、ノルニコチン+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチル
 ホスホノチオエート+TX、O, O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロ
 メン-7-イルホスホロチオエート+TX、O, O-ジエチルO-6-メチル-2-プロ
 ピルピリミジン-4-イルホスホロチオエート+TX、O, O, O', O'-テトラプロピ
 ルジチオピロホスフェート+TX、オレイン酸+TX、パラ-ジクロロベンゼン+TX、
 パラチオン-メチル+TX、ペンタクロロフェノール+TX、ラウリン酸ペンタクロロフ
 ェニル+TX、PH60-38+TX、フェンカプトン+TX、ホスニクロル+TX、ホ
 スフィン+TX、ホキシム-メチル+TX、ピリメタホス+TX、ポリクロロジシクロペ
 ンタジエン異性体+TX、亜ヒ酸カリウム+TX、カリウムチオシアネート+TX、プレ
 コセンI+TX、プレコセンII+TX、プレコセンIII+TX、ピリミドホス+TX
 、プロフルトリン+TX、プロメカルブ+TX、プロチオホス+TX、ピラゾホス+TX
 、ピレスメトリン+TX、カシヤ+TX、キナルホス-メチル+TX、キノチオン+T
 X、ラホキサニド+TX、レスメスリン+TX、ロテノン+TX、カデトリン+TX、リ
 アニア+TX、リアノジン+TX、サバジラ+TX、シュラダン+TX、セブホス+TX
 、SI-0009+TX、チアプロニル+TX、亜ヒ酸ナトリウム+TX、シアン化ナト
 リウム+TX、フッ化ナトリウム+TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム+TX、ペン
 タクロロフェノキシドナトリウム塩+TX、セレン酸ナトリウム+TX、チオシアン酸ナ
 トリウム+TX、スルコフロノ+TX、スルコフロノ-ナトリウム+TX、フッ化スルフ
 リル+TX、スルプロホス+TX、タール油+TX、タジムカルブ+TX、TDE+TX
 、テブピリムホス+TX、テメホス+TX、テラレスリン+TX、テトラクロロエタン+
 TX、チクロホス+TX、チオシクラム+TX、チオシクラム水素オキサレート+TX、
 チオナジン+TX、チオスルタップ+TX、チオスルタップ-ナトリウム+TX、トラロ
 メトリン+TX、トランスパーメトリン+TX、トリアザメート+TX、トリクロルメタ
 ホス-3+TX、トリクロロナト+TX、トリメタカルブ+TX、トルプロカルブ+TX
 、トリクロピリカルブ+TX、トリブレン+TX、ベラトリジン+TX、ベラトリン+T
 X、XMC+TX、ゼータメトリン+TX、亜鉛ホスフィド+TX、ゾラプロホス+TX
 、メペルフルトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX、ビス(トリブチルスズ)オ
 キシド+TX、プロモアセタミド+TX、リン酸第二鉄+TX、ニクロスアミド-オラミ
 ン+TX、酸化トリブチルスズ+TX、ピリモルフ+TX、トリフェンモルフ+TX、1
 , 2-ジプロモ-3-クロロプロパン+TX、1, 3-ジクロロプロペン+TX、3, 4
 -ジクロロテトラヒドロチオフエン1, 1-ジオキシド+TX、3-(4-クロロフェニ
 ル)-5-メチルローダニン+TX、5-メチル-6-チオキソ-1, 3, 5-チアジ
 アナン-3-イル酢酸+TX、6-イソペンテニルアミノプリン+TX、2-フルオロ-
 N-(3-メトキシフェニル)-9H-プリン-6-アミン+TX、ベンクロチアズ+T
 X、サイトカイニン+TX、DCIP+TX、ルフラール+TX、イサミドホス+TX、
 カイネチン+TX、ミロテシウム・ベルカリア (*Myrothecium verruc*
aria) 組成物+TX、テトラクロロチオフエン+TX、キシレノルス+TX、ゼアチ
 ン+TX、エチルキサントゲン酸カリウム+TX、アシベンゾラル+TX、アシベンゾ
 ル-S-メチル+TX、オオイタドリ (*Reynoutria sachalinens*
is) 抽出物+TX、アルファ-クロロヒドリン+TX、アンツ+TX、炭酸バリウム+
 TX、ビスチオセミ+TX、ブロジファクム+TX、ブロマジオリオン+TX、ブロメタリ
 ン+TX、クロロファシノン+TX、コレカルシフェロール+TX、クマクロール+TX
 、クマフリル+TX、クマテトラリル+TX、クリミジン+TX、ジフェナクム+TX、
 ジフェチアロン+TX、ジファシノン+TX、エルゴカルシフェロール+TX、フロクマ
 フェン+TX、フルオロアセタミド+TX、フルプロパジン+TX、フルプロパジンヒド
 ロクロリド+TX、ノルボルミド+TX、ホスアセチム+TX、リン+TX、ピンドン+

10

20

30

40

50

TX、ピリヌロン+TX、シリロシド+TX、一フルオロ酢酸ナトリウム+TX、硫酸タ
 リウム+TX、ワルファリン+TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エチルピペロニレー
 ト+TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ
 -2-エノン+TX、ファルネソール及びネロリドール+TX、ベルブチン+TX、MG
 K264+TX、ピペロニルブトキシド+TX、ピプロタル+TX、プロピル異性体+
 TX、S421+TX、セサメックス+TX、セサスモリン+TX、スルホキシド+TX
 、アントラキノン+TX、ナフテン酸銅+TX、オキシ塩化銅+TX、ジシクロペンタジ
 エン+TX、チラム+TX、ナフテン酸亜鉛+TX、ジラム+TX、イマニン+TX、リ
 バビリン+TX、クロロインコナジド+TX、酸化水銀(II)+TX、チオファネート
 -メチル+TX、アザコナゾール+TX、ビテルタノール+TX、ブロムコナゾール+TX
 X、シプロコナゾール+TX、ジフェノコナゾール+TX、ジニコナゾール+TX、エポ
 キシコナゾール+TX、フェンブコナゾール+TX、フルキンコナゾール+TX、フルシ
 ラゾール+TX、フルトリアホル+TX、フラメトピル+TX、ヘキサコナゾール+TX
 X、イマザリル+TX、イミベンコナゾール+TX、イブコナゾール+TX、メトコナゾ
 ール+TX、ミクロブタニル+TX、パクロブトラゾール+TX、ペフラゾエート+TX
 、ペンコナゾール+TX、プロチオコナゾール+TX、ピリフェノックス+TX、プロク
 ロラズ+TX、プロピコナゾール+TX、ピリソキサゾール+TX、シメコナゾール+TX
 X、テブコナゾール+TX、テトラコナゾール+TX、トリアジメホン+TX、トリアジ
 メノール+TX、トリフルミゾール+TX、トリチコナゾール+TX、アンシミドール+
 TX、フェナリモル+TX、ヌアリモル+TX、ブピリメート+TX、ジメチリモール+
 TX、エチリモール+TX、ドデモルフ+TX、フェンプロピジン+TX、フェンプロピ
 モルフ+TX、スピロキサミン+TX、トリデモルフ+TX、シプロジニル+TX、メパ
 ニピリム+TX、ピリメタニル+TX、フェンピクロニル+TX、フルジオキソニル+TX
 X、ベナラキシル+TX、フララキシル+TX、-メタラキシル-+TX、Rメタラキシ
 ル+TX、オフレース+TX、オキサジキシル+TX、カルベンダジム+TX、デバカル
 ブ+TX、フベリダゾール-+TX、チアベンダゾール+TX、クロゾリネート+TX、
 ジクロゾリン+TX、ミクロゾリン-+TX、プロシミドン+TX、ピンクロゾリン+TX
 X、ボスカリド+TX、カルボキシン+TX、フェンフラム+TX、フルトラニル+TX
 、メプロニル+TX、オキシカルボキシン+TX、ペンチオピラド+TX、チフルザミド
 +TX、ドジン+TX、イミノクタジン+TX、アゾキシストロビン+TX、ジモキシス
 トロビン+TX、エネストロブリン+TX、フェナミンストロビン+TX、フルフェノキ
 シストロビン+TX、フルオキサストロビン+TX、クレソキシム-メチル+TX、メト
 ミノストロビン+TX、トリフロキシストロビン+TX、オリザストロビン+TX、ピコ
 キシストロビン+TX、ピラクロストロビン+TX、ピラメトストロビン+TX、ピラオ
 キシストロビン+TX、フェルバム+TX、マンコゼブ+TX、マンネブ+TX、メチラ
 ム+TX、プロピネブ+TX、ジネブ+TX、カプタホール+TX、キャプタン+TX、
 フルオロイミド+TX、ホルベット+TX、トリルフルアニド+TX、ボルドー液+TX
 、酸化銅+TX、マンカップ-+TX、オキシ-銅+TX、ニトロタル-イソプロピル
 +TX、エディフェンホス+TX、イプロベンホス+TX、ホスジフェン+TX、トルコ
 ホス-メチル+TX、アニラジン+TX、ペンチアバリカルブ+TX、ブラストサイジン
 -S+TX、クロロネブ+TX、クロロタロニル+TX、シフルフェナミド+TX、シモ
 キサニル+TX、ジクロシメット+TX、ジクロメジン+TX、ジクロラン+TX、ジエ
 トフェンカルブ+TX、ジメトモルフ-+TX、フルモルフ+TX、ジチアノン+TX、
 エタボキサム+TX、エトリジアゾール+TX、ファモキサドン+TX、フェンアミドン
 +TX、フェノキサニル+TX、フェリムゾン+TX、フルアジナム+TX、フルオピコ
 リド+TX、フルスルファミド+TX、フルキサピロキサド+TX、フェンヘキサミド+
 TX、ホセチル-アルミニウム+TX、ヒメキサゾール+TX、イプロバリカルブ+TX
 、シアゾファミド+TX、メタスルホカルブ+TX、メトラフェノン+TX、ペンシクロ
 ン+TX、フタリド+TX、ポリオキシン+TX、プロパモカルブ+TX、ピリベンカル
 ブ+TX、プロキナジド+TX、ピロキロン+TX、ピリオフェノン+TX、キノキシフ

10

20

30

40

50

エン+TX、キントゼン+TX、チアジニル+TX、トリアゾキシド+TX、トリシクラ
 ザール+TX、トリホリン+TX、バリダマイシン+TX、バリフェナレート+TX、ゾ
 キサミド+TX、マンジプロパミド+TX、フルベネテラム+TX、イソピラザム+TX
 、セダキサン+TX、ベンゾピンジフルピル+TX、ピジフルメトフェン+TX、3-ジ
 フルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(3', 4', 5'-ト
 リフルオロ-ビフェニル-2-イル)-アミド+TX、イソフルシプラム+TX、イソチ
 アニル+TX、ジピメチトロロン+TX、6-エチル-5, 7-ジオキソ-ピロロ[4, 5
] [1, 4] ジチイノ[1, 2-c] イソチアゾール-3-カルボニトリル+TX、2-
 (ジフルオロメチル)-N-[3-エチル-1, 1-ジメチル-インダン-4-イル] ピ
 リジン-3-カルボキサミド+TX、4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチル
 -5-フェニル-ピリダジン-3-カルボニトリル+TX、(R)-3-(ジフルオロメ
 チル)-1-メチル-N-[1, 1, 3-トリメチルインダン-4-イル] ピラゾール-
 4-カルボキサミド+TX、4-(2-ブロモ-4-フルオロ-フェニル)-N-(2-
 クロロ-6-フルオロ-フェニル)-2, 5-ジメチル-ピラゾール-3-アミン+TX
 、4-(2-ブロモ-4-フルオロ-フェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロ-フェニ
 ル)-1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン+TX、フルインダピル+TX
 、クメトキシストロビン(ジアキシアングジュンジ(jia xiang jun zhi))
 +TX、ルベンミキシアナン(lvbenmixianan)+TX、ジクロベンチアゾ
 クス+TX、マンデストロビン+TX、3-(4, 4-ジフルオロ-3, 4-ジヒドロ-
 3, 3-ジメチルイソキノリン-1-イル)キノロン+TX、2-[2-フルオロ-6-
 [(8-フルオロ-2-メチル-3-キノリル)オキシ]フェニル]プロパン-2-オー
 ル+TX、オキサチアピプロリン+TX、tert-ブチルN-[6-[[[(1-メチ
 ルテトラゾール-5-イル)-フェニル-メチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリ
 ジル]カルバメート+TX、ピラジフルミド+TX、インピルフルキサム+TX、ツロー
 ルプロカルブ+TX、メフェントリフルコナゾール+TX、イプフェントリフルコナゾー
 ル+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-3-エチル-1, 1-ジメチル
 -インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX、N'-(2, 5-ジメチ
 ル-4-フェノキシ-フェニル)-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N
 '-[4-(4, 5-ジクロロチアゾール-2-イル)オキシ-2, 5-ジメチル-フェ
 ニル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、[2-[3-[2-[1-[
 2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]アセチル]-4-ピペ
 リジル]チアゾール-4-イル]-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-5-イル]-3-
 クロロ-フェニル]メタンスルホン酸+TX、ブタ-3-イニルN-[6-[[[(Z)-
 [(1-メチルテトラゾール-5-イル)-フェニル-メチレン]アミノ]オキシメチル
]-2-ピリジル]カルバメート+TX、チルN-[5-[4-(2, 4-ジメチルフェ
 ニル)トリアゾール-2-イル]-2-メチル-フェニル]メチル]カルバメート+TX
 、3-クロロ-6-メチル-5-フェニル-4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル
)ピリダジン+TX、ピリダクロメチル+TX、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル
 -N-[1, 1, 3-トリメチルインダン-4-イル]ピラゾール-4-カルボキサミド
 +TX、1-[2-[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチ
 ル]-3-メチル-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン+TX、1-メチ
 ル-4-[3-メチル-2-[2-メチル-4-(3, 4, 5-トリメチルピラゾール
 -1-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]テトラゾール-5-オン+TX、アミノピ
 リフェン+TX、アメトクトラジン+TX、アミスルプロム+TX、ペンフルフェン+TX
 、(Z, 2E)-5-[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシ-
 2-メトキシイミノ-N, 3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド+TX、フロリルピコ
 キサミド+TX、フェンピコキサミド+TX、テブフロキン+TX、イプフルフェノキン
 +TX、キノフメリン+TX、イソフェタミド+TX、エチル1-[4-[2-(ト
 リフルオロメチル)-1, 3-ジオキソラン-2-イル]メトキシ]フェニル]メチル]
 ピラゾール-3-カルボキシレート+TX (国際公開第2020/056090号に記載

