

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2014-524433

(P2014-524433A)

(43) 公表日 平成26年9月22日 (2014. 9. 22)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 401/04 (2006. 01)	C O 7 D 401/04 C S P	4 C O 6 3
A O 1 N 43/56 (2006. 01)	A O 1 N 43/56 D	4 C O 8 6
A O 1 N 43/84 (2006. 01)	A O 1 N 43/84 I O I	4 H O 1 1
A O 1 P 7/04 (2006. 01)	A O 1 P 7/04	
A 6 1 K 31/4439 (2006. 01)	A 6 1 K 31/4439	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 138 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2014-525464 (P2014-525464)	(71) 出願人	508020155
(86) (22) 出願日	平成24年8月17日 (2012. 8. 17)		ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ
(85) 翻訳文提出日	平成26年4月7日 (2014. 4. 7)		ア
(86) 国際出願番号	PCT/EP2012/066139		B A S F S E
(87) 国際公開番号	W02013/024170		ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
(87) 国際公開日	平成25年2月21日 (2013. 2. 21)		D-67056 Ludwigshafen, Germany
(31) 優先権主張番号	61/524, 790	(74) 代理人	100091096
(32) 優先日	平成23年8月18日 (2011. 8. 18)		弁理士 平木 祐輔
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(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】 有害無脊椎動物を駆除するためのカルバモイルメトキシベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミドおよびカルバモイルメチルアミノベンズアミド

(57) 【要約】

本発明は、置換カルバモイルメトキシベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミド化合物ならびにその立体異性体、塩、互変異性体およびN-オキシド、ならびにこれを含む組成物に関する。本発明はまた、有害無脊椎動物を駆除するための、カルバモイルメトキシベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミド化合物、またはこのような化合物を含む組成物の使用に関する。さらに、本発明は、このような化合物を適用させる方法に関する。

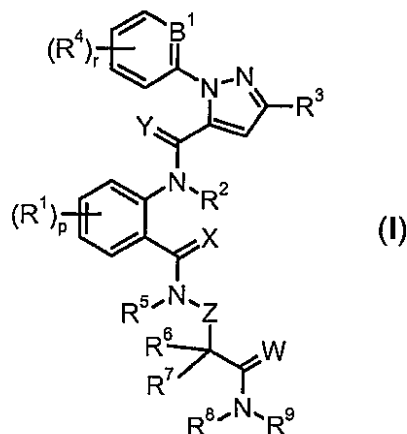
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

(式中、

 B^1 は、N または CH であり、

各 R^1 は、独立して、ハロゲン；シアノ；アジド；ニトロ；-SCN； SF_5 ； $C_1 \sim C_6$ -アルキル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）； $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）； $C_2 \sim C_6$ -アルケニル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）； $C_2 \sim C_6$ -アルキニル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）；-Si(R^{14})₂ R^{15} ；-OR¹¹；-OS(O)_n R^{11} ；-SR¹¹；-S(O)_m R^{11} ；-S(O)_n(R^{12a}) R^{12b} ；-N(R^{12a}) R^{12b} ；-N(R^{12a})C(=O) R^{10} ；-C(=O) R^{10} ；-C(=S) R^{10} ；-C(=O)OR¹¹；-C(=S)OR¹¹；-C(=NR^{12a}) R^{10} ；-C(=O)N(R^{12a}) R^{12b} ；-C(=S)N(R^{12a}) R^{12b} ；フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SO および SO₂ から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

20

30

あるいは、隣接する炭素原子上で結合している2つの基 R^1 が、一緒になって、-CH₂CH₂CH₂CH₂-、-CH=CH-CH=CH-、-N=CH-CH=CH-、-CH=N-CH=CH-、-N=CH-N=CH-、-OCH₂CH₂CH₂-、-OCH=CHCH₂-、-CH₂OCH₂CH₂-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂OCH₂-、-CH₂CH₂CH₂-、-CH=CHCH₂-、-CH₂CH₂O-、-CH=CHO-、-CH₂OCH₂-、-CH₂C(=O)O-、-C(=O)OCH₂-、-O(CH₂)O-、-SCH₂CH₂CH₂-、-SCH=CHCH₂-、-CH₂SCH₂CH₂-、-SCH₂CH₂S-、-SCH₂SCH₂-、-CH₂CH₂S-、-CH=CHS-、-CH₂SCH₂-、-CH₂C(=S)S-、-C(=S)SCH₂-、-S(CH₂)S-、-CH₂CH₂NR²¹-、-CH₂CH=N-、-CH=CH-NR²¹-、-OCH=N- および -SCH=N-、から選択される基であってよく、したがって、これらが結合している炭素原子と一緒に、5または6員の環を形成し、上記基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシおよびハロメトキシから選択される1つ以上の置換基で置き換えられていてもよい、または上記基の1つ以上のCH₂基は、C=O基で置き換えられていてもよく；

40

R^2 は、水素；シアノ； $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）； $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）； $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）； $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい）；-N(R^{12a}) R^{12b} ；-Si(R^{14})₂ R^{15} ；-OR¹¹；-SR¹¹；-S(O)_m R^{11} ；-S(O)_n

50

$N(R^{12a})R^{12b}$; $-C(=O)R^{10}$; $-C(=O)OR^{11}$; $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$; $-C(=S)R^{10}$; $-C(=S)OR^{11}$; $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$; $-C(=NR^{12a})R^{10}$; フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい); および環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-OS(O)_nR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(O)_mR^{11}$ 、 $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、 $-C(=S)R^{10}$ 、 $-C(=S)OR^{11}$ 、 $-C(=NR^{12a})R^{10}$ 、 $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

各 R^4 は、独立して、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(O)_mR^{11}$ 、 $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、 $-C(=S)R^{10}$ 、 $-C(=S)OR^{11}$ 、 $-C(=NR^{12a})R^{10}$ 、 $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R^5 は、水素; シアノ; $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい); $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい); $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい); $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい); $-N(R^{12a})R^{12b}$; $-Si(R^{14})_2R^{15}$; $-OR^{11}$; $-SR^{11}$; $-S(O)_mR^{11}$; $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$; $-C(=O)R^{10}$; $-C(=O)OR^{11}$; $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$; $-C(=S)R^{10}$; $-C(=S)OR^{11}$; $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$; $-C(=NR^{12a})R^{10}$; フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい); ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R^6 、 R^7 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(上述の脂肪族および脂環式の基は、それぞれ独立して、部分的もしくは完全にハロゲン化されてい

てもよく、および/または1、2、3、4、5、6、7、8、9もしくは10の置換基 R^{10} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{10} は、複数の置換基 R^{10} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、 $-OR^{11}$ 、 $-NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-S(O)_nR^{11}$ 、 $-S(O)_nNR^{12a}R^{12b}$ 、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、 $-C(=S)R^{10}$ 、 $-C(=S)NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-C(=S)OR^{11}$ 、 $-C(=S)SR^{11}$ 、 $-C(=NR^{12a})R^{10}$ 、 $-C(=NR^{12a})NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、ならびに3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(前記ヘテロ環式環は、酸素、窒素および硫黄原子からなる群から独立して選択される、1、2または3個のヘテロ原子を含み、1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なり、前記窒素および硫黄原子は、互いに独立して、酸化されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは、 R^6 および R^7 は、一緒になって、 $C_2\sim C_7$ -アルキレンまたは $C_2\sim C_7$ -アルケニレン鎖であり、これらが結合している炭素原子と一緒に、3、4、5、6、7、または8員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和の環を形成し、 $C_2\sim C_7$ -アルキレン鎖の中の CH_2 基のいずれかのうちの1、2、3もしくは4つ、または $C_2\sim C_7$ -アルケニレン鎖の中の CH_2 もしくは CH 基のいずれかのうちの1、2、3もしくは4つは、O、S、NおよびNHからなる群から独立して選択される1、2、3もしくは4つの基で置き換えられていてもよく、 $C_2\sim C_7$ -アルキレンまたは $C_2\sim C_7$ -アルケニレン鎖の中の炭素および/または窒素原子は、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ -アルケニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ -アルキニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルキニルおよびフェニル(1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)からなる群から独立して選択される1、2、3、4または5つの置換基で置換されていてもよく、 $C_2\sim C_7$ -アルキレン、 $C_2\sim C_7$ -アルケニレンまたは $C_2\sim C_7$ -アルキニレン鎖の中の硫黄および窒素原子は、互いに独立して、酸化されていてもよい、

あるいは R^6 および R^7 は、一緒になって、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NR^{12a}$ 、 $=NOR^{11}$ 、または $=CR^{16}R^{17}$ 基を形成し、

R^8 、 R^9 は、互いに独立して、水素、シアノ、 $C_1\sim C_{10}$ -アルキル、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_2\sim C_{10}$ -アルケニル、 $C_2\sim C_{10}$ -アルキニル(上述の脂肪族および脂環式の基は、それぞれ独立して、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1、2、3、4、5、6、7、8、9もしくは10の置換基 R^{10} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{10} は、複数の置換基 R^{10} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、 $-OR^{11}$ 、 $-NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-S(O)_nR^{11}$ 、 $-S(O)_nNR^{12a}R^{12b}$ 、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、 $-C(=S)R^{13}$ 、 $-C(=S)NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-C(=S)OR^{11}$ 、 $-C(=S)SR^{11}$ 、 $-C(=NR^{12a})R^{13}$ 、 $-C(=NR^{12a})NR^{12a}R^{12b}$ 、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、ならびに3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(前記ヘテロ環式環は、酸素、窒素および硫黄原子からなる群から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含み、1、2、3、4または5つの置換基 R^{21} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{21} は、複数の置換基 R^{21} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なり、前記窒素および硫黄原子は、互いに独立して、酸化されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは R^8 および R^9 は、これらが結合している窒素原子と一緒に、3、4、5、6、7または8員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(環員として、N、O、S、NO、SO、 SO_2 、 $C(=O)$ および $C(=S)$ から選択される、1、2、3または4つのさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい)を形成し、このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよく、

あるいは R^8 および R^8 は、一緒になって、 $=CR^{16}R^{17}$ 、 $=S(O)_nR^{11}$ 、 $=S(O)_nNR^{12a}R^{12b}$ 、 $=NR^{11}$

^{2a} または=NOR¹¹基を形成してもよく、

各R¹⁰は、独立して、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、SF₅、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、-Si(R¹⁴)₂R¹⁵、-OR¹¹、-OSO₂R¹¹、-SR¹¹、-S(O)_mR¹¹、-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}、-N(R^{12a})R^{12b}、-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=O)OR¹¹、-C(=O)R²⁰、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R¹⁰がシクロアルキル基またはヘテロ環式環に結合している場合、R¹⁰は、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニルおよびベンジル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から追加的に選択されてもよく、

基-C(=O)R¹⁰、-C(=S)R¹⁰、-C(=NR^{12a})R¹⁰および-N(R^{12a})C(=O)R¹⁰において、R¹⁰は、水素、ハロゲン、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニルおよびベンジル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)から追加的に選択されてもよい、

あるいは2つのジェミナル結合した基R¹⁰が一緒になって、=CR¹⁶R¹⁷、=S(O)_mR¹¹、=S(O)_mN(R^{12a})R^{12b}、=NR^{12a}、=NOR¹¹および=NN(R^{12a})R^{12b}から選択される基を形成するか、

あるいは2つの基R¹⁰は、これらが結合している炭素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6、7もしくは8員の飽和したまたは部分的に不飽和の炭素環式またはヘテロ環式環を形成し、

各R¹¹は、独立して、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ、C₁~C₆-アルキルスルフィニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆-アルキルスルホニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルホニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、-Si(R¹⁴)₂R¹⁵、-SR²³、-S(O)_mR²³、-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}、-N(R^{12a})R^{12b}、-N=CR¹⁸R¹⁹、-C(=O)R²⁰、-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=O)OR²³、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択されるが、

ただし、R¹¹が酸素原子と結合している場合、R¹¹は、C₁~C₆-アルコキシまたはC₁~C₆-ハロアルコキシではないことを条件とし、

R^{12a}、R^{12b}は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ(最後に述べた4つの基の中のアルキル部分は、1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₃~C₈-シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル(このシクロアルキル部分は、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₂~C₆-アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₂~C₆-アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、-N(R

10

20

30

40

50

$^{24})R^{25}$; $-N(R^{24})C(=O)R^{20}$; $-Si(R^{14})_2R^{15}$; $-OR^{23}$; $-SR^{23}$; $-S(O)_mR^{23}$; $-S(O)_nN(R^{24})R^{25}$; $-C(=O)R^{20}$; $-C(=O)OR^{23}$; $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$; $-C(=S)R^{20}$; $-C(=S)OR^{23}$; $-C(=S)N(R^{24})R^{25}$; $-C(=NR^{24})R^{20}$; $-S(O)_mR^{23}$; $-S(O)_nN(R^{24})R^{25}$; フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい); ベンジル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは R^{12a} および R^{12b} は、一緒になって、基 $=CR^{16}R^{17}$ を形成するか、

あるいは R^{12a} および R^{12b} は、これらが結合している窒素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1または2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環を形成してもよく、このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよく、

各 R^{13} は、独立して、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_1\sim C_{10}$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_2\sim C_{10}$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_2\sim C_{10}$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、 $-OR^{23}$ 、 $-OS(O)_nR^{23}$ 、 $-SR^{23}$ 、 $-S(O)_mR^{23}$ 、 $-S(O)_nN(R^{24})R^{25}$ 、 $-N(R^{24})R^{25}$ 、 $C(=O)R^{20}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、 $-C(=NR^{24})R^{20}$ 、 $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=S)N(R^{24})R^{25}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい); ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和または不飽和のヘテロ環式環(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは、隣接する原子上で結合している2つの基 R^{13} が一緒になって、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-N=CH-N=CH-$ 、 $-OCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH=CHO-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2C(=O)O-$ 、 $-C(=O)OCH_2-$ 、 $-O(CH_2)O-$ 、 $-SCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-SCH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2SCH_2CH_2-$ 、 $-SCH_2CH_2S-$ 、 $-SCH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH=CHS-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2C(=S)S-$ 、 $-C(=S)SCH_2-$ 、 $-S(CH_2)S-$ 、 $-CH_2CH_2NR^{24}-$ 、 $-CH_2CH=N-$ 、 $-CH=CH-NR^{24}-$ 、 $-OCH=N-$ および $-SCH=N-$ 、から選択される基を形成し、したがって、これらが結合している原子と一緒に、5または6員の環(上記の基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシおよびハロメトキシから選択される1つ以上の置換基で置き換えられていてもよいし、または上記の基の1つ以上の CH_2 基は、 $C=O$ 基で置き換えられていてもよい)を形成し、

R^{14} 、 R^{15} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_3\sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ- $C_1\sim C_4$ -アルキル、フェニルおよびベンジルからなる群から選択され、

R^{16} 、 R^{17} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2\sim C_6$ -アルケニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ -アルキニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシ- $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $-C(=O)R^{20}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、 $-C(=NR^{24})R^{20}$ 、 $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=S)N(R^{24})R^{25}$ 、フェニル(1、2、3、4、または5つの基 R^{13} で置換されて

10

20

30

40

50

いてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R¹⁸、R¹⁹は、互いに独立しておよび各出現から独立して、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルコキシ-C₁~C₆-アルキル、フェニル(1、2、3、4、または5つの基R¹³で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

各R²⁰は、独立して、水素、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルコキシ-C₁~C₆-アルキル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

各R²¹は、独立してR²のように定義され、

各R²²は、独立して、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、SF₅、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、-Si(R¹⁴)₂R¹⁵、-OR²³、-OSO₂R²³、-SR²³、-S(O)_mR²³、-S(O)_nN(R²⁴)R²⁵、-N(R²⁴)R²⁵、-C(=O)N(R²⁴)R²⁵、-C(=S)N(R²⁴)R²⁵、-C(=O)OR²³、-C(=O)R²³、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R²²がシクロアルキル基に結合している場合、R²²は、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニルおよびC₂~C₆-ハロアルキニルからなる群から追加的に選択されてもよい、

あるいは2つのジェミナル結合した基R²²が一緒になって、=S(O)_mR²³、=S(O)_mN(R²⁴)R²⁵、=NR²⁴、=NOR²³および=NN(R²⁴)R²⁵から選択される基を形成するか、あるいは2つの基R²²が、これらが結合している炭素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6、7または8員の飽和したまたは部分的に不飽和の炭素環式またはヘテロ環式環を形成し、

各R²³は、独立して、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ

、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{15}$ 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノスルホニル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ、ジ- $(C_1 \sim C_6$ -アルキル)-アミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノカルボニル、ジ- $(C_1 \sim C_6$ -アルキル)-アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択されるが、

ただし、 R^{23} が酸素原子と結合している場合、 R^{23} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシまたは $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシではないことを条件とし、

R^{24} および R^{25} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは、 R^{24} および R^{25} は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい)を形成してもよく、このヘテロ環式環は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよく、

各mは、独立して1または2であり、

各nは、独立して0、1または2であり、

pは0、1、2、3または4であり、

rは0、1、2、3、または4であり、

WはOまたはSであり、

XはOまたはSであり、

YはOまたはSであり、

ZはO、 NR^{12a} または $\text{S}(\text{O})_n$ である)

の化合物、またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシド。

【請求項 2】

W、XおよびYが0である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

pが1、2または3、好ましくは2である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

rが0、1、または2、好ましくは1である、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

B¹がNである、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

各R¹が、独立して、ハロゲン、シアノおよびC₁～C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)から選択される、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

【請求項 7】

R²が、水素またはC₁～C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)、好ましくは水素である、請求項 1 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

R³が、水素、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)、好ましくはハロゲンまたはC₁～C₄-ハロアルキルである、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

20

【請求項 9】

R³が水素でない、請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

各R⁴が、独立して、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)、好ましくはハロゲンである、請求項 1 ～ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

R⁵が水素またはC₁～C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)、好ましくは水素である、請求項 1 ～ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

30

【請求項 12】

R⁶およびR⁷が、互いに独立して、水素、ハロゲンおよびC₁～C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)から選択され、好ましくは水素またはC₁～C₄-アルキルである、請求項 1 ～ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 13】

R⁸およびR⁹が、互いに独立して、水素、C₁～C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-アルキニル、C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-ハロアルコキシ、-C(=O)R¹⁰、-C(=O)OR¹¹、-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}、およびフェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、または、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1もしくは2個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、5または6員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₁～C₆-アルコキシおよびC₁～C₆-ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)である、請求項 1 ～ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

40

【請求項 14】

50

R^8 および R^9 が、互いに独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ -シクロアルキルにより置換された $C_1\sim C_4$ -アルキル、フェニルにより置換された $C_1\sim C_2$ -アルキル、 $C_2\sim C_4$ -アルケニル、 $C_2\sim C_4$ -アルキニル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、およびフェニルからなる群から選択されるか；または、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、5または6員の飽和したヘテロ環式環（このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい）である、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

10

R^8 および R^9 は、互いに独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキルおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルからなる群から選択される、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

ZがOである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項17】

Zが NR^{12a} である、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項18】

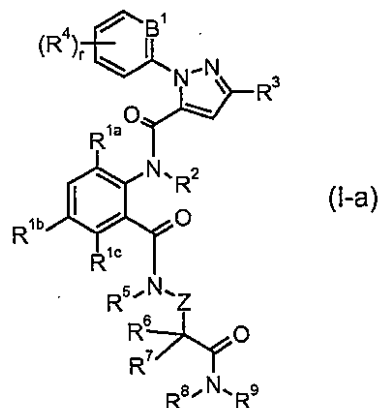
R^{12a} が水素または $C_1\sim C_6$ -アルキル（部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい）、好ましくは水素である、請求項17に記載の化合物。

20

【請求項19】

化合物が一般式(I-a)

【化2】



30

[式中、

R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、水素および R^1 に対して定義される基から選択され；

B^1 、Z、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 およびrは、請求項1～18のいずれかに定義される通りである]

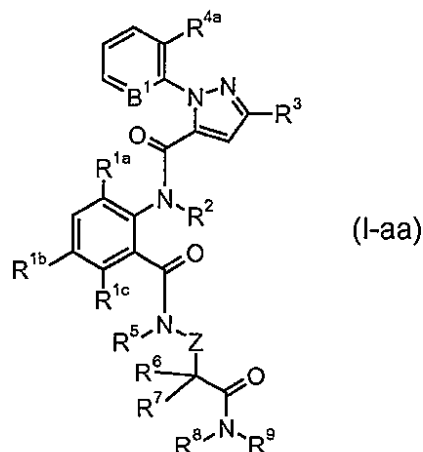
で表される、請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項20】

40

化合物が一般式(I-aa)

【化 3】



10

[式中、

R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、水素および R^1 に対して定義される基から選択され；

R^{4a} は、水素および R^4 に対して定義される基から選択され；

B^1 、 Z 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 は、請求項 1 ～ 19 のいずれかに定義される通りである]

で表される、請求項 19 に記載の化合物。

20

【請求項 21】

B^1 がNであり、 R^{1c} 、 R^2 、 R^5 および R^7 がHであり、 R^{4a} がClであり、 Z 、 R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^3 、 R^6 、 R^8 および R^9 が以下の意味を有する、請求項 20 に記載の式(I-aa)の化合物：

- Z がOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が $C H_3$ であり、 R^9 が CH_3 である；または

- Z がOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が $C H_3$ であり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が $C H_2CH_3$ であり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が $(CH_3)_3$ であり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がCNであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が $C H_3$ であり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がFであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が $C H(CH_3)_2$ であり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がBrであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 がHである；または

- Z がNHであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 がベンジルであり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がBrであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 が CH_3 である；または

- Z がOであり、 R^{1a} がClであり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 がベンジルであり、 R^9 がHである；または

- Z がOであり、 R^{1a} がClであり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 が CH_3 であり、 R^8 が

50

- Zが0であり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がCH₃であり、R⁸がI₂であり、R⁹がCH₃である；または

- ZがOであり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がFであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がフェニルであり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がCH₂CH₃であり、R⁷がCH₃であり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がCNであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がC(CH₃)-シクロプロピルであり、R⁹がHである；または

- Zが0であり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がCH(CH₃)₂であり、R⁸がCH₃であり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸およびR⁹が一緒に-CH₂CH₂OCH₂CH₂-を形成する；または

- ZがOであり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がFであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がCH₃であり、R⁹がCH₂CH₂である；または

- ZがOであり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がFであり、R³がBrであり、R⁶がCH₃であり、R⁸がHであり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がFであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸およびR⁹と一緒に-CH₂CH₂OCH₂CH₂-を形成する；または

- Zが0であり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がCNであり、R³がBrであり、R⁶がCH(CH₃)₂であり、R⁸がCH₂であり、R⁹がCH₂である；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がフェニルであり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がC H₂-CH=CH₂であり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がCNであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がフェニルであり、R⁹がHである；または

- Zが0であり、R^{1a}がClであり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がCH
(CH₃)₂であり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がCNであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がベンジルであり、R⁹がHである；または

- Zが0であり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がフェニルであり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がC₆H₅、CH₂、CH₃であり、R⁹がHである；または

- ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がCNであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がC H₂-CH=CH₂であり、R⁹がCH₂-CH=CH₂である；または

ZがOであり、R^{1a}がCH₃であり、R^{1b}がCNであり、R³がBrであり、R⁶がHであり、R⁸がC 50

- ZがOであり、R^{1a}がBrであり、R^{1b}がClであり、R³がBrであり、R⁶がCH(CH₃)₂であり 50

、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 がHである；または

- ZがOであり、 R^{1a} がClであり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 が CH_3 である；または

- ZがOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が $H_2-C\equiv CH$ であり、 R^9 がHである；または

- ZがOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 および R^9 が一緒に $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ を形成する；または

- ZがOであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 が CH_3 であり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 が CH_3 である；または

- ZがOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がFであり、 R^3 がBrであり、 R^6 が CH_2CH_3 であり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 がHである；または

- ZがOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 が CH_2CH_3 であり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 が CH_3 である；または

- ZがOであり、 R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がFであり、 R^3 がBrであり、 R^6 が CH_2CH_3 であり、 R^8 がHであり、 R^9 がHである；または

- ZがNHであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 が CH_3 である；または

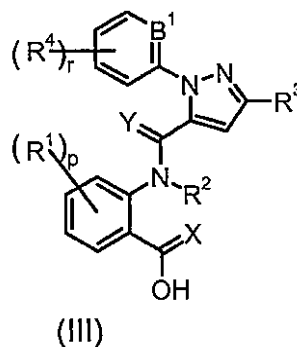
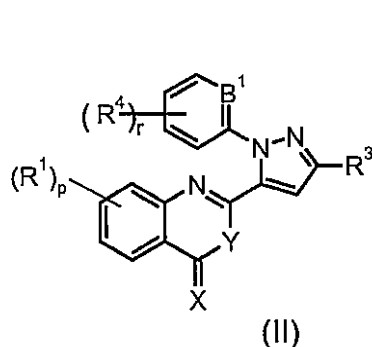
- ZがNHであり、 R^{1a} が CH_3 であり、 R^{1b} がClであり、 R^3 がBrであり、 R^6 がHであり、 R^8 が CH_3 であり、 R^9 がHである。

【請求項 22】

式(I)の化合物を製造する方法であって、以下のステップ：

式(II)または式(III)

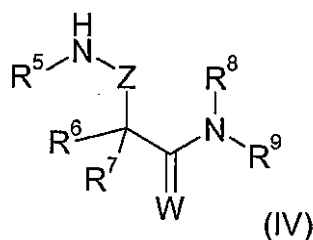
【化 4】



[式中、 B^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X 、 Y 、 p および r は、請求項 1～21 のいずれかに定義される通りである]

の化合物と式IV

【化 5】



[式中、 Z 、 W 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 は、請求項 1～21 のいずれかに定義される通りである]

の化合物を反応させるステップ、ここで、化合物(II)の反応の場合、 R^2 が水素である式(I)の化合物が得られる；および所望により、

R^2 が水素である化合物(I)を R^2-Z' [式中、 R^2 は水素ではなく、 Z' は脱離基である]と反応させるステップ

10

20

30

40

50

を含む、上記方法。

【請求項 2 3】

少なくとも1種の請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、農業上もしくは獣医学的に許容される塩、互変異性体またはN-オキシドと、少なくとも1種の液体および/または固体担体とを含む農業用または獣医学的組成物。

【請求項 2 4】

昆虫、クモまたは線虫の群の有害無脊椎動物を駆除または防除するための方法であって、有害生物またはその食物供給、生息地または繁殖地を、少なくとも1種の請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシド、または請求項 2 3 に記載される組成物の殺有害生物有効量に接触させることを含む、上記方法。

10

【請求項 2 5】

昆虫、クモまたは線虫の群の有害無脊椎動物による攻撃または侵襲から成長している植物を保護するための方法であって、植物またはこの植物が成長しているもしくは成長し得る土壌もしくは水を、少なくとも1種の請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシド、または請求項 2 3 に記載される組成物の殺有害生物有効量に接触させることを含む、上記方法。

【請求項 2 6】

種子を土壌昆虫から保護するため、および苗木の根および苗条を土壌昆虫および葉面昆虫から保護するための方法であって、播種前および/または前発芽後に、種子を少なくとも1種の請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシド、または請求項 2 3 に記載される組成物と接触させることを含む、上記方法。

20

【請求項 2 7】

請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシドを、植物繁殖材料100kg当たり0.1g～10kgの量で含む種子。

【請求項 2 8】

昆虫、クモまたは線虫の群の有害無脊椎動物を駆除または防除するための、請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシド、または請求項 2 3 に記載される組成物の使用。

30

【請求項 2 9】

昆虫、クモまたは線虫の群の有害無脊椎動物による攻撃または侵襲から、成長している植物を保護するための、請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシド、または請求項 2 3 に記載される組成物の使用。

【請求項 3 0】

動物の体内および体上の無脊椎寄生生物を駆除または防除するための、請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシド、または請求項 2 3 に記載される組成物の使用。

【請求項 3 1】

寄生生物に侵襲されたもしくはこれらに感染した動物を処置するための、または動物が寄生生物に侵襲されるもしくはこれらに感染するのを予防するための、または寄生生物の侵襲もしくは感染から動物を保護するための方法であって、請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシド、または請求項 2 3 に記載される組成物の殺寄生生物有効量を動物に経口的に、局所的または非経口的に投与するまたは適用することを含む、上記方法。

40

【請求項 3 2】

医薬として使用するための、請求項 1～2 1 のいずれか 1 項に記載される化合物、またはその立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシド。

【請求項 3 3】

50

寄生生物の侵襲もしくは感染に対する動物の処置、防除、予防または保護において使用するための、請求項1～21のいずれか1項に記載される化合物、またはその立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシド。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、置換カルバモイルメトキシベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミド化合物ならびにその立体異性体、塩、互変異性体およびN-オキシド、ならびにこれを含む組成物に関する。本発明はまた、有害無脊椎動物を駆除するための、カルバモイルメトキシベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミド化合物、またはこの

10

【背景技術】

【0002】

有害無脊椎動物、特に節足動物および線虫は、成長している作物および収穫した作物を破壊し、木造住宅および商業用建造物を攻撃し、食物供給および所有物に大きな経済的損失を引き起こす。多数の殺有害生物性薬剤が知られているが、標的有害生物は前記薬剤に対する抵抗性を生み出す能力があるため、有害無脊椎動物、特に昆虫、クモおよび線虫を駆除するための新規薬剤に対する必要性が継続して存在する。

【0003】

20

特定の置換カルバモイルメトキシカルバモイルメチルアミノベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミド化合物は、例えば、WO 2009/089680、WO 2005/054179、EP 133155、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2010年)、20巻(2号)、665～672頁およびJournal of Organic Chemistry (2001年)、66巻(22号)、7303～7312頁においてこれまでに開示されている。アリアルピラゾールアントラニル酸ジアミドおよびこれらの殺虫剤としての使用は、2006年日本国神戸におけるIUPAC農薬会議(IUPAC pesticides conference)において提示された。しかし、本発明のような特徴的な置換パターンを有する化合物は未だ記載されていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

30

【0004】

【特許文献1】WO 2009/089680

【特許文献2】WO 2005/054179

【特許文献3】EP 133155

【非特許文献】

【0005】

【非特許文献1】Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2010年)、20巻(2号)、665～672頁

【非特許文献2】Journal of Organic Chemistry (2001年)、66巻(22号)、7303～7312頁

【発明の概要】

40

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

したがって本発明の目的は、良好な殺有害生物活性、特に殺虫活性を有し、多数の異なる有害無脊椎動物、特に、防除するのが困難な有害節足動物および/または線虫に対する幅広い活性スペクトルを示す化合物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0007】

これらの目的は、以下の式Iのカルバモイルメトキシベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミドおよびカルバモイルメチルアミノベンズアミド化合物、これらの立体異性体およびこれらの塩、特にこれらの農業上または獣医学的に許容される塩により

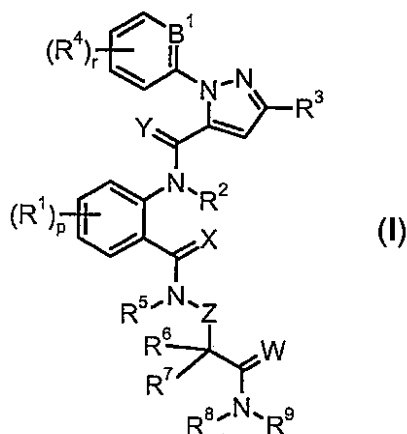
50

達成することができることが判明した。

【0008】

したがって、第1の態様では、本発明は、式(I)の化合物であるカルバモイルメトキシベンズアミドおよびカルバモイルメチルチオベンズアミドおよびカルバモイルメチルアミノベンズアミド化合物またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシドに関する。

【化1】



10

【0009】

20

(式中、

B¹は、NまたはCHであり、

各R¹は、独立して、ハロゲン；シアノ；アジド；ニトロ；-SCN；SF₅；C₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)；C₃~C₈-シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)；C₂~C₆-アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)；C₂~C₆-アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)；-Si(R¹⁴)₂R¹⁵；-OR¹¹；-OS(O)_nR¹¹；-SR¹¹；-S(O)_mR¹¹；-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}；-N(R^{12a})R^{12b}；-N(R^{12a})C(=O)R¹⁰；-C(=O)R¹⁰；-C(=S)R¹⁰；-C(=O)OR¹¹；-C(=S)OR¹¹；-C(=NR^{12a})R¹⁰；-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}；-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}；フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

30

あるいは、隣接する炭素原子上で結合している2つの基R¹が、一緒になって、-CH₂CH₂CH₂CH₂-、-CH=CH-CH=CH-、-N=CH-CH=CH-、-CH=N-CH=CH-、-N=CH-N=CH-、-OCH₂CH₂CH₂-、-OCH=CHCH₂-、-CH₂OCH₂CH₂-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂OCH₂-、-CH₂CH₂CH₂-、-CH=CHCH₂-、-CH₂CH₂O-、-CH=CHO-、-CH₂OCH₂-、-CH₂C(=O)O-、-C(=O)OCH₂-、-O(CH₂)O-、-SCH₂CH₂CH₂-、-SCH=C

40

HCH₂-、-CH₂SCH₂CH₂-、-SCH₂CH₂S-、-SCH₂SCH₂-、-CH₂CH₂S-、-CH=CHS-、-CH₂SCH₂-、-CH₂C(=S)S-、-C(=S)SCH₂-、-S(CH₂)S-、-CH₂CH₂NR²¹-、-CH₂CH=N-、-CH=CH-NR²¹-、-OCH=N-および-SCH=N-、から選択される基であってよく、したがって、これらが結合している炭素原子と一緒に、5または6員の環を形成し、上記基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシおよびハロメトキシから選択される1つ以上の置換基で置き換えられていてもよい、または上記基の1つ以上のCH₂基は、C=O基で置き換えられていてもよく；

50

換されていてもよい)； $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)； $-N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-Si(R^{14})_2R^{15}$ ； $-OR^{11}$ ； $-SR^{11}$ ； $-S(O)_mR^{11}$ ； $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$ ； $-C(=O)R^{10}$ ； $-C(=O)OR^{11}$ ； $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-C(=S)R^{10}$ ； $-C(=S)OR^{11}$ ； $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-C(=NR^{12a})R^{10}$ ；フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)；および環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

10

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-OS(O)_nR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(O)_mR^{11}$ 、 $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、 $-C(=S)R^{10}$ 、 $-C(=S)OR^{11}$ 、 $-C(=NR^{12a})R^{10}$ 、 $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

20

各 R^4 は、独立して、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(O)_mR^{11}$ 、 $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-N(R^{12a})C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、 $-C(=S)R^{10}$ 、 $-C(=S)OR^{11}$ 、 $-C(=NR^{12a})R^{10}$ 、 $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ 、 $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

30

R^5 は、水素；シアノ； $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)； $-N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-Si(R^{14})_2R^{15}$ ； $-OR^{11}$ ； $-SR^{11}$ ； $-S(O)_mR^{11}$ ； $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$ ； $-C(=O)R^{10}$ ； $-C(=O)OR^{11}$ ； $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-C(=S)R^{10}$ ； $-C(=S)OR^{11}$ ； $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-C(=NR^{12a})R^{10}$ ；フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13}

40

50

で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R^6 、 R^7 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-\text{SCN}$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルキニル(上述の脂肪族および脂環式の基は、それぞれ独立して、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1、2、3、4、5、6、7、8、9もしくは10の置換基 R^{10} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{10} は、複数の置換基 R^{10} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{12a})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{12a})\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{15}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、ならびに3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(前記ヘテロ環式環は、酸素、窒素および硫黄原子からなる群から独立して選択される、1、2または3個のヘテロ原子を含み、1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なり、前記窒素および硫黄原子は、互いに独立して、酸化されていてもよい)からなる群から選択されるか、

10

あるいは、 R^6 および R^7 は、一緒になって、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルキレンまたは $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルケニレン鎖であり、これらが結合している炭素原子と一緒に、3、4、5、6、7、または8員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和の環を形成し、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルキレン鎖の中の CH_2 基のいずれかのうちの1、2、3もしくは4つ、または $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルケニレン鎖の中の CH_2 もしくは CH 基のいずれかのうちの1、2、3もしくは4つは、O、S、NおよびNHからなる群から独立して選択される1、2、3もしくは4つの基で置き換えられていてもよく、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルキレンまたは $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルケニレン鎖の中の炭素および/または窒素原子は、ハロゲン、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -ハロアルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -ハロアルキルチオ、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -ハロシクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -ハロアルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -ハロアルキニルおよびフェニル(1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)からなる群から独立して選択される1、2、3、4または5つの置換基で置換されていてもよく、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルキレン、 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルケニレンまたは $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ -アルキニレン鎖の中の硫黄および窒素原子は、互いに独立して、酸化されていてもよい、あるいは R^6 および R^7 は、一緒になって、 $=\text{O}$ 、 $=\text{S}$ 、 $=\text{NR}^{12a}$ 、 $=\text{NOR}^{11}$ 、または $=\text{CR}^{16}\text{R}^{17}$ 基を形成し、

20

30

R^8 、 R^9 は、互いに独立して、水素、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ -アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -シクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_{10}$ -アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_{10}$ -アルキニル(上述の脂肪族および脂環式の基は、それぞれ独立して、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1、2、3、4、5、6、7、8、9もしくは10の置換基 R^{10} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{10} は、複数の置換基 R^{10} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^{13}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{12a})\text{R}^{13}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{12a})\text{NR}^{12a}\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{15}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{13} は、複数の置換基 R^{13} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なる)、ならびに3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(前記ヘテロ環式環は、酸素、窒素および硫黄原子からなる群から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含み、1、2、3、4または5つの置換基 R^{21} で置換されていてもよく、前記置換基 R^{21} は、複数の置換基 R^{21} が存在する場合、互いに同じであるかまたは異なり、前記窒素および硫黄原子は、互いに独立して、酸化されていてもよい)からなる群から選択されるか、

40

あるいは R^8 および R^9 は、これらが結合している窒素原子と一緒に、3、4、5、6、7または8員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(環員として、

50

N、O、S、NO、SO、SO₂、C(=O)およびC(=S)から選択される、1、2、3または4つのさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい)を形成し、このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよく、

あるいはR⁸およびR⁸は、一緒になって、=CR¹⁶R¹⁷、=S(O)_nR¹¹、=S(O)_nNR^{12a}R^{12b}、=NR^{12a}または=NOR¹¹基を形成してもよく、

各R¹⁰は、独立して、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、SF₅、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、-Si(R¹⁴)₂R¹⁵、-OR¹¹、-OSO₂R¹¹、-SR¹¹、-S(O)_mR¹¹、-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}、-N(R^{12a})R^{12b}、-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=O)OR¹¹、-C(=O)R²⁰、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R¹⁰がシクロアルキル基またはヘテロ環式環に結合している場合、R¹⁰は、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニルおよびベンジル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から追加的に選択されてもよく、

基-C(=O)R¹⁰、-C(=S)R¹⁰、-C(=NR^{12a})R¹⁰および-N(R^{12a})C(=O)R¹⁰において、R¹⁰は、水素、ハロゲン、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニルおよびベンジル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)から追加的に選択されてもよい、

あるいは2つのジェミナル結合した基R¹⁰が一緒になって、=CR¹⁶R¹⁷、=S(O)_mR¹¹、=S(O)_mN(R^{12a})R^{12b}、=NR^{12a}、=NOR¹¹および=NN(R^{12a})R^{12b}から選択される基を形成するか、

あるいは2つの基R¹⁰は、これらが結合している炭素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6、7もしくは8員の飽和したまたは部分的に不飽和の炭素環式またはヘテロ環式環を形成し、

各R¹¹は、独立して、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ、C₁~C₆-アルキルスルフィニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆-アルキルスルホニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルホニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、-Si(R¹⁴)₂R¹⁵、-SR²³、-S(O)_mR²³、-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}、-N(R^{12a})R^{12b}、-N=CR¹⁸R¹⁹、-C(=O)R²⁰、-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}、-C(=O)OR²³、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択されるが、

ただし、R¹¹が酸素原子と結合している場合、R¹¹は、C₁~C₆-アルコキシまたはC₁~C₆-ハロアルコキシではないことを条件とし、

R^{12a}、R^{12b}は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ(最後に述べた4つの基の中のアルキル部分は、1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₃~C₈-シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル(このシクロアルキル部分は、部分的もしくは完全にハ

10

20

30

40

50

ロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $-N(R^{24})R^{25}$; $-N(R^{24})C(=O)R^{20}$; $-\text{Si}(R^{14})_2R^{15}$; $-\text{OR}^{23}$; $-\text{SR}^{23}$; $-\text{S}(\text{O})_mR^{23}$; $-\text{S}(\text{O})_nN(R^{24})R^{25}$; $-\text{C}(=\text{O})R^{20}$; $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{23}$; $-\text{C}(=\text{O})N(R^{24})R^{25}$; $-\text{C}(=\text{S})R^{20}$; $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^{23}$; $-\text{C}(=\text{S})N(R^{24})R^{25}$; $-\text{C}(=\text{NR}^{24})R^{20}$; $-\text{S}(\text{O})_mR^{23}$; $-\text{S}(\text{O})_nN(R^{24})R^{25}$; フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい); ベンジル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

