

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5936675号
(P5936675)

(45) 発行日 平成28年6月22日 (2016. 6. 22)

(24) 登録日 平成28年5月20日 (2016. 5. 20)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 471/04 (2006. 01)
 C O 7 D 487/04 (2006. 01)
 C O 7 D 498/04 (2006. 01)
 C O 7 D 513/04 (2006. 01)
 A O 1 N 43/90 (2006. 01)

C O 7 D 471/04 1 O 7 A
 C O 7 D 471/04 C S P
 C O 7 D 487/04 1 4 4
 C O 7 D 487/04 1 4 8
 C O 7 D 498/04 1 O 3

請求項の数 18 (全 103 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2014-503146 (P2014-503146)
 (86) (22) 出願日 平成24年4月5日 (2012. 4. 5)
 (65) 公表番号 特表2014-515019 (P2014-515019A)
 (43) 公表日 平成26年6月26日 (2014. 6. 26)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2012/056253
 (87) 国際公開番号 W02012/136751
 (87) 国際公開日 平成24年10月11日 (2012. 10. 11)
 審査請求日 平成27年4月2日 (2015. 4. 2)
 (31) 優先権主張番号 61/473, 209
 (32) 優先日 平成23年4月8日 (2011. 4. 8)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 508020155
 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロピア
 BASF SE
 ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
 D-67056 Ludwigshafen, Germany
 (74) 代理人 100091096
 弁理士 平木 祐輔
 (74) 代理人 100118773
 弁理士 藤田 節
 (74) 代理人 100122389
 弁理士 新井 栄一

最終頁に続く

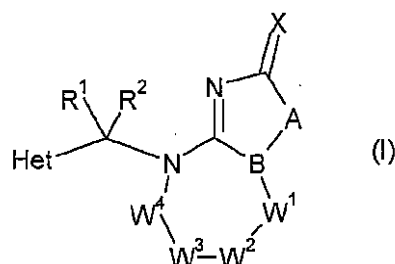
(54) 【発明の名称】 有害動物を駆除するためのN置換されたヘテロ二環式化合物および誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)で表されるN置換されたヘテロ二環式化合物：

【化 1】



(式中、

Xは、OまたはSであり；

Aは、O、S、NR³、CR⁴R⁵、A^{1a}-A^{1b}およびA^{2a}=A^{2b}からなる群から選択され、ここで、
 A^{1a}、A^{1b}は、それぞれO、S、NR³またはCR⁴R⁵から選択され、
 ただし、A^{1a}とA^{1b}とは、同時にOおよび/またはSを表さず、且つ
 A^{2a}、A^{2b}は、互いに独立して、NまたはCR⁶であり；

Bは、NまたはCR⁷であり；W¹、W²、W³およびW⁴は、NおよびBに結合し、これによって飽和もしくは不飽和の5員、6

員または7員のヘテロ環を形成する鎖状基を表し、ここで、

W^1 、 W^2 、 W^3 および W^4 は、それぞれ個別に

CR^6 、 CR^4R^5 、 N 、 NR^3 、 O 、 $S(O)_n$ または $C=Y$ を表し、ここで

Y は、 $C(R^6)_2$ 、 O 、 S または NR^3 から選択され、且つ

W^2 および W^3 はさらに、それぞれ個別に、または両方一緒に単結合または二重結合を表してもよく；

ただし

(i) W^1 、 W^2 、 W^3 および W^4 の2個以下は、同時に O 、 NR^3 、 $S(O)_n$ または $C=Y$ を表し、

且つ/または

(ii) W^1 、 W^2 、 W^3 および W^4 のうちの2個が O または $S(O)_n$ を表す場合、それらの間には少なくとも1個の炭素原子が存在し；

10

Hetは、環員として O 、 S および $N-R^3$ から選択される少なくとも1個のヘテロ原子基を有し、また場合により環員として1個または2個のさらなる N 原子を有する5員または6員の C 結合した飽和、不飽和または芳香族ヘテロ環であり、ここで、

上記のヘテロ環は、置換されていないか、またはその炭素原子において1個もしくは2個の基 R^8 を有し、ここで

R^8 は、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 CN 、 NO_2 、 $S(O)_mR^c$ 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ および $C(S)NR^aR^b$ からなる群から選択され、

20

ここで、上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基、アルキルチオ基、アルケニルオキシ基およびアルキニルオキシ基は、置換されていないか、部分的にもしくは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^1 、 R^2 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 CN 、 NO_2 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ 、 $C(S)NR^aR^b$ および $S(O)_mR^c$ からなる群から選択され、ここで、

上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基およびアルキルチオ基は、置換されていないか、部分的にもしくは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；あるいは

30

R^1 と R^2 は、それらが結合している炭素原子と共に3~6員の飽和炭素環を形成し、ここで、上記の炭素環のそれぞれの炭素原子は、置換されていないか、または1個もしくは2個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^3 が2個以上存在する場合、 R^3 は、互いに独立して、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 $C(O)R^c$ 、 $C(S)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ 、 $C(S)NR^aR^b$ ならびに $S(O)_mR^c$ および $S(O)_mNR^aR^b$ からなる群から選択され、ここで、

上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基およびアルキニル基は、置換されていないか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく、

40

R^4 、 R^5 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニルおよび C_2-C_6 -アルキニルからなる群から選択され、ここで、

上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基およびアルキニル基は、置換されていないか、部分的にまたは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^6 が2個以上存在する場合、 R^6 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシおよび C_1-C_6 -アルキルチオからなる群から選択され、ここで、上記の基の炭素原子は、置換されていないか、部分的にもしくは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^7 は、 R^6 について記載された意味の1つを有し、または

50

R^7 は、Bと W^1 が二重結合によって連結されるような隣接する原子 W^1 への結合を表し、ただし

ここで、 W^1 は、 CR^4R^5 、 NR^3 、O、 $S(O)_n$ または $C=Y$ を表さず；

R^a 、 R^b は、互いに独立して、水素、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -アルケニル、 C_3 - C_6 -ハロアルケニルおよび C_3 - C_6 -アルキニルからなる群から選択され；

R^c は、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -ハロアルケニルおよび C_2 - C_6 -アルキニルからなる群から選択され；

R^d は、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ、 C_2 - C_6 -アルケニルオキシ、 C_2 - C_6 -アルキニルオキシ、 C_1 - C_4 -アルキルチオ、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -アルキルチオ- C_1 - C_4 -アルキル(ここで、上記の10個の基の炭素原子は全て、置換されていないか、または部分的にもしくは完全にハロゲン化されていてもよい)、 NO_2 、 CN 、 NR^eR^f 、 $C(O)R^c$ 、 $C(S)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ 、 $C(S)NR^aR^b$ または $S(O)_mR^c$ 、 $S(O)_mNR^aR^b$ 、フェニル、ヘテロアリール、フェニル- C_1 - C_4 -アルキルおよびヘテロアリール- C_1 - C_4 -アルキル(ここで、最後の4つの基の環は、互いに独立して、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシおよび C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基を有していてもよい)からなる群から選択され；

R^e 、 R^f は、互いに独立して、水素、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -アルケニル、 C_3 - C_6 -ハロアルケニル、 C_3 - C_6 -アルキニル、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ および $C(S)NR^aR^b$ からなる群から選択され；

n 、 m は、0、1または2から選択される整数である)

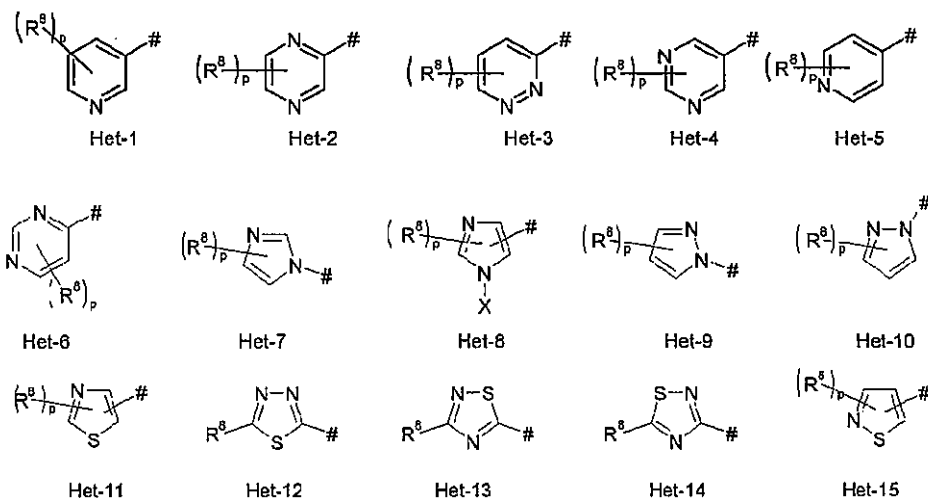
および/またはそれらのエナンチオマーもしくはジアステレオマーまたは農業上もしくは獣医学上許容可能な塩、

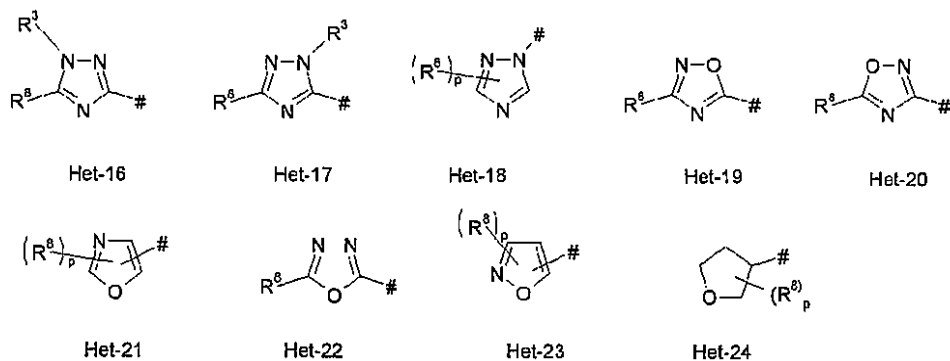
ただし、式(I)の化合物は、4-ピリジン-2-イルメチル-4H-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オンまたは4-チオフェン-2-イルメチル-4H-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オンを表さない。

【請求項2】

Hetが、式Het-1~Het-24：

【化2】





10

(式中、#は式(I)中の結合を表し、

pは、0、1または2であり；且つ

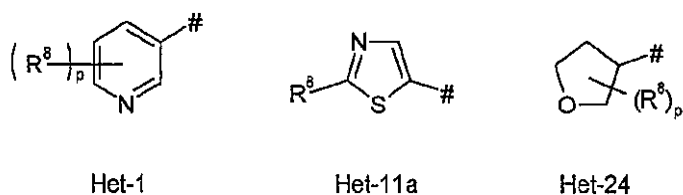
R⁸は、請求項1に定義される意味を有する)

で表される基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3】

Hetが、式Het-1、Het-11aおよびHet-24：

【化3】



20

(式中、#は式(I)中の結合を表し、

R⁸は、水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルコキシまたはC₁-C₄-アルキルから選択され、ここで、最後の2つの基の炭素原子は、部分的にもしくは完全にハロゲン化されていてよく；

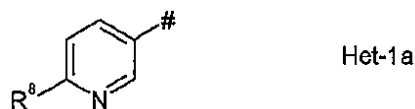
pは、0、1または2である)

で表される基からなる群から選択される、請求項2に記載の式(I)の化合物。

【請求項4】

Hetが、Het-1a：

【化4】



30

(式中、#は式(I)中の結合を表し、

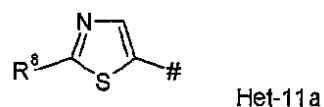
R⁸は、請求項1または3に定義されるとおりである)

である、請求項1または3に記載の式(I)の化合物。

【請求項5】

Hetが、Het-11a：

【化5】



40

(式中、#は式(I)中の結合を表し、

R⁸は、請求項1または3に定義されるとおりである)

である、請求項1または3に記載の式(I)の化合物。

【請求項6】

R¹、R²が、互いに独立して、水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキルおよびC₃-C₆-シクロアルキルからなる群から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記

50

載の式(I)の化合物。

【請求項7】

Aが、O、SまたはCH=CHから選択される、請求項1～6のいずれか1項に記載の式(I)の化合物。

【請求項8】

Bが、NまたはCR⁷であり、ここで
R⁷が、水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキルおよびC₁-C₄-ハロアルキルからなる群から選択される、請求項1～7のいずれか1項に記載の式(I)の化合物。

【請求項9】

BがCR⁷であり、ここで
R⁷は、BとW¹が二重結合によって連結されるような隣接する原子W¹への結合を表し、こ
こで

W¹はNまたはCR⁶であり、ここで

R⁶は、水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキルおよびC₁-C₄-ハロアルキルからなる群から選択される、請求項6に記載の式(I)の化合物。

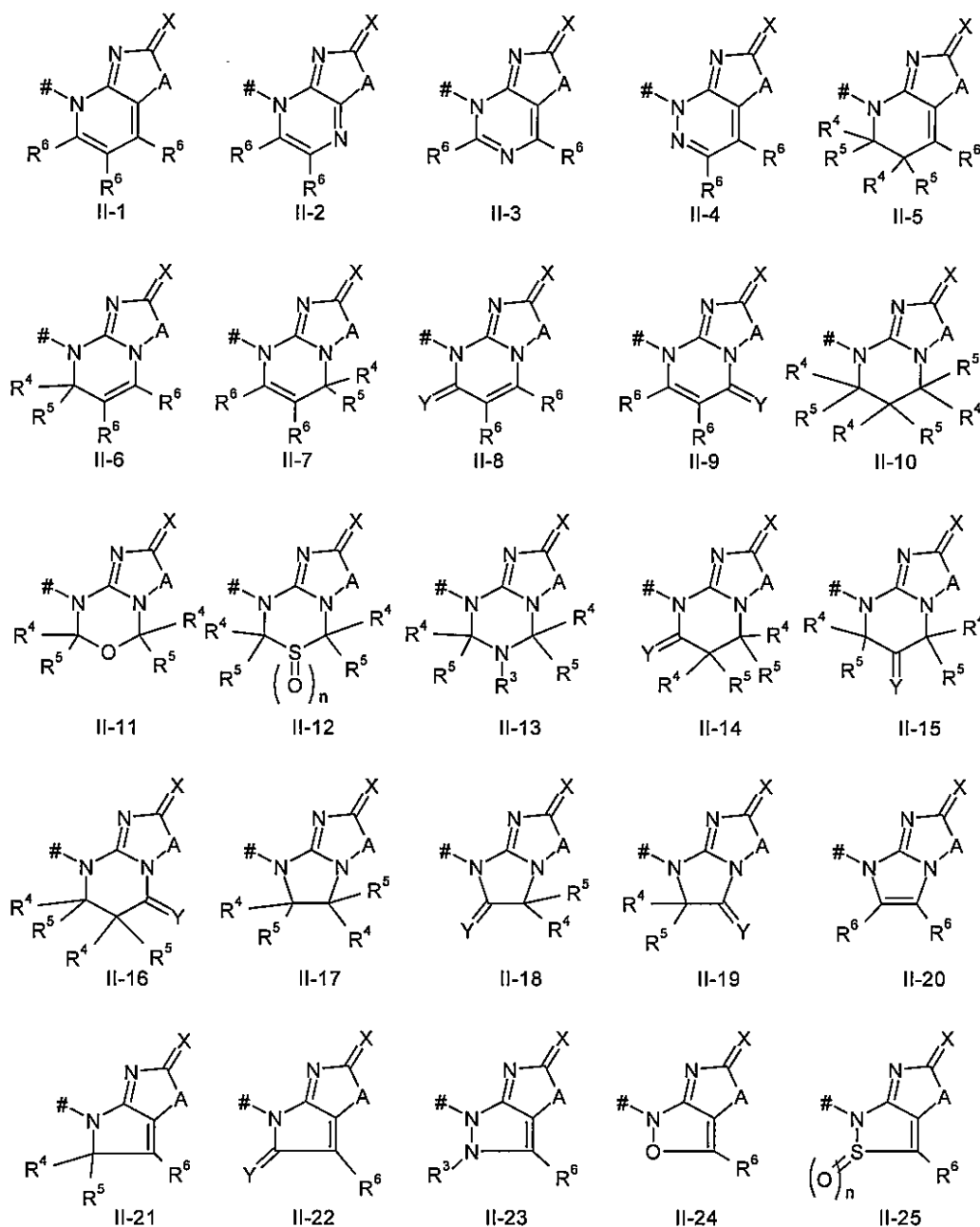
【請求項10】

請求項1～7のいずれか1項に記載の式(I)の化合物であって、式中、
W¹、W²、W³およびW⁴が、それらが結合しているNおよびBと共に、飽和もしくは不飽和の5員または6員のヘテロ環を形成し、ここで基B-W¹-W²-W³-W⁴-Nは、環化環と共に、式II-1～II-25：

10

20

【化 6】



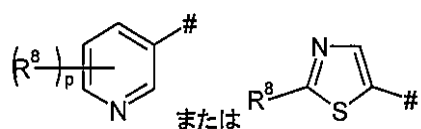
(式中、#は、分子の残りの部分への結合を表し、
R⁴、R⁵、R⁶は、互いに独立して、水素、ハロゲン、C₁-C₂-アルキルまたはC₁-C₂-ハロアルキルからなる群から選択される)

で表される基の群から選択される二環を形成する、前記化合物。

【請求項 11】

請求項 9 に記載の式(I)の化合物であって、式中、
Hetが、

【化 7】



(式中、
R⁸は、ハロゲン、C₁-C₄-アルキルおよびC₁-C₄-ハロアルキルからなる群から選択され、
pは、0、1または2である)

であり；

Aが、O、SまたはCH=CHであり；

Xが、OまたはSであり；且つ

R¹、R²が、互いに独立して、水素、メチル、エチルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、または

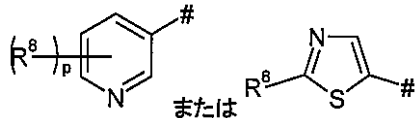
R¹とR²が、それらが結合している炭素原子と共にシクロプロパン環を形成する、前記化合物。

【請求項 1 2】

請求項 1 0 に記載の式(I)の化合物であって、式中、

Hetが、

【化 8】



(式中、

R⁸は、ハロゲンおよびC₁-C₄-ハロアルキルからなる群から選択され、且つ

pは、1、または2である)

であり；

Aが、OまたはSであり；

Xが、OまたはSであり；且つ

R¹、R²がいずれも水素である、

前記化合物。

【請求項 1 3】

少なくとも1種の請求項 1 ～ 1 2 のいずれか1項に定義される化合物と、少なくとも1種の不活性な液体および/または固体の許容可能な担体と、場合により、所望であれば少なくとも1種の界面活性剤とを含む、有害動物を駆除するための農業用または動物用組成物。

【請求項 1 4】

昆虫、クモ形類もしくは線虫の群の無脊椎有害動物またはそれらの餌供給源、生息地もしくは繁殖地を、殺有害生物有効量の少なくとも1種の請求項 1 ～ 1 2 のいずれか1項に定義される化合物と接触させることを含んでなる、該有害動物を駆除または防除する方法（ヒトの医療行為を除く）。

【請求項 1 5】

植物、または該植物が生育している土壌もしくは水を、殺有害生物有効量の少なくとも1種の請求項 1 ～ 1 2 のいずれか1項に定義される化合物と接触させることを含んでなる、生育している植物を、昆虫、クモ形類もしくは線虫の群の無脊椎有害動物による攻撃または侵入から保護する方法。

【請求項 1 6】

植物繁殖材料を、播種前および/または前発芽後に、少なくとも1種の請求項 1 ～ 1 2 のいずれか1項に定義される化合物と接触させることを含んでなる、植物繁殖材料、特に種子を土壌昆虫から保護し、苗の根および苗条を土壌昆虫および葉昆虫から保護する方法。

【請求項 1 7】

寄生生物に侵入されもしくは感染した動物を治療し、または動物が寄生生物に感染もしくは侵入されるのを予防し、または寄生生物による侵入もしくは感染から動物を保護する方法であって、該動物に、殺寄生生物有効量の請求項 1 ～ 1 2 のいずれか1項に定義される化合物を、経口的に、局所的にもしくは非経口的に投与もしくは適用することを含む、上記方法（ヒトの医療行為を除く）。

【請求項 1 8】

寄生生物に侵入されもしくは感染した動物を治療するため、動物が寄生生物に感染しも

10

20

30

40

50

しくは侵入されるのを予防するため、または寄生生物による侵入もしくは感染から動物を保護するための動物用組成物を製造するための、請求項1～12のいずれか1項に定義される化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、N置換されたヘテロ二環式化合物、そのエナンチオマー、ジアステレオマー、誘導体および塩、ならびにそのような化合物を含む組成物に関するものである。本発明は、有害動物を駆除するためのN置換されたヘテロ二環式化合物、その塩またはそれらを含む組成物の使用に関するものでもある。さらに本発明は、そのような化合物の施用方法

10

【背景技術】

【0002】

有害動物は、成長する作物および収穫された作物を破壊し、木造住宅および商業建築物を攻撃して、食物供給および財産に対する多大な経済的損失を生じさせるものである。多くの農薬が知られているが、標的とする有害生物がその薬剤に対する抵抗性を生じる能力を有するために、有害動物駆除のための新たな薬剤が常に必要とされている。特に、昆虫およびダニ類などの有害動物は、効果的に防除することが困難である。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

20

【0003】

従って本発明の目的は、特に防除が困難である昆虫およびダニ類に対して良好な殺有害生物活性を有する化合物を提供することにある。

【課題を解決するための手段】

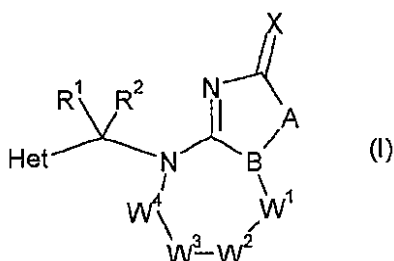
【0004】

これらの目的は、一般式IのN置換されたヘテロ二環式誘導体によって解決されることが見出された：

一般式(I)で表されるN置換されたヘテロ二環式化合物：

【化1】

30



【0005】

(式中、

Xは、OまたはSであり；

40

Aは、O、S、NR³、CR⁴R⁵、A^{1a}-A^{1b}およびA^{2a}=A^{2b}からなる群から選択され、ここで、

A^{1a}、A^{1b}は、それぞれO、S、NR³またはCR⁴R⁵から選択され、

ただし、A^{1a}とA^{1b}とは、同時にOおよび/またはSを表さず、且つ

A^{2a}、A^{2b}は、互いに独立して、NまたはCR⁶であり；

Bは、NまたはCR⁷であり；

W¹、W²、W³およびW⁴は、NおよびBに結合し、これによって飽和もしくは不飽和の5員、6員または7員のヘテロ環を形成する鎖状基を表し、ここで、

W¹、W²、W³およびW⁴は、それぞれ個別に

CR⁶、CR⁴R⁵、N、NR³、O、S(O)_nまたはC=Yを表し、ここで

Yは、C(R⁶)₂、O、SまたはNR³から選択され、且つ

50

W^2 および W^3 はさらに、それぞれ個別に、または両方一緒に単結合または二重結合を表してもよく；

ただし

(i) W^1 、 W^2 、 W^3 および W^4 の2個以下は、同時に0、 NR^3 、 $S(O)_n$ または $C=Y$ を表し、

且つ/または

(ii) W^1 、 W^2 、 W^3 および W^4 のうちの2個が0または $S(O)_n$ を表す場合、それらの間には少なくとも1個の炭素原子が存在し；

Hetは、環員として0、SおよびN- R^3 から選択される少なくとも1個のヘテロ原子基を有し、また場合により環員として1個もしくは2個のさらなるN原子を有する5員または6員のC結合した飽和、不飽和または芳香族ヘテロ環であり、ここで、

上記のヘテロ環は、置換されていないか、またはその炭素原子において1個もしくは2個の基 R^8 を有し、ここで

R^8 は、水素、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_2 - C_6 -アルケニルオキシ、 C_2 - C_6 -アルキニルオキシ、 C_1 - C_4 -アルキルチオ、CN、 NO_2 、 $S(O)_mR^c$ 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ および $C(S)NR^aR^b$ からなる群から選択され、

ここで、上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基、アルキルチオ基、アルケニルオキシ基およびアルキニルオキシ基は、置換されていないか、部分的にもしくは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^1 、 R^2 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルキルチオ、CN、 NO_2 、 $C(O)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ 、 $C(S)NR^aR^b$ および $S(O)_mR^c$ からなる群から選択され、ここで、

上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基およびアルキルチオ基は、置換されていないか、部分的にもしくは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；あるいは

R^1 と R^2 は、それらが結合している炭素原子と共に3~6員の飽和炭素環を形成し、ここで、上記の炭素環のそれぞれの炭素原子は、置換されていないか、または1個もしくは2個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^3 が2個以上存在する場合、 R^3 は、互いに独立して、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -ハロアルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル、 C_2 - C_6 -ハロアルキニル、 $C(O)R^c$ 、 $C(S)R^c$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $C(O)NR^aR^b$ 、 $C(S)NR^aR^b$ ならびに $S(O)_mR^c$ および $S(O)_mNR^aR^b$ からなる群から選択され、ここで、

上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基およびアルキニル基は、置換されていないか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく、

R^4 、 R^5 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニルおよび C_2 - C_6 -アルキニルからなる群から選択され、ここで、

上記のアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基およびアルキニル基は、置換されていないか、部分的にまたは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^6 が2個以上存在する場合、 R^6 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシおよび C_1 - C_6 -アルキルチオからなる群から選択され、ここで、上記の基の炭素原子は、置換されていないか、部分的にもしくは完全にハロゲン化されているか、または1、2もしくは3個の基 R^d の任意の組み合わせを有してよく；

R^7 は、 R^6 について記載された意味の1つを有し、または

R^7 は、Bと W^1 が二重結合によって連結されるような隣接する原子 W^1 への結合を表し、ただし

ここで、 W^1 は、 CR^4R^5 、 NR^3 、0、 $S(O)_n$ または $C=Y$ を表さず；

R^a 、 R^b は、互いに独立して、水素、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロ

10

20

30

40

50

アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-ハロアルケニルおよびC₃-C₆-アルキニルからなる群から選択され；

R^cは、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニルおよびC₂-C₆-アルキニルからなる群から選択され；

R^dは、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₄-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル(ここで、上記の10個の基の炭素原子は全て、置換されていないか、または部分的にもしくは完全にハロゲン化されていてもよい)、NO₂、CN、NR^eR^f、C(O)R^c、C(S)R^c、C(O)OR^a、C(O)NR^aR^b、C(S)NR^aR^bまたはS(O)_mR^c、S(O)_mNR^aR^b、フェニル、ヘテロアリール、フェニル-C₁-C₄-アルキルおよびヘテロアリール-C₁-C₄-アルキル(ここで、最後の4つの基の環は、互いに独立して、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシから選択される1、2、3、4または5個の置換基を有してよい)からなる群から選択され；

R^e、R^fは、互いに独立して、水素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C(O)R^c、C(O)OR^a、C(O)NR^aR^bおよびC(S)NR^aR^bからなる群から選択され；

n、mは、0、1または2から選択される整数である)

および/またはそれらのエナンチオマーもしくはジアステレオマーまたは農業上もしくは獣医学上許容可能な塩、

ただし、式(I)の化合物は、4-ピリジン-2-イルメチル-4H-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オンまたは4-チオフエン-2-イルメチル-4H-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オンを表さない。

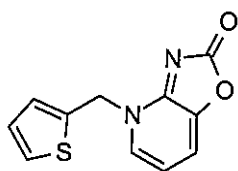
【0006】

このような殺虫活性を有する本発明のN置換されたヘテロ二環式化合物は、当技術分野において以前に報告されていない。

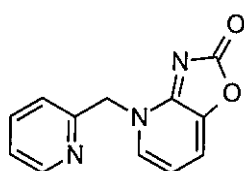
【0007】

CH 461489は、鎮痛特性および消炎特性を有するような医薬目的のオキサゾール誘導体の2つの例、すなわち4-ピリジン-2-イルメチル-4H-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オンおよび4-チオフエン-2-イルメチル-4H-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オン

【化2】



例 9b³)



例 11b³)

を示す。CH 461489に他のN置換されたヘテロ二環式誘導体は開示されておらず、またこの文献中の化合物のいずれについても殺有害生物活性は記載されていない。

【0008】

殺有害生物活性を有する置換エナミノ(チオ)カルボニル化合物が、DE 10 2006 015 467、DE 10 2006 015 470、WO2007/115647およびWO2009/121507に記載されている。殺有害生物活性イソオキサゾール誘導体が、DE 198 38 138に記載されている。殺虫環状カルボニルアミジンがWO 2010/005692に開示され、EP 0 259 738は、殺虫活性を有するヘテロ環式置換化合物について記載している。

【0009】

式IのN置換されたヘテロ二環式化合物およびその農業的に許容される塩は、有害動物、すなわち有害な節足動物および線虫、特に防除が困難な昆虫およびダニ類に対して非常に高い活性を有する。

【0010】

従って本発明は、一般式IのN置換されたヘテロ二環式化合物、その農業的または獣医学的に有用な塩、そのエナンチオマーまたはジアステレオマーに関するものである。

【0011】

さらに本発明は、下記の実施形態に関するものであり、その実施形態を含むものである。

【0012】

-ある量の少なくとも1種の式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩を含む農業組成物または動物用組成物;

-有害動物駆除における式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩の使用;

-有害動物、その生息場所、繁殖地、食物供給源、植物、種子、土壌、区域、有害動物が成長しているか成長する可能性がある資材もしくは環境、または動物の攻撃もしくは侵入から保護されるべき資材、植物、種子、土壌、表面もしくは空間を、殺有害生物有効量の少なくとも1種の式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含んでなる、有害動物の駆除方法;

-作物を、殺有害生物有効量の少なくとも1種の式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含んでなる、有害動物による攻撃または侵入から作物を保護する方法;

-播種前および/または前発芽後に種子を少なくとも1種の式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含んでなる、土壌昆虫からの植物繁殖物、特に種子の保護ならびに土壌および茎葉昆虫からの苗の根および芽の保護方法;

-式Iの化合物またはエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩を含む種子;

-動物の体内および表面における寄生物の駆除における式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは獣医学的に許容される塩の使用;

-殺寄生物有効量の式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーおよび/または獣医学的に許容される塩を動物に対して経口投与、局所投与もしくは非経口投与または施用することを含んでなる、寄生物による侵入または感染に対して動物を治療、管理、予防または保護する方法;

-殺寄生物有効量の式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーおよび/または獣医学的に許容される塩を、獣医学的用途に好適な担体組成物に添加することを含んでなる、寄生物による侵入または感染に対して動物を治療、管理、予防または保護するための動物用組成物の製造方法;

-寄生物による侵入または感染に対して動物を治療、管理、予防もしくは保護するための医薬を製造するための、式Iの化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーおよび/または獣医学的に許容される塩の使用。

【0013】

本発明は特に、少なくとも1種の式Iの化合物および/またはその農業的に許容される塩を含む植物繁殖材料、特に上記のとおり種子に関するものである。

【0014】

本発明は、式Iの化合物の全ての可能な立体異性体、すなわち単一のエナンチオマーまたはジアステレオマーならびにそれらの混合物に関するものである。

【0015】

本発明の化合物は、非晶質であってもよいし、あるいは1以上の異なる結晶状態(多形)または安定性などの異なる巨視的特性を有し得るか活性などの異なる生理特性を示し得る改変形態で存在していてもよい。本発明には、非晶質および結晶性の両方の式Iの化合物、個々の化合物Iの異なる結晶状態または改変形態の混合物、ならびにそれらの非晶質もしくは結晶性塩が含まれる。

【0016】

式Iの化合物の塩は、好ましくは農業的におよび/または獣医学的に許容される塩である。それらは、通常の方法で、例えば式Iの化合物が塩基性官能基を有する場合には化合物を対象のアニオンの酸と反応させることで、あるいは酸性の式Iの化合物を好適な塩基と反応させることで形成することができる。

【0017】

好適な農業的または獣医学的に有用な塩は特に、それらのカチオンの塩またはそれらの酸の酸付加塩であり、そのカチオンおよびアニオンはそれぞれ、本発明による化合物の作用に悪影響を及ぼさない。好適なカチオンは特に、アルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウムおよびカリウムのイオン、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム、マグネシウムおよびバリウムのイオン、そして遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛および鉄のイオン、さらにはアンモニウム(NH_4^+)および1~4個の水素原子が C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ヒドロキシアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、ヒドロキシ- C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、フェニルまたはベンジルで置換されている置換アンモニウムである。置換アンモニウムイオンの例には、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチルアンモニウム、ビス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウムおよびベンジルトリエチルアンモニウム、さらにはホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C_1 - C_4 -アルキル)スルホニウムおよびスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C_1 - C_4 -アルキル)スルホキソニウムなどがある。

【0018】

有用な酸付加塩のアニオンは、主として塩化物イオン、臭化物イオン、フッ化物イオン、硫酸水素イオン、硫酸イオン、リン酸二水素イオン、リン酸水素イオン、リン酸イオン、硝酸イオン、炭酸水素イオン、炭酸イオン、ヘキサフルオロケイ酸イオン、ヘキサフルオロリン酸イオン、安息香酸イオンならびに C_1 - C_4 -アルカン酸のアニオン、好ましくはギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオンおよび酪酸イオンである。それらは、式Iの化合物を、相当するアニオンの酸、好ましくは塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸または硝酸と反応させることで形成することができる。

【0019】

「ハロゲン」という用語のような、可変要素についての上記の定義で言及される有機部分は、個々の基員の個別のリストの総称である。接頭辞 C_n - C_m はいずれの場合も、基中の可能な炭素原子数を示す。

【0020】

「ハロゲン」は、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素を意味するものである。

【0021】

「部分的にもしくは完全ハロゲン化された」という用語は、ある基の1個以上、例えば1、2、3、4もしくは5個または全ての水素原子がハロゲン原子、特にフッ素もしくは塩素で置換されていることを意味する。

【0022】

本明細書で用いられる「 C_n - C_m -アルキル」という用語(さらに C_n - C_m -アルキルアミノ、ジ- C_n - C_m -アルキルアミノ、 C_n - C_m -アミノカルボニル、ジ-(C_n - C_m -アルキルアミノ)カルボニル、 C_n - C_m -アルキルチオ、 C_n - C_m -アルキルスルフィニルおよび C_n - C_m -アルキルスルホニルにおける C_n - C_m -アルキルでも)は、 $n \sim m$ 個、例えば1~10個の炭素原子、好ましくは1~6個の炭素原子を有する分枝鎖状または非分枝鎖状の飽和炭化水素基を指し、例えばメチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、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、1-エチル-2-メチルプロピル、ヘプチル、オクチル、2-エチルヘキシル、ノニルおよびデシルならびにそれらの異性体をさす。 C_1 - C_4 -アルキルは、例えばメチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピルまたは1,1-ジメチルエチルを意味する。

【0023】

本明細書で用いられる「 C_n - C_m -ハロアルキル」という用語（さらに C_n - C_m -ハロアルキルスルフィニルおよび C_n - C_m -ハロアルキルスルホニルにおける C_n - C_m -ハロアルキルでも）は、 $n \sim m$ 個の炭素原子、例えば1~10個、特に1~6個の炭素原子を有する直鎖状または分枝鎖状のアルキル基（上記した通り）であって、これらの基の水素原子の一部または全部が上記のようなハロゲン原子で置換され得るものを指し、例えば C_1 - C_4 -ハロアルキル、例えばクロロメチル、ブromo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、1-クロロエチル、1-ブromoエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-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などである。特に用語「 C_1 - C_{10} -ハロアルキル」は C_1 - C_2 -フルオロアルキル(1、2、3、4もしくは5個の水素原子がフッ素原子により置換されているメチルまたはエチルと同義)、例えばフルオロメチル、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およびペンタフルオロメチルを包含する。