10

20

30

40

50

の方法から調製し得る)、エチル 1-[[4-[(Z)-2-エトキシ-3,3,3-トリフルオロプロプ-1-エノキシ]フェニル]メチル]ピラゾール-3-カルボキシレート+TX (国際公開第2020/056090号に記載の方法から調製し得る)、メチル N-[[4-[1-(4-シクロプロピル-2,6-ジフルオロフェニル)ピラゾール-4-イル]-2-メチルフェニル]メチル]カルバメート+TX (国際公開第2020/097012号に記載の方法から調製し得る)、メチル N-[[4-[1-(2,6-ジフルオロ-4-イソプロピルフェニル)ピラゾール-4-イル]-2-メチルフェニル]メチル]カルバメート+TX (国際公開第2020/097012号に記載の方法から調製し得る)、6-クロロ-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N-[2-(2,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-5-メチルピリダジン-4-カルボキサミド+TX (国際公開第2020/109391号に記載の方法から調製し得る)、6-クロロ-N-[2-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-5-メチルピリダジン-4-カルボキサミド+TX (国際公開第2020/109391号に記載の方法から調製し得る)、6-クロロ-3-(3-シクロプロピル-2-フルオロフェノキシ)-N-[2-(3,4-ジメチルフェニル)-2,2-ジフルオロエチル]-5-メチルピリダジン-4-カルボキサミド+TX (国際公開第2020/109391号に記載の方法から調製し得る)、N-[2-[2,4-ジクロロフェノキシ]フェニル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチルピラゾール-4-カルボキサミド+TX、N-[2-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチルピラゾール-4-カルボキサミド+TX、ベンゾチオストロビン+TX、フェナマクリル+TX、5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-チオール亜鉛塩(2:1)+TX、フルオピラム+TX、フルフェノキサジアザム+TX、フルチアニル+TX、フルオピモミド+TX、ピラプロポイン+TX、ピカルブトラゾクス+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3-エチル-1,1-ジメチルインダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3R)-1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、4-[[6-[2-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-3-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロピル]-3-ピリジル]オキシ]ベンゾニトリル+TX、メチルテトラプロール+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3R)-1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、 α -(1,1-ジメチルエチル)- α -[4'-(トリフルオロメトキシ)[1,1'-ビフェニル]-4-イル]-5-ピリミジンメタノール+TX、フルオキサピプロリン+TX、エノキサストロビン+TX、メチル(Z)-3-メトキシ-2-[2-メチル-5-[4-(トリフルオロメチル)トリアゾール-2-イル]フェノキシ]プロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-3-メトキシ-2-[2-メチル-5-(4-プロピルトリアゾール-2-イル)フェノキシ]プロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-2-[5-(3-イソプロピルピラゾール-1-イル)-2-メチルフェノキシ]-3-メトキシプロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-3-メトキシ-2-[2-メチル-5-(3-プロピルピラゾール-1-イル)フェノキシ]プロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-3-メトキシ-2-[2-メチル-5-[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]フェノキシ]プロプ-2-エノエート+TX (これらの化合物は、国際公開第2020/079111号に記載の方法から調製し得る)、メチル(Z)-2-(5-シクロヘキシル-2-メチルフェノキシ)-3-メトキシプロプ-2-エノエート+TX、メチル(Z)-2-(5-シクロペンチル-2-メチルフェノキシ)-3-メトキシプロプ-2-エノエート+TX (これらの化合物は、国際公開第2020/193387号に記載の方法から調製し得る)、4-[[6-[2-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-3-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロピル]-3-ピリジル]オキシ]ベンゾニトリル+TX、4-[[6-[2-(2,

10

20

30

40

50

4-ジフルオロフェニル)-1, 1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-3-(5-スルファ
 ニル-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロピル]-3-ピリジル]オキシ]ベン
 ゾニトリル+TX、4-[[6-[2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 1-ジフ
 ルオロ-2-ヒドロキシ-3-(5-チオキソ-4H-1, 2, 4-トリアゾール-1-
 イル)プロピル]-3-ピリジル]オキシ]ベンゾニトリル+TX、トリネキサパック+
 TX、クモキシストロビン+TX、チョンションマイシン(zhongshengmyc
 i n)+TX、チオジアゾール銅+TX、亜鉛チアゾール+TX、アメクトトラクチン+
 TX、イブロジオン+TX、セボクチルアミン+TX; N'-[5-ブromo-2-メチル
 -6-[(1S)-1-メチル-2-プロポキシ-エトキシ]-3-ピリジル]-N-エ
 チル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[5-ブromo-2-メチル-6-[(1
 R)-1-メチル-2-プロポキシ-エトキシ]-3-ピリジル]-N-エチル-N-
 メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[5-ブromo-2-メチル-6-(1-メチル-
 2-プロポキシ-エトキシ)-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジ
 ン+TX、N'-[5-クロロ-2-メチル-6-(1-メチル-2-プロポキシ-エト
 キシ)-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[5-
 ブromo-2-メチル-6-(1-メチル-2-プロポキシ-エトキシ)-3-ピリジル
]-N-イソプロピル-N-メチル-ホルムアミジン+TX (これらの化合物は、国際公
 開第2015/155075号に記載の方法により調製され得る); N'-[5-ブromo
 -2-メチル-6-(2-プロポキシプロポキシ)-3-ピリジル]-N-エチル-N-
 メチル-ホルムアミジン+TX (この化合物は、IPC000249876Dに記載
 の方法により調製され得る); N-イソプロピル-N'-[5-メトキシ-2-メチル-
 4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-フェニル-エチル)フェニル]
 -N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[4-(1-シクロプロピル-2, 2, 2-
 ートリフルオロ-1-ヒドロキシ-エチル)-5-メトキシ-2-メチル-フェニル]-
 N-イソプロピル-N-メチル-ホルムアミジン+TX (これらの化合物は、国際公開第
 2018/228896号に記載の方法により調製され得る); N-エチル-N'-[5-
 メトキシ-2-メチル-4-[(2-トリフルオロメチル)オキセタン-2-イル]フェ
 ニル]-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N-エチル-N'-[5-メトキシ-2-
 メチル-4-[(2-トリフルオロメチル)テトラヒドロフラン-2-イル]フェニル
]-N-メチル-ホルムアミジン+TX (これらの化合物は、国際公開第2019/11
 0427号に記載の方法により調製され得る); N-[(1R)-1-ベンジル-3-クロ
 ロ-1-メチル-ブタ-3-エニル]-8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド
 +TX、N-[(1S)-1-ベンジル-3-クロロ-1-メチル-ブタ-3-エニル]
 -8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-[(1R)-1-ベンジル
 -3, 3, 3-トリフルオロ-1-メチル-プロピル]-8-フルオロ-キノリン-3-
 カルボキサミド+TX、N-[(1S)-1-ベンジル-3, 3, 3-トリフルオロ-1-
 メチル-プロピル]-8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-[(1
 R)-1-ベンジル-1, 3-ジメチル-ブチル]-7, 8-ジフルオロ-キノリン-3-
 カルボキサミド+TX、N-[(1S)-1-ベンジル-1, 3-ジメチル-ブチル]
]-7, 8-ジフルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、8-フルオロ-N-[
 (1R)-1-[(3-フルオロフェニル)メチル]-1, 3-ジメチル-ブチル]キノ
 リン-3-カルボキサミド+TX、8-フルオロ-N-[(1S)-1-[(3-フルオ
 ロフェニル)メチル]-1, 3-ジメチル-ブチル]キノリン-3-カルボキサミド+T
 X、N-[(1R)-1-ベンジル-1, 3-ジメチル-ブチル]-8-フルオロ-キノ
 リン-3-カルボキサミド+TX、N-[(1S)-1-ベンジル-1, 3-ジメチル-
 ブチル]-8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX、N-((1R)-1-
 ベンジル-3-クロロ-1-メチル-ブタ-3-エニル)-8-フルオロ-キノリン-3-
 カルボキサミド+TX、N-((1S)-1-ベンジル-3-クロロ-1-メチル-ブ
 タ-3-エニル)-8-フルオロ-キノリン-3-カルボキサミド+TX (これらの化
 合物は、国際公開第2017/153380号に記載の方法により調製され得る); 1-(

10

20

30

40

50

6, 7-ジメチルピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) - 4, 4, 5-トリフル
 オロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、1-(6, 7-ジメチルピラゾロ [1,
 5-a] ピリジン-3-イル) - 4, 4, 6-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキ
 ノリン+TX、4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-1-(6-メチルピラゾロ [1,
 5-a] ピリジン-3-イル) イソキノリン+TX、4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジ
 メチル-1-(7-メチルピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) イソキノリン+
 TX、1-(6-クロロ-7-メチル-ピラゾロ [1, 5-a] ピリジン-3-イル) -
 4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX (これらの化合物は、国際
 公開第2017/025510号に記載の方法により調製され得る) ; 1-(4, 5-ジ
 メチルベンズイミダゾール-1-イル) - 4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル
 -イソキノリン+TX、1-(4, 5-ジメチルベンズイミダゾール-1-イル) - 4,
 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、6-クロロ-4, 4-ジフル
 オロ-3, 3-ジメチル-1-(4-メチルベンズイミダゾール-1-イル) イソキノリ
 ン+TX、4, 4-ジフルオロ-1-(5-フルオロ-4-メチル-ベンズイミダゾール
 -1-イル) - 3, 3-ジメチル-イソキノリン+TX、3-(4, 4-ジフルオロ-3,
 3-ジメチル-1-イソキノリル) - 7, 8-ジヒドロ-6H-シクロペンタ [e] ベ
 ンズイミダゾール+TX (これらの化合物は、国際公開第2016/156085号に記
 載の方法により調製され得る) ; N-メトキシ-N-[[4-[5-(トリフルオロメチ
 ル) - 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] シクロプロパンカ
 ルボキサミド+TX、N, 2-ジメトキシ-N-[[4-[5-(トリフルオロメチル)
 - 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] プロパンアミド+TX
 、N-エチル-2-メチル-N-[[4-[5-(トリフルオロメチル) - 1, 2, 4-
 オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] プロパンアミド+TX、1-メトキシ
 -3-メチル-1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) - 1, 2, 4-オキサジアゾ
 ール-3-イル] フェニル] メチル] 尿素+TX、1, 3-ジメトキシ-1-[[4-[
 5-(トリフルオロメチル) - 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メ
 チル] 尿素+TX、3-エチル-1-メトキシ-1-[[4-[5-(トリフルオロメチ
 ル) - 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] 尿素+TX、N-
 [[4-[5-(トリフルオロメチル) - 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェ
 ニル] メチル] プロパンアミド+TX、4, 4-ジメチル-2-[[4-[5-(トリ
 フルオロメチル) - 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] イソ
 キサゾリジン-3-オン+TX、5, 5-ジメチル-2-[[4-[5-(トリフルオロ
 メチル) - 1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] イソキサゾリ
 ジン-3-オン+TX、エチル 1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) - 1, 2, 4-
 オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] ピラゾール-4-カルボキシレート
 +TX、N, N-ジメチル-1-[[4-[5-(トリフルオロメチル) - 1, 2, 4-
 オキサジアゾール-3-イル] フェニル] メチル] - 1, 2, 4-トリアゾール-3-ア
 ミン+TX。この段落中の化合物は、国際公開第2017/055473号、国際公開第
 2017/055469号、国際公開第2017/093348号及び国際公開第201
 7/118689号に記載の方法により調製され得る ; 2-[6-(4-クロロフェノキシ)
 -2-(トリフルオロメチル) -3-ピリジル] -1-(1, 2, 4-トリアゾール
 -1-イル) プロパン-2-オール+TX (この化合物は、国際公開第2017/029
 179号に記載の方法により調製され得る) ; 2-[6-(4-ブromoフェノキシ) -2
 -(トリフルオロメチル) -3-ピリジル] -1-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イ
 ル) プロパン-2-オール+TX (この化合物は、国際公開第2017/029179号
 に記載の方法により調製され得る) ; 3-[2-(1-クロロシクロプロピル) -3-(
 2-フルオロフェニル) -2-ヒドロキシープロピル] イミダゾール-4-カルボニトリ
 ル+TX (この化合物は、国際公開第2016/156290号に記載の方法により調製
 され得る) ; 3-[2-(1-クロロシクロプロピル) -3-(3-クロロ-2-フルオ
 ロ-フェニル) -2-ヒドロキシープロピル] イミダゾール-4-カルボニトリル+TX

(この化合物は、国際公開第2016/156290号に記載の方法により調製され得る) ; (4-フェノキシフェニル)メチル2-アミノ-6-メチル-ピリジン-3-カルボキシレート+TX (この化合物は、国際公開第2014/006945号に記載の方法により調製され得る) ; 2, 6-ジメチル-1H, 5H-[1, 4]ジチイノ[2, 3-c: 5, 6-c']ジピロール-1, 3, 5, 7(2H, 6H)-テトロロン+TX (この化合物は、国際公開第2011/138281号に記載の方法により調製され得る) ; N-メチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]ベンゼンカルボチオアミド+TX ; N-メチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド+TX ; (Z, 2E)-5-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシ-2-メトキシイミノ-N, 3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド+TX (この化合物は、国際公開第2018/153707号に記載の方法により調製され得る) ; N'-(2-クロロ-5-メチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX ; N'-[2-クロロ-4-(2-フルオロフェノキシ)-5-メチル-フェニル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX (この化合物は、国際公開第2016/202742号に記載の方法により調製され得る) ; 2-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-3-エチル-1, 1-ジメチル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX (この化合物は、国際公開第2014/095675号に記載の方法により調製され得る) ; (5-メチル-2-ピリジル)-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]メタノン+TX、(3-メチルイソキサゾール-5-イル)-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]メタノン+TX (これらの化合物は、国際公開第2017/220485号に記載の方法により調製され得る) ; 2-オキソ-N-プロピル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド+TX (この化合物は、国際公開第2018/065414号に記載の方法により調製され得る) ; エチル1-[[5-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]-2-チエニル]メチル]ピラゾール-4-カルボキシレート+TX (この化合物は、国際公開第2018/158365号に記載の方法により調製され得る) ; 2, 2-ジフルオロ-N-メチル-2-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]アセトアミド+TX、N-[(E)-メトキシイミノメチル]-4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド+TX、N-[(Z)-メトキシイミノメチル]-4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド+TX、N-[N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル]-4-[5-(トリフルオロメチル)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド+TX (これらの化合物は、国際公開第2018/202428号に記載の方法により調製され得る) から選択される生物学的有効物質 ;

以下を含む微生物 : アシネトバクター・ルオフィイ (*Acinetobacter lwoffii*) +TX、アクレモニウム・アルテルナタム (*Acremonium alternatum*) +TX+TX、アクレモニウム・セファロスポリウム (*Acremonium cephalosporium*) +TX+TX、アクレモニウム・ジオスピリ (*Acremonium diostryi*) +TX、アクレモニウム・オブカラバタム (*Acremonium obclavatum*) +TX、アドキソフィス・オラナ (*Adoxophyes orana*) グラニューロウイルス (AdoxGV) (Capex (登録商標)) +TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) 菌株K84 (Galltrol-A (登録商標)) +TX、アルテルナリア・アルテルナータ (*Alternaria alternata*) +TX、アルテルナリア・カッシア (*Alternaria cassia*) +TX、アルテルナリア・デストルエンズ (*Alternaria destruens*) (Smolder (登録商標)) +TX、アムペロマイセス・キスクアリス (*Ampelomyces*