10

あるいは R^{12a} および R^{12b} は、一緒になって、基 $=\text{CR}^{16}\text{R}^{17}$ を形成するか、

あるいは R^{12a} および R^{12b} は、これらが結合している窒素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1または2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環を形成してもよく、このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよく、

各 R^{13} は、独立して、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-\text{SCN}$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $-\text{Si}(R^{14})_2R^{15}$ 、 $-\text{OR}^{23}$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_nR^{23}$ 、 $-\text{SR}^{23}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_mR^{23}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_nN(R^{24})R^{25}$ 、 $-N(R^{24})R^{25}$ 、 $\text{C}(=\text{O})R^{20}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{23}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{24})R^{20}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})N(R^{24})R^{25}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})N(R^{24})R^{25}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい); ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和または不飽和のヘテロ環式環(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

20

30

あるいは、隣接する原子上で結合している2つの基 R^{13} が一緒になって、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{N}-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CH}-\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CHCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHO}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)\text{O}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CHCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHS}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{S}-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^{24}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{NR}^{24}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ および $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、から選択される基を形成し、したがって、これらが結合している原子と一緒に、5または6員の環(上記の基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシおよびハロメトキシから選択される1つ以上の置換基で置き換えられていてもよいし、または上記の基の1つ以上の CH_2 基は、 $\text{C}=\text{O}$ 基で置き換えられていてもよい)を形成し、

40

R^{14} 、 R^{15} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニルおよびベンジルからなる群から選択され、

R^{16} 、 R^{17} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アル

50

キニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $-C(=O)R^{20}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、 $-C(=NR^{24})R^{20}$ 、 $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=S)N(R^{24})R^{25}$ 、フェニル(1、2、3、4、または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R^{18} 、 R^{19} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フェニル(1、2、3、4、または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

各 R^{20} は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

各 R^{21} は、独立して R^2 のように定義され、

各 R^{22} は、独立して、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-Si(R^{14})_2R^{15}$ 、 $-OR^{23}$ 、 $-OSO_2R^{23}$ 、 $-SR^{23}$ 、 $-S(O)_mR^{23}$ 、 $-S(O)_nN(R^{24})R^{25}$ 、 $-N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=S)N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、 $-C(=O)R^{23}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

R^{22} がシクロアルキル基に結合している場合、 R^{22} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニルおよび $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニルからなる群から追加的に選択されてもよい、

あるいは2つのジェミナル結合した基 R^{22} が一緒になって、 $=S(O)_mR^{23}$ 、 $=S(O)_mN(R^{24})R^{25}$ 、 $=NR^{24}$ 、 $=NOR^{23}$ および $=NN(R^{24})R^{25}$ から選択される基を形成するか、

あるいは2つの基 R^{22} が、これらが結合している炭素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基

10

20

30

40

50

を含有する、3、4、5、6、7または8員の飽和したまたは部分的に不飽和の炭素環式またはヘテロ環式環を形成し、

各 R^{23} は、独立して、水素、シアノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ -アルキルスホニル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルスホニル、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_3\sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ -アルケニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ -アルキニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルキニル、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{15}$ 、 $C_1\sim C_6$ -アルキルアミノスルホニル、アミノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキルアミノ、ジ- $(C_1\sim C_6$ -アルキル)-アミノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $C_1\sim C_6$ -アルキルアミノカルボニル、ジ- $(C_1\sim C_6$ -アルキル)-アミノカルボニル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択されるが、

ただし、 R^{23} が酸素原子と結合している場合、 R^{23} は、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシまたは $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシではないことを条件とし、

R^{24} および R^{25} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_2\sim C_6$ -アルケニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ -アルキニル、 $C_2\sim C_6$ -ハロアルキニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは、 R^{24} および R^{25} は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい)を形成してもよく、このヘテロ環式環は、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよく、

各mは、独立して1または2であり、

各nは、独立して0、1または2であり、

pは0、1、2、3または4であり、

rは0、1、2、3、または4であり、

WはOまたはSであり、

10

20

30

40

50

XはOまたはSであり、
YはOまたはSであり、
ZはO、 NR^{12a} または $\text{S}(\text{O})_n$ である)。

【0010】

さらに、本発明は、本発明による化合物の合成のための方法および式(I)の化合物の合成のための中間体化合物に関する。

【0011】

本発明の化合物、すなわち式(I)の化合物、これらの立体異性体、これらの塩、これらの互変異性体またはこれらのN-オキシドは、特に、有害無脊椎動物を防除すること、特に、節足動物および線虫、および特に昆虫を防除することに対して有用である。したがって、本発明はまた、有害無脊椎動物、特に、昆虫、クモまたは線虫のグループの有害無脊椎動物を駆除または防除するための本発明の化合物の使用にも関する。

10

【発明を実施するための形態】

【0012】

「本発明による化合物」という用語は、本明細書で定義されたような化合物(複数可)ならびにその立体異性体、塩、互変異性体またはN-オキシドを含む。「本発明の化合物」という用語は、「本発明による化合物」という用語と等しいと理解されるべきであり、したがってその立体異性体、塩、互変異性体またはN-オキシドも含む。

【0013】

「本発明による組成物」または「本発明の組成物」という用語は、少なくとも1種の、上で定義されたような本発明による化合物を含む組成物(複数可)を含む。

20

【0014】

本発明はまた、その立体異性体、塩、互変異性体またはN-オキシドを含めた、少なくとも1種の本発明による化合物と、少なくとも1種の不活性な液体および/または固体担体とを含む組成物に関する。特に、本発明は、その立体異性体、農業上もしくは獣医学的に許容される塩、互変異性体またはN-オキシドを含めた少なくとも1種の本発明による化合物と、少なくとも1種の液体および/または固体担体とを含む、農業用または獣医学的組成物に関する。

【0015】

本発明はまた、有害無脊椎動物、特に昆虫、クモまたは線虫のグループの有害無脊椎動物を駆除または防除するための方法であって、前記有害生物またはその食物供給、生息地または繁殖地を、その立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた、少なくとも1種の本発明による化合物または本発明による組成物の殺有害生物有効量に接触させることを含む方法に関する。

30

【0016】

本発明はまた、有害無脊椎動物、特に昆虫、クモまたは線虫のグループの有害無脊椎動物による攻撃または侵襲から成長している植物を保護するための方法であって、植物またはこの植物が成長しているもしくは成長し得る土壌もしくは水を、その立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた、少なくとも1種の本発明による化合物または本発明による組成物の殺有害生物有効量に接触させることを含む方法に関する。

40

【0017】

本発明はまた、植物の繁殖物質、好ましくは種子を土壌昆虫から保護するため、および苗木の根および苗条を土壌昆虫および葉面昆虫から保護するための方法であって、播種前および/または前発芽(pregermination)後に、種子をその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた、少なくとも1種の本発明による化合物または本発明による組成物と接触させることを含む方法に関する。

【0018】

本発明はまた、その立体異性体、塩、互変異性体またはN-オキシドを含めた本発明による化合物を、好ましくは植物繁殖材料100kg当たり0.01g~10kgの量で含む、植物繁殖材料、好ましくは種子に関する。

50

【0019】

本発明はまた、昆虫、クモまたは線虫のグループの有害無脊椎動物を駆除または防除するための、その立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物または本発明による組成物の使用に関する。

【0020】

本発明はまた、昆虫、クモまたは線虫のグループの有害無脊椎動物による攻撃または侵襲から、成長している植物を保護するための、その立体異性体、塩もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物または本発明による組成物の使用に関する。

【0021】

本発明はまた、動物の体内および体の上の無脊椎寄生生物を駆除または防除するための、その立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物または本発明による組成物の使用、ならびに動物の体内および体の上の無脊椎寄生生物を駆除または防除するための医薬を調製するための、その立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物または本発明による組成物の使用に関する。

10

【0022】

本発明はまた、寄生生物に侵襲されたもしくはこれらに感染した動物を処置するための、または動物が寄生生物に侵襲されるもしくはこれらに感染するのを予防するための、または寄生生物の侵襲もしくは感染から動物を保護するための方法であって、その立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物または本発明による組成物の殺寄生生物有効量を動物に経口的に、局所的または非経口的に投与するまたは適用させることを含む方法に関する。

20

【0023】

本発明はまた、寄生生物の侵襲もしくは感染から動物を保護するための、または寄生生物が侵襲したもしくはこれらに感染した動物を処置するための医薬の製造のための、その立体異性体、獣医学的に許容される塩もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物または本発明による組成物の使用に関する。

【0024】

本発明はまた、寄生生物に侵襲されたもしくはこれらに感染した動物を処置するための、動物が寄生生物に感染するもしくは寄生生物に侵襲されるのを予防するための、または寄生生物による侵襲もしくは感染から動物を保護するための、その立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物を含む組成物の調製のための方法に関する。

30

【0025】

本発明はまた、医薬として使用するための、その立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体もしくはN-オキシドを含めた本発明による化合物に関する。

【0026】

本発明はまた、寄生生物による侵襲または感染に対する動物の処置、防除、予防または保護における使用のための、その立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体またはN-オキシドを含めた本発明による化合物に関する。

40

【0027】

置換パターンに応じて、式(I)の化合物は1つ以上のキラル中心を有することができ、この場合これらはエナンチオマーまたはジアステレオマーの混合物として存在する。本発明は、式(I)の化合物の純粋なエナンチオマーまたは純粋なジアステレオマーの両方、およびこれらの混合物、ならびに本発明による式(I)の化合物の純粋なエナンチオマーもしくは純粋なジアステレオマーまたはその混合物の使用を提供する。式(I)の適切な化合物はまた、すべての可能な幾何学立体異性体(シス/トランス異性体)およびこれらの混合物も含む。別の態様は、アミド部分の束縛回転によるアトロプ異性の存在であってよい(軸性キラリティーおよびアトロプ異性についての論文の総説については、例えばJ. Clayden、Tetrahedron 2004年、60巻、4335頁を参照し、ベンゼン-アミド結合の sp^2 - sp^2 軸に起因す

50

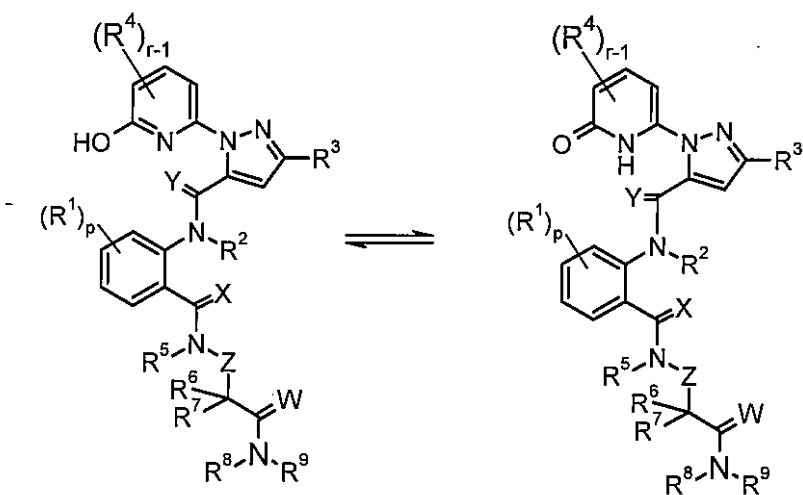
る軸性キラリティーについては、Y. Ishichiら、Tetrahedron 2004年、60巻、4481頁を参照されたい)。シス/トランス異性体は、アルケン、炭素-窒素二重結合、窒素-硫黄二重結合またはアミド基に対して存在し得る。「立体異性体」という用語は、両方の光学異性体、例えば、エナンチオマーまたはジアステレオマー(後者は、分子内のキラリティーの複数のセンターにより存在する)、ならびに幾何異性体(シス/トランス異性体)を包含する。

【0028】

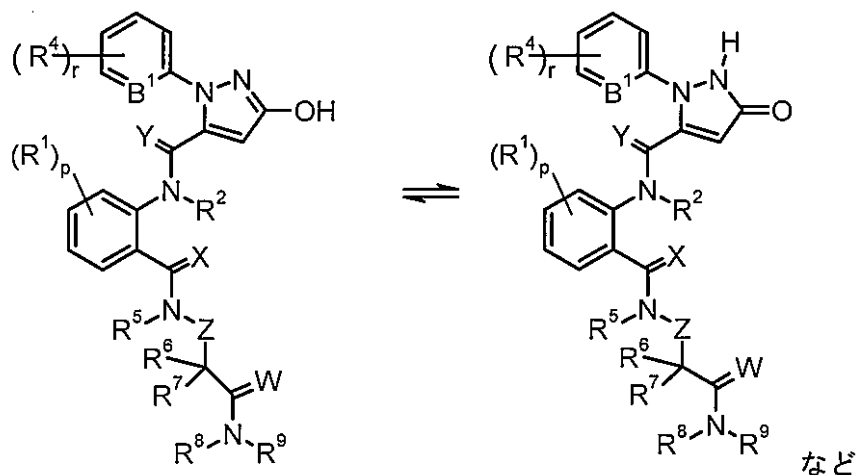
置換パターンに応じて、式(I)の化合物はこれらの互変異性体の形態で存在し得る。したがって本発明はまた、式(I)の互変異性体ならびに前記互変異性体の立体異性体、塩、互変異性体およびN-オキシドに関する。例えば、 R^4 が、 B^1 に近隣して結合しているOHであり、 B^1 がNである場合、または R^3 がOHである場合、化合物(I)は、以下の互変異性体の形態で存在し得る(2つの例示的互変異性体ペアだけ列挙している)

10

【化2】



20



30

など

40

【0029】

「N-オキシド」という用語は、N-オキシド部分に酸化した少なくとも1個の第三級窒素原子を有する任意の本発明の化合物を含む。N-オキシドは、 B^1 がNである化合物(I)において特に可能である。このような化合物のN-オキシドは、適切な酸化剤、例えば、ペルオキシカルボン酸または他のペルオキシドを用いて環窒素原子(複数可)を酸化させることによって調製することができる。

【0030】

本発明の化合物は、アモルファスであってもよいし、または異なる巨視的特性、例えば安定性などを有し得る、もしくは異なる生物学的特性、例えば活性などを示し得る、1種

50

以上の異なる結晶性状態(多形体)で存在してもよい。本発明は、式(I)のアモルファス性化合物ならびに結晶性化合物の両方、これらのエナンチオマーまたはジアステレオマー、式(I)のそれぞれの化合物の異なる結晶性状態の混合物、そのエナンチオマーまたはジアステレオマー、ならびにそのアモルファス性または結晶性の塩を含む。

【0031】

本発明の化合物の塩は、好ましくは農業上および獣医学的に許容される塩である。これらの塩は、従来通りの方法、例えば、本発明の化合物が塩基性官能基を有する場合、化合物を酸と反応させることによって、または本発明の化合物が酸性の官能基を有する場合、化合物を適切な塩基と反応させることによって形成することができる。

【0032】

適切な農業上許容される塩は特に、そのカチオンおよびアニオンがそれぞれ本発明による化合物の殺有害生物性作用にいかなる有害作用も起こさないようなカチオンの塩または酸の酸付加塩である。適切なカチオンは、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などのイオン、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などのイオン、ならびに遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛および鉄などのイオン、さらに、アンモニウム(NH_4^+)および置換アンモニウム(それらの水素原子のうち1~4個が、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -ヒドロキシアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキル、フェニルまたはベンジルで置き換えられている)である。置換アンモニウムイオンの例は、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($\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -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($\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキル)スルホキソニウムを含む。

【0033】

有用な酸付加塩のアニオンは、主に塩化物イオン、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 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -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。これらのアニオンは、本発明の化合物を、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によって、形成することができる。

【0034】

本発明の化合物の獣医学的に許容される塩は、獣医学的使用のための塩を形成することが当技術分野で知られており、認められているようなカチオンの塩または酸付加塩を包含する。例えば、塩基性窒素原子、例えばアミノ基を含有する本発明の化合物により形成される適切な酸付加塩として、無機酸との塩、例えば塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩、および硝酸塩、ならびに有機酸、例えば酢酸、マレイン酸などの塩、例えばマレイン酸、二マレイン酸、フマル酸の一酸塩または二酸塩、例えばフマル酸、二フマル酸、メタンスルフェン酸、メタンスルホン酸、およびコハク酸の一酸塩または二酸塩が挙げられる。

【0035】

「有害無脊椎動物」という用語は、本明細書で使用される場合、例えば植物を攻撃し、これによって、攻撃された植物にかなりの損傷を引き起こし得る昆虫およびクモ、ならびに線虫を含めた有害節足動物、ならびに動物、特に、例えば哺乳動物、もしくはトリなどの温血動物、または爬虫類、両生類もしくは魚などの他の高等動物を侵襲し、これによって、侵襲された動物にかなりの損傷を引き起こし得る外部寄生生物などの動物集団を包含する。

【0036】

「植物繁殖材料」という用語は、植物の増殖のために使用することができる、種子などの植物のすべての生殖部分ならびに挿し木および塊茎(例えばジャガイモ)などの生長力のある植物材料を意味すると理解されるべきである。これは、植物の種子、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎、苗条、芽および他の部分を含む。発芽後または土壌からの出芽後に移植すべき苗木および若木も含み得る。これらの植物繁殖材料は、定植もしくは移植時に、またはその前に、植物保護化合物で防止的に処理してもよい。

【0037】

「植物」という用語は、「非栽培植物」および特に「栽培植物」を含めたいかなる種類の植物も含む。

10

【0038】

「非栽培植物」という用語は、栽培植物の任意の野生型種または関連種または関連属を指す。

【0039】

「栽培植物」という用語は、品種改良、突然変異生成または遺伝子操作により改変された植物を含むと理解されるべきである。遺伝子組換え植物は、遺伝子材料が、組換えDNA技法の使用により改変された植物であり、よって自然環境下では、交雑育種、突然変異または自然組換えで容易に得ることはできない。典型的には、植物のある特性を改善するために、遺伝子改変された植物の遺伝子材料に1種以上の遺伝子が組み入れられている。このような遺伝子改変はまた、例えば、グリコシル化による、またはプレニル化、アセチル化もしくはファルネシル化した部分もしくはPEG部分などのポリマー付加によるタンパク質(複数可)(オリゴペプチドまたはポリペプチド)の標的化された翻訳後修飾(例えばBiotechnol Prog. 2001年、7月-8月; 17巻(4号): 720~8頁、Protein Eng Des Sel. 2004年1月; 17巻(1号): 57~66頁、Nat Protoc. 2007年; 2巻(5号): 1225~35頁、Curr Opin Chem Biol. 2006年10月; 10巻(5号): 487~91頁、Epub 2006年8月28日、Biomaterials. 2001年3月; 22巻(5号): 405~17頁、Bioconjug Chem. 2005年1月-2月; 16巻(1号): 113~21頁に開示されている)も含むが、これらに限定されない。

20

【0040】

「栽培植物」という用語は、品種改良または遺伝子操作の従来の方法の結果として、特定のクラスの除草剤、例えば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など(例えば、US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照されたい)またはイミダゾリノン(例えばUS 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照されたい); 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など(例えばWO 92/00377を参照されたい); 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など(例えばEP-A-0242236、EP-A-242246を参照されたい)またはオキシニル除草剤(例えばUS 5,559,024を参照されたい)などの適用に対する耐性を得た植物も含むと理解されるべきである。いくつかの栽培植物は、品種改良(突然変異生成)の従来の方法により除草剤に対する耐性を得ており、例えばClearfield(登録商標)夏ナタネ(アブラナ)は、イミダゾリノン、例えばイマザモクスに対して耐性がある。遺伝子操作方法は、ダイズ、綿、コーン、ビートおよびナタネなどの栽培植物が、グリホセートおよびグルホシネートなどの除草剤に対する耐性を得るように使用されており、その一部は、RoundupReady(登録商標)(グリホセート)およびLibertyLink(登録商標)(グルホシネート)という商標名で市販されている。

30

40

【0041】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用によって、1種以上の殺虫タンパク質、特に細菌属バシラス(Bacillus)から、特にバシラス・チューリングエンシス(Bacillus thuringiensis)から知られているもの、例えばa-エンドトキシン、例えばCryIA(b)、CryIA(

50

c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)またはCry9c；植物殺虫タンパク質(VIP)、例えばVIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A；例えばポトラブドゥス属の種(*Photorhabdus* spp.)またはクセノラブドゥス属の種(*Xenorhabdus* spp.)などの線虫にコロニー形をつくる細菌の殺虫タンパク質；動物により産生される毒素、例えばサソリ毒、クモ毒、スズメバチ毒、または他の昆虫に特異的な神経毒など；菌類により産生される毒素、例えばストレプトミケテス(*Streptomyces*)毒など、植物レクチン、例えばエンドウレクチンまたはオオムギレクチンなど；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、シスタチンまたはパパイン阻害剤など；リボソーム不活性化タンパク質(RIP)、例えばリシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリンまたはブリオジンなど；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-レダクターゼなど；イオンチャネル遮断剤、例えばナトリウムチャネル遮断剤またはカルシウムチャネル遮断剤など；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿剤ホルモン受容体(ヘリコキニン受容体)；スチルベンシントターゼ、ビベンジルシントターゼ、キチナーゼまたはグルカナーゼを合成することが可能な植物も含むと理解されるべきである。本発明との関連で、これらの殺虫タンパク質または毒素は、プレトキシン、ハイブリッドタンパク質、短縮タンパク質または他のやり方で修飾されたタンパク質としても同様に明確に理解されるべきである。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新規組合せにより特徴づけられる(例えばWO 02/015701を参照されたい)。このような毒素またはこのような毒素を合成することが可能な遺伝子改変植物のさらなる例は、例えば、EP-A374753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A427529、EP-A451878、WO 03/018810およびWO 03/052073に開示されている。このような遺伝子改変植物を生成するための方法は、当業者に一般的に知られており、例えば、上述された刊行物において記載されている。遺伝子改変植物内に含有されるこれらの殺虫タンパク質は、これらのタンパク質を生成する植物に、節足動物のある分類群からの有害な有害生物、特に甲虫(鞘翅目(*Coleoptera*))、双翅目の昆虫(双翅目(*Diptera*))、ならびにチョウおよびガ(鱗翅目(*Lepidoptera*))ならびに植物寄生線虫(線虫綱(*Nematoda*))に対して保護を与える。

【0042】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用により、細菌性、ウイルス性または菌類の病原菌に対するこれらの植物の抵抗性または耐性を増加させる1種以上のタンパク質を合成することが可能な植物も含むと理解されるべきである。このようなタンパク質の例は、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRタンパク質、例えばEP-A0392225を参照されたい)、植物疾患抵抗性遺伝子(例えば、メキシコ野生型ジャガイモ、ソラヌム・バルボカスタヌム(*Solanum bulbocastanum*)由来のフィトフトラ・インフェスタンス(*Phytophthora infestans*)に対して作用する抵抗性遺伝子を発現するジャガイモ品種)またはT4-リゾチーム(例えば、エルウィニア・アミルボラ(*Erwinia amylovora*)などの細菌に対する抵抗性が増加したこれらのタンパク質を合成することが可能なジャガイモ品種)である。このような遺伝子改変植物を生成するための方法は、当業者に一般的に知られており、例えば、上述された刊行物に記載されている。

【0043】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用により、これらの植物の生産性(例えばバイオマス生産、穀粒収量、澱粉含量、油含有量またはタンパク質含有量)、干ばつ、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菌類、細菌性もしくはウイルス性病原菌に対する耐性を増加させる1種以上のタンパク質を合成することが可能な植物も含むと理解されるべきである。

【0044】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用により、ヒトまたは動物栄養を特異的に改善するために、内容物の物質の改変量または内容物の新規物質を含有する植物、例えば、健康促進性の長鎖オメガ-3脂肪酸または不飽和オメガ-9脂肪酸を産生する油料作物

(例えばNexera(登録商標)ナタネ)も含むと理解されるべきである。

【0045】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用により、原料生産を特異的に改善するために、内容物の物質の改変量または内容物の新規物質を含有する植物、例えばアミロペクチンの増加量を産生するジャガイモ(例えばAmflora(登録商標)ジャガイモ)も含むと理解されるべきである。

【0046】

変数の上記定義に述べられている有機部分は、ハロゲンという用語のように、個々の基のメンバーの個々の列挙のための総称である。接頭語 $C_n \sim C_m$ は、いずれの場合も基の中の可能な炭素原子数を示す。

【0047】

ハロゲンという用語は、いずれの場合もフッ素、臭素、塩素またはヨウ素、特にフッ素、塩素または臭素を意味する。

【0048】

「部分的または完全にハロゲン化した」という用語は、所与の基の水素原子の1個以上、例えば1、2、3、4もしくは5個またはすべてが、ハロゲン原子、特にフッ素または塩素で置き換えられていることを意味するとみなされる。部分的または完全にハロゲン化した基は、以下で「ハロ基」とも呼ばれる。例えば、部分的または完全にハロゲン化したアルキルは、ハロアルキルとも呼ばれる。

【0049】

「アルキル」という用語(およびアルキル基を含む他の基のアルキル部分、例えばアルコキシ、アルキルカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニルおよびアルコキシアルキル)は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、普通1~10個の炭素原子、多くの場合1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子および特に1~3個の炭素原子を有する、直鎖または分枝のアルキル基を意味する。 $C_1 \sim C_4$ -アルキルの例は、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、2-ブチル(sec-ブチル)、イソブチルおよびtert-ブチルである。 $C_1 \sim C_6$ -アルキルに対する例は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルに対して述べたものの他に、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、n-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、n-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-メチルプロピルおよび1-エチル-2-メチルプロピルがある。 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルに対する例は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルに対して述べたものの他に、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、n-ヘプチル、1-メチルヘキシル、2-メチルヘキシル、3-メチルヘキシル、4-メチルヘキシル、5-メチルヘキシル、1-エチルペンチル、2-エチルペンチル、3-エチルペンチル、n-オクチル、1-メチルオクチル、2-メチルヘプチル、1-エチルヘキシル、2-エチルヘキシル、1,2-ジメチルヘキシル、1-プロピルペンチル、2-プロピルペンチル、ノニル、デシル、2-プロピルヘプチルおよび3-プロピルヘプチルがある。

【0050】

「アルキレン」(またはアルカンジイル)という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、上で定義されたようなアルキル基を意味し、このアルキル基の中で、炭素骨格の任意の位置における1個の水素原子は、1つのさらなる結合部位で置き換えられており、したがって二価の部分形成する。

【0051】

「ハロアルキル」という用語(およびハロアルキル基を含む他の基のハロアルキル部分、例えばハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルカルボニル、ハロアルキルスルホニルおよびハロアルキルスルフィニル)は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も普通1~10個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_{10}$ -ハロアルキル」)、多くの場合1~6個の炭素原子(

10

20

30

40

50

「 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル」)、さらに多くの場合1~4個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル」)を有する直鎖または分枝のアルキル基を意味し、この基の水素原子は、部分的または完全にハロゲン原子で置き換えられている。好ましいハロアルキル部分は、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、より好ましくは $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、より好ましくはハロメチル、特に $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルキルから選択される。ハロメチルは、水素原子の1、2または3個がハロゲン原子で置き換えられているメチルである。例は、ブロモメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチルなどである。 $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルキルに対する例は、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、ペンタフルオロエチルなどである。 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルに対する例は、 $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルキルに対して述べたものの他に、 $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルキル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、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、2-クロロエチル、2,2-ジクロロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、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、1-ブロモエチル、などがある。 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルに対する例は、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルに対して述べたものの他に、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、1-フルオロプロピル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル、3-クロロプロピル、4-クロロブチルなどがある。

10

20

【0052】

「シクロアルキル」という用語(およびシクロアルキル基を含む他の基のシクロアルキル部分、例えばシクロアルコキシおよびシクロアルキルアルキル)は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、普通3~10個の炭素原子(「 $C_3 \sim C_{10}$ -シクロアルキル」)、好ましくは3~8個の炭素原子(「 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル」)または特に3~6個の炭素原子(「 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル」)を有する単環式または二環式の脂環式基を意味する。3~6個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルを含む。3~8個の炭素原子を有する単環式基の例は、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、シクロヘプチルおよびシクロオクチルを含む。7または8個の炭素原子を有する二環式基の例は、ビスクロ[2.1.1]ヘキシル、ビスクロ[2.2.1]ヘプチル、ビスクロ[3.1.1]ヘプチル、ビスクロ[2.2.1]ヘプチル、ビスクロ[2.2.2]オクチルおよびビスクロ[3.2.1]オクチルを含む。

30

【0053】

「ハロシクロアルキル」という用語(およびハロシクロアルキル基を含む他の基のハロシクロアルキル部分、例えばハロシクロアルキルメチル)は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、普通3~10個の炭素原子、好ましくは3~8個の炭素原子または特に3~6個の炭素原子を有する単環式または二環式の脂環式基を意味し、この脂環式基の中で、水素原子の少なくとも1個、例えば1、2、3、4または5個は、ハロゲン、特にフッ素または塩素で置き換えられている。例は、1-および2-フルオロシクロプロピル、1,2-、2,2-および2,3-ジフルオロシクロプロピル、1,2,2-トリフルオロシクロプロピル、2,2,3,3-テトラフルオロシクロプロピル、1-および2-クロロシクロプロピル、1,2-、2,2-および2,3-ジクロロシクロプロピル、1,2,2-トリクロロシクロプロピル、2,2,3,3-テトラクロロシクロプロピル、1-,2-および3-フルオロシクロペンチル、1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5-ジフルオロシクロペンチル、1-,2-および3-クロロシクロペンチル、1,2-、2,2-、2,3-、3-,3,4-、2,5-ジクロロシクロペンチルなどである。

40

【0054】

本明細書で使用される「シクロアルキル-アルキル」という用語は、上で定義されたようなシクロアルキル基を意味し、このシクロアルキル基は、アルキレン基を介して分子の残りとは結合している。「 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル」という用語は、上で定義されたような $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル基を指し、この $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル基は、上

50

で定義されたような $C_1 \sim C_4$ -アルキル基を介して分子の残りと結合している。例は、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、などである。

【0055】

「アルケニル」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、普通2～10個(「 $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル」)、好ましくは2～6個の炭素原子(「 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル」)、特に2～4個の炭素原子(「 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル」)、および任意の位置で二重結合を有する、単不飽和の直鎖または分枝の炭化水素基、例えば $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、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-プロペニルまたは2-メチル-2-プロペニルなど； $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、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、1-エチル-2-メチル-2-プロペニルなど、または $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル、例えば、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニルに対して述べられている基、および追加的に1-ヘプテニル、2-ヘプテニル、3-ヘプテニル、1-オクテニル、2-オクテニル、3-オクテニル、4-オクテニル、1-ノネニル、2-ノネニル、3-ノネニル、4-ノネニル、1-デセニル、2-デセニル、3-デセニル、4-デセニル、5-デセニルならびにその位置異性体を意味する。

【0056】

「ハロアルケニル」という用語(「ハロゲンで置換されていてもよいアルケニル」と表現されてもよい)は、本明細書で使用される場合、およびハロアルケニルオキシ、ハロアルケニルカルボニルなどの中のハロアルケニル部分は、2～10個(「 $C_2 \sim C_{10}$ -ハロアルケニル」)または2～6個(「 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル」)または2～4個(「 $C_2 \sim C_4$ -ハロアルケニル」)の炭素原子および任意の位置で二重結合を有する、不飽和の直鎖または分枝の炭化水素基を指し、これらの基の水素原子のうちの一部またはすべては、上述されているようなハロゲン原子、特にフッ素、塩素および臭素で置き換えられている、例えばクロロビニル、クロロアリルなどである。

【0057】

「アルキニル」という用語は、本明細書で使用される場合、普通2～10個(「 $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル」)、多くの場合2～6個(「 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル」)、好ましくは2～4個の炭素原子(「 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル」)および任意の位置で1つまたは2つの三重結合を有する、不飽和

の直鎖または分枝の炭化水素基、例えば $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニルなど、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、3,3-ジメチル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニルなどを意味する。

10

【0058】

ハロアルキニルという用語(「ハロゲンで置換されていてもよいアルキニル」とも表現される)は、本明細書で使用される場合、普通3~10個の炭素原子($C_2 \sim C_{10}$ -ハロアルキニル)、多くの場合2~6個($C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル)、好ましくは2~4個の炭素原子($C_2 \sim C_4$ -ハロアルキニル)、および任意の位置で1つまたは2つの三重結合(上述されているように)を有する不飽和の直鎖または分枝の炭化水素基を指し、これらの基の水素原子のうちの一部またはすべては、上述されているようなハロゲン原子、特にフッ素、塩素および臭素で置き換えられている。

20

【0059】

「アルコキシ」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、普通1~10個の炭素原子($C_1 \sim C_{10}$ -アルコキシ)、多くの場合1~6個の炭素原子($C_1 \sim C_6$ -アルコキシ)、好ましくは1~4個の炭素原子($C_1 \sim C_4$ -アルコキシ)を有し、酸素原子を介して分子の残りと結合している、直鎖または分枝のアルキル基を意味する。 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシはメトキシまたはエトキシである。 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシは、追加的に、例えば、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ(イソプロポキシ)、ブトキシ、1-メチルプロポキシ(sec-ブトキシ)、2-メチルプロポキシ(イソブトキシ)または1,1-ジメチルエトキシ(tert-ブトキシ)である。 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシは、追加的に、例えば、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシまたは1-エチル-2-メチルプロポキシ。である。 $C_1 \sim C_8$ -アルコキシは、追加的に、例えば、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、2-エチルヘキシルオキシおよびその位置異性体である。 $C_1 \sim C_{10}$ -アルコキシは、追加的に、例えば、ノニルオキシ、デシルオキシおよびその位置異性体である。

30

40

【0060】

「ハロアルコキシ」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、1~10個の炭素原子($C_1 \sim C_{10}$ -ハロアルコキシ)、多くの場合1~6個の炭素原子($C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ)、好ましくは1~4個の炭素原子($C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ)、より好ましくは1~3個の炭素原子($C_1 \sim C_3$ -ハロアルコキシ)を有する、上で定義されたような直鎖または分枝のアルコキシ基を意味し、この基の水素原子は、ハロゲン原子、特にフッ素原子で部分的または完全に置き換えられている。 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシは、例えば、 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 、 OCH_2Cl 、 $OCHCl_2$ 、 $OCCL_3$ 、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエ

50

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または OC_2F_5 である。 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -ハロアルコキシは、追加的に、例えば、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、2,3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、2-ブロモプロポキシ、3-ブロモプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、3,3,3-トリクロロプロポキシ、 $\text{OCH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、 $\text{OCF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエトキシ、1-(CH_2Cl)-2-クロロエトキシ、1-(CH_2Br)-2-ブロモエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブロモブトキシまたはノナフルオロブトキシである。 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -ハロアルコキシは、追加的に、例えば、5-フルオロペントキシ、5-クロロペントキシ、5-ブロモペントキシ、5-ヨードペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロヘキソキシ、6-クロロヘキソキシ、6-ブロモヘキソキシ、6-ヨードヘキソキシまたはドデカフルオロヘキソキシである。

10

【0061】

「アルコキシ-アルキル」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も普通1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子を含むアルキルを意味し、この基の中で1個の炭素原子は、上で定義されたような、1~10個、多くの場合1~6個、特に1~4個の炭素原子を普通含むアルコキシ基を保有する。「 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル」は、上で定義されたような $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル基であり、この基の中で、1個の水素原子は、上で定義されたような $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルコキシ基で置き換えられている。例は、 CH_2OCH_3 、 $\text{CH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$ 、n-プロポキシメチル、 $\text{CH}_2\text{-OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、n-ブトキシメチル、(1-メチルプロポキシ)-メチル、(2-メチルプロポキシ)メチル、 $\text{CH}_2\text{-OC}(\text{CH}_3)_3$ 、2-(メトキシ)エチル、2-(エトキシ)エチル、2-(n-プロポキシ)-エチル、2-(1-メチルエトキシ)-エチル、2-(n-ブトキシ)エチル、2-(1-メチルプロポキシ)-エチル、2-(2-メチルプロポキシ)-エチル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)-エチル、2-(メトキシ)-プロピル、2-(エトキシ)-プロピル、2-(n-プロポキシ)-プロピル、2-(1-メチルエトキシ)-プロピル、2-(n-ブトキシ)-プロピル、2-(1-メチルプロポキシ)-プロピル、2-(2-メチルプロポキシ)-プロピル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)-プロピル、3-(メトキシ)-プロピル、3-(エトキシ)-プロピル、3-(n-プロポキシ)-プロピル、3-(1-メチルエトキシ)-プロピル、3-(n-ブトキシ)-プロピル、3-(1-メチルプロポキシ)-プロピル、3-(2-メチルプロポキシ)-プロピル、3-(1,1-ジメチルエトキシ)-プロピル、2-(メトキシ)-ブチル、2-(エトキシ)-ブチル、2-(n-プロポキシ)-ブチル、2-(1-メチルエトキシ)-ブチル、2-(n-ブトキシ)-ブチル、2-(1-メチルプロポキシ)-ブチル、2-(2-メチルプロポキシ)-ブチル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)-ブチル、3-(メトキシ)-ブチル、3-(エトキシ)-ブチル、3-(n-プロポキシ)-ブチル、3-(1-メチルエトキシ)-ブチル、3-(n-ブトキシ)-ブチル、3-(1-メチルプロポキシ)-ブチル、3-(2-メチルプロポキシ)-ブチル、3-(1,1-ジメチルエトキシ)-ブチル、4-(メトキシ)-ブチル、4-(エトキシ)-ブチル、4-(n-プロポキシ)-ブチル、4-(1-メチルエトキシ)-ブチル、4-(n-ブトキシ)-ブチル、4-(1-メチルプロポキシ)-ブチル、4-(2-メチルプロポキシ)-ブチル、4-(1,1-ジメチルエトキシ)-ブチルなどである。

20

30

【0062】

「ハロアルコキシ-アルキル」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子を普通含む、上で定義されたようなアルキルを意味し、この基の中で、1個の炭素原子は、1~10個、多くの場合1~6個、特に1~4個の、上で定義されたような炭素原子を普通含む、上で定義されたようなハロアルコキシ基を保有する。例は、フルオロメトキシメチル、ジフルオロメトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル、1-フルオロエトキシメチル、2-フルオロエトキシメチル、1,1-ジフルオロエトキシメチル、1,2-ジフルオロエトキシメチル、2,2-ジフルオロエトキシメチル、1,1,2-トリフルオロエトキシメチル、1,2,2-トリフルオロエトキシメチル、2,2,2-トリフルオロエトキシメチル、ペンタフルオロエトキシメチル、1-フルオロエトキシ-1-エチル、2-フルオロエトキシ-1-エチル、1,1-ジフルオロエトキシ-1-エチル、1,2-ジフルオロエトキシ-1-エチル、2,2-ジフルオロエトキシ-1-エチル、1,1,2-トリフルオロエトキシ

40

50

シ-1-エチル、1,2,2-トリフルオロエトキシ-1-エチル、2,2,2-トリフルオロエトキシ-1-エチル、ペンタフルオロエトキシ-1-エチル、1-フルオロエトキシ-2-エチル、2-フルオロエトキシ-2-エチル、1,1-ジフルオロエトキシ-2-エチル、1,2-ジフルオロエトキシ-2-エチル、2,2-ジフルオロエトキシ-2-エチル、1,1,2-トリフルオロエトキシ-2-エチル、1,2,2-トリフルオロエトキシ-2-エチル、2,2,2-トリフルオロエトキシ-2-エチル、ペンタフルオロエトキシ-2-エチル、などである。

【0063】

「アルキルチオ」(またアルキルスルファニルまたはアルキル-S-)という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、1~10個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルチオ」)を普通含む、多くの場合1~6個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ」)、好ましくは1~4個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ」)を含む、上で定義されたような直鎖または分枝の飽和したアルキル基を意味し、このアルキル基は、アルキル基における任意の位置で硫黄原子を介して付加している。 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオは、メチルチオまたはエチルチオである。 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオは、追加的に、例えば、n-プロピルチオ、1-メチルエチルチオ(イソプロピルチオ)、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ(sec-ブチルチオ)、2-メチルプロピルチオ(イソブチルチオ)または1,1-ジメチルエチルチオ(tert-ブチルチオ)。 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオは、追加的に、例えば、ペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、1,1-ジメチルプロピルチオ、1,2-ジメチルプロピルチオ、2,2-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、4-メチルペンチルチオ、1,1-ジメチルブチルチオ、1,2-ジメチルブチルチオ、1,3-ジメチルブチルチオ、2,2-ジメチルブチルチオ、2,3-ジメチルブチルチオ、3,3-ジメチルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1,1,2-トリメチルプロピルチオ、1,2,2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオまたは1-エチル-2-メチルプロピルチオである。 $C_1 \sim C_8$ -アルキルチオは、追加的に、例えば、ヘプチルチオ、オクチルチオ、2-エチルヘキシルチオおよびその位置異性体である。 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルチオは、追加的に、例えば、ノニルチオ、デシルチオおよびその位置異性体である。

