

(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2019-527221

(P2019-527221A)

(43) 公表日 令和1年9月26日(2019.9.26)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 519/00 (2006.01)	C O 7 D 519/00 3 O 1	4 C O 7 2
A61K 31/437 (2006.01)	C O 7 D 519/00 C S P	4 C O 8 4
A61K 45/00 (2006.01)	A 6 1 K 31/437	4 C O 8 6
A61P 43/00 (2006.01)	A 6 1 K 45/00	4 H O 1 1
A61P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 43/00 1 2 1	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 131 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2019-502171 (P2019-502171)
 (86) (22) 出願日 平成29年7月14日 (2017.7.14)
 (85) 翻訳文提出日 平成31年3月4日 (2019.3.4)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2017/067838
 (87) 国際公開番号 W02018/015289
 (87) 国際公開日 平成30年1月25日 (2018.1.25)
 (31) 優先権主張番号 16180168.3
 (32) 優先日 平成28年7月19日 (2016.7.19)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁 (EP)

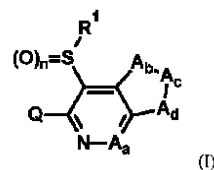
(71) 出願人 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ
 ンゲゼルシャフト
 ドイツ国、40789・モンハイム・アム
 ・ライン、アルフレート・ノベル・シュト
 ラーセ・50
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
 (74) 代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝

最終頁に続く

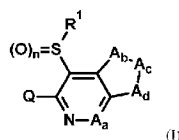
(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての縮合二環式ヘテロ環誘導体

(57) 【要約】

本発明は、式(I)〔式中、A_a、A_b、A_c、A_d、R¹、Q及びnは、本明細書中において示されている意味を有する〕で表される新規化合物、害虫を防除するための殺ダニ剤及び/又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを製造するための方法及び中間体生成物に関する。



【化1】

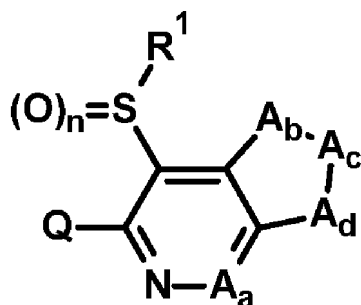


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

〔式中、

A_a は、窒素又は = C (R⁷) - を表し ;A_b は、= N -、- S (O)_m -、- O -、- N (R¹⁵) -、= C (R²) -、- C (= O) - 又は - C (R⁹) (R¹⁰) - を表し ;A_c は、= N -、- S (O)_m -、- O -、= C (R³) -、- C (= O) - 又は - C (R¹¹) (R¹²) - を表し ;

20

A_d は、= N -、- S (O)_m -、- O -、- N (R¹⁵) -、= C (R⁸) -、- C (= O) - 又は - C (R¹³) (R¹⁴) - を表し ;ここで、置換基 A_b、A_c 及び A_d のうちの 1 つのみが、酸素、- S (O)_m - 又は - C (= O) - を表すことができ ;

R¹ は、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、(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、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニル、(C₂ - C₆) - シアノアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₂ - C₆) - シアノアルキニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、アミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノ、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル - (C₁ - C₆) - ア

30

40

50

ルキル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル
を表し；又は、

(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₂ - C₆) - アルケニル
、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル [ここで、これらは、
それぞれ、同一であるか又は異なっているアリール、ヘタリール又はヘテロシクリル置換
基で1置換又は多置換されていてもよく、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシク
リルは、それぞれ、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ
シ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキル
、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハ
ロアルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁
- C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆
)
- アルキルスルフィミノ、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィミノ - (C₁ - C₆) -
アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィミノ - (C₂ - C₆) - アルキルカルボニ
ル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシ
イミノ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ - (C
2 - C₆) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C
6)
- アルキルカルボニル、(C₃ - C₆) - トリアルキルシリル又はベンジル置換基で
1置換又は多置換されていてもよい]を表し；又は、

R¹ は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、同
一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキ
シ、カルバモイル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C
1 - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルコ
キシ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁
- C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィミノ、(C₁ - C₆
)
- アルキルスルフィミノ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスル
フィミノ - (C₂ - C₆) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシ
イミノ、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C
1 - C₆) - アルキルスルホキシイミノ - (C₂ - C₆) - アルキルカルボニル、(C₁
- C₆) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル、(C₃ - C₆
)
- トリアルキルシリル、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は (=O)₂ (ヘテ
ロシクリルの場合のみ) 置換基で1置換又は多置換されていてもよい]を表し；