【0024】

同様に、「 C_n - C_m -アルコキシ」および「 C_n - C_m -アルキルチオ」（または、それぞれ C_n - C_m -アルキルスルフェニル）は、アルキル基の任意の結合位置で、それぞれ酸素結合または硫黄結合を介して結合される、 $n \sim m$ 個の炭素原子、例えば1~10個、特に1~6個または1~4個の炭素原子を有する直鎖状または分枝鎖状のアルキル基（上記した通り）を指す。例としては、 C_1 - C_4 -アルコキシ、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシおよびtert-ブトキシ、さらに C_1 - C_4 -アルキルチオ、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオおよびn-ブチルチオが挙げられる。

【0025】

従って、「 C_n - C_m -ハロアルコキシ」および「 C_n - C_m -ハロアルキルチオ」（または、それぞれ C_n - C_m -ハロアルキルスルフェニル）は、アルキル基の任意の結合位置で、それぞれ酸素結合または硫黄結合を介して結合される、 $n \sim m$ 個の炭素原子、例えば1~10個、特に1~6個または1~4個の炭素原子を有する直鎖状または分枝鎖状のアルキル基（上記した通り）であって、これらの基の水素原子の一部または全部が上記したようなハロゲン原子で置換され得るものを指し、例としては、 C_1 - C_2 -ハロアルコキシ、例えばクロロメトキシ、ブromo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、1-クロロエトキシ、1-ブromoエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、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およびペンタフルオロエトキシ、さらに C_1 - C_2 -ハロアルキルチオ、例えばクロロメチルチオ、ブromoメチルチオ、ジクロロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-クロロエチルチオ、1-ブromoエチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、2-クロロ-2-フルオロエチルチオ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエ

チルチオ、2,2,2-トリクロロエチルチオおよびペンタフルオロエチルチオなどがある。同様に、「 C_1 - C_2 -フルオロアルコキシ」および「 C_1 - C_2 -フルオロアルキルチオ」は、それぞれ酸素原子または硫黄原子を介して分子の残部に結合される C_1 - C_2 -フルオロアルキルを指す。

【0026】

本明細書で用いられる「 C_2 - C_m -アルケニル」という用語は、2~ m 個、例えば2~10個または2~6個の炭素原子と、任意の位置に二重結合を有する分枝鎖状または非分枝鎖状の不飽和炭化水素基を指し、例えば、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチル-エテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-1-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-1-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニルおよび1-エチル-2-メチル-2-プロペニルである。

【0027】

本明細書で用いられる「 C_2 - C_m -アルキニル」という用語は、2~ m 個、例えば2~10個または2~6個の炭素原子を有し、かつ少なくとも1つの三重結合を含む分枝鎖状または非分枝鎖状の不飽和炭化水素基、例えば、エチニル、プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニルなどを指す。

【0028】

本明細書で用いられる「 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル」という用語は、アルキル基の1個の水素原子が C_1 - C_4 -アルコキシ基で置換される、1~4個の炭素原子を有するアルキル（例えば、上記の具体例）を指す。

【0029】

本明細書で用いられる「 C_3 - C_m -シクロアルキル」という用語は、単環式の3~ m 員の飽和脂環式基、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルおよびシクロデシルを指す。

【0030】

本明細書で用いられる「アリール」という用語は、芳香族炭化水素基、例えばナフチル、特にフェニルを指す。

【0031】

本明細書で用いられる「3~6員の炭素環」という用語は、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、およびシクロヘキサン環を指す。

【0032】

本明細書で用いられる「1、2もしくは3個のヘテロ原子を含む3、4、5、6もしくは7員の飽和、部分不飽和または芳香族の複素環」または「ヘテロ原子基を含む」という用語（該

10

20

30

40

50

用語中、ヘテロ原子(基)は、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択され、環員である)は、単環式基であって、飽和、部分不飽和または芳香族であるものを指す。その複素環基は、炭素環員を介してまたは窒素環員を介して分子の残りの部分に結合していることができる。

【0033】

3、4、5、6もしくは7員の飽和複素環式環または複素環の例には、オキシラニル、アジリジニル、アゼチジニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、3-イソオキサゾリジニル、4-イソオキサゾリジニル、5-イソオキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、1,2,4-オキサジアゾリジン-3-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-5-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-3-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-5-イル、1,2,4-トリアゾリジン-3-イル、1,3,4-オキサジアゾリジン-2-イル、1,3,4-チアジアゾリジン-2-イル、1,3,4-トリアゾリジン-2-イル、2-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、1,3-ジオキサン-5-イル、1,4-ジオキサン-2-イル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、3-ヘキサヒドロピリダジニル、4-ヘキサヒドロピリダジニル、2-ヘキサヒドロピリミジニル、4-ヘキサヒドロピリミジニル、5-ヘキサヒドロピリミジニル、2-ピペラジニル、1,3,5-ヘキサヒドロトリアジン-2-イルおよび1,2,4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イル、2-モルホリニル、3-モルホリニル、2-チオモルホリニル、3-チオモルホリニル、1-オキソチオモルホリン-2-イル、1-オキソチオモルホリン-3-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-2-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-3-イル、ヘキサヒドロアゼピン-1-、-2-、-3-または-4-イル、ヘキサヒドロオキセピニル、ヘキサヒドロ-1,3-ジアゼピニル、ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル、ヘキサヒドロ-1,3-オキサゼピニル、ヘキサヒドロ-1,4-オキサゼピニル、ヘキサヒドロ-1,3-ジオキセピニル、ヘキサヒドロ-1,4-ジオキセピニルなどがある。

【0034】

3、4、5、6もしくは7員の部分不飽和複素環式環または複素環の例には、2,3-ジヒドロフル-2-イル、2,3-ジヒドロフル-3-イル、2,4-ジヒドロフル-2-イル、2,4-ジヒドロフル-3-イル、2,3-ジヒドロチエン-2-イル、2,3-ジヒドロチエン-3-イル、2,4-ジヒドロチエン-2-イル、2,4-ジヒドロチエン-3-イル、2-ピロリン-2-イル、2-ピロリン-3-イル、3-ピロリン-2-イル、3-ピロリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-3-イル、3-イソオキサゾリン-3-イル、4-イソオキサゾリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-4-イル、3-イソオキサゾリン-4-イル、4-イソオキサゾリン-4-イル、2-イソオキサゾリン-5-イル、3-イソオキサゾリン-5-イル、4-イソオキサゾリン-5-イル、2-イソチアゾリン-3-イル、3-イソチアゾリン-3-イル、4-イソチアゾリン-3-イル、2-イソチアゾリン-4-イル、3-イソチアゾリン-4-イル、4-イソチアゾリン-4-イル、2-イソチアゾリン-5-イル、3-イソチアゾリン-5-イル、4-イソチアゾリン-5-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-1-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-2-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-3-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-4-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-5-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-1-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-3-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-4-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-5-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-1-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-3-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-4-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-3-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2-、3-、4-、5-または6-ジ-またはテトラヒドロピリジニル、3-ジ-またはテトラヒドロピリダジニル、4-ジ-またはテトラヒドロピリダジニル、2-ジ-またはテトラヒドロピリミジニル、4-ジ-ま

たはテトラヒドロピリミジニル、5-ジ-またはテトラヒドロピリミジニル、ジ-またはテトラヒドロピラジニル、1,3,5-ジ-またはテトラヒドロトリアジン-2-イル、1,2,4-ジ-またはテトラヒドロトリアジン-3-イル、2,3,4,5-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、3,4,5,6-テトラヒドロ[2H]アゼピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,4,7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,6,7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、テトラヒドロオキセピニル、例えば2,3,4,5-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,4,7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,6,7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、テトラヒドロ-1,3-ジアゼピニル、テトラヒドロ-1,4-ジアゼピニル、テトラヒドロ-1,3-オキサゼピニル、テトラヒドロ-1,4-オキサゼピニル、テトラヒドロ-1,3-ジオキセピニルおよびテトラヒドロ-1,4-ジオキセピニルなどがある。

10

【0035】

5員または6員の芳香族複素環(ヘタリール)またはヘテロ芳香族環の例には、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピロリル、3-ピロリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、1,3,4-トリアゾール-2-イル、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニルおよび2-ピラジニルなどがある。

【0036】

20

「 C_2-C_m -アルキレン」は、2からm個、例えば2から7個の炭素原子を有する2価の分岐または好ましくは非分岐の飽和脂肪族鎖であり、例えば CH_2CH_2 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH(CH_3)CH_2$ 、 $CH_2CH(CH_3)$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、および $CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ である。

【0037】

好ましい化合物

本発明の実施形態および好ましい化合物について、下記の各項で説明する。

【0038】

式Iの化合物の可変要素、特にはそれらの置換基、X、A、B、 W^1 、 W^2 、 W^3 、 W^4 、Het、 R^1 および R^2 に関するものの好ましい実施形態に関連する下記の言及は、それ単独、そして特にはあらゆる可能な互いの組み合わせの両方に当てはまるものである。

30

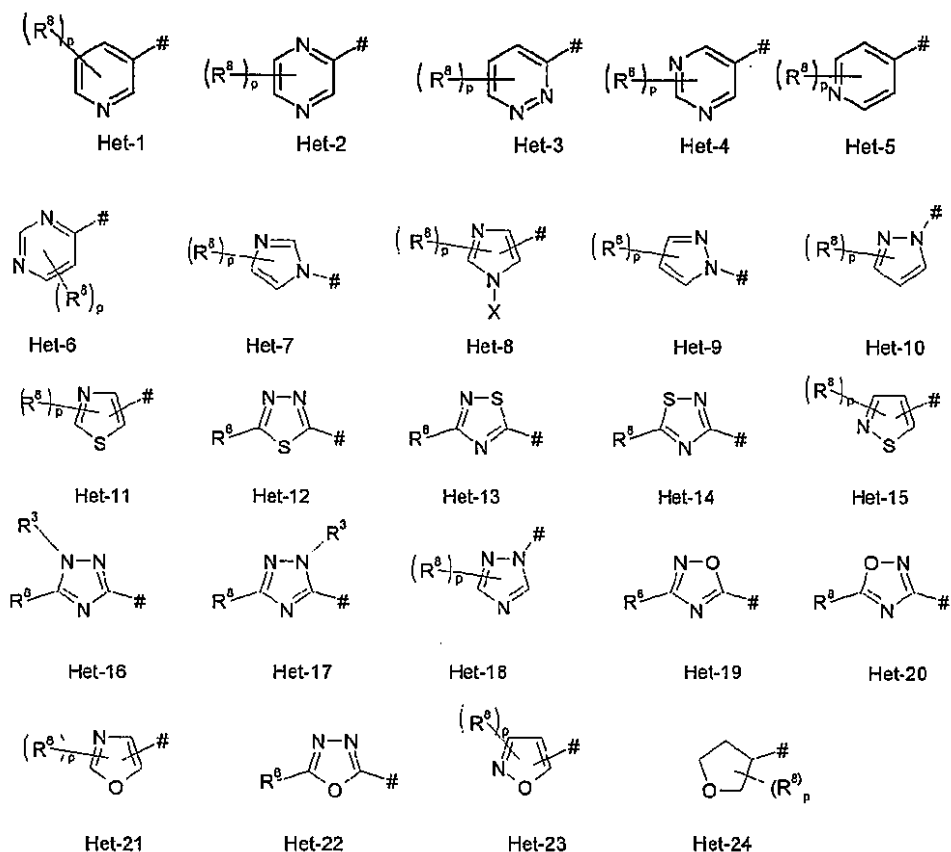
【0039】

本発明の化合物の好ましい部分構造を示す式中に#が現れる場合、それは分子の残りの部分への付着結合を表す。

【0040】

好ましいのは、Hetが、式Het-1~Het-24：

【化 3】



10

20

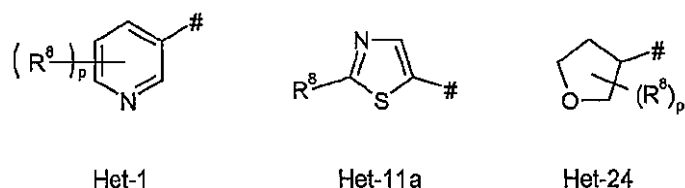
【0041】

(式中、#は、式(I)中の結合を表し、pは、0、1または2であり、 R^8 は、さらに上記に定義される意味を有する)で表される基からなる群から選択される、式(I)の化合物である。

【0042】

特に好ましいのは、Hetが、式Het-1、Het-11aおよびHet-24：

【化 4】



30

【0043】

(式中、 R^8 は、水素、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルコキシまたは C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、後の2つの基の炭素原子は、部分的にもしくは完全にハロゲン化されていてよく、pは、0、1または2である)

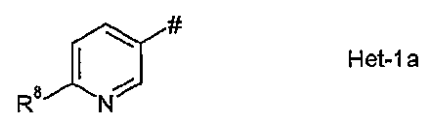
で表される基からなる群から選択される式(I)の化合物である。

40

【0044】

特により好ましいのは、Hetが、Het-1a：

【化 5】



【0045】

(式中、 R^8 は、さらに上記に定義されるとおりである)

である式(I)の化合物である。好ましくは、 R^8 は、水素、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルコキシまたは C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、後の2つの基の炭素原子は、部分的にもしくは

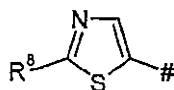
50

は完全にハロゲン化されていてよい。

【0046】

特に好ましいのは、Hetが、Het-11a：

【化6】



Het-11a

【0047】

(式中、 R^8 は、さらに上記に定義されたとおりである)

10

である式(I)の化合物である。好ましくは、 R^8 は、水素、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルコキシまたは C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、後の2つの基の炭素原子は、部分的にもしくは完全にハロゲン化されていてよい。

【0048】

好ましいのは、 R^1 と R^2 が、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルおよび C_3 - C_6 -シクロアルキルからなる群から選択される、式(I)の化合物である。

【0049】

好ましいのは、Aが、O、SまたはCH=CHから選択される、式(I)の化合物である。

【0050】

20

好ましいのは、BがNまたは CR^7 であり、ここで、 R^7 は、水素、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルキルおよび C_1 - C_4 -ハロアルキルからなる群から選択される、式(I)の化合物である。

【0051】

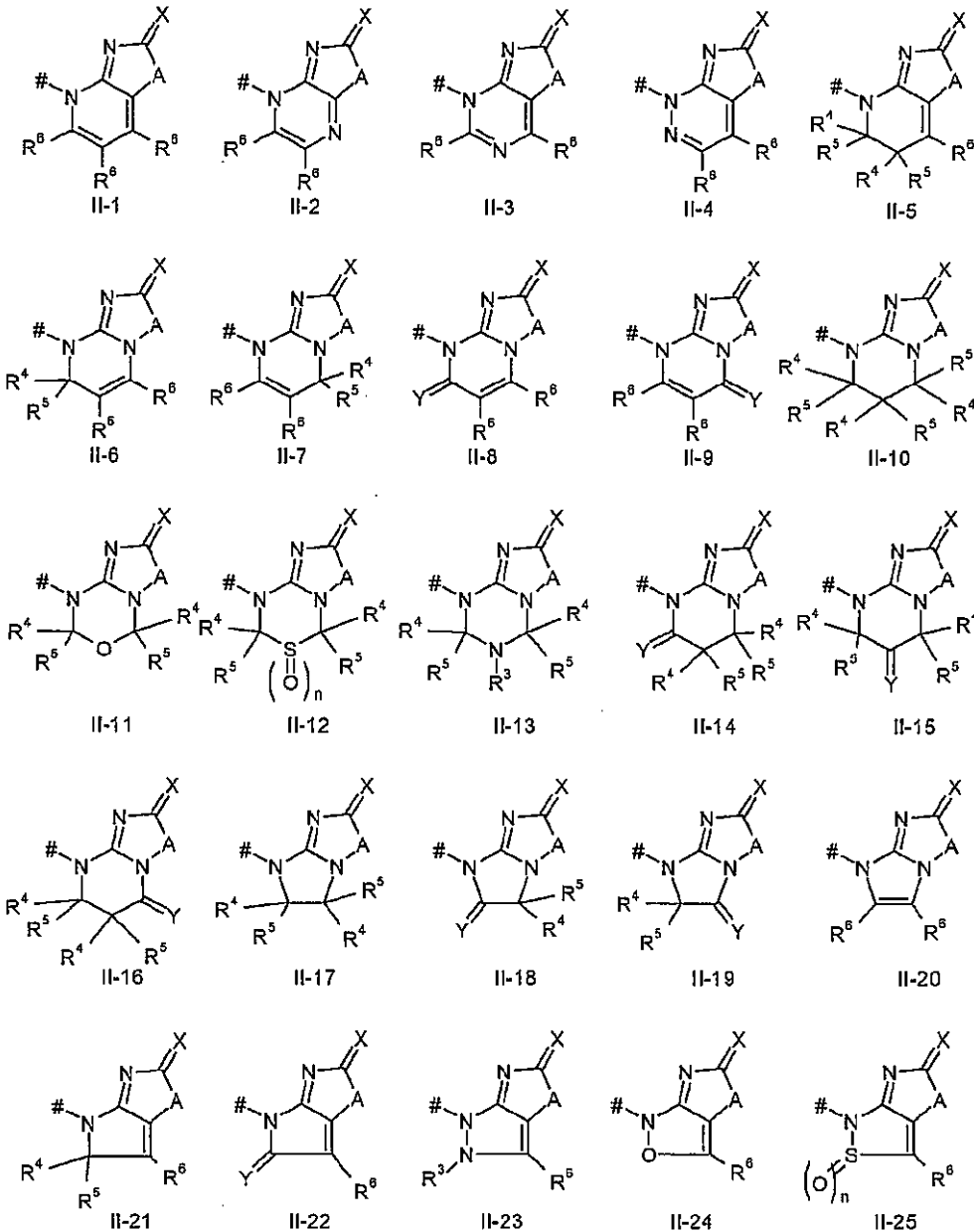
好ましいのは、Bが CR^7 であり、ここで、 R^7 は、Bと W^1 が二重結合によって連結されるような隣接する原子 W^1 への結合を表し、ここで W^1 はNまたは CR^6 であり、ここで、 R^6 は、水素、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルキルおよび C_1 - C_4 -ハロアルキルからなる群から選択される、式(I)の化合物である。

【0052】

好ましいのは、 W^1 、 W^2 、 W^3 および W^4 が、それらが結合しているNおよびBと共に、飽和もしくは不飽和の5員または6員のヘテロ環を形成し、ここで基B- W^1 - W^2 - W^3 - W^4 -Nは、環化環(annulated ring)と共に、式II-1~II-25：

30

【化 7】



【0053】

(式中、 R^4 、 R^5 および R^6 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 C_1 - C_2 -アルキルまたは C_1 - C_2 -ハロアルキルからなる群から選択され、 A 、 X 、 Y および R^3 ならびに n は、さらに上記に定義されるとおりである)で表される基の群から選択される二環を形成する、式(I)の化合物である。

【0054】

特に好ましいのは、基 B - W^1 - W^2 - W^3 - W^4 - N が、環状環と共に、式II-1、II-2、II-5、II-6、II-7、II-10、II-17、II-20およびII-21：

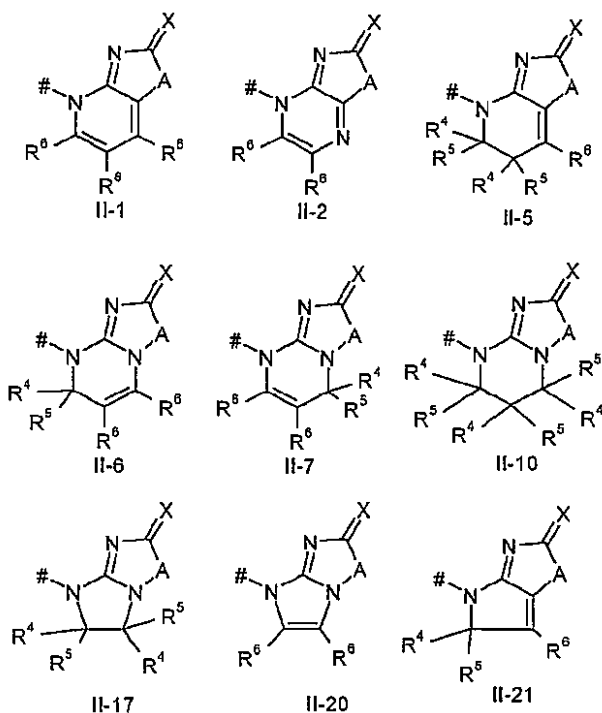
10

20

30

40

【化 8】



10

20

【0055】

(式中、R⁴、R⁵およびR⁶は、好ましくは、互いに独立して、水素、ハロゲン、C₁-C₃-アルキルおよびC₁-C₃-ハロアルキルから選択され；

特に好ましいR⁴、R⁵およびR⁶は、互いに独立して、水素、ハロゲンおよびメチルから選択され；また

ここで、Aは、好ましくはO、SまたはCH=CHから選択され；

特に好ましいAは、OまたはSから選択され；

特により好ましいAは、Oから選択され；

特により好ましいAは、Sから選択され；さらに

ここで、Xは、好ましくはOまたはSから選択され；

30

特に好ましいXは、Oから選択され；

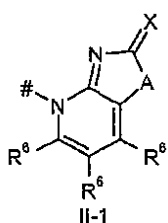
特に好ましいXは、Sから選択される)

で表される基の群から選択される二環を形成する、式(I)の化合物である。

【0056】

特により好ましいのは、基B-W¹-W²-W³-W⁴-Nが、環化環と共に、式II-1：

【化 9】



40

【0057】

(式中、R⁶は、好ましくは、互いに独立して、水素、ハロゲン、C₁-C₃-アルキルおよびC₁-C₃-ハロアルキルから選択され；

特に好ましいR⁶は、互いに独立して、水素、ハロゲンおよびメチルから選択され；また

ここで、Aは、好ましくはOまたはSから選択され；

特により好ましいAは、Oから選択され；

特により好ましいAは、Sから選択され；さらに

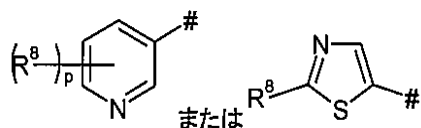
ここで、Xは、好ましくはOまたはSから選択され；

50

特に好ましいXは、Oから選択され；
 特に好ましいXは、Sから選択される）
 で表される二環式基を形成する、式(I)の化合物である。

【0058】

好ましいのは、Hetが、
 【化10】



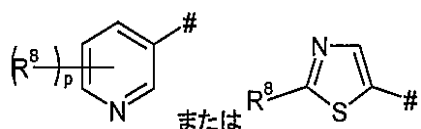
10

【0059】

(式中、 R^8 は、ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルキルおよび C_1 - C_4 -ハロアルキルからなる群から選択され、 p は、0、1または2である)であり；また
 Aが、O、Sまたは $CH=CH$ であり、Xが、OまたはSであり、さらに R^1 および R^2 が、互いに独立して、水素、メチル、エチルおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、または R^1 と R^2 が、それらが結合している炭素原子と共にシクロプロパン環を形成する、式(I)の化合物である。

【0060】

好ましいのは、Hetが、
 【化11】



20

【0061】

(式中、 R^8 は、ハロゲンおよび C_1 - C_4 -ハロアルキルからなる群から選択され、 p は、1または2である)であり；また
 Aが、OまたはSであり、Xが、OまたはSであり、さらに R^1 および R^2 がいずれも水素である、式(I)の化合物である。

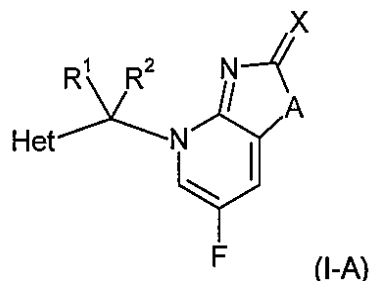
【0062】

特に好ましい式Iの化合物の例を、以下に挙げる。

【0063】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、 R^1 、 R^2 およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-A)の化合物である。

【化12】

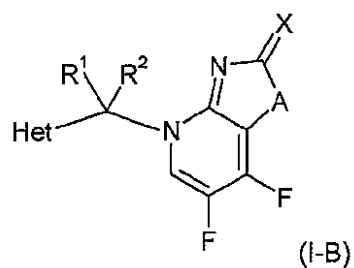


40

【0064】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、 R^1 、 R^2 およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-B)の化合物である。

【化 1 3】

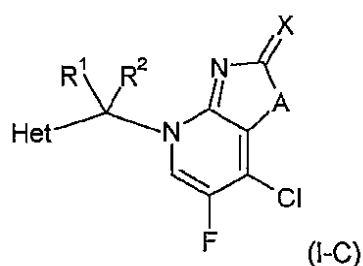


【 0 0 6 5】

10

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-C)の化合物である。

【化 1 4】

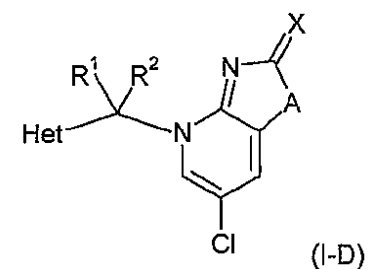


20

【 0 0 6 6】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-D)の化合物である。

【化 1 5】

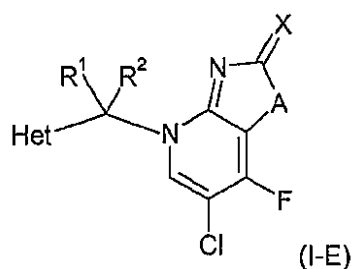


30

【 0 0 6 7】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-E)の化合物である。

【化 1 6】

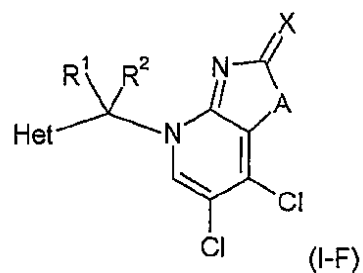


40

【 0 0 6 8】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-F)の化合物である。

【化 1 7】

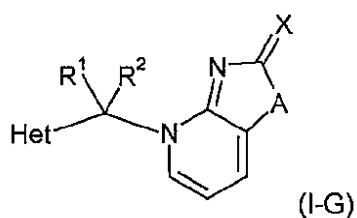


【 0 0 6 9】

10

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-G)の化合物である。

【化 1 8】

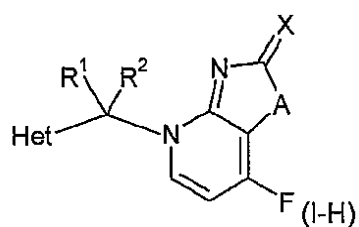


【 0 0 7 0】

20

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-H)の化合物である。

【化 1 9】

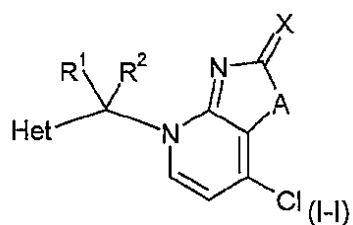


30

【 0 0 7 1】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-I)の化合物である。

【化 2 0】

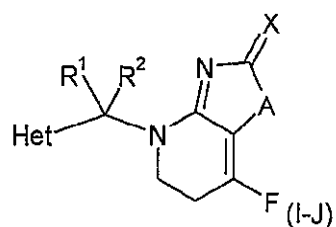


40

【 0 0 7 2】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-J)の化合物である。

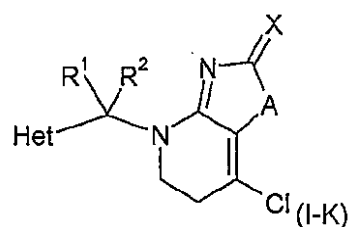
【化 2 1】



【 0 0 7 3】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行
 のいずれかに記載される意味を有する、式(I-K)の化合物である。 10

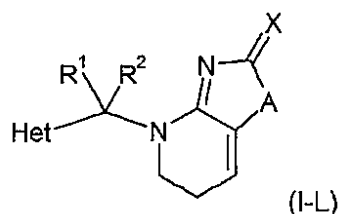
【化 2 2】



【 0 0 7 4】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行
 のいずれかに記載される意味を有する、式(I-L)の化合物である。 20

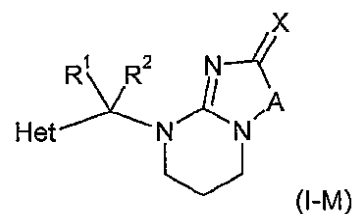
【化 2 3】



【 0 0 7 5】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行
 のいずれかに記載される意味を有する、式(I-M)の化合物である。 30

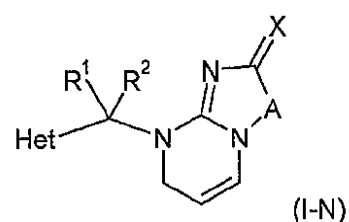
【化 2 4】



【 0 0 7 6】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行
 のいずれかに記載される意味を有する、式(I-N)の化合物である。 40

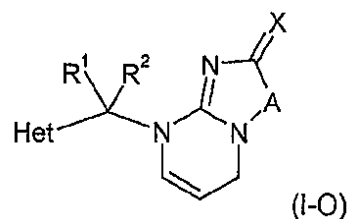
【化 2 5】



【0077】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-O)の化合物である。

【化26】

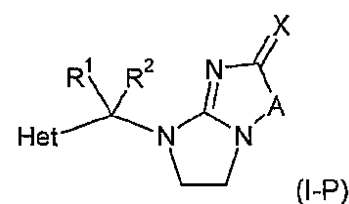


10

【0078】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-P)の化合物である。

【化27】

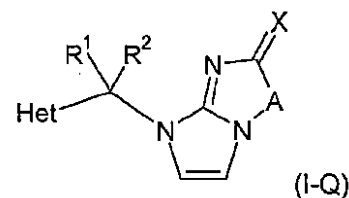


20

【0079】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-Q)の化合物である。

【化28】

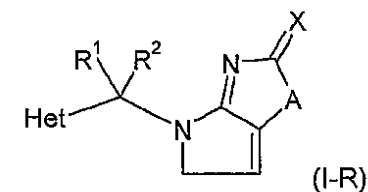


30

【0080】

このような特に好ましい化合物の例は、A、X、R¹、R²およびHetが表Cの第1行～第192行のいずれかに記載される意味を有する、式(I-R)の化合物である。

【化29】

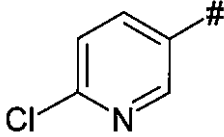
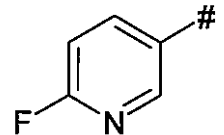
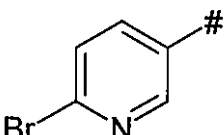
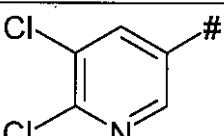
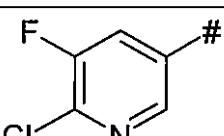
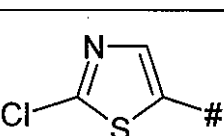
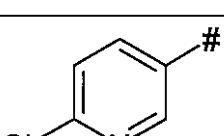
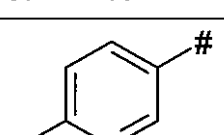
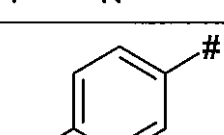
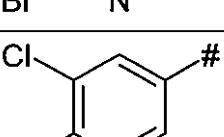


40

【0081】

【表 1】

表C:

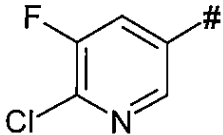
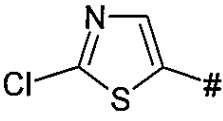
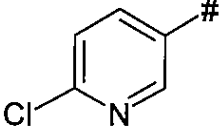
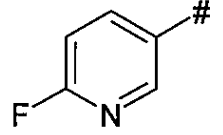
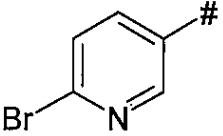
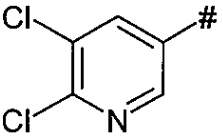
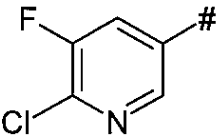
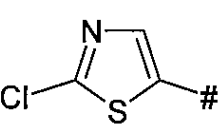
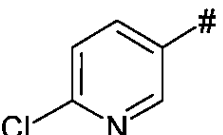
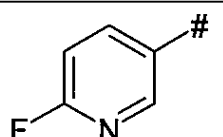
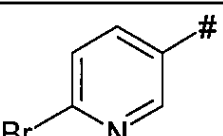
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.1		H	H	O	O
C.2		H	H	O	O
C.3		H	H	O	O
C.4		H	H	O	O
C.5		H	H	O	O
C.6		H	H	O	O
C.7		H	H	O	S
C.8		H	H	O	S
C.9		H	H	O	S
C.10		H	H	O	S

10

20

30

40

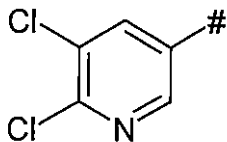
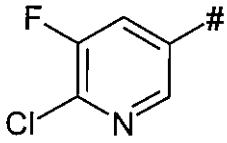
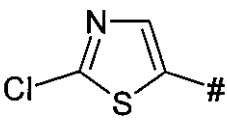
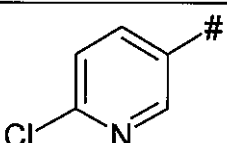
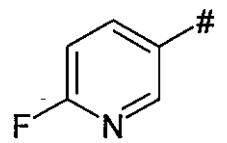
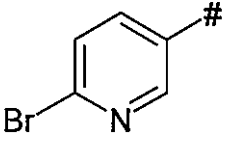
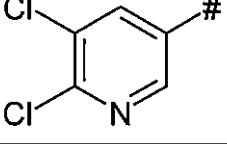
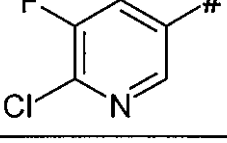
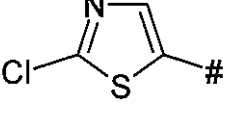
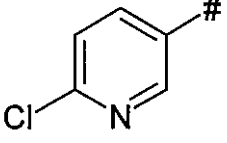
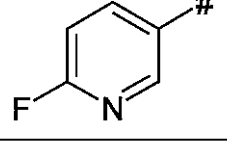
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.11		H	H	O	S
C.12		H	H	O	S
C.13		H	H	S	O
C.14		H	H	S	O
C.15		H	H	S	O
C.16		H	H	S	O
C.17		H	H	S	O
C.18		H	H	S	O
C.19		H	H	S	S
C.20		H	H	S	S
C.21		H	H	S	S

10

20

30

40

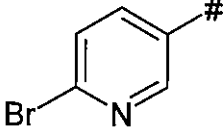
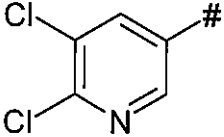
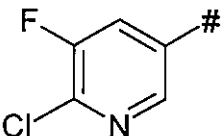
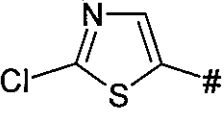
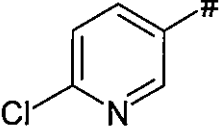
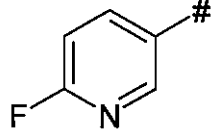
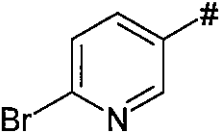
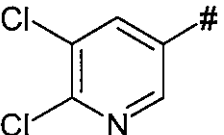
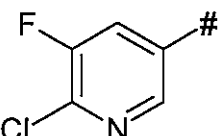
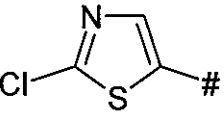
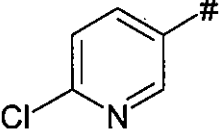
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.22		H	H	S	S
C.23		H	H	S	S
C.24		H	H	S	S
C.25		CH ₃	H	O	O
C.26		CH ₃	H	O	O
C.27		CH ₃	H	O	O
C.28		CH ₃	H	O	O
C.29		CH ₃	H	O	O
C.30		CH ₃	H	O	O
C.31		CH ₃	H	O	S
C.32		CH ₃	H	O	S