10

20

30

40

50

quisqualis) (AQ10 (登録商標)) +TX、アスペルギルス・フラブス (Aspergillus flavus) AF36 (AF36 (登録商標)) +TX、アスペルギルス・フラブス (Aspergillus flavus) NRRL21882 (Aflaguard (登録商標)) +TX、アスペルギルス属の種 (Aspergillus spp.) +TX、アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans) +TX、アゾスピリルム属 (Azospirillum) +TX、(MicroAZ (登録商標)) +TX、TAZO B (登録商標)) +TX、アゾトバクター属 (Azotobacter) +TX、アゾトバクター・クロオクカム (Azotobacter chroococcum) (Azotomeal (登録商標)) +TX、アゾトバクター・シスツ (Azotobacter cysts) (Bionatural Blooming Blossoms (登録商標)) +TX、バチルス・アミロリケファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens) +TX、バチルス・セレウス (Bacillus cereus) +TX、バチルス・キチノスポルス (Bacillus chitinosporus) 菌株CM-1 +TX、バチルス・キチノスポルス (Bacillus chitinosporus) 菌株AQ746 +TX、バチルス・リケニホルミス (Bacillus licheniformis) 菌株HB-2 (Biostart (商標) Rhizoboost (登録商標)) +TX、バチルス・リケニホルミス (Bacillus licheniformis) 菌株3086 (EcoGuard (登録商標)) +TX、Green Releaf (登録商標)) +TX、バチルス・シルクランス (Bacillus circulans) +TX、バチルス・フィルムス (Bacillus firmus) (BioSafe (登録商標)) +TX、BioNem-WP (登録商標) +TX、VOTIVO (登録商標)) +TX、バチルス・フィルムス (Bacillus firmus) 菌株I-1582 +TX、バチルス・マセランス (Bacillus macerans) +TX、バチルス・マリスマルツイ (Bacillus marismortui) +TX、バチルス・メガテリウム (Bacillus megaterium) +TX、バチルス・マイコイデス (Bacillus mycoides) 菌株AQ726 +TX、バチルス・パピラエ (Bacillus papillae) (Milky Spore Powder (登録商標)) +TX、バチルス・プミルス属の種 (Bacillus pumilus spp.) +TX、バチルス・プミルス (Bacillus pumilus) 菌株GB34 (Yield Shield (登録商標)) +TX、バチルス・プミルス (Bacillus pumilus) 菌株AQ717 +TX、バチルス・プミルス (Bacillus pumilus) 菌株QST 2808 (Sonata (登録商標)) +TX、Ballad Plus (登録商標)) +TX、バチルス・スパヘリクス (Bacillus spahericus) (VectoLex (登録商標)) +TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) +TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) 菌株AQ175 +TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) 菌株AQ177 +TX、バチルス属の種 (Bacillus spp.) 菌株AQ178 +TX、バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 菌株QST 713 (CEASE (登録商標)) +TX、Serenade (登録商標) +TX、Rhapsody (登録商標)) +TX、バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 菌株QST 714 (JAZZ (登録商標)) +TX、バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 菌株AQ153 +TX、バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 菌株AQ743 +TX、バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 菌株QST3002 +TX、バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 菌株QST3004 +TX、バチルス・サブチリス変種アミロリケファシエンス (Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens) 菌株FZB24 (Taegro (登録商標)) +TX、Rhizopro (登録商標)) +TX、バチルス・チューリンゲンシス (Bacillus thuringiensis) Cry2Ae +TX、バチルス・チューリンゲンシス (Bacillus

10

20

30

40

50

thuringiensis) Cry1Ab+TX、バチルス・チューリングエンシスアイザワイ (*Bacillus thuringiensis aizawai*) GC91 (Agree (登録商標)) +TX、バチルス・チューリングエンシスイスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israelensis*) (BMP123 (登録商標) +TX、Aquabac (登録商標) +TX、VectoBac (登録商標)) +TX、バチルス・チューリングエンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (Javelin (登録商標) +TX、Deliver (登録商標) +TX、CryMax (登録商標) +TX、Bonide (登録商標) +TX、Scutella WP (登録商標) +TX、Turilav WP (登録商標) +TX、Astuto (登録商標) +TX、Dipel WP (登録商標) +TX、Biobit (登録商標) +TX、Foray (登録商標)) +TX、バチルス・チューリングエンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) BMP 123 (Baritone (登録商標)) +TX、バチルス・チューリングエンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) HD-1 (Bioprotec-CAF/3P (登録商標)) +TX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株BD#32+TX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株AQ52+TX、バチルス・チューリングエンシス変種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis var. aizawai*) (Xentari (登録商標) +TX、Dipel (登録商標)) +TX、バクテリア属の種 (*bacteria spp.*) (GROWMEND (登録商標) +TX、GROWSWEET (登録商標) +TX、Shootup (登録商標)) +TX、クラビパクター・ミシガンシス (*Clavipacter michiganensis*) のバクテリオファージ (AgriPhage (登録商標)) +TX、Bakflor (登録商標) +TX、ベアウベリア・バッシアナ (*Beauveria bassiana*) (Beaugenic (登録商標) +TX、Brocaril WP (登録商標)) +TX、ベアウベリア・バッシアナGHA (*Beauveria bassiana GHA*) (Mycotrol ES (登録商標) +TX、Mycotrol O (登録商標) +TX、Botaniguard (登録商標)) +TX、ベアウベリア・ブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (Engerlingspilz (登録商標) +TX、Schweizer Beauveria (登録商標) +TX、Melocont (登録商標)) +TX、ボーベリア属の種 (*Beauveria spp.*) +TX、ボトリチスシネリア (*Botrytis cineria*) +TX、ダイズ根粒菌 (*Bradyrhizobium japonicum*) (TerraMax (登録商標)) +TX、ブレバチルス・ブレビス (*Brevibacillus brevis*) +TX、バチルス・チューリングエンシス・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis tenebrionis*) (Novodor (登録商標)) +TX、BtBooster+TX、バークホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (Deny (登録商標) +TX、Intercept (登録商標) +TX、Blue Circle (登録商標)) +TX、バークホルデリア・グラジイ (*Burkholderia gladii*) +TX、バークホルデリア・グラジオリ (*Burkholderia gladioli*) +TX、バークホルデリア属の種 (*Burkholderia spp.*) +TX、カナディアンチスルフファンガス (*Canadian thistle fungus*) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標)) +TX、カンジダ・ブチリ (*Candida butyri*) +TX、カンジダ・ファマタ (*Candida famata*) +TX、カンジダ・フルクツス (*Candida fructus*) +TX、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*) +TX、カンジダ・グイリエルモンチイ (*Candida guilliermondii*) +TX、カンジダ・メリビオシカ (*Candida melibiosica*) +TX、カンジダ・オレフィラ (*Candida oleophila*) 菌株O+

10

20

30

40

50

TX、カンジダ・パラブシロシス (*Candida parapsilosis*) +TX
 、カンジダ・ペリクロサ (*Candida pelliculosa*) +TX、カンジダ
 ・ブルケリマ (*Candida pulcherrima*) +TX、カンジダ・レウカウ
 フィイ (*Candida reukaufii*) +TX、カンジダ・サイトアナ (*Can*
dida saitoana) (Bio-Coat (登録商標) +TX、Biocure
 (登録商標)) +TX、カンジダ・サケ (*Candida sake*) +TX、カンジダ
 属の種 (*Candida spp.*) +TX、カンジダ・テニウス (*Candida t*
enius) +TX、セデセア・ドラビスエ (*Cedecea dravisae*) +T
 X、セルモナス・フラビゲナ (*Cellulomonas flavigena*) +TX
 、カエトミウム・コクリオデス (*Chaetomium cochliodes*) (No
 va-Cide (登録商標)) +TX、カエトミウム・グロボスム (*Chaetomiu*
m globosum) (Nova-Cide (登録商標)) +TX、クロモバクテリア
 ム・サブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株PRAA
 4-1T (Grandevo (登録商標)) +TX、クラドスポリウム・クラドスポリオ
 イデス (*Cladosporium cladosporioides*) +TX、クラド
 スポリウム・オキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*) +TX
 、クラドスポリウム・クロロセファルム (*Cladosporium chloroce*
phalum) +TX、クラドスポリウム属の種 (*Cladosporium spp.*
) +TX、クラドスポリウム・テヌイシマム (*Cladosporium tenuis*
simum) +TX、クロノスタキス・ロゼア (*Clonostachys rosea*
) (EndoFine (登録商標)) +TX、コレトリカム・アクタタム (*Colle*
totrichum acutatum) +TX、コニオチリウム・ミニタンス (*Con*
iothyrium minitans) (Cotans WG (登録商標)) +TX、
 コニオチリウム属の種 (*Coniothyrium spp.*) +TX、クリプトコッカ
 ス・アルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS (登
 録商標)) +TX、クリプトコッカス・フミコラ (*Cryptococcus hum*
icola) +TX、クリプトコッカス・インフィルミニアツス (*Cryptococ*
cus infirmo-miniatum) +TX、クリプトコッカス・ラウレンチイ
 (*Cryptococcus laurentii*) +TX、クリプトフレビア・ロイコ
 トレタ (*Cryptophlebia leucotreta*) グラニュロウイルス (*C*
ryptex (登録商標)) +TX、クプリアビダス・カムピネンシス (*Cupriav*
idus campinensis) +TX、シジア・ポモネラ (*Cydia pom*
onella) グラニュロウイルス (CYD-X (登録商標)) +TX、シジア・ポモネラ
 (*Cydia pomonella*) グラニュロウイルス (Madex (登録商標) +T
 X、Madex Plus (登録商標) +TX、Madex Max / Carpovir
 usine (登録商標)) +TX、エビコウヤクタケ (*Cylindrobasidium*
laeve) (Stumpout (登録商標)) +TX、シリンドロクラジウム属 (*Cylindrocladium*) +TX、デバリオマイセス・ハンセニイ (*Debar*
yomyces hansenii) +TX、ドレックスレラ・ハワイイネンシス (*Dr*
echslera hawaiiensis) +TX、エンテロバクター・クロアカ (*Enterobacter cloacae*) +TX、腸内細菌科 (*Enterobac*
teriaceae) +TX、エントモフトラ・ビルレンタ (*Entomophthora*
virulenta) (Vektor (登録商標)) +TX、エピコッカム・ニグラム (*Epicoccum nigrum*) +TX、エピコッカム・プルブラセン
 ス (*Epicoccum purpurascens*) +TX、エピコッカム属の種 (*Epicoccum spp.*) +TX、フィロバシジウム・フロリホルメ (*Filobasidium*
floriforme) +TX、フザリウム・アクミナタム (*Fusarium acu*
minatum) +TX、フザリウム・クラミドスポルム (*Fusarium chla*
mydosporum) +TX、フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium ox*
ysporum) (Fusaclean (登録商標) / Biofox C (登録商標))

10

20

30

40

50

+TX、フザリウム・ブラリフェラタム (*Fusarium proliferatum*) +TX、フザリウム属の種 (*Fusarium* spp.) +TX、グララクトマイセス・ゲオトリクム (*Galactomyces geotrichum*) +TX、グリオクラジウム・カテナラタム (*Gliocladium catenulatum*) (Primastop (登録商標)) +TX、Prestop (登録商標)) +TX、グリオクラジウム・ロセウム (*Gliocladium roseum*) +TX、グリオクラジウム属の種 (*Gliocladium* spp.) (SoilGard (登録商標)) +TX、グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) (Soilgard (登録商標)) +TX、グラニュロウイルス属 (*Granulovirus*) (Granupom (登録商標)) +TX、ハロバシルス・ハロフィルス (*Halobacillus halophilus*) +TX、ハロバシルス・リトラリス (*Halobacillus litoralis*) +TX、ハロバシルス・トルエペリ (*Halobacillus trueperi*) +TX、ハロモナス属の種 (*Halomonas* spp.) +TX、ハロモナススブグラシエ・スコラ (*Halomonas subglaciescola*) +TX、ハロビブリオ・バリアビリス (*Halovibrio variabilis*) +TX、ハンセニアスポラ・ウバルム (*Hanseniaspora uvarum*) +TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多核体ウイルス (*Helicovex* (登録商標)) +TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多角体ウイルス (*Gemstar* (登録商標)) +TX、イソフラボンーホルモノネチン (*Myconate* (登録商標)) +TX、クロエケラアピクラタ (*Kloeckera apiculata*) +TX、クロエケラ属の種 (*Kloeckera* spp.) +TX、ラゲニジウム・ギガンテウム (*Lagenidium giganteum*) (Laginex (登録商標)) +TX、オンシツコナジラミ (*Lecanicillium longisporum*) (Vertiblast (登録商標)) +TX、レカニシリウム・ムスカリウム (*Lecanicillium muscarium*) (Vertikil (登録商標)) +TX、マイマイガ (*Lymantria dispar*) 核多角体ウイルス (*Disparvirus* (登録商標)) +TX、マリノコッカス・ハロフィルス (*Marinococcus halophilus*) +TX、メイラ・ゲウラコニギイ (*Meira geulakonigii*) +TX、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*) (Met52 (登録商標)) +TX、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*) (Destruxin WP (登録商標)) +TX、メチニコビア・フルチコラ (*Metschnikowia fruticola*) (Shemer (登録商標)) +TX、メチニコビア・プルケリマ (*Metschnikowia pulcherrima*) +TX、ミクロドキウム・ジメルム (*Microdochium dimerum*) (Antibot (登録商標)) +TX、ミクロモノスポラ・コエルレア (*Micromonospora coerulea*) +TX、ミクロモノスポラ・コエルレア (*Micromonospora coerulea*) +TX、ミクロスファエロブシス・オクラセア (*Microsphaeropsis ochracea*) +TX、ムスコドル・アルブス (*Muscodor albus*) 620 (Muscudor (登録商標)) +TX、ムスコドル・ロセウス (*Muscodor roseus*) 菌株A3-5 +TX、ミコルヒザエ属の種 (*Mycorrhizae* spp.) (AMykor (登録商標)) +TX、Root Maximizer (登録商標)) +TX、ミロテシウム・ベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 菌株AARC-0255 (DiTera (登録商標)) +TX、BROS PLUS (登録商標) +TX、オフィオストマ・ピリフェルム (*Ophiostoma piliiferum*) 菌株D97 (Sylvanex (登録商標)) +TX、パエシロマイセス・ファリノスス (*Paecilomyces farinosus*) +TX、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (PFR-97 (登録商標)) +TX、PreFeRal (登録商標)) +TX、パエシロマイセス・リナシヌス (Pa

10

20

30

40

50

ecilomyces lilacinus) (Biostat WP (登録商標)) + TX、パエシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株 251 (MeloCon WG (登録商標)) + TX、パエニバチルス・ポリミクサ (*Paenibacillus polymyxa*) + TX、パントエア・アグロメランス (*Pantoea agglomerans*) (BlightBan C9-1 (登録商標)) + TX、パントエア属の種 (*Pantoea* spp.) + TX、パスツーリア属の種 (*Pasteuria* spp.) (Econem (登録商標)) + TX、パスツーリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウム・オーランチオグリセウム (*Penicillium aurantiogriseum*) + TX、ペニシリウム・ビライ (*Penicillium billai*) (Jumpstart (登録商標)) + TX、TagTeam (登録商標)) + TX、ペニシリウム・ブレビコンパクトム (*Penicillium brevicompactum*) + TX、ペニシリウム・フレクエンタンス (*Penicillium frequentans*) + TX、ペニシリウム・グリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) + TX、ペニシリウム・ブルプロゲヌム (*Penicillium purpurogenum*) + TX、ペニシリウム属の種 (*Penicillium* spp.) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオブシス・ギガンテアン (*Phlebiopsis gigantea*) (Rotstop (登録商標)) + TX、リン溶解菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) + TX、フィトフトラ・クリプトギア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フィトフトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Devine (登録商標)) + TX、ピチア・アノマラ (*Pichia anomala*) + TX、ピチア・グイレルモンディイ (*Pichia guillemondii*) + TX、ピチア・メンブランファイエンス (*Pichia membranaefaciens*) + TX、ピチア・オニキス (*Pichia onychis*) + TX、ピチア・スチピテス (*Pichia stipites*) + TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) + TX、シュードモナス・アウレオファシエンス (*Pseudomonas aureofaciens*) (Spot-Less Biofungicide (登録商標)) + TX、シュードモナス・セバシア (*Pseudomonas cepacia*) + TX、シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) (AtEze (登録商標)) + TX、シュードモナス・コルゲート (*Pseudomonas corrugate*) + TX、シュードモナス・フルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標)) + TX、シュードモナス・プチダ (*Pseudomonas putida*) + TX、シュードモナス・リアクタン (*Pseudomonas reactans*) + TX、シュードモナス属の種 (*Pseudomonas* spp.) + TX、シュードモナス・シリングア (*Pseudomonas syringae*) (Bio-Save (登録商標)) + TX、シュードモナス・ビリジフラバ (*Pseudomonas viridiflava*) + TX、蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) (Zequanox (登録商標)) + TX、シュードジマ・フロクロッサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標)) + TX、プッシニア・カナリクラタ (*Puccinia canaliculata*) + TX、プッシニア・トラスペオス (*Puccinia thlaspeos*) (Wood Warrior (登録商標)) + TX、ピシウムパロエカンドラム (*Pythium paroeandrum*) + TX、ピシウム・オリガンドラム (*Pythium oligandrum*) (Polygandron (登録商標)) + TX、Polyversum (登録商標)) + TX、ピシウム・ベリプロクム (*Pythium periplocum*) + TX、ラネラアク・アチリス (*Rhanelia aquatilis*) + TX、ラネラ属の種 (*Rhanelia* spp.) + TX、根粒菌 (Dormal (登録商標)) + T