R²、R³、R⁸ は、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、
ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ - (C₁ - C₆) - アルキルシリル、(C₃ - C₈)
- シクロアルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル
、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈)
- シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁
- C₆) - シアノアルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニ
ル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C
6)
- アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C
6)
- アルケニル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニル、(C₂ - C₆) - シアノアルケニ
ル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₂ - C₆) -
シアノアルキニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C
1 - C₆) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C
6)
- アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁
- C₆) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C
6)
- アルキル - (C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル -
(C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) -
ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C
1 - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(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) - アルコキシ -

10

20

30

40

50

($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルチオカルボニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニルオキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、($C_2 - C_6$) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - ($C_2 - C_6$) - アルケニルアミノカルボニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノ、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキルアミノ又はNHCO - ($C_1 - C_6$) - アルキル ($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニルアミノ)を表し；

R^7 は、水素、シアノ、ハロゲン、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、ハロ - ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - シアノアルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) - アルキニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルキニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル又は($C_1 - C_6$) - ハロアルキルスルホニルを表し；

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} は、互いに独立して、水素、ハロゲン、($C_1 - C_6$) - アルキル又は($C_1 - C_6$) - ハロアルキルを表し；

R^{15} は、水素、アセチル、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ヒドロキシアルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - シアノアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_4$) - アルケニル、($C_2 - C_4$) - アルケニルオキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_4$) - ハロアルケニルオキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_4$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_4$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_4$) - アルキニル、($C_2 - C_4$) - アルキニルオキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_4$) - ハロアルキニルオキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_4$) - ハロアルキニル、($C_2 - C_4$) - シアノアルキニル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルキル - ($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、ハロ - ($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルキルチオ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキルチオ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキルスルフィニル - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - アルキルスルホニル - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - アルキルカルボニル - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキルカルボニル - ($C_1 - C_4$) - アルキルを表し；又は、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_4$) - アルケニル、($C_2 - C_4$) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているアリアル又はヘテロシクリル置換基で1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリアル又はヘテロシクリルは、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_3 - C_4$) - シクロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルキル

10

20

30

40

50

チオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル又は(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し;又は、

R¹⁵は、アリール又はヘテロシクリル[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホキシイミノ、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ)又は(=O)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ)置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し;

Qは、部分的飽和若しくは飽和のヘテロ環式又はヘテロ芳香族の8員、9員、10員、11員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系[ここで、これらは、少なくとも1のカルボニル基を含むことができ、及び/又は、ここで、該環系は、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、及び、その際、該置換基は、互いに独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ-(C₁ - C₆) - アルキルシリル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - 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) - シアノアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₂ - C₆) - シアノアルキニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル - (C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(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) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミ

10

20

30

40

50

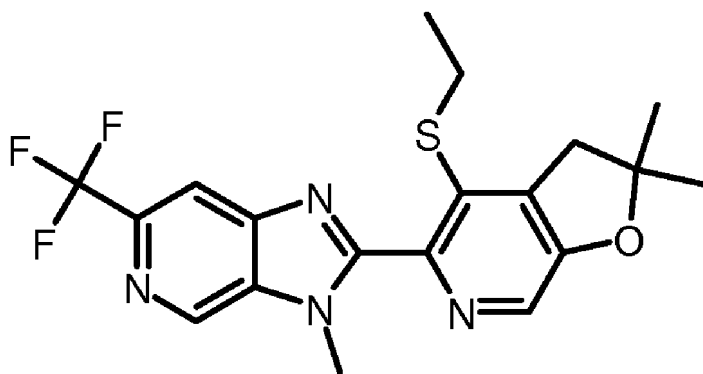
ノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、NHCO - (C₁ - C₆) - アルキル ((C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノ) から選択されることができ、又は、該置換基は、独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環 (ここで、フェニル又は該環は、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシで1置換されているもよいか又は同じように若しくは異なるように多置換されているもよい) から選択されることができ]を表し；

mは、0、1又は2であり；

nは、0、1又は2を表す]

で表される化合物、但し、

【化2】



は、除く。

【請求項2】

A_aが、= C (R⁷) - を表し；

A_bが、= N - 、 - S (O)_m - 、 - O - 、 - N (R¹⁵) - 、 = C (R²) - 、 - C (=O) - 又は - C (R⁹) (R¹⁰) - を表し；