10

20

30

40

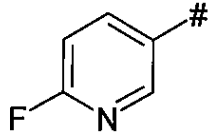
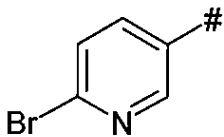
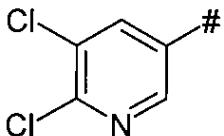
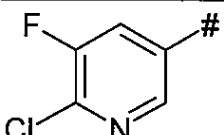
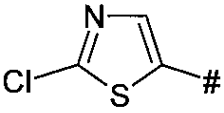
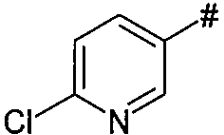
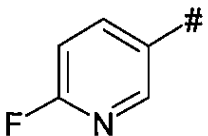
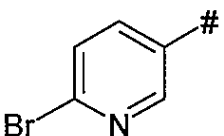
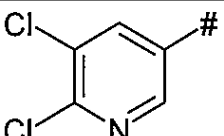
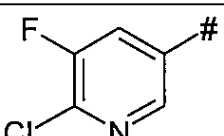
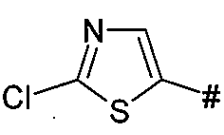
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.33		CH ₃	H	O	S
C.34		CH ₃	H	O	S
C.35		CH ₃	H	O	S
C.36		CH ₃	H	O	S
C.37		CH ₃	H	S	O
C.38		CH ₃	H	S	O
C.39		CH ₃	H	S	O
C.40		CH ₃	H	S	O
C.41		CH ₃	H	S	O
C.42		CH ₃	H	S	O
C.43		CH ₃	H	S	S

10

20

30

40

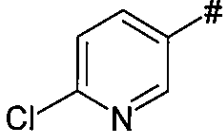
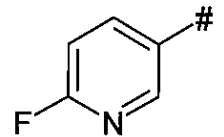
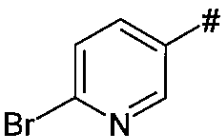
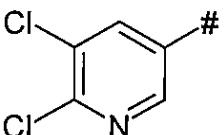
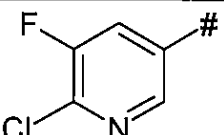
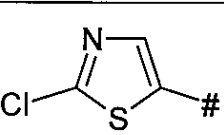
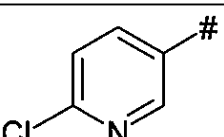
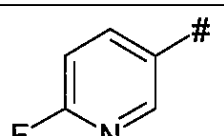
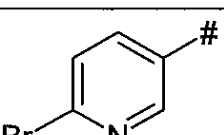
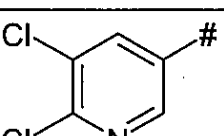
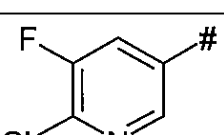
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.44		CH ₃	H	S	S
C.45		CH ₃	H	S	S
C.46		CH ₃	H	S	S
C.47		CH ₃	H	S	S
C.48		CH ₃	H	S	S
C.49		H	CF ₃	O	O
C.50		H	CF ₃	O	O
C.51		H	CF ₃	O	O
C.52		H	CF ₃	O	O
C.53		H	CF ₃	O	O
C.54		H	CF ₃	O	O

10

20

30

40

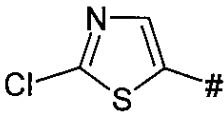
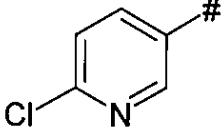
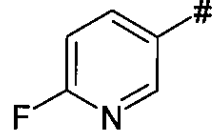
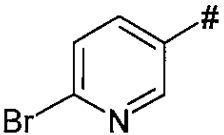
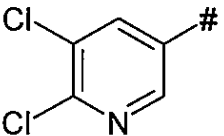
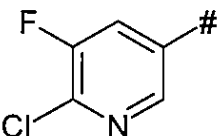
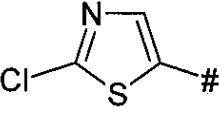
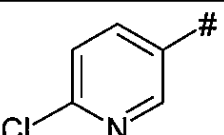
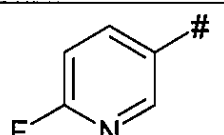
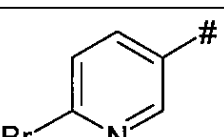
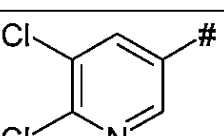
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.55		H	CF ₃	O	S
C.56		H	CF ₃	O	S
C.57		H	CF ₃	O	S
C.58		H	CF ₃	O	S
C.59		H	CF ₃	O	S
C.60		H	CF ₃	O	S
C.61		H	CF ₃	S	O
C.62		H	CF ₃	S	O
C.63		H	CF ₃	S	O
C.64		H	CF ₃	S	O
C.65		H	CF ₃	S	O

10

20

30

40

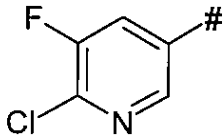
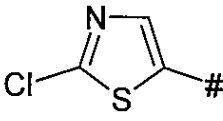
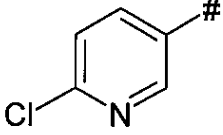
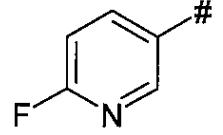
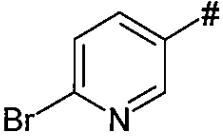
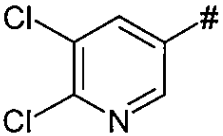
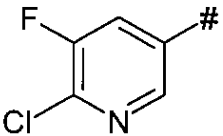
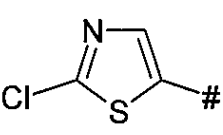
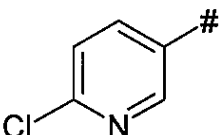
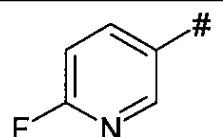
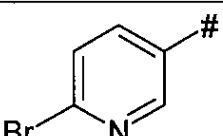
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.66		H	CF ₃	S	O
C.67		H	CF ₃	S	S
C.68		H	CF ₃	S	S
C.69		H	CF ₃	S	S
C.70		H	CF ₃	S	S
C.71		H	CF ₃	S	S
C.72		H	CF ₃	S	S
C.73		H	CF ₃	O	O
C.74		H	CF ₃	O	O
C.75		H	CF ₃	O	O
C.76		H	CF ₃	O	O

10

20

30

40

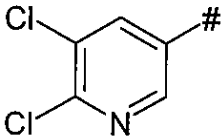
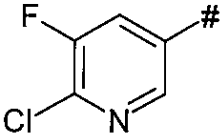
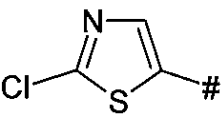
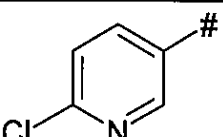
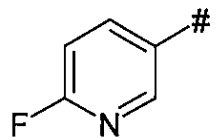
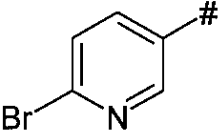
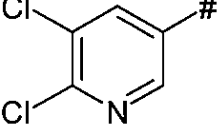
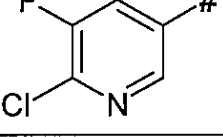
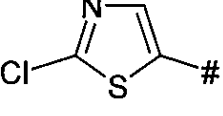
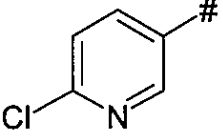
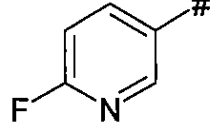
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.77		H	CF ₃	O	O
C.78		H	CF ₃	O	O
C.79		H	CF ₃	O	S
C.80		H	CF ₃	O	S
C.81		H	CF ₃	O	S
C.82		H	CF ₃	O	S
C.83		H	CF ₃	O	S
C.84		H	CF ₃	O	S
C.85		H	CF ₃	S	O
C.86		H	CF ₃	S	O
C.87		H	CF ₃	S	O

10

20

30

40

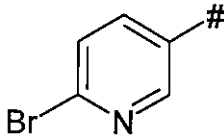
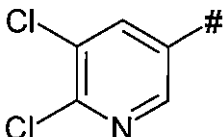
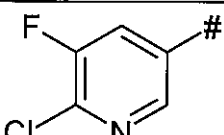
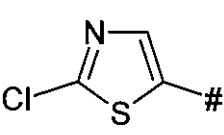
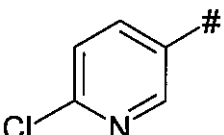
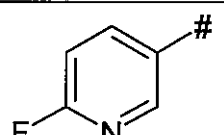
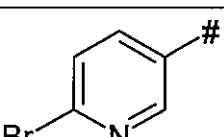
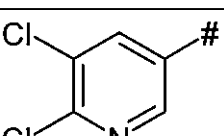
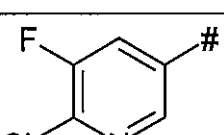
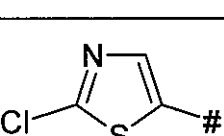
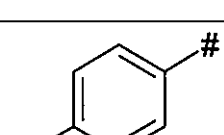
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.88		H	CF ₃	S	O
C.89		H	CF ₃	S	O
C.90		H	CF ₃	S	O
C.91		H	CF ₃	S	S
C.92		H	CF ₃	S	S
C.93		H	CF ₃	S	S
C.94		H	CF ₃	S	S
C.95		H	CF ₃	S	S
C.96		H	CF ₃	S	S
C.97		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.98		CH ₂ -CH ₂		O	O

10

20

30

40

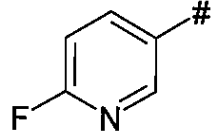
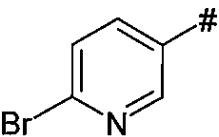
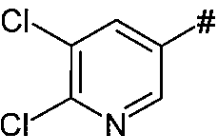
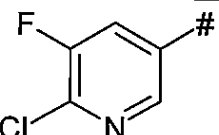
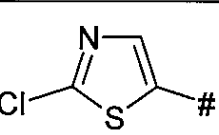
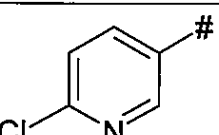
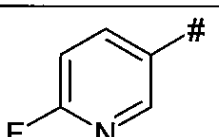
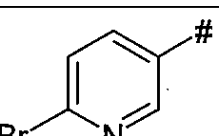
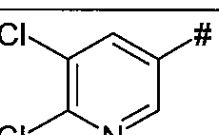
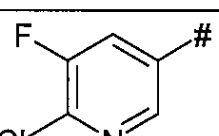
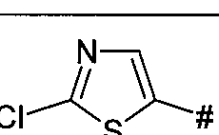
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.99		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.100		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.101		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.102		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.103		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.104		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.105		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.106		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.107		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.108		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.109		CH ₂ -CH ₂		S	O

10

20

30

40

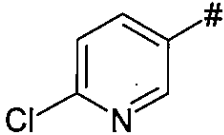
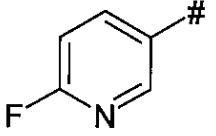
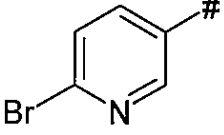
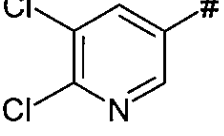
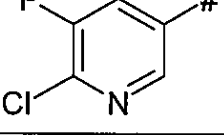
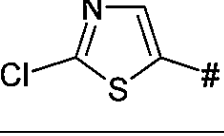
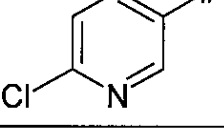
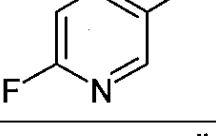
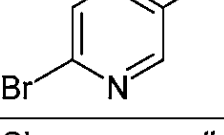
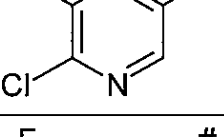
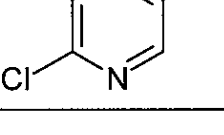
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.110		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.111		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.112		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.113		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.114		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.115		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.116		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.117		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.118		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.119		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.120		CH ₂ -CH ₂		S	S

10

20

30

40

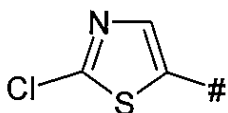
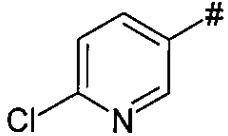
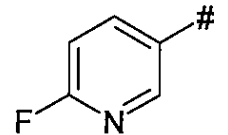
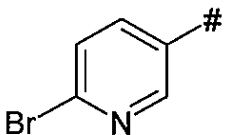
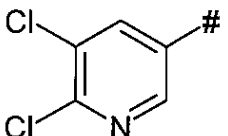
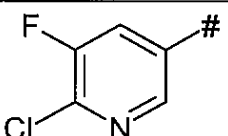
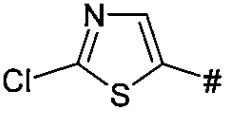
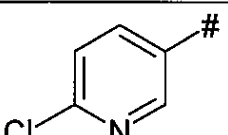
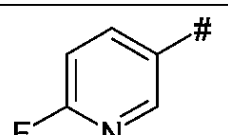
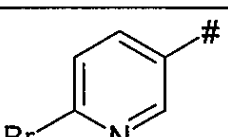
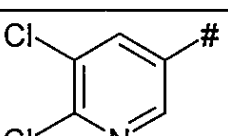
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.121		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.122		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.123		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.124		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.125		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.126		CH ₂ -CH ₂		O	O
C.127		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.128		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.129		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.130		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.131		CH ₂ -CH ₂		O	S

10

20

30

40

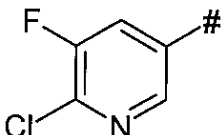
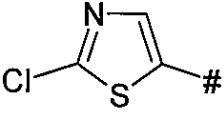
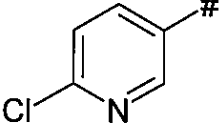
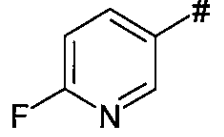
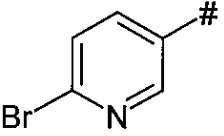
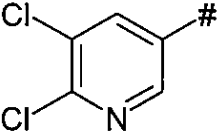
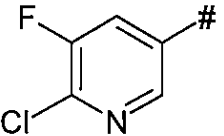
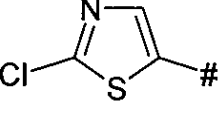
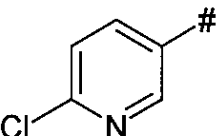
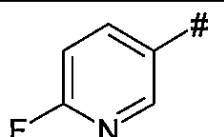
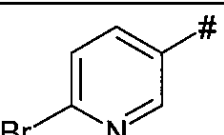
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.132		CH ₂ -CH ₂		O	S
C.133		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.134		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.135		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.136		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.137		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.138		CH ₂ -CH ₂		S	O
C.139		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.140		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.141		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.142		CH ₂ -CH ₂		S	S

10

20

30

40

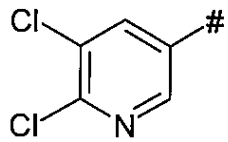
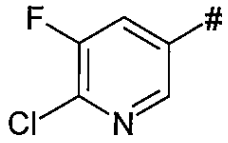
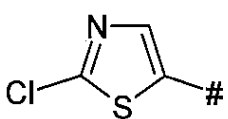
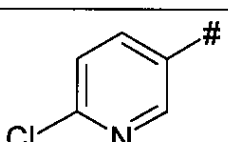
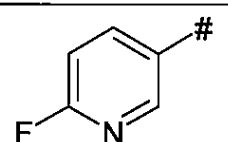
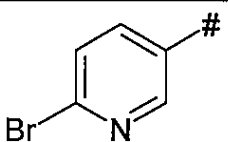
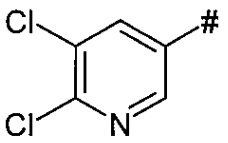
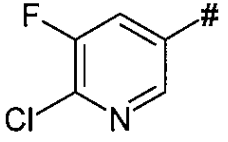
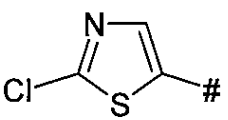
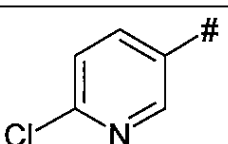
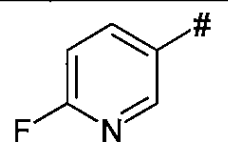
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.143		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.144		CH ₂ -CH ₂		S	S
C.145		CH ₃	CH ₃	O	O
C.146		CH ₃	CH ₃	O	O
C.147		CH ₃	CH ₃	O	O
C.148		CH ₃	CH ₃	O	O
C.149		CH ₃	CH ₃	O	O
C.150		CH ₃	CH ₃	O	O
C.151		CH ₃	CH ₃	O	S
C.152		CH ₃	CH ₃	O	S
C.153		CH ₃	CH ₃	O	S

10

20

30

40

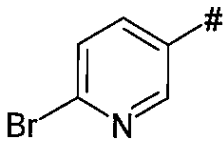
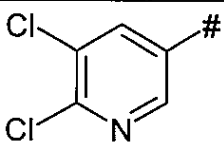
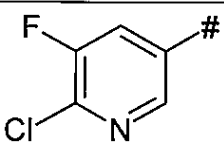
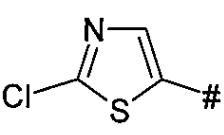
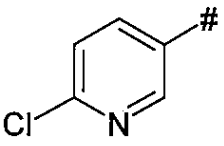
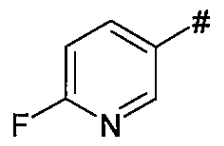
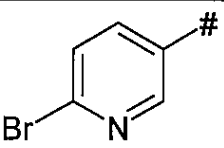
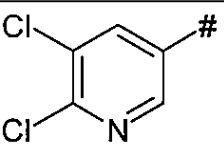
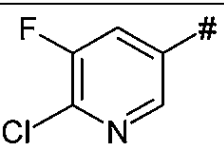
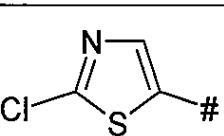
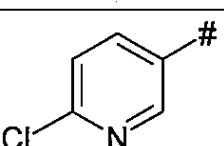
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.154		CH ₃	CH ₃	O	S
C.155		CH ₃	CH ₃	O	S
C.156		CH ₃	CH ₃	O	S
C.157		CH ₃	CH ₃	S	O
C.158		CH ₃	CH ₃	S	O
C.159		CH ₃	CH ₃	S	O
C.160		CH ₃	CH ₃	S	O
C.161		CH ₃	CH ₃	S	O
C.162		CH ₃	CH ₃	S	O
C.163		CH ₃	CH ₃	S	S
C.164		CH ₃	CH ₃	S	S

10

20

30

40

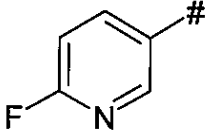
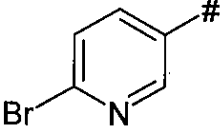
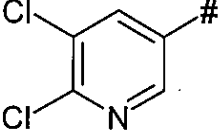
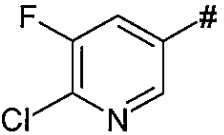
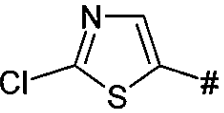
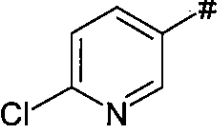
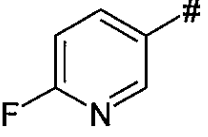
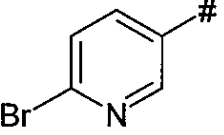
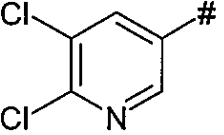
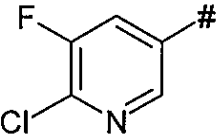
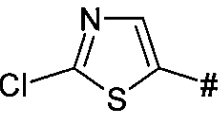
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.165		CH ₃	CH ₃	S	S
C.166		CH ₃	CH ₃	S	S
C.167		CH ₃	CH ₃	S	S
C.168		CH ₃	CH ₃	S	S
C.169		CH ₃	CH ₃	O	O
C.170		CH ₃	CH ₃	O	O
C.171		CH ₃	CH ₃	O	O
C.172		CH ₃	CH ₃	O	O
C.173		CH ₃	CH ₃	O	O
C.174		CH ₃	CH ₃	O	O
C.175		CH ₃	CH ₃	O	S

10

20

30

40

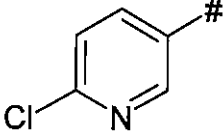
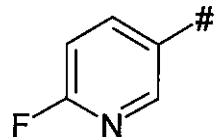
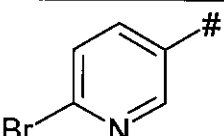
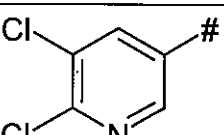
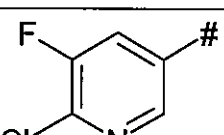
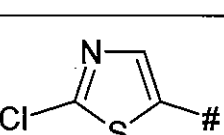
化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.176		CH ₃	CH ₃	O	S
C.177		CH ₃	CH ₃	O	S
C.178		CH ₃	CH ₃	O	S
C.179		CH ₃	CH ₃	O	S
C.180		CH ₃	CH ₃	O	S
C.181		CH ₃	CH ₃	S	O
C.182		CH ₃	CH ₃	S	O
C.183		CH ₃	CH ₃	S	O
C.184		CH ₃	CH ₃	S	O
C.185		CH ₃	CH ₃	S	O
C.186		CH ₃	CH ₃	S	O

10

20

30

40

化合物 no.	Het	R ¹	R ²	X	A
C.187		CH ₃	CH ₃	S	S
C.188		CH ₃	CH ₃	S	S
C.189		CH ₃	CH ₃	S	S
C.190		CH ₃	CH ₃	S	S
C.191		CH ₃	CH ₃	S	S
C.192		CH ₃	CH ₃	S	S

【0082】

さらに、表中の個々の可変要素について記載されている意味は、それ自体、それらが記載されている組み合わせとは無関係に、当該置換基の特に好ましい実施形態である。

【0083】

製造方法

本発明による式(I)の化合物は、例えば、以下に記載する製造方法および製造スキームに従って製造することができる。

【0084】

本発明による式(I)の化合物は、有機化学の標準的な方法によって、例えば、以下に記載する製造方法および製造スキームによって製造することができる。スキーム中に示される分子構造のHet、A、B、X、R¹、R²、R⁴、W¹、W²、W³およびW⁴の定義は、上記に定義されるとおりである。室温は、約20～25℃の温度範囲を意味する。

【0085】

式(I)の化合物の製造のための一般的な方法の2つの例を、以下のスキームAに示す。このように、式(I)の化合物中に含まれる二環式構造要素の構築は、例えば、式1の前駆体の環外アミノ基の分子内アルキル化によって達成することができる。式1中の好適な脱離基(LG)の例としては、限定するものではないが、ハロゲン、スルホン酸アルキルまたはスルホン酸ハロアルキルが挙げられる。この変換は、好ましくは、室温～溶媒の還流温度において、炭酸塩または第3級アミン塩基などの塩基の存在下、アセトニトリル、テトラヒド

10

20

30

40

50

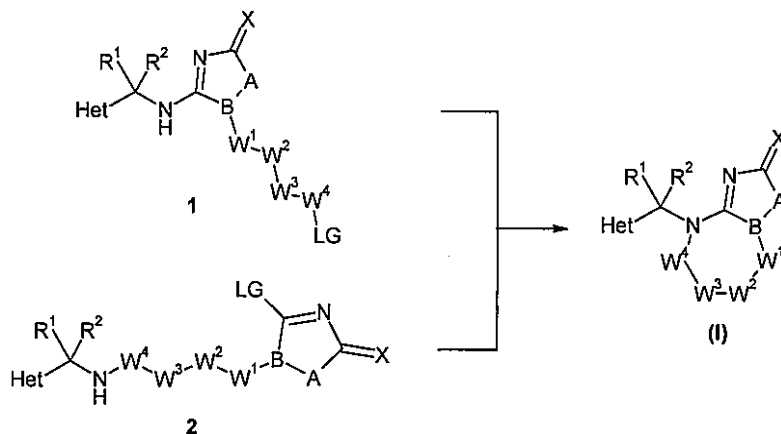
ロフランまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの極性溶媒中で行われる。

【0086】

式(I)の化合物への第2の合成経路は、式2の前駆体の分子内環化である。好適な脱離基(LG)としては、限定するものではないが、ハロゲン、O-アルキルまたはS-アルキルが挙げられる。この反応は、好ましくは、室温～160℃の温度において、トルエンまたはキシレンなどの不活性溶媒中で行われる。

【化30】

スキームA:



10

20

【0087】

式(I)の化合物の合成のための前駆体を表す式1aの化合物(式中、BはNを表す)は、例えば、式6のS-アルキルイソチオ尿素中間体から出発して、スキームBに示される経路によって製造することができる。このようにして、式6の中間体を式7のヒドロキシルアミン構成要素と共にインキュベーションすると、式8のアミノ-オキサジアゾロンまたはアミノ-オキサジアゾロチオンが得られる。式6中の好適な脱離基(LG¹)としては、限定するものではないが、O-アルキルまたはS-アルキルが挙げられる。保護されていてもよいヒドロキシル基は、式7中の好適な基Lを表し；有用な保護基(存在する場合)としては、さらなる置換基を有していてもよいトリアルキルシリル基、アリール-アルキル-シリル基またはベンジル基が挙げられる。環化縮合反応は、例えば第3級アミン塩基などの塩基の存在下、ピリジン中、またはテトラヒドロフラン、ジオキサンまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの極性溶媒中で選択的に行われる。この変換に好ましい温度は、室温～約150℃である。

30

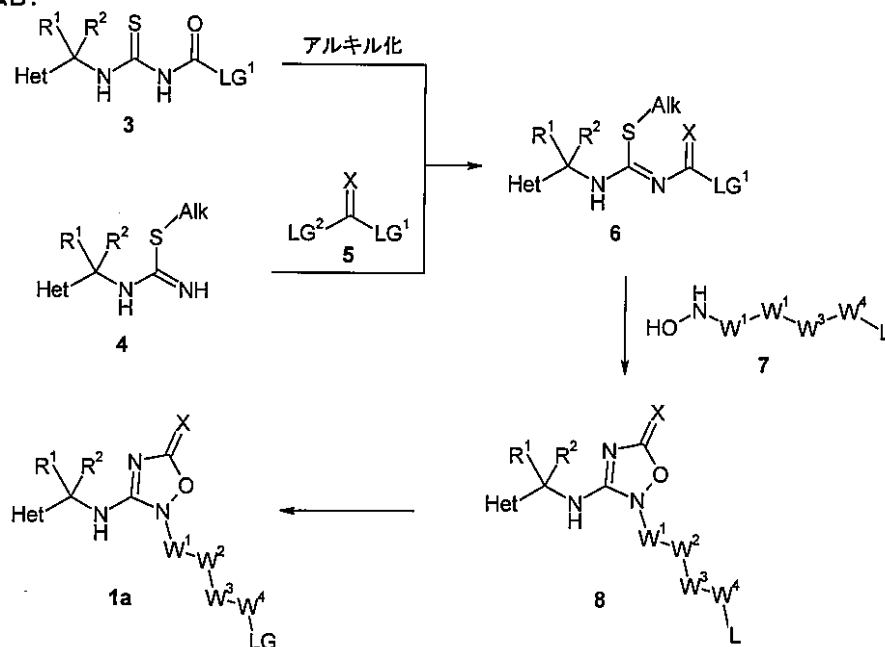
【0088】

式1aの化合物は、最終的には、式8の前駆体に脱離基(LG)を導入することによって得ることができる。この目的のため、(保護されていてもよい)ヒドロキシル基(L)は、一連の脱保護(保護基が存在する場合)において、例えばハロゲン化物、メシラート、トシラートまたはトリフラートなどの好適な脱離基に変換され、その後、標準的な文献方法に従ってハロゲン化物またはスルホン酸アルキル脱離基に変換される。

40

【化 3 1】

スキームB:



10

【0089】

次に、式6のイソチオ尿素出発物質を、例えば式3のチオ尿素誘導体の位置選択的S-アルキル化によって、または式4のS-アルキルイソチオ尿素誘導体のアシル化によって得ることができる。式3および式4の化合物の代表的な製造方法の例については、J. Org. Chem. 2000, 65 (5), 1566-1568およびSynthesis 1988, 6, 460-466をそれぞれ参照のこと。

【0090】

チオ尿素誘導体3のアルキル化の好ましい条件としては、室温～各溶媒の沸点における、炭酸塩または第3級アミン塩基の存在下での、アセトン、テトラヒドロフランまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの極性溶媒の使用が挙げられる。代表的な方法は、W02008/08 6462に記載されている。式5のカルボニル試薬またはチオカルボニル試薬を用いた式4のイソチオ尿素誘導体のアシル化反応は、好ましくは、トルエン、ジクロロメタンもしくはクロロホルムなどの非極性非プロトン性溶媒、またはこれらの溶媒の1種を有機相として含む二相水性溶媒混合物中で行われる。好適な式5の試薬は、例えば、クロロギ酸アルキルまたはクロロギ酸アリール、炭酸ジアルキル、炭酸ジアリールまたは炭酸アルキルアリール(XはOを表す)ならびにそれらのチオカルボニル誘導体(XはSを表す)である。また、この変換のための好ましい条件のセットとして、有機溶媒中で行われる反応のための第3級アミン塩基などの塩基の存在、または二相溶媒混合物中で行われる反応のための炭酸塩塩基も挙げられる。好ましい温度は、約0℃～約100℃である。代表的な方法は、Tetrahedron Lett. 1991, 32 (7), 875-878 およびTetrahedron Lett. 2009, 50 (15), 1667-1670に記載されている。

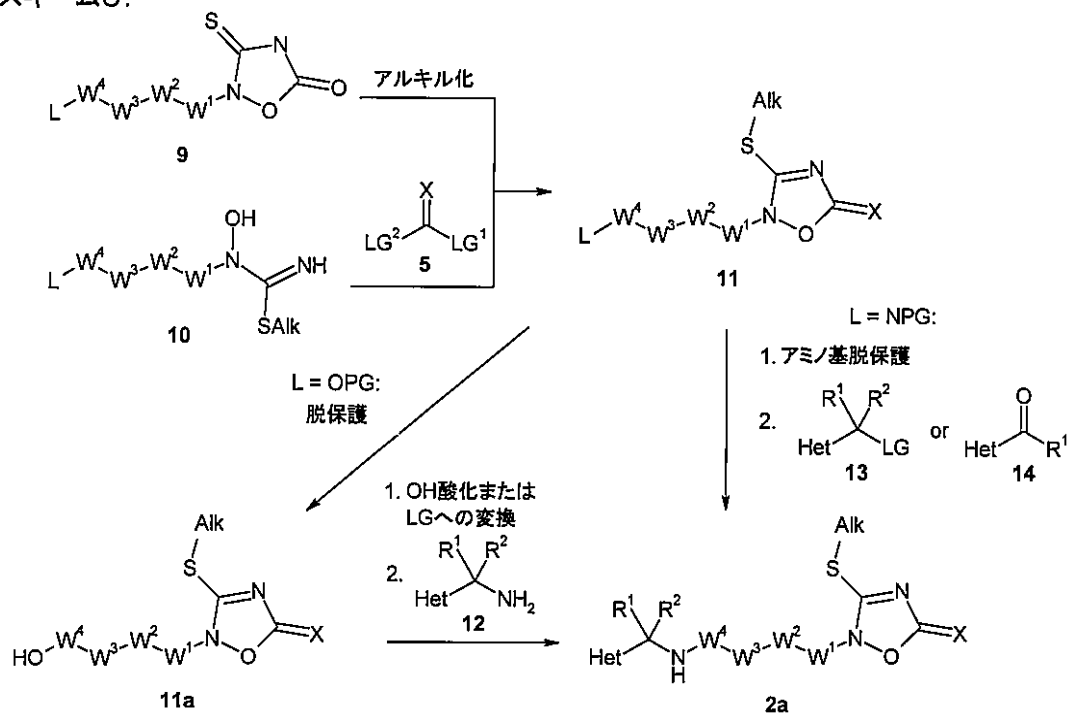
20

30

40

【化 3 2】

スキームC:



【0091】

式(I)の化合物の合成のための前駆体を表す式2aの化合物(式中、DはNを表す)は、例えば、式9の2-置換3-チオ-1,2,4-オキサジアゾリジン-3,5-ジオン中間体またはS-アルキルカルバミドチオ酸エステル10から出発して、スキームCに示される経路によって製造することができる。式9および式10の構成要素は、当技術分野で公知の方法によって製造することができる；例えば、ChemMedChem 2010, 5(1), 79-85およびB. Clementら、Archiv der Pharmazie 1988, 321 (10), 769-770を参照のこと。これらの出発物質中に存在する好適な基Lは、例えば、保護されていてもよいヒドロキシル基または保護されたアミノ基である。有用なヒドロキシル保護基(OPG)としては、さらなる置換基を有していてもよい、トリアルキルシリル基、アリール-アルキル-シリル基またはベンジル基が挙げられる。好適なアミノ保護基(NPG)としては、カーバメート (例えばtert-ブチルカーバメート、ベンジルカーバメートもしくはフルオレニルメチルカーバメート)、アセテート (例えばトリフルオロアセテート) またはイミド (例えばフタルイミドもしくはスクシンイミド) が挙げられる。

【0092】

ヨードメタンまたはヨードエタンなどのアルキル化試薬を用いた式9の化合物のアルキル化は、位置選択的方法で進行し、式11の中間体を与える。この変換は、典型的には、室温～溶媒の還流温度において、第3級アミンまたは炭酸塩塩基(例えば、それぞれトリエチルアミンまたは炭酸ナトリウム)の存在下、アセトン、アセトニトリルまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で行われる。

【0093】

別法として、式11の化合物は、式10の前駆体を式5のカルボニル試薬またはチオカルボニル試薬と反応させることによって製造することができる。好適な式5の試薬の例は、ホスゲン、カルボニルジイミダゾール、クロロギ酸アルキルまたはクロロギ酸アリール、炭酸ジアルキル、炭酸ジアリールまたは炭酸アルキルアリールおよびジチオ炭酸ジアルキル、ジチオ炭酸ジアリールまたはジチオ炭酸アルキルアリール(XはOを表す)ならびにそれらのチオカルボニル誘導体(XはSを表す)である。

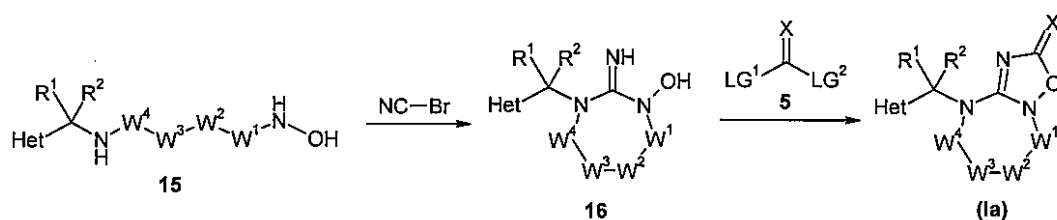
【0094】

官能基Lの性質に応じて、式11の中間体は、幾つかの異なるプロトコルに従って式2aの

生成物に変換することができる。Lが保護されたヒドロキシル基を表す場合、標準的な文献方法に従って、脱保護の後、遊離OH官能基を脱離基(例えばハロゲン化物またはスルホン酸アルキル基)に変換するか、またはアルデヒド官能基に酸化させ、その後、アルキル化(Lは脱離基を表す)条件または還元的アミノ化(Lはアルデヒド基を表す)条件下、式12のアミンと共にインキュベーションする。式12のアミン構成要素は、当技術分野で公知の方法によって製造することができる；例えば、S. Patai “The Chemistry of the Amino Group” Interscience Publishers, New York, 1968を参照のこと。式11の化合物(式中、Lは保護されたアミノ基を表す)について、式2aの生成物への変換は、最初に、標準的な文献方法によってアミノ基を脱保護し、その後式13の求電子試薬と共にインキュベーションすることによって達成することができる。好適な脱離基(LG)としては、限定するものではないが、ハロゲン、メシラート、トシラートまたはトリフラートが挙げられる。この変換は、典型的には、室温～溶媒の還流温度において、第3級アミンまたは炭酸塩塩基(例えば、それぞれトリエチルアミンまたは炭酸ナトリウム)の存在下、DMF、アセトニトリルまたはTHFなどの極性溶媒中で行われる。別法として、式2aの化合物(式中、R²はHである)は、式11の化合物(LはNH₂を表す)を、還元的アミノ化条件下で、式14のアルデヒドまたはケトンと反応させることによって得られる。