10

20

30

40

50

X、Vault（登録商標））+TX、リゾクトニア属の種（Rhizoctonia）
 +TX、ロドコッカス・グロベルルス（Rhodococcus globerulus）
 菌株AQ719+TX、ロドスポリジウム・ディオボバタム（Rhodosporidium diobovatum）+TX、ロドスポリジウム・トルロイデス（Rhodosporidium toruloides）+TX、ロドトルラ属の種（Rhodotorula spp.）+TX、ドトルラ・グルチニス（Rhodotorula glutinis）+TX、ロドトルラ・グラミニス（Rhodotorula graminis）+TX、ロドトルラ・ムシラグノサ（Rhodotorula mucilaginosa）+TX、ロドトル・ラルブラ（Rhodotorula rubra）+TX、
 サッカロマイセス・セレビスエ（Saccharomyces cerevisiae）+TX、
 サリノコッカス・ロセウス（Salinococcus roseus）+TX、
 スクレロチニア・ミノル（Sclerotinia minor）+TX、スクレロチニア・ミノル（Sclerotinia minor）（SARRITOR（登録商標））+TX、
 シタリジウム属の種（Scytalidium spp.）+TX、シタリジウム・ウレジニコラ（Scytalidium uredinicola）+TX、
 シロイチモジヨトウ（Spodoptera exigua）核多角体ウイルス（Spod-X（登録商標））+TX、
 Spexit（登録商標））+TX、セラチア・マルセセンス（Serratia marcescens）+TX、セラチアプリムシカ（Serratia plymuthica）+TX、セラチア属の種（Serratia spp.）+TX、
 ソルダリア・フィミコラ（Sordaria fimicola）+TX、
 エジプトヨトウ（Spodoptera littoralis）核多核体ウイルス（Littovir（登録商標））+TX、
 スポロボロミセス・ロセウス（Sporobolomyces roseus）+TX、
 ステノトロホモナス・マルトフィリア（Stenotrophomonas maltophilia）+TX、
 ストレプトマイセス・アヒグロスコピクス（Streptomyces ahigroscopicus）+TX、
 ストレプトマイセス・アルバドンカス（Streptomyces albaduncus）+TX、
 ストレプトマイセス・エクサホリアテス（Streptomyces exfoliates）+TX、
 ストレプトマイセス・ガルブス（Streptomyces galbus）+TX、
 ストレプトマイセス・グリセオプラヌス（Streptomyces griseoplanus）+TX、
 ストレプトマイセス・グリセオビリディス（Streptomyces griseoviridis）（Mycostop（登録商標））+TX、
 ストレプトマイセス・リディクス（Streptomyces lydicus）（Actinovate（登録商標））+TX、
 ストレプトマイセス・リディクス（Streptomyces lydicus）WYEC-108（Actinogrow（登録商標））+TX、
 ストレプトマイセス・ビオラセウス（Streptomyces violaceus）+TX、
 チレチオブシス・ミノル（Tilletiopsis minor）+TX、
 チレチオブシス属の種（Tilletiopsis spp.）+TX、
 トリコデルマ・アスペレルム（Trichoderma asperellum）（T34 Biocontrol（登録商標））+TX、
 トリコデルマ・ガムシイ（Trichoderma gamsii）（Tenet（登録商標））+TX、
 トリコデルマ・アトロビリデ（Trichoderma atroviride）（Plantmate（登録商標））+TX、
 トリコデルマ・ハマツム（Trichoderma hamatum）TH 382+TX、
 トリコデルマ・ハルジアヌムリファイ（Trichoderma harzianum rifai）（Mycostar（登録商標））+TX、
 トリコデルマ・ハルジアヌム（Trichoderma harzianum）T-22（Trianium-P（登録商標））+TX、
 PlantShield HC（登録商標）+TX、
 RootShield（登録商標）+TX、
 Trianium-G（登録商標）+TX、
 トリコデルマ・ハルジアヌム（Trichoderma harzianum）T-39（Trichodex（登録商標））+TX、
 トリコデルマ・インハマツム（Trichoderma inhamatum）+TX、
 トリコデルマ・コニンギ

10

20

30

40

50

イ (Trichoderma koningii) +TX、トリコデルマ属の種 (Trichoderma spp.) LC 52 (Sentinel (登録商標)) +TX、トリコデルマ・リグノルム (Trichoderma lignorum) +TX、トリコデルマ・ロンギブラキアツム (Trichoderma longibrachiatum) +TX、トリコデルマ・ポリスボルム (Trichoderma polysporum) (Binab T (登録商標)) +TX、トリコデルマ・タクシ (Trichoderma taxi) +TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) +TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (旧名グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) GL-21) (SoilGuard (登録商標)) +TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) +TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標)) +TX、トリコスポロン・プルランス (Trichosporon pullulans) +TX、トリコスポロン属の種 (Trichosporon spp.) +TX、トリコテシウム属の種 (Trichothecium spp.) +TX、トリコテシウム・ロセウム (Trichothecium roseum) +TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94670 +TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94671 +TX、ウロクラディウム・アトラム (Ulocladium atrum) +TX、ウロクラディウム・オウデマンシイ (Ulocladium oudemansii) (Botry-Zen (登録商標)) +TX、ウスチラゴ・マイディス (Ustilago maydis) +TX、様々な細菌及び補助微量栄養素 (Natural II (登録商標)) +TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標)) +TX、ベルチシリウム・クラミドスポリウム (Verticillium chlamydosporium) +TX、ベルチシリウム・レカニイ (Verticillium lecanii) (Mycotal (登録商標)) +TX、Vertalec (登録商標)) +TX、Vip3Aa20 (Viptera (登録商標)) +TX、ビルギバクリルス・マリスモルツイ (Virgibacillus marismortui) +TX、キサントモナス カムペストリス pv. ポアエ (Xanthomonas campestris pv. Poae) (Camperico (登録商標)) +TX、ゼノラブダス・ボビエニイ (Xenorhabdus bovienii) +TX、ゼノラブダス・ネマトフィルス (Xenorhabdus nematophilus) ;

以下を含む植物抽出物：松油 (Retenol (登録商標)) +TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標)) +TX、AzaGuard (登録商標) +TX、MeemAzaL (登録商標) +TX、Molt-X (登録商標) +TX、植物性の昆虫成長制御剤 (Botanical IGR) (Neemazad (登録商標)) +TX、Neemix (登録商標)) +TX、ナタネ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標)) +TX、アメリカアリタソウ (Chenopodium ambrosioides near ambrosioides) (Requiem (登録商標)) +TX、キク属 (Chrysanthemum) 抽出物 (Crisant (登録商標)) +TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標)) +TX、シソ科植物 (Labiatae) の精油 (Botania (登録商標)) +TX、クローブローズマリーペパーミント及びタイム油の抽出物 (Garden insect killer (登録商標)) +TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標)) +TX、ニンニク +TX、レモングラス油 (GreenMatch (登録商標)) +TX、ニーム油 +TX、イヌハッカ (Nepeta cataria) (キャットニップ油) +TX、イヌハッカ (Nepeta catarina) +TX、ニコチン +TX、オレガノ油 (Moss Buster (登録商標)) +TX、ゴマ科植物 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標)) +TX、除虫菊 +TX、シャボンノキ (Quillaja saponaria) (NemaQ (登録商標)) +TX、オオイタドリ (Reynoutr

ia sachalinensis) (Regalia (登録商標) +TX、Sakalia (登録商標) +TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標) +TX、ミカン科植物 (Rutaceae) 抽出物 (Soleo (登録商標) +TX、ダイズ油 (Ortho ecosense (登録商標) +TX、ティーツリー油 (Timorex Gold (登録商標) +TX、タイム油 +TX、AGNIQUE (登録商標) MMF +TX、Bug Oil (登録商標) +TX、ローズマリーゴマペパーミントタイム及びシナモン抽出物の混合物 (EF 300 (登録商標) +TX、クローブローズマリー及びペパーミント抽出物の混合物 (EF 400 (登録商標) +TX、クローブペパーミントニク油及びミントの混合物 (Soil Shot (登録商標) +TX、カオリン (Screen (登録商標) +TX、褐藻類の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標)) ;

10

以下のものを含むフェロモン：クロネハイロヒメハマキ (blackheaded fireworm) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標) +TX、コドリング (Codling Moth) フェロモン (Paramount dispenser (CM) / Isomate C-Plus (登録商標) +TX、グレープベリーモス (Grape Berry Moth) フェロモン (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone (登録商標) +TX、ハマキガ科のガ (Leafroller) フェロモン (3M MEC-LR Sprayable Pheromone (登録商標) +TX、Muscamone (Snip7 Fly Bait (登録商標) +TX、Starbar Premium Fly Bait (登録商標) +TX、ナシヒメシンクイ (Oriental Fruit Moth) フェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標) +TX、スカシバガ科のガ (Peachtree Borer) フェロモン (Isomate-P (登録商標) +TX、トマトピンworm (Tomato Pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標) +TX、Entostate 粉末 (ヤシの木からの抽出物) (Exosex CM (登録商標) +TX、(E+TX, Z+TX, Z) -3+TX, 8+TX, 11テトラデカトリエニルアセテート+TX、(Z+TX, Z+TX, E) -7+TX, 11+TX, 13-ヘキサデカトリエナール+TX、(E+TX, Z) -7+TX, 9-ドデカジエン-1-イルアセテート+TX、2-メチル-1-ブタノール+TX、酢酸カルシウム+TX、Scenturion (登録商標) +TX、Biolure (登録商標) +TX、Check-Mate (登録商標) +TX、ラバンズリル・セネシオアート (Lavandulyl senecioate) ;

20

30

以下を含むマクロ生物：アブラコバチ (Aphelinus abdominalis) +TX、エルビアブラバチ (Aphidius ervi) (Aphelinus-System (登録商標) +TX、アセロファガス・パパイヤ (Acerophagus papaya) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia-System (登録商標) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標) +TX、アゲニアスピス・シトリコラ (Ageniaspis citricola) +TX、アゲニアスピス・フシコリス (Ageniaspis fuscicollis) +TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標) +TX、Andersoni-System (登録商標) +TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標) +TX、Spical (登録商標) +TX、アンブリセイウス・ククメリス (Amblyseius cucumeris) (Thripex (登録商標) +TX、Bugline cucumeris (登録商標) +TX、アンブリセイウス・ファラキス (Amblyseius fallacis) (Fa

40

50

llacis (登録商標)) + TX、スワルスキーカブリダニ (*Amblyseius swirskii*) (*Bugline swirskii* (登録商標)) + TX、*Swirskii-Mite* (登録商標)) + TX、ケナガカブリダニ (*Amblyseius womersleyi*) (*WomerMite* (登録商標)) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (*Amitus hesperidum*) + TX、アナグルス・アトムス (*Anagrus atomus*) + TX、アナギルス・フスシベントリス (*Anagyrus fusciventris*) + TX、アナギルス・カマリ (*Anagyrus kamali*) + TX、*Anagyrus loeckii* + TX、アナギルス・シュードコッカス (*Anagyrus pseudococchi*) (*Citripar* (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (*Anicetus benefices*) + TX、ゾウムシコガネコバチ (*Anisopteromalus calandrae*) + TX、アントコリス・ネモラリス (*Anthocoris nemoralis*) (*Anthocoris-System* (登録商標)) + TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) (*Apheline* (登録商標)) + TX、*Aphiline* (登録商標)) + TX、アフエリヌス・アシキス (*Aphelinus asychis*) + TX、アフイジウス・コレマニ (*Aphidius colemani*) (*Aphipar* (登録商標)) + TX、エルビアブラバチ (*Aphidius ervi*) (*Ervipar* (登録商標)) + TX、アフイジウス・ギフエンシス (*Aphidius gifuensis*) + TX、アフイジウス・マトリカリアエ (*Aphidius matricariae*) (*Aphipar-M* (登録商標)) + TX、アフイドレテス・アフイディマイザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (*Aphidend* (登録商標)) + TX、アフイドレテス・アフイディマイザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (*Aphidoline* (登録商標)) + TX、アフイチス・リングナネンシス (*Aphytis lingnanensis*) + TX、アフイチス・メリヌス (*Aphytis melinus*) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウイイ (*Aplostocetus hagenowii*) + TX、アセタ・コリアリア (*Athetacoriaria*) (*Staphyline* (登録商標)) + TX、マルハナバチ属の種 (*Bombus spp.*) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (*Natupol Beehive* (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (*Beeline* (登録商標)) + TX、*Tripol* (登録商標)) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (*Cephalonomia stephanoderis*) + TX、チノコルス・ニグリツス (*Chilocorus nigritus*) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysoline* (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysopa* (登録商標)) + TX、クリソベルラ・ルフイラブリス (*Chrysoperla rufilabris*) + TX、シロスピルス・インゲヌウス (*Cirrospilus ingenuus*) + TX、シロスピルス・クアドリストリアツス (*Cirrospilus quadristriatus*) + TX、シトロステクス・フィロクニストイデス (*Citrostichus phyllocnistoides*) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (*Closterocerus chamaeleon*) + TX、クロステロセルス属 (*Closterocerus spp.*) + TX、コシドキシセノイデス・ペルミヌツス (*Coccidoxenoides perminutus*) (*Planopar* (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウペリ (*Coccophagus cowperi*) + TX、コッコファグス・リシムニア (*Coccophagus lycimnia*) + TX、キアシサムライコマユバチ (*Cotesia flavipes*) + TX、コナガサムライコマユバチ (*Cotesia plutellae*) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (*Cryptobug* (登録商標)) + TX、*Cryptoline* (登録商標)) + TX、キムネタマキスイ (*Cybocephalus nipponicus*) + TX、ハモグリコマユバ