A_cが、= C (R³) - 、 - C (=O) - 又は - C (R¹¹) (R¹²) - を表し；

A_dが、= N - 、 - S (O)_m - 、 - O - 、 - N (R¹⁵) - 、 = C (R⁸) - 、 - C (=O) - 又は - C (R¹³) (R¹⁴) - を表し；

ここで、置換基 A_b、A_c及びA_dのうちの1つのみが、酸素、- S (O)_m - 又は - C (=O) - を表すことができ；

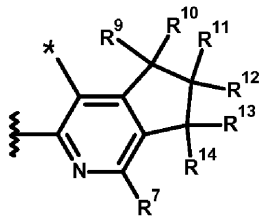
その結果、下記構造単位 A 1 ~ A 1 4 :

10

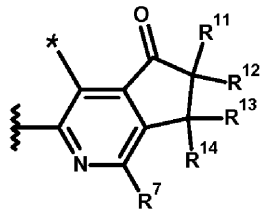
20

30

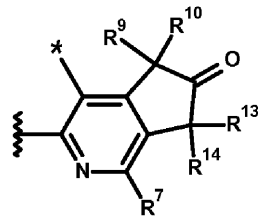
【化 3】



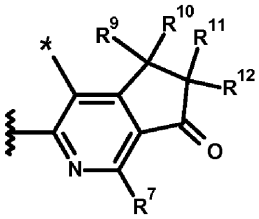
A1



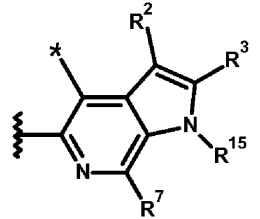
A2



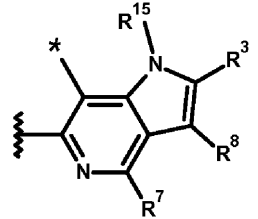
A3



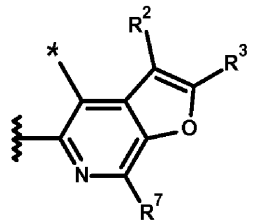
A4



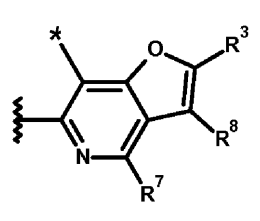
A5



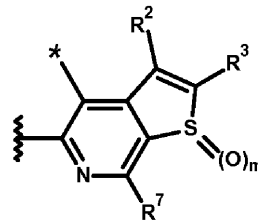
A6



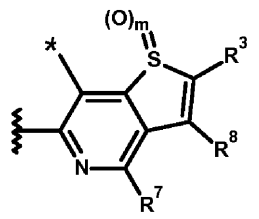
A7



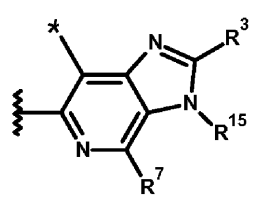
A8



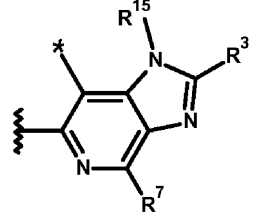
A9



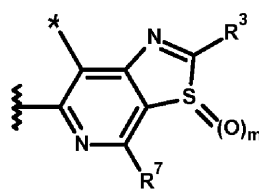
A10



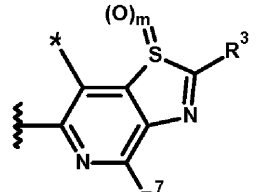
A11



A12



A13



A14

[ここで、置換基 Q への結合は波線によって識別されており、及び、硫黄原子への結合は星印 * によって識別されている]

をもたらす；

R¹ が、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ヒドロキシアルキル、(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

10

20

30

40

50

クロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；又は、

(C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているアリール又はヘテロシクリル置換基で1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール又はヘテロシクリルは、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっているハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ又は(C₁ - C₄) - アルキルチオ置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し；又は、

10

R¹ が、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ)又は(=O)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ)置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し；

R²、R³、R⁸ が、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - 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、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル又はNHCO - (C₁ - C₄) - アルキル ((C₁ - C₄) - アルキルカルボニルアミノ)を表し；

20

30

R⁷ が、水素、シアノ、ハロゲン、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル、(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、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル又は(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルホニルを表し；

40

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ が、互いに独立して、水素、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル又は(C₁ - C₄) - ハロアルキルを表し；

R¹⁵ が、水素、アセチル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；又は、

(C₁ - C₄) - アルキル [ここで、これは、いずれの場合にも、同一であるか又は異な

50

っているアリール又はヘテロシクリル置換基で1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール又はヘテロシクリルは、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっているハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル又は(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し；