【化 3 3】

スキームD:

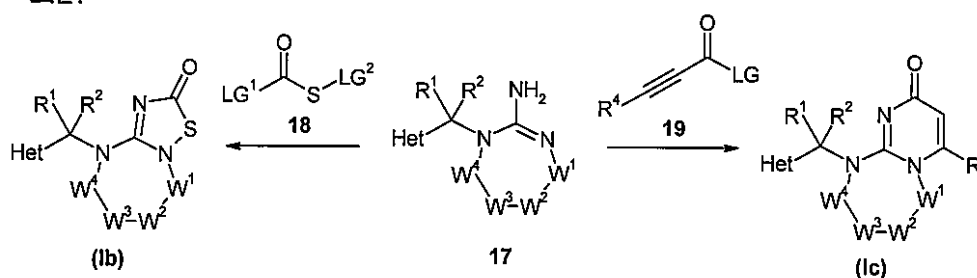


【0095】

式(I)の化合物(式中、AはOであり、BはNである)のサブセットを表す式(Ia)の化合物は、スキームDに示される一連のステップによって製造することができる。このように、臭化シアンまたは塩化シアンとの反応による式15の化合物の環化により、式16のヒドロキシグアニジン中間体が得られる。この変換は、ジアミンを対応する環状グアニジンに変換するのと同様に、好ましくは、室温または穏やかな昇温において、アセトニトリルまたはN、N-ジメチルホルムアミドなどの極性溶媒中で行う；例えば、J. E. Casidaら, J. Med. Chem. 1999, 42, 2227-2234を参照。式16のヒドロキシグアニジンは、式5のカルボニル化試薬と共にインキュベーションすることによって、対応する式(Ia)の二環式化合物に変換することができる。好適な式5の試薬の例は、ホスゲン、カルボニルジイミダゾール、クロロギ酸アルキルまたはクロロギ酸アリール、炭酸ジアルキル、炭酸ジアリールまたは炭酸アルキルアリールおよびジチオ炭酸ジアルキル、ジチオ炭酸ジアリールまたはジチオ炭酸アルキルアリール(XはOを表す)ならびにそれらのチオカルボニル誘導体(XはSを表す)である。この変換のための好ましい条件としては、室温～溶媒の還流温度における、ジクロロメタン、クロロホルムまたはトルエンなどの非極性溶媒の使用が挙げられる。第3級アミン塩基などの塩基の存在は、式5中の脱離基の1つがハロゲンである場合には好ましい。ヒドロキシグアニジン化合物の類似のカルボニル化反応は、例えば、G. Zinnerら, Archiv der Pharmazie 1986, 319 (12), 1073-1079またはC.-Z. Dongら, Bioorg. Med. Chem. 2005, 13 (6), 1989-2007に記載されている。

【化 3 4】

スキームE:



10

【0096】

式(I)の化合物のサブセットの合成のためのさらに有用な中間体は、式17のグアニジン誘導体である。これらの中間体の製造は文献に記載されている；例えば、J. E. Casidaら, J. Labelled Compounds Radiopharm. 1996, 38, 971-978およびJ. E. Casidaら, J. Med. Chem. 1999, 42, 2227-2234を参照のこと。式17の化合物を、式18のアシルスルフェニル試薬と反応させると、式(Ib)の二環式生成物が得られる。好適なアシルスルフェニル試薬は、例えば、クロロホルミルスルフェニルクロリドまたはアルキルクロロカルボニルスルフィドである。この変換のための好ましい条件としては、約0～約100℃の温度における、第3級アミン塩基などの塩基の存在下での、テトラヒドロフラン、トルエンまたはベンゼンなどの非プロトン性溶媒の使用が挙げられる。代表的な方法については、例えば、K. Pilgramら, J. Org. Chem. 1973, 38 (8), 1575-1578およびK. Pilgramら, J. Org. Chem. 1973, 38 (8), 1578-1582を参照のこと。

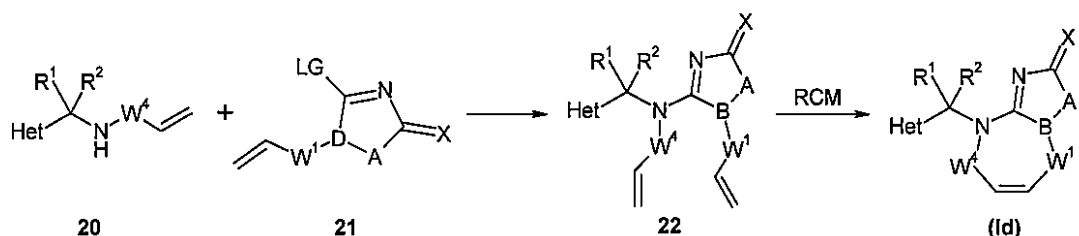
20

【0097】

式(Ic)の化合物は、式17のグアニジンを、式19のプロピオン酸誘導体と反応させることによって得ることができる。好適な式19の試薬としては、例えば、プロピオン酸アルキルまたはハロゲン化プロピオニルが挙げられる。この変換は、好ましくは、溶媒の還流温度などの昇温において、トルエンまたはキシレンなどの非極性溶媒中で行われる。代表的な方法については、M. A. Munierら, J. Heterocycl. Chem. 1978, 15 (5), 849-853を参照されたい。

【化 3 5】

スキームF:



30

【0098】

また、二環構造モチーフ中に不飽和要素を含む式(Id)の化合物も、式22の前駆体を閉環メタセシスさせることによって製造することができる。この目的のため、式22のジエンを、当技術分野で周知の方法に従って、例えば、グラブスルテニウム(Grubbs ruthenium)錯体触媒またはシュロックモリブデン(Schrock molybdenum)錯体触媒などのメタセシス触媒と共にインキュベートする(例えば、A. Gradillasら, Angew. Chem. Int. Ed. 2006, 45 (37), 6086-6101およびこの文献中で引用される参考文献を参照のこと)。式22の中間体は、式20のアミンを、式11の化合物の合成に用いられる方法(スキームC)によって得ることができる式21の構成要素と共にインキュベーションすることによって入手可能である。式21中の好適な脱離基LGとして、S-アルキル、O-アルキルまたはハロゲンが挙げられる。式20のアミンは、当技術分野で公知の方法によって製造することができる；例えば、S. Pat

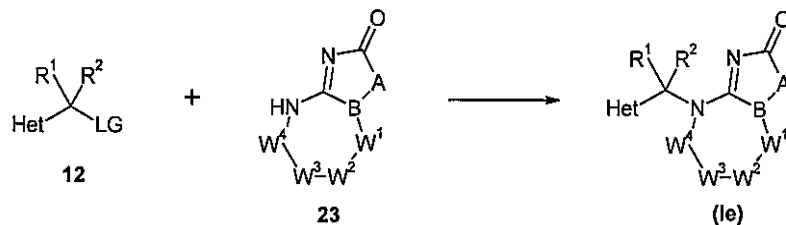
40

50

ai “The Chemistry of the Amino Group” Interscience Publishers, New York, 1968を参照のこと。中間体22を与える化合物20と化合物21との反応は、好ましくは、室温～溶媒の還流温度において、第3級アミンまたは炭酸塩塩基(例えば、それぞれトリエチルアミンまたは炭酸ナトリウム)の存在下、テトラヒドロフラン、アセトニトリルまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの極性溶媒中で行われる。この変換のための代表的な方法は：S. Chenら, Bioorg. Med. Chem. Lett. 2007, 17 (8), 2134-2138に記載されている。

【化36】

スキームG:



10

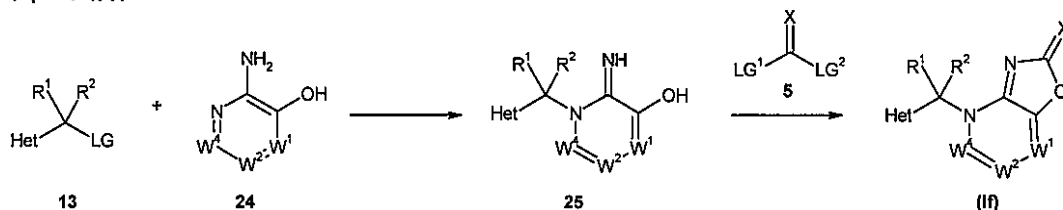
【0099】

式(Ie)の化合物の製造のための一般的な方法は、式13の求電子試薬を用いた式23の二環のアルキル化(スキームG)である。式13中の脱離基(LG)の例としては、ハロゲン、スルホン酸アルキルまたはスルホン酸フルオロアルキルが挙げられる。好ましくは、この変換は、室温～溶媒の還流温度において、炭酸塩または第3級アミン塩基(例えば、それぞれトリエチルアミンまたは炭酸ナトリウム)などの塩基の存在下、アセトニトリルまたはアセトンなどの極性溶媒中で行われる。式(II-1)のサブセットに対応する二環23(式中、Aは0を表す)について、このようなアルキル化反応は、例えば、CH461489およびW02007/022257に記載されている。

20

【化37】

スキームH:



30

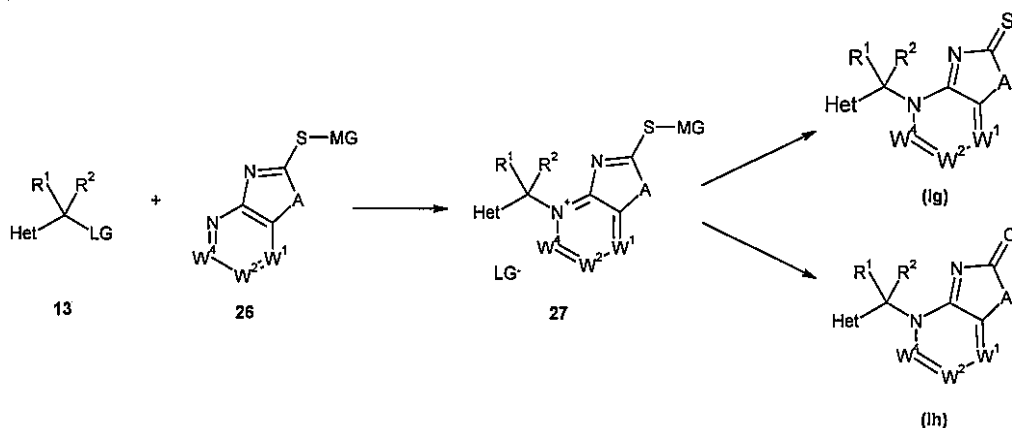
【0100】

式(II-1)、(II-2)、(II-3)または(II-4)の二環のサブセットを表す構造要素を特徴とする式(If)の化合物(式中、XはOまたはSを表し、W¹、W²およびW⁴は、CR⁶またはNを表す)は、スキームHに概略される合成順序によって製造することができる。このように、式24のアミノ-ヒドロキシ置換芳香族ヘテロ環(例えば、ピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジンまたはトリアジン)を、式13の求電子試薬を用いてN-アルキル化し(例えば、R. C. Youngら, J. Med. Chem. 1987, 30 (7), 1150-1156を参照)、その後、式25の生成物を式5のカルボニル化/チオカルボニル化試薬と反応させると、式(If)の二環が生じる。好適な式5の試薬は、例えば、ホスゲン、カルボニルジイミダゾール、クロロギ酸アルキルまたはクロロギ酸アリール、炭酸ジアルキル、炭酸ジアリールまたは炭酸アルキルアリールおよびジチオ炭酸ジアルキル、ジチオ炭酸ジアリールまたはジチオ炭酸アルキルアリール(XはOを表す)ならびにそれらのチオカルボニル誘導体(XはSを表す)である。カルボニル化反応の代表的な例については、W02009/023844を参照のこと。

40

【化 3 8】

スキームI:



10

【0101】

式26のチオエーテルの位置選択的アルキル化を利用した、式(Ig)の化合物および式(Ih)の化合物の製造のための合成経路は、スキームIに示される。この変換の例、ならびに式26の化合物の合成の例については：L. Bethgeら, Bioorg. Med. Chem. 2008, 16 (1), 114-125；Y. Liuら, J. Heterocyclic Chem. 2010, 47 (3), 683-686；W02000/066664を参照のこと。

20

【0102】

硫黄マスキング基(MG)の性質に応じて、式27の中間体を、式(Ig)の生成物および式(Ih)の生成物に変換することができる。MGが、例えば(置換)ベンジル、フルオレニルメチルまたはメトキシメチルなどの硫黄保護基である式27の化合物について、標準的な文献方法によるこのマスキング基の脱保護は、式(Ig)の化合物を与える。別法として、式27の中間体の、式(Ig)の生成物への変換は、0℃～溶媒の還流温度において、場合により塩基の存在下、式27の中間体をスルフィド塩(例えばアンモニウムスルフィド)またはH₂Sと共に極性溶媒中でインキュベーションすることによって達成することができる。好ましい溶媒は、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルホルムアミドまたはピリジンである。

30

【0103】

さらに、式(Ih)の化合物は、式26の中間体(式中、MGは(置換)アルキル基を表す)を硫黄酸化させ、その後結果として得られるスルホキシドまたはスルホン基を水酸化物と置換することによって得ることができる。好適な酸化剤としては、例えば、メタ-クロロ過安息香酸、過酸化水素または次亜塩素酸ナトリウムが挙げられる。酸化が塩基性水性媒体中で行われる場合、式27の化合物の、式(Ih)の生成物への変換は、単一工程で達成することができる。

【0104】

個々の化合物が上記の経路により製造できない場合は、他の化合物Iの誘導体化により、または上記合成経路の慣用の改変により製造可能である。

40

【0105】

反応混合物の後処理は、慣用方法で、例えば水と混合し、相を分離させ、適当であれば、クロマトグラフィー(例えばアルミナまたはシリカゲル)で粗生成物を精製することにより行う。いくつかの中間体および最終生成物は、無色または薄褐色の粘性オイルの状態で見られるので、減圧下に適度な昇温で揮発性成分を除くか、あるいは精製する。中間体および最終生成物が固体として得られる場合は、それらを再結晶または温浸により精製してもよい。

【0106】

有害生物

式Iの化合物およびそれらの塩は、有害な節足動物(例えば、クモ形類、多足類および

50

昆虫)ならびに線虫類を効果的に防除するのに特に適している。

【0107】

式Iの化合物は以下の有害生物を効果的に駆除するのに特に適している。

【0108】

チョウ類(鱗翅目:Lepidoptera)の昆虫、例えば、タマナヤガ(*Agrotis ypsilon*)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、アメリカワタノミガ(*Alabama argillacea*)、ハッショウマメケムシ(*Anticarsia gemmatalis*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、ガンマキンウワバ(*Autographa gamma*)、ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、カコエシア・ムリナナ(*Cacoecia murinana*)、カプア・レチクラナ(*Capua reticulana*)、ケイマトビア・ブルマタ(*Cheimatobia brumata*)、トウヒシントメハマキ(*Choristoneura fu* 10
miferana)、コリストネウラ・オシデンタリス(*Choristoneura occidentalis*)、アワヨトウ(*Cirphis unipuncta*)、コドリリング(*Cydia pomonella*)、デンドロリムス・ピニ(*Dendrolimus pini*)、アメリカウリノメイガ(*Diaphania nitidalis*)、サウスウエスタンコーンボラー(*Diatraea grandiosella*)、ミスジアオリング(*Earias insulana*)、モロコシマダラメイガ(*Elasmopalpus lignosellus*)、ブドウホソハマキ(*Eupoecilia ambiguella*)、エベトリア・ボウリアナ(*Evetria bouliana*)、フェルチア・スブテラネア(*Feltia subterranea*)、ハチノスツヅリガ(*Galleria mellonella*)、グラホリタ・フネブラナ(*Grapholitha funebrana*)、ナツヒメシンクイ(*Grapholitha molesta*)、タバコガ(*Heliothis armigera*)、ニセアメリカタバコガ(*Heliothis virescens*)、タバコガ(*Heliothis zea*)、ハイマダラノメイガ(*Hellula undalis*)、ヒベルニア・デホリアリア(*Hibernia defoliaria*)、アメリカ 20
シロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、ヒポノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコペルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、ランブジナ・フィセラリア(*Lambdina fiscellaria*)、シロイチモンジヨトウ(*Laphygma exigua*)、ロイコプテラ・コフィーラ(*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、キンモンホソガ(*Lithocolletis blancardella*)、ホソバヒメハマキ(*Lobesia botrana*)、ヘリキスジノメイガ(*Loxostege sticticalis*)、マイマイガ(*Lymantria dispar*)、ノンネマイマイ(*Lymantria monacha*)、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)、オビカレハ(*Malacosoma neustria*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、オルギア・プソイドツガータ(*Orgyia pseudotsugata*)、アワノメイガ(*Ostrinia nubilalis*)、マツキリガ(*Panolis flammea*)、ワタキバガ(*Pectinophora gossypiella*)、ニセタマナヤガ(*Peridroma saucia*)、ファレラ・ブ 30
セファラ(*Phalera bucephala*)、ジャガイモキバガ(*Phthorimaea operculella*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、オオモンシロチョウ(*Pieris brassicae*)、ヤガ(*Plathypena scabra*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、キンウワバ(*Pseudoplusia includens*)、リアシオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、トマトガ(*Scrobipalpus absoluta*)、バクガ(*Sitotroga cerealella*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、ヨトウガ(*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・リットラリス(*Spodoptera littoralis*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、マツノギョウレツケムシ(*Thaumtopoea pityocampa*)、トルトリキス・ビリダナ(*Tortrix viridana*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、およびゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)；

【0109】

甲虫類(鞘翅目:Coleoptera)、例えば、アカバナガタマムシ(*Agrilus sinuatus*)、アグリオテス・リネアツス(*Agriotes lineatus*)、アグリオテス・オブスクルス(*Agriotes obscurus*)、アンフィマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスパル(*Anisandrus dispar*)、アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*)、アントノムス・ポモルム(*Anthonomus pomorum*)、アフトナ・オイフォリダエ(*Aphthona euphoridae*)、アトウス・ヘモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、ブラストファグス・ピニペルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダタ(*Blitophaga undata*)、ソラマメゾウムシ(*Bruchus rufimanus*)、エンドウゾウムシ(*Bruchus pisorum*)、ヒラマメゾウムシ(*Bruchus lentis*)、ドロハマキ 50
チョッキリ(*Byctiscus betulae*)、カメノコハムシ(*Cassida nebulosa*)、セロトマ・

トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、キンイロハナムグリ(*Cetonia aurata*)、コイトリンクス・アッシミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・ナピ(*Ceuthorrhynchus napi*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、コノデルス・ベスペルチヌス(*Conoderus vespertinus*)、アスパラガスクビナガハムシ(*Crioceris asparagi*)、クテニセラ属の種(*Ctenicera* spp.)、ジアブロチカ・ロンギコルニス(*Diabrotica longicornis*)、ジアブロチカ・セミプンクタタ(*Diabrotica semipunctata*)、ジアブロチカ・12-プンクタタ(*Diabrotica 12-punctata*)、ジアブロチカ・スペシオサ(*Diabrotica speciosa*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ(*Diabrotica virgifera*)、インゲンテントウ(*Epilachna varivestis*)、エピトリクス・ヒルチペンニス(*Epitrix hirtipennis*)、ユーチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、マツアナアキゾウムシ(*Hylobius abietis*)、ヒペラ・ブルンネイペンニス(*Hypera brunneipennis*)、ヒペラ・ポストカ(*Hypera postica*)、ヤツバキクイムシ(*Ips typographus*)、レマ・ビリネアタ(*Lema bilineata*)、レマ・メラノプス(*Lema melanopus*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リモニウス・カリホルニクス(*Limoniuss californicus*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptus oryzophilus*)、メラノツス・コムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、コフキコガネ(*Melolontha hippocastani*)、コフキコガネ(*Melolontha melolontha*)、イネクビボソハムシ(*Oulema oryzae*)、キンケクチブトゾウムシ(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オバツス(*Otiorrhynchus ovatus*)、ファエドン・コクレアリエ(*Phaedon cochleariae*)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロトレタ・クリソセファラ(*Phyllotreta chrysocephala*)、フィロファガ属の種(*Phyllophaga* spp.)、フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta nemorum*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、アカアシチビコフキゾウムシ(*Sitona lineatus*)、およびシトフィルス・グラナリア(*Sitophilus granaria*) ;

【0110】

ハエ、カ(双翅目:Diptera)、例えば、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、キンイロヤブカ(*Aedes vexans*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、ハマダラカ(*Anopheles maculipennis*、*Anopheles crucians*、*Anopheles albimanus*)、ガンビアハマダラカ(*Anopheles gambiae*)、ハマダラカ(*Anopheles freeborni*、*Anopheles leucosphyrus*)、コガタハマダラカ(*Anopheles minimus*)、ハマダラカ(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(*Calliphora vicina*)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、旧世界ラセンウジバエ(*Chrysomya bezziana*)、新世界ラセンウジバエ(*Chrysomya hominivorax*)、ハエ(*Chrysomya macellaria*)、サシバエ(*Chrysops discalis*)、アブ(*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*)、ラセンウジバエ(*Cochliomyia hominivorax*)、ソルガムタマバエ(*Contarinia sorghicola*)、ヒトクイバエ(*Cordylobia anthropophaga*)、ヌカカ(*Culicoides furens*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、イエカ(*Culex nigripalpus*)、ネッタイイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、イエカ(*Culex tarsalis*)、ハボシカ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オリーブミバエ(*Dacus oleae*)、ダイコンタマバエ(*Dasineura brassicae*)、タマネギバエ(*Delia antique*)、コムギハナバエ(*Delia coarctata*)、タネバエ(*Delia platura*)、キャベツハナバエ(*Delia radicum*)、ヒフバエ(*Dermatobia hominis*)、ヒメイエバエ(*Fannia canicularis*)、ヒメコバエ(*Geomyza tripunctata*)、ウマバエ(*Gasterophilus intestinalis*)、ツェツェバエ(*Glossina morsitans*)、ツェツェバエ(*Glossina palpalis*、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、タネバエ(*Hylemyia platura*)、ウシバエ(*Hypoderma lineata*)、ヌカカ(*Leptocnops torrens*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、キンバエ(*Lucilia caprina*)、ヒツジキンバエ(*Lucilia cuprina*)、ヒロズキンバエ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・チチラヌス(*Mansonia titillanus*)、コムギタマバエ(*Mayetiola destructor*)、ムス

カ・アウツムナリス(*Musca autumnalis*)、イエバエ(*Musca domestica*)、オオイエバエ(*Musca stabulans*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、オポマイザ・フロラム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、アカザモクセリハナバエ(*Pegomya hysocyami*)、ホルビア属のハエ(*Phorbia antiqua*、*Phorbia brassicae*、*Phorbia coarctata*)、サシチョウバエ(*Phlebotomus argentipes*)、ヤブカ(*Psorophora columbiae*)、ニンジンサビバエ(*Psila rosae*)、プソロフォラ・ディスカラ(*Psorophora discolor*)、ブユ(*Prosimulium mixtum*)、ヨーロッパオウトウミバエ(*Rhagoletis cerasi*)、リンゴミバエ(*Rhagoletis pomonella*)、ニクバエ(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* sp.)、ブユ(*Simulium vittatum*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、ウシアブ(*Tabanus bovinus*)、アブ(*Tabanus atratus*、*Tabanus lineola*、*Tabanus similis*)、ガガンボ(*Tipula oleracea*、*Tipula paludosa*) ;

10

【0111】

アザミウマ(総翅目(*Thysanoptera*))、例えば、ジクロモトリプス・コルベッチ(*Dichromothrips corbetti*)、ジクロモトリプス属の種(*Dichromothrips* spp.)、フランクリエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリエラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリエラ・トリチシ(*Frankliniella tritici*)、シルトスリップス・シトリ(*Scirtothrips citri*)、イネアザミウマ(*Thrips oryzae*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)およびネギアザミウマ(*Thrips tabaci*) ;

【0112】

シロアリ(等翅目:*Isoptera*)、例えば、カロテルメス・フラビコリス(*Calotermes flavicollis*)、ロイコテルメス・フラビペス(*Leucotermes flavipes*)、ヘテロテルムス・アウレウス(*Heterotermes aureus*)、レチクリテルメス・フラビペス(*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヴァルジニクス(*Reticulitermes virginicus*)、レチクリテルメス・ルシフグス(*Reticulitermes lucifugus*)、レチクリテルメス・サントネンシス(*Reticulitermes santonensis*)、レチクリテルメス・グラッセイ(*Reticulitermes grassei*)、テルメス・ナタレンシス(*Termes natalensis*)、およびイエシロアリ(*Coptotermes formosus*) ;

20

【0113】

ゴキブリ(網翅目:*Blattaria - Blattodea*)、例えば、チャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、モリチャバネゴキブリ(*Blattella asahinae*)、ワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、トビイロゴキブリ(*Periplaneta brunnea*)、クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、コワモンゴキブリ(*Periplaneta australasiae*)、およびトウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*) ;

30

【0114】

バグ、アブラムシ、ヨコバイ、コナジラミ、カイガラムシ、セミ(半翅目(*Hemiptera*))、例えば、カメムシ(*Acrosternum hilare*)、ナガカメムシ(*Blissus leucopterus*)、カスミカメムシ(*Cyrtopeltis notatus*)、アカホシカメムシ(*Dysdercus cingulatus*)、ホシカメムシ(*Dysdercus intermedius*)、キンカメムシ(*Eurygaster integriceps*)、ユスキスツス・インピクチベントリス(*Euschistus impictiventris*)、ヘリカメムシ(*Leptoglossus phyllopus*)、メクラカメムシ(*Lygus lineolaris*)、ミドリメクラガメ(*Lygus pratensis*)、ミナミアオカメムシ(*Nezara viridula*)、チビカメムシ(*Piesma quadrata*)、ソルベア・インスラリス(*Solubea insularis*)、チアンタ・ペルジトル(*Thyanta perditor*)、アシルトシフォン・オノブリキス(*Acyrtosiphon onobrychis*)、カサアブラムシ(*Adelges laricis*)、アフイデュラ・ナスツルチイ(*Aphidula nasturtii*)、クロアブラムシ(*Aphis fabae*)、イチゴネアブラムシ(*Aphis forbesi*)、リンゴアブラムシ(*Aphis pomi*)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、アフイス・グロッサラリア(*Aphis grossulariae*)、アフイス・シュネイデリ(*Aphis schneideri*)、アフイス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*)、ニワトコアブラムシ(*Aphis sambuci*)、エンドウヒゲナガアブラムシ(*Acyrtosiphon pisum*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(*Aulacorthum solani*)、シルバーリーフコナジラミ(*Bemisia argentifolii*)、アザミオマルアブラムシ(*Brachycaudus cardui*)、ムギワラギクオマルア

40

50

ブラムシ(*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキカウダス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)、ブラシカウダス・プルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ダイコンアブラムシ(*Brevicoryne brassicae*)、カピトフォルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシッピー(*Cerosipha gossypii*)、イチゴケナガアブラムシ(*Chaetosiphon fragaefolii*)、スグリトックリアブラムシ(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマニアナ(*Dreyfusia nordmanniana*)、ドレイフシア・ピセア(*Dreyfusia piceae*)、ジサフィス・ラディコラ(*Dysaphis radicola*)、ジサウラコルス・シュードソラニ(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、オオバコアブラムシ(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、ジャガイモヒメヨコバイ(*Empoasca fabae*)、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus pruni*)、チシャミドリアブラムシ(*Hyperomyzus lactucae*)、ムギヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum avenae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフォン・ロサエ(*Macrosiphon rosae*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrae*)、ムギウスイロアブラムシ(*Metopolophium dirhodum*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ミズス・アスカロニクス(*Myzus ascalonicus*)、ニワウメクロコブアブラムシ(*Myzus cerasi*)、カワリコブアブラムシ(*Myzus varians*)、レタスヒゲナガアブラムシ(*Nasonovia ribis-nigri*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、アブラムシ(*Pemphigus bursarius*)、クロフツノウンカ(*Perkinsiella saccharicida*)、ホップイボアブラムシ(*Phorodon humuli*)、リンゴキジラミ(*Psylla mali*)、ナシキジラミ(*Psylla piri*)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、トウモロコシアブラムシ(*Rhopalosiphum maidis*)、ムギクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum padi*)、リンゴクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum insertum*)、サッパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サッパフィス・マリ(*Sappaphis mali*)、ムギミドリアブラムシ(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌジノサ(*Schizoneura lanuginosa*)、シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、オンシツコナジラミ(*Trialetrodes vaporariorum*)、トキソプテラ・オーランチアンド(*Toxoptera aurantii*)、ブドウネアブラムシ(*Viteus vitifolii*)、トコジラミ(*Cimex lectularius*)、ネッタイトコジラミ(*Cimex hemipterus*)、レデュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種(*Triatoma* spp.)、およびアリス・クリタツス(*Arilus critatus*)；

【0115】

アリ、ミツバチ、スズメバチ、ハバチ（膜翅目：Hymenoptera）、例えば、カブラハバチ(*Athalia rosae*)、ハキリアリ(*Atta cephalotes*)、ハキリアリ(*Atta capiguara*)、ハキリアリ(*Atta cephalotes*)、ハキリアリ(*Atta laevigata*)、アッタ・ロブスタ(*Atta robusta*)、ハキリアリ(*Atta sexdens*)、テキサスハキリアリ(*Atta texana*)、シリアゲアリ類(*Crematogaster* spp.)、ホプロカンパ・ミスタ(*Hoplocampa minuta*)、ホプロカンパ・テスツジネア(*Hoplocampa testudinea*)、トビイロケアリ(*Lasius niger*)、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、アカカミアリ(*Solenopsis geminata*)、ヒアリ(*Solenopsis invicta*)、カミアリ(*Solenopsis richteri*)、ソレノプシス・キシロニ(*Solenopsis xyloni*)、アカシュウカクアリ(*Pogonomyrmex barbatus*)、シュウカクアリ(*Pogonomyrmex californicus*)、ツヤオオズアリ(*Pheidole megacephala*)、アリバチ(*Dasymutilla occidentalis*)、マルハナバチ類(*Bombus* spp.)、クロスズメバチ(*Vespula squamosa*)、クロスズメバチ(*Paravespula vulgaris*)、クロスズメバチ(*Paravespula pennsylvanica*)、スズメバチ(*Paravespula germanica*)、スズメバチ(*Dolichovespula maculata*)、スズメバチ(*Vespa crabro*)、アシナガバチ(*Polistes rubiginosa*)、オオアリ(*Camponotus floridanus*)、およびアルゼンチンアリ(*Linepithema humile*)；

【0116】

コオロギ、バッタ、イナゴ（直翅目：Orthoptera）、例えば、ヨーロッパイエコオロギ(*Acheta domestica*)、ケラ(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、メラノプルス属のバッタ(*Melanoplus bivittatus*、*Melanoplus femurrubrum*、*Melanoplus mexicanus*、*Melanoplus sanguinipes*、*Melanoplus spretus*)、アカトビバッタ(*Nomadacris septemfasciata*)、アメリカイナゴ(*Schistocerca americana*)、サバクトビバ

ツタ(*Schistocerca gregaria*)、モロコトビバツタ(*Doclostaurus maroccanus*)、クラズミウマ(*Tachycines asynamorus*)、ワタリバツタ(*Oedaleus senegalensis*)、ゾノゼルス・ヴァリエガツス(*Zonozelus variegatus*)、ヒエログリフス・ダガネンシス(*Hieroglyphus daganensis*)、バツタ(*Kraussaria angulifera*)、イナゴ(*Calliptamus italicus*)、オーストラリアトビバツタ(*Chortoicetes terminifera*)、およびアカトビバツタ(*Locustana pardalina*) ;

【0117】

クモ形類、例えばクモ形綱(ダニ目:*Acarina*)、例えば、ヒメダニ科(*Argasidae*)、マダニ科(*Ixodidae*)およびヒゼンダニ科(*Sarcoptidae*)に属するもの、例えばアメリカキラマダニ(*Amblyomma americanum*)、マダニ(*Amblyomma variegatum*)、メキシコ湾岸マダニ(*Amblyomma maculatum*)、ヒメダニ(*Argas persicus*)、マダニ(*Boophilus annulatus*、*Boophilus decoloratus*、*Boophilus microplus*)、カクマダニ(*Dermacentor silvarum*、*Dermacentor andersoni*、*Dermacentor variabilis*)、ヒアロンマ・トルンカツム(*Hyalomma truncatum*)、マダニ(*Ixodes ricinus*)、マダニ(*Ixodes rubicundus*)、クロアシマダニ(*Ixodes scapularis*)、オーストラリア産マダニ(*Ixodes holocyclus*)、西部クロアシマダニ(*Ixodes pacificus*)、カズキダニ(*Ornithodoros moubata*、*Ornithodoros hermsi*、*Ornithodoros turicata*)、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)、ミミダニ(*Otobius megnini*)、ワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、ヒツジヒゼンダニ(*Psoroptes ovis*)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)、コイタマダニ(*Rhipicephalus appendiculatus*、*Rhipicephalus evertsi*)、ヒゼンダニ(*Sarcoptes scabiei*)、ならびにフシダニ科(*Eriophyidae* spp.)、例えば、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、ミカンサビダニ(*Phyllocoptrata oleivora*)、およびエリオフィエス・シェルドニ(*Eriophyes sheldoni*) ; ホコリダニ科(*Tarsonemidae* spp.)、例えば、フィトネムス・パリズス(*Phytonemus pallidus*)、およびチャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*) ; ヒメハダニ科(*Tenuipalpidae* spp.)、例えば、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*) ; ハダニ科(*Tetranychidae* spp.)、例えば、ニセナミハダニ(*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ(*Tetranychus kanzawai*)、オウトウハダニ(*Tetranychus pacificus*)、ニセナミハダニ(*Tetranychus telarius*)、およびナミハダニ(*Tetranychus urticae*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、およびオリゴニクス・プラテンシス(*Oligonychus pratensis*) ; 真正クモ目(*Araneida*)、例えば、クロゴケグモ(*Latrodectus mactans*)、およびドクイトグモ(*Loxosceles reclusa*) ;

【0118】

ノミ(隠翅目:*Siphonaptera*)、例えば、ネコノミ(*Ctenocephalides felis*)、イヌノミ(*Ctenocephalides canis*)、ケオプスネズミノミ(*Xenopsylla cheopis*)、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、スナノミ(*Tunga penetrans*)、およびヨーロッパネズミノミ(*Nosopsyllus fasciatus*) ;

シミ(総尾目:*Thysanura*)、例えば、セイヨウシミ(*Lepisma saccharina*)、およびマダラシミ(*Thermobia domestica*) ;

ムカデ(唇脚綱:*Chilopoda*)、例えばハウスムカデ(*Scutigera coleoptrata*) ;

ヤスデ(倍脚綱:*Diplopoda*)、例えばナルセウス属の種(*Narceus* spp.) ;

ハサミムシ(革翅目:*Dermaptera*)、例えばヨーロッパクギヌキハサミムシ(*forficula auricularia*) ;

シラミ(シラミ目:*Phthiraptera*)、例えば、アタマジラミ(*Pediculus humanus capitis*)、コロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ(*Phthirus pubis*)、ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ(*Linognathus vituli*)、ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)、ニワトリハジラミ(*Menopon gallinae*)、ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)、およびケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*) ;