10

20

30

40

50

チ (*Dacnusa sibirica*) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*Minusa* (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Diminex* (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (*Delphastus catalinae*) (*Delphastus* (登録商標)) + TX、デルファスツス・プシルス (*Delphastus pusillus*) + TX、ジアカスミモルファ・クラウシイ (*Diachasmimorpha krausii*) + TX、ジアカスミモルファ・ロンギカウダタ (*Diachasmimorpha longicaudata*) + TX、ジアパルシス・ジュクンダ (*Diaparsis jucunda*) + TX、ジアホレンシルツス・アリガレンシス (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Miglyphus* (登録商標)) + TX、*Digline* (登録商標)) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*DacDigline* (登録商標)) + TX、*Minex* (登録商標)) + TX、ディベルシネルブス属 (*Diversinervus* spp.) + TX、エンカルシア・シトリナ (*Encarsia citrina*) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max* (登録商標)) + TX、*Encarline* (登録商標)) + TX、*En-Strip* (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Enermix* (登録商標)) + TX、エンカルシア・グアデロウパエ (*Encarsia guadeloupae*) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス (*Encarsia haitiensis*) + TX、ホソヒラタアブ (*Episyrphus balteatus*) (*Syrphidend* (登録商標)) + TX、エレットモセリス・シフォニニ (*Eretmoceris siphonini*) + TX、エレットモセルス・カリフォルニクス (*Eretmocerus californicus*) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Erca* *l* (登録商標)) + TX、*Eretline e* (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Bemimix* (登録商標)) + TX、エレットモセルス・ハヤチ (*Eretmocerus hayati*) + TX、エレットモセルス・ムンヅス (*Eretmocerus mundus*) (*Bemipar* (登録商標)) + TX、*Eretline m* (登録商標)) + TX、エレットモセルス・シフォニニ (*Eretmocerus siphonini*) + TX、エキソコムス・クアドリプスツラツス (*Exochomus quadripustulatus*) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Spiden* *d* (登録商標)) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Feltiline* (登録商標)) + TX、フォピウス・アリサヌス (*Fopius arisanus*) + TX、フォピウス・セラチチボルス (*Fopius ceratitivorus*) + TX、ホルモノネチン (*Wirless Beehome* (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (*Franklinothrips vespiformis*) (*Vespop* (登録商標)) + TX、ガレンドロムス・オクシデンタリス (*Galendromus occidentalis*) + TX、ゴニオズス・レグネリ (*Goniozus legneri*) + TX、シマメイガコマユバチ (*Habrobracon hebetor*) + TX、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*) (*HarmoBeetle* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (*Heterorhabditis* spp.) (*Lawn Patrol* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) (*NemaShield HB* (登録商標)) + TX、*Nemaseek* (登録商標)) + TX、*Terranem-Nam* (登録商標)) + TX、*Terranem* (登録商標)) + TX、*Larvanem* (登録商標)) + TX、*B-Green* (登録商標)) + TX、*NemAttack* (登録商標)) + TX、*Nematop* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・メジディス (*Heterorhabdit*

10

20

30

40

50

is megidis) (*Nemasys* H (登録商標) +TX、*BioNem* H (登録商標) +TX、*Exhibitline* hm (登録商標) +TX、*Larvane m-M* (登録商標)) +TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) +TX、ヒポアスピス・アクレイファー (*Hypoaspis aculeifer*) (*Aculeifer-System* (登録商標) +TX、*Entomite-A* (登録商標)) +TX、ヒポアスピス・ミルス (*Hypoaspis miles*) (*Hypoline m* (登録商標) +TX、*Entomite-M* (登録商標)) +TX、ルバリア・レウコスポイデス (*Lbalia leucospoides*) +TX、レカノイデウス・フロシムス (*Lecanoides floccissimus*) +TX、レモファグス・エラブンツス (*Lemophagus errabundus*) +TX、レプトマスチデア・アブノルミス (*Leptomastidea abnormis*) +TX、レプトマスチクス・ダクチロピィ (*Leptomastix dactylopii*) (*Leptopar* (登録商標)) +TX、レプトマスチクス・エポナ (*Leptomastix epona*) +TX、リンドルス・ロファンタエ (*Lindorus lophanthae*) +TX、リボレクシス・オレグマエ (*Lipolexis oregmae*) +TX、ルシリア・カエサル (*Lucilia caesar*) (*Natufly* (登録商標)) +TX、リシフレブス・テストケイペス (*Lysiphlebus testaceipes*) +TX、マクロロフス・カリギノス (*Macrolophus caliginosus*) (*Mirical-N* (登録商標) +TX、*Macroline c* (登録商標) +TX、*Mirical* (登録商標)) +TX、メソセイウルス・ロンギペス (*Mesoseiulus longipes*) +TX、メタフィクス・フラプス (*Metaphycus flavus*) +TX、メタフィクス・ロウンズブリィ (*Metaphycus lounsburyi*) +TX、ミクロムス・アングラツス (*Micromus angulatus*) (*Milacewing* (登録商標)) +TX、ミクロテリス・フラプス (*Microterys flavus*) +TX、ムシディフラクス・ラポトレルス (*Muscidifurax raptorellus*) 及びスパランギア・カメロニ (*Spalangia cameroni*) (*Biopar* (登録商標)) +TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (*Neodryinus typlocybae*) +TX、ミヤコカブリダニ (*Neoseiulus californicus*) +TX、ネオセイウルス・ククメリス (*Neoseiulus cucumeris*) (*THRYPEX* (登録商標)) +TX、ネオセイウルス・ファラシス (*Neoseiulus fallacis*) +TX、ネシディオコリス・テヌイス (*Nesideocoris tenuis*) (*NesidioBug* (登録商標) +TX、*Nesibug* (登録商標)) +TX、オフィラ・アエネセンス (*Ophyra aenescens*) (*Biofly* (登録商標)) +TX、シノビハナカメムシ (*Orius insidiosus*) (*Thripor-I* (登録商標) +TX、*Oriline i* (登録商標)) +TX、エルヒメハナカメムシ (*Orius laevigatus*) (*Thripor-L* (登録商標) +TX、*Oriline l* (登録商標)) +TX、オリウス・マジュスクルス (*Orius majusculus*) (*Oriline m* (登録商標)) +TX、タイリクヒメハナカメムシ (*Orius strigicollis*) (*Thripor-S* (登録商標)) +TX、パウエシア・ジュニペロルム (*Pauesia juniperorum*) +TX、ペディオビウス・ホベオレツス (*Pediobius foveolatus*) +TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (*Phasmarhabditis hermaphrodita*) (*Nemaslug* (登録商標)) +TX、フィマスチクス・コフエア (*Phymastichus coffea*) +TX、フィトセイウルス・マクロピルス (*Phytoseiulus macropilus*) +TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (*Spidex* (登録商標) +TX、*Phytoline p* (登録商標)) +TX、ポディスス・マクリベントリス (*Podisus maculiventris*) (*Podisus* (登録商標)) +TX、シューダクテオン・クルバツス (*Pseud*

10

20

30

40

50

acteon curvatus) + TX、シューダクテオン・オブツス (*Pseudacteon obtusus*) + TX、シューダクテオン・トリクスピス (*Pseudacteon tricuspis*) + TX、シューダフィクス・マクリペンニス (*Pseudaphycus maculipennis*) + TX、シュードレプトマスティクス・メキシカーナ (*Pseudleptomastix mexicana*) + TX、サイラエファグス・ピロス (*Psyllaephagus pilosus*) + TX、サイタリア・コンコロール (*Psytalia concolor*) (複合体) + TX、クアドラスティクス属の種 (*Quadrastichus spp.*) + TX、リゾビウス・ロファンタエ (*Rhyzobius lophanthae*) + TX、ベダリアテントウ (*Rodolia cardinalis*) + TX、オオクビキレガイ (*Rumina decollate*) + TX、セミエラケア・ペティオラツス (*Semielacher petiolatus*) + TX、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) (*Ervibank* (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・カルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (*Nematac C* (登録商標)) + TX、*Millenium* (登録商標) + TX、*BioNem C* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemastar* (登録商標) + TX、*Capsanem* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (*NemaShield* (登録商標) + TX、*Nemasy S F* (登録商標) + TX、*BioNem F* (登録商標) + TX、*Steinernema-System* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemaplus* (登録商標) + TX、*Exhibitline sf* (登録商標) + TX、*Scia-rid* (登録商標) + TX、*Entonem* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・クラッセイ (*Steinernema kraussei*) (*Nemasy L* (登録商標) + TX、*BioNem L* (登録商標) + TX、*Exhibitline srb* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (*BioVector* (登録商標) + TX、*BioVektor* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (*Nematac S* (登録商標)) + TX、スタイナーネマ属の種 (*Steinernema spp.*) + TX、スタイナーネマチド属の種 (*Steinernematid spp.*) (*Guardian Nematodes* (登録商標)) + TX、ステルス・プンクチルム (*Stethorus punctillum*) (*Stethorus* (登録商標)) + TX、タマリキシア・ラジアタ (*Tamarixia radiata*) + TX、テトラスティクス・セティファー (*Tetrastichus setifer*) + TX、トリポビウス・セミルテウス (*Thripobius semiluteus*) + TX、トリムス・シネンシス (*Torymus sinensis*) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricholine b* (登録商標)) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricho-Strip* (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ (*Trichogramma evanescens*) + TX、トリコグラマ・ミヌツム (*Trichogramma minutum*) + TX、アワノメイガタマゴバチ (*Trichogramma ostriniae*) + TX、トリコグラマ・プラトネリ (*Trichogramma platneri*) + TX、トリコグラマ・プレチオスム (*Trichogramma pretiosum*) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (*Xanthopimpla stemmator*) ;
 以下を含む他の生物剤：アブシジン酸 + TX、*bioSea* (登録商標) + TX、コンドロステレウム・ブルプレウム (*Chondrostereum purpureum*) (*Chontrol Paste* (登録商標)) + TX、コレトトリクム・グレオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*) (*Collegeo* (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (*Cueva* (登録商標)) + TX、デルタトラップ (*Trapline d* (登録商標)) + TX、エルウィニア・アミロボラ (*E*

10

20

30

40

50

rwinia amylovora) (ハルピン) (ProAct (登録商標) +TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標) +TX、エクストラバージンオリーブ油の天然副生成物由来の脂肪酸 (FLIPPER (登録商標) +TX、リン酸第二鉄 (Ferri-phosphate) (Ferramol (登録商標) +TX、ファネルトラップ (Trapline y (登録商標) +TX、Gallex (登録商標) +TX、Grower's Secret (登録商標) +TX、ホモブラシノリド (Homobrassonolide) +TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標) +TX、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標) +TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (Microctonus hyperodae) +TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (Mycoleptodiscus terrestris) (Des-X (登録商標) +TX、BioGain (登録商標) +TX、Aminomite (登録商標) +TX、Zenox (登録商標) +TX、フェロモントラップ (Thripline ams (登録商標) +TX、炭酸水素カリウム (MilStop (登録商標) +TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標) +TX、ケイ酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標) +TX、ヨウ化カリウム+チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標) +TX、SuffOil-X (登録商標) +TX、クモ毒+TX、ノセマ・ロクスタエ (Nosema locustae) (Semaspore Organic Grasshopper Control (登録商標) +TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標) +TX、Rebell Amarillo (登録商標) +TX及びトラップ (Takitrapi line y + b (登録商標) +TX ;

10

20

30

40

50

(1) 以下の群から選択される抗細菌剤 :

(1.1) その例は以下のとおりであるバクテリア: Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) からのバチルス・モハベンシス (Bacillus mojavensis) 菌株R3B (受入番号NCAIM (P) B001389) (国際公開第2013/034938号) +TX ; バチルス・プミルス (Bacillus pumilus) 、特にNRRL受入番号50185を有する菌株BU F-33 (BASF製のCARTISSA (登録商標) 製品の一部として入手可能、EPA登録番号71840-19) +TX ; バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 、特に菌株QST713/AQ713 (Bayer CropScience LP, USからのSERENADE OPTI又はSERENADE ASOとして入手可能、NRRL受入番号B21661を有する、米国特許第6,060,051号明細書) +TX ; バチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) 菌株BU1814 (BASF SE製のVELONDIS (登録商標) PLUS、VELONDIS (登録商標) FLEX及びVELONDIS (登録商標) EXTRAとして入手可能) +TX ; 受入番号DSM10271を有するバチルス・サブチリス・var. アミロリクエファシエンス (Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens) 菌株FZB24 (NovozymesからTAEGRO (登録商標) 又はTAEGRO (登録商標) ECO (EPA登録番号70127-5) として入手可能) +TX ; Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) からのバチルス・サブチリス (Bacillus subtilis) CX-9060+TX ; バチルス属の一種 (Bacillus sp.) 、特に菌株D747 (クミアイ化学工業株式会社製のDOUBLE NICKEL (登録商標) として入手可能) 、受入番号FERM BP-8234を有する、米国特許第7,094,592号明細書+TX ; 受入番号NRRL B-50972又は受入番号NRRL B-67129を有するパエニバシラス属の一種 (Paenibacillus sp.) 菌株、国際公開第2016/154297号+TX ; パエニバチルス・ポリミクサ (Paenibacillus polymyxa) 、特に菌株AC-1 (例えばGreen Biotech Company Ltd. 製のTOPSEED (登録商標)) +TX ; パントエア・アグロメランス (Pantoea agglomerata

ns)、特に菌株E325(受入番号NRRL B-21856)(Northwest Agri Products製のBLOOMTIME BIOLOGICAL(商標)FD BIOPESTICIDEとして入手可能)+TX; Sourcon Padenaからのシュードモナス・プロラディクス(Pseudomonas proradix)(例えばPRORADIX(登録商標))+TX;並びに

(1.2)その例は以下のとおりである真菌:アウレオバシジウム・プルランス(Aureobasidium pullulans)、特に菌株DSM14940の分芽胞子、菌株DSM14941の分芽胞子又は菌株DSM14940及びDSM14941の分芽胞子の混合物(例えば、bio-ferm, CH製のBOTECTOR(登録商標)及びBLOSSOM PROTECT(登録商標))+TX;シュードザイマ・アフィジス(Pseudozyma aphidis)(Yissum Research Development Company of the Hebrew University of Jerusalemによる国際公開第2011/151819号に開示されている)+TX;Lesaffre et Compagnie, FRからのサッカロマイセス・セレビシエ(Saccharomyces cerevisiae)、特に菌株CNCM番号1-3936、CNCM番号1-3937、CNCM番号1-3938又はCNCM番号1-3939(国際公開第2010/086790号);

10

(2)以下の群から選択される生物学的殺菌・殺カビ剤:

(2.1)その例は以下のとおりであるバクテリア:アグロバクテリウム・ラジオバクター(Agrobacterium radiobacter)菌株K84(例えばAgBioChem, CA製のGALLTROL-A(登録商標))+TX;アグロバクテリウム・ラジオバクター(Agrobacterium radiobacter)菌株K1026(例えばBASF SE製のNOGALL(商標))+TX;受入番号DSM10271を有するバチルス・サブチリス・var. アミロリケファシエンス(Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens)菌株FZB24(NovozymesからTAEGRO(登録商標)又はTAEGRO(登録商標)ECO(EPA登録番号70127-5)として入手可能)+TX;バチルス・アミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens)、特に菌株D747(クマイイ化学工業株式会社からDouble Nickel(商標)として入手可能、受入番号FERM BP-8234を有する、米国特許第7,094,592号明細書)+TX;バチルス・アミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens)菌株F727(菌株MBI110としても公知である)(NRRL受入番号B-50768、国際公開第2014/028521号)(Marrone Bio Innovations製のSTARGUS(登録商標))+TX;バチルス・アミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens)菌株FZB42、受入番号DSM23117(ABITEP, DEからRHIZOVIITAL(登録商標)として入手可能)+TX;バチルス・アミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens)アイソレートB246(例えばUniversity of Pretoria製のAVOGREEN(商標))+TX;バチルス・リケニホルミス(Bacillus licheniformis)、特に受入番号ATCC55406を有する菌株SB3086、国際公開第2003/000051号(NovozymesからECOGUARD(登録商標)Biofungicide及びGREEN RELEAF(商標)として入手可能)+TX+TX;バチルス・リケニホルミスFMCH001(Bacillus licheniformis FMCH001)及びバチルス・サブチリスFMCH002(Bacillus subtilis FMCH002)(FMC Corporation製のQUARTZO(登録商標)(WG)及びPRESENCE(登録商標)(WP))+TX;バチルス・メチロトロフィカス(Bacillus methylotrophicus)菌株BAC-9912(Chinese Academy of Sciences' Institute of Applied Ecology製)+TX;Certis USA LLC(三井物産