Qが、ヘテロ芳香族の8員、9員、10員、11員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系[ここで、該環系は、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、及び、その際、該置換基は、互いに独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ - (C₁ - C₆) - アルキルシリル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、(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) - シアノアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(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) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、NHCO - (C₁ - C₆) - アルキル(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノ)から選択されることができ、又は、該置換基は、独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環(ここで、フェニル又は該環は、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシで1置換されていてもよいか又は同じように若しくは異なるように多置換されていてもよい)から選択されることができ]を表し；

10

20

30

40

50

m が、0、1 又は 2 を表し；

n が、0、1 又は 2 を表す；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 3】

A_a が、= C (R⁷) - 表し；

A_b が、= N -、- S (O)_m -、- N (R^{1 5}) -、= C (R²) -、- C (= O) -
- 又は - C (R⁹) (R^{1 0}) - を表し；

A_c が、= C (R³) - 又は - C (R^{1 1}) (R^{1 2}) - を表し；

A_d が、= N -、- S (O)_m -、- N (R^{1 5}) -、= C (R⁸) - 又は - C (R^{1 3}) (R^{1 4}) - を表し；

ここで、置換基 A_b 及び A_d のうちの 1 つのみが、酸素、- S (O)_m - 又は - C (= O) - を表すことができ；

その結果、以下の構造単位をもたらす：A 1、A 2、A 5、A 6、A 9、A 10、A 11、A 12、A 13、A 14；

R¹ が、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ヒドロキシアルキル、(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、(C₁ - C₄) - アルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) - アルキル又は (C₁ - C₄) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；

R²、R³、R⁸ が、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルホニル、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル又は NHCO - (C₁ - C₄) - アルキル (C₁ - C₄) - アルキルカルボニルアミノ) を表し；

R⁷ が、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) - アルキル又は (C₁ - C₄) - ハロアルキルを表し；

R⁹、R^{1 0}、R^{1 1}、R^{1 2}、R^{1 3}、R^{1 4} が、互いに独立して、水素、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル又は (C₁ - C₄) - ハロアルキルを表し；

R^{1 5} が、水素、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル又は (C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；