トビムシ(トビムシ目:*springtail*)、例えばシロトビムシ類(*Onychiurus* spp.)。

【0119】

それらはまた、以下の線虫類の防除にも適している。植物寄生性線虫、例えばネコブセンチュウ類の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*)、および他のネコブセンチュウ類；シスト形成センチュウ類のジャガイモシストセンチュウ(*Globodera rostochiensis*)および他のグロボデラ属の種；穀物シストセンチュウ(*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*)、クローバーシストセンチュウ(*Heterodera trifolii*)、および他のヘテロデラ属の種；種子コブセンチュウ類のアングイナ属(*Anguina*)の種；クキおよびハセンチュウ類のアフェレンコイデス属(*Aphelenchoides*)の種；刺毛センチュウ類のペロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*)および他のペロノライムス属の種；マツセンチュウ類のマツノザイセンチュウ(*Bursaphelenchus xylophilus*)および他のブルサフェレンクス属の種；ワセンチュウ類のクリコネマ属(*Criconema*)の種、クリコネメラ属(*Criconemella*)の種、クリコネモイデス属(*Criconemoides*)の種、メソクリコネマ属(*Mesocriconema*)の種；クキおよびリンケイセンチュウ類のイモグサレセンチュウ(*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ(*Ditylenchus dipsaci*)、および他のジチレンクス属の種；突錐センチュウ類のドリコドルス属(*Dolichodorus*)の種；ラセンセンチュウ類のヘリオコチレンクス・マルチシンクツス(*Helicotylenchus multicinctus*)および他のヘリオコチレンクス属の種；鞘センチュウおよび有鞘センチュウ類のヘミシクリオホラ属(*Hemicycliophora*)の種およびヘミクリコネモイデス属(*Hemicriconemoides*)の種；ヒルスマンニエラ属(*Hirshmanniella*)の種；ヤリセンチュウ類のホプロアイムス属(*Hoploaimus*)の種；ニセネコブセンチュウ類のナコブス属(*Nacobbus*)の種；ハリセンチュウ類のロンギドルス・エロンガツス(*Longidorus elongatus*)および他のロンギドルス属の種；ネグサレセンチュウ類の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*)、パラチレンクス・クルビタツス(*Pratylenchus curvatus*)、パラチレンクス・ゴオデイ(*Pratylenchus goodeyi*)および他のパラチレンクス属の種；ネモグリセンチュウ類のバナナネモグリセンチュウ(*Radopholus similis*)および他のラドホルス属の種；ニセフクロセンチュウ類のロチレンクス・ロボスツス(*Rotylenchus robustus*)および他のロチレンクス属の種；スクテロネマ属(*Scutellonema*)の種；ユミハリセンチュウ類のトリコドルス・プリミチブス(*Trichodorus primitivus*)および他のトリコドルス属の種、パラトリコドルス属(*Paratrichodorus*)の種；イシュクセンチュウ類のナミイシュクセンチュウ(*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・ズビウス(*Tylenchorhynchus dubius*)、および他のチレンコリンクス属の種；ミカンセンチュウ類のチレンクルス属(*Tylenchulus*)の種；オオハリセンチュウ類のキシフィネマ属(*Xiphinema*)の種；ならびに他の植物寄生性線虫。

【0120】

式Iの化合物およびそれらの塩はまた、クモ形類(クモ形綱)、例えば以下のダニ類(ダニ目)を防除するためにも有用である。ヒメダニ科(*Argasidae*)、マダニ科(*Ixodidae*)、およびヒゼンダニ科(*Sarcoptidae*)に属するもの、例えば、アメリカキララマダニ(*Amblyomma americanum*)、マダニ(*Amblyomma variegatum*)、ヒメダニ(*Argas persicus*)、マダニ(*Boophilus annulatus*、*Boophilus decoloratus*、*Boophilus microplus*)、カクマダニ(*Dermacentor silvarum*)、ヒアロンマ・トルンカツム(*Hyalomma truncatum*)、マダニ(*Ixodes ricinus*)、マダニ(*Ixodes rubicundus*)、カズキダニ(*Ornithodoros moubata*)、ミミダニ(*Otobius megnini*)、ワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、ヒツジヒゼンダニ(*Psoroptes ovis*)、コイタマダニ(*Rhipicephalus appendiculatus*、*Rhipicephalus evertsi*)、ヒゼンダニ(*Sarcoptes scabiei*)；およびフシダニ科の種(*Eriophyidae* spp.)、例えば、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、ミカンサビダニ(*Phyllocoptrata oleivora*)、およびエリオフィエス・シェルドニ(*Eriophyes sheldoni*)；ホコリダニ科の種(*Tarsonemidae* spp.)、例えば、フィトネムス・パリズス(*Phytonemus pallidus*)およびチャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*)；ヒメハダニ科の種(*Tenuipalpidae* spp.)、例えば、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*)；ハダニ科の種(*Tetranychidae* spp.)、例えば、ニセナミ

ハダニ(*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ(*Tetranychus kanzawai*)、オウトウハダニ(*Tetranychus pacificus*)、ニセナミハダニ(*Tetranychus telarius*)、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、およびオリゴニクス・プラテンシス(*Oligonychus pratensis*)。

【0121】

式Iの化合物は特に昆虫、好ましくは刺吸型昆虫、例えば総翅目(総翅目(*Thysanoptera*))、双翅目(*Diptera*)、および半翅目(*Hemiptera*)に属する昆虫、とりわけ以下の種を防除するのに有用である。

【0122】

総翅目(*Thysanoptera*)：フランクリエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリエラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリエラ・トリチシ(*Frankliniella tritici*)、シルトトリプス・シトリ(*Scirtothrips citri*)、イネアザミウマ(*Thrips oryzae*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)およびネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)；

【0123】

双翅目(*Diptera*)：例えば、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、キンイロヤブカ(*Aedes vexans*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、ハマダラカ(*Anopheles maculipennis*、*Anopheles crucians*、*Anopheles albimanus*)、ガンビアハマダラカ(*Anopheles gambiae*)、ハマダラカ(*Anopheles freeborni*、*Anopheles leucosphyrus*)、コガタハマダラカ(*Anopheles minimus*)、ハマダラカ(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(*Calliphora vicina*)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、旧世界ラセンウジバエ(*Chrysomya bezziana*)、新世界ラセンウジバエ(*Chrysomya hominivorax*)、ハエ(*Chrysomya macellaria*)、サシバエ(*Chrysops discalis*)、アブ(*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*)、ラセンウジバエ(*Cochliomyia hominivorax*)、ソルガムタマバエ(*Contarinia sorghicola*)、ヒトクイバエ(*Cordylobia anthropophaga*)、ヌカカ(*Culicoides furens*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、イエカ(*Culex nigripalpus*)、ネッタイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、イエカ(*Culex tarsalis*)、ハボシカ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オリーブミバエ(*Dacus oleae*)、ダイコンタマバエ(*Dasineura brassicae*)、タマネギバエ(*Delia antique*)、コムギハナバエ(*Delia coarctata*)、タネバエ(*Delia platura*)、キャベツハナバエ(*Delia radicum*)、ヒフバエ(*Dermatobia hominis*)、ヒメイエバエ(*Fannia canicularis*)、ヒメコバエ(*Geomyza tripunctata*)、ウマバエ(*Gasterophilus intestinalis*)、ツエツエバエ(*Glossina morsitans*)、ツエツエバエ(*Glossina palpalis*、*Glossina fuscipes*、*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、タネバエ(*Hylemyia platura*)、ウシバエ(*Hypoderma lineata*)、ヌカカ(*Leptoconops torrens*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、キンバエ(*Lucilia caprina*)、ヒツジキンバエ(*Lucilia cuprina*)、ヒロズキンバエ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・チチラス(*Mansonia titillanus*)、コムギタマバエ(*Mayetiola destructor*)、イエバエ(*Musca domestica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、オボマイザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、アカザモクセリハナバエ(*Pegomya hysocyami*)、ホルビア属のハエ(*Phorbia antiqua*、*Phorbia brassicae*、*Phorbia coarctata*)、サシチョウバエ(*Phlebotomus argentipes*)、ヤブカ(*Psorophora columbiae*)、ニンジンサビバエ(*Psila rosae*)、プソロフォラ・ディスカラ(*Psorophora discolor*)、ブユ(*Prosimulium mixtum*)、ヨーロッパオウトウミバエ(*Rhagoletis cerasi*)、リンゴミバエ(*Rhagoletis pomonella*)、ニクバエ(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* sp.)、ブユ(*Simulium vittatum*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、ウシアブ(*Tabanus bovinus*)、アブ(*Tabanus atratus*、*Tabanus lineola*、*Tabanus similis*)、ガガンボ(*Tipula oleracea*、*Tipula paludosa*)；

10

20

30

40

50

【0124】

半翅目(Hemiptera)、特にアブラムシ：アクリトシフォン・オノブリキス(*Acyrtosiphon onobrychis*)、カサアブラムシ(*Adelges laricis*)、アフィデュラ・ナスツルチイ(*Aphidula nasturtii*)、クロアブラムシ(*Aphis fabae*)、イチゴネアブラムシ(*Aphis forbesi*)、リンゴアブラムシ(*Aphis pomi*)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、アフィス・グロッサラリア(*Aphis grossulariae*)、アフィス・シュネイデリ(*Aphis schneideri*)、アフィス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*)、ニワトコアブラムシ(*Aphis sambuci*)、エンドウヒゲナガアブラムシ(*Acyrtosiphon pisum*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(*Aulacorthum solani*)、アザミオマルアブラムシ(*Brachycaudus cardui*)、ムギワラギクオマルアブラムシ(*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキカウダス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)、ブラシカウダス・プルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ダイコンアブラムシ(*Brevicoryne brassicae*)、カピトフォルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシッピー(*Cerosiphia gossypii*)、イチゴケナガアブラムシ(*Chaetosiphon fragaefolii*)、スグリトックリアブラムシ(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマニアナ(*Dreyfusia nordmanniana*)、ドレイフシア・ピセア(*Dreyfusia piceae*)、ジサフィス・ラディコラ(*Dysaphis radicola*)、ジサウラコルス・シュードソラニ(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、オオバコアブラムシ(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、ジャガイモヒメヨコバイ(*Empoasca fabae*)、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus pruni*)、チシャミドリアブラムシ(*Hyperomyzus lactucae*)、ムギヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum avenae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフォン・ロサエ(*Macrosiphon rosae*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyraeae*)、ムギウスイロアブラムシ(*Metopolophium dirhodum*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ミズス・アスカロニクス(*Myzus ascalonicus*)、ニワウメクロコブアブラムシ(*Myzus cerasi*)、カワリコブアブラムシ(*Myzus varians*)、レタスヒゲナガアブラムシ(*Nasonovia ribis-nigri*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、アブラムシ(*Pemphigus bursarius*)、クロフツノウンカ(*Perkinsiella saccharicida*)、ホップイボアブラムシ(*Phorodon humuli*)、リンゴキジラミ(*Psylla mali*)、ナシキジラミ(*Psylla piri*)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、トウモロコシアブラムシ(*Rhopalosiphum maidis*)、ムギクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum padi*)、リンゴクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum insertum*)、サッパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サッパフィス・マリ(*Sappaphis mali*)、ムギミドリアブラムシ(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌジノサ(*Schizoneura lanuginosa*)、シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、オンシツコナジラミ(*Trialetrodes vaporariorum*)、トキソプテラ・オーランチアンド(*Toxoptera aurantiiand*)、およびブドウネアブラムシ(*Viteus vitifolii*)。

【0125】

式Iの化合物は特に、半翅目(Hemiptera)および総翅目(Thysanoptera)の昆虫の防除に有用である。

【0126】

製剤

本発明の方法で使用するために、化合物Iは従来の製剤、例えば液剤、乳剤、懸濁液剤、散剤、粉剤、ペースト剤、粒剤、直接散布可能な液剤などに変換することができる。使用形態はその特定の目的および適用方法によって決まる。製剤および適用方法は、いずれの場合も、本発明による式Iの化合物の微細かつ均一な分散が確実になされるように選択される。

【0127】

製剤は公知の方法で調製し(例えば、US 3,060,084、EP-A 707 445 (濃縮剤に関して)、Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48、Perry's Chemical Engineer's Handbook, 第4版, McGraw-Hill, New York, 1963, p. 8-57、およびWO 91/13546、US 4,172,714、US 4,144,050、US 3,920,442、US 5,180,587、US 5,23

10

20

30

40

50

2,701、US 5,208,030、GB 2,095,558、US 3,299,566、Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961、Hance et al., Weed Control Handbook, 第8版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989、ならびにMollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (ドイツ), 2001, 2、D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8)を参照)、例えば、活性化化合物を、農業化学物質 (agrochemical) の製剤化に適する助剤 (例えば、溶媒および/または担体、所望により乳化剤、界面活性剤および分散剤、防腐剤、消泡剤、凍結防止剤、種子処理用の製剤の場合には、さらに任意で着色剤および/または結合剤および/またはゲル化剤) を用いて、のばすことにより調製する。

10

【0128】

好適な溶媒/担体としては、例えば以下のものがある。

-溶媒、例えば水、芳香族溶媒 (例えば、Solvesso(登録商標)の製品、キシレンなど)、パラフィン類 (例えば、鉱油留分)、アルコール類 (例えば、メタノール、ブタノール、ペンタノール、ベンジルアルコール)、ケトン類 (例えば、シクロヘキサノン、 γ -ブチロラクトン)、ピロリドン類 (N-メチルピロリドン(NMP)、N-オクチルピロリドン(NOP))、アセテート類 (二酢酸グリコール)、アルキルラクテート類、ラクトン類 (例えば、 γ -ブチロラクトン)、グリコール類、脂肪酸ジメチルアミド、脂肪酸および脂肪酸エステル、トリグリセリド類、植物もしくは動物起源の油および改質油 (例えば、アルキル化植物油) (基本的には、溶媒混合物も使用可能である) ;

20

-担体、例えば、粉碎天然鉱物および粉碎合成鉱物 (例えば、シリカゲル、微細ケイ酸、シリケート、タルク、カオリン、アタクレイ、石灰石、石灰、白亜、赤土、黄土、クレイ、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム)、粉碎合成材料、肥料 (例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素など)、植物起源の産物 (例えば、穀粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉)、セルロース粉末、ならびにその他の固形担体。

【0129】

好適な乳化剤は非イオン性およびアニオン性乳化剤 (例えば、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、アルキルスルホネートおよびアリアルスルホネート) である。

30

【0130】

分散剤の例はリグニン亜硫酸廃液およびメチルセルロースである。

【0131】

好適な界面活性剤は、以下のものである：リグノスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸、アルキルアリアルスルホン酸、アルキル硫酸、アルキルスルホン酸、脂肪アルコール硫酸、脂肪酸、および硫酸化脂肪アルコールグリコールエーテルのアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩およびアンモニウム塩、さらにはスルホン化ナフタレンおよびナフタレン誘導体とホルムアルデヒドの縮合物、ナフタレンまたはナフタレンスルホン酸とフェノールおよびホルムアルデヒドの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、オクチルフェノール、ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、トリステアシルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、アルコールと脂肪アルコール/エチレンオキシドの縮合物、エトキシ化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、エトキシ化ポリオキシプロピレン、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタール、ソルビトールエステル。

40

【0132】

さらに、凍結防止剤、例えばグリセリン、エチレングリコール、プロピレングリコールおよび殺細菌剤を製剤に添加することもできる。

【0133】

好適な消泡剤は、例えばシリコン系またはステアリン酸マグネシウム系の消泡剤である

50

。

【0134】

好適な防腐剤は、例えばジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールである。

【0135】

好適な増粘剤は、製剤に擬塑性の流動挙動を付与する化合物、すなわち静止時には高粘度を、そして攪拌段階では低粘度を付与する化合物である。これに関連して、例えば市販の多糖類系の増粘剤として、Xanthan Gum(登録商標)(Kelco社製のKelzan(登録商標))、Rhodopol(登録商標)23(Rhone Poulenc社製)もしくはVeegum(登録商標)(R.T. Vanderbilt社製)、または有機フィロ珪酸塩鉱物、例えばAttaclay(登録商標)(Engelhardt社製)が挙げられる。本発明による分散液剤に適した消泡剤は、例えば、シリコーン乳剤(例えば、Rhodia社製のSilikon(登録商標)SRE、WackerもしくはRhodorsil(登録商標))、長鎖アルコール、脂肪酸、有機フッ素化合物およびこれらの混合物である。本発明の組成物を微生物による攻撃に対して安定化するために殺生物剤を添加することができる。好適な殺生物剤は、例えば、イソチアゾロン系のものであり、Avecia社(またはArch社)からProxel(登録商標)、またはThor Chemie社からActicide(登録商標)RSおよびRohm & Haas社からKathon(登録商標)MKという商標で市販されている化合物がある。好適な凍結防止剤は有機ポリオール、例えばエチレングリコール、プロピレングリコール、またはグリセロールである。これらは通常、活性化合物組成物の全量に対して10重量%を超えない量で使用する。適切な場合、本発明の活性化合物組成物は、そのpHを調整するために、調製した製剤の全量に対して1から5重量%の緩衝剤を含むことができるが、用いる緩衝剤の量および種類は活性化合物(1種または複数種)の化学的性質によって変わる。緩衝剤の例は、弱い無機酸または有機酸(例えば、リン酸、ホウ酸、酢酸、プロピオン酸、クエン酸、フマル酸、酒石酸、シュウ酸、およびコハク酸など)のアルカリ金属塩である。

【0136】

直接散布可能な液剤、乳剤、ペースト剤、または油分散液剤を調製するのに適している物質は、中から高沸点の鉱油留分、例えばケロシンまたはディーゼルオイル、さらにはコールタールオイル、および植物または動物油、脂肪族、環状および芳香族の炭化水素、例えばトルエン、キシレン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンもしくはその誘導体、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール、シクロヘキサノン、イソホロン、強極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドン、および水である。

【0137】

粉剤、広域散布剤および散剤は、活性物質と固形担体を混合するか、または同時に粉砕することによって製造することができる。

【0138】

粒剤(例えば、コーティング粒剤、含浸粒剤、均質粒剤など)は、活性成分を固形担体に結合させることにより製造することができる。固形担体の例は、鉱物質土類(例えば、シリカゲル、シリケート、タルク、カオリン、アタクレイ、石灰石、石灰、白亜、赤土、黄土、クレイ、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウムなど)、粉碎合成材料、肥料(例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素など)、植物起源の材料(例えば、穀粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉など)、セルロース粉末、ならびにその他の固形担体である。

【0139】

一般に、製剤は、活性成分を0.01から95重量%、好ましくは0.1から90重量%含有する。活性成分は、純度90%から100%、好ましくは95%から100%(NMRスペクトルによる)で用いられる。

【0140】

種子処理を目的とする場合は、それぞれの製剤を2から10倍に希釈して、0.01から60重量%(好ましくは0.1から40重量%)の活性化合物を含む即使用可能な濃縮剤とする。

【0141】

式Iの化合物は、そのまま、その製剤の形で、またはその製剤から調製された使用形態で 사용할ことが可能であり、例えば、直接散布可能な液剤、粉剤、懸濁液剤もしくは分散液剤、乳剤、油分散液剤、ペースト剤、散粉用製品、広域散布剤、または粒剤の形で、散布、噴霧、散粉、広域散布または散水により使用することができる。使用形態はもっぱらその所期の目的によって決まるが、いずれの場合にも、本発明の活性化合物の可能なかぎり微細な分散が確実になるようにすべきである。

【0142】

以下に製剤の例を示す。

【0143】

1. 水で希釈する製品（種子処理を目的とする場合は、その製品を希釈してまたは希釈せずに種子に適用することができる）

A) 水溶性濃縮剤 (SL、LS)

10重量部の活性化合物を90重量部の水または水溶性溶媒に溶解する。別法として、湿潤剤または他の助剤を加える。活性化合物を水で希釈すると溶解し、それにより10%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0144】

B) 分散性濃縮剤 (DC)

20重量部の活性化合物を、10重量部の分散剤（例えばポリビニルピロリドン）を加えながら、70重量部のシクロヘキサノンに溶解する。水で希釈すると分散液となり、それにより20%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0145】

C) 乳化性濃縮剤 (EC)

15重量部の活性化合物を、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびエトキシ化ヒマシ油（それぞれ5重量部）を加えながら、7重量部のキシレンに溶解する。水で希釈するとエマルションとなり、それにより15%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0146】

D) 乳剤 (EW、EO、ES)

25重量部の活性化合物を、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびエトキシ化ヒマシ油（それぞれ5重量部）を加えながら、35重量部のキシレンに溶解する。この混合物を、乳化装置（例えば、Ultraturrax）を用いて30重量部の水に加えて、均質なエマルションにする。水で希釈するとエマルションとなり、それにより25%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0147】

E) 懸濁液剤 (SC、OD、FS)

攪拌型ボールミル内で、20重量部の活性化合物を、10重量部の分散剤、湿潤剤および70重量部の水または有機溶媒を加えながら粉碎し、微細な活性化合物の懸濁液を得る。水で希釈すると活性化合物の安定な懸濁液となり、それにより20%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0148】

F) 水分散性粒剤および水溶性粒剤 (WG、SG)

50重量部の活性化合物を、50重量部の分散剤および湿潤剤を加えながら微細に粉碎し、専用の装置（例えば、押出機、噴霧塔、流動床）を用いて水分散性または水溶性の粒剤とする。水で希釈すると活性化合物の安定な分散液または溶液となり、それにより50%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0149】

G) 水分散性粉剤および水溶性粉剤 (WP、SP、SS、WS)

75重量部の活性化合物を、25重量部の分散剤、湿潤剤およびシリカゲルを加えてローターステーターミル内で粉碎する。水で希釈すると活性化合物の安定な分散液または溶液となり、それにより75%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0150】

H)ゲル剤(GF)

攪拌型ボールミル内で、20重量部の活性化合物を、10重量部の分散剤、1重量部のゲル化剤、湿潤剤および70重量部の水または有機溶媒を加えながら粉碎すると、微細な活性化合物の懸濁液が得られる。水で希釈すると活性化合物の安定な懸濁液となり、それにより20%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

【0151】

2.葉に施用するために希釈せずに施用する製品。種子処理を目的とする場合は、その製品を希釈してからまたは希釈せずに種子に施用することができる。

【0152】

I)散粉用粉剤(DP、DS)

5重量部の活性化合物を微粉碎し、95重量部の微粉碎カオリンと十分に混合する。これにより5%(w/w)の活性化合物を含む散粉用製品が得られる。

【0153】

J)粒剤(GR、FG、GG、MG)

0.5重量部の活性化合物を微粉碎し、95.5重量部の担体と結合させ、それにより0.5%(w/w)の活性化合物を含む製剤を得る。現在用いられている方法は押出、噴霧乾燥または流動床である。それにより希釈せずに葉に施用する粒剤が得られる。

【0154】

K)ULV液剤(UL)

10重量部の活性化合物を90重量部の有機溶媒（例えば、キシレン）に溶解する。それにより10%(w/w)の活性化合物を含む製品が得られるが、これは希釈せずに葉に施用する。

【0155】

水性の使用形態は、濃縮乳剤、ペースト剤または湿潤性粉剤（散布可能な粉剤、油分散液剤）に水を加えることにより調製することができる。乳剤、ペースト剤または油分散液剤を調製するためには、活性物質を、そのまま、または油もしくは溶媒に溶解して、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤を用いて水中でホモジナイズすることができる。別法として、活性物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤、適当な場合には溶媒または油を含む濃縮物を調製することができるが、そのような濃縮物は水で希釈するのに適している。

【0156】

即時使用可能な製品中の活性成分の濃度は、比較的広い範囲内で変化し得る。一般的に、上記濃度は0.0001から10%、好ましくは0.01から1%である。

【0157】

活性成分はまた、超微量（ULV: ultra-low volume）法でも首尾よく使用することができ、95重量%を超える活性成分を含む製剤を施用すること、または添加剤を含まない活性成分を施用することが可能である。

【0158】

本発明の方法では、化合物Iを他の活性成分、例えば他の殺有害生物剤（農薬）、殺虫剤、除草剤、肥料（例えば、硝酸アンモニウム、尿素、炭酸カリウム、および過リン酸塩）、植物有害物質および植物成長調節剤、葉害軽減剤ならびに殺線虫剤と一緒に施用することができる。これらの追加成分は、逐次または上記組成物と組み合わせて使用することが可能であり、適当な場合には、使用の直前にのみ加えることもできる（タンクミックス）。例えば、植物に本発明の組成物をスプレーするのは、他の活性成分で植物を処理する前または処理した後のいずれでもよい。

【0159】

本発明の化合物と共に使用可能で、しかも相乗効果をもたらす可能性がある殺有害生物剤の下記のリストMは、可能な組合せを例示するものであって、何らかの限定を課すことを意図したものではない。

【0160】

M.1 アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤であって、以下のクラスから選択されるもの

M.1A カーバメート系、例えばアルジカルブ、アラニカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブおよびトリアザメート；または以下のクラスから選択されるもの

M.1B 有機リン系、例えばアセフェート、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、ジメトンSメチル、ダイアジノン、ジクロロボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファンファー、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル0-(メトキシアミノチオ-ホスホリル)サリチレート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン-メチル、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロベタンホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホンおよびバミドチオン；

【0161】

M.2. GABA作動性クロリドチャネルアンタゴニスト系、例えば以下のもの：

M.2A シクロジエン有機塩素化合物系、例えばエンドスルファンまたはクロルデンなど；または

M.2B フィプロール系(フェニルピラゾール系)、例えばエチプロール、フィプロニル、フルフィプロール、ピラフルプロールおよびピリプロールなど；

【0162】

M.3 ナトリウムチャネル調節因子であって、以下のクラスから選択されるもの

M.3A ピレスロイド系：例えばアクリナトリン、アレトリン、d-シス-トランスアレトリン、d-トランスアレトリン、ビフェントリン、ビオアレトリン、ビオアレトリンS-シルクロペンテニル、ビオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、ガンマ-シハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ベータ-シペルメトリン、シータ-シペルメトリン、ゼータ-シペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エムペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ-フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、メペルフルトリン、メトフルトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン(除虫菊)、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメチルフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリンおよびトランスフルトリン；または

M.3B ナトリウムチャネル調節因子、例えばDDTまたはメトキシクロル；

【0163】

M.4 ニコチンアセチルコリン受容体アゴニスト(nAChR)であって、以下のクラスから選択されるもの

M.4A ネオニコチノイド系、例えばアセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリドおよびチアメトキサム；またはM.4B ニコチン；

【0164】

M.5 ニコチンアセチルコリン受容体アロステリック活性化因子であって、以下のクラスから選択されるもの、

例えばスピノサドまたはスピネトラム；

【0165】

M.6 クロリドチャネル活性化因子であって、アベルメクチンおよびミルベマイシンのクラスから選択されるもの、例えばアバメクチン、エマメクチンベンゾエート、イベルメクチン、レピメクチンまたはミルベメクチン；

【0166】

M.7 幼若ホルモン様物質(mimetic)、例えば

M.7A 幼若ホルモン類似体系、例えばヒドロプレン、キノプレンおよびメトプレンなど；またはその他のM.7B フェノキシカルブもしくはM.7C ピリプロキシフェンなど；

【0167】

M.8 種々の非特異的(多部位)阻害剤、例えば

M.8A アルキルハロゲン化物(臭化メチルなど)および他のアルキルハロゲン化物、またはM.8B クロロピクリン、またはM.8C フッ化スルフルル、またはM.8D ホウ砂、またはM.8E 吐酒石；

【0168】

M.9 選択的同翅類摂食阻害薬、例えば

M.9B ピメトロジン、またはM.9C フロニカミド；

【0169】

M.10 ダニ成長阻害剤、例えば

M.10A クロフェンテジン、ヘキシチアゾックスおよびジフロビダジン、またはM.10B エトキサゾール；

【0170】

M.11 微生物の昆虫中腸膜攪乱物質、例えばバチルス・チューリングエンシス(*bacillus thuringiensis*)またはバチルス・スファエリクス(*bacillus sphaericus*)およびこれらが産生する殺虫タンパク質、例えばバチルス・チューリングエンシス亜種イスラエレンシス(*bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*)、バチルス・スファエリクス(*bacillus sphaericus*)、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*)、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキ(*bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)およびバチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス(*bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*)、またはBt作物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3BbおよびCry34/35Ab1；

【0171】

M.12 ミトコンドリアATPシンターゼ阻害剤、例えば

M.12A ジアフェンチウロン、または

M.12B 有機スズ殺ダニ剤、例えばアゾシクロチン、シヘキサチンまたは酸化フェンブタスズ、またはM.12C プロパルギット、またはM.12D テトラジホン；

【0172】

M.13 プロトン勾配の攪乱を介した酸化的リン酸化の脱共役剤、例えばクロルフェナピル、DNOCまたはスルフルラミド；

M.14 ニコチンアセチルコリン受容体(nAChR)チャネル遮断薬(例えばネレリストキシン類似体系)、例えばベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラムまたはチオスルタップナトリウムなど；

【0173】

M.15 キチン生合成阻害剤0型(ベンゾイル尿素系など)、例えばビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロンまたはトリフルムロンなど；

【0174】

M.16 キチン生合成阻害剤1型、例えばブプロフェジンなど；

M.17 脱皮攪乱物質、双翅類、例えばシロマジンなど；

10

20

30

40

50

M.18 ジアシルヒドラジンなどのエクジソン受容体アゴニスト、例えばメトキシフェノジド、テブフェノジド、ハロフェノジド、フフェノジドまたはクロマフェノジド；

M.19 オクトパミン受容体アゴニスト、例えばアミトラズなど；

M.20 ミトコンドリア複合体III電子伝達系阻害剤、例えば

M.20A ヒドラメチルノン、またはM.20Bアセキノシル、またはM.20C フルアクリピリム；
【0175】

M.21 ミトコンドリア複合体I電子伝達系阻害剤、例えば

M.21A METIダニ駆除剤および殺虫剤、例えばフェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラドまたはトルフェンピラド、またはM.21Bロテノン；

10

M.22 電位依存性ナトリウムチャネル遮断薬、例えば

M.22A インドキサカルブ、またはM.22Bメタフルミゾン；

M.23 アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤(テトロノ酸誘導体系およびテトラミン酸誘導体系など)、例えばスピロジクロフェン、スピロメシフェンまたはスピロテトラマト；

M.24 ミトコンドリア複合体IV電子伝達系阻害剤、例えば

M.24A ホスフィン系、例えばアルミニウムホスフィド、カルシウムホスフィド、ホスフィンまたは
亜鉛ホスフィド、またはM.24B シアン化物；

M.25 ミトコンドリア複合体II電子伝達系阻害剤(ベータ-ケトニトリル誘導体系など)、
例えばシエノピラフェンまたはシフルメトフェン；

20

【0176】

M.28 リアノジン受容体調節因子であって、ジアミド系のクラスから選択されるもの、
例えばフルベンジアミド、クロラントラニリプロール(rynaxypyr(登録商標))、シアント
ラニリプロール(cyazypyr(登録商標))、またはそのフタルアミド化合物など

M.28.1：(R)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミドおよび

M.28.2：(S)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド、またはその化合物

30

M.28.3：3-ブromo-N-{2-ブromo-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、またはその化合物

M.28.4：メチル-2-[3,5-ジブromo-2-({3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル}カルボニル)アミノ]ベンゾイル]-1,2-ジメチルヒドラジンカルボキシレート；

【0177】

M.X 未知のまたは不明確な作用機序の殺虫活性化合物、例えばアザジラクチン、アミドフルメット、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、ブromoプロピレート、キノメチオナート、クリオライト、ジコホル、フルフェネリム、フロメトキン、フルエンスルホン、フル
ピラジフロン、ピペロニルブトキシド、ピリダリル、ピリフルキナゾン、スルホキサフロ
ル、またはその化合物など

40

M.X.1：4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサ
ゾール-3-イル]-2-メチル-N-[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-ベン
ズアミド、またはその化合物

M.X.2：シクロプロパン酢酸、1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[(2-シクロ
プロピルアセチル)オキシ]メチル]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-デカヒドロ-12-ヒドロ
キシ-4,6a,12b-トリメチル-11-オキソ-9-(3-ピリジニル)-2H,11H-ナフト[2,1-b]ピラノ[3
,4-e]ピラン-3,6-ジイル]エステル、またはその化合物

M.X.3：11-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-12-ヒドロキシ-1,4-ジオキサ-9-アザジス

50

ピロ[4.2.4.2]-テトラデカ-11-エン-10-オン、またはその化合物

M.X.4:3-(4'-フルオロ-2,4-ジメチルビフェニル-3-イル)-4-ヒドロキシ-8-オキサ-1-アザスピロ[4.5]デカ-3-エン-2-オン、またはその化合物

M.X.5:1-[2-フルオロ-4-メチル-5-[(2,2,2-トリフルオロエチル)スルフィニル]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-アミン、またはバチルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)に基づく活性剤(Votivo, I-1582)。

【0178】

上記にリストされる市販の化合物群Mは、数ある他の刊行物の中でも特に、The Pesticide Manual, 第15版、C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011)中に見出すことができる。

【0179】

フタルアミド(M.28.1およびM.28.2)は、いずれもWO 2007/101540から公知である。アントラニルアミド(M.28.3)は、WO2005/077943に記載されている。ヒドラジド化合物(M.28.4)は、WO 2007/043677に記載されている。キノリン誘導体であるフロメトキンは、WO2006/013896に示されている。アミノフラノン化合物であるフルピラジフロンは、WO 2007/115644から公知である。スルホキシイミン化合物(スルホキサフロル)は、WO2007/149134から公知である。イソオキサゾリン化合物(M.X.1)は、WO2005/085216に記載されている。ピリピロペン誘導体(M.X.2)は、WO 2006/129714に記載されている。スピロケタール置換環状ケトエノール誘導体(M.X.3)は、WO2006/089633から公知であり、またビフェニル置換スピロ環状ケトエノール誘導体(M.X.4)は、WO2008/067911から公知である。最後に、M.X.5のようなトリアゾイルフェニルスルフィドスルフィドは、WO2006/043635に記載されており、またバチルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)に基づく生物学的防除剤は、WO2009/124707に記載されている。

【0180】

本発明による化合物と併用し得る活性殺真菌剤の下記のリストは、可能な組合せを例示するものであって、何らかの限定を課すことを意図したものではない：

【0181】

F.I) 呼吸阻害剤

F.I-1) 複合体IIIのQo部位阻害剤(例えばストロビルリン系)

ストロビルリン系：アゾキシストロビン(azoxystrobin)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin)、エネストロブリン(enestroburin)、フルオキサストロビン(fluxastrobin)、クレソキシム-メチル(kresoxim-メチル)、メトミノストロビン(metominostrobin)、オリサストロビン(orysastrobin)、ピコキシストロビン(picoxystrobin)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、ピラメトストロビン(pyrametostrobin)、ピラオキシストロビン(pyraoxystrobin)、ピリベンカルブ(pyribencarb)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)、メチル(2-クロロ-5-[1-(3-メチルベンジルオキシイミノ)エチル]ベンジル)カーバメートおよび2-(2-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-アリリデンアミノオキシメチル)-フェニル)-2-メトキシイミノ-Nメチル-アセトアミド；

オキサゾリジンジオン系およびイミダゾリノン系：ファモキサドン(famoxadone)、フェナミドン(fenamidone)；

F.I-2) 複合体II阻害剤(例えばカルボシアミド系)：

カルボキシアニリド系：ベノダニル(benodanil)、ビキサフェン(bixafen)、ボスカリド(boscalid)、カルボキシニン(Carboxin)、フェンフラム(fenfuram)、フェンヘキサミド(fenhexamid)、フルオピラム(fluopyram)、フルトラニル(flutolanil)、フラメトピル(furametpyr)、イソピラザム(isopyrazam)、イソチアニル(isotianil)、メプロニル(mepropril)、オキシカルボキシニン(oxycarboxin)、ペンフルフェン(penflufen)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、セダキサン(sedaxane)、テクロフタラム(tecloftalam)、チフルザミド(thifluzamid)、チアジニル(tiadinil)、2-アミノ-4-メチル-チアゾール-5-カルボキシアニリド、N-(3',4',5'-トリフルオロビフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(4'-トリフルオ