20

30

40

50

株式会社の子会社)からのバチルス・モハベンシス (*Bacillus mojavensis*) 菌株 R3B (受入番号 NCAIM (P) B001389) (国際公開第 2013/034938 号) + TX; バチルス・マイコイデス (*Bacillus mycooides*)、アイソレート、受入番号 B-30890 を有する (Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) から BMJ TGA I (登録商標) 又は WG 及び Life Guard (商標) として入手可能) + TX; バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株 QST2808 (Bayer Crop Science LP, US から SONATA (登録商標) として入手可能、受入番号 NRRL B-30087 を有する、米国特許第 6,245,551 号明細書に記載) + TX; バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株 GB34 (Bayer AG, DE から Yield Shield (登録商標) として入手可能) + TX; バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に NRRL 受入番号 50185 を有する菌株 BU F-33 (BASF からの CARTISSA 製品の一部として入手可能、EPA 登録番号 71840-19) + TX; バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 QST713/AQ713 (Bayer Crop Science LP, US から SERENADE OPTI 又は SERENADE ASO として入手可能、NRRL 受入番号 B21661 を有する、米国特許第 6,060,051 号明細書に記載) + TX; バチルス・サブチリス Y1336 (*Bacillus subtilis* Y1336) (Bion-Tech, Taiwan から BIOBAC (登録商標) WP として入手可能、登録番号 4764、5454、5096 及び 5277 で、台湾において生物学的殺菌・殺カビ剤として登録されている) + TX; バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 MBI 600 (BASF SE から SUBTILEX として入手可能)、受入番号 NRRL B-50595 を有する、米国特許第 5,061,495 号明細書 + TX; バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 GB03 (Bayer AG, DE から Kodiak (登録商標) として入手可能) + TX; バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 BU1814 (BASF SE から VELONDIS (登録商標) PLUS、VELONDIS (登録商標) FLEX 及び VELONDIS (登録商標) EXTRA として入手可能) + TX; Certis USA LLC (三井物産株式会社の子会社) からのバチルス・サブチリス CX-9060 (*Bacillus subtilis* CX-9060) + TX; バチルス・サブチリス KTSB (*Bacillus subtilis* KTSB) 菌株 (Donaghys 製の FOLIACTIVE (登録商標)) + TX; バチルス・サブチリス IAB/BS03 (*Bacillus subtilis* IAB/BS03) (STK Bio-Ag Technologies 製の AVIV (商標)、Idai Nature 製の PORTENTO (登録商標)) + TX; バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 Y1336 (Bion-Tech, Taiwan 製の BIOBAC (登録商標) WP として入手可能、登録番号 4764、5454、5096 及び 5277 で、台湾において生物学的殺菌・殺カビ剤として登録されている) + TX; BASF SE からのパエニバチル・スエピフィチカス (*Paenibacillus epiphyticus*) (国際公開第 2016/020371 号) + TX; BASF SE からのパエニバチルス・ポリミクサブランタルム (*Paenibacillus polymyxa* ssp. *plantarum*) (国際公開第 2016/020371 号) + TX; 受入番号 NRRL B-50972 又は受入番号 NRRL B-67129 を有するパエニバチルス属の一種 (*Paenibacillus* sp.) 菌株、国際公開第 2016/154297 号 + TX; シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) 菌株 AFS009、受入番号 NRRL B-50897 を有する、国際公開第 2017/019448 号 (例えば、AgBio Innovations, US 製の HOWLER (商標) 及び ZIO (登録商標)) + TX; シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*)、特に菌株 MA342 (例えば Bioagri and Koppert

10

20

30

40

50

によるCEDOMON（登録商標）、CERALL（登録商標）及びCEDRESS（登録商標））+TX；シュードモナス・フルオレッセンス（*Pseudomonas fluorescens*）菌株A506（例えばNuFarmによるBLIGHTBAN（登録商標）A506）+TX；シュードモナス・プロラディクス（*Pseudomonas proradix*）（例えばSourcon Padena製のPRORADIX（登録商標））+TX；ストレプトマイセス・グリセオビリディス（*Streptomyces griseoviridis*）菌株K61（ストレプトマイセス・ガルブス（*Streptomyces galbus*）菌株K61としても公知である）（受入番号DSM7206）（VerderaからのMYCOSTOP（登録商標）、BioWorks製のREFERENCE（登録商標）、Crop Protection 2006, 25, 468-475を参照されたい）+TX；ストレプトマイセス・リディクス（*Streptomyces lydicus*）菌株WYEC108（ストレプトマイセス・リディクス（*Streptomyces lydicus*）菌株WYCD108USとしても公知である）（Novozymes製のACTINO-IRON（登録商標）及びACTINOVATE（登録商標））+TX；並びに

（2.2）その例は以下のとおりである真菌：アムペロマイセス・キスクアリス（*Ampelomyces quisqualis*）、特に菌株AQ 10（例えばIntrachemBio ItaliaによるAQ 10（登録商標））+TX；受入番号CNCM 1-807を有するアムペロマイセス・キスクアリス（*Ampelomyces quisqualis*）菌株AQ10（例えば、IntrachemBio ItaliaによるAQ 10（登録商標））+TX；アスペルギルス・フラブス（*Aspergillus flavus*）菌株NRRL 21882（Syngenta／ChemChina製のAFLA-GUARD（登録商標）として知られる製品）+TX；アウレオバシジウム・プルランス（*Aureobasidium pullulans*）、特に菌株DSM 14940の分芽胞子+TX；アウレオバシジウム・プルランス（*Aureobasidium pullulans*）、特に菌株DSM 14941の分芽胞子+TX；アウレオバシジウム・プルランス（*Aureobasidium pullulans*）、特に菌株DSM 14940及びDSM 14941の分芽胞子の混合物（例えばbio-ferm, CHによるBotector（登録商標））+TX；ケトミウム・クプレウム（*Chaetomium cupreum*）（受入番号CABI 353812）（例えばAgrilifeによるBIOKUPRUM（商標））+TX；カエトミウム・グロボスム（*Chaetomium globosum*）（RivaleによるRIVADIOM（登録商標）として入手可能）+TX；クラドスポリウム・クラドスポリオイデス（*Cladosporium cladosporioides*）、菌株H39、受入番号CBS 122244を有する、米国特許出願公開第2010／0291039号明細書（Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek）+TX；コニオチリウム・ミニタンス（*Coniothyrium minitans*）、特に菌株CON／M／91-8（受入番号DSM9660、例えばBayer Crop Science Biologics GmbH製のContans（登録商標））+TX；クリプトコッカス・フラベセンス（*Cryptococcus flavescens*）、菌株3C（NRRL Y-50378）（B2.2.99）+TX；ダクチラリア・カンジダ（*Dactylaria Candida*）+TX；ジロホスホラ・アロペクリ（*Dilophosphora alopecuri*）（TWIST FUNGUS（登録商標）として入手可能）+TX；フザリウム・オキシスポルム（*Fusarium oxysporum*）、菌株Fo47（Natural Plant ProtectionによるFUSACLEAN（登録商標）として入手可能）+TX；グリオクラジウム・カテヌラタム（*Gliocladium catenulatum*）（同義語：クロノスタキス・ロゼアf. カテヌラータ（*Clonostachys rosea* f. *catenulate*））菌株J1446（例えばLallemmandによるPrestop（登録商標））+TX；グリオクラジウム・ロセウム（*Gliocladium ros*

10

20

30

40

50

eum) (クロノスタキスロゼア・フロゼア (*Clonostachys rosea* f. *rosea*) としても公知である)、特に菌 *Adjuvants Plus* からの株 321U、Xue に開示されている菌株 ACM941 (*Efficacy of Clonostachys rosea strain ACM941 and fungicide seed treatments for controlling the root rot complex of field pea*, *Can Jour Plant Sci* 83 (3) : 519-524) 又は菌株 IK726 (*Jensen DF, et al. Development of a biocontrol agent for plant disease control with special emphasis on the near commercial fungal antagonist Clonostachys rosea strain 'IK726'*, *Australas Plant Pathol.* 2007, 36: 95-101) + TX; 菌株 KV01 のレカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (過去には、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) として公知) 分生子 (例えば *Koppert / Arysta* による *Vertalec* (登録商標)) + TX; メツシュニコウィア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に菌株 NRRL Y-30752、(B2.2.3) + TX; ミクロスファエロプシス・オクラセア (*Microsphaeropsis ochracea*) + TX; ムスコドル・ロセウス (*Muscodora rosea*)、特に菌株 A3-5 (受入番号 NRRL 30548) + TX; BASF SE からのペニシリウム・ステッキイ (*Penicillium steckii*) (DSM 27859、国際公開第 2015/067800 号) + TX; ペニシリウム・ベルミクラツム (*Penicillium vermiculatum*) + TX; カミカワタケ (*Phlebiopsis gigantea*) 菌株 VRA 1992 (*Danstar Ferment* 製の ROTSTOP (登録商標) C) + TX; ピチ・アアノマラ (*Pichia anomala*)、菌株 WRL-076 (NRRL Y-30842)、米国特許第 7,579,183 号明細書 + TX; シュードジマ・フロクロッサ (*Pseudozyma flocculosa*)、菌株 PF-A22 UL (*Plant Products Co., CA* による SPORODEX (登録商標) L として入手可能) + TX; サッカロマイセス・セレビスエ (*Saccharomyces cerevisiae*)、特に菌株 LASO2 (*Agro-Levures et Derives*)、菌株 LAS117 細胞壁 (*Lesaffre* 製の CEREVISANE (登録商標)、BASF SE 製の ROMEO (登録商標))、*Lesaffre et Compagnie, FR* からの菌株 CNCM 番号 1-3936、CNCM 番号 1-3937、CNCM 番号 1-3938、CNCM 番号 1-3939 (国際公開第 2010/086790 号) + TX; シンプリシリウム・ラノソニヴェウム (*Simplificillium lanosoniveum*) + TX; タラロマイセス・フラバス (*Talaromyces flavus*)、菌株 V117b + TX; トリコデルマ・アスペレロイデス JM41R (*Trichoderma asperelloides* JM41R) (受入番号 NRRL B-50759) (BASF SE 製の TRICHO PLUS (登録商標)) + TX; トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*)、特に、菌株 kd (例えば *Andermatt Biocontrol* からの T-Gro) + TX; トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*)、特に菌株 SKT-1、受入番号 FERM P-16510 を有する (例えば *クミアイ化学工業株式会社* 製の ECO-HOPE (登録商標))、菌株 T34 (例えば *Biocontrol Technologies S.L., ES* による T34 Biocontrol) 又は *Isagro* からの菌株 ICC 012 + TX; トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に菌株 SC1 (受入番号 CBS 122089 を有する、国際公開第 2009/116106 号及び米国特許第 8,431,120 号明細書 (*Bi-PA*))、菌株 77B (*Andermatt Biocontrol* からの T

10

20

30

40

50

77) 又は菌株 LU132 (例えば Agrimm Technologies Limited からの Sentinel) +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 CNCM 1-1237 (例えば Agrauxine, FR からの Esquive (登録商標) WP) +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株番号 V08/002387 +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 NMI 番号 V08/002388 +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 NMI 番号 V08/002389 +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 NMI 番号 V08/002390 +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 LC52 (例えば Agrimm Technologies Limited による Tenet) +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 ATCC 20476 (IMI 206040) +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 T11 (IMI 352941/CECT20498) +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 SKT-1 (FERM P-16510)、特開平11-253151号公報 +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 SKT-2 (FERM P-16511)、特開平11-253151号公報 +TX; トリコデルマ・アトロビリデ (Trichoderma atroviride)、菌株 SKT-3 (FERM P-17021)、特開平11-253151号公報 +TX; トリコデルマ・フェルティル (Trichoderma fertile) (例えば BASF 製の製品 TrichoPlus) +TX; トリコデルマ・ガムシイ (Trichoderma gamsii) (旧名 T. ヴィリデ (T. viride))、菌株 ICC080 (IMI CC 392151 CABI、例えば AGROBIOSOL DE MEXICO, S. A. DE C. V. による BioDerma) +TX; トリコデルマ・ガムシイ (Trichoderma gamsii) (旧名 T. ヴィリデ (T. viride))、菌株 ICC 080 (IMI CC 392151 CABI) (AGROBIOSOL DE MEXICO, S. A. DE C. V. による BIODERMA (登録商標) として入手可能) +TX; トリコデルマ・ハルマツム (Trichoderma harmatum) +TX; 受入番号 ATCC 28012 を有する トリコデルマ・ハルマツム (Trichoderma harmatum) +TX; トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) 菌株 T-22 (例えば Andermatt Biocontrol 又は Koppert からの Trianum-P) 又は菌株 Cepa SimbT5 (Simbiose Agro) +TX; トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) +TX; トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ T39 (Trichoderma harzianum rifai T39) (例えば Makhteshim, US 製の Trichodex (登録商標)) +TX; トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum)、菌株 ITEM 908 (例えば Koppert からの Trianum-P) +TX; トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum)、菌株 TH35 (例えば Mycontrol による Root-Pro) +TX; トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum)、菌株 DB103 (Dagut at Biolab により T-GRO (登録商標) 7456 として入手可能) +TX; トリコデルマ・ポリスポルム (Trichoderma polysporum)、菌株 IMI 206039 (例えば BINAB Bio-Innovation AB, Sweden による Binab TF WP) +TX; 受入番号 Ts3550 を有する トリコデルマ・ストロマチクム (Trichoderma stromaticum) (例えば CEPLAC, Brazil による Tricovab) +TX; トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (グリオクラジウム・ビレ

10

20

30

40

50

ンス (*Gliocladium virens*) としても公知である)、特に菌株 GL-21 (例えば Certis, US による SoilGard) + TX; トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*) 菌株 G-41、過去にグリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) として公知 (受入番号 ATCC 20906) (例えば、BioWorks, US 製の ROOTSHIELD (登録商標) PLUS WP 及び TURFSHIELD (登録商標) PLUS WP) + TX; トリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*)、菌株 TV1 (例えば Koppert による Trianium-P) + TX; トリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*)、特に菌株 B35 (Pietr et al., 1993, Zesz. Nauk. ARW Szczecinie 161:125-137) + TX; トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 ICC 012 (トリコデルマ・ハルジアヌム ICC 012 (*Trichoderma harzianum* ICC 012) としても公知である)、受入番号 CABI CCIMI 392716 を有する、トリコデルマ・ガムシ (*Trichoderma gamsii*) (旧名 T. ヴィリデ (*T. viride*)) 菌株 ICC 080、受入番号 IMI 392151 (例えば、Isagro USA, Inc. 製の BIO-TAM (商標) 及び Agrobiosol de Mexico, S.A. de C.V. による BIODERMA (登録商標)) の混合物 + TX; 受入番号 NM 99/06216 を有するウロクラディウム・オウデマンシ (*Ulocladium oudemansii*) 菌株 U3 (例えば、Botry-Zen Ltd, New Zealand による BOTRY-ZEN (登録商標) 及び BioWorks, Inc. 製の BOTRYSTOP (登録商標)) + TX; パーティシリウム・アルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*) (旧名 V. ダーリエ (*V. dahliae*))、受入番号 WCS 850 を有する菌株 WCS 850、Central Bureau for Fungal Cultures に寄託されている (例えば、Tree Care Innovations 製の DUTCH TRIG (登録商標)) + TX; ベルチシリウム・クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*) + TX;