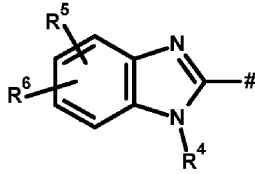
Q が、Q 1 ~ Q 20

10

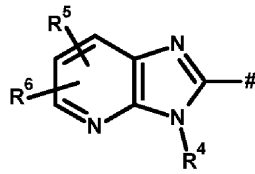
20

30

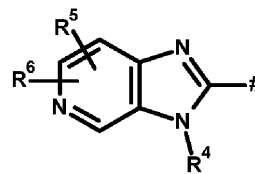
【化 4】



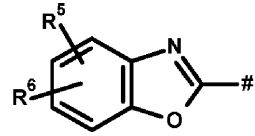
Q1



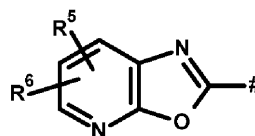
Q2



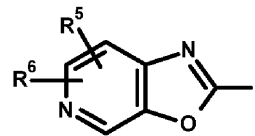
Q3



Q4

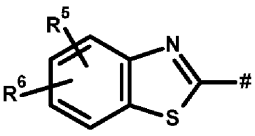


Q5

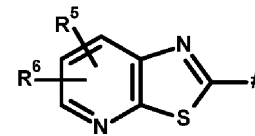


Q6

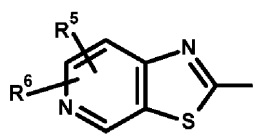
10



Q7

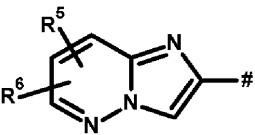


Q8

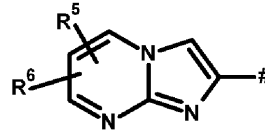


Q9

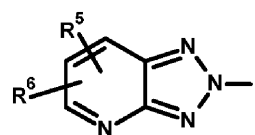
20



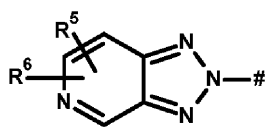
Q10



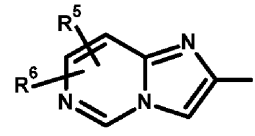
Q11



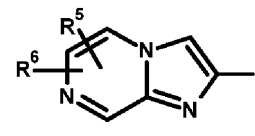
Q12



Q13

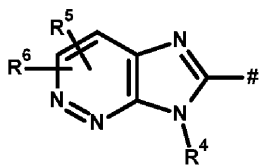


Q14

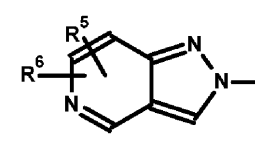


Q15

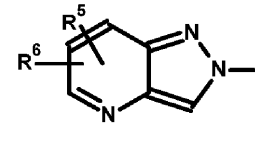
30



Q16

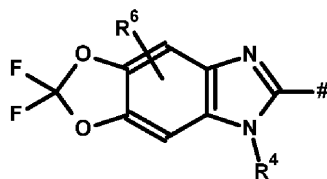


Q17

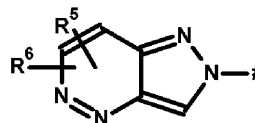


Q18

40



Q19



Q20

からなる群から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系を表し；

R⁴が、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)

50

- シアノアルキル、(C₁ - C₄) - ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ
 - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) - アル
 キル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₄)
) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ -
 C₄) - ハロアルケニル、(C₂ - C₄) - シアノアルケニル、(C₂ - C₄) -
 アルキニル、(C₂ - C₄) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ -
 C₄) - ハロアルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロア
 ルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆)
 - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル
 チオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C
 4) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) - アルキル又は
 (C₁ - C₄) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；

R⁵、R⁶が、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(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) - シクロアルキル - (C₃ - C₆) - シクロア
 ルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄)
 - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルコキシイミノ、
 (C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) -
 アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) -
 アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アル
 キルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) - ハロア
 ルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、ジ
 - (C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニルア
 ミノ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノ、アミノ
 スルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル又はジ - (C₁ - C₄) - アル
 キルアミノスルホニルを表し；

mが、0、1又は2を表し；

nが、0、1又は2を表す；

請求項1に記載の式(I)で表される化合物。

【請求項4】

A_aが、= C(R⁷) - 表し；

A_bが、= N - 、 - S(O)_m - 、 - N(R¹⁵) - 、 = C(R²) - 、 - C(=O)
 - 又は - C(R⁹)(R¹⁰) - を表し；

A_cが、= C(R³) - 又は - C(R¹¹)(R¹²) - を表し；

A_dが、= N - 、 - S(O)_m - 、 - N(R¹⁵) - 、 = C(R⁸) - 又は - C(R¹³
 3)(R¹⁴) - を表し；

ここで、置換基A_b及びA_dのうちの1つのみが、酸素、- S(O)_m - 又は - C(=O)
) - を表すことができ；

その結果、以下の構造単位をもたらす：A₁、A₂、A₅、A₆、A₉、A₁₀、A₁₁
 、A₁₂、A₁₃、A₁₄；

R¹が、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル又はシクロプロピルを表し；

R²、R³、R⁸が、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、
 メチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又はトリフルオ
 ロメチルチオを表し；

R⁷が、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル又はトリフルオロメチル
 を表し；

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴が、互いに独立して、水素、フッ素、
 塩素、臭素、メチル、エチル又はトリフルオロメチルを表し；

R¹⁵が、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、sec - プロピル又

10

20

30

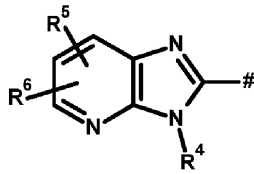
40

50

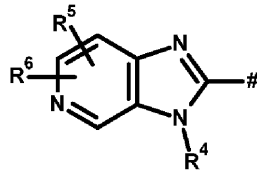
は tert - ブチルを表し；

Q が、Q 2、Q 3、Q 10、Q 14 及び Q 16

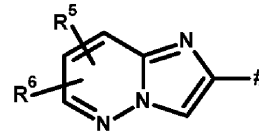
【化 5】



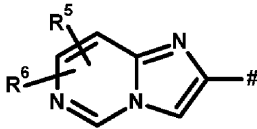
Q2



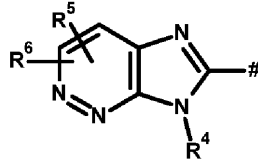
Q3



Q10



Q14



Q16

10

からなる群から選択されるヘテロ芳香族の 9 員縮合二環式環系を表し；

20

R⁴ が、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルを表し；

R⁵ が、フッ素、塩素、臭素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル (CH₂CFH₂、CHFCH₃)、ジフルオロエチル (CF₂CH₃、CH₂CHF₂、CHFCHF₂)、トリフルオロエチル (CH₂CF₃、CHFCHF₂、CF₂CFH₂)、テトラフルオロエチル (CHFCHF₃、CF₂CHF₂)、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルを表し；