10

20

30

40

50

ロメチルチオビフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドおよびN-(2-(1,3,3-トリメチル-ブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド；

F.I-3) 複合体IIIのQi部位阻害剤：シアゾファミド(cyazofamid)、アミスルブロム(amsulbrom)；

F.I-4) 他の呼吸阻害剤(複合体I、脱共役剤)

ジフルメトリム(diflumentorim)；テクナゼン(tecnazen)；フェリムゾン(ferimzone)；アメトクトラジン(ametoctradin)；シルチオフアム(silthiofam)；

ニトロフェニル誘導体：ピナパクリル(binapacryl)、ジノブトン(dinobuton)、ジノカップ(dinocap)、フルアジナム(fluazinam)、ニトロタールイソプロピル(nitrthal-iso propyl)、

有機金属化合物：フェンチン塩、例えば酢酸フェンチン(fentin-acetate)、塩化フェンチン(fentin chloride)または水酸化フェンチン(fentin hydroxide)；

【0182】

F.II) ステロール生合成阻害剤(SBI殺菌剤)

F.II-1) C14デメチラーゼ阻害剤(DMI殺菌剤、例えばトリアゾール系、イミダゾール系)

トリアゾール系：アザコナゾール(azaconazole)、ビテルタノール(bitertanol)、ブロムコナゾール(bromuconazole)、シプロコナゾール(cyproconazole)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾール-M(diniconazole-M)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、フルトリアホル(flutriafol)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、イミベンコナゾール(imibenconazole)、イプコナゾール(ipconazole)、メトコナゾール(metconazole)、ミクロブタニル(myclobutanil)、パクロブトラゾール(paclobutrazole)、ペンコナゾール(penconazole)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロチオコナゾール(prothioconazole)、シメコナゾール(simeconazole)、テブコナゾール(tebuconazole)、テトラコナゾール(tetraconazole)、トリアジメホン(triadimefon)、トリアジメノール(triadimenol)、トリチコナゾール(triticonazole)、ウニコナゾール(uniconazole)；

イミダゾール系：イマザリル(imazalil)、ペフラゾエート(pefurazoate)、オキシポコナゾール(oxpoconazole)、プロクロラズ(prochloraz)、トリフルミゾール(trifluzazole)；

ピリミジン系、ピリジン系およびピペラジン系：フェナリモル(fenarimol)、ヌアリモル(nuarimol)、ピリフェノックス(pyrifenoxy)、トリホリン(triforine)；

F.II-2) デルタ14-レダクターゼ阻害剤(アミン系、例えばモルホリン系、ピペリジン系)モルホリン系：アルジモルフ(aldimorph)、ドデモルフ(dodemorph)、酢酸ドデモルフ(dodemorph-acetate)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、トリデモルフ(tridemorph)；

ピペリジン系：フェンプロピジン(fenpropidin)、ピペラリン(piperalin)；

スピロケタールアミン系：スピロキシアミン(spiroxamine)；

F.II-3) 3-ケトレダクターゼ阻害剤：ヒドロキシアニリド系：フェンヘキサミド(fenhexamid)；

【0183】

F.III) 核酸合成阻害剤

F.III-1) RNA、DNA合成

フェニルアミド系またはアシルアミノ酸殺真菌剤：ベナラキシル(benalexyl)、ベナラキシル-M(benalexyl-M)、キララキシル(kiralaxyl)、メタラキシル(metalaxyl)、メタラキシル-M(metalaxyl-M)(メフェノキサム(mefenoxam))、オフラス(ofurace)、オキサジキシル(oxadixyl)；

イソオキサゾール系およびイソチアゾロン系：ヒメキサゾール(hymexazole)、オクチリ

10

20

30

40

50

ノン (octhilinone) ;

F.III-2) DNAトポイソメラーゼ阻害剤：オキソリン酸 (oxolinic acid) ;

F.III-3) ヌクレオチド代謝(例えばアデノシンデアミナーゼ)

ヒドロキシ(2-アミノ)-ピリミジン系：ブピリメート (bupirimate) ;

【0184】

F.IV) 細胞分裂および/または細胞骨格阻害剤

F.IV-1) チューブリン阻害剤：ベンズイミダゾール系およびチオファネート系：ベノミル (benomyl)、カルベンダジム (Carbendazim)、フベリダゾール (fuberidazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオファネート-メチル (thiophanate-methyl) ;

トリアゾロピリミジン系：5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン

10

F.IV-2) 他の細胞分裂阻害剤

ベンズアミド系およびフェニルアセトアミド系：ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、エタボキサム (ethaboxam)、ペンシクロン (pencycuron)、フルオピコリド (fluopicolide)、ゾキサミド (zoxamide) ;

F.IV-3) アクチン阻害剤：ベンゾフェノン系：メトラフェノン (metrafenopne) ;

【0185】

F.V) アミノ酸およびタンパク質合成の阻害剤

F.V-1) M(メチオニン)合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン系)

アニリノ-ピリミジン系：シプロジニル (cyprodinil)、メパニピリム (mepanipirim)、ニトラピリン (nitrapyrin)、ピリメタニル (pyrimethanil) ;

20

F.V-2) タンパク質合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン系)

抗生物質：ブラスタシジン-S (blasticidin-S)、カスガマイシン (kasugamycin)、カスガマイシン塩酸塩水和物、ミルジオマイシン (mildiomycin)、ストレプトマイシン (streptomycin)、オキシテトラサイクリン (oxytetracyclin)、ポリオキシシン (polyoxine)、バリダマイシンA (validamycin A) ;

【0186】

F.VI) シグナル伝達阻害剤

F.VI-1) MAP/ヒスチジンキナーゼ阻害剤(例えばアニリノ-ピリミジン系)

ジカルボキサミド系：フルオロイミド (fluoroimid)、イプロジオン (iprodone)、プロシミドン (procymidone)、ビンクロゾリン (vinclozolin) ;

30

フェニルピロール系：フェンピクロニル (fenpiclonil)、フルジオキシニル (fludioxonil) ;

F.VI-2) Gタンパク質阻害剤：キノリン系：キノキシフェン (quinoxifen) ;

【0187】

F.VII) 脂質および膜合成阻害剤

F.VII-1) リン脂質生合成阻害剤

有機リン化合物系：エジフェンホス (edifenphos)、イプロベンホス (iprobefos)、ピラゾホス (pyrazophos) ;

ジチオラン系：イソプロチオラン (isoprothiolane) ;

40

F.VII-2) 脂質過酸化

芳香族炭化水素系：ジクロラン (dicloran)、キントゼン (quintozene)、テクナゼン (tecnazene)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、ビフェニル (biphenyl)、クロロネブ (chloroneb)、エトリジアゾール (etridiazole) ;

F.VII-3) カルボキシル酸アミド系(CAA殺菌剤)

桂皮酸アミド系およびマンデル酸アミド系：ジメトモルフ (dimethomorph)、フルモルフ (flumorph)、マンジプロバミド (mandiproamid)、ピリモルフ (pyrimorph) ;

バリナアミドカーバメート系：ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、バリフェナレート (valifenalate)、およびN-(1-(1-(4-シアノ-フェニル)エタンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン

50

酸-(4-フルオロフェニル)エステル；

F.VII-4) 細胞膜透過性に作用する化合物および脂肪酸

カーバメート系：プロパモカルブ (propamocarb)、プロパモカルブ塩酸塩

【0188】

F.VIII) 多部位に作用し得る阻害剤

F.VIII-1) 無機活性物質：ボルドー (Bordeaux) 混合液、酢酸銅、水酸化銅、オキシ塩化銅、塩基性硫酸銅、硫黄；

F.VIII-2) チオカーバメート系およびジチオカーバメート系：ファーバム (ferbam)、マンゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メタム (metam)、メタスルホカルブ (methasulphocarb)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チラム (thiram)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)；

10

F.VIII-3) 有機塩素化合物(例えばフタルイミド系、スルファミド系、クロロニトリル系)：アニラジン (anilazine)、クロロタロニル (chlorothalonil)、カプタホール (captafol)、カプタン (captan)、フォルペット (folpet)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、ジクロロフェン (dichlorophen)、フルスルファミド (flusulfamid)、ヘキサクロロベンゼン (hexachlorobenzene)、ペンタクロロフェノール (pentachlorophenole) およびその塩、フタリド (phthalide)、トリルフルアニド (tolylfluanid)、N-(4-クロロ-2-ニトロ-フェニル)-N-エチル-4-メチル-ベンゼンスルホンアミド；

F.VIII-4) グアニジン系：グアニジン (guanidine)、ドジン (dodine)、ドジン遊離塩基、グアザチン (guazatine)、グアザチン酢酸塩、イミノクタジン (iminooctadine)、イミノクタジン三酢酸塩 (iminooctadine-triacetate)、イミノクタジン-トリス(アルベシレート) (iminooctadine-tris(albesilate))；

20

F.VIII-5) アントラキノン系：ジチアノン (dithianon)；

【0189】

F.IX) 細胞壁合成阻害剤

F.IX-1) グルカン合成阻害剤：バリダマイシン (validamycin)、ポリオキシンB (polyoxin B)；

F.IX-2) メラニン合成阻害剤：ピロキロン (pyroquilon)、トリシクラゾール (tricyclazole)、カルプロパミド (Carpropamid)、ジシクロメット (dicyclomet)、フェノキサニル (fenoxanil)；

30

【0190】

F.X) 植物防御誘導物質

F.X-1) サリチル酸経路：アシベンゾラル-S-メチル (acibenzolar-S-methyl)；

F.X-2) その他：プロベナゾール (probenazole)、イソチアニル (isotianil)、チアジニル (tiadinil)、プロヘキサジオンカルシウム (prohexadione-calcium)；

ホスホン酸塩系：ホセチル (fosetyl)、ホセチルアルミニウム (fosetyl-aluminum)、亜リン酸およびその塩；

【0191】

F.XI) 未知の作用機序：

ブロンポール (bronopol)、キノメチオナート (chinomethionat)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、シモキサニル (cymoxanil)、ダゾメット (dazomet)、デバカルブ (debacarb)、ジクロメジン (diclomezine)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、ジフェンゾコートメチルサルフェート (difenzoquat-methylsulfate)、ジフェニルアミン (diphenylamin)、フルメトベル (flumetover)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルチアニル (flutianil)、メタルスルホカルブ (methasulfocarb)、オキシシン銅 (oxin-copper)、プロキナジド (proquinazid)、テブフロキン (tebufloquin)、テクロフタラム (tecloftalam)、トリアゾキシド (triazoxide)、2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン、N-(シクロプロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロメトキシ-2,3-ジフルオロ-フェニル)-メチル)-2-フェニルアセトアミド、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミド、N'-(4-(4-フ

40

50

ルオロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミド、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミド、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミド、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル-アミド、メトキシ-酢酸6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチル-キノリン-4-イルエステルおよびN-メチル-2-{1-[(5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]-4-チアゾールカルボキサミド、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(ピリゾキサゾール)、3-[5-(4-メチル-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン、5-アミノ-2-イソプロピル-3-オキソ-4-オルト-トリル-2,3-ジヒドロ-ピラゾール-1-カルボチオ酸S-アリルエステル、N-(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)-シクロプロパンカルボン酸アミド、5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-ピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール、2-(4-クロロ-フェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-イソオキサゾール-5-イル]-2-プロパ-2-イニルオキシ-アセトアミド；

【0192】

F.XI) 成長調節剤：

アブシジン酸、アミドクロル (amidochlor)、アンシミドール (ancymidol)、6-ベンジルアミノプリン (6-benzylaminopurine)、ブラシノリド (brassinolide)、ブトラリン (butralin)、クロルメコート (chlormequat) (塩化クロルメコート (chlormequat chloride))、塩化コリン (choline chloride)、シクラニリド (cyclanilid)、ダミノジド (daminozide)、ジケグラック (dikegulac)、ジメチピン (dimethipin)、2,6-ジメチルプリン (2,6-dimethylpuridine)、エテホン (ethephon)、フルメトラリン (flumetralin)、フルルプリミドール (flurprimidol)、フルチアセト (fluthiacet)、フォルクロルフエヌロン (forchlorfenuron)、ジベレリン酸 (gibberellic acid)、イナベンフィド (inabenfide)、インドール-3-酢酸、マレイン酸ヒドラジド (maleic hydrazide)、メフルイジド (mefluidide)、メピコート (mepiquat) (塩化メピコート (mepiquat chloride))、ナフタレン酢酸 (naphthaleneacetic acid)、N6-ベンジルアデニン (N6-benzyladenine)、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、プロヘキサジオン (prohexadione) (プロヘキサジオンカルシウム (prohexadione-calcium))、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、チジアズロン (thidiazuron)、トリアペンテノール (triapenthenol)、トリブチルホスホトリチオエート (tributyl phosphotriethioate)、2,3,5-トリ-ヨード安息香酸 (2,3,5-tri-iodobenzoic acid)、トリネキサパックエチル (trinexapac-ethyl) およびウニコナゾール (uniconazole)；

【0193】

F.XII) 生物学的防除剤

抗真菌生物防除剤：NRRL番号がB-21661のバチルス・サブスチリス株(例えば、AgraQuest, Inc.(米国)から市販されているRHAPSODY(登録商標)、SERENADE(登録商標)MAXおよびSERENADE(登録商標)ASO)、NRRL番号がB-30087のバチルス・プミルス株(例えば、AgraQuest, Inc.(米国)から市販されているSONATA(登録商標)およびBALLAD(登録商標)Plus)、ウロクラジウム・オウデマンシー (Ulocladium oudemansii) (例えば、BotriZen Ltd.(ニュージーランド)から市販されている製品BOTRY-ZEN)、キトサン(例えば、BotriZen Ltd.(ニュージーランド)から市販されているARMOUR-ZEN)。

【0194】

施用例

動物有害生物(すなわち、昆虫、クモ形類および線虫)、植物、植物が生育している土壌または水は、当技術分野で周知の任意の施用法により、本発明の式Iの化合物またはそ

れを含有する組成物と接触させることができる。そのため、「接触」には、直接接触（本化合物/組成物を動物有害生物または植物、典型的には植物の葉、茎または根に直接施用すること）と間接接触（本化合物/組成物を動物有害生物または植物の所在地に施用すること）の両方が含まれる。

【0195】

式Iの化合物またはそれを含有する殺有害生物組成物（農薬組成物）は、生育中の植物/作物を殺有害生物有効量の式Iの化合物と接触させることにより、その植物および作物を動物有害生物（特に、昆虫、コナダニ類またはクモ形類）による攻撃または侵入から保護するために使用することができる。「作物」とは、生育中と収穫後の両方の作物を指す。

【0196】

本発明の化合物およびそれを含む組成物は、以下のような種々の栽培植物上に存在する多数の昆虫を防除するのに特に重要である：穀物、根菜類、油料作物、野菜、香辛料作物、観賞植物、例えばデュラムと他のコムギ、オオムギ、オートムギ、ライムギ、トウモロコシ（飼料用トウモロコシおよび砂糖用トウモロコシ/スイートおよびフィールドコーン）、ダイズ、アブラナ科植物、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、アブラナ、カブ、テンサイ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、牧草、芝生、芝、飼料用の草、トマト、ニラネギ、カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ属の種、マメ、エンドウマメ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えばジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/テンジクアオイ、パンジーおよびインパチェンス。

【0197】

本発明の化合物は、そのまままたは組成物の形態で、昆虫、または昆虫の攻撃から保護すべき植物、植物の繁殖材料（例えば種子）、土壌、表面、資材もしくは部屋を殺有害生物有効量の本活性化化合物で処理することにより用いられる。施用は、植物、植物の繁殖材料（例えば種子）、土壌、表面、資材または部屋に昆虫が感染する前と後の両方に行うことができる。

【0198】

本発明はまた、動物有害生物、それらの生息地、繁殖地、食糧、動物有害生物が生息しているかまたは生息するかもしれない栽培植物、種子、土壌、区域、資材または環境、あるいは動物有害生物の攻撃または侵入から保護すべき資材、植物、種子、土壌、表面または空間を殺有害生物有効量の少なくとも1種の活性化化合物Iの混合物と接触させることを含んでなる、動物有害生物の駆除方法を包含する。

【0199】

さらに、動物有害生物は、標的有害生物、その食糧、生息地、繁殖地またはその所在地を殺有害生物有効量の式Iの化合物と接触させることにより、防除することができる。そのため、施用は、所在地、生育中の作物、または収穫後の作物が有害生物に感染する前または後に行うことができる。

【0200】

本発明の化合物はまた、有害生物の発生が予想される場所に予防的に施用することも可能である。

【0201】

式Iの化合物はまた、生育中の植物を殺有害生物有効量の式Iの化合物と接触させることにより、該植物を有害生物による攻撃または侵入から保護するために使用することもできる。そのため、「接触」には、直接接触（本化合物/組成物を有害生物および/または植物、典型的には植物の葉、茎または根に直接施用すること）と間接接触（本化合物/組成物を有害生物および/または植物の所在地に施用すること）の両方が含まれる。

【0202】

「所在地」とは、有害生物または寄生動物が生育しているか生育する可能性のある生息地、繁殖地、植物、種子、土壌、区域、資材または環境を意味する。

【0203】

「植物繁殖材料」とは、植物の増殖のために使用できる植物の繁殖力のある部分全て、例えば種子および栄養植物材料（例えば挿し木および塊茎（例えばジャガイモ））を意味すると理解すべきである。これには、種子、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎、シュート、新芽および植物の他の部分が含まれる。発芽後、または土壌から出芽した後に移植される苗木および若い植物も含めることができる。これらの植物繁殖材料は、植え付けまたは移植のとき、あるいはその前に植物保護化合物を用いて予防的に処理することができる。

【0204】

「栽培植物」とは、育種、突然変異誘発または遺伝子操作により改変された植物を含むものと理解すべきである。遺伝子改変植物とは、自然環境のもとでは交雑育種、突然変異または天然の組換えによっては容易に得られないほど、組換えDNA技術の使用により遺伝物質が改変されている植物のことである。典型的には、植物の特定の性質を改善するために、遺伝子改変植物の遺伝物質に1つ以上の遺伝子が組み込まれている。そのような遺伝子改変には、限定するものではないが、タンパク質（オリゴ-またはポリペプチド）の標的化した翻訳後修飾、例えばグリコシル化、あるいはプレニル化、アセチル化もしくはファルネシル化部分またはPEG部分のようなポリマー付加による修飾も含まれる（例えば、Biotechnol Prog. 2001 Jul-Aug, 17(4):720-8; Protein Eng Des Sel. 2004 Jan, 17(1):57-66; Nat Protoc. 2007, 2(5):1225-35.; Curr Opin Chem Biol. 2006 Oct, 10(5):487-91. Epub 2006 Aug 28; Biomaterials. 2001 Mar, 22(5):405-17; Bioconjug Chem. 2005 Jan-Feb, 16(1):113-21に開示される）。

【0205】

「栽培植物」とは、通常の育種法または遺伝子操作法の結果として、以下に挙げる特定のクラスの除草剤の施用に対して耐性にされている植物をも含むものと理解すべきである：ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤;アセト乳酸シンターゼ(ALS)阻害剤、例えばスルホニル尿素系(例えば、US6,222,100、W001/82685、W000/26390、W097/41218、W098/02526、W098/02527、W004/106529、W005/20673、W003/14357、W003/13225、W003/14356、W004/16073参照)またはイミダゾリノン系(例えば、US6,222,100、W001/82685、W000/26390、W097/41218、W098/02526、W098/02527、W004/106529、W005/20673、W003/14357、W003/13225、W003/14356、W004/16073参照);エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ(EPSPS)阻害剤、例えばグリホセート系(例えば、W092/00377参照);グルタミンシンテターゼ(GS)阻害剤、例えばグルホシネート系(例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246参照)またはオキシニル系除草剤(例えば、US5,559,024参照)。数種の栽培植物は通常の育種法（突然変異誘発法）によって除草剤耐性にされており、例えば、Clearfield（登録商標）サマーレイプ（カノーラ）はイミダゾリノン系除草剤、例えばイマザモックスに対して耐性である。遺伝子操作法は、ダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビート、アブラナなどの栽培植物を、グリホセート系やグルホシネート系のような除草剤に対して耐性にするために使用されており、これらの栽培植物のいくつかは、RoundupReady（登録商標）（グリホセート系）およびLibertyLink（登録商標）（グルホシネート系）という商品名で市販されている。

【0206】

「栽培植物」とは、組換えDNA技術の使用によって、以下に挙げる1種以上の殺虫タンパク質を合成することができる植物をも含むものと理解すべきである：特に細菌バチルス属、とりわけバチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)から公知のa-エンドトキシン、例えばCryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)またはCry9c; 栄養成長期殺虫タンパク質(vegetative insecticidal proteins: VIP)、例えばVIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A; 線虫をコロニー化する細菌の殺虫タンパク質、例えばフォトラブダス属菌(*Photorhabdus* spp.)またはゼノラブダス属菌(*Xenorhabdus* spp.); 動物により産生される毒素、例えばサソリ毒素、クモ形類毒素、スズメバチ毒素、または他の昆虫特異的神経毒; 菌類により産生される毒素、例えばストレプトマイセス属菌の毒素、植物レクチン、例えばエンドウマメまたはオオムギのレクチン; アグルチニン; プロテイナーゼ阻害剤、例えばトリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチ

ン(patatin)、シスタチンまたはパパイン阻害剤；リボソーム不活性化タンパク質(RIP)、例えばリシン、メイズ-RIP(maize-RIP)、アブリン、ルフィン(luffin)、サポリンまたはブリオジン(bryodin)；ステロイド代謝酵素、例えば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-IDP-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、エクジソン阻害剤またはHMG-CoA-レダクターゼ；イオンチャネル遮断剤、例えばナトリウムまたはカリウムチャネルの遮断剤；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体（ヘリコキニン(helicokinin)受容体）；スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼまたはグルカナナーゼ。本発明との関連において、これらの殺虫タンパク質または毒素はプレトキシシン、ハイブリッドタンパク質、トランケート型または他の修飾型タンパク質としても存在しうることを理解すべきである。ハイブリッドタンパク質はタンパク質ドメインの新しい組合せにより特徴づけられる（例えば、W002/015701を参照のこと）。こうした毒素の更なる例またはこうした毒素を合成する能力がある遺伝子改変植物は、例えば、EP-A374753、W093/007278、W095/34656、EP-A427529、EP-A451878、W003/018810およびW003/052073に開示される。かかる遺伝子改変植物を作製する方法は一般的に当業者に知られており、例えば、先に挙げた刊行物に記載される。遺伝子改変植物に含まれるこれらの殺虫タンパク質は、これらのタンパク質を産生する植物に、節足動物のある種の分類グループに属する有害生物、特にカブトムシ(甲虫目)、ハエ(双翅目)、チョウおよびガ(鱗翅目)、ならびに植物寄生性線虫(線形動物)からの保護を付与する。

10

【0207】

さらに「栽培植物」とは、組換えDNA技術の使用によって、細菌、ウイルスまたは真菌病原体に対する植物の抵抗性または耐性を高める1種以上のタンパク質を合成する能力がある植物をも含むものと理解すべきである。そうしたタンパク質の例は、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRタンパク質、例えばEP-A 0 392 225参照)、植物疾患耐性遺伝子（例えば、メキシコの野生ジャガイモ *Solanum bulbocastanum* に由来する、ジャガイモ疫病菌 *Phytophthora infestans* に対して作用する耐性遺伝子を発現するジャガイモ栽培品種）、またはT4-リゾチーム（例えば、火傷病菌 *Erwinia amylovora* のような細菌に対して増強された耐性を示す、こうしたタンパク質を合成する能力があるジャガイモ栽培品種）である。かかる遺伝子改変植物を作製する方法は一般的に当業者に知られており、例えば、先に挙げた刊行物に記載される。

20

【0208】

さらに「栽培植物」とは、組換えDNA技術の使用によって、生産性（例えば、バイオマス生産、穀物の収穫量、デンプンの含有量、油の含有量またはタンパク質の含有量）、乾燥、塩分もしくは他の成長制限環境因子に対する耐性、または有害生物および植物の真菌、細菌もしくはウイルス病原体に対する耐性を高める、1種以上のタンパク質を合成する能力がある植物をも含むものと理解すべきである。

30

【0209】

さらに「栽培植物」とは、組換えDNA技術の使用によって、特にヒトまたは動物の栄養を改善するために、改変された量の含有物質または新たな含有物質を含む植物、例えば、健康を増進する長鎖 ω -3脂肪酸または不飽和 ω -9脂肪酸を産生する油料植物（例えば、Nexera(登録商標)ナタネ）をも含むものと理解すべきである。

40

【0210】

さらに「栽培植物」とは、組換えDNA技術の使用によって、特に原料生産を高めるために、改変された量の含有物質または新たな含有物質を含む植物、例えば、増加した量のアミロペクチンを産生するジャガイモ（例えば、Amflora(登録商標)ジャガイモ）をも含むものと理解すべきである。

【0211】

一般に、「殺有害生物有効量」とは、標的生物の成長に対する目に見える効果（例えば、標的生物の壊死、死滅、成長の遅延、阻止、除去、破壊、あるいは標的生物の発生および活動の低減といった効果）を達成するために必要とされる活性成分の量を意味する。殺有害生物有効量は、本発明において用いる各種の化合物/組成物ごとに変化しうる。組成

50

物の殺有害生物有効量は、一般的な条件、例えば所望の殺有害生物効果および持続時間、天候、標的生物種、所在地、施用方式などによっても変化するだろう。

【0212】

土壌処理の場合、または有害生物が住んでいる場所すなわち巣への施用の場合、本活性成分の量は、100m²あたり0.0001から500g、好ましくは100m²あたり0.001から20gの範囲である。

【0213】

資材を保護する際の通常の施用率は、例えば、処理される資材1m²あたり本活性化合物0.01gから1000g、望ましくは1m²あたり0.1gから50gである。

【0214】

資材への含浸に用いるための殺虫組成物は、典型的には、0.001から95重量%、好ましくは0.1から45重量%、さらに好ましくは1から25重量%の少なくとも1種の忌避剤および/または殺虫剤を含有する。

【0215】

作物植物の処理に用いる場合、本発明の活性成分の施用量は、1ヘクタールあたり0.1gから4000g、望ましくは1ヘクタールあたり25gから600g、さらに望ましくは1ヘクタールあたり50gから500gの範囲内である。

【0216】

式Iの化合物は接触（土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物の各種部分または動物の各種部分での接触）と摂取（餌または植物部分）の両方によって有効である。

【0217】

本発明の化合物はまた、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギまたはゴキブリのような非作物有害昆虫にも施用することができる。非作物有害生物に対して使用する場合は、式Iの化合物を餌組成物として用いることが好ましい。

【0218】

こうした餌は液状、固形または半固形の製剤（例えば、ゲル剤）とすることができる。固形の餌は、個別の使用に好適な、様々な形状および形態、例えば粒状、塊状、棒状、円板状に成形することができる。液状の餌は、適切な施用を確実にするため、様々なデバイス（例えば、開放容器、スプレー器具、液滴供給源、または蒸気供給源）に充填することができる。ゲル剤は、水性または油性のマトリクスをベースとして、粘性、水分保持またはエージング特性に関して特定の必要品へと製剤化することができる。

【0219】

組成物として用いる餌は、昆虫（例えば、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギなど、またはゴキブリ）がそれを食べるよう刺激するために十分に誘引性のある製品である。この誘引性は、食餌促進剤または性フェロモンを用いることにより操作することができる。食餌促進剤は、例えば、限定するものではないが、動物および/または植物タンパク質（肉粉、魚粉または血粉、昆虫の各種部分、卵黄）、動物および/または植物由来の油脂、あるいはモノ-、オリゴ-もしくはポリオルガノサッカライドから、特にスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、デンプン、ペクチン、または糖蜜もしくは蜂蜜からさえも、選択される。さらに、果物、作物、植物、動物、昆虫またはその特定部分の新鮮なもしくは腐りかけの部分も、食餌促進剤としての役割を果たすことができる。性フェロモンは、より昆虫特異的であることが知られている。特異的フェロモンは文献に記載されており、当業者に公知である。

【0220】

餌組成物中で使用する場合、本活性成分の典型的な含有量は0.001から15重量%、望ましくは0.001から5重量%である。

【0221】

エアロゾル（例えばスプレー缶中の）、油性スプレーまたはポンプ式スプレーとしての式Iの化合物の製剤は、専門家以外のユーザーがハエ、ノミ、ダニ、蚊またはゴキブリなどの有害生物を防除するのに非常に適している。エアロゾルの処方物は以下の成分を含む

10

20

30

40

50

ことが好ましい：活性成分、溶媒、例えば低級アルコール（例：メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール）、ケトン（例：アセトン、メチルエチルケトン）、沸騰範囲が約50から250℃のパラフィン系炭化水素（例：灯油）、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素（例：トルエン、キシレン）、水、さらに助剤、例えば乳化剤（例：ソルビトールモノオレエート、3から7モルのエチレンオキシドを含むオレイルエトキシレート、脂肪アルコールエトキシレート）、香油（例：エーテル油、中鎖脂肪酸と低級アルコールとのエステル、芳香族カルボニル化合物）、適切な場合には、安定剤（例：安息香酸ナトリウム、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチル）および、必要に応じて、噴射剤（例：プロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素、またはこれらの混合気体）。 10

【0222】

上記の油性スプレー製剤は、噴射剤をまったく使用しない点で、エアロゾル処方物とは異なる。

【0223】

スプレー組成物中で用いる場合、本活性成分の含有量は0.001から80重量%、好ましくは0.01から50重量%、最も好ましくは0.01から15重量%である。

【0224】

式Iの化合物およびその各組成物は、蚊取線香および燻蒸剤、発煙カートリッジ、気化器プレートまたは長時間気化器、さらにモスペーパー、モスパッドまたは他の熱非依存性気化器システムにおいても使用可能である。 20

【0225】

また、式Iの化合物およびその各組成物を用いて、昆虫が媒介する感染症（例えば、マラリア、デング熱および黄熱病、リンパ性糸状虫症、および皮膚リーシュマニア症）を防除する方法は、家屋の表面処理、カーテン、テント、衣料品、蚊帳、ツェツェバエ用捕獲具などへのエアスプレーおよび含浸も含む。繊維、織物、ニット製品、不織布、ネット状材料、ホイルまたは防水布に施用するための殺虫組成物は、本殺虫剤と、場合により忌避剤および少なくとも1種の結合剤を含有する混合物を含むことが好ましい。好適な忌避剤は、例えば、N,N-ジエチル-m-トルアミド(DEET)、N,N-ジエチルフェニルアセトアミド(DEPA)、1-(3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル)-2-メチルピペリン、(2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)酢酸ラクトン、2-エチル-1,3-ヘキサジオール、インダロン、メチルネオデカンアミド(MNDA)、昆虫防除用ではないピレスロイド、例えば{(+/-)-3-アリル-2-メチル-4-オキシシクロペンタ-2-(+)-エンイル-(+)-トランス-クリサンテメート(エスビオトリン：Esbiothrin)、植物抽出物から誘導されるかまたは植物抽出物と同じものである忌避剤、例えばリモネン、オイゲノール、(+)-ユーカマロール(1)、(-)-1-エピ-ユーカマロール、またはスポッテッドガム(*Eucalyptus maculata*)、ハマゴウ(*Vitex rotundifolia*)、パルマローザ(*Cymbopogon martinii*)、レモングラス(*Cymbopogon citratus*)、シトロネラ(*Cymbopogon nardus*)のような植物からの粗製植物抽出物である。好適な結合剤は、例えば、脂肪酸のビニルエステル（例：酢酸ビニルおよびビニルベルサテート）、アルコールのアクリル酸エステルおよびメタクリル酸エステル（例：アクリル酸ブチル、アクリル酸2-エチルヘキシル、およびアクリル酸メチル）、モノエチレン性およびジエチレン性不飽和炭化水素（例：スチレン）、ならびに脂肪族ジエン（例：ブタジエン）のポリマーおよびコポリマーから選択される。 30 40

【0226】

カーテンおよび蚊帳への含浸は、一般に、その繊維材料を殺虫剤のエマルジョンまたは分散液に浸漬することによるか、または蚊帳上にそれらを噴霧することにより行う。

【0227】

式Iの化合物およびその組成物は、木材（例えば木、板塀、枕木など）、および建物（例えば家屋、付属建物、工場など）、さらに建設材料、家具、皮革、繊維、ビニル製品、電線、およびケーブルなどをアリおよび/またはシロアリから保護するため、そしてまた作物またはヒトに害を加えること（例えば、有害生物が家屋や公共施設へ侵入する場合など 50

）からアリおよびシロアリを防除するために用いることができる。式Iの化合物は、木材を保護するために周囲の土壌表面または床下の土壌に施用されるだけでなく、床下コンクリート、床柱、梁、合板、家具などの表面のような材木製品、パーティクルボード、ハーフボードなどの木製品、および被覆電線、ビニルシートなどのビニル製品、発泡スチロールなどの断熱材などにも施用することができる。作物またはヒトに害を加えるアリに対して施用する場合には、本発明のアリ防除剤を作物または周囲の土壌に施用するか、直接アリの巣などに施用する。

【0228】

種子処理

式Iの化合物はまた、有害昆虫から（特に土壌中に生息している有害昆虫から）種子を保護し、生じる植物の根および芽を土壌有害生物および食葉性昆虫から保護するために種子を処理するのに適している。

10

【0229】

式Iの化合物は、種子を土壌有害生物から保護し、かつ生じる植物の根および芽を土壌有害生物および食葉性昆虫から保護するのに特に有用である。好ましいのは、生じる植物の根および芽の保護である。より好ましいのは、生じる植物の芽の刺吸型昆虫からの保護であり、最も好ましいのはアブラムシからの保護である。

【0230】

したがって、本発明は、昆虫から（特に土壌昆虫から）種子を保護し、かつ昆虫から（特に土壌昆虫および食葉性昆虫から）苗の根および芽を保護する方法を含み、この方法は、播種前および/または発芽処理後の種子を一般式Iの化合物またはその塩と接触させることを含んでなる。特に好ましいのは、植物の根および芽を保護する方法、さらに好ましいのは、植物の芽を刺吸型昆虫から保護する方法、最も好ましいのは、植物の芽をアブラムシから保護する方法である。

20

【0231】

「種子」という用語は、真正種子、種子片、球根、球茎、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、挿し木、切断した芽などを含むがこれらに限らない、あらゆる種類の種子および植物繁殖器を包含し、好適な実施形態では、真正種子を意味する。

【0232】

種子処理という用語は、種子粉衣、種子コーティング、種子散粉、種子浸漬、および種子ペレット化のような、当技術分野で公知のあらゆる好適な種子処理技術が含まれる。本発明はまた、本活性化化合物でコーティングされた、または本活性化化合物を含む種子を包含する。

30

【0233】

「コーティングされたおよび/または含む」とは、一般的に、活性成分の一部が多かれ少なかれ施用方法に応じて繁殖材料に浸透しうるが、活性成分は大部分が施用時に繁殖材料の表面にあることを意味する。当該繁殖製品を（再度）植え付ける場合、それは活性成分を吸収する可能性がある。

【0234】

適当な種子は、以下の植物の種子である：穀物、根菜類、油料作物、野菜、香辛料作物、観賞植物、例えばデュラムおよび他のコムギ、オオムギ、オートムギ、ライムギ、トウモロコシ（飼料用トウモロコシおよび砂糖用トウモロコシ/スイートおよびフィールドコーン）、ダイズ、アブラナ科植物、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、アブラナ、カブ、テンサイ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、牧草、芝生、芝、飼料用の草、トマト、ニラネギ、カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ属の種、メロン、マメ、エンドウマメ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えばジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/テンジクアオイ、パンジーおよびインパチェンス。