【0064】

「ハロアルキルチオ」という用語は、本明細書で使用される場合、上で定義されたようなアルキルチオ基を指し、この基の中で、水素原子は、フッ素、塩素、臭素および/またはヨウ素で部分的または完全に置換されている。 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルチオは、例えば、 SCH_2F 、 $SCHF_2$ 、 SCF_3 、 SCH_2Cl 、 $SCHCl_2$ 、 $SCCl_3$ 、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、2-フルオロエチルチオ、2-クロロエチルチオ、2-ブロモエチルチオ、2-ヨードエチルチオ、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または SC_2F_5 である。 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオは、追加的に、例えば、2-フルオロプロピルチオ、3-フルオロプロピルチオ、2,2-ジフルオロプロピルチオ、2,3-ジフルオロプロピルチオ、2-クロロプロピルチオ、3-クロロプロピルチオ、2,3-ジクロロプロピルチオ、2-ブロモプロピルチオ、3-ブロモプロピルチオ、3,3,3-トリフルオロプロピルチオ、3,3,3-トリクロロプロピルチオ、 $SCH_2-C_2F_5$ 、 $SCF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエチルチオ、1-(CH_2Cl)-2-クロロエチルチオ、1-(CH_2Br)-2-ブロモエチルチオ、4-フルオロブチルチオ、4-クロロブチルチオ、4-ブロモブチルチオまたはノナフルオロブチルチオである。 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオは、追加的に、例えば、5-フルオロペンチルチオ、5-クロロペンチルチオ、5-ブロモペンチルチオ、5-ヨードペンチルチオ、ウンデカフルオロペンチルチオ、6-フルオロヘキシルチオ、6-クロロヘキシルチオ、6-ブロモヘキシルチオ、6-ヨードヘキシルチオまたはドデカフルオロヘキシルチオである。

【0065】

「アルキルスルフィニル」および「 $S(O)_n$ -アルキル」(式中、nは1である)という用語は等しく、これらは、本明細書で使用される場合、スルフィニル[S(O)]基を介して付加して

いる、上で定義されたようなアルキル基を意味する。例えば、「 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_2$ -アルキル基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_4$ -アルキル基を指す。「 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_6$ -アルキル基を指す。 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルフィニルは、メチルスルフィニルまたはエチルスルフィニルである。 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルフィニルは、追加的に、例えば、*n*-プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル(イソプロピルスルフィニル)、ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル(*sec*-ブチルスルフィニル)、2-メチルプロピルスルフィニル(イソブチルスルフィニル)または1,1-ジメチルエチルスルフィニル(*tert*-ブチルスルフィニル)である。 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニルは、追加的に、例えば、ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、1,1-ジメチルプロピルスルフィニル、1,2-ジメチルプロピルスルフィニル、2,2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1,1-ジメチルブチルスルフィニル、1,2-ジメチルブチルスルフィニル、1,3-ジメチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルブチルスルフィニル、2,3-ジメチルブチルスルフィニル、3,3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルフィニルまたは1-エチル-2-メチルプロピルスルフィニルである。

【0066】

「ハロアルキルスルフィニル」および「 $S(0)_n$ -ハロアルキル」(式中、*n*は1である)という用語は等しく、これらは、本明細書で使用される場合、スルフィニル[S(0)]基を介して付加している、上で定義されたようなハロアルキル基を意味する。「 $S(0)_n$ - $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル」(式中、*n*は1である)という用語、すなわち「 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルスルフィニル」は、スルフィニル[S(0)]基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル基である。「 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル基である。 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルフィニルは、例えば、 $S(0)CH_2F$ 、 $S(0)CHF_2$ 、 $S(0)CF_3$ 、 $S(0)CH_2Cl$ 、 $S(0)CHCl_2$ 、 $S(0)CCl_3$ 、クロロフルオロメチルスルフィニル、ジクロロフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2-クロロエチルスルフィニル、2-ブromoエチルスルフィニル、2-ヨードエチルスルフィニル、2,2-ジフルオロエチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、2-クロロ-2-フルオロエチルスルフィニル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルスルフィニル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチルスルフィニル、2,2,2-トリクロロエチルスルフィニルまたは $S(0)C_2F_5$ である。 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルスルフィニルは、追加的に、例えば、2-フルオロプロピルスルフィニル、3-フルオロプロピルスルフィニル、2,2-ジフルオロプロピルスルフィニル、2,3-ジフルオロプロピルスルフィニル、2-クロロプロピルスルフィニル、3-クロロプロピルスルフィニル、2,3-ジクロロプロピルスルフィニル、2-ブromoプロピルスルフィニル、3-ブromoプロピルスルフィニル、3,3,3-トリフルオロプロピルスルフィニル、3,3,3-トリクロロプロピルスルフィニル、 $S(0)CH_2-C_2F_5$ 、 $S(0)CF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエチルスルフィニル、1-(CH_2Cl)-2-クロロエチルスルフィニル、1-(CH_2Br)-2-ブromoエチルスルフィニル、4-フルオロブチルスルフィニル、4-クロロブチルスルフィニル、4-ブromoブチルスルフィニルまたはノナフルオロブチルスルフィニル。 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニルは、追加的に、例えば、5-フルオロペンチルスルフィニル、5-クロロペンチルスルフィニル、5-ブromoペンチルスルフィニル、5-ヨードペンチルスルフィニル、ウンデカフルオロペンチルスルフィニル、6-フルオロヘキシルスルフィニル、6-クロロヘキシルスルフィニル、6-ブromoヘキシルスルフィニル、6-ヨードヘキシルスルフィニル

ルまたはドデカフルオロヘキシルスルフィニルである。

【0067】

「アルキルスルホニル」および「 $S(O)_n$ -アルキル」(式中、 n は2である)という用語は等しく、これらは、本明細書で使用される場合、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して付加している、上で定義されたようなアルキル基を意味する。「 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_2$ -アルキル基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_4$ -アルキル基を指す。「 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_6$ -アルキル基を指す。 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルホニルは、メチルスルホニルまたはエチルスルホニルである。 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルは、追加的に、例えば、 n -プロピルスルホニル、1-メチルエチルスルホニル(イソプロピルスルホニル)、ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル(sec-ブチルスルホニル)、2-メチルプロピルスルホニル(イソブチルスルホニル)または1,1-ジメチルエチルスルホニル(tert-ブチルスルホニル)である。 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニルは、追加的に、例えば、ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、1,1-ジメチルプロピルスルホニル、1,2-ジメチルプロピルスルホニル、2,2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1,1-ジメチルブチルスルホニル、1,2-ジメチルブチルスルホニル、1,3-ジメチルブチルスルホニル、2,2-ジメチルブチルスルホニル、2,3-ジメチルブチルスルホニル、3,3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルホニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニルまたは1-エチル-2-メチルプロピルスルホニルである。

【0068】

「ハロアルキルスルホニル」および「 $S(O)_n$ -ハロアルキル」(式中、 n は2である)という用語は等しく、これらは、本明細書で使用される場合、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して付加している、上で定義されたようなハロアルキル基を意味する。「 $S(O)_n$ - $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル」(式中、 n は2である)という用語、すなわち「 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル基である。「 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニル」という用語は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して付加している、上で定義されたような $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル基である。 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルホニルは、例えば、 $S(O)_2CH_2F$ 、 $S(O)_2CHF_2$ 、 $S(O)_2CF_3$ 、 $S(O)_2CH_2Cl$ 、 $S(O)_2CHCl_2$ 、 $S(O)_2CCl_3$ 、クロロフルオロメチルスルホニル、ジクロロフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロエチルスルホニル、2-ブロモエチルスルホニル、2-ヨードエチルスルホニル、2,2-ジフルオロエチルスルホニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル、2-クロロ-2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルスルホニル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチルスルホニル、2,2,2-トリクロロエチルスルホニルまたは $S(O)_2C_2F_5$ である。 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルスルホニルは、追加的に、例えば、2-フルオロプロピルスルホニル、3-フルオロプロピルスルホニル、2,2-ジフルオロプロピルスルホニル、2,3-ジフルオロプロピルスルホニル、2-クロロプロピルスルホニル、3-クロロプロピルスルホニル、2,3-ジクロロプロピルスルホニル、2-ブロモプロピルスルホニル、3-ブロモプロピルスルホニル、3,3,3-トリフルオロプロピルスルホニル、3,3,3-トリクロロプロピルスルホニル、 $S(O)_2CH_2-C_2F_5$ 、 $S(O)_2CF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエチルスルホニル、1-(CH_2Cl)-2-クロロエチルスルホニル、1-(CH_2Br)-2-ブロモエチルスルホニル、4-フルオロブチルスルホニル、4-クロロブチルスルホニル、4-ブロモブチルスルホニルまたはノナフルオロブチルスルホニル。 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニルは、追加的に、例えば、5-フルオロペンチルスルホニル、5-クロロペンチルスルホニル、5-ブロモペンチルスルホニル、5-ヨードペンチルスルホニル、ウンデカフルオロペンチルスルホニル、6-フルオロヘキシルスルホニル、6-クロロ

ヘキシルスルホニル、6-プロモヘキシルスルホニル、6-ヨードヘキシルスルホニルまたはドデカフルオロヘキシルスルホニルである。

【0069】

「アルキルアミノ」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、基-NHR(式中、Rは、普通1~6個の炭素原子(「C₁~C₆-アルキルアミノ」)、好ましくは1~4個の炭素原子(「C₁~C₄-アルキルアミノ」)を有する直鎖または分枝のアルキル基である)を意味する。C₁~C₆-アルキルアミノの例は、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-ブチルアミノ、2-ブチルアミノ、イソ-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノなどである。

【0070】

「ジアルキルアミノ」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、基-NRR'(式中、RおよびR'は、互いに独立して、それぞれが普通1~6個の炭素原子(「ジ-(C₁~C₆-アルキル)-アミノ」)、好ましくは、1~4個の炭素原子(「ジ-(C₁~C₄-アルキル)-アミノ」)を有する、直鎖または分枝のアルキル基である)を意味する。ジ-(C₁~C₆-アルキル)-アミノ基の例は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、メチル-エチル-アミノ、メチル-プロピル-アミノ、メチル-イソプロピルアミノ、メチル-ブチル-アミノ、メチル-イソブチル-アミノ、エチル-プロピル-アミノ、エチル-イソプロピルアミノ、エチル-ブチル-アミノ、エチル-イソブチル-アミノ、などである。

【0071】

「アルキルアミノスルホニル」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、上で定義されたような直鎖または分枝のアルキルアミノ基を意味し、このアルキルアミノ基は、スルホニル[S(0)₂]基を介して分子の残りと結合している。アルキルアミノスルホニル基の例は、メチルアミノスルホニル、エチルアミノスルホニル、n-プロピルアミノスルホニル、イソプロピルアミノスルホニル、n-ブチルアミノスルホニル、2-ブチルアミノスルホニル、イソ-ブチルアミノスルホニル、tert-ブチルアミノスルホニル、などである。

【0072】

「ジアルキルアミノスルホニル」という用語は、本明細書で使用される場合、いずれの場合も、上で定義されたような直鎖または分枝のアルキルアミノ基を意味し、この基は、スルホニル[S(0)₂]基を介して分子の残りと結合している。ジアルキルアミノスルホニル基の例は、ジメチルアミノスルホニル、ジエチルアミノスルホニル、ジプロピルアミノスルホニル、ジブチルアミノスルホニル、メチル-エチル-アミノスルホニル、メチル-プロピル-アミノスルホニル、メチル-イソプロピルアミノスルホニル、メチル-ブチル-アミノスルホニル、メチル-イソブチル-アミノスルホニル、エチル-プロピル-アミノスルホニル、エチル-イソプロピルアミノスルホニル、エチル-ブチル-アミノスルホニル、エチル-イソブチル-アミノスルホニル、などである。

【0073】

基の中の接尾語「-カルボニル」は、いずれの場合も基がカルボニルC=O基を介して分子の残りと結合していることを意味する。これは、例えばアルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニルにおける場合である。

【0074】

「3~6員の炭素環」という用語は、本明細書で使用される場合、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。

【0075】

「アリール」という用語は、本明細書で使用される場合、単環式、二環式または三環式の芳香族炭化水素基、例えばフェニルまたはナフチルなど、特にフェニルを指す。

【0076】

「ヘタリールまたは(ヘテロ)アリール」という用語は、本明細書で使用される場合、単環式、二環式または三環式のヘテロ芳香族炭化水素基、好ましくは単環式ヘテロ芳香族基

10

20

30

40

50

、例えばピリジル、ピリミジルなどを指す。

【0077】

「3、4、5、6、7または8員の飽和した炭素環」という用語は、本明細書で使用される場合、単環式であり、完全に飽和している炭素環を指す。このような環の例として、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、シクロオクタンなどが挙げられる。

【0078】

「3、4、5、6、7または8員の部分的に不飽和の炭素環」および「5または6員の部分的に不飽和の炭素環」という用語は、単環式であり、1以上の不飽和度を有する炭素環を指す。このような環の例として、シクロプロペン、シクロブテン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シクロヘプテン、シクロオクテンなどが挙げられる。

10

【0079】

「環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環」[ここで、「最大に不飽和」は「芳香族」も含む]という用語は、本明細書で使用される場合、単環式基を意味し、この単環式基は、飽和、部分的に不飽和または最大に不飽和である(芳香族を含む)。不飽和の環は、少なくとも1つのC-Cおよび/またはC-Nおよび/またはN-N二重結合(複数可)を含有する。最大に不飽和の環は、環サイズにより許容されるだけ多くのコンジュゲートC-Cおよび/またはC-Nおよび/またはN-N二重結合を含有する。最大に不飽和の5または6員のヘテロ環式環は芳香族である。ヘテロ環式環は、炭素環員を介してまたは窒素環員を介して分子の残りに付加していてもよい。当然のことながら、ヘテロ環式環は、少なくとも1個の炭素環原子を含有する。環が複数の0環原子を含有する場合、これらは隣接していない。

20

【0080】

3、4、5、6または7員の飽和したヘテロ環式環の例として、オキシラニル、チイラニル、アジリジニル、オキセタニル、チエタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロチエン-2-イル、テトラヒドロチエン-3-イル、ピロリジン-1-イル、ピロリジン-2-イル、ピロリジン-3-イル、ピラゾリジン-1-イル、ピラゾリジン-3-イル、ピラゾリジン-4-イル、ピラゾリジン-5-イル、イミダゾリジン-1-イル、イミダゾリジン-2-イル、イミダゾリジン-4-イル、オキサゾリジン-2-イル、オキサゾリジン-3-イル、オキサゾリジン-4-イル、オキサゾリジン-5-イル、イソオキサゾリジン-2-イル、イソオキサゾリジン-3-イル、イソオキサゾリジン-4-イル、イソオキサゾリジン-5-イル、チアゾリジン-2-イル、チアゾリジン-3-イル、チアゾリジン-4-イル、チアゾリジン-5-イル、イソチアゾリジン-2-イル、イソチアゾリジン-3-イル、イソチアゾリジン-4-イル、イソチアゾリジン-5-イル、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-1-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、ピペリジン-1-イル、ピペリジン-2-イル、ピペリジン-3-イル、ピペリジン-4-イル、ヘキサヒドロピリダジン-3-イル、ヘキサヒドロピリダジン-4-イル、ヘキサヒドロピリミジン-2-イル、ヘキサヒドロピリミジン-4-イル、ヘキサヒドロピリミジン-5-イル、ピペラジン-1-イル、ピペラジン-2-イル、1,3,5-ヘキサヒドロトリアジン-1-イル、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、モルホリン-2-イル、モルホリン-3-イル、モルホリン-4-イル、チオモルホリン-2-イル、チオモルホリン-3-イル、チオモルホリン-4-イル、1-オキシチオモルホリン-2-イル、1-オキシチオモルホリン-3-イル、1-オキシチオモルホリン-4-イル、1,1-ジオキシチオモルホリン-2-イル、1,1-ジオキシチオモルホリン-3-イル、1,1-ジオキシチオモルホリン-4-イル、アゼパン-1-、-2-、-3-または-4-イル、オキセパン-2-、-3-、-4-または-5-イル、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

30

40

50

,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-ジオキサゼピニル、ヘキサヒドロ-1,4-ジオキサゼピニルなどが挙げられる。

【0081】

3、4、5、6または7員の部分的に不飽和のヘテロ環式環の例として、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、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、テトラヒドロオキサゼピニル、例えば2,3,4,5-テトラヒドロ[1H]オキサゼピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,4,7-テトラヒドロ[1H]オキサゼピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,6,7-テトラヒドロ[1H]オキサゼピン-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-ジオキサゼピニルおよびテトラヒドロ-1,4-ジオキサゼピニルなどが挙げられる。

【0082】

3、4、5、6または7員の最大に不飽和の(芳香族を含む)ヘテロ環式環は、例えば、5または6員の最大に不飽和の(芳香族を含む)ヘテロ環式環である。例は、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、1-ピラゾリル、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、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、1,3,4-トリアゾール-1-イル、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、1-オキソピリジン-2-イル、1-オキソピリジン-3-イル、1-オキソピリジン-4-イル、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-ピラジニルである。

【0083】

「3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式

環であって、前記ヘテロ環式環が酸素、窒素および硫黄原子からなる群から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含み、前記窒素および硫黄原子が互いに独立して、酸化されていてもよいヘテロ環式環」という用語は、「環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環」[「最大に不飽和」は「芳香族」も含む]という上記で定義された用語と等しい。

【0084】

「環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6、7または8員の飽和したまたは部分的に不飽和の炭素環式またはヘテロ環式環」という用語は、本明細書で使用される場合、最大に不飽和の環系を除いて、上で定義されたような「3、4、5、6、7または8員の飽和した炭素環」を意味する一方で、他方では、「環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6、7または8員の飽和したまたは部分的に不飽和のヘテロ環式環」を意味する。飽和したまたは部分的に不飽和の3、4、5、6または7員のヘテロ環式環は上で定義された通りである。

【0085】

R^{12a}およびR^{12b}が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、またはR²⁴およびR²⁵が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはN、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択されるヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環を形成する場合、これは、窒素環原子の他にも、環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2、3もしくは4個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、N結合ヘテロ環式環である。例は、アジリジン-1-イル、アゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イル、ピラゾリジン-1-イル、イミダゾリン-1-イル、オキサゾリジン-3-イル、イソオキサゾリジン-3-イル、チアゾリジン-1-イル、イソチアゾリジン-1-イル、トリアゾリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、ピペラジン-1-イル、モルホリン-4-イル、チオモルホリン-1-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル、ピロリン-1-イル、ピロリン-1-イル、イミダゾリン-1-イル、ジヒドロピリジン-1-イル、テトラヒドロピリジン-1-イル、ピロール-1-イル、ピラゾール-1-イル、イミダゾール-1-イルなどである。

【0086】

R⁸およびR⁹が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SO、SO₂、C(=O)およびC(=S)から選択される1、2、3または4個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、3、4、5、6、7または8員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環を形成する場合、これは、窒素環原子の他にも、環員として、N、O、S、NO、SO、SO₂、C(=O)およびC(=S)から選択される1、2、3もしくは4個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよいN結合ヘテロ環式環である。これらが結合している窒素原子と一緒にあって、R^{12a}およびR^{12b}またはR²⁴およびR²⁵により形成される環に対して上記に列挙したものの他にも、例として、ピロリジン-2-オン-1-イル、ピロリジン-2,5-ジオン-1-イル、ピロリジン-3-オン-1-イル、ピロリジン-2-チオン-1-イル、ピラゾリジン-3-オン-1-イル、ピラゾリジン-4-オン-1-イル、イミダゾリジン-2-オン-1-イル、イミダゾリジン-4-オン-1-イル、ピペリジン-2-オン-1-イルなどがある。

【0087】

式(I)の化合物の変数(置換基)の好ましい実施形態について以下に述べる所見は、それ自体有効であり、ならびに好ましくは互いに組み合わせて、ならびにその立体異性体、塩、互変異性体またはN-オキシドと組み合わせて有効である。

【0088】

変数の好ましい実施形態に関して以下に述べられた所見はさらに、これら自体で有効であり、ならびに好ましくは式(I)の化合物に関して、さらに本発明による使用および方法

、ならびに本発明による組成物に関して互いに組み合わせて有効である。

【0089】

当然のことながら、 r 基 R^4 は、炭素環原子上で水素原子を置き換える。例えば、 B^1 がCHであると定義され、この位置が基 R^4 で置換されることになる場合、 B^1 は当然C- R^4 である。複数の基 R^4 が存在する場合、これらは、同一でありまたは異なることができる。

【0090】

当然のことながら、 p 基 R^1 は、炭素環原子上の水素原子を置き換える。複数の基 R^1 が存在する場合、これらは、同一でありまたは異なることができる。

【0091】

好ましい本発明による化合物は、式(I)の化合物またはその立体異性体、塩、互変異性体もしくはN-オキシドであり、この塩は、農業上または獣医学的に許容される塩である。さらに好ましい本発明による化合物は、式(I)の化合物またはその立体異性体もしくは塩、特に農業上または獣医学的に許容される塩である。最も好ましい本発明による化合物は、式(I)の化合物またはその塩、特に農業上または獣医学的に許容されるその塩である。

10

【0092】

好ましいのは、 W が0である、式(I)の化合物である。

【0093】

好ましいのは、 X が0である、式(I)の化合物である。

【0094】

好ましいのは、 Y が0である、式(I)の化合物である。

20

【0095】

好ましいのは、 W 、 X および Y が0である、式(I)の化合物である。

【0096】

好ましいのは、 p が1、2または3、具体的には2である、式(I)の化合物である。

【0097】

好ましいのは、 r が0、1、または2、具体的には1である、式(I)の化合物である。

【0098】

好ましいのは、 p が1、2または3、具体的には2であり、 r が0、1、または2、具体的には1である、式(I)の化合物である。

【0099】

特定の実施形態では、 B^1 はNである。

30

【0100】

好ましいのは、各 R^1 が、独立して、ハロゲン；シアノ； $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $-OR^{11}$ ； $-OS(O)_nR^{11}$ ； $-SR^{11}$ ； $-S(O)_mR^{11}$ ； $-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}$ ； $-N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-N(R^{12a})C(=O)R^{10}$ ； $C(=O)R^{10}$ ； $-C(=O)OR^{11}$ ；フェニル(1、2または3つの基 R^{13} で置換されていてもよい)；および環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上、好ましくは1、2または3つ、より好ましくは1または2つ、特に1つの基 R^{13} で置換されていてもよい)から選択されるか、

40

あるいは隣接する炭素原子上で結合している2つの基 R^1 が、一緒になって、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-N=CH-N=CH-$ 、 $-OCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH=CH-$

50

CH₂-、-CH₂OCH₂CH₂-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂OCH₂-、-CH₂CH₂CH₂-、-CH=CHCH₂-、-CH₂CH₂O-、
 -CH=CHO-、-CH₂OCH₂-、-CH₂C(=O)O-、-C(=O)OCH₂-、O(CH₂)O-、-SCH₂CH₂CH₂-、-SCH=CHCH
 2-、-CH₂SCH₂CH₂-、-SCH₂CH₂S-、-SCH₂SCH₂-、-CH₂CH₂S-、-CH=CHS-、-CH₂SCH₂-、-CH₂C(
 =S)S-、-C(=S)SCH₂-、-S(CH₂)S-、-CH₂CH₂NR²¹-、-CH₂CH=N-、-CH=CH-NR²¹-、-OCH=N- およ
 び-SCH=N-、から選択される基であってよく、したがって、これらが結合している炭素原
 子と一緒に、5または6員の環を形成し、上記基の水素原子が、ハロゲン、メチル、
 ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシおよびハロメトキシから選択される、1つ以上、好
 ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの置換基で置き換えら
 れていてもよい、または上記基のうちの1つ以上、好ましくは1もしくは2つのCH₂基が、
 C=O基で置き換えられていてもよい、式(I)の化合物である。

10

【0101】

特に、各R¹は、独立して、ハロゲン、シアノおよびC₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全
 にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ
 、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基R¹⁰で置換されていてもよい)から選択され
 る。より具体的には、各R¹は、独立してハロゲン、シアノ、C₁~C₆-アルキルおよびC₁~C
 4-ハロアルキルから選択される。具体的には、各R¹は、独立して、ハロゲン、シアノ、C₁
 ~C₄-アルキルおよびCF₃から、さらに具体的には、ハロゲン、シアノおよびC₁~C₄-アル
 キルから、極めて具体的には、F、Cl、Br、シアノおよびメチルから選択される。

【0102】

好ましいのは、R²が水素またはC₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化され
 ていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1も
 しくは2つ、特に1つの基R¹⁰で置換されていてもよい)である、式(I)の化合物である。よ
 り好ましくは、R²は、水素またはC₁~C₄-アルキルである。具体的にはR²は水素である。

20

【0103】

好ましいのは、R³が、水素、ハロゲン；シアノ；C₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全
 にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、
 より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基R¹⁰で置換されていてもよい)；C₃~C₈-シクロ
 アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、
 好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基R¹⁰で置換され
 ていてもよい)；C₂~C₆-アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく
 、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、
 特に1つの基R¹⁰で置換されていてもよい)；C₂~C₆-アルキニル(部分的もしくは完全にハ
 ロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より
 好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基R¹⁰で置換されていてもよい)；-OR¹¹；-OS(O)_nR¹¹
 ；-SR¹¹；-S(O)_mR¹¹；-S(O)_nN(R^{12a})R^{12b}；-N(R^{12a})R^{12b}；-N(R^{12a})C(=O)R¹⁰；C(=O)R¹⁰
 ；-C(=O)OR¹¹；フェニル(1、2または3つの基R¹³で置換されていてもよい)；および環員と
 して、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテ
 ロ原子基を含有する、5または6員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式
 環(このヘテロ環式環は、1つ以上、好ましくは1、2または3つ、より好ましくは1または2
 つ、特に1つの基R¹³で置換されていてもよい)から選択される式(I)の化合物である。より
 好ましくは、R³は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハ
 ロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より
 好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基R¹⁰で置換されていてもよい)、C₁~C₆-アルコキシ
 およびC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される。特に、R³は、水素、ハロゲン、シアノお
 よびC₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/また
 は1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基R¹⁰
 で置換されていてもよい)から選択される。より具体的には、R³は、水素、ハロゲン、C₁
 ~C₆-アルキルおよびC₁~C₄-ハロアルキルから選択される。具体的には、R³は、水素、ハ
 ロゲン、C₁~C₄-アルキル、およびC₁~C₂-ハロアルキルから、極めて具体的には、ハロゲ
 ンから、特にBr、およびC₁~C₂-ハロアルキル、特にCF₃から選択される。

30

40

50

【0104】

特定の実施形態では、 R^3 は、水素を除き、上記に与えられた一般的または好ましい意味のうちの1つを有する。

【0105】

好ましいのは、各 R^4 が、独立して、ハロゲン；シアノ； $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_2\sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $C_2\sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $-OR^{11}$ ； $-OS(O)_nR^{11}$ ； $-SR^{11}$ ； $-S(O)_mR^{11}$ ； $-S(O)_nN(R^{12a})R^{2b}$ ； $-N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-N(R^{12a})C(=O)R^{10}$ ； $C(=O)R^{10}$ ； $-C(=O)OR^{11}$ ；フェニル(1、2または3つの基 R^{13} で置換されていてもよい)；および環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上、好ましくは1、2または3つ、より好ましくは1または2つ、特に1つの基 R^{13} で置換されていてもよい)から選択される式(I)の化合物である。特に、各 R^4 は、独立して、ハロゲン、シアノおよび $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)から選択される。より具体的には、各 R^4 は、独立して、ハロゲンおよび $C_1\sim C_4$ -ハロアルキルから選択される。具体的には、各 R^4 は、独立して、ハロゲンから、極めて具体的にはClから選択される。

10

20

【0106】

好ましいのは、 R^5 が水素または $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)である、式(I)の化合物である。より好ましくは、 R^5 は、水素または $C_1\sim C_4$ -アルキルである。具体的には R^5 は水素である。

30

【0107】

好ましいのは、 R^6 および R^7 が、互いに独立して、水素、ハロゲンおよび $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)から選択される、式(I)の化合物である。より好ましくは、 R^6 および R^7 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、および $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルから選択される。具体的には、 R^6 および R^7 は、水素または $C_1\sim C_4$ -アルキルである。

【0108】

好ましいのは、 R^8 および R^9 が、独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2\sim C_6$ -アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2\sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_3\sim C_6$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6ま

40

50

たは7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上、好ましくは1、2または3つ、より好ましくは1または2つ、特に1つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ および $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ から選択されるか、

あるいは R^8 および R^9 が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を場合によって含有し、1、2または3つの基 R^{13} で置換されていてもよい、飽和した、部分的に不飽和または芳香族の5または6員の環を形成する、式(I)の化合物である。

【0109】

より好ましくは、 R^8 および R^9 は、互いに独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、および $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ からなる群から選択されるか、あるいはこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、5または6員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)を形成する。

【0110】

代替の、さらに好ましい実施形態では、 R^8 および R^9 は、互いに独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、好ましくは1、2もしくは3つ、より好ましくは1もしくは2つ、特に1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、 $C_2\sim C_4$ -アルケニル、 $C_2\sim C_4$ -アルキニル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $-C(=O)R^{10}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、 $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ 、およびフェニル(1、2、3、4または5つの置換基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、あるいは、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、5または6員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)を形成する。

【0111】

特に、 R^8 および R^9 は、互いに独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルおよび $C_1\sim C_6$ -アルキル(1、2または3つの置換基 R^{13} を保有してもよいフェニルで置換されている)からなる群から選択される。

【0112】

代替の特定の実施形態では、 R^8 および R^9 は、互いに独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルキル($C_3\sim C_6$ -シクロアルキルで置換されている)、 $C_1\sim C_2$ -アルキル(フェニルで置換されている)、 $C_2\sim C_4$ -アルケニル、 $C_2\sim C_4$ -アルキニル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、およびフェニルからなる群から選択されるか、あるいは、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、5または6員の飽和した環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)を形成する。

【0113】

具体的には、 R^8 および R^9 は、互いに独立して、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキルおよびベンジルからなる群から選択される。さらに具体的には、 R^8 および R^9 のうちの一方は、水素またはメチルであり、他方は、水素、 $C_1\sim C_6$ -アルキルおよびベンジルから選択される。

【0114】

好ましい一実施形態では、Zは NR^{12a} である。別の好ましい実施形態では、ZはOである。

【0115】

Zが NR^{12a} である場合、 R^{12a} は、好ましくは水素または $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)であり、具体的には水素である。

【0116】

R^{10} がアルキル、アルケニルまたはアルキニル基上の置換基である場合、 R^{10} は、好ましくは、シアノ、アジド、ニトロ、 $-\text{SCN}$ 、 SF_5 、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -ハロシクロアルキル、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{R}^{11}$ 、 $-\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{20}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、あるいは2つのジェミナル結合した基 R^{10} が一緒になって、 $=\text{CR}^{16}\text{R}^{17}$ 、 $=\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{11}$ 、 $=\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $=\text{NR}^{12a}$ 、 $=\text{NOR}^{11}$ および $=\text{NNR}^{12a}\text{R}^{12b}$ から選択される基を形成するか、あるいは2つの基 R^{10} は、これらが結合している炭素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6、7または8員の飽和したまたは部分的に不飽和の炭素環式またはヘテロ環式環を形成し、ここで、 R^{11} 、 R^{12a} 、 R^{12b} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{20} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0117】

R^{10} がアルキル、アルケニルまたはアルキニル基上の置換基である場合、 R^{10} は、より好ましくは、シアノ、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -ハロシクロアルキル、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{12a})\text{R}^{20}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{11} 、 R^{12a} 、 R^{12b} 、 R^{13} および R^{20} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0118】

R^{10} がアルキル、アルケニルまたはアルキニル基上の置換基である場合、 R^{10} は、さらにより好ましくは、シアノ、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ -ハロシクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -ハロアルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -ハロアルキルチオ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{20}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{11} 、 R^{12a} 、 R^{12b} 、 R^{13} 、および R^{20} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0119】

R^{20} がアルキル、アルケニルまたはアルキニル基上の置換基である場合、 R^{20} は特に、シアノ、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ -ハロシクロアルキル、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{20}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した

、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{11} 、 R^{12a} 、 R^{12b} 、 R^{13} および R^{20} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0120】

R^{10} がシクロアルキル基上の置換基である場合、 R^{10} は、好ましくは、シアノ、アジド、ニトロ、 $-\text{SCN}$ 、 SF_5 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -ハロシクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -ハロアルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -ハロアルキニル、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{R}^{11}$ 、 $-\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは2つのジェミナル結合した基 R^7 が一緒になって、 $=\text{CR}^{16}\text{R}^{17}$ 、 $=\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{11}$ 、 $=\text{S}(\text{O})_m\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $=\text{NR}^{12a}$ 、 $=\text{NOR}^{11}$ および $=\text{NNR}^{12a}\text{R}^{12b}$ から選択される基を形成するか、

あるいは2つの基 R^{10} は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6、7または8員の飽和したまたは部分的に不飽和の炭素環式またはヘテロ環式環を形成し、

ここで、 R^{11} 、 R^{12a} 、 R^{12b} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} および R^{20} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0121】

R^{10} がシクロアルキル基上の置換基である場合、 R^{10} は、より好ましくは、ハロゲン、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{R}^{11}$ 、 $-\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{11}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{11} 、 R^{12a} 、 R^{12b} および R^{13} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0122】

R^{10} がシクロアルキル基上の置換基である場合、 R^{10} は、さらにより好ましくは、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシおよび $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -ハロアルコキシからなる群から選択される。特に、シクロアルキル基上の置換基として、 R^{10} は、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキルおよび $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -ハロアルキルから選択される。

【0123】

R^{10} が $\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{C}(=\text{S})$ または $\text{C}(=\text{NR}^{12a})$ 上の置換基である場合、 R^{10} は、好ましくは、水素、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ -ハロシクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -ハロアルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -ハロアルキニル、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{12b}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{11} 、 R^{12a} 、 R^{12b} および R^{13} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0124】

R^{10} がC(=O)、C(=S)またはC(=NR^{12a})上の置換基である場合、 R^{10} は、より好ましくは、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、R¹³は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

10

【0125】

R^{10} がC(=O)、C(=S)またはC(=NR^{12a})上の置換基である場合、 R^{10} は、より好ましくはC₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、R¹³は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

20

【0126】

R^{10} がC(=O)、C(=S)またはC(=NR^{12a})上の置換基である場合、 R^{10} は、さらにより好ましくは、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₃-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、C₃~C₆-ハロシクロアルキル、C₁~C₄-アルコキシ、C₁~C₃-ハロアルコキシ、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、OおよびSから選択される、1、2または3個のヘテロ原子を含有する、5または6員のヘテロ芳香族環(このヘテロ芳香族環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、R¹³は上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0127】

好ましくは、各R¹¹は、独立して、水素、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上、例えば1、2、3または4つ、好ましくは1または2つ、より好ましくは1つの基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、R¹³は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

30

【0128】

より好ましくは、各R¹¹は、独立して、水素、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、フェニル(1、2、3、4または5つの基R¹³で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、OおよびSから選択される、1、2または3個のヘテロ原子を含有する、5または6員のヘテロ芳香族環(このヘテロ芳香族環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、R¹³は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

40

【0129】

R^{12a}およびR^{12b}は、互いに独立して、および各出現から独立して、好ましくは、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよい)、C₂~C₆-アルケニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基R²²で置換されていてもよ

50

い)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $S(O)_m R^{23}$ 、 $S(O)_n N R^{24} R^{25}$ 、フェニル(1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ベンジル(フェニル部分は、1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{13} 、 R^{23} 、 R^{24} および R^{25} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有するか、あるいは

10

R^{12a} および R^{12b} は、一緒になって、基 $=CR^{16}R^{17}$ 、(式中、 R^{16} および R^{17} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する)を形成するか、あるいは

R^{12a} および R^{12b} は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族の、好ましくは飽和した、ヘテロ環式環を形成し、このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよく、ここで、 R^{13} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

20

【0130】

R^{12a} および R^{12b} の上記の好ましい実施形態では、 R^{16} は、好ましくは水素またはメチルであり、 R^{17} は、好ましくは、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $-C(=O)R^{20}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、または $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ であり、ここで、 R^{20} 、 R^{23} 、 R^{24} および R^{25} は、上記に与えられた意味のうちの1つまたは特に以下に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0131】

R^{12a} および R^{12b} の上記の好ましい実施形態では、 R^{12a} および R^{12b} は、これらが一緒になって基 $=CR^{16}R^{17}$ を形成しない場合、またはこれらが結合しているN原子と一緒にあってヘテロ環式環を形成しない場合、好ましくは、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニルおよび $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシカルボニルから選択され、より好ましくは水素または $C_1 \sim C_4$ -アルキルである。

30

【0132】

R^{12a} および R^{12b} が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環を形成する場合、これは、好ましくは、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、3、5または6員の飽和したヘテロ環式環である。

【0133】

具体的には、 R^{12a} および R^{12b} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ベンジル(このフェニル部分は、1、2、3、4または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択される。さらに具体的には、 R^{12b} は水素または $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、 R^{12a} は、上記で特定された意味のうちの1つを有する。

40

【0134】

好ましくは、各 R^{13} は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的もしくは

50

は完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $-OR^{23}$ 、 $-OS(O)_nR^{23}$ 、 $-SR^{23}$ 、 $-S(O)_mR^{23}$ 、 $-S(O)_nN(R^{24})R^{25}$ 、 $-N(R^{24})R^{25}$ 、 $C(=O)R^{20}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、 $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和した、部分的に不飽和または最大に不飽和のヘテロ環式環(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択されるか、

あるいは隣接する原子上で結合している2つの基 R^{13} が一緒になって、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-N=CH-N=CH-$ 、 $-OCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH=CHO-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2C(=O)O-$ 、 $-C(=O)OCH_2-$ 、および $-O(CH_2)O-$ 、から選択される基を形成し、したがってこれらが結合している原子と一緒に5または6員の環を形成し、上記基の水素原子が、ハロゲン、メチル、ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシおよびハロメトキシから選択される1つ以上の置換基で置き換えられていてもよい、または上記基の1つ以上の CH_2 基が $C=O$ 基で置き換えられていてもよく、

ここで、 R^{20} 、 R^{23} 、 R^{24} および R^{25} は、一般的な意味のうちの1つまたは特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0135】

より好ましくは、各 R^{13} は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上の基 R^{22} で置換されていてもよい)、 $-OR^{23}$ 、 $-N(R^{24})R^{25}$ 、 $C(=O)R^{20}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、 $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)；ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、3、4、5、6または7員の飽和または不飽和のヘテロ環式環(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{20} 、 R^{23} 、 R^{24} および R^{25} は、一般的な意味のうちの1つ、または特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0136】

さらにより好ましくは、各 R^{13} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシおよび $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシからなる群から選択される。特に、各 R^{13} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルおよび $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルからなる群から選択される。

【0137】

好ましくは、 R^{14} および R^{15} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルから選択され、特にメチルである。

【0138】

好ましくは、 R^{16} および R^{17} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルからなる群から選択される。より好ましくは、 R^{16} および R^{17} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ -アルキルからなる群から、特に水素およびハロゲンからなる群から選択される。具体的には、これらは水素である。

【0139】

10

20

30

40

50

好ましくは、 R^{18} および R^{19} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、およびフェニル(1、2、3、4、または5つの基 R^{13} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、ここで、 R^{13} は、一般的な意味のうちの1つ、または特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0140】

好ましくは、各 R^{20} は、独立して、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3\sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ -ハロシクロアルキル、フェニルおよびベンジルからなる群から選択される。より好ましくは、各 R^{20} は、独立して、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルおよびフェニルからなる群から選択され、特に $C_1\sim C_4$ -アルキルまたは $C_1\sim C_3$ -ハロアルキルである。

10

【0141】

好ましくは、各 R^{21} は、独立して、水素； $C_1\sim C_{10}$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、例えば1、2、3もしくは4つ、好ましくは1もしくは2つ、より好ましくは1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $-C(=O)R^{10}$ ； $-C(=O)OR^{11}$ ； $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ ； $-C(=S)R^{10}$ ； $-C(=S)OR^{11}$ ； $-C(=S)N(R^{12a})R^{12b}$ および $-C(=NR^{12a})R^{10}$ からなる群から選択され、ここで、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12a} および R^{12b} は、一般的な意味のうちの1つ、または特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。

【0142】

より好ましくは、各 R^{21} は、水素； $C_1\sim C_6$ -アルキル(部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、および/または1つ以上、例えば1、2、3もしくは4つ、好ましくは1もしくは2つ、より好ましくは1つの基 R^{10} で置換されていてもよい)； $-C(=O)R^{10}$ および $-C(=O)N(R^{12a})R^{12b}$ からなる群から選択され、ここで、 R^{10} 、 R^{12a} および R^{12b} は、一般的な意味のうちの1つ、または特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。好ましくは、この場合、 $C_1\sim C_6$ -アルキル置換基としての R^{10} は、CN、 $C_3\sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキルチオ、フェニルならびに環員として、N、OおよびSから選択される、1、2または3個のヘテロ原子を含有し、1、2または3つの基 R^{13} で場合によって置換されている、5または6員のヘタリアル環から選択される。この場合、CO置換基としての R^{10} は、好ましくは、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される。この場合、 R^{12a} および R^{12b} は、好ましくは、水素および $C_1\sim C_6$ -アルキルから選択される。