R⁶ が、水素を表し；

m が、0 を表し；

n が、0、1 又は 2 を表す；

30

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 5】

A_a が、= C (R⁷) - を表し；

A_b が、- S (O)_m - 又は = C (R²) - を表し；

A_c が、= C (R³) - を表し；

A_d が、= N -、- S (O)_m - 又は = C (R⁸) - を表し；

その結果、以下の構造単位をもたらす：A 9、A 10、A 14；

R¹ が、エチルを表し；

R² が、水素を表し；

R³ が、水素を表し；

R⁷ が、水素を表し；

R⁸ が、水素を表し；

40

Q が、Q 2 及び Q 3 からなる群から選択されるヘテロ芳香族の 9 員縮合二環式環系を表し；

R⁴ が、メチルを表し；

R⁵ が、トリフルオロメチルを表し；

R⁶ が、水素を表し；

m が、0 を表し；

n が、0、1 又は 2 を表す；

50

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 6】

Q が、Q 2 及び Q 3 からなる群から選択されるヘテロ芳香族の 9 員縮合二環式環系を表し；及び、

A_a、A_b、A_c、A_d、R¹、R⁴、R⁵、R⁶ 及び n が、請求項 3、4 又は 5 において与えられている意味を有する；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 7】

A_a が、= C (R⁷) - を表し；

A_b が、- S (O)_m - 又は = C (R²) - を表し；

A_c が、= C (R³) - を表し；

A_d が、= N -、- S (O)_m - 又は = C (R⁸) - を表し；

その結果、以下の構造単位をもたらす：A 9、A 10、A 14；及び、

Q、R¹、R²、R³、R⁷、R⁸、m 及び n が、請求項 1、2、3、4 又は 5 において与えられている意味を有する；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 8】

A_a が、= C (R⁷) - を表し；

A_b が、- S (O)_m - 又は = C (R²) - を表し；

A_c が、= C (R³) - を表し；

A_d が、= N -、- S (O)_m - 又は = C (R⁸) - を表し；

その結果、以下の構造単位をもたらす：A 9、A 10、A 14；及び、

Q が、Q 2 又は Q 3 を表し；及び、

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、m 及び n が、請求項 3、4 又は 5 において与えられている意味を有する；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 9】

農薬製剤であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物を含み、並びに、増量剤及び / 又は界面活性剤も含んでいる、前記農薬製剤。

【請求項 10】

さらなる農薬活性化合物を付加的に含んでいる、請求項 9 に記載の農薬製剤。

【請求項 11】

害虫を防除する方法であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 9 若しくは 10 に記載の農薬製剤を該害虫及び / 又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする、前記方法。

【請求項 12】

害虫を防除するための、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 9 若しくは 10 に記載の農薬製剤の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式 (I) で表される新規縮合二環式ヘテロ環誘導体、害虫 (animal pest) を防除するための、特に、節足動物 (とりわけ、昆虫類及びクモ形類動物) を防除するための、殺ダニ剤及び / 又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを調製するための調製方法及び中間体に関する。

【背景技術】

【0002】

殺虫特性を有している縮合二環式ヘテロ環誘導体は、文献中に、例えば、WO 2010 / 125985、WO 2012 / 074135、WO 2012 / 086848、WO 2013 / 018928、WO 2013 / 191113、WO 2014 / 142

10

20

30

40

50

292、WO 2014/148451、WO 2015/000715、WO 2016/124563、WO 2016/124557、WO 2016/162318、PCT/EP2016/075365、PCT/EP2016/078989、PCT/EP2017/050773、EP 16163912.5、EP 16168252.1、WO 2015/121136、WO 2015/002211、WO 2015/071180、WO 2016/020286、WO 2015/059039、WO 2015/190316、WO 2016/091731、WO 2016/107742、EP 16180168.3、EP 16180170.9、EP 16184163.0、EP 16189445.6、EP 16200177.0、EP 17153317.7、WO 2017/026384などに、既に記載されている。