40

【0235】

さらに、本活性化化合物はまた、育種（遺伝子工学的手法を含む）の結果として除草剤、

50

殺菌剤または殺虫剤の作用に耐性を示す植物から得られる種子の処理にも使用することができる。

【0236】

例えば、本活性化合物は、スルホニル尿素、イミダゾリノン、グルホシネート-アンモニウムまたはグリホセート-イソプロピルアンモニウムおよび同様の活性物質からなるグループからの除草剤に耐性である植物(例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246参照)(W092/0377)(EP-A-0257993、米国特許第5,013,659号)からの種子、または植物をある種の有害生物に対して耐性にするパチルス・チューリングエンシス毒素(Bt毒素)を産生する能力があるトランスジェニック作物(例えば、ワタ)(EP-A-0142924、EP-A-0193259)からの種子の処理に用いることができる。

10

【0237】

さらに、本活性化合物はまた、例えば伝統的な育種法および/または突然変異体の作製により、あるいは組換え法により作製することができる、既存の植物と比較して改変された特徴を有する植物から得られる種子の処理にも使用することができる。例えば、いくつかのケースは、植物において合成されるデンプンを改変する目的で、作物の組換え改変について記載しており(例えば、W092/11376、W092/14827、W091/19806)、また、改変された脂肪酸組成を有するトランスジェニック作物についても記載している(W091/13972)。

【0238】

本活性化合物の種子処理施用は、播種前および植物の出芽前に種子に噴霧または散布することにより実施する。

20

【0239】

種子処理に特に有用な組成物は、例えば以下のものである。

【0240】

- A 液剤(SL、LS)
- D 乳剤(EW、EO、ES)
- E 懸濁液剤(SC、OD、FS)
- F 顆粒水和剤および顆粒水溶剤(WG、SG)
- G 粉末水和剤および粉末水溶剤(WP、SP、WS)
- H ゲル剤(GF)
- I 粉剤(DP、DS)。

30

【0241】

通常の種子処理用の製剤には、例えば、フロアブル剤FS、液剤LS、乾式処理用粉剤DS、スラリー処理用粉末水和剤WS、粉末水溶剤SS、乳剤ESおよびEC、ゲル剤GFが挙げられる。これらの製剤は希釈してまたは希釈しないで種子に施用することができる。種子への施用は、播種前に、種子に直接行うか、または発芽処理の後に行う。

【0242】

好ましい実施形態では、FS剤が種子処理に用いられる。典型的には、FS剤は1から800g/Lの活性成分、1から200g/Lの界面活性剤、0から200g/Lの凍結防止剤、0から400g/Lの結合剤、0から200g/Lの顔料、および1リットルまでの溶媒(好ましくは水)を含み得る。

【0243】

40

種子処理用の特に好ましい式Iの化合物のFS剤は、通常、0.1から80重量%(1から800g/L)の活性成分、0.1から20重量%(1から200g/L)の少なくとも1種の界面活性剤、例えば0.05から5重量%の湿潤剤および0.5から15重量%の分散剤、20重量%まで(例えば5から20重量%)の凍結防止剤、0から15重量%(例えば1から15重量%)の顔料および/または染料、0から40重量%(例えば1から40重量%)の結合剤(展着剤/粘着剤)、任意で5重量%まで(例えば0.1から5重量%)の増粘剤、任意で0.1から2重量%の消泡剤、および任意で殺生物剤のような防腐剤、酸化防止剤など(例えば、0.01から1重量%の量)、ならびに全量100重量%までの充填剤/賦形剤を含有する。

【0244】

種子処理用の製剤はさらに結合剤を含み、場合により着色剤を含んでもよい。

50

【0245】

結合剤は、処理後の種子への活性物質の付着を高めるために添加される。好適な結合剤は以下のものである：エチレンオキシド、プロピレンオキシドなどのアルキレンオキシドのホモ-およびコポリマー、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ならびにそれらのコポリマー、エチレン-酢酸ビニルコポリマー、アクリル酸ホモ-およびコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミドおよびポリエチレンイミン、セルロース、チロースおよびデンプンなどの多糖類、オレフィン/無水マレイン酸コポリマーのようなポリオレフィンホモ-およびコポリマー、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンホモ-およびコポリマー。

【0246】

場合により、前記製剤には着色剤をも含めることができる。種子処理製剤に好適な着色剤または染料は、以下のものである：ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112、C.I.ソルベントレッド1、ピグメントブルー15：4、ピグメントブルー15：3、ピグメントブルー15：2、ピグメントブルー15：1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48：2、ピグメントレッド48：1、ピグメントレッド57：1、ピグメントレッド53：1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108。

【0247】

ゲル化剤の例はカラギーナン（Satiagel(登録商標)）である。

【0248】

種子の処理において、本化合物Iの施用量は、通常、種子100kgあたり0.1gから10kg、好ましくは種子100kgあたり1gから5kg、より好ましくは種子100kgあたり1gから1000g、特に種子100kgあたり1gから200gである。

【0249】

したがって、本発明はさらに、本明細書中で定義した式Iの化合物またはその農業上有用な塩を含む種子に関する。化合物Iまたはその農業上有用な塩の量は、一般に、種子100kgあたり0.1gから10kg、好ましくは種子100kgあたり1gから5kg、特に種子100kgあたり1gから1000gの範囲で変化しうる。レタスのような特定の作物によっては、施用量がさらに多くなり得る。

【0250】

動物の健康

式Iの化合物またはそのエナンチオマーもしくは獣医学上許容される塩は、特に、動物の体内および表面上の寄生生物を駆除するための使用にも適している。

【0251】

したがって、本発明の目的は、動物の体内および表面上の寄生生物を防除するための新規な方法を提供することでもある。本発明の別の目的は、動物用の比較的安全な殺有害生物剤を提供することである。本発明の別の目的はさらに、既存の殺有害生物剤より低い用量で使用する事ができる動物用の殺有害生物剤を提供することである。本発明の更なる目的は、寄生生物の長期持続防除をもたらす動物用の殺有害生物剤を提供することである。

【0252】

本発明はまた、動物の体内および表面上の寄生生物を駆除するための、殺寄生生物有効量の式Iの化合物またはそのエナンチオマーもしくは獣医学上許容される塩および許容される担体を含む組成物にも関する。

【0253】

さらに、本発明は、寄生生物による侵入および感染に対して動物を処置し、管理し、予防し、また保護するための方法も提供し、この方法は、殺寄生生物有効量の式Iの化合物

またはそのエナンチオマーもしくは獣医学上許容される塩あるいはそれを含む組成物を動物に経口的、局所的、または非経口的に投与または適用することを含んでなる。

【0254】

本発明はさらに、殺寄生生物有効量の式Iの化合物またはそのエナンチオマーもしくは獣医学上許容される塩、あるいはそれを含有する組成物を含有する、寄生生物による侵入および感染に対して動物を処置し、管理し、予防し、または保護するための組成物の調製方法を提供する。

【0255】

農業有害生物に対する化合物の活性は、動物の体内および表面の、内部および外部寄生生物を防除するためのその適合性（これは、例えば、経口適用の場合には非嘔吐の低用量、動物との代謝適合性、低毒性、および安全な取扱いを必要とする）を示唆するものではない。

【0256】

驚いたことに、このたび、式Iの化合物は動物の体内および表面の、内部および外部寄生生物を駆除するのに適していることが見い出された。

【0257】

式Iの化合物またはそのエナンチオマーもしくは獣医学上許容される塩、およびそれを含む組成物は、好ましくは、温血動物（ヒトを含む）および魚類を含む動物への寄生生物の侵入および感染を防除しかつ予防するために用いられる。それらは例えば、ウシ、ヒツジ、イノシシ、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ、トリ、ウサギ、ヤギ、イヌ、ネコ、水牛、ロバ、ダマジカ、トナカイなどの哺乳類への、さらにまた、ミンク、チンチラ、アライグマなどの毛皮用の動物、メンドリ、ガチョウ、シチメンチョウ、アヒルなどの鳥類、ならびにマス、コイ、ウナギなどの淡水魚および海水魚のような魚類への、寄生生物の侵入および感染を防除しかつ予防するのに適している。

【0258】

式Iの化合物またはそのエナンチオマーもしくは獣医学上許容される塩、およびそれを含む組成物は、好ましくは、イヌやネコといった家庭用動物への寄生生物の侵入および感染を防除しかつ予防するために用いられる。

【0259】

温血動物および魚類への侵入としては、限定するものではないが、シラミ、ハジラミ、マダニ、鼻ウマバエの幼虫、ヒツジシラミバエ、刺咬性ハエ、キンバエ、ハエ、ハエウジ、ツツガムシ、ブヨ、カおよびノミが挙げられる。

【0260】

式Iの化合物またはそのエナンチオマーもしくは獣医学上許容される塩、およびそれを含む組成物は、内部および/または外部寄生生物の全身のおよび/または非全身の防除に適している。それらは発育段階の全てまたは一部に対して活性である。

【0261】

式Iの化合物は外部寄生生物を駆除するのに特に有用である。

【0262】

式Iの化合物は、それぞれ以下の目および種の寄生生物を駆除するのに特に有用である。

【0263】

ノミ（隠翅目：Siphonaptera）、例えば、ネコノミ（*Ctenocephalides felis*）、イヌノミ（*Ctenocephalides canis*）、ケオプスネズミノミ（*Xenopsylla cheopis*）、ヒトノミ（*Pulex irritans*）、スナノミ（*Tunga penetrans*）、およびヨーロッパネズミノミ（*Nosopsyllus fasciatus*）；

【0264】

ゴキブリ（網翅目：Blattaria - Blattodea）、例えば、チャバネゴキブリ（*Blattella germanica*）、モリチャバネゴキブリ（*Blattella asahinae*）、ワモンゴキブリ（*Periplaneta americana*）、ヤマトゴキブリ（*Periplaneta japonica*）、トビイロゴキブリ（*Periplaneta*

10

20

30

40

50

brunnea)、クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、コワモンゴキブリ(*Periplaneta australasiae*)、およびトウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*) ;

【0265】

ハエ、カ(双翅目:Diptera)、例えば、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、キンイロヤブカ(*Aedes vexans*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、ハマダラカ(*Anopheles maculipennis*、*Anopheles crucians*、*Anopheles albimanus*)、ガンビアハマダラカ(*Anopheles gambiae*)、ハマダラカ(*Anopheles freeborni*、*Anopheles leucosphyrus*)、コガタハマダラカ(*Anopheles minimus*)、ハマダラカ(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(*Calliphora vicina*)、旧世界ラセンウジバエ(*Chrysomya bezziana*)、新世界ラセンウジバエ(*Chrysomya hominivorax*)、ハエ(*Chrysomya macellaria*)、サシバエ(*Chrysops discalis*)、アブ(*Chrysops silacea*、*Chrysops atlanticus*)、ラセンウジバエ(*Cochliomyia hominivorax*)、ヒトクイバエ(*Cordylobia anthropophaga*)、ヌカカ(*Culicoides furens*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、イエカ(*Culex nigripalpus*)、ネッタイイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、イエカ(*Culex tarsalis*)、ハボシカ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ヒフバエ(*Dermatobia hominis*)、ヒメイエバエ(*Fannia canicularis*)、ウマバエ(*Gasterophilus intestinalis*)、ツェツェバエ(*Glossina morsitans*)、ツェツェバエ(*Glossina palpalis*)、ツェツェバエ(*Glossina fuscipes*)、ツェツェバエ(*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒツペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、ウシバエ(*Hypoderma lineata*)、ヌカカ(*Leptoconops torrens*)、キンバエ(*Lucilia caprina*)、ヒツジキンバエ(*Lucilia cuprina*)、ヒロズキンバエ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア属の種(*Mansonia* spp.)、イエバエ(*Musca domestica*)、オオイバエ(*Muscina stabulans*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、サシチョウバエ(*Phlebotomus argentipes*)、ヤブカ(*Psorophora columbiae*)、プソロフォラ・ディスカラ(*Psorophora discolor*)、ブユ(*Prosimulium mixtum*)、ニクバエ(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* sp.)、ブユ(*Simulium vittatum*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、ウシアブ(*Tabanus bovinus*)、アブ(*Tabanus atratus*、*Tabanus lineola*、および*Tabanus similis*) ;

【0266】

シラミ(シラミ目:Phthiraptera)、例えば、アタマジラミ(*Pediculus humanus capitis*)、コロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ(*Phthirus pubis*)、ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ(*Linognathus vituli*)、ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)、ニワトリハジラミ(*Menopon gallinae*)、ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)、およびケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*) ;

ダニおよび寄生性ダニ(ダニ目:Parasitiformes):ダニ(マダニ科:Ixodida)、例えば、クロアシマダニ(*Ixodes scapularis*)、オーストラリア産マダニ(*Ixodes holocyclus*)、西部クロアシマダニ(*Ixodes pacificus*)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)、マダニ(*Dermacentor andersoni*)、アメリカイヌカクマダニ(*Dermacentor variabilis*)、アメリカキララマダニ(*Amblyomma americanum*)、メキシコ湾岸マダニ(*Amblyomma maculatum*)、ヒメダニ(*Ornithodoros hermsi*、*Ornithodoros turicata*)、ならびに寄生性ダニ(トゲダニ亜目:Mesostigmata)、例えば、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)およびワクモ(*Dermanyssus gallinae*) ;

【0267】

ケダニ亜目(Actiniedida)(Prostigmata)およびコナダニ亜目(Acaridida)(Astigmata)、例えば、ホコリダニ類(*Acarapis* spp.)、ツメダニ類(*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア属の種(*Ornithocheyletia* spp.)、ケモチダニ類(*Myobia* spp.)、プソレルガテス属の種(*Psorergates* spp.)、ニキビダニ類(*Demodex* spp.)、ツツガムシ類(*Trombicula* spp.)、ズツキダニ類(*Listrophorus* spp.)、コナダニ類(*Acarus* spp.)、ケナガコナダニ類(*Tyrophagus* spp.)、ゴミコナダニ類(*Caloglyphus* spp.)、ヒカダニ類(*Hypodectes* spp.)

、ウモウダニ類(*Pterolichus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ類(*Psoroptes* spp.)、ショクヒゼンダニ類(*Chorioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ類(*Otodectes* spp.)、ヒゼンダニ類(*Sarcoptes* spp.)、ショウセンコウヒゼンダニ類(*Notoedres* spp.)、カイセンダニ類(*Knemidocoptes* spp.)、フエダニ類(*Cytodites* spp.)、およびラミノシオプテス属の種(*Lamino sioptes* spp.)；

【0268】

バグ（異翅目：*Heteropterida*）：トコジラミ(*Cimex lectularius*)、ネッタイトコジラミ(*Cimex hemipterus*)、サシガメ(*Reduvius senilis*)、サシガメ類(*Triatoma* spp.)、ロードニウス属の種(*Rhodnius* spp.)、パンストロギルス属の種(*Panstrongylus* spp.)、およびサシガメ(*Arilus critatus*)；

10

【0269】

シラミ目 (*Anoplurida*)、例えば、ケモノジラミ類(*Haematopinus* spp.)、ケモノホソジラミ類(*Linognathus* spp.)、ペディクルス属の種(*Pediculus* spp.)、ケジラミ類(*Phthirus* spp.)、およびソレノポテス属の種(*Solenopotes* spp.)；

【0270】

ハジラミ目 (*Mallophagida*) (マルツノハジラミ(*Arnblycerina*)亜目およびホソツノハジラミ(*Ischnocerina*)亜目)、例えば、トリメノボン属の種(*Trimenopon* spp.)、メノボン属の種(*Menopon* spp.)、トリノトン属の種(*Trinoton* spp.)、ボビコラ属の種(*Bovicola* spp.)、ウェルネキエラ属の種(*Werneckiella* spp.)、レピケントロン属の種(*Lepikentron* spp.)、トリコデクテス属の種(*Trichodectes* spp.)、およびフェリコラ属の種(*Felicola* spp.)；

20

【0271】

回虫線形動物：

回虫および旋毛虫、例えば、旋毛虫科（トリキネラ属の種(*Trichinella* spp.)）、鞭虫科（トリクリス属の種(*Trichuris* spp.)、カピラリア属の種(*Capillaria* spp.)）；

桿線虫目 (*Rhabditida*)、例えば、ラブディチス属の種(*Rhabditis* spp.)、糞線虫属の種(*Strongyloides* spp.)、ヘリセファロブス属の種(*Helicephalobus* spp.)；

【0272】

円虫目 (*Strongylida*)、例えば、ストロンジルス属の種(*Strongylus* spp.)、鉤虫類(*Ancylostoma* spp.)、アメリカ鉤虫(*Necator americanus*)、ブノストマム属の種(*Bunostomum* spp.) (十二指腸虫)、毛様線虫類(*Trichostrongylus* spp.)、捻転胃虫(*Haemonchus contortus*)、オステルターグ胃虫類(*Ostertagia* spp.)、クーペリア属の種(*Cooperia* spp.)、ネマトディルス属の種(*Nematodirus* spp.)、ジクチオカウルス属の種(*Dictyocaulus* spp.)、シアトストーマ属の種(*Cyathostoma* spp.)、エソファゴストーマム属の種(*Oesophagostomum* spp.)、ブタ腎虫(*Stephanurus dentatus*)、オルラヌス属の種(*Ollulanus* spp.)、チャベルチア属の種(*Chabertia* spp.)、ブタ腎虫(*Stephanurus dentatus*)、開嘴虫(*Syn gamus trachea*)、アンシロストマ属の種(*Ancylostoma* spp.)、狭頭鉤虫類(*Uncinaria* spp.)、グロボセファルス属の種(*Globocephalus* spp.)、ネカトル属の種(*Necator* spp.)、ブタ肺虫類(*Metastrongylus* spp.)、毛細肺虫(*Muellerius capillaris*)、プロトストロンギルス属の種(*Protostrongylus* spp.)、住血線虫類(*Angiostrongylus* spp.)、パレラフォストロンギルス属の種(*Parelaphostrongylus* spp.)、ネコ肺虫(*Aleurostrongylus abstrusus*)、および腎虫(*Dioctophyma renale*)；

30

40

【0273】

腸管寄生回虫（回虫目：*Ascaridida*）、例えば、ヒト回虫(*Ascaris lumbricoides*)、ブタ回虫(*Ascaris suum*)、ニワトリ回虫(*Ascaridia galli*)、ウマ回虫(*Parascaris equorum*)、蟯虫(*Enterobius vermicularis*) (線虫)、イヌ回虫(*Toxocara canis*)、回虫(*Toxascaris leonine*)、蟯虫類(*Skrjabinema* spp.)、およびウマ蟯虫(*Oxyuris equi*)；

カマラヌス目 (*Camallanida*)、例えば、メジナ虫(*Dracunculus medinensis*) (メジナチュウ)；

【0274】

50

旋尾線虫目(Spirurida)、例えば、眼虫類(Thelazia spp.)、ウケレリア属の種(Wucheria spp.)、ブルギア属の種(Brugia spp.)、回旋糸状虫類(Onchocerca spp.)、イヌ糸状虫類(Dirofilaria spp.)、ディペタロネーマ属の種(Dipetalonema spp.)、セタリア属の種(Setaria spp.)、エレオフォラ属の種(Elaeophora spp.)、血色食道虫(Spirocerca lupi)、およびハブロンーマ属の種(Habronema spp.)；

鉤頭虫(Acanthocephala)、例えば、アカントケファルス属の種(Acanthocephalus spp.)、大鉤頭虫(Macracanthorhynchus hirudinaceus)、およびオンシコーラ属の種(Oncicola spp.)；

【0275】

プラナリア（扁形動物：Plathelminthes）：

10

吸虫(Trematoda)、例えば、肝蛭類(Fasciola spp.)、ファシオロイデス・マグナ(Fascioloides magna)、肺吸虫類(Paragonimus spp.)、槍形吸虫類(Dicrocoelium spp.)、肥大吸虫(Fasciolopsis buski)、肝吸虫(Clonorchis sinensis)、シストソーマ属の種(Schistosoma spp.)、トリコビルハルツ属の種(Trichobilharzia spp.)、吸虫(Alaria alata)、肺吸虫類(Paragonimus spp.)、およびナノサイエテス属の種(Nanocyetes spp.)；

【0276】

条虫(Cercomeromorpha)、特に条虫綱(Cestoda)（条虫）、例えば、広節裂頭条虫類(Diphyllobothrium spp.)、テニア属の種(Tenia spp.)、エキノコックス属の種(Echinococcus spp.)、イヌ条虫(Dipylidium caninum)、マルチセプス属の種(Multiceps spp.)、膜様条虫類(Hymenolepis spp.)、有線条虫類(Mesocestoides spp.)、ヴァンピロレピス属の種(Vampirolepis spp.)、モニエジア属の種(Moniezia spp.)、アノプロケファラ属の種(Anoplocephala spp.)、スピロメトラ属の種(Spirometra spp.)、アノプロケファラ属の種(Anoplocephala spp.)、および膜様条虫類(Hymenolepis spp.)。

20

【0277】

式Iの化合物およびそれを含む組成物は、双翅目、隠翅目およびマダニ目に属する有害生物の防除に特に有用である。

【0278】

さらに、蚊を駆除するための式Iの化合物およびそれを含む組成物の使用は特に好適である。

【0279】

30

ハエを駆除するための式Iの化合物およびそれを含む組成物の使用は、本発明の更なる好適な実施形態である。

【0280】

さらに、ノミを駆除するための式Iの化合物およびそれを含む組成物の使用は特に好ましい。

【0281】

ダニを駆除するための式Iの化合物およびそれを含む組成物の使用は、本発明の更なる好ましい実施形態である。

【0282】

式Iの化合物はまた、内部寄生生物（回虫、鉤頭虫およびプラナリア）を駆除するのに特に有用である。

40

【0283】

投与は予防のためであっても、治療のためであってもよい。

【0284】

本活性化合物は、そのまま直接または適当な製剤の形で、経口的に、局所的/経皮的に、または非経口的に投与される。

【0285】

温血動物に経口投与するために、式Iの化合物は飼料、プレミックス飼料、濃厚飼料、丸剤、液剤、ペースト剤、懸濁液剤、ドレンチ剤、ゲル剤、錠剤、ボーラス剤、およびカプセル剤として製剤化することができる。さらに、式Iの化合物を飲料水に入れて動物に

50

投与することも可能である。経口投与では、選択される剤形は1日あたり0.01mg/kgから100mg/kg（動物の体重）、好ましくは0.5mg/kgから100mg/kg（動物の体重）の式Iの化合物を動物に供給すべきである。

【0286】

あるいはまた、式Iの化合物は非経口的に、例えば胃内、筋内、静脈内、または皮下注射により動物に投与することができる。皮下注射の場合は、式Iの化合物を生理的に許容される担体中に分散または溶解する。別法として、皮下投与のために式Iの化合物をインプラントに製剤化してもよい。さらに、式Iの化合物を動物に経皮的に投与することもできる。非経口投与では、選択される剤形は1日あたり0.01mg/kgから100mg/kg（動物の体重）の式Iの化合物を動物に供給すべきである。

10

【0287】

式Iの化合物はまた、ディップ剤、散剤、粉剤、首輪、メダル、スプレー剤、シャンプー、スポットオン式(spot-on)およびポアオン式(pour-on)液剤の形で、さらに軟膏または水中油型もしくは油中水型乳剤の形で、動物に局所的に適用することもできる。局所適用では、ディップ剤およびスプレー剤は通常0.5ppmから5,000ppm、好ましくは1ppmから3,000ppmの式Iの化合物を含有する。さらに、式Iの化合物は動物用の、特にウシやヒツジなどの四足獣用の、耳タグとして製剤化することも可能である。

【0288】

適当な製剤は以下のものである。

【0289】

20

-液剤、例えば、経口液剤、希釈後に経口投与するための濃厚液剤、皮膚または体腔に使用するための液剤、ポアオン式液剤、ゲル剤；

-経口または経皮投与用の乳剤および懸濁液剤；半固形製剤；

-活性化合物が軟膏基剤または水中油型もしくは油中水型エマルジョン基剤中で処理されている製剤；

-固形製剤、例えば、粉剤、プレミックス剤または濃厚製剤、顆粒剤、ペレット剤、錠剤、ボーラス剤、カプセル剤；エアゾール剤および吸入剤、ならびに活性化合物含有成形品。

【0290】

注射に適する組成物を調製するには、活性成分を適当な溶媒に溶解し、場合により酸、塩基、緩衝塩、防腐剤、可溶化剤などの更なる成分を添加する。かかる液剤を濾過して、無菌状態で充填する。

30

【0291】

好適な溶媒は生理的に許容される溶媒であり、例えば、水、アルカノール（例：エタノール、ブタノール）、ベンジルアルコール、グリセロール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、N-メチルピロリドン、2-ピロリドン、およびこれらの混合物である。

【0292】

活性化合物は、場合により、注射用に適した、生理的に許容される植物油または合成油に溶解することもできる。

40

【0293】

好適な可溶化剤は、主溶媒への活性化合物の溶解を促進する溶媒、またはその沈殿を防止する溶媒である。例としては、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチル化ヒマシ油、およびポリオキシエチル化ソルビタンエステルがある。

【0294】

好適な防腐剤は、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステル、およびn-ブタノールである。

【0295】

経口液剤は直接投与される。濃厚液剤は使用濃度に前希釈した後に経口投与する。経口液剤と濃厚液剤は、当分野の現在の技術に従って、また注射液剤について上述したように

50

調製されるが、無菌の手順は必要でない。

【0296】

皮膚上で用いる液剤は皮膚に滴下するか、塗り広げるか、こすり付けるか、振りかけるか、またはスプレーする。

【0297】

皮膚上で用いる液剤は、当分野の現在の技術に従って、また注射液剤について上述した方法に従って調製されるが、無菌の手順は必要でない。

【0298】

更なる好適な溶媒は以下のものである：ポリプロピレングリコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、酢酸エチルまたはブチルのようなエステル、安息香酸ベンジル、アルキレングリコールアルキルエーテル（例えば、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル）のようなエーテル、アセトンまたはメチルエチルケトンのようなケトン、芳香族炭化水素、植物油および合成油、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、トランスクトール(transcutol)、ソルケタル(solketal)、プロピレンカーボネート、およびこれらの混合物。

【0299】

調製中に増粘剤を加えることが有利でありうる。好適な増粘剤は無機増粘剤、例えばベントナイト、コロイドケイ酸、およびステアリン酸アルミニウムと、有機増粘剤、例えばセルロース誘導体、ポリビニルアルコール、ならびにそれらのコポリマー、アクリレートおよびメタクリレートである。

【0300】

ゲル剤は皮膚に塗布するかまたは塗り広げるか、あるいは体腔内に注入する。ゲル剤の調製は、注射液剤の場合に記載したように調製した溶液を十分な増粘剤で処理して、軟膏様の粘稠度を有する透明な物質が得られるように行う。用いる増粘剤は上に挙げた増粘剤である。

【0301】

ポアオン(pour-on)製剤は限られた皮膚領域に注がれるかまたはスプレーされ、活性化化合物が皮膚を浸透して全身的に作用する。

【0302】

ポアオン製剤を調製するには、活性化化合物を、適当な皮膚適合性の溶媒または混合溶媒中に溶解するか、懸濁するか、または乳化する。適当な場合は、他の助剤、例えば着色剤、生体吸収促進物質、酸化防止剤、光安定剤、粘着剤を添加する。

【0303】

好適な溶媒は以下のものである：水、アルカノール、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセロール、芳香族アルコール（例：ベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール）、エステル（例：酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジル）、エーテル（例：ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテルのようなアルキレングリコールアルキルエーテル）、ケトン（例：アセトン、メチルエチルケトン）、環状カーボネート（例：プロピレンカーボネート、エチレンカーボネート）、芳香族および/または脂肪族炭化水素、植物油または合成油、DMF、ジメチルアセトアミド、n-アルキルピロリドン（例：メチルピロリドン、n-ブチルピロリドンもしくはn-オクチルピロリドン、N-メチルピロリドン、2-ピロリドン）、2,2-ジメチル-4-オキシ-メチレン-1,3-ジオキサランおよびグリセロールホルマル。

【0304】

好適な着色剤は、動物での使用が認可されている、溶解可能または懸濁可能な、あらゆる着色剤である。

【0305】

好適な吸収促進物質は、例えば、DMSO、スプレッド用オイル、例えばイソプロピルミリステート、ジプロピレングリコールペラルゴネート、シリコン油およびポリエーテルと

10

20

30

40

50

のそのコポリマー、脂肪酸エステル、トリグリセリド、脂肪アルコールである。

【0306】

好適な酸化防止剤は、亜硫酸塩またはメタ重亜硫酸塩（例えば、メタ重亜硫酸カリウム）、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、トコフェロールである。

【0307】

好適な光安定剤は、例えばノバンチソール酸(novantisolic acid)である。

【0308】

好適な粘着剤は、例えばセルロース誘導体、デンプン誘導体、ポリアクリレート、天然高分子物質、例えばアルギン酸塩、ゼラチンである。

10

【0309】

乳剤は経口的に、経皮的に、または注射剤として投与することができる。

【0310】

乳剤は油中水型または水中油型のいずれかの乳剤である。

【0311】

乳剤の調製は、活性化合物を疎水性相または親水性相のいずれかに溶解し、これを適当な乳化剤を用いて、適当であれば、着色剤、吸収促進物質、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、増粘剤のような他の助剤を加えて、他方の相の溶媒と共にホモジナイズすることにより行う。

【0312】

好適な疎水性相（油）は以下のものである。

20

【0313】

液状パラフィン、シリコン油、天然の植物油、例えばゴマ油、アーモンド油、ヒマシ油、合成トリグリセリド、例えばカプリル酸/カプリン酸ビグリセリド、鎖長 C_8 - C_{12} の植物性脂肪酸または他の特別に選択された天然脂肪酸を有するトリグリセリド混合物、ヒドロキシル基を含有し得る飽和または不飽和脂肪酸の部分グリセリド混合物、 C_8 - C_{10} 脂肪酸のモノ-およびジグリセリド、脂肪酸エステル、例えばステアリン酸エチル、アジピン酸ジ-n-ブチル、ラウリン酸ヘキシル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、分枝鎖状の中鎖脂肪酸と鎖長 C_{16} - C_{18} の飽和脂肪アルコールとのエステル、ミリスチル酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、鎖長 C_{12} - C_{18} の飽和脂肪アルコールのカプリル酸/カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、蠟様の脂肪酸エステル、例えば合成のアヒル尾骨腺脂肪、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、および後者に関係するエステル混合物、脂肪アルコール、例えばイソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコール、および脂肪酸、例えばオレイン酸、ならびにこれらの混合物。

30

【0314】

好適な親水性相は以下のものである：水、アルコール、例えばプロピレングリコール、グリセロール、ソルビトール、およびこれらの混合物。

【0315】

好適な乳化剤は以下のものである。

40

【0316】

非イオン性界面活性剤、例えば、ポリエトキシ化ヒマシ油、ポリエトキシ化ソルビタンモノオレエート、ソルビタンモノステアレート、グリセロールモノステアレート、ポリオキシエチルステアレート、アルキルフェノールポリグリコールエーテル；

両性界面活性剤、例えば、N-ラウリル-p-イミノジプロピオン酸ジナトリウムまたはレシチン；

アニオン性界面活性剤、例えば、ラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコールエーテル硫酸塩、モノ/ジアルキルポリグリコールエーテルオルトリン酸エステルのモノエタノールアミン塩；

50

カチオン性界面活性剤、例えば、塩化セチルトリメチルアンモニウム。

【0317】

好適な他の助剤は、粘度を上昇させかつ乳剤を安定化する物質であり、例えば、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロースおよび他のセルロース、デンプン誘導体、ポリアクリレート、アルギン酸塩、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテルと無水マレイン酸のコポリマー、ポリエチレングリコール、蠟、コロイドケイ酸、または上記物質の混合物である。

【0318】

懸濁液剤は、経口的にまたは局所的/経皮的に投与することができる。懸濁液剤の調製は、活性化化合物を懸濁化剤中に、場合により湿潤剤、着色剤、生体吸収促進物質、防腐剤、酸化防止剤、光安定化剤などの他の助剤を添加して、懸濁することにより行う。

10

【0319】

液状の懸濁化剤は、あらゆる均質溶媒および混合溶媒である。

【0320】

好適な湿潤剤（分散剤）は、先に挙げた乳化剤である。

【0321】

他の助剤としては、先に示したものが挙げられる。

【0322】

半固形製剤は、経口的にまたは局所的/経皮的に投与することができる。それらは、粘度がより高いことのみによって、上記の懸濁液剤および乳剤と相違する。

20

【0323】

固形製剤を製造するには、活性化化合物を適当な賦形剤と混合し、場合により助剤を添加して、その混合物を所望の形状に成形する。

【0324】

好適な賦形剤は、生理的に許容される、あらゆる固体の不活性物質である。用いられる賦形剤は無機および有機物質である。無機物質の例としては、塩化ナトリウム、炭酸塩、例えば炭酸カルシウム、炭酸水素塩、酸化アルミニウム、酸化チタン、ケイ酸、陶土、沈降またはコロイド状シリカ、またはリン酸塩がある。有機物質としては、例えば、糖類、セルロース、食物および飼料、例えば粉乳、動物ミール、穀物の粗びき粉および破砕物、デンプンがある。

30

【0325】

好適な助剤は、先に挙げた防腐剤、酸化防止剤、および/または着色剤である。

【0326】

他の好適な助剤は、滑沢剤および潤滑剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、タルク、ベントナイト）、崩壊剤（例えば、デンプンもしくは架橋ポリビニルピロリドン）、結合剤（例えば、デンプン、ゼラチンもしくは直鎖ポリビニルピロリドン）、および乾燥結合剤（例えば、微結晶性セルロース）である。

【0327】

一般的に、「殺寄生生物有効量」とは、標的生物の成長に認めうる効果（標的生物の壊死、死滅、抑制、予防、ならびに標的生物の発生および活性の消滅、破壊、さもなくば低減の効果を含む）を及ぼすのに必要な活性成分の量を意味する。殺寄生生物有効量は本発明で用いる各種化合物/組成物ごとに变化しうる。組成物の殺寄生生物有効量は、所望する殺寄生生物効果および持続期間、標的生物種、施用方法などの一般条件に応じて変化するのであろう。

40

【0328】

本発明で用いることができる組成物は、一般に約0.001から95%の式Iの化合物を含み得る。

【0329】

通常、式Iの化合物を1日あたり0.5mg/kgから100mg/kg、好ましくは1日あたり1mg/kgから50mg/kgの総量で適用することが有利である。

50

【0330】

即時使用可能(ready-to-use)製剤は、寄生生物、好ましくは外部寄生生物に対して作用する本化合物を10ppmから80重量%、好ましくは0.1から65重量%、さらに好ましくは1から50重量%、最も好ましくは5から40重量%の濃度で含有する。

【0331】

使用前に希釈する製剤は、外部寄生生物に対して作用する本化合物を0.5から90重量%、好ましくは1から50重量%の濃度で含有する。

【0332】

さらに、かかる製剤は、内部寄生生物に対して作用する式Iの化合物を10ppmから2重量%、好ましくは0.05から0.9重量%、特に好ましくは0.005から0.25重量%の濃度で含有する。

10

【0333】

本発明の好ましい実施形態において、式Iの化合物を含む組成物は経皮的/局所的に適用される。

【0334】

更なる好ましい実施形態において、局所適用は、本化合物を含有する成形品の形で行われ、例えば、首輪、メダル、耳タグ、身体の一部に固定するためのバンド、ならびに接着性ストリップおよびフォイルの形で実施される。

【0335】

一般には、式Iの化合物を、3週間にわたって10mg/kgから300mg/kg（処置動物の体重）、好ましくは20mg/kgから200mg/kg、最も好ましくは25mg/kgから160mg/kgの総量で放出する固形製剤を適用することが有利である。