20

30

【0143】

特に、各 R^{21} は、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -ハロアルキルおよび $-C(=O)R^{10}$ からなる群から選択され、具体的には、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキルおよび $-C(=O)R^{10}$ からなる群から選択され、ここで、 R^{10} は、一般的な意味のうちの1つ、または特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有し、具体的には $C_1\sim C_4$ -アルキルである。

【0144】

R^{22} がアルキル、アルケニルまたはアルキニル基上の置換基である場合、 R^{22} は、好ましくは、シアノ、 $C_3\sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $-OR^{23}$ 、 $-C(=O)N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=S)N(R^{24})R^{25}$ 、 $-C(=O)OR^{23}$ 、 $-C(=O)R^{20}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環(最後に述べられた3つの基の中の環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

40

ここで、

R^{20} および R^{23} は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -ハロアルキル、フェニル、ベンジル、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよ

50

びSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環から選択され、最後に述べられた3つの基の中の環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよく、

R²⁴およびR²⁵は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、フェニル、ベンジル、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する5または6員のヘテロ環式環から選択され、最後に述べられた3つの基の中の環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい。

【0145】

R²²がシクロアルキル基上の置換基である場合、R²²は、好ましくは、シアノ、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-ハロシクロアルキル、-C(=O)N(R²⁴)R²⁵、-C(=S)N(R²⁴)R²⁵、-C(=O)OR²³、-C(=O)R²⁰、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環からなる群から選択され、最後に述べた3つの基の中の環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよく、

ここで、

R²⁰およびR²³は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、フェニル、ベンジル、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環から選択され、最後に述べた3つの基の中の環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよく、

R²⁴およびR²⁵は、互いに独立しておよび各出現から独立して、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、フェニル、ベンジル、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環から選択され、最後に述べた3つの基の中の環は、1つ以上の基R¹³で置換されていてもよい。

【0146】

R²³は、好ましくは、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₂~C₄-アルケニル、C₂~C₄-ハロアルケニル、C₂~C₄-アルキニル、C₂~C₄-ハロアルキニル、C₃~C₆-シクロアルキル、C₃~C₆-ハロシクロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよびSO₂から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環からなる群から選択され、最後に述べた3つの基の中の環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい。

【0147】

R²⁴およびR²⁵は、互いに独立しておよび各出現から独立して、好ましくは、水素、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシおよびC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(

ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される、1、2、3、4または5つの基で置換されていてもよい)、ならびに環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1、2または3個のヘテロ原子またはヘテロ原子基を含有する、5または6員のヘテロ環式環からなる群から選択され、最後に述べた3つの基の中の環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

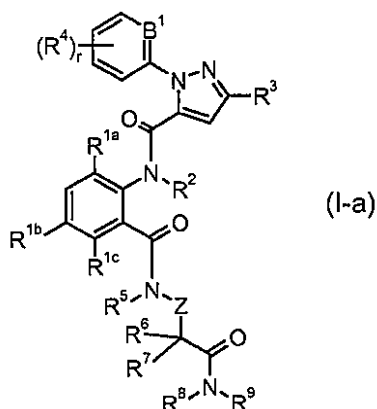
あるいは R^{24} および R^{25} は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SOおよび SO_2 から選択される1もしくは2個のさらなるヘテロ原子またはヘテロ原子基を追加的に含有してもよい、5または6員の飽和した、部分的に不飽和または芳香族のヘテロ環式環を形成してもよく、このヘテロ環式環は、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、 $C_1\sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ -アルコキシおよび $C_1\sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい。

10

【0148】

好ましい実施形態では、式(I)の化合物は、一般式(I-a)

【化3】



20

【0149】

(式中、

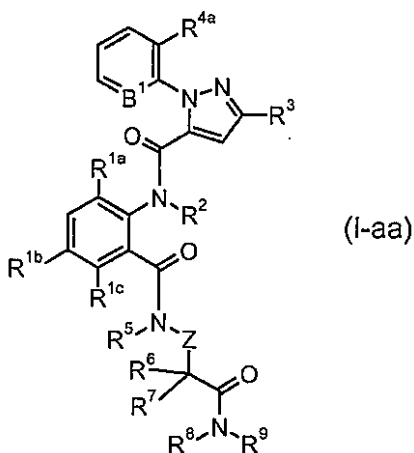
R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、水素と、 R^1 に対して定義された通りの基とから選択され、 B^1 、Z、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および r は、一般的な意味のうちの1つ、または特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する)の化合物である。

30

【0150】

特に、式(I)の化合物は、一般式(I-aa)

【化4】



40

【0151】

(式中、

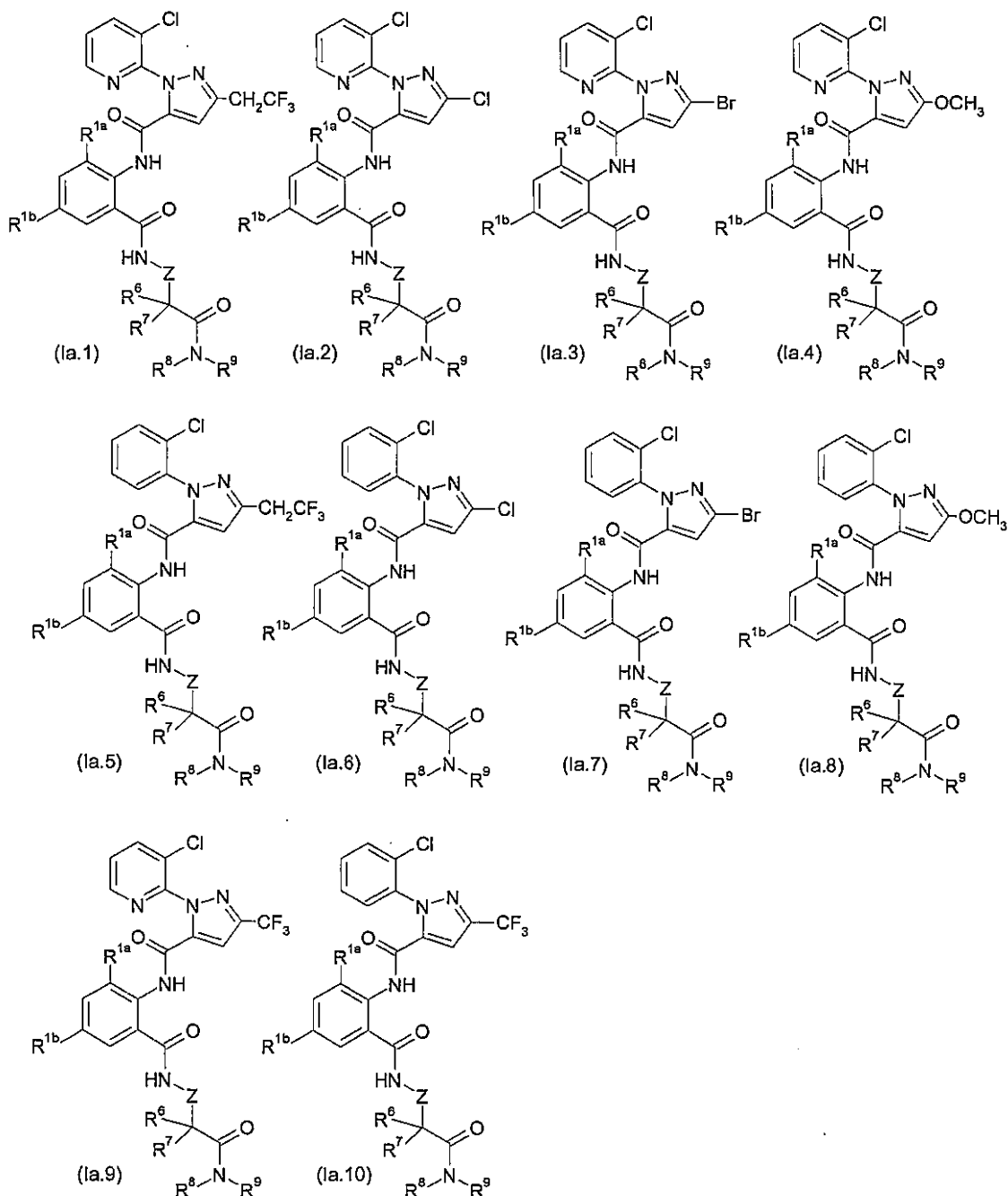
50

R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、水素と、 R^1 に対して定義された通りの基とから選択され、
 R^{4a} は、水素と、 R^4 に対して定義された通りの基とから選択され、
 B^1 、 Z 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 は、一般的な意味のうちの1つ、または特に上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する)の化合物である。

【0152】

好ましい化合物の例は、以下の式Ia.1~Ia.10の化合物であり、式中、変数は一般的な意味、または上記に与えられた好ましい意味のうちの1つを有する。好ましい化合物の例は、以下の表1~1200において収集された個々の化合物である。さらに、表の中の個々の変数に対して以下に述べられた意味は、それ自体、これが述べられている組合せから独立した、対象の置換基のある特定の好ましい実施形態である。

【化5】



【0153】

表1

R^{1a} がメチルであり、 R^{1b} がメチルであり、 Z がOであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 およ

10

20

30

40

50

表 18

表 19

表 20

表 21

10

表 22

表 23

表 24

20

表 25

表 26

表 27

表 28

30

表 29

表 30

表 31

40

表 32

表 33

表 34

50

表 52

表 53

表 54

表 55

表 56

表 57

表 58

表 59

表 60

表 61

表 62

表 63

表 64

表 65

表 66

表 67

表 68

表 69

表 70

表71

10

表 72

表 73

表 74

20

表 75

表 76

表 77

30

表 78

表 79

表 80

表 81

40

表 82

表 83

表 84

50

R^{1a}がBrであり、R^{1b}がFであり、ZがNCH₂CH₃であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表101

表 102

R^{1a}がClであり、R^{1b}がメチルであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

R^{1a}がBrであり、R^{1b}がメチルであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表106

R^{1a}がメチルであり、R^{1b}がCNであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

R^{1a}がCNであり、R^{1b}がメチルであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

R^{1a}がClであり、R^{1b}がClであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表109

R^{1a}がClであり、R^{1b}がBrであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表110

R^{1a}がBrであり、R^{1b}がClであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表111

R^{1a}がClであり、R^{1b}がCNであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表112

R^{1a}がCNであり、R^{1b}がClであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表113

R^{1a}がBrであり、R^{1b}がBrであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表114

R^{1a}がBrであり、R^{1b}がCNであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表115

R^{1a}がCNであり、R^{1b}がBrであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表116

R^{1a}がCNであり、R^{1b}がCNであり、ZがNCH(CH₃)₂であり、化合物に対するR⁶、R⁷、R⁸およびR⁹の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物

表117

R^{1a} がFであり、 R^{1b} がClであり、Zが $NCH(CH_3)_2$ であり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 およ

び R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物
表118

R^{1a} がClであり、 R^{1b} がFであり、Zが $NCH(CH_3)_2$ であり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物
表119

R^{1a} がFであり、 R^{1b} がBrであり、Zが $NCH(CH_3)_2$ であり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物
表120

R^{1a} がBrであり、 R^{1b} がFであり、Zが $NCH(CH_3)_2$ であり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.1の化合物。

10

【0154】

表121～240

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.2の化合物。

【0155】

表241～360

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.3の化合物。

20

【0156】

表361～480

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.4の化合物。

【0157】

表481～600

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.5の化合物。

30

【0158】

表601～720

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.6の化合物。

【0159】

表721～840

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.7の化合物。

40

【0160】

表841～960

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.8の化合物。

【0161】

表961～1080

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.9の化合物。

50

【0162】

表1081～1200

R^{1a} 、 R^{1b} およびZの組合せが、表1～120のいずれかにおいて定義された通りであり、化合物に対する R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 の組合せが、それぞれの場合に、表Aの1つの行に対応している、式Ia.10の化合物。

【表1】

番号	R^6	R^7	R^8	R^9
A-1	H	H	H	H
A-2	H	H	H	CH ₃
A-3	H	H	H	C ₂ H ₅
A-4	H	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-5	H	H	H	^c (CH ₂) ₃
A-6	H	H	H	CH ₂ CF ₃
A-7	H	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-8	H	H	H	C ₆ H ₅
A-9	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-10	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-11	H	H	H	C(CH ₃) ₃
A-12	H	H	H	CH ₂ CF ₃

10

20

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-13	H	H	H	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-14	H	H	H	CH ₂ C≡CH
A-15	H	H	CH ₃	H
A-16	H	H	CH ₃	CH ₃
A-17	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅
A-18	H	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-19	H	H	CH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-20	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-21	H	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-22	H	H	CH ₃	C ₆ H ₅
A-23	H	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-24	H	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-25	H	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-26	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-27	H	H	CH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-28	H	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-29	H	H	C ₂ H ₅	H
A-30	H	H	C ₂ H ₅	CH ₃
A-31	H	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-32	H	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-33	H	H	C ₂ H ₅	^o (CH ₂) ₃
A-34	H	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-35	H	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-36	H	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-37	H	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-38	H	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-39	H	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-40	H	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-41	H	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-42	H	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-43	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-44	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-45	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-46	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-47	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	^o (CH ₂) ₃
A-48	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-49	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-50	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-51	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-52	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-53	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-54	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-55	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-56	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-57	H	H	OCH ₃	H
A-58	H	H	OCH ₃	CH ₃
A-59	H	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-60	H	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-61	H	H	OCH ₃	C(CH ₂) ₃
A-62	H	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-63	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-64	H	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-65	H	H	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-66	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-67	H	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-68	H	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-69	H	H	OCH ₃	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-70	H	H	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-71	CH ₃	H	H	H
A-72	CH ₃	H	H	CH ₃
A-73	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
A-74	CH ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-75	CH ₃	H	H	C(CH ₂) ₃
A-76	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
A-77	CH ₃	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-78	CH ₃	H	H	C ₆ H ₅
A-79	CH ₃	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-80	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-81	CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₃
A-82	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
A-83	CH ₃	H	H	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-84	CH ₃	H	H	CH ₂ C≡CH
A-85	CH ₃	H	CH ₃	H
A-86	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-87	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
A-88	CH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-89	CH ₃	H	CH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-90	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-91	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-92	CH ₃	H	CH ₃	C ₆ H ₅
A-93	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-94	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-95	CH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-96	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-97	CH ₃	H	CH ₃	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-98	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-99	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H
A-100	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₃
A-101	CH ₃	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-102	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-103	CH ₃	H	C ₂ H ₅	^c (CH ₂) ₃
A-104	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-105	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-106	CH ₃	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-107	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-108	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-109	CH ₃	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-110	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-111	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-112	CH ₃	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-113	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-114	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-115	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-116	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-117	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	^c (CH ₂) ₃
A-118	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-119	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-120	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-121	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-122	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-123	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-124	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-125	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-126	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-127	CH ₃	H	OCH ₃	H
A-128	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₃
A-129	CH ₃	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-130	CH ₃	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-131	CH ₃	H	OCH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-132	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-133	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-134	CH ₃	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-135	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-136	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-137	CH ₃	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-138	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-139	CH ₃	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-140	CH ₃	H	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-141	C ₂ H ₅	H	H	H
A-142	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃
A-143	C ₂ H ₅	H	H	C ₂ H ₅
A-144	C ₂ H ₅	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-145	C ₂ H ₅	H	H	^o (CH ₂) ₃
A-146	C ₂ H ₅	H	H	CH ₂ CF ₃
A-147	C ₂ H ₅	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-148	C ₂ H ₅	H	H	C ₆ H ₅
A-149	C ₂ H ₅	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-150	C ₂ H ₅	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-151	C ₂ H ₅	H	H	C(CH ₃) ₃
A-152	C ₂ H ₅	H	H	CH ₂ CF ₃
A-153	C ₂ H ₅	H	H	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-154	C ₂ H ₅	H	H	CH ₂ C≡CH
A-155	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H
A-156	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃
A-157	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₂ H ₅
A-158	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-159	C ₂ H ₅	H	CH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-160	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-161	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-162	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C ₆ H ₅
A-163	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-164	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-165	C ₂ H ₅	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-166	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-167	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-168	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-169	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	H
A-170	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₃
A-171	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-172	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-173	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	^o (CH ₂) ₃
A-174	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-175	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-176	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-177	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-178	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-179	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-180	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-181	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-182	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-183	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-184	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-185	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-186	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-187	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	^o (CH ₂) ₃
A-188	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-189	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-190	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-191	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-192	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-193	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-194	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-195	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-196	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-197	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	H
A-198	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH ₃
A-199	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-200	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-201	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-202	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-203	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-204	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-205	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-206	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-207	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-208	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-209	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-210	C ₂ H ₅	H	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-211	CH(CH ₃) ₂	H	H	H
A-212	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃
A-213	CH(CH ₃) ₂	H	H	C ₂ H ₅
A-214	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-215	CH(CH ₃) ₂	H	H	^c (CH ₂) ₃
A-216	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂ CF ₃
A-217	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-218	CH(CH ₃) ₂	H	H	C ₆ H ₅
A-219	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-220	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-221	CH(CH ₃) ₂	H	H	C(CH ₃) ₃
A-222	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂ CF ₃
A-223	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-224	CH(CH ₃) ₂	H	H	CH ₂ C≡CH
A-225	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	H
A-226	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₃
A-227	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	C ₂ H ₅
A-228	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-229	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-230	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-231	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-232	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	C ₆ H ₅

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-233	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-234	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-235	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-236	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-237	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-238	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-239	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	H
A-240	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₃
A-241	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-242	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-243	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	^c (CH ₂) ₃
A-244	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-245	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-246	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-247	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-248	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-249	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-250	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-251	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-252	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-253	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-254	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-255	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-256	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-257	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	^c (CH ₂) ₃
A-258	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-259	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-260	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-261	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-262	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-263	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-264	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-265	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-266	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-267	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	H
A-268	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH ₃
A-269	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	C ₂ H ₅

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-270	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-271	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-272	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-273	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-274	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-275	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-276	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-277	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-278	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-279	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-280	CH(CH ₃) ₂	H	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-281	CH ₃	CH ₃	H	H
A-282	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
A-283	CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
A-284	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A-285	CH ₃	CH ₃	H	^c (CH ₂) ₃
A-286	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃
A-287	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-288	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅
A-289	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-290	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-291	CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
A-292	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃
A-293	CH ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-294	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
A-295	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
A-296	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
A-297	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
A-298	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-299	CH ₃	CH ₃	CH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-300	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-301	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-302	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
A-303	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-304	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-305	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-306	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-307	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-308	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-309	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H
A-310	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
A-311	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-312	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-313	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	^o (CH ₂) ₃
A-314	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-315	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-316	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-317	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-318	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-319	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-320	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-321	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-322	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-323	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-324	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-325	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-326	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-327	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	^o (CH ₂) ₃
A-328	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-329	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-330	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-331	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-332	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-333	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-334	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-335	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-336	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-337	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
A-338	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
A-339	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-340	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-341	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-342	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-343	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-344	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-345	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-346	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-347	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-348	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-349	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-350	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-351	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
A-352	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃
A-353	C ₂ H ₅	CH ₃	H	C ₂ H ₅
A-354	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A-355	C ₂ H ₅	CH ₃	H	^o (CH ₂) ₃
A-356	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃
A-357	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-358	C ₂ H ₅	CH ₃	H	C ₆ H ₅
A-359	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-360	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-361	C ₂ H ₅	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
A-362	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃
A-363	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-364	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
A-365	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
A-366	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃
A-367	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
A-368	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-369	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-370	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-371	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-372	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
A-373	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-374	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-375	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-376	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-377	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-378	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-379	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	H
A-380	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-381	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-382	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-383	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	^c (CH ₂) ₃
A-384	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-385	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-386	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-387	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-388	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-389	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-390	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-391	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-392	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-393	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-394	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-395	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-396	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-397	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	^c (CH ₂) ₃
A-398	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-399	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-400	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-401	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-402	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-403	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-404	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-405	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-406	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-407	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	H
A-408	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
A-409	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-410	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-411	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-412	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-413	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-414	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-415	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-416	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-417	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	C(CH ₃) ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-418	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-419	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-420	C ₂ H ₅	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-421	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H
A-422	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₃
A-423	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	C ₂ H ₅
A-424	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A-425	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	C(CH ₂) ₃
A-426	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃
A-427	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-428	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	C ₆ H ₅
A-429	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-430	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-431	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	C(CH ₃) ₃
A-432	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃
A-433	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-434	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
A-435	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H
A-436	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃
A-437	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
A-438	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-439	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	C(CH ₂) ₃
A-440	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-441	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-442	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅
A-443	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-444	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-445	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-446	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-447	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-448	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-449	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	H
A-450	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
A-451	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-452	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-453	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₂) ₃
A-454	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-455	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-456	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-457	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-458	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-459	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-460	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-461	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-462	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-463	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-464	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-465	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-466	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-467	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₂) ₃
A-468	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-469	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-470	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-471	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-472	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-473	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-474	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-475	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-476	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-477	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	H
A-478	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
A-479	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-480	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-481	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	C(CH ₂) ₃
A-482	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-483	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-484	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-485	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-486	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-487	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-488	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-489	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃)C(CH ₂) ₃
A-490	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-491	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-492	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃
A-493	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
A-494	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂
A-495	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	^o (CH ₂) ₃
A-496	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CF ₃
A-497	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-498	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅
A-499	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-500	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-501	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₃
A-502	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CF ₃
A-503	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-504	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₂ C≡CH
A-505	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
A-506	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
A-507	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅
A-508	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-509	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-510	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-511	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-512	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₅
A-513	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-514	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-515	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-516	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-517	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-518	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-519	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
A-520	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
A-521	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-522	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-523	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	^o (CH ₂) ₃
A-524	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-525	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-526	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-527	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-528	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-529	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-530	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-531	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-532	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-533	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-534	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-535	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-536	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-537	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	^o (CH ₂) ₃
A-538	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-539	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-540	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-541	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-542	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-543	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-544	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-545	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-546	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-547	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	H
A-548	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
A-549	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-550	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-551	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-552	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-553	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-554	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-555	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-556	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-557	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-558	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-559	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-560	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-561	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	H
A-562	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₃
A-563	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅
A-564	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ₂
A-565	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	^o (CH ₂) ₃

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-566	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CF ₃
A-567	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-568	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	C ₆ H ₅
A-569	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₂ C ₆ H ₅
A-570	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-571	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	C(CH ₃) ₃
A-572	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₂ CF ₃
A-573	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-574	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	CH ₂ C≡CH
A-575	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	H
A-576	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
A-577	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅
A-578	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-579	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	^o (CH ₂) ₃
A-580	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-581	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-582	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₆ H ₅
A-583	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-584	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-585	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-586	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-587	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-588	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-589	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
A-590	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
A-591	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-592	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-593	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	^o (CH ₂) ₃
A-594	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-595	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-596	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-597	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-598	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-599	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-600	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-601	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^o (CH ₂) ₃
A-602	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-603	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-604	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-605	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-606	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂
A-607	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	^c (CH ₂) ₃
A-608	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-609	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-610	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-611	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-612	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-613	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-614	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-615	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-616	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-617	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	H
A-618	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃
A-619	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-620	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-621	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-622	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-623	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-624	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-625	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-626	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-627	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-628	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-629	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-630	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-631	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H
A-632	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃
A-633	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	C ₂ H ₅
A-634	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂
A-635	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	^c (CH ₂) ₃
A-636	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CF ₃
A-637	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH=CH ₂
A-638	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	C ₆ H ₅
A-639	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ C ₆ H ₅

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-640	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-641	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	C(CH ₃) ₃
A-642	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ CF ₃
A-643	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ^α (CH ₂) ₃
A-644	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ C≡CH
A-645	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H
A-646	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃
A-647	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₂ H ₅
A-648	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-649	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	^α (CH ₂) ₃
A-650	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-651	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-652	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C ₆ H ₅
A-653	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-654	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-655	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-656	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ CF ₃
A-657	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ^α (CH ₂) ₃
A-658	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ C≡CH
A-659	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	H
A-660	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₃
A-661	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
A-662	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂
A-663	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	^α (CH ₂) ₃
A-664	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-665	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH=CH ₂
A-666	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅
A-667	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅
A-668	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-669	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
A-670	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ CF ₃
A-671	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ^α (CH ₂) ₃
A-672	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	CH ₂ C≡CH
A-673	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-674	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-675	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	C ₂ H ₅
A-676	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-677	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	^c (CH ₂) ₃
A-678	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-679	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂
A-680	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	C ₆ H ₅
A-681	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
A-682	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-683	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃
A-684	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃
A-685	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-686	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ C≡CH
A-687	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	H
A-688	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₃
A-689	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	C ₂ H ₅
A-690	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-691	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	^c (CH ₂) ₃
A-692	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-693	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
A-694	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	C ₆ H ₅
A-695	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅
A-696	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-697	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	C(CH ₃) ₃
A-698	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₂ CF ₃
A-699	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH(CH ₃) ^c (CH ₂) ₃
A-700	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	OCH ₃	CH ₂ C≡CH
A-701	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-702	CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-703	C ₂ H ₅	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-704	CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-705	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-706	C ₂ H ₅	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-707	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-708	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-709	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-710	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
A-711	H	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	
A-712	CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	
A-713	C ₂ H ₅	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	

10

20

30

40

番号	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
A-714	CH(CH ₃) ₂	H		-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
A-715	CH ₃	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
A-716	C ₂ H ₅	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
A-717	CH(CH ₃) ₂	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
A-718	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
A-719	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅		-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -
A-720	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂		-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -

$\eta(\text{CH}_2)_3$ = シクロプロピル

【0163】

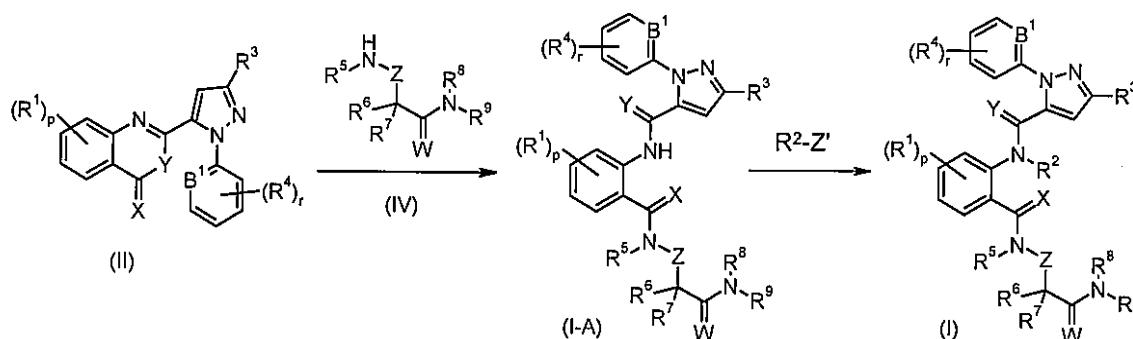
式(I)の化合物は、有機化学の標準的方法、例えばスキーム1~12においておよび実施例の合成の記載において本明細書で以下に記載されている方法により調製することができる。スキーム1~12の置換基、変数およびインデックスは、他で特定されていない限り、式(I)に対して上記に定義された通りである。

【0164】

式(I)の化合物は、以下のスキーム1に示されているように調製することができる。

【化6】

スキーム1



【0165】

式(II)の化合物を、式(IV)の化合物と反応させることによって、式(I-A)の化合物を得る。反応は、極性または無極性の非プロトン性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、アセトニトリル、ジメチルスルホキシドまたはピリジンなどの中で、またはこれらの溶媒の混合物の中で、0℃~100℃の間、好ましくは20℃~90℃の間の温度範囲内で適切に行う。式(I-A)の化合物(式中、R²はHである)を、化合物(I)(式中、R²はHではない)に変換するため、式(I-A)の化合物を、式R²-Z'の化合物(式中、R²はHではなく、Z'は脱離基、例えば、臭素、塩素またはヨウ素原子であるか、またはトシレート、メシレートまたはトリフレートなどである)と反応させることによって、式(I)の化合物を得ることができる。反応は、塩基、例えば水素化ナトリウムまたは水素化カリウムなどの存在下、適切には、極性の非プロトン性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、アセトニトリル、ジメチルスルホキシドまたはピリジンなど、またはこれらの溶媒の混合物の中で、0℃~100℃の間の温度範囲内で適切に行う。式Iの化合物に対する他の調製方法もまた、例えばWO 01/70671に記載されているような類似の反応から適応させることもできる。

【0166】

式(II)のベンゾオキサジノン(ベンゾオキサジンチオン)およびベンゾチアジノン(ベンゾチアジンチオン)は、公知の方法を介して、例えばアントラニル酸またはイサト酸無水物のいずれかと、酸塩化物とのカップリングを介して入手可能である。ベンゾオキサジノ

ンの合成および化学反応への参照については、Jacobsenら、Bioorganic and Medicinal Chemistry、2000年、8巻、2095～2103頁およびその中に引用された参考文献を参照されたい。Coppola、J. Heterocyclic Chemistry、1999年、36巻、563～588頁も参照されたい。式(II)のベンゾオキサジノン(ベンゾオキサジンチオン)はまた、WO 04/046129またはWO 04/011447に記載されている手順に従い、ならびにその中に引用された参考文献およびその適切な改変形態に従い調製することもできる。

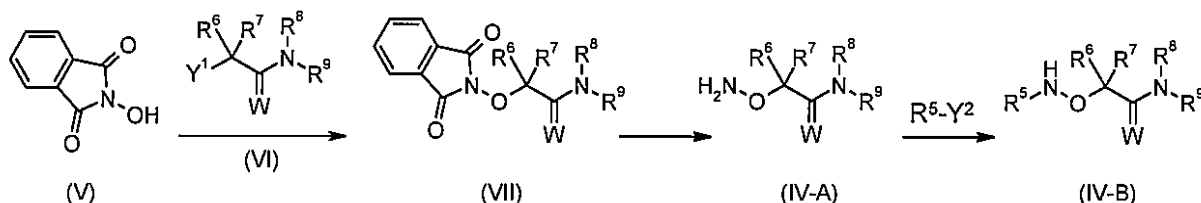
【0167】

Zが酸素原子であり、 R^6 または R^7 のいずれか1つがHであり、 $R^5 \sim R^9$ が、他に式(I)に対して記載されている通りである式(IV)の化合物は、以下のスキーム2に示されているように得ることができる。

10

【化7】

スキーム2



【0168】

20

N-ヒドロキシフタルアミド(V)と、式(VI)の化合物(式中、Y¹は、クロロ、ブロモ、ヨードまたはヒドロキシル基である)との反応により、式(VII)の化合物を得る。Y¹がヒドロキシルである場合を除いて、反応は、塩基、例えば第I族金属炭酸塩、トリアルキルアミンまたは第I族金属水素化物などの存在下、非プロトンの極性溶媒、例えばN-メチルピロリジン-2-オン、N,N-ジメチルホルムアミドまたはテトラヒドロフランなどの存在下、25℃～180℃の間で行う。Y¹がヒドロキシルである場合、反応は、適切なトリアルキルまたはトリアリールホスフィン試薬およびN,N'-アゾジカルボン酸ジアルキル試薬の存在下、Organic Letters、2009年、11巻(9号)、2019～2022頁またはSynthesis、(4巻)、655～659頁、およびその中の参考文献に記載されている条件と同じ様に、Mitsunobu反応により進行させることができる。式(IV-A)の化合物は、式(IV)の化合物(式中、Zは酸素であり、 R^5 は水素であり、 R^6 および R^7 のいずれか1つが水素である)の特別な場合であるが、これを得るための式(VII)の化合物のフタルアミド保護基の切断を、ヒドラジンまたはメチルヒドラジンの存在下、極性のプロトン性溶媒、例えばメタノールまたはエタノールなどの中で、0℃～80℃の間で行う。式(IV-B)の化合物は、式(IV)(式中、Zは酸素であり、 R^6 および R^7 のいずれか1つは水素である)の特別な場合であるが、式(IV-A)の化合物から出発して、式 R^5 -Y²のアルキル化基の存在下、弱塩基、例えばトリアルキルアミン、炭酸ナトリウム、または炭酸カリウムなど、および非プロトンの極性溶媒、例えばジクロロメタン、クロロホルム、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチル-アセトアミドまたはN-メチルピロリジン-2-オンなどの中で、0℃～150℃の間でこれを合成する。 R^5 は、式(I)に対して定義された通りであり、Y²は、脱離基、例えば、クロロ、ブロモまたはヨード基などである。式(IV-A)および(IV-B)の化合物は、式(IV)の化合物と式(II)の化合物との反応と同様に反応させることによって、上記スキーム1に記載されているように、式(I-A)および(I)の化合物を逐次的に得ることができる。

30

40

【0169】

式(VI)の化合物は、それぞれのアミン R^8R^9NH と、相当する酸塩化物(Y¹)(R^6)(R^7)CCOClとの以下の標準的アミド結合形成により得ることができる。

【0170】

式(IV-A)および(IV-B)の化合物(式中、 R^6 および R^7 は両方ともアルキル基である)は、以下の通り調製することができる：

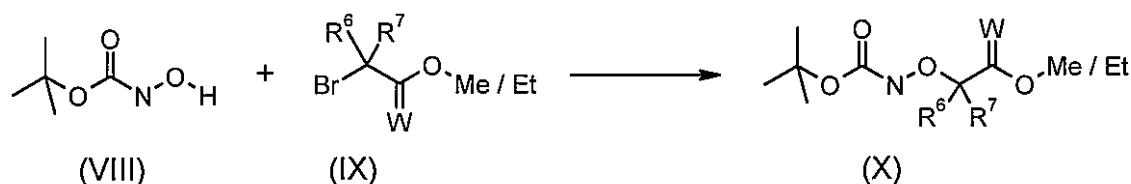
化合物(X)を得るための、化合物(VIII)と化合物(IX)との反応は、J. Medicinal Chemis

50

try、2008年、41巻(15号)、4601～4608頁(有用な情報、化合物I-d)の文献手順に従い実行できる。以下のスキーム3も参照されたい。

【化8】

スキーム3



“Me”はメチルを意味し、“Et”はエチルを意味する。

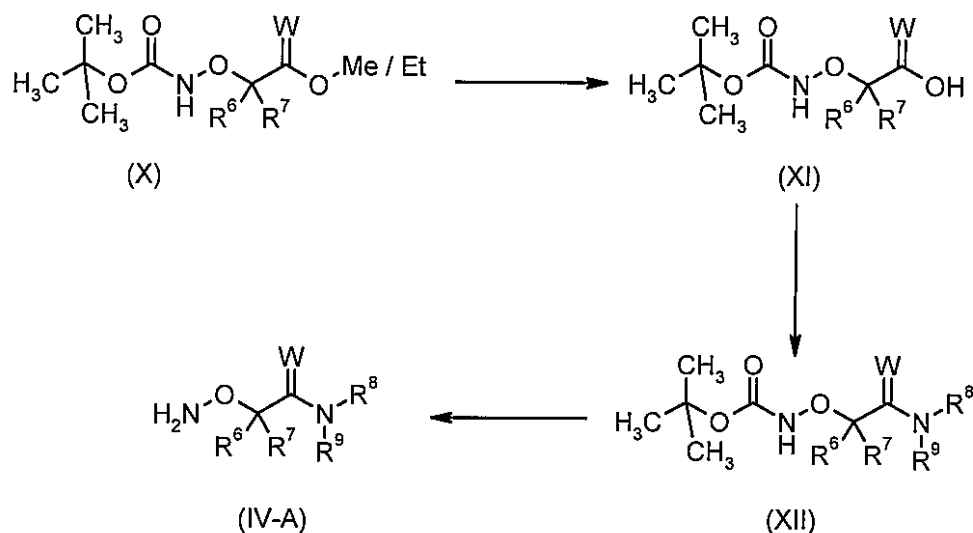
10

【0171】

以下のスキーム4に示されているように、化合物(X)は、標準的エステル加水分解条件を使用して、例えば、適切な極性のプロトン性溶媒または溶媒混合物中で金属水酸化物などを使用して、遊離酸(XI)へ加水分解することができる。標準的なアミドカップリング条件下で、遊離酸を、適切なアミン HNR^8R^9 で処理することによって、アミド(XII)が与えられる。

【化9】

スキーム4



“Me”はメチルを意味し、“Et”はエチルを意味する。

20

30

【0172】

酸性条件下、tert-ブチルカルバメートは、Greene, T. W.; Wutz, P. G. M., *Protective Groups in Organic Synthesis*, Wiley、第4版に記載されているように、遊離のアミンへと分解されることが知られている。したがって、式(IV-A)の化合物(式中、 R^6 および R^7 のどちらも水素原子ではなく、置換基は、式(I)に対して他で定義された通りである)は、非プロトンの有機溶媒中、 0°C ～ 50°C の間の温度で、式(XII)の化合物を、濃縮鉱酸またはトリフルオロ酢酸と反応させることによって、調製することができる。

40

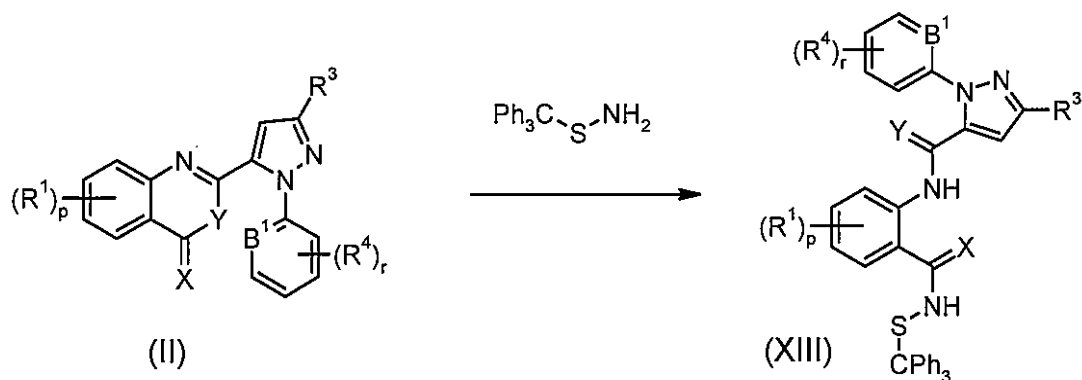
【0173】

化合物(IV)において、 R^5 が水素であり、Zが硫黄である特別な場合、これらの中間体は、以下の通り調製し、化合物(II)と同様にさらに反応させることによって、式(I)の化合物(式中、 R^5 はHであり、Zは硫黄である)を得ることができる：

式(II)の化合物を、市販されている、化合物 $\text{PH}_3\text{C}-\text{S}-\text{NH}_2$ 、(式中、Phはフェニルである)と反応させる(以下のスキーム5を参照されたい)。

【化 10】

スキーム5



10

“Ph”はフェニルを意味する。

【0174】

反応は、非プロトン性溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、アセトニトリル、ジメチルスルホキシドまたはピリジンなど、またはこれらの溶媒の混合物の中で、0℃～100℃の間、好ましくは20℃～90℃の間の温度範囲内で行う。

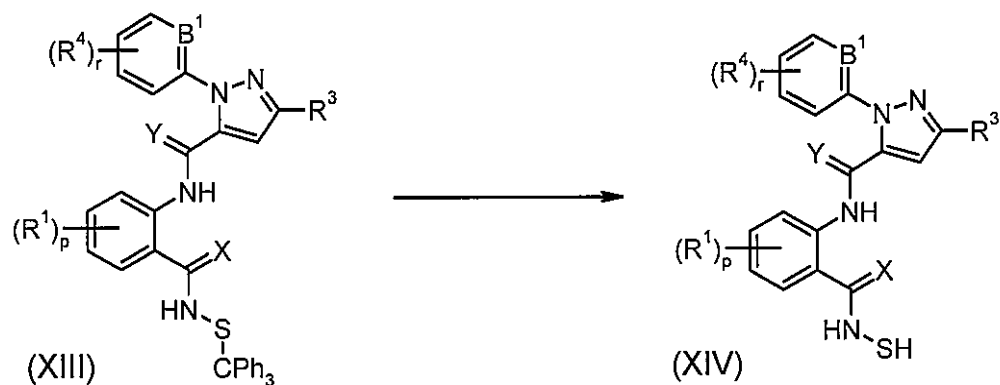
【0175】

化合物(XIII)は、還元条件下、例えば、トリフルオロ酢酸の存在下でトリアルキルシランなどを使用して、化合物(XIV)へ加水分解することができる(例えば、Chemistry, A European Journal、2003年、9巻(15号)、3683～91頁)、以下のスキーム6も参照されたい。