10

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】WO 2010/125985

【特許文献2】WO 2012/074135

【特許文献3】WO 2012/086848

【特許文献4】WO 2013/018928

【特許文献5】WO 2013/191113

【特許文献6】WO 2014/142292

【特許文献7】WO 2014/148451

20

【特許文献8】WO 2015/000715

【特許文献9】WO 2016/124563

【特許文献10】WO 2016/124557

【特許文献11】WO 2016/162318

【特許文献12】PCT/EP2016/075365

【特許文献13】PCT/EP2016/078989

【特許文献14】PCT/EP2017/050773

【特許文献15】EP 16163912.5

【特許文献16】EP 16168252.1

【特許文献17】WO 2015/121136

30

【特許文献18】WO 2015/002211

【特許文献19】WO 2015/071180

【特許文献20】WO 2016/020286

【特許文献21】WO 2015/059039

【特許文献22】WO 2015/190316

【特許文献23】WO 2016/091731

【特許文献24】WO 2016/107742

【特許文献25】EP 16180168.3

【特許文献26】EP 16180170.9

【特許文献27】EP 16184163.0

40

【特許文献28】EP 16189445.6

【特許文献29】EP 16200177.0

【特許文献30】EP 17153317.7

【特許文献31】WO 2017/026384

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

しかしながら、上記で引用されている文献から既に知られている活性化合物の一部は、狭い適用範囲しか有さないという点において、又は、十分な殺虫活性若しくは殺ダニ活性を有していないという点において、使用において不利点を有している。

50

【課題を解決するための手段】

【0005】

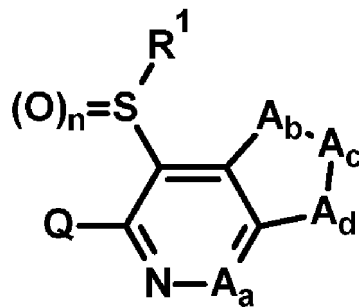
新規縮合二環式ヘテロ環誘導体が見いだされ、これらは、既に知られている化合物よりも有利点を有している。そのような有利点の例としては、より良好な生物学的特性又は環境に関する特性、より広い範囲の施用方法、向上した殺虫効果又は殺ダニ効果、及び、作物植物との良好な適合性などがある。該縮合二環式ヘテロ環誘導体は、効力（特に、防除が困難な昆虫類に対する効力）を向上させるために別の作用剤と組合せて使用することが可能である。

【0006】

従って、本発明は、式（I）

10

【化1】



(I)

20

【0007】

〔式中（構成1）〕、

A_a は、窒素又は = C (R⁷) - を表し；

A_b は、= N -、- S (O)_m -、- O -、- N (R¹⁵) -、= C (R²) -、- C (= O) - 又は - C (R⁹) (R¹⁰) - を表し；

A_c は、= N -、- S (O)_m -、- O -、= C (R³) -、- C (= O) - 又は - C (R¹¹) (R¹²) - を表し；

A_d は、= N -、- S (O)_m -、- O -、- N (R¹⁵) -、= C (R⁸) -、- C (= O) - 又は - C (R¹³) (R¹⁴) - を表し；

30

ここで、置換基 A_b、A_c 及び A_d のうちの1つのみが、酸素、- S (O)_m - 又は - C (= O) - を表すことができ；

R¹ は、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、(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、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニル、(C₂ - C₆) - シアノアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₂ - C₆) - シアノアルキニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、アミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノ、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C

40

50

$C_1 - C_6$) - アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキル - アミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) - アルキルを表し；又は、

($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_2 - C_6$) - アルキニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているアリール、ヘタリール又はヘテロシクリル置換基で1置換又は多置換されていてもよく、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) - トリアルキルシリル又はベンジル置換基で1置換又は多置換されていてもよい]を表し；又は、

R^1 は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) - トリアルキルシリル、($=O$) (ヘテロシクリルの場合のみ)又は($=O$)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ)置換基で1置換又は多置換されていてもよい]を表し；

R^2 、 R^3 、 R^8 は、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ - ($C_1 - C_6$) - アルキルシリル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキル - ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル - ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、ハロ - ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - シアノアルキル、($C_1 - C_6$) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) - アルキニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルキニル、($C_2 - C_6$) - シアノアルキニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシ、(

10

20

30

40

50

C₁ - C₆) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル - (C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(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) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ又はNHCO - (C₁ - C₆) - アルキル (C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノ)を表し；

10

20

R⁷ は、水素、シアノ、ハロゲン、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルキル、(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、(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又は(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニルを表し；

30

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、(C₁ - C₆) - アルキル又は(C₁ - C₆) - ハロアルキルを表し；

R¹⁵ は、水素、アセチル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルケニル、(C₂ - C₄) - シアノアルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル、(C₂ - C₄) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルキニル、(C₂ - C₄) - シアノアルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル - (C₁ -