20

【0336】

成形品を製造する場合は、熱可塑性および軟質プラスチックならびにエラストマーおよび熱可塑性エラストマーが用いられる。好適なプラスチックおよびエラストマーは、式Iの化合物と十分に適合しうるポリビニル樹脂、ポリウレタン、ポリアクリレート、エポキシ樹脂、セルロース、セルロース誘導体、ポリアミドおよびポリエステルである。プラスチックおよびエラストマーの詳細なリストならびに成形品の製造法は、例えばW003/086075に記載される。

【実施例】

【0337】

30

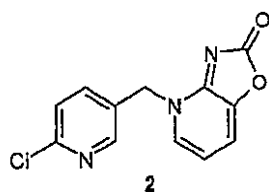
以下、下記の実施例によって本発明をさらに詳細に説明するが、これらはいかなる形でも本発明を限定するものではない。

【0338】

S. 合成実施例

合成例S.1:

【化39】



40

【0339】

2-クロロ-5-ヨードメチル-ピリジン(2.6g、10.26 mmol、W02006/060029に従って調製)をC₆H₅CN(50mL)に溶解させた溶液に、4H-オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オン(1.86g、13.67mmol)とK₂CO₃(5.67g、41.0mmol)を添加し、懸濁液を還流で1時間攪拌した。室温まで冷却した後、固形物を濾過によって除去し、濾液を減圧下で蒸発させた。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、MeOH/CH₂Cl₂ 勾配)によって精製し、0.79g(3.0mmol、29%)の化合物E.2を無色の固体として得た。

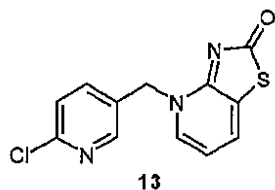
LC-MS: mass calcd. for C₁₂H₉ClN₃O₂ [M+H]⁺ 262.0 found 262.0; t_R = 1.83分

50

【0340】

合成例S.2:

【化40】



【0341】

10

2-クロロ-5-ヨードメチル-ピリジン(0.6g、1.97mmol、W02006/060029に従って調製)をCH₃CN(10mL)に溶解させた溶液に、3H-チアゾロ[4,5-b]ピリジン-2-オン(0.31g、2.04mmol、Bull. Soc. Chim. Fr. 1993, 130, 395に従って調製)とK₂CO₃(1.09g、7.89mmol)を添加し、懸濁液を還流で2時間攪拌した。室温まで冷却した後、固形物を濾過によって単離し、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、MeOH/CH₂Cl₂勾配)にかけて、90mg(0.32mmol、16%)の化合物13を無色の固体として得た。

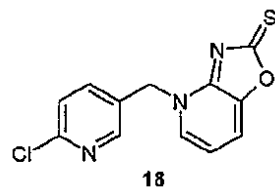
LC-MS: mass calcd. for C₁₂H₉ClN₃OS [M+H]⁺ 278.0 found 278.0; t_R = 2.00分

【0342】

合成例S.3:

【化41】

20



【0343】

2-クロロ-5-クロロメチル-ピリジン(1.0g、6.17mmol)、2-アミノ-ピリジン-3-オール(0.68g、6.17mmol)およびNaI(0.93g、6.17mmol)をアセトン(10mL)に懸濁させた懸濁液を、12時間還流させた。室温まで冷却した後、固形物を濾過によって除去し、濾液を減圧下で蒸発させた。残渣を酢酸エチルで粉碎し、1.63gの粗2-アミノ-1-(6-クロロ-ピリジン-3-イルメチル)-3-ヒドロキシ-ピリジニウムクロリドを得て、さらに精製することなく使用した。

30

【0344】

フェニルクロロチオノカーボネート(0.37g、2.12mmol)とEt₃N(0.32g、3.18mmol)を、上記の粗生成物(0.5g)をDMF(3mL)に溶解させた溶液に添加し、この溶液を70℃で5時間攪拌した。混合物をH₂Oで希釈し、CH₂Cl₂で2回抽出した。結合有機相をNa₂SO₄で乾燥させ、減圧下で蒸発させた。残渣をメチルtert-ブチルエーテルで粉碎し、RP-HPLCでさらに精製し、20mg(0.07 mmol, 3.5%)の化合物E.14を黄色がかった固体として得た。

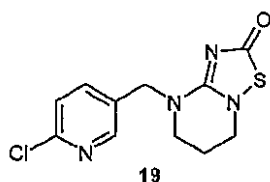
LC-MS: mass calcd. for C₁₂H₉ClN₃OS [M+H]⁺ 278.0 found 278.0; t_R = 2.02分

40

【0345】

合成例S.4:

【化42】



【0346】

50

-5℃において、1-(6-クロロ-ピリジン-3-イルメチル)-1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリミジン-2-イルアミン(1.0g、4.45mmol、J. Med. Chem. 1999, 42 (12), 2231に従って調製)を乾燥THF(7.5mL)に溶解させた溶液を、クロロホルミルスルフェニルクロリド(0.64g、4.9mmol)を乾燥THF(7.5mL)に溶解させた溶液に滴加した。次いで、この溶液を還流で2時間攪拌した。室温まで冷却した後、固形物を濾過によって除去し、濾液を減圧下で蒸発させた。残渣をRP-HPLCで精製し、90mg(0.32mmol、7%)の化合物E.15を得た。

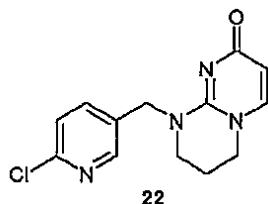
LC-MS: mass calcd. for $C_{11}H_{12}ClN_4OS$ $[M+H]^+$ 283.0 found 283.0; t_R = 2.43分

【0347】

合成例S.5:

【化43】

10



【0348】

80℃において、1-(6-クロロ-ピリジン-3-イルメチル)-1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリミジン-2-イルアミン(200mg、0.89mmol、J. Med. Chem. 1999, 42, 2227-2234に従って調製)とエチルプロピオレート(175mg、1.78mmol)をm-キシレン(3mL)に溶解させた溶液を、3.5時間攪拌した。次いで、溶媒を減圧下に除去し、残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO_2 、MeOH/ CH_2Cl_2 勾配)で精製し、15mg(0.05 mmol、6%)の化合物E.22を得た。

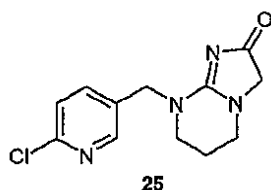
20

LC-MS: mass calcd. for $C_{13}H_{14}ClN_4O$ $[M+H]^+$ 277.1 found 277.1; t_R = 1.61分

【0349】

合成例S.6:

【化44】



30

【0350】

80℃において、1-(6-クロロ-ピリジン-3-イルメチル)-1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリミジン-2-イルアミン(250mg、1.11mmol)とエチルプロモアセテート(185mg、1.12mmol)をピリジン(5mL)に溶解させた溶液を5時間攪拌した。エチルプロモアセテートの第2当量を添加し、80℃においてさらに4時間攪拌し続けた。溶媒を減圧下に除去し、残渣をRP-HPLCで精製して20mg(0.05mmol、5%)の化合物E.25をTFA塩として得た。

LC-MS: mass calcd. for $C_{12}H_{14}ClN_4O$ $[M+H]^+$ 265.1 found 265.0; t_R = 1.29分

【0351】

40

C. 化合物例

本発明の化合物の例は、上記の合成例に示される。

【0352】

本発明による式Iの化合物の例は、以下の表E.1に示される。化合物例は、例えば、結合高速液体クロマトグラフィー/質量分析(HPLC/MS)によって特性決定することができる。

【0353】

分析HPLCカラム: RP-18カラム(Merck KgaA社(ドイツ)製のChromolith Speed ROD)。溶出: アセトニトリル + 0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)/水 + 0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)、比率5:95 → 95:5、40℃にて5分。

【0354】

50

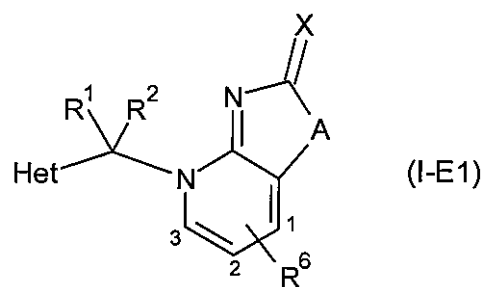
*) 分析HPLCカラム：Phenomenex Kinetex 1.7 μ m XB-C18 100A；50 x 2.1mm；移動相：A：水 + 0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)；B：アセトニトリル + 0.1%TFA；勾配：5～100% B 1.50分；100% B 0.20分；流速：0.8～1.0mL/分、60℃にて1.50分。

【0355】

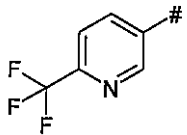
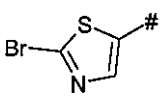
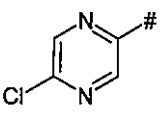
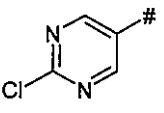
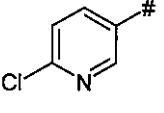
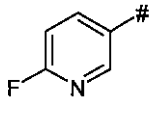
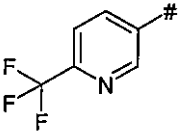
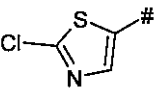
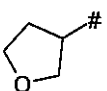
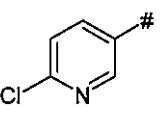
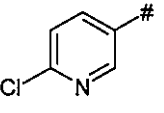
MS法：ESI陽性。

【表 2】

表 E.1 I-E1 の化合物の例 :



No.	Het ^{a)}	R ¹	R ²	A	X	R ⁶	物理化学データ ^{b)}
E1.1		H	H	O	O	H	r.t. = 1.59 分 m/z = 245.4
E1.2		H	H	O	O	H	r.t. = 1.83 分 m/z = 262.0
E1.3		H	H	O	O	H	r.t. = 1.96 分 m/z = 307.9
E1.4		H	H	O	O	H	r.t. = 2.07 分 m/z = 279.4
E1.5		H	H	O	O	H	r.t. = 2.25 分 m/z = 296.9
E1.6		H	H	O	O	H	r.t. = 1.93 分 m/z = 267.9
E1.7		H	H	O	O	H	r.t. = 1.35 分 m/z = 221.0
E1.8		H	H	O	O	H	r.t. = 1.41 分 m/z = 232.0

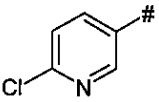
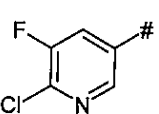
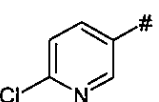
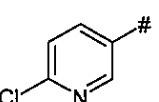
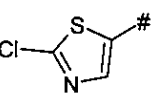
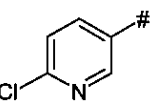
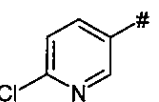
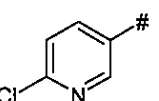
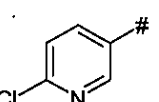
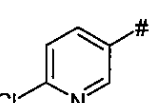
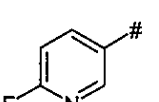
No.	Het ^{a)}	R ¹	R ²	A	X	R ⁶	物理化学データ ^{b)}
E1.9		H	H	O	O	H	r.t. = 2.14 分 m/z = 296.1
E1.10		H	H	O	O	H	r.t. = 1.84 分 m/z = 313.8
E1.11		H	H	O	O	H	r.t. = 1.64 分 m/z = 263.0
E1.12		H	H	O	O	H	r.t. = 1.47 分 m/z = 262.9
E1.13		H	H	S	O	H	r.t. = 2.00 分 m/z = 278.0
E1.14		H	H	S	O	H	r.t. = 1.77 分 m/z = 262.0
E1.15		H	H	S	O	H	r.t. = 2.23 分 m/z = 312.0
E1.16		H	H	S	O	H	r.t. = 2.05 分 m/z = 206.0
E1.17		H	H	S	O	H	r.t. = 1.54 分 m/z = 237.1
E1.18		H	H	O	S	H	r.t. = 2.02 分 m/z = 278.0
E1.19		H	H	NH	O	H	r.t. = 1.27 分 m/z = 261.0

10

20

30

40

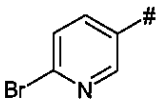
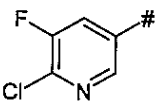
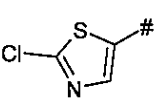
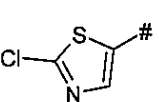
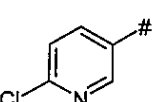
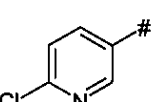
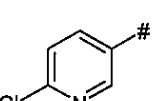
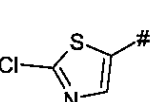
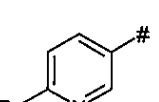
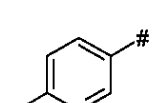
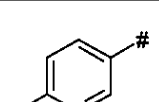
No.	Het ^{a)}	R ¹	R ²	A	X	R ⁶	物理化学データ ^{b)}
E1.20		H	H	O	O	2-F	r.t. = 1.90 分 m/z = 279.9
E1.21		H	H	S	O	H	r.t. = 2.43 分 m/z = 296.0
E1.22		H	H	O	O	2-Cl	r.t. = 2.17 分 m/z = 297.0
E1.23		H	H	O	O	2-Br	r.t. = 2.25 分 m/z = 341.8
E1.24		H	H	O	S	H	r.t. = 2.12 分 m/z = 284.0
E1.25		H	H	O	O	2,3-di-Cl	r.t. = 2.56 分 m/z = 331.0
E1.26		H	H	O	O	2,3-di-Br	r.t. = 2.71 分 m/z = 420.8
E1.27		H	H	O	O	2-CH ₃	r.t. = 1.98 分 m/z = 276.0
E1.28		H	H	O	S	2-CH ₃	r.t. = 2.22 分 m/z = 292.0
E1.29		H	H	O	S	2-F	r.t. = 2.18 分 m/z = 295.9
E1.30		H	H	O	S	H	r.t. = 1.72 分 m/z = 262.0

10

20

30

40

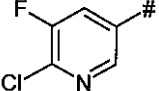
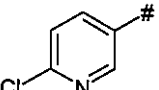
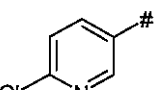
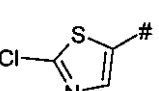
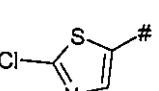
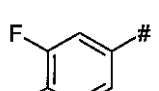
No.	Het ^{a)}	R ¹	R ²	A	X	R ⁶	物理化学データ ^{b)}
E1.31		H	H	O	S	H	r.t. = 2.09 分 m/z = 321.9
E1.32		H	H	O	S	H	r.t. = 2.27 分 m/z = 296.0
E1.33		H	H	O	O	2-CH ₃	r.t. = 1.12 分*) m/z = 282.0
E1.34		H	H	O	O	2-F	r.t. = 0.78 分*) m/z = 285.9
E1.35		H	H	S	S	H	r.t. = 0.81 分*) m/z = 293.9
E1.36		H	H	S	S	2-CH ₃	r.t. = 0.87 分*) m/z = 308.0
E1.37		H	H	S	S	2-Br	r.t. = 0.96 分*) m/z = 373.8
E1.38		H	H	O	S	2-CH ₃	r.t. = 0.84 分*) m/z = 297.9
E1.39		H	H	O	S	2-CH ₃	r.t. = 0.84 分*) m/z = 337.8
E1.40		H	H	O	O	2-CH ₃	r.t. = 0.80 分*) m/z = 321.9
E1.41		H	H	O	S	2-F	r.t. = 0.83 分*) m/z = 339.9

10

20

30

40

No.	Het ^{a)}	R ¹	R ²	A	X	R ⁶	物理化学データ ^{b)}
E1.42		H	H	S	S	H	r.t. = 0.88 分*) m/z = 312.0
E1.43		H	H	O	S	1- CH ₃	r.t. = 0.81 分*) m/z = 292.2
E1.44		H	H	O	O	1- CH ₃	r.t. = 0.76 分*) m/z = 276.2
E1.45		H	H	S	S	2- CH ₃	r.t. = 0.89 分*) m/z = 313.9
E1.46		H	H	S	S	H	r.t. = 0.83 分*) m/z = 299.9
E1.47		H	H	S	S	2- CH ₃	r.t. = 0.93 分*) m/z = 326.0

a) #は、分子の残りの部分への結合点を表す；

b) r.t. = HPLC保持時間；[M+H]⁺、[M+Na]⁺または[M+K]⁺ピークのm/z。

*) 分析 UPLC カラム(上記参照)

【 0 3 5 6 】

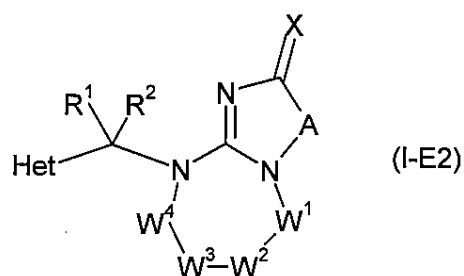
10

20

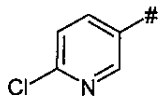
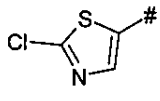
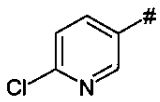
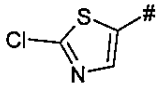
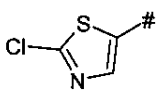
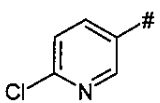
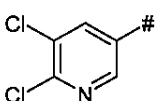
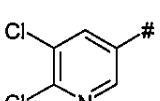
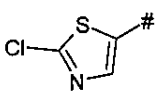
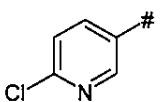
30

【表 3】

表 E.2 式 I-E2 の化合物の例：



No.	Het ^{a)}	R1	R2	W ⁴ -W ³ -W ² -W ¹	A	X	物理化学データ ^{b)}
E2.1		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	S	O	r.t. = 2.43 分 m/z = 283.0
E2.2		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -	S	O	r.t. = 2.20 分 m/z = 269.0
E2.3		H	H	-CH=CH-	S	O	r.t. = 2.52 分 m/z = 304.9
E2.4		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	-CH=CH-	O	r.t. = 1.61 分 m/z = 277.1
E2.5		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH=CH-	O	r.t. = 1.44 分 m/z = 263.1
E2.6		H	H	-CH=CH-	-CH=CH-	O	r.t. = 1.50 分 m/z = 261.0
E2.7		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	CH ₂	O	r.t. = 1.29 分 m/z = 265.0
E2.8		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -	O	O	r.t. = 1.71 分

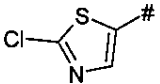
No.	Het ^{a)}	R1	R2	W ⁴ -W ³ -W ² -W ¹	A	X	物理化学データ ^{b)}
							m/z = 253.0
E2.9		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	O	O	r.t. = 0.704 分*) m/z = 267.0
E2.10		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	O	O	r.t. = 0.723 分*) m/z = 272.9
E2.11		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	O	S	r.t. = 2.102 分 m/z = 283.1
E2.12		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -	O	O	r.t. = 1.837 分 m/z = 259.0
E2.13		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	O	S	r.t. = 0.723 分*) m/z = 272.9
E2.14		H	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -	S	O	r.t. = 0.852 分*) m/z = 285.2
E2.15		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	O	S	r.t. = 0.922 分*) m/z = 317.2
E2.16		H	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	O	O	r.t. = 0.848 分*) m/z = 301.2
E2.17		H	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -	S	O	r.t. = 0.905 分*) m/z = 291.2
E2.18		H	H	-CH=CH-N=	S	O	r.t. = 0.767 分*) m/z = 279.2

10

20

30

40

No.	Het ^{a)}	R1	R2	W ⁴ -W ³ -W ² -W ¹	A	X	物理化学データ ^{b)}
E2.19		H	H	-CH=CH-N=	S	O	r.t. = 0.794 分 ^{*)} m/z = 285.2

a) #は、分子の残りの部分への結合点を表す；

10

b) r.t. = HPLC保持時間；[M+H]⁺、[M+Na]⁺または[M+K]⁺ピークのm/z。

*) 分析 UPLC カラム

【0357】

化合物は、一般的に、例えば結合高速液体クロマトグラフィー/質量分析(HPLC/MS)で、¹H-NMRおよび/またはそれらの化合物の融点によって特性決定することができる。

【0358】

B. 生物学の実施例

以下の生物学の試験で、本発明の式Iの化合物の生物学の活性を示し、評価することができる、またはできた。

20

【0359】

一般的条件

別段の断りがない限り、ほとんどの試験溶液は下記のように調製した：

活性化合物を、1：1 (vol：vol) 蒸留水：アセトンの混合物中で所望の濃度で溶解させる。試験溶液は、使用当日に(また別段の断りがない限り、通常は重量/体積の濃度で)調製する。

【0360】

B.1 モモアカアブラムシ(Green Peach Aphid)(ミズス・ペルシカエ(Myzus persicae))

活性化合物を、チューブ入りの10,000ppm溶液としてシクロヘキサノン中で製剤化した。このチューブを、噴霧ノズルを備えた自動静電噴霧機に挿入して原液とし、50%アセトン：50%水(v/v)中でこの原液の低希釈液を作製した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))を、この溶液に0.01% (v/v)の量で含めた。

30

【0361】

第1本葉期のピーマン植物に、処理前に、主コロニーから採取した重度に寄生された葉を処理植物の最上部に置くことによって寄生させた。アブラムシを一晩移動させて1植物当たり30～50匹のアブラムシの寄生を達成し、宿主葉を取り除いた。その後、寄生された植物に、噴霧スプレーノズルを備えた自動静電植物噴霧機でスプレーした。この植物を、噴霧機のドラフト中で乾燥させ、取り出し、次いで、24時間光周期の蛍光照明下、約25°C、相対湿度約20～40%の生育室中で維持した。未処理の対照植物上のアブラムシの死亡率と比較した、処理植物上のアブラムシの死亡率を、5日後に測定した。

40

【0362】

この試験では、300ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.4、E1.5、E1.6、E1.8、E1.12、E1.14、E1.18、E1.20、E1.21、E1.24、E1.28、E1.30、E1.31、E1.32、E1.35、E1.36、E1.40、E1.41、E2.3、E2.9、E2.10、E2.11、E2.12、E2.13、E2.15およびE2.16が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0363】

B.2 ワタアブラムシ(Cotton aphid)(アフィス・ゴシピイ(Aphis gossypii))

活性化合物を50：50(vol：vol)のアセトン：水と100ppmのKinetic(登録商標)界面活性剤中で製剤化した。

50

【0364】

子葉段階のワタ植物(1鉢につき1植物)に、主コロニーから採取した重度に寄生された葉を、各子葉の上端に置くことによって寄生させた。アブラムシを宿主植物に一晩移動させ、アブラムシを移動させるために使用した葉は取り除いた。この子葉を試験溶液に浸してから乾燥させた。5日後、死亡率の計数を行った。

【0365】

この試験では、300ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.4、E1.6、E1.8、E1.12、E1.18、E1.21、E1.24、E1.30、E1.31、E1.32、E1.35、E1.42、E2.9、E2.10、E2.11、E2.13およびE2.16が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0366】

B.3 ササゲアブラムシ(Cowpea aphid)(アフィス・クラキボラ(*Aphis craccivora*))

活性化化合物を、1:1(vol:vol)蒸留水:アセトンの混合物中で所望の濃度に溶解させる。試験溶液は、使用当日に調製する。

【0367】

様々な段階にある約100~150匹のアブラムシにコロニー形成された鉢植えのササゲ植物に、有害生物の個体数を記録した後でスプレーした。24、72および120時間後に個体数の減少を評価した。

【0368】

この試験では、500ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.4、E1.6、E1.7、E1.8、E1.9、E1.10、E1.11、E1.13、E1.14、E1.16、E1.18、E1.20、E1.21、E1.22、E1.23、E1.24、E1.25、E1.26、E1.27、E1.28、E1.30、E1.31、E1.32、E1.35、E1.38、E1.39、E1.41、E1.42、E1.44、E1.45、E1.46、E2.8、E2.9、E2.10、E2.11、E2.12、E2.13、E2.15およびE2.16が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0369】

B.4 ソラマメヒゲナガアブラムシ(vetch aphid)(メゴウラ・ビシエ(*Megoura viciae*))

接触手段または浸透手段によるソラマメヒゲナガアブラムシ(vetch aphid、メゴウラ・ビシエ(*Megoura viciae*))の防除を評価するため、ソラマメのリーフディスクを入れた24ウェルマイクロタイタープレートで試験ユニットを構成した。

【0370】

化合物は、75%(v/v)の水および25%(v/v)のDMSOを含有する溶液を用いて製剤化した。異なる濃度の製剤化化合物を、特注のマイクロアトマイザーを使用してリーフディスク上に2.5μlスプレーした(2セット)。

【0371】

施用後、リーフディスクを空気乾燥させ、5~8匹の成虫のアブラムシを、マイクロタイタープレートウェル内のリーフディスク上に置いた。次いで、処理したリーフディスク上でアブラムシに吸汁させ、約23±1℃、相対湿度約50±5%で5日間インキュベートした。その後、アブラムシの死亡率と繁殖力を目視で評価した。

【0372】

この試験では、800ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.4、E1.5、E1.6、E1.8、E1.9、E1.10、E1.11、E1.12、E1.13、E1.14、E1.15、E1.16、E1.18、E1.19、E1.21、E1.22、E1.23、E1.24、E1.27、E1.28、E1.30、E1.31、E1.32、E1.33、E1.35、E1.36、E1.37、E1.38、E1.40、E1.41、E1.42、E1.43、E1.44、E1.46、E1.47、E2.3、E2.7、E2.8、E2.9、E2.10、E2.11、E2.13、E2.15、E2.16、E2.18が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0373】

B.5 シルバーリーフコナジラミ(Silverleaf whitefly)(ベミシア・アルゲンチフォリイ(*bemisia argentifolii*))

活性化化合物を、チューブ入りの10,000ppm溶液としてシクロヘキサノン中で製剤化した。このチューブを、噴霧ノズルを備えた自動静電噴霧機に挿入して原液とし、50%アセトン:50%水(v/v)中でこの原液の低希釈液を作製した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登

10

20

30

40

50

録商標))を、この溶液に0.01%(v/v)の量で含めた。

【0374】

子葉段階のワタ植物(1鉢につき1植物)に、噴霧スプレーノズルを備えた自動静電植物噴霧機でスプレーした。この植物を、噴霧機のドラフト中で乾燥させ、次いで噴霧機から取り出した。各鉢を、プラスチックカップ中に置き、約10~12匹のコナジラミの成虫(およそ3~5日齢)を入れた。これらの昆虫は、吸引装置と、バリエーピペットチップに接続した非毒性Tygon(登録商標)管を使用して採集した。その後、採集された虫を含むチップを、処理済みの植物が植えられている土壤に穏やかに挿入し、虫をチップから這い出させて食餌用の葉に到達させた。カップは、再利用可能な遮蔽蓋で覆った。試験植物を、蛍光照明(24時間光周期)への直接曝露を避けてカップ内に熱がこもるのを防ぎながら、約25℃、相対湿度約20~40%の生育室中で3日間維持した。死亡率は、処理の3日後に未処理の対照植物と比較して評価した。

10

【0375】

この試験では、500ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.4、E1.7、E1.12、E1.14、E1.16、E1.18、E1.20、E1.24、E1.30、E1.31、E1.32、E1.35、E1.41、E1.42、E2.9、E2.10、E2.11、E2.12、E2.13およびE2.15が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0376】

B.6 ワタミハナゾウムシ(Boll weevil)(アントノムス・グランディス(*Anthonomus grandis*))

20

ワタミハナゾウムシ(*Anthonomus grandis*)の防除を評価するため、昆虫食餌と20~30個のワタミハナゾウムシの卵を入れた24ウェルマイクロタイタープレートで試験ユニットを構成した。

【0377】

化合物は、75%(v/v)の水および25%(v/v)のDMSOを含有する溶液を用いて製剤化した。異なる濃度の製剤化化合物を、特注のマイクロアトマイザーを使用して昆虫食餌上に20 µlスプレーした(2セット)。

【0378】

施用後、マイクロタイタープレートを、約23±1℃、相対湿度約50±5%で5日間インキュベートした。その後、卵と幼虫の死亡率を目視で評価した。

30

【0379】

この試験では、2500ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.4、E1.5、E1.6、E1.10、E1.12、E1.13、E1.14、E1.16、E1.18、E1.21、E1.24、E1.25、E1.27、E1.30、E1.31、E1.32、E1.33、E1.35、E1.36、E1.37、E1.42、E1.43、E1.45、E1.46、E2.9、E2.10、E2.11、E2.13、E2.15およびE2.16が、未処理の対照と比較して75%超の死亡率を示した。

【0380】

B.7 ランアザミウマ(Orchid thrips)(ジクロモトリプス・コルベッティ(*dichromothrips corbetti*))

バイオアッセイに使用するランアザミウマ(*dichromothrips corbetti*)の成虫を、研究室条件下で継続的に維持したコロニーから得た。試験目的のため、試験化合物を、アセトン：水(vol:vol)の1:1混合物と0.01%(vol/vol)Kinetic(登録商標)界面活性剤中で300ppm(重量 化合物：体積 希釈剤)の濃度に希釈した。

40

【0381】

各化合物のアザミウマに対する効力を、花浸漬技術を用いて評価した。試験場所としてプラスチック製ペトリ皿を使用した。個々の無傷のラン花の花弁を全て処理溶液に浸して、乾燥させた。処理した花を、10~15匹のアザミウマ成虫と共に個々のペトリ皿に入れた。その後、これらのペトリ皿を蓋で覆った。アッセイ期間中、全ての試験場所を連続光下、約28℃の温度に保持した。4日後、各花の上、および各ペトリ皿の内壁沿いに生存しているアザミウマの数を計数した。アザミウマの死亡率のレベルを、処理前のアザミウマの数から外挿した。

50

【0382】

この試験では、500ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.4、E1.6、E1.7、E1.8、E1.10、E1.11、E1.14、E1.16、E1.18、E1.20、E1.21、E1.24、E1.28、E1.30、E1.31、E1.32、E1.35、E1.36、E1.38、E1.42、E1.43、E1.46、E2.8、E2.9、E2.10、E2.11、E2.12およびE2.13が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0383】

B.8 ツマグロヨコバイ(Rice green leafhopper)(ネフォテティックス・ヴィレセンス(*Nephotettix virescens*))

イネ苗の汚れを落とし、洗浄して24時間後にスプレーした。活性化合物を50:50のアセトン:水(vol:vol)中で製剤化し、0.1%(vol/vol)の界面活性剤(EL 620)を添加した。鉢植えのイネ苗に5mlの試験溶液をスプレーし、空気乾燥させ、ケージに入れて10匹の成虫を接種した。処理したイネ植物を約28~29℃、相対湿度約50~60%に保った。72時間後に死亡率を記録した。

10

【0384】

この試験では、500ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.4、E1.5、E1.6、E1.8、E1.13、E1.16、E1.18、E1.21、E1.24、E1.30、E1.31、E1.32、E1.35、E1.42、E1.43、E1.46、E2.9、E2.10、E2.11およびE2.13が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

【0385】

B.9 トビイロウンカ(Rice brown plant hopper)(ニラパルバタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*))

イネ苗の汚れを落とし、洗浄して24時間後にスプレーした。活性化合物を50:50のアセトン:水(vol:vol)中で製剤化し、0.1%(vol/vol)の界面活性剤(EL 620)を添加した。鉢植えのイネ苗に5mlの試験溶液をスプレーし、空気乾燥させ、ケージに入れて10匹の成虫を接種した。処理したイネ植物を約28~29℃、相対湿度約50~60%に保った。72時間後に死亡率を記録した。

20

【0386】

この試験では、500ppmの化合物E1.2、E1.3、E1.4、E1.5、E1.19、E1.24、E1.28、E1.30、E1.31、E1.32、E1.35、E1.42、E1.43、E2.9、E2.11およびE2.13が、未処理の対照と比較して少なくとも75%の死亡率を示した。

30

【0387】

B.10 チチュウカイミバエ(Mediterranean fruitfly)(セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*))

チチュウカイミバエ(Mediterranean fruitfly)(セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*))の防除を評価するため、昆虫餌と50~80個のチチュウカイミバエの卵を入れたマイクロタイタープレートで試験ユニットを構成した。

【0388】

化合物は、75%(v/v)の水および25%(v/v)のDMSOを含有する溶液を用いて製剤化した。異なる濃度の製剤化化合物を、特注のマイクロアトマイザーを使用して昆虫食餌上に5μlスプレーした(2セット)。

40

【0389】

施用後、マイクロタイタープレートを、約28±1℃、相対湿度約80±5%で5日間インキュベートした。その後、卵と幼虫の死亡率を目視で評価した。

【0390】

この試験では、800ppmの化合物E1.1、E1.2、E1.3、E1.6、E1.10、E1.16、E1.18、E1.23、E1.24、E1.30、E1.31、E1.42、E2.9、E2.10、E2.11およびE2.15が、未処理の対照と比較して75%の死亡率を示した。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

A 0 1 P	7/04	(2006.01)	C 0 7 D	498/04	1 0 5
A 6 1 K	31/444	(2006.01)	C 0 7 D	513/04	3 4 3
A 6 1 K	31/519	(2006.01)	C 0 7 D	513/04	3 5 1
A 6 1 K	31/506	(2006.01)	C 0 7 D	513/04	3 0 1
A 6 1 K	31/497	(2006.01)	C 0 7 D	513/04	3 2 5
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)	C 0 7 D	513/04	3 4 1
A 6 1 K	31/5395	(2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 3
A 6 1 K	31/53	(2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 4
A 6 1 P	33/00	(2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 5
A 6 1 P	33/10	(2006.01)	A 0 1 P	7/04	
			A 6 1 K	31/444	
			A 6 1 K	31/519	
			A 6 1 K	31/506	
			A 6 1 K	31/497	
			A 6 1 K	31/4439	
			A 6 1 K	31/5395	
			A 6 1 K	31/53	
			A 6 1 P	33/00	
			A 6 1 P	33/00	1 7 1
			A 6 1 P	33/10	

(74)代理人 100111741

弁理士 田中 夏夫

(74)代理人 100169971

弁理士 菊田 尚子

(74)代理人 100125508

弁理士 藤井 愛

(74)代理人 100135909

弁理士 野村 和歌子

(72)発明者 パウリニ, ラルフ

ドイツ連邦共和国 6 7 0 9 8 バート デュルクハイム, イム ノネンガルテン 5 7

(72)発明者 バイヤー, カルステン

ドイツ連邦共和国 5 5 1 1 8 マインツ, ライブニツシュトラッセ 4 0 - 4 2

(72)発明者 バスティアーンズ, ヘンリクス マリア マルティヌス

アメリカ合衆国 2 7 5 1 6 ノースカロライナ州, チャペル ヒル, アバディーン ドライブ
6 1 3

(72)発明者 ランケル, ナンシー, ビー.

アメリカ合衆国 2 7 5 1 3 ノースカロライナ州, ケーリー, バードジー コート 1 1 1

審査官 三上 晶子

(56)参考文献 米国特許第0 3 9 3 5 2 2 2 (US, A)

国際公開第2 0 1 0 / 0 0 5 6 9 2 (WO, A 2)

特表2 0 0 9 - 5 3 1 3 4 8 (JP, A)

特表2 0 0 9 - 5 3 1 3 5 1 (JP, A)

Database REGISTRY, 2 0 1 1 年 3 月 2 2 日, RN 1269404-57-0, 1269404-15-0, 1269278-38-7
, 1269250-57-8, 1269098-01-2, 1268995-57-8, 1268987-89-8, 1268954-97-7, 901886-68-8; R

etrieved from STN international [online] ;retrieved on 2 December 2015

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D471/00-471/22

C07D487/00-491/22

C07D498/00-498/22

C07D513/00-521/00

A01N 1/00- 65/48

A01P 1/00- 23/00

A61K 31/33- 33/44

A61P 1/00- 43/00

CAplus/REGISTRY (STN)