20

【化 11】

スキーム6



30

“Ph”はフェニルを意味する。

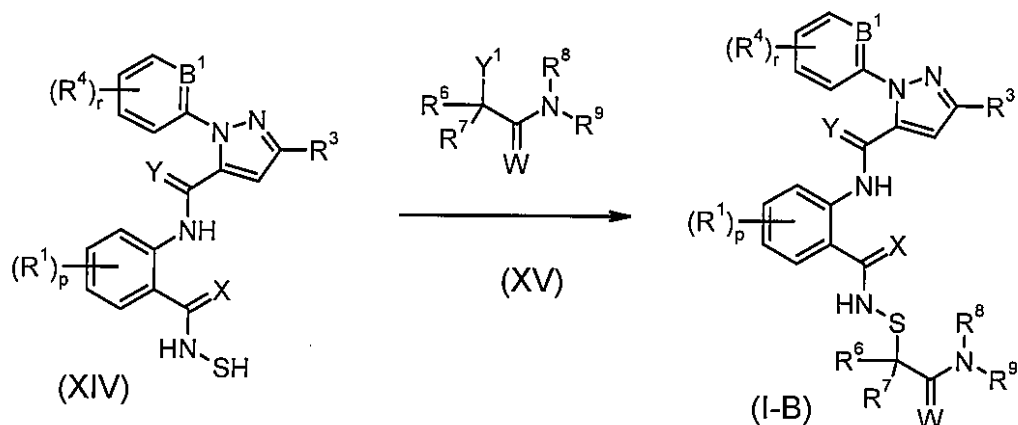
【0176】

以下のスキーム7から見るように、化合物(XIV)は、適切な非プロトン性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、アセトニトリル、N-メチル-ピロール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、N,N-ジメチルホルムアミドなど、または上記溶媒の適切な混合物の中で、適切な塩基、例えば金属水酸化物、金属水素化物、金属炭酸塩または金属アルコキシドなどを使用して、式(XV)の化合物(式中、Y¹は脱離基である)でアルキル化することができ、化合物(I-B)(式中、ZはSであり、R²およびR⁵はHである)が生じる。

40

【化 1 2】

スキーム7



10

【0177】

化合物(IV)において、 R^5 が水素であり、 Z が NR^{12a} である場合、これらの中間体は、以下の通り調製し、化合物(IV)と同様にさらに反応させることによって、式(I)の化合物(式中、 R^5 はHであり、 Z は NR^{12a} である)を得ることができる：

以下のスキーム8において見ることができるよう、化合物(XV)は、適切な溶媒、例えばジメチルスルホキシド、アセトニトリル、N-メチル-ピロール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、N,N-ジメチルホルムアミドなどまたは上記溶媒の適切な混合物を使用して、 $0^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の間、好ましくは $20^\circ\text{C} \sim 90^\circ\text{C}$ の間の温度範囲で、水性ヒドラジンで処理することによって、化合物(XVI)を得ることができる。

20

【0178】

化合物(II)は、適切な溶媒、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、アセトニトリル、ジメチルスルホキシドまたはピリジンなど、またはこれらの溶媒の混合物を使用して、 $0^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の間、好ましくは $20^\circ\text{C} \sim 90^\circ\text{C}$ の間の温度範囲で、化合物(XVI)で開環することによって、化合物(I-C)を得ることができる。

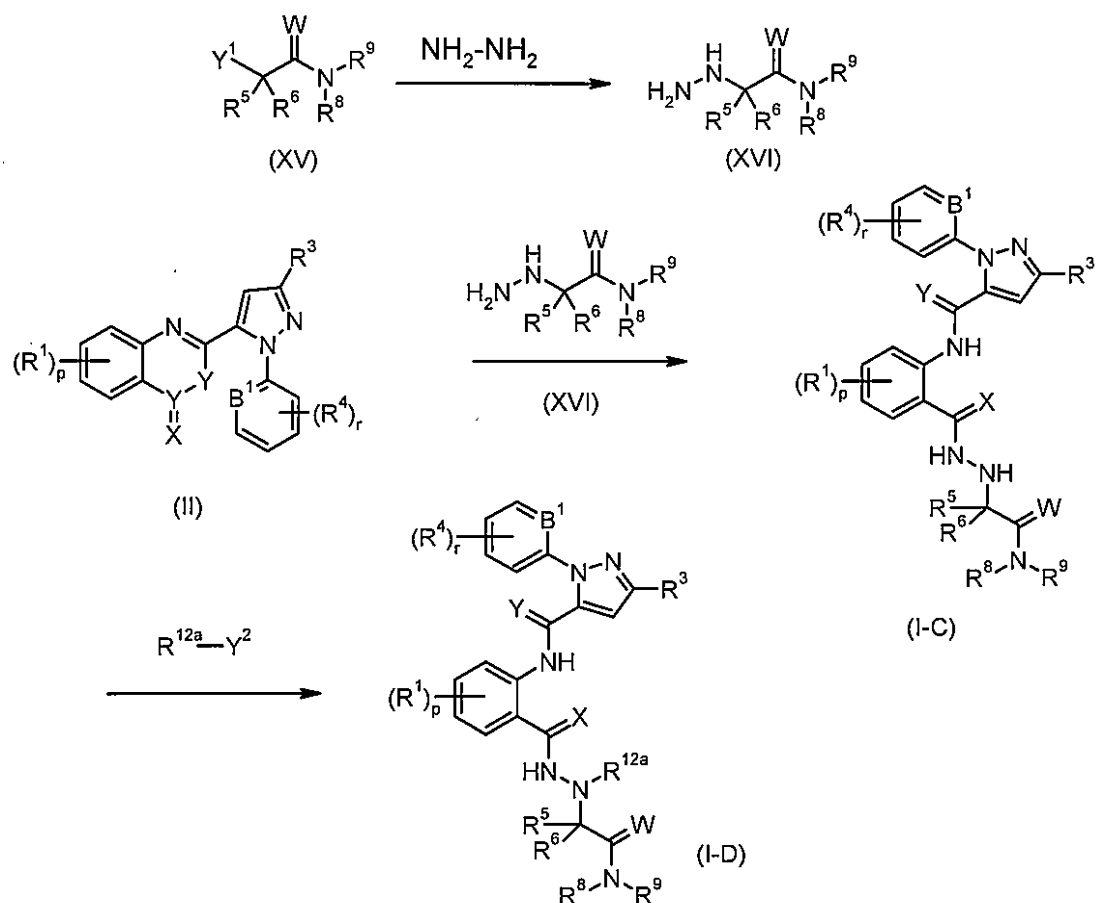
【0179】

化合物(I-C)は、適切な塩基、例えば金属水酸化物、アルコキシド、アミド、炭酸塩もしくは水素化物、またはトリアルキルアミンなどの存在下または不在下で、適切な溶媒中で、式 $R^{12a}-Y^2$ の化合物(式中、 R^{12a} および Y^2 は、上記に定義された通りである)で処理することによって、化合物I-D(式中、 Z は NR^{12a} であり、 R^2 および R^5 はHである)を得ることができる。

30

【化 1 3】

スキーム8



10

20

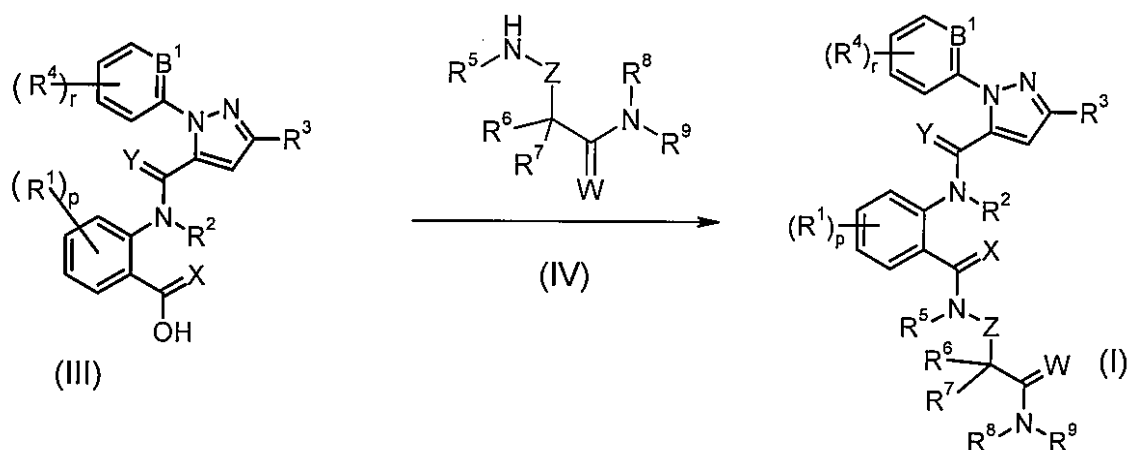
【0180】

代わりに、式(I)の化合物はまた、以下のスキーム9において示されているように、式(II)の化合物と、式(IV)の化合物とを反応させることによって調製することもできる。

30

【化 1 4】

スキーム9



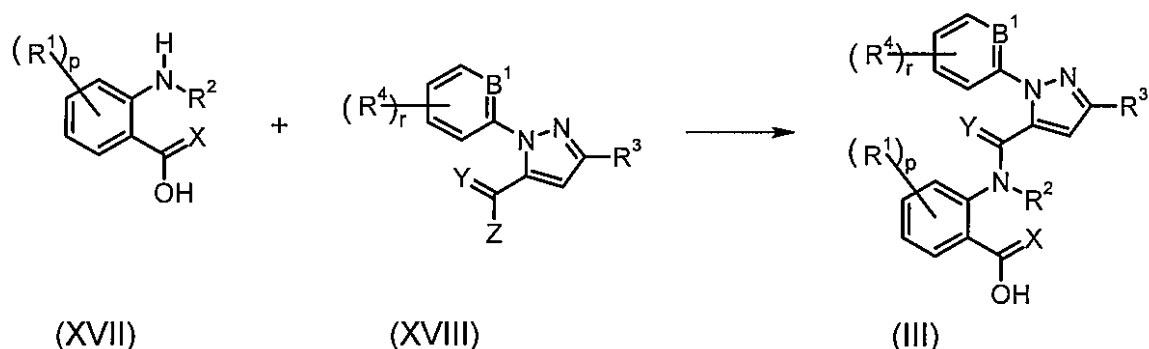
40

【0181】

式(III)の化合物は、以下のスキーム10に示されているように、式(XVII)の化合物を、化合物(XVIII)と反応させることによって調製することができる。

【化 1 5】

スキーム10



10

【0182】

Zは、脱離基、例えばハロゲン、特にCl、OHなど、または活性化したエステル基由来の基、例えば4-ニトロフェノキシもしくはペンタフルオロフェノキシなどである。反応は、例えばWO 2003/15519、WO 2006/062978、WO 2008/007158またはWO 2009/111553に記載されているような公知のアミド形成反応と同じ様に行うことができる。特にZがハロゲンの場合、反応は塩基の存在下で行うことが適切である。適切な塩基は、上に列挙した塩基である。特にZがハロゲンの場合、塩基に加えてまたは塩基の代わりに、アミド化触媒を使用することができる。適切なアミド化触媒は、ジアルキルアミノピリジン、例えば4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン(4-DMAP)などである。

20

【0183】

ZがClである式XVIIIの化合物は、ZがOHである式XVIIIの化合物を、例えばWO 2006/062978、WO 2008/07158またはWO 2009/111553において記載されているようなハロゲン化剤、例えば塩化スルホニル、例えば $SOCl_2$ 、塩化アルキルスルホニル、例えば塩化メタンスルホニル、または塩化アリールスルホニル、例えば塩化トシルもしくは塩化ベンゼンスルホニル、または塩化オキサリルとその場で反応させることによって調製することができる。

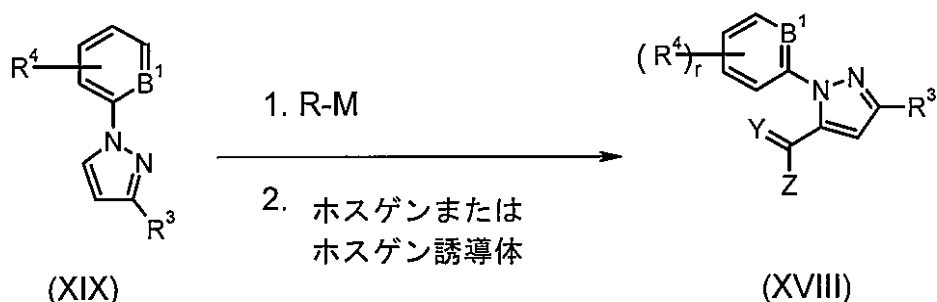
【0184】

式XVIIIの化合物は、スキーム11において描写されているように調製することができる。

30

【化 1 6】

スキーム11



40

【0185】

第1ステップでは、炭素結合または窒素結合したリチウムを有するリチウム有機塩基、または炭素結合したマグネシウムを有するマグネシウム有機塩基、例えばn-ブチルリチウム、リチウムジアルキルアミド、特にリチウムジイソプロピルアミド、ならびにアルキルおよびシクロアルキルマグネシウムハライド、例えばメチルマグネシウムクロリド、エチルマグネシウムクロリド、n-プロピルマグネシウムクロリド、イソプロピルマグネシウムクロリド、メチルマグネシウムブロミド、エチルマグネシウムブロミド、n-プロピルマグネシウムブロミドおよびイソプロピルマグネシウムブロミドから選択される塩基R-Mで、

50

ピラゾール(XIX)を脱プロトン化する。脱プロトン化は、非プロトン性有機溶媒中で適切に行う。適切な非プロトン性有機溶媒として、例えば、脂肪族 $C_3 \sim C_6$ エーテル、例えばジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジプロピルエーテル、メチルイソブチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテルおよびtert-ブチルエチルエーテルなど、脂環式 $C_3 \sim C_6$ エーテル、例えばテトラヒドロフラン(THF)、テトラヒドロピラン、2-メチルテトラヒドロフラン、3-メチルテトラヒドロフランおよびジオキサンなど、脂肪族炭化水素、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタンおよびオクタンなど、さらに石油エーテル、脂環式炭化水素、例えばシクロペンタンおよびシクロヘキサンなど、芳香族炭化水素、例えばベンゼン、トルエン、キシレンおよびメシチレンなど、またはこれらの溶媒の混合物が挙げられる。

10

【0186】

次いで、脱プロトン化した化合物は、これをホスゲンまたはホスゲン同等物、例えばジホスゲン(すなわちクロロギ酸トリクロロメチル)などからなる群から選択される試薬と反応させることによって、クロロカルボニル化の対象とする。

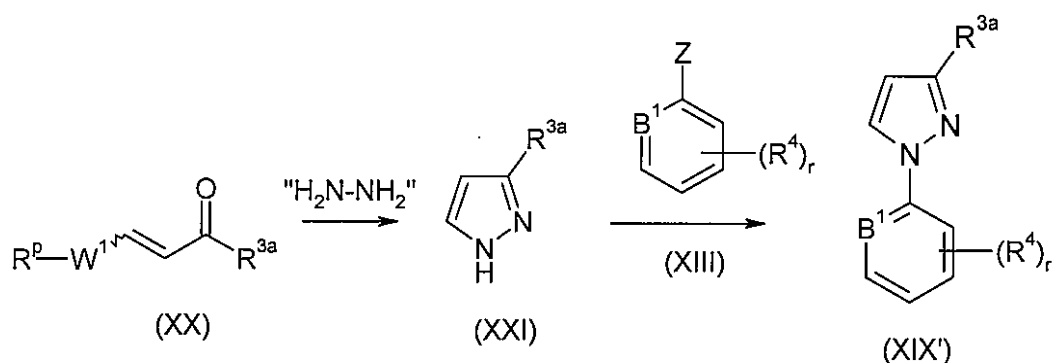
【0187】

式XIXの化合物は、例えばWO 2003/015519またはWO 2003/106427から公知であり、またはその中にまたはWO 2008/126858、WO 2008/126933、WO 2008/130021、WO 2007/043677およびBioorganic and Medicinal Chemistry Letters、2005年、15巻、4898~4906頁において記載されている方法と類似の方法で調製することができる。式XIXの化合物(式中、 R^3 はC結合している基 R^{3a} である)(化合物XIX')は、例えば以下のスキーム12に描写されている

20

【化17】

スキーム12



30

【0188】

W^1 はOまたはSである。Zは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルチオ、 $-S(O)R^{bb}$ 、 $-S(O)_2R^{bb}$ 、 $-OS(O)R^{bb}$ 、 $-OS(O)_2R^{bb}$ および $-NO_2$ など(R^{bb} は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルまたはフェニルである)の適切な脱離基であり、この基は、非置換であるか、またはハロゲンおよび $C_1 \sim C_4$ -アルキルから選択される1、2または3つの基を保有する。 R^p は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルおよび $C_1 \sim C_6$ -ハロシクロアルキルからなる群から選択される。第1および第2のステップの反応は、WO 2008/126858、WO 2008/126933、WO 2008/130021、WO 2007/043677およびBioorganic and Medicinal Chemistry Letters、2005年、15巻、4898~4906頁に記載されている方法と類似の方法で実施することができる。スキーム12に描写されている第1ステップでは、式XXの化合物は、ヒドラジンまたはヒドラジン水和物またはその塩(H_2N-NH_2)と反応する。反応は、溶媒中で適切に行う。適切な溶媒として、水および極性のプロトン性有機溶媒およびその混合物が挙げられる。適切な極性のプロトン性溶媒の例は、特にアルコール、例えば $C_1 \sim C_4$ -アルカノール、 $C_2 \sim C_4$ -アルカンジオール、例えばエチレングリコールまたはプロピレングリコール、ジ-およびトリ- $C_2 \sim C_3$ -アルキレンエーテル、例えばジエチレングリコールまたはトリエチレン

40

50

グリコール、モノ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルエーテルなど、特に $C_2 \sim C_4$ -アルカンジオールのモノメチルエーテル、例えばエチレングリコールモノメチルエーテル、またはモノ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルエーテル、特にジ-またはトリ- $C_2 \sim C_3$ -アルキレンエーテルのモノメチルエーテル、およびこれらの混合物である。スキーム12の第1ステップは酸の存在下で行うことが有利であると判明した。適切な酸は、特に強酸、例えば塩酸、硫酸、硝酸など、または有機スルホン酸、例えばアルキルスルホン酸またはアリールスルホン酸などである。

【0189】

第2のステップでの反応は、溶媒中で適切に行う。適切な溶媒は非プロトン性である。適切な非プロトン性溶媒の例は、ハロゲン化アルカン、例えば塩化メチレン、クロロホルムまたは1,2-ジクロロエタンなど、芳香族炭化水素、例えばベンゼン、トルエン、キシレンまたはクロロベンゼンなど、開鎖エーテル、例えばジエチルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル、ジイソプロピルエーテルまたはメチル-イソブチルエーテルなど、環式エーテル、例えばテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサンまたは2-メチルテトラヒドロフランなど、脂肪族カルボン酸のN,N-ジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミド、例えばN,N-ジメチルホルムアミドまたはN,N-ジメチルアセトアミドなど、N- $C_1 \sim C_4$ -アルキルラクタム、例えばN-メチルピロリジノンなど、スルホキシド、例えばジメチルスルホキシドなど、ニトリル、例えばアセトニトリルまたはプロピオニトリルなど、およびピリジン、例えば、ピリジン、2,6-ジメチルピリジンまたは2,4,6-トリメチルピリジンなどである。スキーム12の第2のステップを塩基の存在下で行うことが有利であると判明した。適切な塩基は、例えば金属水酸化物、特にアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムなど、炭酸塩、特にアルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウムまたは炭酸カリウムなど、リン酸塩またはリン酸水素塩、特にアルカリ金属リン酸塩またはリン酸水素塩、例えばリン酸リチウム、リン酸ナトリウムまたはリン酸カリウムなど、またはリン酸水素リチウム、リン酸水素ナトリウムまたはリン酸水素カリウム、アルコキシド、特にアルカリ金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシドもしくはカリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドもしくはカリウムエトキシド、またはナトリウムtert-ブトキシドもしくはカリウムtert-ブトキシド、およびアミン塩基、例えばアンモニアおよび有機アミンなど、例えばジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミン、トリ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミン、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルアミン、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル-ジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミンまたは環式アミン、例えばジメチルアミン、ジエチルアミン、ジイソプロピルアミン、シクロヘキシルアミン、ジメチルシクロヘキシルアミン、トリメチルアミン、ジエチルアミンまたはトリエチルアミンなど、ピペリジンおよびN-メチルピペリジンである。

【0190】

通例として、これらの立体異性体、塩、互変異性体およびN-オキシドを含む式(I)の化合物および合成方法におけるこれらの前駆体は、上記に記載されている方法で調製することができる。個々の化合物が上に記載された経路を介して調製することができない場合、これらは、他の化合物(I)もしくはそれぞれの前駆体の誘導体化、または記載されている合成経路の慣習的な改変により調製することができる。例えば、個々の場合において、式(I)のある化合物は、式(I)の他の化合物から、誘導体化、例えばエステル加水分解、アミド化、エステル化、エーテル切断、オレフィン化、還元、酸化などにより、または記載されている合成経路の慣習的な改変により有利に調製することができる。

【0191】

反応混合物は、慣習的方式で、例えば水と混合し、相を分離し、適当であれば、例えばアルミナまたはシリカゲル上で、クロマトグラフィーにより粗生成物を精製することによって、ワークアップを行う。中間体および最終生成物の一部は、無色または薄茶色の粘性の油の形態で得ることができ、減圧下および適度な高温でこれを揮発性成分から遊離または精製する。中間体および最終生成物を固体として得た場合、これらは再結晶化または粉碎により精製することができる。

【0192】

これらの優れた活性により、本発明の化合物は、有害無脊椎動物を防除するために使用

10

20

30

40

50

することができる。

【0193】

したがって、本発明はまた、有害無脊椎動物を防除するための方法であって、有害生物、これらの食物供給、これらの生息地もしくはこれらの繁殖地、もしくは有害生物が成長しているもしくは成長し得る、栽培植物、植物繁殖材料(例えば種子など)、土壌、領域、材料もしくは環境、または有害生物の攻撃もしくは侵襲から保護すべき材料、栽培植物、植物繁殖材料(例えば種子など)、土壌、表面もしくは空間を、上記に定義されたような本発明の化合物または組成物の殺有害生物有効量で処理することを含む方法も提供する。

【0194】

好ましくは、本発明の方法は、植物繁殖材料(例えば種子など)およびそれから成長する植物を、有害無脊椎動物の攻撃または侵襲から保護する役目を果たし、上記に定義されたような本発明の化合物の殺有害生物有効量、または上記および以下に定義されたような農業用組成物の殺有害生物有効量を用いて、植物繁殖材料(例えば種子など)を処理することを含む。本発明の方法は、本発明に従い処理した「基質」(植物、植物繁殖材料、土壤材料など)の保護に限定されないばかりか、予防的効果も有し、したがって、例えば、植物それ自体が処理されていなくても、処理した植物繁殖材料(例えば種子など)から成長する植物に保護を施す。

【0195】

本発明の意味において、「有害無脊椎動物」とは、好ましくは節足動物および線虫から、より好ましくは有害な昆虫、クモおよび線虫から、さらにより好ましくは昆虫、コナダニおよび線虫から選択される。本発明の意味において、「有害無脊椎動物」は最も好ましくは昆虫である。

【0196】

本発明は、有害無脊椎動物を駆除するための農業用組成物であって、殺有害生物性作用を有するような量の少なくとも1種の本発明による化合物および少なくとも1種の農学的に許容される不活性な液体および/または固形の担体、ならびに所望する場合、少なくとも1種の界面活性剤を含む農業用組成物をさらに提供する。

【0197】

このような組成物は、本発明の単一の活性化合物または本発明のいくつかの活性化合物の混合物を含み得る。本発明による組成物は、個々の異性体もしくは異性体の混合物、または塩ならびに個々の互変異性体または互変異性体の混合物を含み得る。

【0198】

これらの塩、立体異性体および互変異性体を含む本発明の化合物は、有害節足動物、例えばクモ、多足類および昆虫ならびに線虫を効率的に防除することに対して特に適切である。これらは、以下の有害生物を効率的に駆除または防除することに対して特に適切である：

鱗翅目(Lepidoptera)に由来する昆虫、例えば、アグロティス・イプシロン(*Agrotis ypsilon*)、アグロティス・セゲタム(*Agrotis segetum*)、アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillacea*)、アンチカルシア・ゲマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、アルギレスチア・コンジュゲラ(*Argyresthia conjugella*)、オートグラファ・ガンマ(*Autographa gamma*)、ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、カコエキア・ムリナナ(*Cacoecia murinana*)、カプア・レチキュラナ(*Capua reticulana*)、ケイマトビア・ブルマタ(*Cheimatobia brumata*)、コリストネウラ・フミフェラナ(*Choristoneura fumiferana*)、コリストネウラ・オシデンタリス(*Choristoneura occidentalis*)、キルフイス・ユニパンクタ(*Cirphis unipuncta*)、シディア・ポモネラ(*Cydia pomonella*)、デンドロリマス・ピニ(*Dendrolimus pini*)、ジアファニア・ニチダリス(*Diaphania nitidalis*)、ジアトラエア・グランジオセラ(*Diatraea grandiosella*)、エアリアス・インスラナ(*Earias insulana*)、エラスモパルパス・リグノセラス(*Elasmopalpus lignosellus*)、エウポエキリア・アンビゲラ(*Eupoeecilia ambiguella*)、エベトリア・ボーリアナ(*Evetria bouliana*)、フェルチア・サブテラネア(*Feltia subterranea*)、ガレリア・メロネラ(*Galleria mellonella*)、グラホリタ

・フネブラナ(*Grapholitha funebrana*)、グラホリタ・モレスタ(*Grapholitha molesta*)、ヘリオチス・アルミゲラ(*Heliothis armigera*)、ヘリオチス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)、ヘリオチス・ゼア(*Heliothis zea*)、ヘルラ・ウンダリス(*Hellula undalis*)、ヒベルニア・デフォリアリア(*Hibernia defoliaria*)、ヒファントリア・クネア(*Hyphantria cunea*)、ヒポノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコベルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、ラムジナ・フィスセラリア(*Lambdina fiscellaria*)、ラフィグマ・エキシグア(*Laphygma exigua*)、ロイコプテラ・コフェーラ(*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、リトコレティス・ブランカルデラ(*Lithocolletis blancardella*)、ロベシア・ボトラナ(*Lobesia botrana*)、ロキソステジ・スティクティカリス(*Loxostege sticticalis*)、リマントリア・ジスパー(*Lymantria dispar*)、リマントリア・モナカ(*Lymantria monacha*)、リオネチア・クレルケラ(*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ニューストリア(*Malacosoma neustria*)、マメストラ・ブラシカエ(*Mamestra brassicae*)、オルギア・シュードツガタ(*Orgyia pseudotsugata*)、オストロニア・ヌビラリス(*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フラメア(*Panolis flammea*)、ペクチノフォラ・ゴシピエラ(*Pectinophora gossypiella*)、ペリドロマ・サウキア(*Peridroma saucia*)、ファレラ・ブセファラ(*Phalera bucephala*)、フトリマエア・オペルクレラ(*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスティス・キトレラ(*Phyllocnistis citrella*)、ピエリス・ブラシカエ(*Pieris brassicae*)、ピエリス・ラパエ(*Pieris rapae*)、プラチベナ・スカブラ(*Plathypena scabra*)、プルテラ・キシロステラ(*Plutella xylostella*)、シュードプルシア・インクルデンス(*Pseudoplusia includens*)、リアキオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、スクロビバルプラ・アブソルタ(*Scrobipalpula absoluta*)、シトラガ・セラアレラ(*Sitotroga cerealella*)、スパルガノティス・ピレリアナ(*Sparganothis pilleriana*)、スポドプテラ・フルギベルダ(*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・リトラリス(*Spodoptera littoralis*)、スポドプテラ・リツラ(*Spodoptera litura*)、タウマトポエア・ピチオカンパ(*Thaumatopeoa pityocampa*)、トルトリックス・ビリダナ(*Tortrix viridana*)、トリコプルシア・ニ(*Trichoplusia ni*)およびゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)、

甲虫(甲虫目(Coleoptera))、例えば、アグリルス・シヌアツス(*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*)、アンヒマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスバル(*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・エウフォリダエ(*Aphthona euphoridae*)、アトウス・ハエモロイダリス(*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・ウンダータ(*Blitophaga undata*)、ブルクス・ルフィマヌス(*Bruchus rufimanus*)、ブルクス・ピソルム(*Bruchus pisorum*)、ブルクス・レンチス(*Bruchus lentis*)、ビクチスクス・ベツラエ(*Byctiscus betulae*)、カシダ・ネブロサ(*Cassida nebulosa*)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、セトニア・アウラータ(*Cetonia aurata*)、ソートリンクス・アシミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ソートリンクス・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*)、クリオセリス・アスパラギ(*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・スペキオサ(*Diabrotica speciosa*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ(*Diabrotica virgifera*)、エピラクナ・バリベスチス(*Epilachna varivestis*)、エピトリックス・ヒルチペニス(*Epitrix hirtipennis*)、エウチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、ヒロビウス・アビエチス(*Hylobius abietis*)、ヒペラ・ブルネイペニス(*Hypera brunneipennis*)、ヒペラ・ポストカ(*Hypera postica*)、イプス・チポグラフィ(*Ips typographus*)、レマ・ビリネアタ(*Lema bilineata*)、レマ・メラノプス(*Lema melanopus*)、レプチノタルサ・デセム

リネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リモニウス・カリフォルニクス(*Limonius californicus*)、リソロプトルス・オリゾフィルス(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、メラノツス・コムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、メロロンタ・ヒポカスタニ(*Melolontha hippocastani*)、メロロンタ・メロロンタ(*Melolontha melolontha*)、オウレマ・オリザエ(*Oulema oryzae*)、オチオリンクス・スルカツス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オバツス(*Otiorrhynchus ovatus*)、ファエドン・コクレアリアエ(*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.)、フィロベルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、フィロトレタ・ネモルム(*Phyllotreta nemorum*)、フィロトレタ・ストリオラタ(*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ(*Popillia japonica*)、シトナ・リネアツス(*Sitona lineatus*)およびシトフィルス・グラナリア(*Sitophilus granaria*)、

ハエ、蚊(双翅目(*Diptera*))、例えば、アエデス・アエギプチ(*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス(*Aedes albopictus*)、アエデス・ベキサンズ(*Aedes vexans*)、アナストレファ・ルデンス(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルキアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・ロイコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、アノフェレス・ミニムス(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラツス(*Anopheles quadrimaculatus*)、カリフォラ・ビキナ(*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*)、クリソミア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラックス(*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マセラリア(*Chrysomya macellaria*)、クリソプス・ジスカリス(*Chrysops discalis*)、クリソプス・シラセア(*Chrysops silacea*)、クリソプス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、コクリオミア・ホミニボラックス(*Cochliomyia hominivorax*)、コンタリニア・ソルギコラ(*Contarinia sorghicola*)、コルジロビア・アントロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、クレックス・ピピエンス(*Culex pipiens*)、クレックス・ニグリバルパス(*Culex nigripalpus*)、クレックス・クインクエファシアツス(*Culex quinquefasciatus*)、クレックス・タルサリス(*Culex tarsalis*)、クリセタ・イノルナタ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ダクス・ククルビタエ(*Dacus cucurbitae*)、ダクス・オレアエ(*Dacus oleae*)、ダシネウラ・ブラシカエ(*Dasineura brassicae*)、デリア・アンチクエ(*Delia antique*)、デリア・コアルクタタ(*Delia coarctata*)、デリア・プラツラ(*Delia platura*)、デリア・ラジクム(*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、ファニア・カニクラリス(*Fannia canicularis*)、ゲオミザ・トリプンクタタ(*Geomyza tripunctata*)、ガステロフィルス・インテスチナリス(*Gasterophilus intestinalis*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロシナ・フシペス(*Glossina fuscipes*)、グロシナ・タキノイデス(*Glossina tachinoides*)、ハEMATOBIA・イリタンス(*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.)、ヒレミア・プラツラ(*Hylemyia platura*)、ヒポデルマ・リネアタ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノプス・トレンス(*Leptoconops torrens*)、リリオミザ・サチバエ(*Liriomyza sativae*)、リリオミザ・トリフォリイ(*Liriomyza trifolii*)、ルキリア・カプリナ(*Lucilia caprina*)、ルキリア・クプリナ(*Lucilia cuprina*)、ルキリア・セリカタ(*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*)、マイエチオラ・デストルクトル(*Mayetiola destructor*)、ムスカ・アウツムナリス(*Musca autumnalis*)、ムスカ・ドメスティカ(*Musca domestica*)、ムシナ・スタブランズ(*Muscina stabulans*)、オエストルス・オビス(*Oestrus ovis*)、オポミザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒソキアミ(*Pegomya hysocyami*)、フォルビア・アンチクア(*Phorbia antiqua*)、フォルビア・ブラシカエ(*Phorbia brassicae*)、フォルビア・コアルクタ

10

20

30

40

50

タ(*Phorbia coarctata*)、フレボトムス・アルゲンチペス(*Phlebotomus argentipes*)、プ
 ソロフォラ・コロンビアエ(*Psorophora columbiae*)、プシラ・ロサエ(*Psila rosae*)、プ
 ソロフォラ・ジスコロル(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimul
 ium mixtum*)、ラゴレチス・セラシ(*Rhagoletis cerasi*)、ラゴレチス・ポモネラ(*Rhagole
 tis pomonella*)、サルコファガ・ハエモロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サル
 コファガ属の種(*Sarcophaga* spp.)、シムリウム・ビッタツム(*Simulium vittatum*)、スト
 モキシス・カルキトランス(*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス・ボビヌス(*Tabanus bovinu
 s*)、タバヌス・アトラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)お
 よびタバナス・シミリス(*Tabanus similis*)、チブラ・オレラセア(*Tipula oleracea*)およ
 びチブラ・パルドサ(*Tipula paludosa*)、

10

アザミウマ(総翅目(*Thysanoptera*))、例えば、ジクロモトリプス・コルベッティ(*Dichrom
 othrips corbetti*)、ジクロモトリプス属の種(*Dichromothrips* spp.)、フランクリニエ
 ラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オシデンタリス(*Frankliniella
 occidentalis*)、フランクリニエラ・トリチキ(*Frankliniella tritici*)、シルトリプス・
 キトリ(*Scirtothrips citri*)、トリプス・オリザエ(*Thrips oryzae*)、トリプス・パルミ(
Thrips palmi)およびトリプス・タバキ(*Thrips tabaci*)、

シロアリ(等翅目(*Isoptera*))、例えば、カロテルメス・フラビコリス(*Calotermes flavic
 ollis*)、ロイコテルメス・フラビペス(*Leucotermes flavipes*)、ヘテロテルメス・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・ビルギニクス(*Reticulitermes virginicus*)、レチクリテルメス・
 ルキフグス(*Reticulitermes lucifugus*)、レチクリテルメス・サントネンシス(*Reticulit
 ermes santonensis*)、レチクリテルメス・グラセイ(*Reticulitermes grassei*)、テルメス
 ・ナタレンシス(*Termes natalensis*)およびコプトテルメス・フォルモサヌス(*Coptotorme
 s formosanus*)、

20

ゴキブリ(ゴキブリ目(*Blattaria-Blattodea*))、例えば、ブラテラ・ゲルマニカ(*Blattell
 a germanica*)、ブラテラ・アサヒナエ(*Blattella asahinae*)、ペリプラネタ・アメリカ
 ナ(*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・ジャポニカ(*Periplaneta japonica*)、ペリ
 プラネタ・ブルネア(*Periplaneta brunnea*)、ペリプラネタ・フリギノサ(*Periplaneta fu
 ligginosa*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ(*Periplaneta australasiae*)、およびブ
 ラッタ・オリエンタリス(*Blatta orientalis*)、

30

半翅類の昆虫、アブラムシ、ヨコバイ、コナジラミ、カイガラムシ、セミ、(*Hemiptera*)
 例えば、アクロステルヌム・ヒラレ(*Acrosternum hilare*)、ブリサス・ロイコプテルス(*B
 lissus leucopterus*)、シルトベルチス・ノタツス(*Cyrtopeltis notatus*)、ディスデルク
 ス・キングラツス(*Dysdercus cingulatus*)、ディスデルクス・インテルメジウス(*Dysderc
 us intermedius*)、エウリガステル・インテグリセプス(*Eurygaster integriceps*)、エウ
 シスツス・インピクチベントリス(*Euschistus impictiventris*)、レプトグロッサス・フ
 ィロプス(*Leptoglossus phyllopus*)、リグス・ヘスペルス(*Lygus hesperus*)、リグス・リ
 ネオラリス(*Lygus lineolaris*)、リグス・プラテンシス(*Lygus pratensis*)、ネザラ・ビ
 リデュラ(*Nezara viridula*)、ピエスマ・クアドラタ(*Piesma quadrata*)、ソルベア・イン
 スラリス(*Solubea insularis*)、チアンタ・ベルジトル(*Thyanta perditor*)、アクリトシ
 フォン・オノブリキス(*Acyrthosiphon onobrychis*)、アデルゲス・ラリキス(*Adelges lar
 icis*)、アフィズラ・ナスツルチ(*Aphidula nasturtii*)、アフィス・ファバエ(*Aphis faba
 e*)、アフィス・フォルベシ(*Aphis forbesi*)、アフィス・ボミ(*Aphis pomi*)、アフィス・
 ゴシピ(*Aphis gossypii*)、アフィス・グロスラリアエ(*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 spiraecola*)、アフィ
 ス・サンブキ(*Aphis sambuci*)、アクリトシフォン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アウ
 ラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)、ベミシア・アルゲンチフォリ(*Bemisia argen
 tifolii*)、ブラチカウズス・カルズイ(*Brachycaudus cardui*)、ブラチカウズス・ヘリク
 リシ(*Brachycaudus helichrysi*)、ブラチカウズス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)
 、ブラチカウズス・プルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ブレビコリネ・ブラシカエ(*B*

40

50

revicoryne brassicae)、カピトフォルス・ホルニ(Capitophorus horni)、セロシファ・
 ゴシビ(Cerosipha gossypii)、カエトシフォン・フラガエフォリ(Chaetosiphon fragaefolii)、
 クリプトミズス・リビス(Cryptomyzus ribis)、ドレイフシア・ノルドマニアナエ(
 Dreyfusia nordmannianae)、ドレイフシア・ピセアエ(Dreyfusia piceae)、ジサフィス・
 ラジコラ(Dysaphis radicola)、ジサウラコルツム・シュードソラニ(Dysaulacorthum pse
 udosolani)、ジサフィス・プラントギネア(Dysaphis plantaginea)、ジサフィス・ピリ(D
 ysaphis pyri)、エンポアスカ・ファバエ(Empoasca fabae)、ヒアロプテルス・ブルニ(Hy
 alopterus pruni)、ヒペロミズス・ラクツカエ(Hyperomyzus lactucae)、マクロシフム・
 アベナエ(Macrosiphum avenae)、マクロシフム・エウホルビアエ(Macrosiphum euphorbia
 e)、マクロシフォン・ロサエ(Macrosiphon rosae)、メゴウラ・ビキアエ(Megoura viciae)
)、メラナフィス・ピラリウス(Melanaphis pyraeae)、メトポロフィウム・ジローズム(M
 etopolophium dirhodum)、ミズス・ペルシカエ(Myzus persicae)、ミズス・アスカロニク
 ス(Myzus ascalonicus)、ミズス・セラシ(Myzus cerasi)、ミズス・バリアンス(Myzus va
 rians)、ナソノビア・リビス-ニグリ(Nasonovia ribis-nigri)、ネフォティクス・ビレセ
 ンス(Nephotettix virescens)、ニラパルバタ・ルゲンス(Nilaparvata lugens)、ペム
 フィグス・ブルサリウス(Pemphigus bursarius)、パーキンシエラ・サッカリキダ(Perkin
 siella saccharicida)、ホロドン・フミリ(Phorodon humili)、プシラ・マリ(Psylla mal
 i)、プシラ・ピリ(Psylla piri)、ロパロミズス・アスカロニクス(Rhopalomyzus ascalon
 icus)、ロパロシフム・マイジス(Rhopalosiphum maidis)、ロパロシフム・パジ(Rhopalos
 iphum padi)、ロパロシフム・インセルツム(Rhopalosiphum insertum)、サッパフィス・
 マラ(Sappaphis mala)、サッパフィス・マリ(Sappaphis mali)、シザフィス・グラミヌム
 (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)、トリアロイロデス・バボラリオルム(Trialeurodes vap
 orariorum)、トキソプテラ・アウランチアンド(Toxoptera aurantiiand)、ビテウス・ビ
 チフォリイ(Viteus vitifolii)、キメックス・レクツラリウス(Cimex lectularius)、キ
 メックス・ヘミプテルス(Cimex hemipterus)、レデュビウス・セニリス(Reduvius senili
 s)、トリアトマ属の種(Triatoma spp.)およびア rilus critatus)、
 アリ、ミツバチ、狩蜂、ハバチ(膜翅目(Hymenoptera))、例えば、アタリア・ロサエ(Atha
 lia rosae)、アッタ・セファロテス(Atta cephalotes)、アッタ・カピグアラ(Atta capig
 uara)、アッタ・ラエビガタ(Atta laevigata)、アッタ・ロブスタ(Atta robusta)、アッ
 タ・セクスデンス(Atta sexdens)、アッタ・テキサナ(Atta texana)、クレマトガステル
 属の種(Crematogaster spp.)、ホプロカンパ・ミヌタ(Hoplocampa minuta)、ホプロカン
 パ・テストジネア(Hoplocampa testudinea)、ラシウス・ニガー(Lasius niger)、モノモ
 リウム・ファラオニス(Monomorium pharaonis)、ソレノプシス・ゲミナタ(Solenopsis ge
 minata)、ソレノプシス・インビクタ(Solenopsis invicta)、ソレノプシス・リクテリ(So
 lenopsis richteri)、ソレノプシス・キシロニ(Solenopsis xyloni)、ポゴノミルメック
 ス・バルバツス(Pogonomyrmex barbatulus)、ポゴノミルレックス・カリフォルニクス(Pogo
 nomyrmex californicus)、フェイドレ・メガセファラ(Pheidole megacephala)、ダシムチ
 ラ・オシデンタリス(Dasymutilla occidentalis)、ボンブス属の種(Bombus spp.)、ベス
 プラ・スクアモサ(Vespula squamosa)、パラベスプラ・ブルガリス(Paravespula vulgari
 s)、パラベスプラ・ペンシルバニカ(Paravespula pennsylvanica)、パラベスプラ・ゲル
 マニカ(Paravespula germanica)、ドリコベスプラ・マクラタ(Dolichovespula maculata)
 、ベスパ・クラブロ(Vespa crabro)、ポリステス・ルビギノサ(Polistes rubiginosa)、
 カンポノツス・フロリダヌス(Camponotus floridanus)およびリネピテマ・フミレ(Linepi
 thema humile)、
 コオロギ、バッタ、イナゴ(直翅目(Orthoptera))、例えば、アケタ・ドメスティカ(Achet
 a domestica)、グリロタルパ・グリロタルパ(Gryllotalpa gryllotalpa)、ロクスタ・ミ
 グラトリア(Locusta migratoria)、メラノプラス・ビビタツス(Melanoplus bivittatus)
 、メラノプラス・フムルールブラム(Melanoplus femurrubrum)、メラノプラス・メキシカ
 ヌス(Melanoplus mexicanus)、メラノプラス・サングイニペス(Melanoplus sanguinipes)