(3) 以下の群から選択される植物の成長及び／又は植物の健康を改善する効果を有する生物学的防除剤:

(3.1) その例は以下のとおりであるバクテリア: アゾスピリルム・ブラシレンセ (*Azospirillum brasilense*) (例えば、KALO, Inc. 製の VIGOR (登録商標)) + TX; アゾスピリルム・リポフェルム (*Azospirillum lipoferum*) (例えば、TerraMax, Inc. 製の VERTEX-IF (商標)) + TX; アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、特に菌株 ZB-SK-5 + TX; アゾトバクター・クロオコッカム (*Azotobacter chroococcum*)、特に菌株 H23 + TX; アゾトバクター・ビネランジイ (*Azotobacter vinelandii*)、特に菌株 ATCC 12837 + TX; アゾトバクター・ビネランジイ (*Azotobacter vinelandii*) 及び クロストリジウム・パステウリアナム (*Clostridium pasteurianum*) の混合物 (Agrinos から INVIGO RATE (登録商標) として入手可能) + TX; バチルス・アミロリケファシエンズ pm414 (*Bacillus amyloliquefaciens* pm414) (Biofilm Crop Protection 製の LOLI-PEPTA (登録商標)) + TX; バチルス・アミロリケファシエンズ SB3281 (*Bacillus amyloliquefaciens* SB3281) (ATCC #PTA-7542、国際公開第 2017/205258 号) + TX; バチルス・アミロリケファシエンズ TJ1000 (*Bacillus amyloliquefaciens* TJ1000) (Novozymes から QUIKROOTS (登録商標) として入手可能) + TX; バチルス・アミロリケファシエンズ (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株 IN937a + TX; バチルス・アミロリケファシエンズ (*Bacillus*

10

20

30

40

50

amyloliquefaciens)、特に菌株FZB42(例えばABITEP, DE製のRHI ZOVITAL(登録商標))+TX;バチルス・アミロリケファシエンスBS27(Bacillus amyloliquefaciens BS27)(受入番号NRRL B-5015)+TX;バチルス・セレウス(Bacillus cereus)科の構成員EE128(NRRL番号B-50917)+TX;バチルス・セレウス(Bacillus cereus)科の構成員EE349(NRRL番号B-50928)+TX;バチルス・セレウス(Bacillus cereus)、特に菌株BP01(ATCC 55675、例えばArysta Lifescience, US製のMEPICHLOR(登録商標))+TX;バチルス・フィルムス(Bacillus firmus)、特に菌株CNMC 1-1582(例えばBASF SE製のVOTIVO(登録商標))+TX;バチルス・マイコイデスBT155(Bacillus mycooides BT155)(NRRL番号B-50921)+TX;バチルス・マイコイデスEE118(Bacillus mycooides EE118)(NRRL番号B-50918)+TX;バチルス・マイコイデスEE141(Bacillus mycooides EE141)(NRRL番号B-50916)+TX;バチルス・マイコイデスBT46-3(Bacillus mycooides BT46-3)(NRRL番号B-50922)+TX;バチルス・プミルス(Bacillus pumilus)、特に菌株QST2808(受入番号NRRL番号B-30087)+TX;バチルス・プミルス(Bacillus pumilus)、特に菌株GB34(例えばBayer Crop Science, DE製のYIELD SHIELD(登録商標))+TX;バチルス・シアメンシス(Bacillus siamensis)、特に菌株KCTC 13613T+TX;バチルス・サブチリス(Bacillus subtilis)、特に菌株QST713/AQ713(NRRL受入番号B-21661を有し、及び米国特許第6,060,051号明細書に記載、Bayer Crop Science LP, USからSERENADE(登録商標)OPTI又はSERENADE(登録商標)ASOとして入手可能)+TX;バチルス・サブチリス(Bacillus subtilis)、特に菌株AQ30002(受入番号NRRL B-50421を有し、及び米国特許出願公開第13/330,576号明細書に記載)+TX;バチルス・サブチリス(Bacillus subtilis)、特に菌株AQ30004(並びにNRRL B-50455及び米国特許出願公開第13/330,576号明細書に記載)+TX;バチルス・サブチリス(Bacillus subtilis)菌株BU1814、(BASF SEからTEQUALIS(登録商標)として入手可能)、枯草菌rm303(Bacillus subtilis rm303)(Biofilm Crop Protection製のRHI ZOMAX(登録商標))+TX;バチルス・チューリンゲンシスBT013A(Bacillus thuringiensis BT013A)(NRRL番号B-50924)(バチルス・チューリンゲンシス4Q7(Bacillus thuringiensis 4Q7)としても公知である)+TX;バチルス・リケニホルミスFMCH001(Bacillus licheniformis FMCH001)及びバチルス・サブチリスFMCH002(Bacillus subtilis FMCH002)の混合物(FMC CorporationからQUARTZO(登録商標)(WG)、PRESENCE(登録商標)(WP)として入手可能)+TX;バチルス・サブチリス(Bacillus subtilis)、特に菌株MBI 600(例えばBASF SE製のSUBTILEX(登録商標))+TX;バチルス・テキレンシス(Bacillus tequilensis)、特に菌株NII-0943+TX;ダイズ根粒菌(Bradyrhizobium japonicum)(例えばNovozymes製のOPTIMIZE(登録商標))+TX;デルフィア・アシドボランス(Delftia acidovorans)、特に菌株RAY209(例えばBrett Young SeedsからのBIOBOOST(登録商標))+TX;メソリゾビウム・シセリ(Mesorhizobium cicer)(例えば、BASF SEからのNODULATOR)+TX;ラクトバチルス属の一種(Lactob

10

20

30

40

50

acillus sp.) (例えば *LactopAFI* 製の *LACTOPLANT* (登録商標)) + TX; ヘアリーベッチ根粒菌 (*Rhizobium leguminosarium* biovar *viciae*) (例えば、*BASF SE* からの *NODULATOR*) + TX; シュードモナス・プロラディクス (*Pseudomonas prora dix*) (例えば *Sourcon Padena* 製の *PRORADIX* (登録商標)) + TX; 緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*)、特に菌株 *PN1* + TX; リゾビウム・レグミノサルム (*Rhizobium leguminosarum*)、特に *bv. viciae* 菌株 *Z25* (受入番号 *CECT 4585*) + TX; パエニバチルス・ポリミクサ (*Paenibacillus polymyxa*)、特に菌株 *AC-1* (例えば *Green Biotech Company Ltd.* 製の *TOPSEED* (登録商標)) + TX; セラチア・マルセセンス (*Serratia marcescens*)、特に菌株 *SRM* (受入番号 *MTCC 8708*) + TX; アルファルファ根粒菌 (*Sinorhizobium meliloti*) 菌株 *NRG-185-1* (*Bayer CropScience* 製の *NITRAGIN* (登録商標) *GOLD*) + TX; チオバチルス属の一種 (*Thiobacillus* sp.) (例えば *Cropaid Ltd UK* 製の *CROPAID* (登録商標)) + TX; 並びに

(3.2) その例は以下のとおりである真菌：プルプレオチリウム・リラシヌム (*Purpureocillium lilacinum*) (過去には、パエシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) として知られている) 菌株 *251* (*AGAL 89/030550*、例えば *Bayer CropScience Biologics GmbH* からの *BioAct*) + TX; ペニシリウム・ビライイ (*Penicillium bilaii*)、菌株 *ATCC 22348* (例えば *Acceleron BioAg* 製の *JumpStart* (登録商標))、タラロマイセス・フラバス (*Talaromyces flavus*)、菌株 *V117b* + TX; トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 *CNCM 1-1237* (例えば *Agrauxine, FR* 製の *Esquive* (登録商標) *WP*)、トリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*)、例えば菌株 *B35* (*Pietret al., 1993, Zesz. Nauk. ARW Szczecinie 161:125-137*) + TX; トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 *LC52* (トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 *LU132* としても公知である、例えば *Agrimm Technologies Limited* からの *Sentinel*) + TX; 国際特許出願 *PCT/イタリア特許出願公開第2008/000196* 号明細書に記載のトリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 *SC1* + TX; トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 *kd* (例えば *Andermatt Biocontrol* からの *T-Gro*) + TX; トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 *Eco-T* (*Plant Health Products, ZA*)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) 菌株 *T-22* (例えば *Andermatt Biocontrol* 又は *Koppert* からの *Triatum-P*) + TX; ミロテシウム・ベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 菌株 *AARC-0255* (例えば *Valent Biosciences* 製の *DiTera* (商標)) + TX; ペニシリウム・ビライイ (*Penicillium bilaii*) 菌株 *ATCC ATCC20851* + TX; ピシウム・オリガンDRAM (*Pythium oligandrum*) 菌株 *M1* (*ATCC38472*、例えば *Bioprepraty, CZ* からの *Polyversum*) + TX; トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*) 菌株 *GL-21* (例えば *Certis, USA* 製の *SoilGard* (登録商標)) + TX; バーティシリウム・アルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*) (旧名 *V. ダーリエ* (*V. dahliae*)) 菌株 *WCS850* (*CBS276.92*、例えば *Tree Care Inno*

10

20

30

40

50

vationsからのDutch Trig)+TX;トリコデルマ・アトロビリデ(Trichoderma atroviride)、特に菌株番号V08/002387、菌株番号NMI番号V08/002388、菌株番号NMI番号V08/002389、菌株番号NMI番号V08/002390+TX;トリコデルマ・ハルジアヌム(Trichoderma harzianum)菌株ITEM 908、トリコデルマ・ハルジアヌム(Trichoderma harzianum)、菌株TSTh20+TX;トリコデルマ・ハルジアヌム(Trichoderma harzianum)菌株1295-22+TX;ピシウム・オリガンDRAM(Pythium oligandrum)菌株DV74+TX;リゾポゴン・アミロポゴン(Rhizopogon amyloporogon)(例えばHelena Chemical CompanyからのMycosolに含まれている)+TX;リゾポゴン・フルビグレバ(Rhizopogon fulvigleba)(例えばHelena Chemical CompanyからのMycosolに含まれている)+TX;トリコデルマ・ビレンス(Trichoderma virens)菌株GI-3+TX;

10

(4) 以下から選択される殺虫的に有効な生物学的防除剤

(4.1) その例は以下のとおりであるバクテリア:アグロバクテリウム・ラジオバクター(Agrobacterium radiobacter)菌株K84(AgBiochem Inc.からのGalltrol)+TX;バチルス・アミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens)、特に菌株PTS-4838(例えばValent Biosciences, USからのAVEO)+TX;バチルス・フィルムス(Bacillus firmus)、特に菌株CNMC1-1582(例えばBASF SE製のVOTIVO(登録商標))+TX;Bacillus mycoides, isolate J.(例えばCertis USA LLC(三井物産株式会社の子会社)からのBmJ)+TX;バチルス・スファエリクス(Bacillus sphaericus)であって、特にSerotype H5a5b菌株2362(菌株ABTS-1743)(例えばValent BioSciences, US製のVECTOLEX(登録商標))+TX;バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ(Bacillus thuringiensis subsp. aizawai)、特に菌株ABTS-1857(SD-1372、例えばValent BioSciences製のXENTARI(登録商標))+TX;バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ(Bacillus thuringiensis subsp. aizawai)、特にserotype H-7(例えばValent BioSciences, US製のFLORBAC(登録商標)WG)+TX;バチルス・チューリングエンシスイスラエレンシス(Bacillus thuringiensis israelensis)菌株BMP 144(例えばBecker Microbial Products, ILによるAQUABAC(登録商標))+TX;バチルス・チューリングエンシス亜種イスラエレンシス(Bacillus thuringiensis subsp. israelensis)(serotype H-14)菌株AM65-52(受入番号ATCC 1276)(例えばValent BioSciences, USによるVECTOBAC(登録商標))+TX;バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ(Bacillus thuringiensis subsp. aizawai)菌株GC-91+TX;バチルス・チューリングエンシスvar. コルメリ(Bacillus thuringiensis var. Colmeri)(例えばChangzhou Jiaanghai Chemical FactoryによるTIANBAOBTCT)+TX;バチルス・チューリングエンシスvar. ジャポネンシス(Bacillus thuringiensis var. japonensis)菌株Buibui+TX;Becker Microbial Products, ILからのバチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ(Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)菌株BMP 123+TX;Becker Microbial Products, ILによるバチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ(Baci

20

30

40

50

llus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 BMP 123、例えば Bayer Crop Science からの BARITONE+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 HD-1 (例えば Valent Bio Sciences, US 製の DIPEL (登録商標) ES)+TX; パチルス・チューリングエンシス var. クルスターキ (*Bacillus thuringiensis var. kurstaki*) 菌株 EVB-113-19 (例えば、AEF Global 製の BIOPROTEC (登録商標))+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 ABTS351+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 PB 54+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 SA 11、(Certis, US からの JAVELIN)+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 SA 12 (Certis, US からの THURICIDE)+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 EG2348 (Certis, US からの LEPINOX)+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) 菌株 EG 784 1 (Certis, US からの CRYMAX)+TX; パチルス・チューリングエンシス亜種 テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) 菌株 NB176 (SD-5428、例えば BioFaf DE 製の NOVODOR (登録商標) FC)+TX; プレビパチルス・ラテロスポラス (*Brevibacillus laterosporus*) (Ecolibrium Biologicals からの LATERAL)+TX; バークホルデリア属の種 (*Burkholderia* spp.)、特に バークホルデリア・リノジェンシス (*Burkholderia rinojensis*) 菌株 A396 (バークホルデリア・リノジェンシス (*Burkholderia rinojensis*) 菌株 MBI 305 としても公知である) (受入番号 NRRL B-50319+TX; 国際公開第 2011/106491 号及び国際公開第 2013/032693 号+TX; 例えば Marrone Bio Innovations 製の MBI206 TGA1 及び ZELTO (登録商標)+TX; クロモバクテリウム・サブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*)、特に 菌株 PRAA4-1T (MBI-203+TX; 例えば Marrone Bio Innovations 製の GRANDEVO (登録商標))+TX; レカニシリウム・ムスカリウム Ve6 (*Lecanicillium muscarium* Ve6) (Koppert からの MYCOTAL)+TX; パエニパチルス・ポピリエ (*Paenibacillus popilliae*) (旧名 パチルスポピリエ (*Bacillus popilliae*))+TX; 例えば St. Gabriel Laboratories 製の MILKY SPORE POWDER (商標) 及び MILKY SPORE GRANULAR (商標)+TX; パスツリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) 菌株 Pn1 (Syngenta/ChemChina からの CLARIVA)+TX; セラチア・エントモフィラ (*Serratia entomophila*) (例えば Wrightson Seeds による INVADÉ (登録商標))+TX; セラチア・マルセセンス (*Serratia marcescens*)、特に 菌株 SRM (受入番号 MTCC 8708)+TX; トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) (Novozymes からの TRICHODERMAX)+TX; ボルバキア・ピピエンティス (*Wolbachia pipientis*) ZAP 菌株 (例えば、MosquitoMate 製の ZAP MALES (登録商標))+TX; 並びに