10

20

30

40

50

、メラノプラス・スプレツス(*Melanoplus spretus*)、ノマダクリス・セプテムファシアタ(*Nomadacris septemfasciata*)、シストセルカ・アメリカナ(*Schistocerca americana*)、シストセルカ・グレガリア(*Schistocerca gregaria*)、ドキオスタウルス・マロカヌス(*Doclostaurus maroccanus*)、タキキネス・アシナモルス(*Tachycines asynamorus*)、オエダレウス・セネガレンシス(*Oedaleus senegalensis*)、ゾノゼルス・バリエガツス(*Zonozerus variegatus*)、ヒエログリフス・ダガネンシス(*Hieroglyphus daganensis*)、クラウサリア・アングリフェラ(*Kraussaria angulifera*)、カリプタムス・イタリクス(*Calliptamus italicus*)、コルトイセテス・テルミニフェラ(*Chortoicetes terminifera*)、およびロクスタナ・パルダリナ(*Locustana pardalina*)、

クモ形類動物などのクモ類(コナダニ)、例えば、ヒメダニ科(*Argasidae*)、マダニ科(*Ixodidae*)およびヒゼンダニ科(*Sarcoptidae*)、例えば、アンブリオマ・アメリカヌム(*Amblyomma americanum*)、アンブリオマ・バリエガツム(*Amblyomma variegatum*)、アンブリオマ・マクラツム(*Amblyomma maculatum*)、アルガス・ペルシクス(*Argas persicus*)、ボーフィルス・アヌラツス(*Boophilus annulatus*)、ボーフィルス・デコロラツス(*Boophilus decoloratus*)、ボーフィルス・ミクロプルス(*Boophilus microplus*)、デルマセントル・シルバルム(*Dermacentor silvarum*)、デルマセントル・アンデルソニ(*Dermacentor andersoni*)、デルマセントル・バリアビリス(*Dermacentor variabilis*)、ヒアローマ・トルンカツム(*Hyalomma truncatum*)、イクソデス・リキヌス(*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ルビクンズス(*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカブラリス(*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス(*Ixodes holocyclus*)、イクソデス・パキフィクス(*Ixodes pacificus*)、オルニトドルス・モウバタ(*Ornithodoros moubata*)、オルニトドルス・ヘルムシ(*Ornithodoros hermsi*)、オルニトドルス・ツリカタ(*Ornithodoros turicata*)、オルニトニسس・バコチ(*Ornithonyssus bacoti*)、オトビウス・メグニニ(*Otobius megnini*)、デルマニسس・ガリナエ(*Dermanyssus gallinae*)、プソロプテス・オビス(*Psoroptes ovis*)、リピセファルス・サングイネウス(*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファルス・アペンジクラツス(*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファルス・エベルトシ(*Rhipicephalus evertsi*)、サルコプテス・スカビエイ(*Sarcoptes scabiei*)、ならびにフシダニ属の種(*Eriophyidae*)、例えば、アクルス・シレクテンダリ(*Aculus schlechtendali*)、フィロコプトラタ・オレイボラ(*Phyllocoptrata oleivora*)、およびエリオフィエス・シェルドニ(*Eriophyes sheldoni*)；タルソネミダエ属の種(*Tarsonemidae* spp.)、例えば、フィトネムス・パリズス(*Phytonemus pallidus*)およびポリファゴタルソネムス・ラツス(*Polyphagotarsonemus latus*)；ヒメハダニ属の種(*Tenuipalpidae* spp.)、例えば、ブレビパルプス・フォエニキス(*Brevipalpus phoenicis*)；ハダニ属の種(*Tetranychidae* spp.)、例えば、テトラニクス・キンナバリヌス(*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・カンザワイ(*Tetranychus kanzawai*)、テトラニクス・パキフィクス(*Tetranychus pacificus*)、テトラニクス・テラリウス(*Tetranychus telarius*)およびテトラニクス・ウルティカエ(*Tetranychus urticae*)、パノニクス・ウルミ(*Panonychus ulmi*)、パノニクス・キトリ(*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、ラトロデクツス・マクタンズ(*Latrodectus mactans*)、ロクソセレス・レクルサ(*Loxosceles reclusa*)、

ノミ(ノミ目(*Siphonaptera*))、例えば、クテノセファリデス・フェリス(*Ctenocephalides felis*)、クテノセファリデス・カニス(*Ctenocephalides canis*)、キセノプシラ・ケオピス(*Xenopsylla cheopis*)、プレックス・イリタンス(*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス(*Tunga penetrans*)、およびノソプシルス・ファシアツス(*Nosopsyllus fasciatus*)、セイヨウシミ、マダラシミ(シミ目(*Thysanura*))、例えば、レピスマ・サッカリナ(*Lepisma saccharina*)およびテルモビア・ドメスチカ(*Thermobia domestica*)、ムカデ(ムカデ綱(*Chilopoda*))、例えば、スクチゲラ・コレオプトラタ(*Scutigera coleoptrata*)、

ヤスデ(ヤスデ綱(*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、フォルフィクラ・アウリクラリア(*forficu*

la auricularia)、

シラミ(フチラブテラ(Phthiraptera))、例えば、ペジクルス・フマヌス・カピチス(Pediculus humanus capitis)、ペジクルス・フマヌス・コルボリス(Pediculus humanus corporis)、プチルス・プビス(Pthirus pubis)、ハエマトピヌス・エウリステルヌス(Haematopinus eurysternus)、ハエマトピヌス・スイス(Haematopinus suis)、リノグナツス・ビツリ(Linognathus vituli)、ボビコラ・ボビス(Bovicola bovis)、メノポン・ガリナエ(Menopon gallinae)、メナカンツス・ストラミネウス(Menacanthus stramineus)およびソレノポテス・カピラツス(Solenopotes capillatus)、トビムシ目(トビムシ)、例えばオニキウラス属の種

これらの塩、立体異性体および互変異性体を含む本発明の化合物はまた、植物寄生線虫 : 例えば、根瘤線虫、キタネコブセンチュウ(Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita)、ジャワネコブセンチュウ(Meloidogyne javanica)、および他のメロイドギン(Meloidogyne)種 ; シスト形成性線虫、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(Globodera)種 ; ムギシストセンチュウ(Heterodera avenae)、ダイズシストセンチュウ(Heterodera glycines)、テンサイシストセンチュウ(Heterodera schachtii)、クローバシストセンチュウ(Heterodera trifolii)、および他のヘテロデラ(Heterodera)種 ; シードゴール(Seed gall)線虫、アングイナ(Ang uina)種 ; 茎および葉の線虫、アフエレンコイデス(Aphelenchoides)種 ; 刺し(Sting)線虫、ベロノライムス・ロンギカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)および他のベロノライムス(Belonolaimus)種 ; マツ(Pine)線虫、マツノザイセンチュウ(Bursaphelenchus xyl ophilus)および他のブルサフェレンクス(Bursaphelenchus)種 ; リング(Ring)線虫、クリコネマ(Criconema)種、クリコネメラ(Criconemella)種、クリコネモイデス(Criconemoide s)種、メソクリコネマ(Mesocriconema)種 ; 茎および鱗茎線虫類、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(Ditylenchus)種 ; 突き錐(Awl)線虫、ドリコドルス(Dolichodorus)種 ; 螺旋(Spira l)線虫、ヘリオコチレンクス・ムルチシンクツス(Helicotylenchus multicinctus)および他のヘリコチレンクス(Helicotylenchus)種 ; 葉鞘および葉鞘類(Sheath and sheathoid)線虫、ヘミシクリオフォラ(Hemicycliophora)種およびヘミクリコネモイデス(Hemicrico nemoides)種 ; ヒルシュマニエラ(Hirshmanniella)種 ; 槍(Lance)線虫、ホプロアイムス(H oploaimus)種 ; 偽根瘤(false rootknot)線虫、ナコブス(Nacobbus)種 ; 針(Needle)線虫類、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(Longido rus)種 ; 病変(Lesion)線虫、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)、プラチレンクス・クルビタツス(Pratylench us curvatus)、プラチレンクス・ゴードイ(Pratylenchus goodeyi)および他のプラチレンクス(Pratylenchus)種 ; 穿孔(Burrowing)線虫、バナナネモグリセンチュウ(Radophol us similis)および他のラドホルス(Radopholus)種 ; 腎臓形(Reniform)線虫、ロチレンクス・ロブスツス(Rotylenchus robustus)および他のロチレンクス(Rotylenchus)種 ; スクテロネマ(Scutellonema)種 ; 短根(Stubby root)線虫、トリコドルス・プリミチブス(Tric hodorius primitivus)および他のトリコドルス(Trichodorus)種、パラトリコドルス(Parat richodorus)種 ; スタント(Stunt)線虫、ナミイシュクセンチュウ(Tylenchorhynchus clay toni)、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(Tylenchorhynchus)種 ; カンキツ類線虫、チレンクルス(Tylenchulus)種 ; ダガー(Da gger)線虫、キシフィネマ(Xiphinema)種など ; ならびに他の植物寄生線虫種などの線虫を防除するのに適切である。

【0199】

これらの塩、立体異性体および互変異性体を含む本発明の化合物は、特に、昆虫、好ましくは咀嚼性およびかみつきおよび刺すおよび吸汁性の昆虫、例えば、鱗翅目(Lepidopte ra)、鞘翅目(Coleoptera)および半翅目(Hemiptera)の属の昆虫など、特に鱗翅目、鞘翅目および半翅目を防除するのに有用である。

【0200】

10

20

30

40

50

これらの塩、立体異性体および互変異性体を含む本発明の化合物はさらに、総翅目(Thysanoptera)、双翅目(Diptera)(特にハエ、蚊)、膜翅目(Hymenoptera)(特にアリ)および等翅目(Isoptera)(特にシロアリ)の目の昆虫を防除するのに有用である。

【0201】

これらの塩、立体異性体および互変異性体を含む本発明の化合物は特に、鱗翅目および鞘翅目の目の昆虫を防除するのに有用である。

【0202】

本発明の化合物は、慣習的な製剤、例えば液剤、乳剤、懸濁剤、粉末、散剤、ペースト剤、粒剤および直接噴霧可能な液剤に変換することができる。使用形態は、特定の目的および適用方法に依存する。製剤および適用方法は、いずれの場合も本発明の化合物の微細および均一な分布を確実にするように選ばれる。

10

【0203】

製剤は、公知の方式で(例えば、総説については、US 3,060,084、EP-A707445(液体濃縮剤について)、Browning、「Agglomeration」、Chemical Engineering、1967年12月4日、147~48頁、Perry's Chemical Engineer's Handbook、第4版、McGraw-Hill、New York、1963年、8~57頁を参照、および以下参照、WO 91/13546、US 4,172,714、US 4,144,050、US 3,920,442、US 5,180,587、US 5,232,701、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年、Hanceら、Weed Control Handbook、第8版、Blackwell Scientific Publications、Oxford、1989年およびMollet, H.、Grubemann, A.、Formulation technology、Wiley VCH Verlag GmbH、Weinheim (Germany)、2001年、2. D. A. Knowles、Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations、Kluwer Academic Publishers、Dordrecht、1998年(ISBN0-7514-0443-8)、例えば、活性化合物を、例えば溶媒および/または担体、所望する場合、乳化剤、界面活性剤および分散剤、保存剤、消泡剤、不凍剤で、種子処理製剤には、場合によって、着色剤および/または結合剤および/またはゲル化剤などで、農薬の製剤化に対して適切な助剤で増量することによって調製する。

20

【0204】

適切である溶媒/担体は、例えば:

-溶媒、例えば、水、芳香族溶媒(例えばSolvesso製品、キシレンなど)、パラフィン(例えば鉱物画分)、アルコール(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(例えばシクロヘキサノン、ガンマ-ブチロラクトン)、ピロリドン[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(二酢酸グリコール)、乳酸アルキル、ラクトン、例えば、γ-ブチロラクトン、グリコール、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、植物または動物由来の油および変性油、例えば、アルキル化した植物油など。原則として、溶媒混合物も使用することができる。

30

【0205】

-担体、例えば、粉碎した天然鉱物および粉碎した合成鉱物、例えばシリカゲル、微細に分割したケイ酸、ケイ酸塩、タルク、カオリン、アタクレイ、石灰石、石灰、チョーク、ボール、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウムおよび硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、粉碎した合成材料、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、尿素および植物由来の産物、例えば、禾穀類ミール、樹皮ミール、木粉および堅果殻ミール、セルロース粉末および他の固体担体など。

40

【0206】

適切な乳化剤は、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酸アルコールエーテル、アルキルスルホネートおよびアリールスルホネート)である。

【0207】

分散剤の例は、リグニン-スルフィット廃液およびメチルセルロースである。

【0208】

適切な界面活性剤は表面活性化合物、例えばアニオン性、カチオン性、非イオン性およ

50

び両性の界面活性剤、ブロックポリマー、多価電解質、およびこれらの混合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、経皮吸収促進剤、保護用コロイド、または補助剤として使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's、Vol.1: Emulsifiers & De-tergents、McCutcheon's Directories、Glen Rock、USA、2008年(国際版または北米版)に列挙されている。

【0209】

適切なアニオン性界面活性剤は、スルホネート、スルフェート、ホスフェート、カルボキシレートのアルカリ、アルカリ土類またはアンモニウム塩、およびこれらの混合物である。スルホネートの例は、アルキルアリールスルホネート、ジフェニルスルホネート、アルファ-オレフィンスルホネート、リグニンスルホネート、脂肪酸および油のスルホネート、エトキシ化アルキルフェノールのスルホネート、アルコキシ化アリールフェノールのスルホネート、縮合ナフタレンのスルホネート、ドデシルベンゼンおよびトリデシルベンゼンのスルホネート、ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホネート、スルホスクシネートまたはスルホスクシナメートである。スルフェートの例は、脂肪酸および油のスルフェート、エトキシ化アルキルフェノールのスルフェート、アルコールのスルフェート、エトキシ化アルコールのスルフェート、または脂肪酸エステルのスルフェートである。ホスフェートの例は、リン酸エステルである。カルボキシレートの例は、アルキルカルボキシレート、およびカルボキシル化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレートである。

【0210】

適切な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミノオキシド、エステル、糖ベースの界面活性剤、ポリマー界面活性剤、およびこれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1~50当量でアルコキシ化されたアルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸または脂肪酸エステルなどの化合物である。エチレンオキシドおよび/またはプロピレンオキシドは、アルコキシ化のために採用することができ、好ましくはエチレンオキシドであってよい。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミドまたは脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステルまたはモノグリセリドである。糖ベースの界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロースおよびグルコースエステルまたはアルキル-ポリグルコシドである。ポリマー界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール、またはビニルアセテートのホモポリマーまたはコポリマーである。

【0211】

適切なカチオン性界面活性剤は、第4級界面活性剤、例えば1または2つの疎水基を有する第4級アンモニウム化合物、または長鎖の一級アミンの塩である。適切な両性の界面活性剤は、アルキルベタインおよびイミダゾリンである。適切なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシドおよびポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-BまたはA-B-Aタイプ、またはアルカノール、ポリエチレンオキシドおよびポリプロピレンオキシドを含むA-B-Cタイプのブロックポリマーである。適切な多価電解質は、ポリ酸またはポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸またはポリ酸コームポリマーのアルカリ塩である。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミンまたはポリエチレンアミンである。

【0212】

適切な補助剤は、無視できる位の量の殺有害生物活性を有するか、または殺有害生物活性そのものさえも有さず、標的上で化合物Iの生物学的性能を改善する化合物である。例として、界面活性剤、鉱物または植物油、および他の助剤がある。さらなる例は、Knowles、Adjuvants and additives、Agrow Reports DS256、T&F Informa UK、2006年、第5章で列挙されている。

【0213】

同様に不凍剤、例えば、グリセリン、エチレングリコールまたはプロピレングリコールなど、および殺菌剤、例えばプロノポールおよびイソチアゾリノン誘導体、例えばアルキ

ルイソ-チアゾリノンおよびベンゾイソチアゾリノンなどを製剤に加えることもできる。

【0214】

適切な消泡剤は、例えばシリコンまたはステアリン酸マグネシウムに基づく消泡剤である。

【0215】

適切な保存剤は、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。

【0216】

適切な増粘剤は、製剤に、偽塑性流動挙動、すなわち静止時の高い粘性および攪拌工程での低い粘性を付与する化合物である。この関連において挙げることができるのは、例えば、多糖ベースの市販の増粘剤、例えばXanthan Gum(登録商標)(Kelzan(登録商標)、Kelco製)、Rhodopol(登録商標)23(Rhone Poulenc)またはVeegum(登録商標)(R.T. Vanderbilt製)、または有機のフィロシリケート、例えばAttaclay(登録商標)(Engelhardt製)。本発明によるディスパージョンに対して適切な消泡剤は、例えば、シリコンエマルジョン(例えばSilikon(登録商標)SRE、WackerまたはRhodorsil(登録商標)Rhodia製など)、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。殺生物剤を加えることによって、本発明による組成物を微生物による攻撃に対して安定化させることができる。適切な殺生物剤は、例えば、イソチアゾロンに基づくもの、例えば、Avecia(またはArch)からProxel(登録商標)という商標で、またはThor ChemieからActicide(登録商標)RSという商標で、およびRohm & HaasからKathon(登録商標)MKという商標で市販されている化合物などである。適切な不凍剤は、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。これらは普通、活性化化合物組成物の総重量に対して、10重量%以下の量で採用される。適当な場合、本発明による活性化化合物の組成物は、調製した製剤の総量に対して、1~5重量%の緩衝液を含むことによって、活性化化合物(複数可)の化学的特性に応じて、使用する緩衝剤のpH、量およびタイプを調節することができる。緩衝剤の例は、弱無機酸または弱有機酸、例えば、リン酸、ボロン酸、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。

【0217】

直接噴霧可能な液剤、乳剤、ペースト剤またはオイルディスパージョンの調製に対して適切な物質は、中~高沸点の鉱油画分、例えば、ケロセンまたはディーゼル油、さらにコールタール油および植物または動物由来の油、脂肪族、環式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またはこれらの誘導体など、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などである。

【0218】

散剤、散布用材料および粉末は、活性物質を、固体担体と混合するか、または同時に粉碎することによって調製することができる。

【0219】

粒剤、例えばコーティングした粒剤、含浸した粒剤および均一な粒剤は、活性成分を固体担体に結合させることによって調製することができる。固体担体の例は、鉱物質土類、例えばシリカゲル、ケイ酸塩、タルク、カオリン、アタクレイ、石灰石、石灰、チョーク、ボール、黄土、粘土、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、および植物由来の産物、例えば禾穀類ミール、樹皮ミール、木粉および堅果殻ミールなど、セルロース粉末および他の固体担体である。

【0220】

一般的に、製剤、すなわち本発明による組成物は、0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%の活性成分を含む。活性成分は、90%~100%、好ましくは95%~100%の純度(NMRスペ

10

20

30

40

50

クトルによる)で採用される。

【0221】

種子処理の目的のため、それぞれの製剤は、2～10倍に希釈することによって、すぐに使える調製物において、重量で0.01～60重量%、好ましくは0.1～40重量%の活性化合物濃度をもたらすことができる。

【0222】

よって、本発明の化合物は、これらの製剤の形態、またはこれらから調製される使用形態、例えば直接噴霧可能な液剤、散剤、懸濁剤またはディスパージョン、乳剤、オイルディスパージョン、ペースト剤、散粉用製剤、散布用材料、または粒剤の形態で、噴霧、霧吹き、散粉、散布または注入を用いて使用することができる。使用形態は、意図する目的に完全に依存する；これらは、いずれの場合も、本発明による活性化合物の可能な限り微細な分布を確実にすることを意図する。

10

【0223】

以下は、製剤の例である：

1. 水で希釈するための製品。種子処理の目的のため、このような製品は、希釈してまたは希釈しないで、種子に適用することができる。

【0224】

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中に溶解する。代替として、湿潤剤または他の助剤を加える。活性化合物は、水で希釈すると溶解し、これにより、10%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

20

【0225】

B) 分散性濃縮剤(DC)

20重量部の活性化合物は、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中に溶解する。水での希釈により、ディスパージョンが得られ、これによって、20%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

【0226】

C) 乳化性濃縮剤(EC)

15重量部の活性化合物は、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびヒマシ油エトキシ化物(いずれの場合も5重量部)を加えながら、7重量部のキシレン中に溶解する。水での希釈により、乳剤が得られ、これによって、15%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

30

【0227】

D) 乳剤(EW、EO、ES)

25重量部の活性化合物は、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムおよびヒマシ油エトキシ化物(いずれの場合も5重量部)を加えながら、35重量部のキシレン中に溶解する。この混合物を、乳化機器(例えばUltraturrax)を用いて30重量部の水中に導入し、均一な乳剤にする。水での希釈により、乳剤が得られ、これによって、25%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

【0228】

E) 懸濁剤(SC、OD、FS)

攪拌されたボールミル内で、20重量部の活性化合物は、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、細かく砕くことによって、微細な活性化合物懸濁剤を得る。水での希釈により、活性化合物の安定した懸濁液が得られ、これによって、20%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

40

【0229】

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は、50重量部の分散剤および湿潤剤を加えながら細かく粉碎し、工業的装置(例えば押出し、噴霧塔、流動床)を用いて水分散性または水溶性の粒剤として作製する。水での希釈により、活性化合物の安定したディスパージョンまたは溶液が得ら

50

れ、これによって、50%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

【0230】

G)水分散性散剤および水溶性散剤(WP、SP、SS、WS)

75重量部の活性化合物は、25重量部の分散剤、湿潤剤およびシリカゲルを加えながら、ローターステーターミル内で粉碎する。水での希釈により、活性化合物の安定したディスページョンまたは溶液が得られ、これによって、75%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

【0231】

H)ゲル製剤(GF)

攪拌されたボールミル内で、20重量部の活性化合物は、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、細かく砕くことによって、微細な活性化合物懸濁液を得る。水での希釈により、活性化合物の安定した懸濁液が得られ、これによって、20%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。

【0232】

2.葉面への適用のための、希釈しないで適用される製品。種子処理目的のため、このような製品は、希釈してまたは希釈しないで種子に適用することができる。

【0233】

I)散粉性散剤(DP、DS)

5重量部の活性化合物を細かく粉碎し、95重量部の微細に分割されたカオリンと密に混合する。これにより、5%(w/w)の活性化合物を有する散粉性製品が得られる。

【0234】

J)粒剤(GR、FG、GG、MG)

0.5重量部の活性化合物を細かく粉碎し、95.5重量部の担体と結びつけ、これによって、0.5%(w/w)の活性化合物を有する製剤が得られる。現行の方法は、押出し、噴霧乾燥または流動床である。これにより、葉面での使用のための、希釈しないで適用される粒剤が得られる。

【0235】

K)ULV溶剤(UL)

10重量部の活性化合物を、90重量部の有機溶媒、例えばキシレン中に溶解する。これにより、10%(w/w)の活性化合物を有する製品が得られる。これを、葉面での使用のために希釈しないで適用する。

【0236】

水性の使用形態は、水の添加により、乳剤濃縮剤、ペースト剤または水和剤(噴霧可能な散剤、オイルディスページョン)から調製することができる。乳剤、ペースト剤またはオイルディスページョンを調製するために、物質はそのまままたは油もしくは溶媒中に溶解して、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。代わりに、活性物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤、および適当な場合、溶媒または油から構成される濃縮剤を調製することが可能であり、このような濃縮剤は、水での希釈に対して適切である。

【0237】

すぐに使える製品における活性成分濃度は、比較的広い範囲で変動させることができる。一般的に、濃度は、0.0001~10%、好ましくは0.001~1%である。

【0238】

活性成分はまた、超微量法(ULV)において成功裏に使用することもでき、95重量%超の活性成分を含む製剤を適用すること、または添加剤を含まない活性成分を適用することさえ可能である。

【0239】

本発明の方法および使用において、本発明による化合物は、他の活性成分、例えば他の殺有害生物剤、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、植物毒素および植物生長調節剤、毒性緩和剤および殺線虫剤と共に適

10

20

30

40

50

用してもよい。これらの追加成分は、逐次的に、または上に記載された組成物と組み合わせ使用することができ、適当な場合には、使用の直前にしか加えることができないものもある(タンクミックス)。例えば、植物(複数可)には、本発明の組成物を、他の活性成分による処理の前後に噴霧することができる。

【0240】

本発明による化合物と一緒に用いることができ、潜在的相乗効果が生じる可能性のある農薬の以下のリストMは、可能な組合せの例示を目的とするが、限定を加えるものではない。

【0241】

M.1. 有機(チオ)リン酸化合物: 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、クロロエトキシホス、クロルフエンビンホス、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、デメトン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、ジスルフォトン、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、フルピラゾホス、ホスチアゼート、ヘプテノホス、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、ホラート、ホサロン、ホスメト、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、スルホテブ、テブピリンホス、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、バミドチオン;

M.2. カーバメート化合物: アルジカルブ、アラニカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、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、メトミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクスル、チोज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、トリアザメート;

M.3. ピレスロイド化合物: アクリナトリン、アレスリン、d-シス-トランスアレスリン、d-トランスアレスリン、ピフェントリン、バイオアレスリン、バイオアレスリンS-シクロペンテニル、バイオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、 β -シフルトリン、シハロトリン、 λ -シハロトリン、 γ -シハロトリン、シペルメトリン、 α -シペルメトリン、 β -シペルメトリン、 θ -シペルメトリン、 ζ -シペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクセス、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、 τ -フルバリネート、ハルフェンプロクセス、イミプロトリン、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(除虫菊剤)、レスメトリン、シラフルオフェン、テフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン;

M.4. 幼若ホルモン模倣薬: ヒドロブレン、キノブレン、メトブレン、フェノキシカルブ、ピリプロキシフェン;

M.5. ニコチン受容体アゴニスト/アンタゴニスト化合物: アセタミプリド、ベンスルタップ、塩酸カルタップ、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、チアメトキサム、ニテンピラム、ニコチン、スピノサド(アロステリックアゴニスト)、スピネトラム(アロステリックアゴニスト)、チアクロプリド、チオシクラム、チオスルタップ-ナトリウムおよびAKD1022;

M.6. GABA作動性塩化物チャネルアンタゴニスト化合物: クロルデン、エンドスルファン、 γ -HCH(リンダン); エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロール;

M.7. 塩化物チャネル活性剤: アバメクチン、エマネクチンベンゾエート、ミルベメクチン、レピメクチン;

M.8. MET1 I化合物: 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、トルフェンピラド、フルフェネリム、ロテノン;

- M.9. METI IIおよびIII化合物:アセキノシル、フルアシプリム、ヒドラメチルノン;
- M.10.酸化リン酸の脱共役剤:クロルフェナビル、DNOC;
- M.11.酸化リン酸阻害剤:アゾシクロチン、シヘキサチン、ジアフェンチウロン、フェンブタチンオキシド、プロパルギット、テトラジホン;
- M.12.脱皮かく乱物質:シロマジン、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド;
- M.13.協力剤:ピペロニルブトキシド、トリブホス;
- M.14.ナトリウムチャンネル遮断化合物:インドキサカルブ、メタフルミゾン;
- M.15.燻蒸剤:臭化メチル、クロロピクリンフッ化スルフルル;
- M.16.選択的摂食遮断薬:クリロチエ、ピメトロジン、フロニカミド;
- M.17.ダニ成長阻害剤:クロフェンテジン、ヘキシチアゾックス、エトキサゾール;
- M.18.キチン合成阻害剤:ブプロフェジン、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、トリフルムロン;
- M.19.脂質生合成阻害剤:スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマット;
- M.20.オクトパミン作動性アゴニスト:アミトラズ;
- M.21.リアノジン受容体調節因子:フルベンジアミドおよびフタラミド化合物(R)-、(S)-3-クロル-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオール-1-(トリフルオールメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタラミド(M21.1)
- M.22.イソキサゾリン化合物: 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-イソキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-ピリジン-2-イルメチル-ベンズアミド(M22.1)、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)-ベンズアミド(M22.2)、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(M22.3)、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-イソキサゾール-3-イル]-ナフタレン-1-カルボン酸[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-アミド(M22.4)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-イソキサゾール-3-イル]-N-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルベンズアミド(M22.5)、4-[5-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-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(M22.6)、4-[5-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル]-ナフタレン-1-カルボン酸[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-アミド(M22.7)および5-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル]-2-[1,2,4]トリアゾール-1-イル-ベンゾニトリル(M22.8);
- M.23.アントラニルアミド化合物:クロルアントラニリプロール、シアントラニリプロール、
- 5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[4-シアノ-2-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-6-メチル-フェニル]-アミド(M23.1)、
- 5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-クロロ-4-シアノ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.2)、
- 5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-ブロモ-4-シアノ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.3)、
- 5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-ブロモ-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]-アミド(M23.4)、
- 5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2,4-ジクロロ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.5)、
- 5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[4-クロロ-2-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-6-メチル-フェニル]-アミド(M23.6)、

10

20

30

40

50

N'-(2-{[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.7)、

N'-(2-{[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-N'-メチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.8)、

N'-(2-{[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-N,N'-ジメチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.9)、

N'-(3,5-ジブromo-2-{[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.10)、

N'-(3,5-ジブromo-2-{[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-N'-メチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.11) および

N'-(3,5-ジブromo-2-{[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-N,N'-ジメチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.12);

M.24. マロノニトリル化合物: 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)マロノニトリル(CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₃)(M24.1) および 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロブチル)-マロノジニトリル(CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₂CF₃)(M24.2);

M.25. 微生物かく乱物質: バシルス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)の亜種イスラエレンシ(*Israelensi*)、バシルス・スフェリクス(*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリンギエンシスの亜種アイザワイ(*Aizawai*)、バシルス・ツリンギエンシスの亜種クルスタキ(*Kurstaki*)、バシルス・ツリンギエンシスの亜種テネブリオニス(*Tenebrionis*);

M.26. アミノフラノン化合物:

4-{[(6-ブromoピリド-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.1)、

4-{[(6-フルオロピリド-3-イル)メチル](2,2-ジフルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.2)、

4-{[(2-クロロ1,3-チアゾロ-5-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.3)、

4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.4)、

4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](2,2-ジフルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.5)、

4-{[(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル)メチル](メチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.6)、

4-{[(5,6-ジクロロピリド-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.7)、

4-{[(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル)メチル](シクロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.8)、

4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](シクロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.9) および

4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](メチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.10);

M.27. 様々な化合物: リン化アルミニウム、アミドフルメト、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、ホウ砂、ブromoプロピレート、シアン化物、シエノピラフェン、シフルメトフェン、キノメチオネート、ジコホル、フルオロアセテート、ホスフィン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、硫黄、有機硫黄化合物、吐酒石、スルホキサフロル、N-R'-2,2-ジハロ-1-R''-シクロ-プロパンカルボキサミド-2-(2,6-ジクロロ- α , α , α -トリフルオロ-p-トリル)ヒドラゾンまたはN-R'-2,2-ジ(R''')プロピオンアミド-2-(2,6-ジク

10

20

30

40

50

ロロ- α , α , α -トリフルオロ-p-トリル)-ヒドラゾン、ここで、R'はメチルまたはエチルであり、ハロはクロロまたはプロモであり、R''は水素またはメチルであり、R'''はメチルまたはエチル、4-But-2-イニロキシ-6-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-2-フルオロ-ピリミジンである(M27.1)、

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(M27.2)および

8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチル-フェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチル-ピリダジン-3-イル)-3-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン(M27.3)。

10

【0242】

Mグループで市販されている化合物は、刊行物の中でも、The Pesticide Manual、第13版、British Crop Protection Council (2003年)中に見出すことができる。パラオキソンおよびこれらの調製は、Farm Chemicals Handbook、88巻、Meister Publishing Company、2001年において記載されている。フルピラゾホスは、Pesticide Science 54巻、1988年、237~243頁およびUS 4,822,779において記載されている。AKD1022およびその調製は、US 6,300,348において記載されている。M21.1はWO 2007/101540から知られている。イソオキサゾリンM22.1~M22.8は、例えばWO 2005/085216、WO 2007/079162、WO 2007/026965、WO 2009/126668およびWO 2009/051956において記載されている。アントラニルアミドM23.1~M23.6は、WO 2008/72743およびWO 2008/72783において記載され、M23.7~M23.12などはWO 2007/043677において記載されている。マロノニトリルM24.1およびM24.2は、WO 02/089579、WO 02/090320、WO 02/090321、WO 04/006677、WO 05/068423、WO 05/068432およびWO 05/063694において記載されている。アミノフラノンM26.1~M26.10は、例えばWO 2007/115644において記載されている。アルキニルエーテルM27.1は、例えばJP 2006131529において記載されている。有機硫黄化合物はWO 2007060839において記載されている。ピリピロベン誘導体M27.2は、WO 2008/66153およびWO 2008/108491において記載されている。ピリダジンM27.3は、JP 2008/115155において記載されている。

20

【0243】

本発明による化合物と併せて使用することができる活性物質の以下のリストFは、可能な組合せを例示することを意図するが、これらを限定するものではない：

30

F.I)呼吸阻害剤

F.I-1)Qo部位における複合体IIIの阻害剤(例えばストロビルリン)

ストロビルリン:アゾキシストロビン、クメトキシストロビン、クモキシストロビン、ジモキシストロビン、エネストロブリン、フルオキサストロビン、クレゾキシム-メチル、メトミノストロビン、オリザストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、ピリベンカルブ、トリクロピリカルブ/クロロジンカルブ、トリフロキシストロビン、2-[2-(2,5-ジメチル-フェノキシメチル)-フェニル]-3-メトキシ-アクリル酸メチルエステルおよび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；

40

オキサゾリジンジオンおよびイミダゾリノン:ファモキサドン、フェンアミドン；

F.I-2)複合体IIの阻害剤(例えばカルボキサミド)：

カルボキシアニリド:ベノダニル、ビキサフェン、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フェンヘキサミド、フルオピラム、フルトラニル、フラメトピル、イソピラザム、イソチアニル、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルザミド、チアジニル、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

50

サミド；

F.I-3) Qi 部位での複合体IIIの阻害剤: シアゾファミド、アミスルブロム；

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；テクナゼン；フェリムゾン；アメトクトラジン；シルチオフアム；

ニトロフェニル誘導体: ビナパクリル、ジノブトン、ジノカップ、フルアジナム、ニトル
タール-イソプロピル、

有機金属化合物: フェンチン塩、例えばフェンチン-アセテート、フェンチンクロリドまたは
フェンチンヒドロキシドなど；

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、イミダゾール)

トリアゾール: アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール
、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、エポキシコナゾール、フェ
ンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアフォル、ヘキサコ
ナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、パ
クロブトラゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナ
ゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメフォン、トリアジメノール、ト
リチコナゾール、ウニコナゾール；

イミダゾール: イマザリル、ペフラゾエート、オキシポコナゾール、プロクロラズ、トリ
フルミゾール；

ピリミジン、ピリジンおよびピペラジン: フェナリモール、ヌアリモール、ピリフェノッ
クス、トリフォリン；

F.II-2) デルタ14-レダクターゼ阻害剤(アミン、例えばモルホリン、ピペリジン)

モルホリン: アルジモルフ、ドデモルフ、ドデモルフ-アセテート、フェンプロピモルフ、
トリデモルフ；

ピペリジン: フェンプロピジン、ピペラリン；

スピロケタラミン: スピロキサミン；

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

F.III) 核酸合成阻害剤

F.III-1) RNA、DNA合成

フェニルアミドまたはアシルアミノ酸殺菌剤: ベナラキシル、ベナラキシル-M、キララキ
シル、メタラキシル、メタラキシル-M(メフェノキサム)、オフラセ、オキサジキシル；
イソオキサゾールおよびイソチアゾロン: ヒメキサゾール、オクチリノン；

F.III-2) DNAトポイソメラーゼ阻害剤: オキシリニン酸；

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: プピリメート；

F.IV) 細胞分裂およびまたは細胞骨格の阻害剤

F.IV-1) チューブリン阻害剤: ベンゾイミダゾールおよびチオフアネート: ベノミル、カル
ベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオフアネート-メチル；

トリアゾロピリミジン: 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[1,5a]ピリミジン

F.IV-2) 他の細胞分裂阻害剤

ベンズアミドおよびフェニルアセトアミド: ジエトフェンカルブ、エタボキサム、ペンシ
クロン、フルオピコリド、ゾキサミド；

F.IV-3) アクチン阻害剤: ベンゾフェノン: メトラフェノン；

F.V) アミノ酸およびタンパク質合成阻害剤

F.V-1) メチオニン合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン)

アニリノ-ピリミジン: シプロジニル、メパニピリム、ニトラピリン、ピリメタニル；

F.V-2) タンパク質合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン)

抗生剤: プラスチシジン-S、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩-水和物、ミルジオマ
イシン、ストレプトマイシン、オキシテトラサイクリン、ポリオキシシン、バリダマイシン

10

20

30

40

50

A ;

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)

ジカルボキシイミド: フルオロイミド、イプロジオン、プロシミドン、ピンクログリン ;
フェニルピロール: フェンピクロニル、フルジオキシソニル ;

F.VI-2) Gタンパク質阻害剤: キノリン: キノキシフェン ;

F.VII) 脂質合成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: エジフェンホス、イプロベンフォス、ピラゾホス ;
ジチオラン: イソプロチオラン ;

10

F.VII-2) 脂質過酸化

芳香族炭化水素: ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクロフォス-メチル、ビフェニル、クロロネブ、エトリジアゾール ;

F.VII-3) カルボキシル酸アミド (CAA殺菌剤)

ケイ皮酸またはマンデル酸アミド: ジメトモルフ、フルモルフ、マンジプロアミド、ピリモルフ ;

バリンアミドカルバメート: ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、ピリベンカルブ、バリフェナレートおよびN-(1-(1-(4-シアノ-フェニル)エタンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン酸-(4-フルオロフェニル)エステル ;

F.VII-4) 細胞膜透過性および脂肪酸に影響を及ぼす化合物

カルバメート: プロバモカルブ、プロバモカルブ-ヒドロクロリド

20

F.VIII) 多部位作用を有する阻害剤

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

F.VIII-2) チオカルバメートおよびジチオカルバメート: フェルバム、マンコゼブ、マネブ、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、プロピネブ、チラム、ジネブ、ジラム ;

F.VIII-3) 有機塩素化合物 (例えばフタルイミド、スルファミド、クロロニトリル):

アニラジン、クロロタロニル、カプタフォル、カプタン、フォルベット、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、フルスルファミド、ヘキサクロロベンゼン、ペンタクロロフェノールおよびその塩、フタリド、トリルフルアニド、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 ;

30

F.VIII-4) グアニジン: グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン-アセテート、イミノクタジン、イミノクタジン-トリアセテート、イミノクタジン-トリス(アルベシレート) ;

F.VIII-5) アントラキノン: ジチアノン ;

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、ポリオキシシンB ;

F.IX-2) メラニン合成阻害剤: ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロバミド、ジシクロメト、フェンオキサニル ;

40

F.X) 植物防御誘導剤

F.X-1) サリチル酸経路: アシベンゾラル-S-メチル ;

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

ホスホネート: フォセチル、フォセチル-アルミニウム、亜リン酸およびその塩 ;

F.XI) 未知の作用機序:

プロノポール、キノメチオネート、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾクワット、ジフェンゾクワットメチルスルフェート、ジフェニルアミン、フルメトベル、フルスルファミド、フルチアニル、メタスルホカルブ、オキシシン-銅、プロキンアジド、テブフロキン、テクロフタラム、トリアゾキシド、2-ブトキシ-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-

50

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-メチルホルムアミジン、N'-(4-(4-フルオロ-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-メチルホルムアミジン、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-メチルホルムアミジン、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-メチルホルムアミジン、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、ピリソオキサゾール、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；

F.XI) 生長調節剤：

アブサイシン酸、アミドクロル、アンシミドール、6-ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、ブトラリン、クロロメコート(クロロメコートクロリド)、コリンクロリド、シクルアニリド、ダミノジド、ジケグラク、ジメチピン、2,6-ジメチルプリジン、エテホン、フルメトラリン、フルフルプリミドール、フルチアセット、ホルクロルフェニユロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール-3-酢酸、マレイン酸ヒドラジド、メフルイジド、メピコート(メピコートクロリド)、ナフタレン酢酸、N6ベンジルアデニン、パクロブトラゾール、プロヘキサジオン(プロヘキサジオン-カルシウム)、プロヒドロジャスモン、チジアズロン、トリアペンテノール、トリブチルホスホロトリチオエート、2,3,5トリヨード安息香酸、トリネキサパック-エチルおよびウニコナゾール；

F.XII) 生物学的制御剤

抗菌性生物防除剤：枯草菌(*Bacillus subtilis*)、菌株NRRL No. B-21661(例えばRHAPSODY(登録商標)、SERENADE(登録商標)MAXおよびSERENADE(登録商標)ASO、AgraQuest, Inc.、USA.製)、バシラス・プミルス(*Bacillus pumilus*)、菌株NRRL No. B-30087(例えばSONATA(登録商標)およびBALLAD(登録商標)Plus、AgraQuest, Inc.、USA製)、ウロクラジウム・オウデマンシ(*Ulocladium oudemansii*)(例えば、BOTRY-ZEN、BotriZen Ltd.、New Zealand製の製品)、キトサン(例えばARMOUR-ZEN、BotriZen Ltd.、New Zealand製)。

【0244】

本発明はまた、1種以上の、好ましくは1種の、本発明の個別化した化合物Iと、上記リストMおよび/またはFから選択される、1種以上の、好ましくは1、2または3種の、特に1種の殺有害生物剤とを含有する組成物にも関する。

【0245】

本発明による組成物は、少なくとも1種の本発明の化合物Iと、上記リストMおよび/またはFから選択される少なくとも1種の殺有害生物剤との物理的混合物であってよい。したがって、本発明はまた、1種以上の、好ましくは1種の本発明の化合物Iと、上記リストMおよび/またはFから選択される、1種以上の、好ましくは1、2または3種の、特に1種の殺有害生物剤とを含む混合物を提供する。しかし、組成物はまた、少なくとも1種の本発明の化合物Iと、上記リストMおよび/またはFから選択される少なくとも1種の殺有害生物剤との任意の組合せであってよく、化合物は、同じ製剤中に一緒に存在する必要はない。

【0246】

少なくとも1種の本発明の化合物Iならびに上記リストMおよび/またはFから選択される少なくとも1種の殺有害生物剤が同じ製剤中に一緒に存在しない本発明による組成物の例は、コンビパックである。コンビパックの中で、コンビパックの2種以上の成分は、別々に包装され、すなわち、事前に一緒に製剤化されていない。よって、コンビパックは、1つ以上の別個の容器、例えばバイアル、缶、ボトル、ポーチ、バッグまたはキャニスターなどを含み、各容器は、農芸化学組成物に対して別個の成分を含有する。1つの例は、2成分コンビパックである。したがって本発明はまた、少なくとも1種の化合物A、液体もしくは固体担体、適当な場合、少なくとも1種の界面活性剤および/または少なくとも1種の慣習的助剤を含む第1成分と、次いで、少なくとも1種の化合物B、液体もしくは固体担体、適当な場合、少なくとも1種の界面活性剤および/または少なくとも1種の慣習的助剤を含む第2成分とを含む2成分コンビパックに関する。例えば適切な液体および固体担体、界面活性剤ならびに慣習的助剤についてのさらなる詳細は、以下に記載されている。

10

【0247】

有害無脊椎動物(「有害動物」とも呼ばれる)、すなわち、昆虫、クモおよび線虫など、植物、この植物が成長しているまたは成長し得る土壌または水を、当技術分野で公知の任意の適用方法により、本発明の化合物またはこれらを含む組成物(複数可)に接触させることができる。よって、「接触させること」は、直接的接触(化合物/組成物を、有害無脊椎動物または植物、典型的には、植物の葉、茎または根に直接適用する)と、間接的接触(有害無脊椎動物または植物の居場所に化合物/組成物を適用させる)との両方を含む。

【0248】

20

本発明の化合物またはこれらを含む殺有害生物組成物を使用して、植物/作物を、本発明の化合物の殺有害生物有効量に接触させることによって、有害動物、特に昆虫、コナダニまたはクモによる攻撃または侵襲から成長する植物および作物を保護することができる。「作物」という用語は、成長している作物および収穫した作物の両方を指す。

【0249】

本発明の化合物およびこれらを含む組成物は、様々な栽培植物、例えば穀物、根菜作物、油料作物、野菜植物、香辛料、観賞植物、例えばデュラム小麦および他の小麦、オオムギ、カラスムギ、ライムギ、トウモロコシ(飼料用トウモロコシおよびシュガートウモロコシ/スウィートコーンおよびフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、綿、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、アブラナ、テンサイ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、イネ科草本、ローン、芝、飼料用イネ科草本、トマト、リーキ、パンプキン/カボチャ、キャベツ、アйсバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ(Brassica)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、パンジーおよびツリフネソウなどの種子の多数の昆虫の防除において特に重要である。

30

【0250】

本発明の化合物は、殺虫性攻撃から保護すべき昆虫または植物、植物繁殖材料、例えば種子、土壌、表面、材料または部屋などを、活性化化合物の殺虫有効量で処理することによって、そのまままたは組成物の形態で採用される。この適用は、昆虫が植物、植物繁殖材料、例えば種子、土壌、表面、材料または部屋などに感染する前および感染した後の両方において行うことができる。

40

【0251】

さらに、有害無脊椎動物は、標的の有害生物、その食物供給、生息地、繁殖地またはその居場所を、本発明の化合物の殺有害生物有効量に接触させることによって防除することができる。よって、この適用は、有害生物が居場所、成長している作物、または収穫された作物に感染する前または感染した後に行うことができる。

【0252】

本発明の化合物はまた、有害生物の出現が予想される場所に予防的に適用することができる。

【0253】

50

本発明の化合物はまた、成長している植物を、本発明の化合物の殺有害生物有効量に接触させることによって、この植物を有害生物による攻撃または侵襲から保護するために使用することもできる。よって、「接触させること」は、直接的接触(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、茎または根に直接適用する)と、間接的接触(有害生物および/または植物の居場所に化合物/組成物を適用させる)との両方を含む。

【0254】

「居場所」とは、有害生物または寄生生物が成長しているまたは成長し得る、生息地、繁殖地、植物、種子、土壌、領域、材料または環境を意味する。

【0255】

一般的に、「殺有害生物有効量」とは、成長について観察可能な効果を達成するのに必要とされる活性成分の量を意味し、これは、ネクロシス、死滅、遅延、予防、および除去、破壊、またはさもなければ標的生物の出現および活性を減少させる効果を含む。殺有害生物有効量は、本発明で使用する様々な化合物/組成物に対して変動することができる。組成物の殺有害生物有効量はまた、一般的条件、例えば、所望の殺有害生物性効果および継続時間、天候、標的種、居場所、適用モードなどに従い変動することになる。

【0256】

土壌の処理または有害生物の滞留場所または巣への適用の場合、活性成分の量は、100m²当たり、0.0001~500g、好ましくは100m²当たり、0.001~20gの範囲である。

【0257】

材料の保護における慣習的な施用量は、例えば、処理される材料1m²当たり活性化合物0.01g~1000gであり、望ましくは1m²当たり0.1g~50gである。

【0258】

材料を含浸して使用するための殺虫組成物は、典型的には、0.001~95重量%、好ましくは0.1~45重量%、より好ましくは1~25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。

【0259】

作物植物を処理する使用のためには、本発明の活性成分の施用量は、1ヘクタール当たり0.1g~4000g、望ましくは1ヘクタール当たり5g~500g、さらに望ましくは1ヘクタール当たり5g~200gの範囲であってよい。

【0260】

本発明の化合物は、接触(土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物部位または動物部位を介して)および摂取(ベイト剤(bait)、または植物部位)を介して効果的である。

【0261】

本発明の化合物はまた、非作物の昆虫有害生物、例えばアリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、蚊、コオロギ、またはゴキブリなどに対して適用することもできる。前記非作物有害生物に対する使用のため、本発明の化合物は、好ましくはベイト剤組成物(bait composition)で使用する。

【0262】

ベイト剤は、液体、固体または半固体の調製物(例えばゲル)であってよい。固体ベイト剤は、それぞれの適用に対して適切な様々な形状および形態、例えば粒剤、ブロック剤、スティック剤、ディスク剤に形成することができる。液体ベイト剤は、適切な適用を確実にするための様々なデバイス、例えば開放容器、噴霧デバイス、液滴源、または蒸発源の中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することができ、粘着性、水分保持またはエージング特性に関する特定の必要品に製剤化することができる。

【0263】

組成物に採用されているベイト剤は、昆虫、例えばアリ、シロアリ、カリバチ、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に駆り立てるのに十分な誘引性のある製品である。誘引性は、摂食刺激剤または性フェロモンを使用することで操作すること

10

20

30

40

50

ができる。食物刺激剤は、例えば、動物および/または植物タンパク質(肉粉、魚粉または血粉、昆虫部分、卵黄)から、動物および/または植物由来の脂肪および油から、または単糖類、オリゴ糖類またはポリ有機糖類から、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ばれるが、これらだけに限らない。果実、作物、植物、動物、昆虫の新鮮もしくは腐りかけの部分またはその特異的な部分もまた、摂食刺激剤としての役目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、当業者に知られている。

【0264】

ベイト剤組成物での使用に対して、活性成分の典型的な含有量は、0.001重量%~15重量%、望ましくは0.001重量%~5重量%の活性成分である。

【0265】

エアゾール剤(例えば、スプレー缶中)、オイルスプレー剤またはポンプスプレー剤としての本発明の化合物の製剤は、専門家ではないユーザーが、有害生物、例えばハエ、ノミ、マダニ、蚊またはゴキブリなどを防除するために極めて適切である。エアゾール処方剤は、活性化合物、溶媒、例えば低級アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール)、ケトン(例えばアセトン、メチルエチルケトン)、およそ50~250℃の沸騰範囲を有するパラフィン炭化水素(例えばケロセン)、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、例えばトルエン、キシレンなど、水、さらには助剤、例えば乳化剤、例えばソルビトールモノオレエート、3~7モルのエチレンオキシドを有するオレイルエトキシレート、脂肪族アルコールエトキシレートなど、香油、例えばエーテル油、中間脂肪酸の低級アルコールとのエステル、芳香族カルボニル化合物など、適当な場合、安定剤、例えば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など、ならびに、必要な場合、噴霧剤、例えばプロパン、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、またはこれらのガスの混合物などで構成するのが好ましい。

【0266】

オイルスプレー製剤は、噴霧剤が使用されないという点でエアゾール処方剤とは異なる。

【0267】

スプレー組成物での使用に対して、活性成分の含有量は、0.001~80重量%、好ましくは0.01~50重量%および最も好ましくは0.01~15重量%である。

【0268】

本発明の化合物およびそのそれぞれの組成物はまた、蚊取線香および燻蒸コイル、煙カートリッジ、気化器プレートまたは長時間気化器において、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使用することができる。

【0269】

本発明の化合物およびそのそれぞれの組成物で、昆虫により伝達される感染症(例えばマラリア、デング熱および黄熱病、リンパ節フィラリア症、およびリーシュマニア症)を防除する方法はまた、小屋および家屋の表面を処理すること、カーテン、テント、衣料品、蚊帳、ツェツェバエトラップなどの空気噴霧および含浸も含む。繊維、織物、ニット製品、不織布、製網材料またはホイルおよび防水布への適用のための殺虫組成物は、殺虫剤、場合によって忌避剤および少なくとも1種の結合剤を含む混合物を含むことが好ましい。適切な忌避剤は、例えばN,N-ジエチル-メタ-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、インドロン、メチルネオデカンアミド(MNDA)、{(+/-)-3-アリル-2-メチル-4-オキシシクロペンタ-2-(+)-エニル-(+)-trans-クリサンテメート(エスピオスリン)などの昆虫防除に対して使用されないピレスロイド、リモネン、オイゲノール、(+)-オイカマロール(1)、(-)-1-エピ-オイカマロールなどの植物抽出物、またはエウカリプツス・マクラタ(Eucalyptus

10

20

30

40

50

maculata)、ハマゴウ(*Vitex rotundifolia*)、シムボポガン・マルチニ(*Cymbopogon martii*)、シムボポガン・シトラツス(*Cymbopogon citratus*)(レモングラス)、シモボガン・ナルツズ(*Cymbopogon nartdus*)(シトロネラ)などの植物からの粗製の植物抽出物由来のまたはこれらと同一の忌避剤である。適切な結合剤は、例えば脂肪族酸のビニルエステル(例えば酢酸ビニルおよびベルサチン酸ビニルなど)、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、例えばアクリル酸ブチル、アクリル酸2-エチルヘキシル、およびアクリル酸メチルなど、モノエチレン性およびジエチレン性不飽和炭化水素、例えばスチレンなど、および脂肪族ジエン、例えばブタジエンなどのポリマーおよびコポリマーから選択される。

【0270】

10

カーテンおよび蚊帳の含浸は、一般的に、布地材料を殺虫剤の乳剤もしくはディスパージョンに浸漬するか、またはネット上にこれらを噴霧することによって行う。

【0271】

本発明の化合物およびこれらの組成物は、木質材料、例えば木、板塀、枕木など、および建築物、例えば家屋、納屋、工場ばかりでなく、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、ならびにアリおよびシロアリが作物またはヒトに被害を与える(例えば、有害生物が家屋および公共施設に侵入した場合)のを防除するために使用することができる。本発明の化合物は、木質材料を保護するために周辺の土壌表面または床下土壌に適用するばかりでなく、製材品、例えば、床下コンクリート、床柱、梁、ベニヤ板、家具などの表面、木製品、例えばパーティクルボード、ハーフボードなど、およびビニル製品、例えばコーティングされた電線、ビニルシートなど、断熱材、例えばスチレン発泡体などにも適用することができる。作物またはヒトに被害を与えるアリに対して適用する場合、本発明のアリ防除剤を作物または周辺の土壌に適用するか、またはアリの巣などに直接適用する。

20

【0272】

本発明の化合物は、植物繁殖材料、特に種子の処理に対しても適切であり、これによって、これらの種子を昆虫有害生物、特に土壌に生息する昆虫有害生物から保護し、ならびに結果として生じる植物の根および苗条を土壌有害生物および葉面昆虫から保護する。

【0273】

本発明の化合物は、土壌有害生物から種子を保護し、結果として生じる植物の根および苗条を土壌有害生物および葉面昆虫から保護するのに特に有用である。結果として生じる植物の根および苗条の保護が好ましい。より好ましいのは、結果として生じる植物の苗条を、刺す昆虫および吸汁性昆虫から保護することであり、アブラムシからの保護が最も好ましい。

30

【0274】

したがって、本発明は、昆虫、特に土壌昆虫から種子を保護するため、および昆虫、特に土壌および葉面昆虫から苗木の根および苗条を保護するための方法であって、播種前および/または発芽前処理後に、種子をその塩を含む本発明の化合物と接触させることを含む方法を含む。特に好ましいのは、植物の根および苗条が保護される方法であり、より好ましいのは、植物苗条が刺す昆虫および吸汁性昆虫から保護される方法であり、最も好ましいのは、植物苗条がアブラムシから保護される方法である。

40

【0275】

種子という用語は、すべての種類の種子および植物栄養繁殖体を包含し、これらに限定されないが、真の種子、種子小片、吸枝、球茎、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、挿し木、切り取った苗条などを含み、好ましい実施形態では真の種子を意味する。

【0276】

種子処理という用語は、当技術分野で公知のすべての適切な種子処理技術、例えば種子粉衣法、種子コーティング法、種子散粉法、種子浸漬法および種子ペレット化法を含む。

【0277】

本発明はまた、活性化合物でコーティングされたまたは活性化合物を含有する種子を含

50

む。

【0278】

「～でコーティングされた、および/または～を含有する」という用語は、一般的に、適用時に活性成分が増殖物の表面上の大部分にあることを意味するが、適用方法に応じて、成分の一部が多かれ少なかれ増殖物に侵入してもよい。前記増殖物(再び)植えられた際に活性成分を吸収することができる。

【0279】

適切な種子は、穀物、根菜作物、油料作物、野菜植物、香辛料、観賞植物の種子、例えばデュラム小麦および他の小麦、オオムギ、カラスムギ、ライムギ、トウモロコシ(飼料用トウモロコシおよびシュガートウモロコシ/スウィートコーンおよびフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、綿、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、アブラナ、テンサイ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、イネ科草本、ローン、芝、飼料用イネ科草本、トマト、リーキ、パンプキン/カボチャ、キャベツ、アイスパークレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種、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、例えばジャガイモなど、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、パンジーおよびツリフネソウの種子である。

【0280】

さらに、活性化合物はまた、遺伝子操作法を含めた品種改良により、除草剤または殺菌剤または殺虫剤の作用に耐容性を示す植物由来の種子の処理に使用することもできる。

【0281】

例えば、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類似の活性物質からなる群からの除草剤に耐性がある植物由来の種子の処理において(例えば、EP-A242236、EP-A242246)(WO 92/00377)(EP-A257993、U.S.5,013,659を参照されたい)あるいは植物を特定の有害生物に対して耐性とするバシラス・チューリングエンシス毒(Bt毒)を産生する能力がある遺伝子組換え作物植物、例えば綿において(EP-A142924、EP-A193259)、活性化合物を採用することができる。

【0282】

さらに、例えば従来の品種改良法および/または突然変異体の生成、あるいは組換え手順により生成することができる現存する植物と比較して特徴が改変された植物由来の種子の処理に活性化合物を使用することもできる。例えば、植物内で合成されるデンプンの改変を目的とする作物植物の組換え改変のいくつかの事例(例えばWO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)、または脂肪酸組成物が修飾された遺伝子組換え作物植物の事例(WO 91/13972)が記載されている。

【0283】

活性化合物の種子処理適用は、植物の播種前および植物の出芽前に種子に噴霧または散粉することによって行う。

【0284】

特に種子処理に対して有用な組成物は、例えば以下である：

- A 可溶性濃縮剤(SL、LS)
- D 乳剤(EW、EO、ES)
- E 懸濁剤(SC、OD、FS)
- F 水分散性粒剤および水溶性粒剤(WG、SG)
- G 水分散性散剤および水溶性散剤(WP、SP、WS)
- H ゲル製剤(GF)
- I 散粉性散剤(DP、DS)

従来の種子処理製剤は、例えば流動性のある濃縮剤(FS)、液剤(LS)、乾燥処理用散剤(DS)、スラリー処理用水分散性散剤(WS)、水溶性散剤(SS)および乳剤(ESおよびEC)およびゲル製剤(GF)を含む。これらの製剤は、希釈してまたは希釈しないで種子に適用することができる。種子への適用は、播種前に種子に直接、または種子を発芽前処理した後に行う。

【0285】

好ましい実施形態では、FS製剤は種子処理用に使用する。典型的には、FS製剤は、1～800g/lの活性成分、1～200g/lの界面活性剤、0～200g/lの不凍剤、0～400g/lの結合剤、0～200g/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。

【0286】

種子処理用の特に好ましい本発明の化合物のFS製剤は、普通0.1～80重量%(1～800g/l)の活性成分、0.1～20重量%(1～200g/l)の少なくとも1種の界面活性剤、例えば0.05～5重量%の湿潤剤および0.5～15重量%の分散剤、20重量%まで、例えば5～20%の不凍剤、0～15重量%、例えば1～15重量%の顔料および/または色素、0～40重量%、例えば1～40重量%の結合剤(固着剤/付着剤)、場合によって5重量%まで、例えば0.1～5重量%の増粘剤、場合によって0.1～2%の消泡剤、ならびに場合によって保存剤、例えば、殺生物剤、抗酸化剤などを、例えば0.01～1重量%の量で、および充填剤/ビヒクルを100重量%まで含む。

10

【0287】

種子処理製剤は、結合剤、および場合によって着色剤も追加的に含んでもよい。

【0288】

結合剤を加えることによって、処理後の種子上の活性物質の付着を改善することができる。適切な結合剤は、アルキレンオキシド由来のホモポリマーおよびコポリマー、例えばエチレンオキシドまたはプロピレンオキシドなど、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、およびこれらのコポリマー、エチレン-酢酸ビニルコポリマー、アクリル酸のホモポリマーおよびコポリマー、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ジイミン、多糖、例えばセルロース、チロースおよびデンプンなど、ポリオレフィンホモポリマーおよびコポリマー、例えばオレフィン/無水マレイン酸コポリマーなど、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンのホモポリマーおよびコポリマーである。

20

【0289】

場合によって、また着色剤も製剤に含めることができる。種子処理製剤に対して適切な着色剤または色素は、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である。

30

【0290】

ゲル化剤の例は、カラギーナン(Satiagel(登録商標))である。

【0291】

種子の処理において、本発明の化合物の施用量は、一般的に種子100kg当たり0.01g～10kg、好ましくは種子100kg当たり0.05g～5kg、より好ましくは種子100kg当たり0.1g～1000gおよび特に種子100kg当たり0.1g～200gである。

40

【0292】

したがって本発明はまた、本明細書で定義されたような農業上有用なその塩を含めた本発明の化合物を含む種子にも関する。農業上有用なその塩を含めた本発明の化合物の量は、一般的に種子100kg当たり0.01g～10kg、好ましくは種子100kg当たり0.05g～5kg、特に種子100kg当たり0.1g～1000gで変動することになる。レタスなど特定の作物については、この率はより高くてもよい。

【0293】

種子を処理するために採用することができる方法は、原則として、すべての適切な種子処理および特に当技術分野で公知の種子粉衣法技法、例えば、種子コーティング法(例え

50

ば種子ペレット化)、種子散粉法および種子吸収(例えば種子浸漬)などである。ここで「種子処理」とは種子と、本発明の化合物を互いに接触させるすべての方法を指し、「種子粉衣法」とは、種子にある量の本発明の化合物を提供する、すなわち本発明の化合物を含む種子を作り出す種子処理の方法を指す。原則として、処理は、種子の収穫から種子の播種までの任意の時点において種子に適用することができる。種子は、例えば「プランターボックス」法を使用して、種子の定植の直前またはその間に処理することができる。しかし、処理は、効力の大幅な減少が観察されることなく、例えば種子粉衣処理の形態で、種子の定植の数週間または数カ月前、例えば最大12カ月前まで行うこともできる。

【0294】

適切には、この処理は、未播種種子に適用する。本明細書で使用される場合、「未播種種子」という用語は、種子の収穫から、植物の発芽および成長を目的とする地中への種子の播種までの任意の期間における種子を含むことを意図する。

【0295】

具体的には、適切なデバイス、例えば、固体または固体/液体混合パートナーのための混合装置内で、そのまままたは水による事前の希釈後に、組成物が種子上で均一に分布されるまで、種子を所定量の種子処理製剤と混合する処理において、手順に従う。適当な場合、この後に乾燥ステップが続く。

【0296】

これらの立体異性体、獣医学的に許容される塩またはN-オキシドを含めた本発明の化合物はまた、特に動物の体内および体の上の寄生生物を駆除するために使用するのに適切でもある。

【0297】

したがって、本発明の目的はまた、動物の体内および体の上の寄生生物を防除するための新規方法を提供することでもある。本発明の別の目的は、動物にとってより安全な殺有害生物剤を提供することである。さらに、本発明の別の目的は、現存する殺有害生物剤よりも低い投与量で 사용할ことができる動物用の殺有害生物剤を提供することである。本発明の別の目的は、寄生生物の長期残留防除を提供する、動物用の殺有害生物剤を提供することである。

【0298】

本発明はまた、動物の体内および体の上の寄生生物を駆除するための、これらの立体異性体、獣医学的に許容される塩またはN-オキシドを含めた本発明の化合物の殺寄生生物有効量と、許容される担体とを含む組成物にも関する。

【0299】

本発明はまた、寄生生物の侵襲および感染に対して動物を処置、防除、予防および保護するための方法であって、その立体異性体、獣医学的に許容される塩またはN-オキシドを含めた本発明の化合物の殺寄生生物有効量、またはこれを含む組成物を、動物に、経口的、局所的または非経口的に投与または適用させることを含む方法を提供する。

【0300】

本発明はまた、その立体異性体、獣医学的に許容される塩またはN-オキシドを含めた、本発明の化合物の殺寄生生物有効量、またはこれを含む組成物を含む、寄生生物の侵襲または感染に対して、動物を処置、防除、予防または保護するための組成物を調製するための方法を提供する。

【0301】

農業有害生物に対する化合物の活性は、例えば、経口適用の場合における低い非催吐性用量、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動物の体内および体の上の内部寄生生物および外部寄生生物の防除について、これらの適性を示唆するものではない。

【0302】

驚くことに今回、式(I)の化合物およびこれらの立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体およびN-オキシドは、動物の体内および体の上の内部寄生生物および外部寄

10

20

30

40

50

生生物を駆除するのに適切であることが判明した。

【0303】

本発明の化合物、特に式(I)の化合物およびこれらの立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体およびN-オキシド、ならびにこれらを含む組成物は、温血動物(ヒトを含む)および魚を含めた動物において、侵襲および感染を防除および予防するために使用するのが好ましい。これらは、例えば哺乳動物、例えばウシ、ヒツジ、ブタ、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ、家禽類、ウサギ、ヤギ、イヌおよびネコ、水牛、ロバ、ダマジカおよびトナカイ、さらに毛皮動物、例えばミンク、チンチラおよびアライグマなど、トリ、例えば雌鳥、ガチョウ、シチメンチョウおよびアヒルなど、ならびに魚、例えば淡水魚および塩水魚、例えばマス、コイおよびウナギなどにおける侵襲および感染を防除および予防するのに適切である。

10

【0304】

これらの立体異性体、獣医学的に許容される塩またはN-オキシドを含めた本発明の化合物およびこれらを含む組成物は、家畜、例えばイヌまたはネコなどにおける侵襲および感染を防除および予防するのに使用されるのが好ましい。

【0305】

温血動物および魚における侵襲として、これらに限定されないが、シラミ、ハジラミ、マダニ、ハナウマバエ、ヒツジシラミバエ、刺咬性ハエ、キンバエ、ハエ、ミアシティックハエ幼虫、ツツガムシ、ブヨ、蚊およびノミが挙げられる。

【0306】

これらの立体異性体、獣医学的に許容される塩またはN-オキシドを含めた本発明の化合物、およびこれらを含む組成物は、外部寄生生物および/または内部寄生生物の浸透性および/または非浸透性防除に対して適切である。これらは、発達のすべてまたは一部の段階に対して活性がある。

20

【0307】

本発明の化合物は、特に以下の目および種の寄生生物をそれぞれ駆除するのに有用である：

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*)、

30

ゴキブリ(ゴキブリ目(Blattaria)-ブラトデア(Blattodea))、例えばチャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、ブラテラ・アサヒナエ(*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*)、ペリプラネタ・フリギノサ(*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*)、ハエ、蚊(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*)、アノフェレス・マクリペニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルシアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、ガンビエハマダラカ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレエボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・ロイコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、コガタハマダラカ(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラツス(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(*Calliphora vicina*)、クリソミア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラクス(*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マセラリア(*Chrysomya macellaria*)、クリソプス・ジスカリス(*Chrysops discalis*)、クリソプス・シラセア(*Chrysops silacea*)、クリソプス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、アメリカオビキンバエ(*Cochliomyia hominivorax*)、コルジロビア・アントロボファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、クレクス・ニグリバルプス(*Culex nigripalpus*)、ネッタイイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、

40

50

atus)、クレクス・タルサリス(*Culex tarsalis*)、クリセタ・イノルナタ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ヒトヒフバエ(*Dermatobia hominis*)、ヒメイエバエ(*Fannia canicularis*)、ウマバエ(*Gasterophilus intestinalis*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロシナ・フスシベス(*Glossina fuscipes*)、グロシナ・タキノイデス(*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*)、ヒペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、ヒポデルマ・リネアタ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノプス・トレンス(*Leptoconops torrens*)、ルシリア・カプリナ(*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*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、フェレボトムス・アルゲンチベス(*Phlebotomus argentipes*)、プソロフォラ・コロムビアエ(*Psorophora columbiae*)、プソロフォラ・ジスコロル(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimulium mixtum*)、サルコファガ・ヘモロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* spp.)、シムリウム・ビタツム(*Simulium vittatum*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス・ボビヌス(*Tabanus bovinus*)、タバヌス・アトラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)、およびタバヌス・シミリス(*Tabanus similis*)、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*)。

【0308】

マダニおよび寄生ダニ(パラシチフォルメス(*Parasitiformes*)):マダニ(イクソジダ(*Ixodida*))、例えばクロアシマダニ(*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス(*Ixodes holocyclus*)、西部クロアシマダニ(*Ixodes pacificus*)、リフィセファルス・サンギネウス(*Rhiphicephalus sanguineus*)、デルマセントル・アンデルソニ(*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*)、アンブリオマ・マクラツム(*Amblyomma maculatum*)、オルニソドルス・ヘルムシ(*Ornithodoros hermsi*)、オルニソドルス・ツリカタ(*Ornithodoros turicata*)および寄生ダニ(メソスチグマタ(*Mesostigmata*))、例えばイエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)およびワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、

アクチネジダ(*Actiniedida*)(ケダニ亜目(*Prostigmata*))およびアカリジダ(*Acaridida*)(コナダニ亜目(*Astigmata*))、例えばアカラピス属の種(*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属の種(*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア属の種(*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属の種(*Myobia* spp.)、プソレルガテス属の種(*Psorergates* spp.)、デモデクス属の種(*Demodex* spp.)、トロムビクラ属の種(*Trombicula* spp.)、リストロホルス属の種(*Listrophorus* spp.)、アカルス属の種(*Acarus* spp.)、チロファグス属の種(*Tyrophagus* spp.)、カログリフス属の種(*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属の種(*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属の種(*Pterolichus* spp.)、プソロプテス属の種(*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属の種(*Chorioptes* spp.)、オトデクテス属の種(*Otodectes* spp.)、サルコプテス属の種(*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属の種(*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属の種(*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属の種(*Cytodites* spp.)、およびラミノシオプテス属の種(*Laminosioptes* spp.)、

バグ(ヘテロプテリダ(*Heteropterida*)):トコジラミ(*Cimex lectularius*)、ネッタイトコジラミ(*Cimex hemipterus*)、レジュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種(*Triatoma* spp.)、ロドニウス属の種(*Rhodnius* spp.)、パンストロンギルス属の種(*Panstrongylus* spp.)およびアリス・クリタツス(*Arilus critatus*)、

アノプルリダ(Anoplurida)、例えばハエマトピヌス属の種(*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属の種(*Linognathus* spp.)、ペジクルス属の種(*Pediculus* spp.)、フチルス属の種(*Phtirus* spp.)、およびソレノポテス属の種(*Solenopotes* spp.)、マロファギダ(Mallophagida)(アルンブリセリナ亜目(suborder Arnblycerina)およびイスクノセリナ亜目(suborder Ischnocerina))、例えばトリメノポン属の種(*Trimenopon* spp.)、メノポン属の種(*Menopon* spp.)、トリノトン属の種(*Trinoton* spp.)、ボビコラ属の種(*Bovicola* spp.)、ウエルネキエラ属の種(*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.)、

線形動物門線虫(Roundworms Nematoda):

ワイプワーム(Wipeworms)およびトリチノーシス(*Trichinosis*)(トリコシリングダ(*Trichosyringida*))、例えばトリキネリダエ(トリチネラ属の種(*Trichinella* spp.))、(トリクリダエ(*Trichuridae*))トリクリス属の種(*Trichuris* spp.)、カピラリア属の種(*Capillaria* spp.)、

ラブジチダ目(Rhabditida)、例えばラブジチス属の種(*Rhabditis* spp.)、ストロンギロイデス属の種(*Strongyloides* spp.)、ヘリセファロブス属の種(*Helicephalobus* spp.)、ストロンギリダ亜目(*Strongylida*)、例えばストロンギルス属の種(*Strongylus* spp.)、アンシロストマ属の種(*Ancylostoma* spp.)、ネカトル・アメリカヌス(*Necator americanus*)、ブノストムム属の種(*Bunostomum* spp.)(鉤虫(Hookworm))、トリコストロンギルス属の種(*Trichostrongylus* spp.)、捻転胃虫(*Haemonchus contortus*)、オステルタギア属の種(*Ostertagia* spp.)、コオペリア属の種(*Cooperia* spp.)、ネマトジルス属の種(*Nematodirus* spp.)、ジクチオカウルス属の種(*Dictyocaulus* spp.)、シアトストマ属の種(*Cyathostoma* spp.)、エソファゴストムム属の種(*Oesophagostomum* spp.)、ステファヌルス・デントツス(*Stephanurus dentatus*)、オルヌス属の種(*Ollulanus* spp.)、カベルチア属の種(*Cabertia* spp.)、ステファヌルス・デントツス(*Stephanurus dentatus*)、シンガムス・トラケア(*Syngamus trachea*)、アンシロストマ属の種(*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属の種(*Uncinaria* spp.)、グロボセファルス属の種(*Globocephalus* spp.)、ネカトル属の種(*Necator* spp.)、メタストロンギルス属の種(*Metastrongylus* spp.)、ムエルレリウス・カピラリス(*Muellerius capillaris*)、プロトストロンギルス属の種(*Protostrongylus* spp.)、アンギオストロンギルス属の種(*Angiostrongylus* spp.)、パレラフォストロンギルス属の種(*Parelaphostrongylus* spp.)、アレウロストロンギルス・アブストルスス(*Aleurostrongylus abstrusus*)、およびジオクトフィマ・レナレ(*Dioctophyma renale*)、腸管内線虫(回虫目(*Ascaridida*))、例えばアスカリス・ルムブリコイデス(*Ascaris lumbricoides*)、ブタ回虫(*Ascaris suum*)、アスカリジア・ガリ(*Ascaridia galli*)、パラスカリス・エクオルム(*Parascaris equorum*)、エンテロビウス・ベルミクラリス(*Enterobius vermicularis*)(線虫(Threadworm))、トキシカラ・カニス(*Toxocara canis*)、トキサスカリス・レオニン(*Toxascaris leonine*)、スクルジャビネマ属の種(*Skrjabinema* spp.)、およびオキシウリス・エキ(*Oxyuris equi*)、

カマラニダ(*Camallanida*)、例えばドラクンクルス・メジネンシス(*Dracunculus medinensis*)(ギニア虫)

センビセンチュウ目(*Spirurida*)、例えばテラジア属の種(*Thelazia* spp.)、ウケレリア属の種(*Wuchereria* spp.)、ブルギア属の種(*Brugia* spp.)、オンコセルカ属の種(*Onchocerca* spp.)、ジロフィラリ属の種(*Dirofilaria* spp.)、ジベタロネマ属の種(*Dipetalonema* spp.)、セタリア属の種(*Setaria* spp.)、エレオフォラ属の種(*Elaeophora* spp.)、スピロセルカ・ルピ(*Spirocerca lupi*)、およびハプロネマ属の種(*Habronema* spp.)、鉤頭虫(鉤頭動物門(*Acanthocephala*))、例えばアカントセファルス属の種(*Acanthocephalus* spp.)、マクラカントリンクス・ヒルジナセウス(*Macracanthorhynchus hirudinaceus*)およびオンシコラ属の種(*Oncicola* spp.)、

プラナリア(プラテルミンテス(*Plathelminthes*)):

吸虫(吸虫綱(*Trematoda*))、例えばファシオラ属の種(*Faciola* spp.)、ファシオロイデス

10

20

30

40

50

・マグナ(*Fascioloides magna*)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、ジクロコエリウム属の種(*Dicrocoelium* spp.)、ファシオロプシス・ブスキ(*Fasciolopsis buski*)、肝吸虫(*Clonorchis sinensis*)、住血吸虫属の種(*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルジア属の種(*Trichobilharzia* spp.)、アラリア・アラタ(*Alaria alata*)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、およびナノシエテス属の種(*Nanocyetes* spp.)、セルコメロモルファ(*Cercomeromorpha*)、特に条虫綱(*Cestoda*) (条虫(Tapeworms))、例えばジフィロボトリウム属の種(*Diphyllbothrium* spp.)、テニア属の種(*Tenia* spp.)、エキノкокクス属の種(*Echinococcus* spp.)、ジピリジウム・カニヌム(*Dipylidium caninum*)、ムルチセプス属の種(*Multiceps* spp.)、ヒメノレピス属の種(*Hymenolepis* spp.)、メソセストイデス属の種(*Mesocestoides* spp.)、バンピロレピス属の種(*Vampirolepis* spp.)、モニエジア属の種(*Moniezia* spp.)、アノプロセファラ属の種(*Anoplocephala* spp.)、シロメトラ属の種(*Sirometra* spp.)、アノプロセファラ属の種(*Anoplocephala* spp.)、およびヒメノレピス属の種(*Hymenolepis* spp.)。

10

【0309】

本発明は、本発明の化合物およびこれらを含む組成物の、動物の体内および/または体の上の寄生生物を防除および/または駆除するための治療的および非治療的使用に関する。本発明の化合物およびこれらを含む組成物を使用して、本発明の化合物およびこれらを含む組成物の殺寄生生物有効量を動物に接触させることによって、寄生生物による攻撃または侵襲から動物を保護することができる。

20

【0310】

本発明の化合物およびこれらを含む組成物は、接触(土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、ブランケットまたは動物部位を介して)および摂取(例えばベイト剤)の両方を介して効果的となり得る。よって、「接触させること」は、直接的接触(本発明の化合物を含む殺有害生物性混合物/組成物を直接寄生生物に適用することであり、これは、その居場所-Pで間接接触させること、場合によって、殺有害生物性混合物/組成物を保護すべき動物に直接投与することも含み得る)および間接的接触(化合物/組成物を寄生生物の居場所に適用する)の両方を含む。その居場所への適用を介して寄生生物を接触させることは、本発明の化合物の非治療的使用の例である。上記で使用された「居場所-P」とは、動物の外側で寄生生物が成長しているまたは成長し得る、生息地、食物供給、繁殖地、領域、材料または環境を意味する。

30

【0311】

一般的に、「殺寄生生物有効量」は、ネクロシス、死滅、遅延、予防、および除去、破壊、またはさもなければ標的生物の出現および活性を減少させるという効果を含む、成長に対する観察可能な効果を達成するのに必要とされる活性成分の量を意味する。殺寄生生物有効量は、本発明の様々な化合物/組成物に対して変動し得る。組成物の殺寄生生物有効量もまた、一般的な条件、例えば所望の殺寄生生物効果および継続時間、標的種、適用モードなどに従い変動することになる。

【0312】

本発明の化合物はまた、有害生物または寄生生物の出現が予想される場所に予防的に適用することができる。

40

【0313】

投与は、防止的および治療的に行うことができる。

【0314】

活性化合物の投与は、直接または適切な調製物の形態で、経口的に、局所的に/経皮的にまたは非経口的に行われる。

【実施例】

【0315】

本発明は、ここで、これに対していかなる限定を課すこともなく、以下の例によりさらに詳細に例示される。

【0316】

50

調製例

化合物は、例えばカップリングした高速液体クロマトグラフィー/質量分析法(HPLC/MS)、 ^1H -NMRおよび/またはこれらの融点により特徴づけることができる。

【0317】

分析用HPLCカラム:RP-18カラムChromolith Speed ROD、Merck KgaA、ドイツ製。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)を、5:95~95:5の割合で、40℃で5分間。

【0318】

^1H -NMR、それぞれの ^{13}C -NMR:信号は、化学シフト(ppm、 δ [デルタ])vs.テトラメチルシラン、それぞれの ^{13}C -NMRに対する CDCl_3 で、これらの多重度およびこれらの積分(所与の水素原子の相対的な数)により特徴づけられる。以下の略語は、信号の多重度の特徴づけるために使用される:m=多重線、sept=七重線、q=四重線、t=三重線、d=二重線、dd=二重線の二重線、s=一重線、b=太線。