10

20

30

40

50

(4.2) 例が以下のものである真菌：ベアウベリア・バッシアナ (*Beauveria bassiana*) 菌株 ATCC 74040 (例えば Intrachem Bio Italia 製の NATURALIS (登録商標)) + TX; ベアウベリア・バッシアナ (*Beauveria bassiana*) 菌株 GHA (受入番号 ATCC 74250、例えば Laverlam International Corporation 製の BOTANIGUARD (登録商標) ES 及び MYCONTROL-O (登録商標)) + TX; ベアウベリア・バッシアナ (*Beauveria bassiana*) 菌株 ATP02 (受入番号 DSM 24665) + TX; SePRO からのイサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*) (過去には、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) として知られている) 菌株 Apopka 97) PREFERAL + TX; メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*) 3213-1 (NRRL 受入番号 67074 で寄託されている) (国際公開第 2017/066094 号 + TX; Pioneer Hi-Bred International) + TX; メタリジウム・ロベルツイイ (*Metarhizium robertsii*) 15013-1 (NRRL 受入番号 67073 で寄託されている) + TX; メタリジウム・ロベルツイイ (*Metarhizium robertsii*) 23013-3 (NRRL 受入番号 67075 で寄託されている) + TX; パエシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株 251 (Certis, US からの MELOCON) + TX; ズーフトラ・ラジカンス (*Zoophthora radicans*) + TX;

(5) 以下からなる群から選択されるウイルス：リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) (リンゴコカクモンハマキ) グラニューローシスウイルス (GV) + TX; コドリング (*Cydia pomonella*) (コドリング) グラニューローシスウイルス (GV) + TX; オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) (オオタバコガ (cotton bollworm)) 核多角体病ウイルス (NPV) + TX; シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) (シロイチモジヨトウ) mNPV + TX; スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) (ツマジロクサヨトウ) mNPV + TX; エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) NPV + TX;

(6) 以下から選択される、植物又は植物部位又は植物組織に「接種株」として付加可能であり、その特定の特性のために、植物の成長及び植物の健康を促進させるバクテリア及び真菌：アグロバクテリウム (*Agrobacterium* spp.) + TX; アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*) + TX; アゾスピリillum 属の種 (*Azospirillum* spp.) + TX; アゾトバクター属の種 (*Azotobacter* spp.) + TX; ブラジリゾビウム属の種 (*Bradyrhizobium* spp.) + TX; バークホルデリア属の種 (*Burkholderia* spp.)、特にバークホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (過去には、シュードモナス・セパシア (*Pseudomonas cepacia*) として公知である) + TX; ギガスポラ属の種 (*Gigaspora* spp.) 又はギガスポラ・モノスポルム (*Gigaspora monosporum*) + TX; グロムス属の種 (*Glomus* spp.) + TX; キツネタケ属の種 (*Laccaria* spp.) + TX; ラクトバチルスブクネリ (*Lactobacillus buchneri*) + TX; パラグロムス属の種 (*Paraglomus* spp.) + TX; コツブタケ (*Pisolithus tinctorius*) + TX; シュードモナス属の種 (*Pseudomonas* spp.) + TX; リゾビウム属の種 (*Rhizobium* spp.)、特にクローバー根粒菌 (*Rhizobium trifolii*) + TX; ショウロ属の種 (*Rhizopogon* spp.) + TX; ニセシヨウロ属の種 (*Scleroderma* spp.) + TX; ヌメリイグチ属の種 (*Suillus* spp.) + TX; ストレプトマイセス属の種 (*Streptomyces* spp.) + TX;

(7) 以下から選択される、生物学的防除剤として使用可能である、タンパク質及び二次代謝産物を含む微生物により形成された植物抽出物及び生成物：ニンニク (*Allium sativum*) (Eco-SprayからのNEMGUARD) +TX; ADAMAからのBRALIC) +TX; Armour-Zen+TX; ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*) +TX; アザジラクチン (例えばCertis, USからのAZATIN XL) +TX; Biokeeper WP+TX; アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特にアブラナ粉末又はマスタード粉末+TX; カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*) +TX; ケラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*) +TX; ケンボジウム・アンテルミンチウム (*Chenopodium anthelminticum*) +TX; キチン+TX; セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*) +TX; スギナ (*Equisetum arvense*) +TX; Fortune Aza+TX; Fungastop+TX; Heads Up (キヌア (*Chenopodium quinoa*) サポニン抽出物) +TX; PROBLAD (ルピナス種子由来の天然のBladポリペプチド)、Certis EU+TX; FRACTURE (ルピナス種子由来の天然のBladポリペプチド)、FMC+TX; ジョチュウギク／ピレトリン+TX; クアッシア・アマラ (*Quassia amara*) +TX; コナラ属 (*Quercus*) +TX; キラヤ属 (*Quillaja*) 抽出物 (BASFからのQL AGRI 35) +TX; オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (Marro ne BioからのREGALLIA／REGALIA MAXX) +TX; 「Requiem (商標) Insecticide」+TX; ロテノン+TX; リアニア／リアノジン+TX; ヒレハリソウ (*Symphytum officinale*) +TX; タンジー (*Tanacetum vulgare*) +TX; チモール+TX; ゲラニオールと混合したチモール (Eden ResearchからのCEDROZ) +TX; ゲラニオール及びオイゲノールと混合したチモール (Eden ResearchからのMEVAL ONE) +TX; Triact 70+TX; TriCon+TX; キンレンカ (*Tropaneulium majus*) +TX; メラレウカ・アルテルニフォリア (*Melaleuca alternifolia*) 抽出物 (STKからのTIMOREX GOLD) +TX; セイヨウイラクサ (*Urtica dioica*) +TX; ベラトリン+TX; 及びセイヨウヤドリギ (*Viscum album*) +TX; 並びに

ベノキサコール+TX、クロキントセット (クロキントセットメキシルを含む) +TX、シブロスルファミド+TX、ジクロルミド+TX、フェンクロラゾール (フェンクロラゾール-エチルを含む) +TX、フェンクロリム+TX、フルキソフェニム+TX、フリラゾール+TX、イソキサジフェン (イソキサジフェン-エチルを含む) +TX、メフェンピル (メフェンピル-ジエチルを含む) +TX、メトカミフェン+TX及びオキサベトリニル+TXなどの毒性緩和剤。

10

20

30

40

50

【0346】

上記の混合物は、有害生物を防除する方法に使用可能であり、この方法は、上記の混合物を含む組成物を有害生物又はその環境に適用する工程を含むが、手術又は治療による人又は動物の身体の治療の方法及び人又は動物の身体において実施される診断方法を除く。

【0347】

表A-1～A-3、B-1～B-3、C-1～C-3、D-1～D-3、E-1～E-3及びF-1～F-3並びに表Pから選択される式Iの化合物と、上記の1種以上の有効成分を含む混合物は、例えば、単一のレディミックス形態において、「タンクミックス」など、単一の有効成分の別個の配合物から組成される組み合わせられたスプレー混合物として、及び、逐次、すなわち数時間又は数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の有効成分の併用で施用可能である。表A-1～A-3、B-1～B-3、C-1～C-3、D-1～D-3、E-1～E-3及びF-1～F-3並びに表Pから選択される式Iの化合物と上記の有効成分との適用順序は、本発明の実施に重要ではない。

【0348】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば非エポキシ化又はエポキシ化植物油（例えば、エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又は大豆油）、消泡剤、例えばシリコン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤及び／又は粘着付与剤、肥料又は特定の効果を得るための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤又は除草剤などのさらなる固体又は液体助剤も含み得る。

【0349】

本発明に係る組成物は、例えば、固体有効成分を粉碎し、篩にかけ、及び／又は圧縮することにより、助剤の非存在下において、及び例えば有効成分を1つ又は複数の助剤と均質混合し、及び／又は粉碎することにより、少なくとも1つの助剤の存在下においてそれ自体公知の方法で調製される。この組成物の調製のためのこれらの方法及びこれらの組成物の調製のための化合物Ⅰの使用も本発明の主題である。

10

【0350】

この組成物のための施用方法、すなわち噴霧、霧化、散布、はけ塗り、粉衣、拡散又は注ぎかけ（これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである）など、上記のタイプの有害生物を防除する方法及び上記のタイプの有害生物を防除するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1～1000 ppm、好ましくは、0.1～500 ppmの有効成分である。1ヘクタール当たりの施用量は、一般に、1ヘクタール当たり1～2000 gの有効成分、特に10～1000 g / ha、好ましくは、10～600 g / haである。

【0351】

20

作物保護の分野における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用（葉面施用）であり、該当する有害生物による寄生の危険性に合わせて施用頻度及び施用量を選択することができる。代わりに、有効成分は、植物の生息地に液体組成物を灌注することにより、又は固体形態の有効成分を植物の生息地、例えば土壤中に例えば粒剤の形態で導入すること（土壌施用）により、根系（全身作用）を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。

【0352】

本発明の化合物及びその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば果実、塊茎又は穀粒などの種子又は苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。代わりに、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することによって又は固体組成物の層を塗布することによって種子仁に塗付され得る（コーティング）。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を例えばドリルまき時に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法及びこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物及び防除される有害生物／真菌に応じて決まり、一般に、100 kgの種子当たり1～200グラム、好ましくは、100 kgの種子当たり5～150グラム（100 kgの種子当たり10～100グラムなど）である。

30

【0353】

種子という用語は、真正種子、種子片、吸枝、トウモロコシ粒、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽などを含むが、これらに限定されないあらゆる種類の種子及び植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

40

【0354】

本発明は、式（Ⅰ）の化合物で被覆若しくは処理されるか又はそれを含有する種子も含む。「で被覆又は処理されるか及び／又はそれを含有する」という用語は、一般に、有効成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、有効成分を吸収し得る。実施形態において、本発明により、式（Ⅰ）の化合物が付着された植物繁殖材料が利用可能とされている。さらに、これにより、式（Ⅰ）の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能とされている。

50

【0355】

種子処理は、種子粉衣、種子粉衣、種子散粉、種子液浸及び種子ペレット化などの技術分野において公知であるすべての好適な種子処理技術を含む。式（I）の化合物の種子処理適用は、吹付けなどのいずれか公知の方法により、又は、播種の前若しくは種子の播種／植え付けの最中における種子の散粉により実施可能である。

【0356】

生物学的実施例：

以下の実施例により本発明を例示する。本発明の特定の化合物は、低施用量で効力が高いことにより公知の化合物と区別可能であり、これは、実施例において概述されている実験手法を用い、必要に応じて例えば50ppm、24ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm又は0.2ppmといったより少ない施用量を用いて、当業者により検証可能である。

【0357】

実施例B1：ニカメイガ（*Chilo suppressalis*）（ニカメイチュウ）に対する活性

人工餌料の入った24ウェルマイクロタイタープレートに、ピペットにより、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2幼虫を外寄生させた（ウェル当たり6～8匹）。サンプルを、未処理のサンプルと比して、外寄生の6日後に、死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害のカテゴリの少なくとも1つが未処理のサンプルよりも高い場合に、テストサンプルによるニカメイガ（*Chilo suppressalis*）の防除がもたらされている。

【0358】

以下の化合物が、200ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：P1、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17。

【0359】

実施例B2：ジアブロチカバルテアタ（*Diabrotica balteata*）（コーンルートワーム）に対する活性

24ウェルマイクロタイタープレート中における寒天層の上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2幼虫（ウェル毎に6～10匹）を外寄生させた。未処理のサンプルと比して、外寄生の4日後に、サンプルを死亡率及び成長阻害について評価した。

【0360】

以下の化合物が、200ppmの施用量で、2種のカテゴリ（死亡率又は成長阻害）の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17。

【0361】

実施例B3：ユースキスツスヘロス（*Euschistus heros*）（ネオトロピカルブラウスティンクバグ（*Neotropical Brown Stink Bug*））に対する活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥後、葉にN2若虫を外寄生させた。未処理のサンプルと比して、外寄生の5日後に、サンプルを死亡率及び成長阻害について評価した。

【0362】

以下の化合物が、200ppmの施用量で、2つのカテゴリの少なくとも一方（死亡率又は成長阻害）において、少なくとも80%の効果をもたらした：P2、P4、P11、

P 1 5。

【 0 3 6 3 】

実施例 B 4：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) に対する活性 摂食／接触活性

ヒマワリの葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシの個体群を寄生させた。サンプルを、寄生の 6 日後に死亡率について評価した。

【 0 3 6 4 】

以下の化合物が 200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の死亡率をもたらした：P 1、P 2、P 3、P 4、P 12、P 14。

【 0 3 6 5 】

実施例 B 5：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ) に対する活性 人工餌料の入った 24 ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、コナガの卵をプラスチック製のステンシルを介してゲル吸い取り紙上にピペットし、プレートをこれで閉じた。未処理のサンプルと比較して、外寄生から 8 日後に、サンプルを死亡率及び成長阻害について評価した。

【 0 3 6 6 】

以下の化合物が、200 ppm の施用量で、2つのカテゴリの少なくとも一方（死亡率又は成長阻害）において、少なくとも 80 % の効果をもたらした：P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 17。

【 0 3 6 7 】

実施例 B 6：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) に対する活性

綿の葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に 5 匹の L1 幼虫を寄生させた。サンプルを、未処理のサンプルと比して、外寄生の 3 日後に、死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害のカテゴリの少なくとも 1 つが未処理のサンプルよりも高い場合に、テストサンプルによるエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除がもたらされている。

【 0 3 6 8 】

以下の化合物が、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の防除をもたらした：P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 17。

10

20

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/072481

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. **C07D491/056 C07D471/04 A01N43/38 A01N43/42 A01N43/50**
A01N43/56

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.
A	WO 2021/140122 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION AG [CH]) 15 July 2021 (2021-07-15) page 113 to page 118; table P; compounds P1 to P38 page 149 to page 151; biological examples B1 to B12 claims 1, 2, 6-9, 15-18 -----	1-20

☐ 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

11 November 2022

Date of mailing of the international search report

22/11/2022

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

Cortés Suárez, José

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2022/072481

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2021140122 A1	15-07-2021	AR 120982 A1	06-04-2022
		AU 2021205610 A1	28-07-2022
		BR 112022013436 A2	13-09-2022
		CA 3163813 A1	15-07-2021
		CN 115023426 A	06-09-2022
		CO 2022009504 A2	08-07-2022
		EP 4087841 A1	16-11-2022
		KR 20220124757 A	14-09-2022
		TW 202132300 A	01-09-2021
		WO 2021140122 A1	15-07-2021

フロントページの続き

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,N
E,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,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,IR,IS,IT,J
M,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,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,T
H,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100123766

弁理士 松田 七重

(74)代理人 100212509

弁理士 太田 知子

(72)発明者 シケルヴァル ヴィカス

イギリス アールジー 4 2 6 イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル
インターナショナル リサーチ センター内

(72)発明者 ミューレバッハ ミシェル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ

(72)発明者 ヒューター オットマー フランツ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ

(72)発明者 シュトラー アンドレ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ

(72)発明者 エメリー ダニエル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ

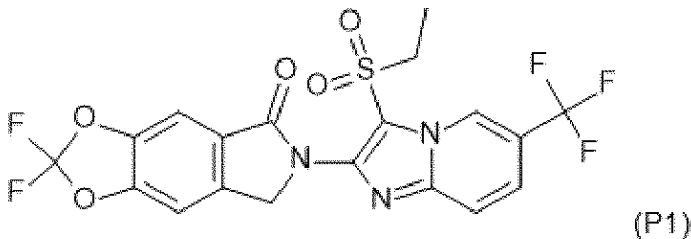
(72)発明者 サスマル スフルネンドゥ

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム サンタ モニカ ワークス内

Fターム (参考) 2B121 AA11 CC02 EA26 FA20

4H011 AC01 BB10

【要約の続き】



である。さらに、本発明は、式 (I) の化合物を含む農薬組成物、これらの組成物の調製、及び、農業又は園芸における、特に昆虫といった節足動物、軟体動物、線虫又は代表的なダニ目 (Acarina) を含む動物有害生物を駆除、予防又は防除するための化合物又は組成物の使用に関する。