10

【0319】

使用される略語:時間に対してh、分に対してmin、20~25℃に対して室温、テトラヒドロフランに対してTHF、n-ブチル-リチウムに対してn-BuLi、tert-ブチルメチルエーテルに対してMTBE。

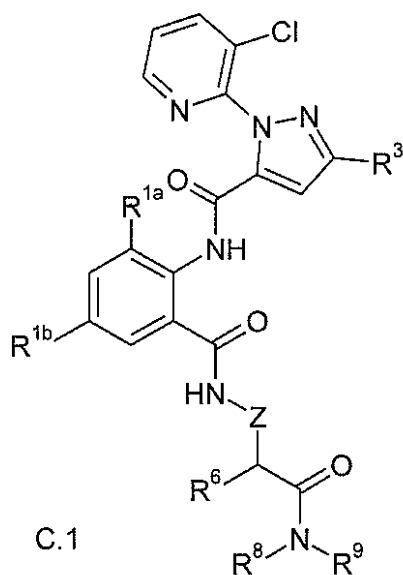
【0320】

C.化合物例C.1化合物例1

20

化合物例1-1~1-11は、式C.1化合物に対応する:

【化18】



30

【0321】

(式中、各化合物例のZ、 R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^3 、 R^6 、 R^8 および R^9 は、以下の表C.1において定義される)。

40

【表 2】

表C.1

化合物番号	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁶	R ⁸	R ⁹	Z
1-1	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₃	CH ₃	O
1-2	CH ₃	Cl	Br	H	H	H	O
1-3	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₃	H	O
1-4	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₂ CH ₃	H	O
1-5	CH ₃	Cl	Br	H	C(CH ₃) ₃	H	O
1-6	CH ₃	CN	Br	H	CH ₃	H	O
1-7	Br	F	Br	H	CH ₃	H	O
1-8	Br	Cl	Br	H	CH ₃	H	O
1-9	CH ₃	Cl	Br	H	CH(CH ₃) ₂	H	O
1-10	Br	Br	Br	H	CH ₃	H	O
1-11	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	NH
1-12	Br	Br	Br	H	CH ₃	CH ₃	O
1-13	Cl	Cl	Br	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	O
1-14	Cl	Cl	Br	CH ₃	H	H	O
1-15	Br	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O
1-16	Br	Cl	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	O
1-17	Br	F	Br	H	C ₆ H ₅	H	O
1-18	Br	F	Br	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	O
1-19	Br	Cl	Br	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	O
1-20	Br	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	H	O
1-21	CH ₃	CN	Br	H	CH(CH ₃)- シクロプロピル	H	O
1-22	Br	Cl	Br	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	O
1-23	CH ₃	Cl	Br	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	O
1-24	CH ₃	Cl	CF ₃	H	CH ₃	H	O
1-25	CH ₃	Cl	Br	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		O
1-26	Br	F	Br	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	O
1-27	Br	F	Br	CH ₃	H	H	O
1-28	Br	F	Br	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		O
1-29	Br	F	Br	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	O
1-30	CH ₃	CN	Br	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	O
1-31	CH ₃	Cl	Br	H	C ₆ H ₅	H	O
1-32	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	O
1-33	CH ₃	CN	Br	H	C ₆ H ₅	H	O
1-34	Cl	Cl	Br	H	CH(CH ₃) ₂	H	O
1-35	CH ₃	CN	Br	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	O
1-36	Br	Cl	Br	H	C ₆ H ₅	H	O
1-37	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	O
1-38	CH ₃	CN	Br	H	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	O
1-39	CH ₃	CN	Br	H	CH ₃	OCH ₃	O
1-40	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	H	O
1-41	Br	Cl	Br	CH ₃	H	H	O
1-42	Br	Cl	Br	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	O

10

20

30

40

化合物番号	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁶	R ⁸	R ⁹	Z
1-43	Br	F	Br	CH ₃	CH ₃	H	O
1-44	CH ₃	Cl	Br	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	O
1-45	Br	Cl	Br	CH ₂ CH ₃	H	H	O
1-46	Br	Cl	Br	CH(CH ₃) ₂	H	H	O
1-47	Br	Br	Br	H	C ₆ H ₅	H	O
1-48	Cl	Cl	Br	H	CH ₃	H	O
1-49	Br	F	Br	H	C(CH ₃) ₃	H	O
1-50	Br	F	Br	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O
1-51	Br	F	Br	CH(CH ₃) ₂	H	H	O
1-52	CH ₃	Cl	Br	CH(CH ₃) ₂	H	H	O
1-53	Br	Br	Br	H	CH(CH ₃) ₂	H	O
1-54	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	H	H	O
1-55	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	O
1-56	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₂ CF ₃	H	O
1-57	Br	Cl	Br	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	O
1-58	CH ₃	Cl	Br	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O
1-59	Br	Cl	Br	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		O
1-60	CH ₃	Cl	Br	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	O
1-61	Br	Cl	Br	H	C(CH ₃) ₃	H	O
1-62	CH ₃	CN	Br	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	O
1-63	Br	F	Br	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	O
1-64	Br	Cl	Br	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	O
1-65	Cl	Cl	Br	H	CH ₃	CH ₃	O
1-66	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₂ C≡CH	H	O
1-67	Br	Cl	Br	H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -		O
1-68	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O
1-69	Br	F	Br	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	O
1-70	Br	Cl	Br	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	O
1-71	Br	F	Br	CH ₂ CH ₃	H	H	O
1-72	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₃	CH ₃	NH
1-73	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₃	H	NH

10

20

30

表 C.2: 表 C.1 に記載される上記化合物例の物理化学的データ

化合物番号	HPLC データ、保持時間 t_r [分], m/z
1-1	$t_r = 2.93$ 分; $m/z = 571.9$ (M+H)
1-2	$t_r = 2.47$ 分; $m/z = 542.9$ (M+H)
1-3	$t_r = 2.62$ 分; $m/z = 557.0$ (M+H)
1-4	$t_r = 2.91$ 分; $m/z = 571.0$ (M+H)
1-5	$t_r = 3.31$ 分; $m/z = 599.0$ (M+H)
1-6	$t_r = 2.51$ 分; $m/z = 548.0$ (M+H)
1-7	$t_r = 2.60$ 分; $m/z = 604.8$ (M+H)
1-8	$t_r = 2.77$ 分; $m/z = 622.8$ (M+H)
1-9	$t_r = 3.64$ 分; $m/z = 584.9$ (M+H)
1-10	$t_r = 2.86$ 分; $m/z = 666.8$ (M+H)
1-11	$t_r = 3.29$ 分; $m/z = 631.9$ (M+H)
1-12	$t_r = 3.01$ 分; $m/z = 680.8$ (M+H)
1-13	$t_r = 3.44$ 分; $m/z = 652.9$ (M+H)
1-14	$t_r = 2.80$ 分; $m/z = 576.9$ (M+H)
1-15	$t_r = 3.04$ 分; $m/z = 649.9$ (M+H)
1-16	$t_r = 3.11$ 分; $m/z = 646.8$ (M+H)
1-17	$t_r = 3.37$ 分; $m/z = 666.8$ (M+H)
1-18	$t_r = 3.25$ 分; $m/z = 680.9$ (M+H)
1-19	$t_r = 3.10$ 分; $m/z = 650.9$ (M+H)
1-20	$t_r = 2.95$ 分; $m/z = 636.9$ (M+H)
1-21	$t_r = 3.17$ 分; $m/z = 584.1$ (M+H)
1-22	$t_r = 3.34$ 分; $m/z = 676.9$ (M+H)
1-23	$t_r = 3.21$ 分; $m/z = 599.0$ (M+H)
1-24	$t_r = 2.97$ 分; $m/z = 545.9$ (M+H)
1-25	$t_r = 2.76$ 分; $m/z = 611.0$ (M+H)
1-26	$t_r = 2.94$ 分; $m/z = 615.0$ (M+H)
1-27	$t_r = 2.61$ 分; $m/z = 604.8$ (M+H)
1-28	$t_r = 2.73$ 分; $m/z = 642.8$ (M+H)
1-29	$t_r = 3.07$ 分; $m/z = 647.0$ (M+H)
1-30	$t_r = 3.12$ 分; $m/z = 304.1$ (M+H)
1-31	$t_r = 3.34$ 分; $m/z = 617.0$ (M+H)
1-32	$t_r = 3.04$ 分; $m/z = 581.0$ (M+H)
1-33	$t_r = 3.21$ 分; $m/z = 608.0$ (M+H)
1-34	$t_r = 3.17$ 分; $m/z = 587.0$ (M+H)
1-35	$t_r = 3.24$ 分; $m/z = 624.1$ (M+H)
1-36	$t_r = 3.54$ 分; $m/z = 682.9$ (M+H)
1-37	$t_r = 3.11$ 分; $m/z = 584.9$ (M+H)
1-38	$t_r = 3.28$ 分; $m/z = 596.1$ (M+H)
1-39	$t_r = 2.80$ 分; $m/z = 560.0$ (M+H)
1-40	$t_r = 2.88$ 分; $m/z = 571.0$ (M+H)
1-41	$t_r = 2.85$ 分; $m/z = 620.9$ (M+H)
1-42	$t_r = 3.07$ 分; $m/z = 630.9$ (M+H)
1-43	$t_r = 2.77$ 分; $m/z = 618.9$ (M+H)
1-44	$t_r = 2.96$ 分; $m/z = 585.2$ (M+H)
1-45	$t_r = 2.98$ 分; $m/z = 634.9$ (M+H)

10

20

30

40

化合物番号	HPLC データ、保持時間 t_r [分], m/z
1-46	$t_r = 3.03$ 分; $m/z = 648.9$ (M+H)
1-47	$t_r = 3.15$ 分; $m/z = 728.8$ (M+H)
1-48	$t_r = 2.84$ 分; $m/z = 576.8$ (M+H)
1-49	$t_r = 3.26$ 分; $m/z = 628.9$ (M+H)
1-50	$t_r = 2.88$ 分; $m/z = 645.9$ (M+H)
1-51	$t_r = 2.87$ 分; $m/z = 632.9$ (M+H)
1-52	$t_r = 3.08$ 分; $m/z = 585.0$ (M+H)
1-53	$t_r = 3.15$ 分; $m/z = 676.9$ (M+H)
1-54	$t_r = 3.64$ 分; $m/z = 555.0$ (M+H)
1-55	$t_r = 3.39$ 分; $m/z = 613.0$ (M+H)
1-56	$t_r = 3.30$ 分; $m/z = 625.0$ (M+H)
1-57	$t_r = 3.46$ 分; $m/z = 696.9$ (M+H)
1-58	$t_r = 3.03$ 分; $m/z = 597.3$ (M+H)
1-59	$t_r = 3.04$ 分; $m/z = 642.8$ (M+H)
1-60	$t_r = 3.05$ 分; $m/z = 599.1$ (M+H)
1-61	$t_r = 3.43$ 分; $m/z = 644.9$ (M+H)
1-62	$t_r = 2.79$ 分; $m/z = 559.0$ (M+H)
1-63	$t_r = 2.93$ 分; $m/z = 646.9$ (M+H)
1-64	$t_r = 3.25$ 分; $m/z = 662.9$ (M+H)
1-65	$t_r = 2.95$ 分; $m/z = 573.0$ (M+H)
1-66	$t_r = 3.03$ 分; $m/z = 581.0$ (M+H)
1-67	$t_r = 2.96$ 分; $m/z = 658.8$ (M+H)
1-68	$t_r = 2.92$ 分; $m/z = 584.9$ (M+H)
1-69	$t_r = 2.92$ 分; $m/z = 632.9$ (M+H)
1-70	$t_r = 3.09$ 分; $m/z = 662.9$ (M+H)
1-71	$t_r = 2.79$ 分; $m/z = 618.9$ (M+H)
1-72	$t_r = 3.07$ 分; $m/z = 476.0$ (M+H)
1-73	$t_r = 2.66$ 分; $m/z = 555.9$ (M+H)

10

20

30

【0322】

S. 式Iの化合物に対する合成例

S.1 5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸(4-クロロ-2-メチル-6-メチルカルバモイルメトキシカルバモイル-フェニル)-アミドの合成例(表C.1の化合物1-3に対応)

ステップ1.1:2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イルオキシ)-N-メチル-アセトアミドの合成

N-ヒドロキシフタルイミド(7.4g、45mmol)のN-メチル-2-ピロリドン(55mL)中溶液に、粉末状炭酸カリウム(4.3g、31mmol)を25℃で加えた。結果として生じた赤色の混合物を40℃に10min温め、2-クロロ-N-メチルアセトアミド(4.8g、45mmol)のN-メチル-2-ピロリドン(10mL)中溶液を滴加した。混合物を60℃に温め、この温度で2h攪拌し、次いで80℃で18h攪拌した。混合物を冷却し、氷水(およそ300mL)に注入し、pH2~4に酸性化した。混合物を0℃でさらに2h攪拌し、結晶性沈殿物を濾過し、少量の冷水で洗浄し、高真空下、50℃で乾燥させることによって、表題化合物を得た(4.0g、37%)。LCMS: r.t. 1.70 min、 m/z 235 (M+H)⁺。

40

【0323】

ステップ1.2:2-[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-イル]-6-クロロ-8-メチル-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-4-オンの合成

6-クロロ-8-メチル-1H-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-2,4-ジオン(3.2g、15.1mmol)のアセ

50

トニトリル(12mL)中懸濁液に、5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-塩化カルボニル(5.6g、17.5mmol)のアセトニトリル(5mL)中溶液を滴加し、次いでピリジン(7.8mL)および混合物を25℃で30min攪拌した。混合物を3h攪拌しながら還流させ(槽温度110℃)、次いで25℃で16h攪拌しながら還流させ、0~5℃に冷却した。白色の沈殿物を濾別し、少量の氷冷アセトニトリルで洗浄し、空気乾燥させることによって、表題化合物を得た(5.9g、86%)。LCMS: r.t. 3.48 min、m/z 453 (M+H)⁺; ¹H NMR(DMSO, 500MHz) δ 8.63(dd, J=1.5, 4.5Hz, 1H), 8.35(dd, J=1.5, 8.0Hz, 1H), 7.89(dd, J=0.5, 2.5Hz, 1H), 7.78 - 7.77(m, 1H), 7.77(dd, J=5.0, 8.0Hz, 1H), 7.53(s, 1H), 1.72(s, 3H)。

【0324】

10

ステップ1.3:2-アミノオキシ-N-メチル-アセトアミドの合成

2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イルオキシ)-N-メチルアセトアミド(4.0g、17mmol)のエタノール(50mL)中懸濁液に、25℃でヒドラジン水和物(2.5g、50mmol)を加えた。混合物を25℃で4h攪拌し、0℃に0.5h冷却し、濾過し、残渣を冷たいエタノールで洗浄した。上清液を濃縮し、氷水(およそ40mL)中に溶解し、水性NaHCO₃を使用してpHを10になるよう調節し、混合物をジクロロメタンで抽出した(4×300mL)。合わせた有機相を乾燥させ(MgSO₄)、回転式蒸発させることによって、表題生成物を得た(0.48g、27%)。これを以下のステップで、さらなる精製なしでそのまま使用した。

【0325】

20

ステップ1.4:5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸(4-クロロ-2-メチル-6-メチルカルバモイルメトキシカルバモイル-フェニル)-アミドの合成

2-[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-イル]-6-クロロ-8-メチル-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-4-オン(670mg、1.48mmol)のテトラヒドロフラン(13mL)中溶液に、2-アミノオキシ-N-メチル-アセトアミド(480mg、4.61mmol)を加え、混合物を48h攪拌しながら還流させた。混合物を濃縮し、残渣をCH₂Cl₂とH₂Oとの間に分離させた。濃縮した水性NH₄Clで水相をpH7になるよう調節し、CH₂Cl₂で抽出した。合わせた有機相を乾燥させ(MgSO₄)、濃縮した。残渣を、酢酸エチル:ジエチルエーテル、1:1(20mL)から結晶化し、結晶性固体を酢酸エチルで洗浄し、高真空下50℃で乾燥させることによって、表題生成物を得た(580mg、70%)。LCMS: r.t. 2.62min、m/z 557 (M+H)⁺; ¹H NMR(500MHz, DMSO) δ 11.9(s, 1H), 10.3(s, 1H), 8.50(dd, J=1.5, 4.5Hz, 1H), 8.16(dd, J=1.5, 8.0Hz, 1H), 8.13(s, 1H), 7.60(dd, J=5.0, 8.0Hz, 1H), 7.55(s, 1H), 7.37(s, 2H), 4.25(s, 2H), 2.62(d, J=5.0Hz, 3H), 2.18(s, 3H)。

30

【0326】

S.2 5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸(2,4-ジブロモ-6-メチルカルバモイルメトキシカルバモイル-フェニル)-アミドの合成例(表C.1の化合物1-10に対応)

ステップ2.1:2-[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-イル]-6,8-ジブロモ-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-4-オンの合成

6,8-ジブロモ-1H-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-2,4-ジオン(4.14g、12.9mmol)のアセトニトリル(7mL)中懸濁液に、5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-塩化カルボニル(4.76g、14.8mmol)のアセトニトリル(5mL)中溶液を加えた。混合物に、ピリジン(7.4mL)を滴加すると軽い発熱が観察された。混合物を25℃で30min攪拌し、還流(槽温度110℃)で1.5h攪拌し25℃で18h攪拌した。混合物を氷浴中で冷却し、結果として生じた白色の沈殿物を濾過し、冷たいアセトニトリルで洗浄し、風乾させることによって、白色の固体として、表題化合物を得た(3.79g、52%)。LCMS: 4.04 min、m/z 562(M+H)⁺; ¹H NMR(500MHz, DMSO) δ 8.59(dd, J=1.5, 5.0Hz, 1H), 8.35(d, J=2.0Hz, 1H), 8.32(dd, J=1.5, 8.5Hz, 1H), 8.18(d, J=2.0Hz, 1H), 7.72(dd, J=5.0, 8.5Hz, 1H), 7.57(s, 1H)。

40

【0327】

ステップ2.2:5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸(2,4

50

-ジブromo-6-メチルカルバモイルメトキシカルバモイル-フェニル)-アミドの合成:

2-[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-イル]-6,8-ジブromo-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-4-オン(400mg、0.7mmol)のテトラヒドロフラン(10mL)中溶液に、2-アミノオキシ-N-メチル-アセトアミド(74mg、0.7mmol)を加え、混合物を25℃で72h攪拌し、次いで60℃で5h攪拌し、還流で2h攪拌した。混合物を濃縮し、残渣をクロマトグラフィー(CH₂Cl₂:MeOH、97.5:2.5)にかけることによって、白色の固体として、表題化合物を得た(400mg、84%):m.p. 220~221℃; LCMS r.t. 2.86 min、m/z 666.8 (M+H)⁺; ¹H NMR(500MHz, DMSO) δ 11.99(s, 1H), 10.58(s, 1H), 8.50(dd, J=1.5, 5.0Hz, 1H), 8.17 - 8.14(m, 2H), 8.06(s, 1H), 7.69(d, J=5.0, 8.0Hz, 1H), 7.43(s, 1H), 4.23(s, 2H), 2.61(d, J=4.5Hz, 3H)。

10

【0328】

S.3 5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸{2-[N'-(ベンジルカルバモイル-メチル)-ヒドラジノカルボニル]-4-クロロ-6-メチル-フェニル}-アミドの合成例(表C.1の化合物1-11に対応)

ステップ3.1:N-ベンジル-2-ヒドラジノ-アセトアミドの合成

0℃で、ヒドラジン水和物(5.4g、109mmol)のアセトニトリル(5mL)中溶液に、2-クロロ-N-ベンジルアセトアミド(1.0g、5.45mmol)のアセトニトリル(3mL)中溶液を0℃で滴加した。混合物を0℃で4h攪拌し、次いで25℃で48h放置した。分離した水相/ヒドラジン相をシリンジで除去し、アセトニトリル相を蒸発させ、トルエンと共に粉碎し、再び蒸発させた。クロマトグラフィー(塩化メチレン:MeOH、85:15)により、表題生成物を得た(0.71g、72%); LCMS 1.30 min; m/z 180.1 (M+H)⁺; ¹H NMR 7.35 - 7.25(m, 5H), 7.05(bd s, 1H), 4.85(br s, 1H), 4.55(m, 2H), 3.45(s, 2H), 2.05(br s, 2H)。

20

【0329】

ステップ3.2:5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸{2-[N'-(ベンジルカルバモイル-メチル)-ヒドラジノカルボニル]-4-クロロ-6-メチル-フェニル}-アミドの合成

2-[5-ブromo-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-イル]-6-クロロ-8-メチル-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-4-オン(0.2g、0.44mmol)のジメチルスルホキシド(5mL)中溶液に、N-ベンジル-2-ヒドラジノ-アセトアミド(0.1g、0.56mmol)を加え、混合物を70℃で4h攪拌した。混合物を塩化アンモニウム希釈水溶液に注ぎ入れ、沈殿した結晶を濾過し、H₂Oで洗浄し、高真空下で18h乾燥させることによって、白色の結晶として、表題生成物を得た(0.18g、64%); m.p. 120~121℃; LCMS r.t. 2.91 min、m/z 631.9 (M+H)⁺。

30

【0330】

B. 生物学の実施例

本発明の式Iの化合物の活性は、以下に記載されている生物学の試験で実証し、評価することができた。

【0331】

他に特定されていない限り、試験溶液は以下の通り調製した:

活性化合物は、所望の濃度で、蒸留水:アセトンの1:1(vol:vol)混合物中に溶解した。試験溶液は、使用当日に調製する。

40

【0332】

B.1コナガ(Plutella xylostella)

活性化合物は、蒸留水:アセトンの1:1(vol:vol)混合物中に所望の濃度で溶解し、界面活性剤(Alkamuls(登録商標)EL620)を0.1%(vol/vol)の割合で加えた。試験溶液を使用当日に調製した。

【0333】

キャベツの葉を試験溶液に浸漬し、風乾した。処理した葉を、湿った濾紙を並べたペトリディッシュに置き、10匹の3齢幼虫を接種した。致死率を処理の72時間後に記録した。0~100%のスケールを使用して食害も記録した。

【0334】

50

この試験において、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、500ppmで、未処理の対照と比較して100%の致死率を示した。

【0335】

B.2アワヨトウ(スポドプテラ・エリジアナ(*Spodoptera eridiana*))；2齢幼虫

活性化合物は、管で供給する10,000ppm溶液として、シクロヘキサノン中で製剤化した。噴霧ノズルを備えた、自動電動式噴霧器へ管を挿入し、50%アセトン:50%水(v/v)中で低希釈物が作製される保存液としてこれらを供給した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))は、0.01%(v/v)の量で溶液に含まれていた。

10

【0336】

ライマメ植物(Sieva品種)を鉢に2株育て、第1本葉段階で処理に対して選択した。噴霧スプレーノズルを備えた自動電動植物噴霧器で試験溶液をこの葉に噴霧した。植物を噴霧器ヒュームフード内で乾燥させ、次いで噴霧器から取り出した。各鉢を、封鎖ジップを有する孔開きのプラスチックバッグの中に入れた。約10~11匹のヨトウムシ幼虫をバッグに入れ、バッグのジップを閉じた。試験植物は、蛍光照明(光周期24時間)への直接的曝露を回避することで、バッグ内部に熱がこもるのを防ぎながら、生育部屋内で、約25℃および相対湿度約20~40%で4日間維持した。処理の4日後、致死率および給餌の減少を未処理の対照植物と比較して査定した。

20

【0337】

この試験では、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、500ppmで、未処理の対照と比較して100%の致死率を示した。

30

【0338】

B.3マメアブラムシ(*aphis craccivora*)

活性化合物を蒸留水:アセトンの1:1(vol:vol)混合物中に所望の濃度で溶解した。界面活性剤(Alkamuls(登録商標)EL620)を0.1%(vol/vol)の割合で加える。試験溶液は、使用当日に調製した。

【0339】

鉢植えのササゲ植物は、適用の24時間前に、アブラムシに侵襲された植物から切り取った葉組織を手作業で移すことによって、様々な段階のおよそ50~100匹のアブラムシのコロニーが形成された。有害生物の個体数を記録した後で植物に噴霧した。処理した植物を照明カート上で約28℃で維持した。72時間後パーセント致死率を査定した。

40

【0340】

この試験では、化合物1-4、1-6、1-7、1-8、1-10、1-13、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-33、1-34、1-35、1-36、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-48、1-49、1-50、1-51、1-53、1-57、1-59、1-61、1-62、1-63、1-65、1-67、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、それぞれ500ppmで、未処理の対照と比較して、75%超の致死率を示した。

【0341】

B.4チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)

昆虫食餌および50~80個のチチュウカイミバエのタマゴを含有するマイクロタイタープレートで、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)の防除を評価するための試験ユニッ

50

トを構成した。化合物は、75%v/vの水および25%v/vのDMSOを含有する溶液を使用して製剤化した。特注で構築したマイクロアトマイザーを使用して、異なる濃度の製剤化した化合物を、2回反復して昆虫食餌上に5 μ l噴霧した。適用後、マイクロタイタープレートを約28 $\pm$ 1 $^{\circ}$ Cおよび約80 $\pm$ 5%相対湿度で5日間インキュベートした。次いでタマゴおよび幼虫の致死率を目視により査定した。

【0342】

この試験では、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、それぞれ2500ppmで、未処理の対照と比較して、75%超の致死率を示した。

10

【0343】

B.5ランアザミウマ(ジクロモトリプス・コルベッチ(*dichromothrips corbetti*))

バイオアッセイに使用した成体のジクロモトリプス・コルベッチは、実験室条件下で持続的に維持したコロニーから得た。試験することを目的として、アセトン:水の1:1混合物(vol:vol)プラス0.01%vol/volのAlkamuls(登録商標)EL620界面活性剤中で、試験化合物を希釈した。

【0344】

花浸漬技術の使用により、各化合物のアザミウマの効力を評価した。プラスチックベトリディッシュを試験領域として使用した。個々の、無処理のランの花のすべての花卉を処理溶液に浸漬し、乾燥させておいた。約20匹のアザミウマ成虫と共に処理した花を個々のベトリディッシュに置いた。次いでベトリディッシュを蓋で覆った。アッセイ期間中すべての試験領域は、連続照明下、約28 $^{\circ}$ Cの温度で保持した。3日後、各花の上および各ベトリディッシュの内壁に沿って生存するアザミウマの数をカウントした。処理後72時間経ってパーセント致死率を記録した。

20

【0345】

この試験では、化合物1-2、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-12、1-15、1-16、1-19、1-20、1-21、1-25、1-26、1-27、1-28、1-32、1-33、1-34、1-35、1-37、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-47、1-49、1-53、1-54、1-56、1-59、1-61、1-62、1-63、1-66、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、それぞれ500ppmで、未処理の対照と比較して、75%超の致死率を示した。

30

【0346】

B.6ソラマメアブラムシ(メゴウラ・ビシエ(*Megoura viciae*))

接触または浸透性手段を介してソラマメアブラムシ(メゴウラ・ビシエ)の防除を評価するため、ソラマメ葉のディスクを含有する、24ウェルマイクロタイタープレートから試験ユニットを構成した。

【0347】

75%v/vの水および25%v/vのDMSOを含有する溶液を使用して化合物を製剤化した。特注で構築したマイクロアトマイザーを使用して、異なる濃度の製剤化した化合物を、2回反復して、葉のディスク上に2.5 μ l噴霧した。適用後、葉のディスクを風乾し、マイクロタイターのプレートウェル内部の葉のディスク上に5~8匹のアブラムシ成虫を置いた。次いでアブラムシに処理した葉ディスクを吸汁させ、約23 $\pm$ 1 $^{\circ}$ Cおよび約50 $\pm$ 5%相対湿度で5日間インキュベートした。次いでアブラムシの致死率および繁殖力を目視により査定した。

40

【0348】

この試験では、化合物1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、1-53、1-54、1-55、

50

1-56、1-59、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-69、1-70および1-71は、それぞれ2500ppmで、未処理の対照と比較して、75%超の致死率を示した。

【0349】

B.7ニセアメリカタバコガ(ヘリオチス・ビレセンス(*Heliothis virescens*))I

ニセアメリカタバコガ(ヘリオチス・ビレセンス)の防除を評価するため、昆虫食餌および15~25個のニセアメリカタバコガタマゴを含有する96ウェルマイクロタイタープレートから試験ユニットを構成した。

【0350】

75%v/vの水および25%v/vのDMSOを含有する溶液を使用して化合物を製剤化した。特注で構築したマイクロアトマイザーを使用して、異なる濃度の製剤化した化合物を、2回反復して、昆虫食餌上に10μl噴霧した。適用後、約28±1℃および約80±5%相対湿度で5日間マイクロタイターのプレートをインキュベートした。次いでタマゴおよび幼虫の致死率を目視により査定した。

10

【0351】

この試験では、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、それぞれ2500ppmで、未処理の対照と比較して、75%超の致死率を示した。

20

【0352】

B.8ワタミハナゾウムシ(*Anthonomus grandis*)

ワタミハナゾウムシ(*Anthonomus grandis*)の防除を評価するため、昆虫食餌および20~30匹のワタミハナゾウムシのタマゴを含有する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。75%v/vの水および25%v/vのDMSOを含有する溶液を使用して、化合物を製剤化した。特注で構築したマイクロアトマイザーを使用して、異なる濃度の製剤化した化合物を、2回反復して、昆虫食餌上に20μl噴霧した。適用後、約23±1℃および約50±5%相対湿度で5日間マイクロタイターのプレートをインキュベートした。次いでタマゴおよび幼虫の致死率を目視により査定した。

30

【0353】

この試験では、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-50、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、それぞれ2500ppmで、未処理の対照と比較して、75%超の致死率を示した。

【0354】

B.9モモアカアブラムシ(ミズス・ペルシカエ(*Myzus persicae*))

40

活性化合物は、管で供給される10,000ppm溶液としてシクロヘキサノン中で製剤化した。噴霧ノズルを備えた自動電動式噴霧器に管を挿入し、50%アセトン:50%水(v/v)中で低希釈物が作製される保存液としてこれらを供給した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))は、溶液中に0.01%(v/v)の量で含まれていた。

【0355】

第1本葉段階のピーマン植物は、主要コロニーから得た、ひどく侵襲された葉を処理植物の上に配置することによって、処理前に侵襲させた。アブラムシを一晩かけて移し、1株当たり30~50匹のアブラムシの侵襲を遂行し、宿主葉を取り除いた。次いで侵襲された植物に、噴霧スプレーノズルを備えた自動電動植物噴霧器で噴霧した。植物を噴霧ヒュームフード内で乾燥させ、取り出し、次いで生育部屋内で、24hrの光周期の蛍光照明下、約

50

25℃および相対湿度約20～40%で維持した。5日後、処理した植物上のアブラムシ致死率を、未処理の対照植物上の致死率と比べて判定した。

【0356】

この試験では、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-50、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72および1-73は、それぞれ2500ppmで、未処理の対照と比較して、75%超の致死率を示した。

10

【0357】

B.10比較例

特定のピラゾイルアミノ-N-アルコキシベンズアミドは、以前に殺虫剤として記載されている。しかし本発明による2-ピラゾイルアミノ-N-カルバモイルメトキシベンズアミド化合物を用いた同等の査定は、本発明の化合物Iの優れた殺虫活性を示した。

【0358】

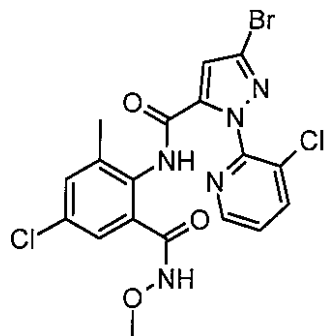
比較例として、公知の化合物X-1(5-プロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール3-カルボン酸(4-クロロ-2-メトキシカルバモイル-6-メチル-フェニル)-アミド)を使用した。化合物X-1は、CN101337959(実施例1を参照)において記載され、WO 200170671およびWO 2003016300により包含される。

20

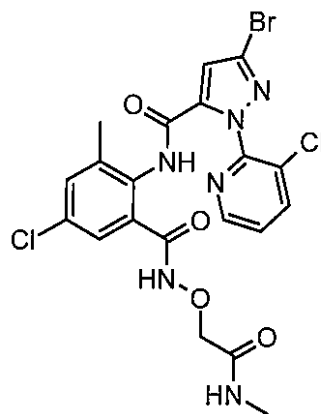
【0359】

アワヨトウ(*Spodoptera eridania*)およびコロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)に対する公知の化合物X-1の殺虫活性を、本発明による表C-1の化合物1-3と比較した。生物学的実施例B.2(アワヨトウ)において上記に記載されている試験手順および以下に記載されている試験手順(コロラドハムシ)に従い、上述の有害生物に対するこれらの化合物の活性をそれぞれ判定した。

【化19】



比較例X-1



表C.1の化合物1-3
(本発明による)

30

40

【0360】

これら試験の結果は、以下の表D(アワヨトウに対する活性)およびE(コロラドハムシに対する活性)で要約されている。

【表 3】

表 D

濃度 (ppm)	表 C.1 の化合物 1-3 の活性(%致死率)	比較例 X-1 の活性(%致死率)
30	100	100
10	100	100
1	100	0

10

【0361】

コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)(2齢の幼虫)

活性化合物は、管で供給される10,000ppm溶液として、シクロヘキサノン中に製剤化した。噴霧ノズルを備えた自動電動式噴霧器に管を挿入し、50%アセトン:50%水(v/v)中で低希釈物が作製される保存液として供給した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))は、溶液中に0.01%(v/v)の量で含まれていた。

【0362】

ナスを鉢に2株育て、第1本葉段階で処理に対して選択した。噴霧スプレーノズルを備えた自動電動植物噴霧器で試験溶液をこの葉に噴霧した。植物を噴霧器ヒュームフード内で乾燥させ、次いで噴霧器から取り出した。次いで処理した葉を切り取り、鉢から取り出し、湿らせた濾紙を並べたペトリディッシュの中に置いた。5匹の甲虫幼虫を各ペトリディッシュに導入し、ディッシュをペトリディッシュの蓋で覆った。蛍光照明(24時間光周期)への直接的曝露を回避することで、ディッシュ内部に熱がこもるのを防ぎながら、生育部屋内で、約25℃および相対湿度約20~40%で4日間ペトリディッシュを維持した。処理の4日後、未処理の対照植物と比較して、致死率および給餌の減少を査定した。

20

【表 4】

表 E

濃度 (ppm)	表 C.1 の化合物 1-3 の活性(%致死率)	比較例 X-1 の活性(%致死率)
30	100	100
10	100	100
1	100	0

30

40

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2012/066139

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D231/04 C07D401/04 A61K31/505 A01N43/52 C07D231/14
ADD.

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A61K A01N

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

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

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2005/054179 A2 (LEO PHARMA AS [DK]; FENSHOLDT JEF [DK]; THORHAUGE JACOB [DK]; NOERREMA) 16 June 2005 (2005-06-16) cited in the application page 3, line 9 - page 3, line 13; claims; examples -----	1-33
A	WO 2008/034785 A2 (BASF AG [DE]; LANGEWALD JUERGEN [DE]; STIERL REINHARD BASF SE [DE]; LA) 27 March 2008 (2008-03-27) page 1, line 5 - page 4, line 15; claims; examples -----	1-33
A	WO 03/015519 A1 (DU PONT [US]; LAHM GEORGE PHILIP [US]; SELBY THOMAS PAUL [US]; STEVENS) 27 February 2003 (2003-02-27) page 1, line 4 - page 1, line 6; claims; examples ----- -/-	1-33

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

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

19 October 2012

Date of mailing of the international search report

31/10/2012

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Schmid, Arnold

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2012/066139

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 133 155 A2 (CIBA GEIGY AG [CH]) 13 February 1985 (1985-02-13) cited in the application page 1, 1st paragraph; claims; examples -----	1-33

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2012/066139

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005054179 A2	16-06-2005	AR 046785 A1	21-12-2005
		AT 517081 T	15-08-2011
		AU 2004295022 A1	16-06-2005
		BR P10417158 A	06-03-2007
		CA 2549242 A1	16-06-2005
		CN 1906155 A	31-01-2007
		EP 1697312 A2	06-09-2006
		HK 1098127 A1	14-01-2011
		JP 2007513098 A	24-05-2007
		KR 20070026337 A	08-03-2007
		MX PA06006210 A	25-08-2006
		NZ 547231 A	26-02-2010
		RU 2357952 C2	10-06-2009
		US 2007244117 A1	18-10-2007
		WO 2005054179 A2	16-06-2005
		ZA 200603873 A	29-10-2008
WO 2008034785 A2	27-03-2008	AR 062887 A1	10-12-2008
		AR 062888 A1	10-12-2008
		AU 2007298999 A1	27-03-2008
		AU 2007299001 A1	27-03-2008
		CA 2661170 A1	27-03-2008
		CA 2661180 A1	27-03-2008
		CL 27142007 A1	30-05-2008
		CL 27152007 A1	30-05-2008
		EA 200900389 A1	30-10-2009
		EA 200900390 A1	30-10-2009
		EP 2091330 A2	26-08-2009
		EP 2091331 A2	26-08-2009
		EP 2489262 A2	22-08-2012
		EP 2489263 A2	22-08-2012
		EP 2489264 A2	22-08-2012
		EP 2489265 A2	22-08-2012
		EP 2489266 A2	22-08-2012
		EP 2489267 A2	22-08-2012
		EP 2489268 A2	22-08-2012
		JP 2010503641 A	04-02-2010
		JP 2010503642 A	04-02-2010
		KR 20090057126 A	03-06-2009
		KR 20090068338 A	26-06-2009
		TW 200820903 A	16-05-2008
		TW 200821295 A	16-05-2008
		US 2010022389 A1	28-01-2010
		US 2010041682 A1	18-02-2010
		WO 2008034785 A2	27-03-2008
		WO 2008034787 A2	27-03-2008
WO 03015519 A1	27-02-2003	AR 036872 A1	13-10-2004
		AT 469549 T	15-06-2010
		BR 0212023 A	03-08-2004
		CA 2454485 A1	27-02-2003
		CN 1678192 A	05-10-2005
		CO 5550395 A2	31-08-2005
		DK 1416797 T3	20-09-2010
		EG 23419 A	04-07-2005
		EP 1416797 A1	12-05-2004
		ES 2343568 T3	04-08-2010
		JP 3729825 B2	21-12-2005

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2012/066139

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date	
		JP 4334445 B2	30-09-2009	
		JP 2004538328 A	24-12-2004	
		JP 2005041880 A	17-02-2005	
		KR 20040030071 A	08-04-2004	
		MX 253292 B	11-01-2008	
		NZ 530443 A	29-07-2005	
		PL 208090 B1	31-03-2011	
		PL 208897 B1	30-06-2011	
		PT 1416797 E	14-07-2010	
		TW I225774 B	01-01-2005	
		US 2004198984 A1	07-10-2004	
		US 2007225336 A1	27-09-2007	
		US 2011124857 A1	26-05-2011	
		US 2011124871 A1	26-05-2011	
		US 2012171183 A1	05-07-2012	
		WO 03015519 A1	27-02-2003	

EP 0133155	A2	13-02-1985	EP 0133155 A2	13-02-1985
			JP 60023349 A	05-02-1985
			ZA 8404859 A	27-02-1985

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード (参考)
A 6 1 P 31/04	(2006.01)	A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 33/00	(2006.01)	A 6 1 P 33/00	

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

(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 100180932

弁理士 和田 洋子

(72)発明者 カイザー, フローリアン

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, シュペルツェンシュトラーセ 9

(72)発明者 デシュムク, プラサント

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 3 マンハイム, メアーフェルトシュトラーセ 6 2

(72)発明者 ケルバー, カルステン

ドイツ連邦共和国 6 9 2 1 4 エッペルハイム, ヒンテレ リスゲヴァン 2 6

(72)発明者 フォン ダイニング, ヴォルフガンク

ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 5 ノイシュタット, アン デア ブライヒェ 2 4

(72)発明者 ディックハウト, ヨアヒム

ドイツ連邦共和国 6 9 1 2 1 ハイデルベルク, クライン レービングスガッセ 4/3

(72)発明者 ナリーニ, アラン

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 1 マンハイム, 1 2-1 3, キュー 3

(72)発明者 バンドゥール, ニナ ゲルトルド

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, シュペルツェンシュトラーセ 1 6

(72)発明者 カルバートソン, デボラ エル.

アメリカ合衆国 2 7 5 2 6 ノースカロライナ州, フクエイ バリナ, ビンテージ リッジ レーン 6 4 0 0

(72)発明者 アンスポー, ダグラス ディー.

アメリカ合衆国 2 7 5 0 2 ノースカロライナ州, アペックス, ワインコット ドライブ 4 0 0 7

Fターム(参考) 4C063 AA01 BB02 CC22 DD12 EE01 EE03

4C086 AA01 AA02 AA03 BC36 GA07 GA08 MA01 MA04 NA14 ZB35

ZB37 ZC61

4H011 AC01 BB09 BB10