40

50

C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₄) - アルキル、
 (C₁ - C₄) - ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；又は、
 (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル
 [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているアリール又はヘテロシク
 リル置換基で1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール又はヘテロシクリル
 は、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄
) - アルキル、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁
 - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキル
 チオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル又は(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル
 置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し；又は、

R¹⁵は、アリール又はヘテロシクリル[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか
 又は異なっているハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₆) - シク
 ロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄
) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスル
 フィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホキシ
 イミノ、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ)
 又は(=O)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ)置換基で1置換又は2置換されていてもよ
 い]を表し；

Qは、部分的飽和若しくは飽和のヘテロ環式又はヘテロ芳香族の8員、9員、10員、
 11員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系[ここで、これらは、少なくとも1
 のカルボニル基を含むことができ、及び/又は、ここで、該環系は、同一であるか又は異
 なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、及び、その際、該置換基は、互
 いに独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ
 - (C₁ - C₆) - アルキルシリル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₃ - C₈
) - シクロアルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈
) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆
) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルキル、(C₁
 - C₆) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ
 、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - 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) - シアノアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル
 、(C₂ - C₆) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₆) - ハ
 ロアルキニル、(C₂ - C₆) - シアノアルキニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁
 - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₆) - アル
 キル、(C₂ - C₆) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆)
 - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルコキ
 シ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆
) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルキルヒドロキシ
 イミノ、(C₁ - C₆) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₁ - C₆
) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル - (C₁ - C₆) - アルコキシイ
 ミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆
) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆
) - アルキル、(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) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスル
 フィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁
 - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆
) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルス
 ルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆
) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₆)
 - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアル

10

20

30

40

50

キルカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、NHCO - (C₁ - C₆) - アルキル ((C₁ - C₆) - アルキルカルボニルアミノ) から選択されることができ、又は、該置換基は、互いに独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環 (ここで、フェニル又は該環は、同一であるか又は異なっているC₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ置換基で1置換又は多置換されていてよい) から選択されることができ]を表し；

10

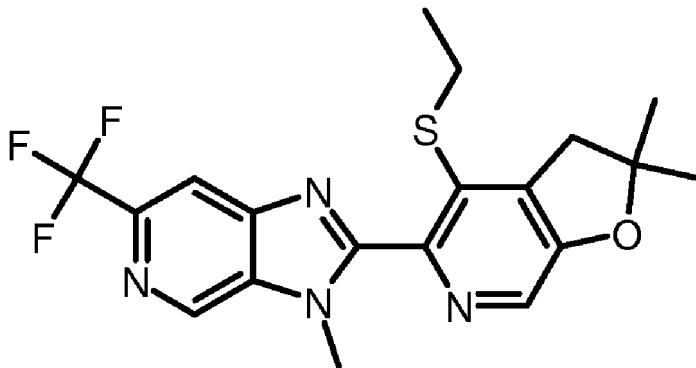
mは、0、1又は2を表し；

20

nは、0、1又は2を表す]

で表される新規化合物を提供するが、但し、

【化2】



30

【0008】

は、除く。

【0009】

さらに、式(I)で表される化合物が、殺有害生物剤として、好ましくは、殺虫剤及び/又は殺ダニ剤として、極めて優れた効力を有していること、及び、さらに、概して、植物との極めて良好な適合性、特に、作物植物に関して、植物との極めて良好な適合性を示すということが、見いだされた。

40

【発明を実施するための形態】

【0010】

本発明の化合物は、概して、式(I)によって定義される。上記及び下記に記載されている式の中で与えられているラジカルの好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。

【0011】

構成2

A_aは、好ましくは、=C(R⁷)-を表し；

50

A_b は、好ましくは、 $=N-$ 、 $-S(O)_m-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^{15})-$ 、 $=C(R^2)-$ 、 $-C(=O)-$ 又は $-C(R^9)(R^{10})-$ を表し；

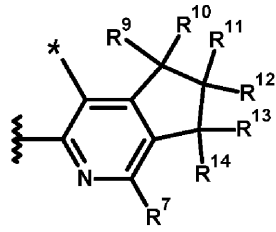
A_c は、好ましくは、 $=C(R^3)-$ 、 $-C(=O)-$ 又は $-C(R^{11})(R^{12})-$ を表し；

A_d は、好ましくは、 $=N-$ 、 $-S(O)_m-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^{15})-$ 、 $=C(R^8)-$ 、 $-C(=O)-$ 又は $-C(R^{13})(R^{14})-$ を表し；

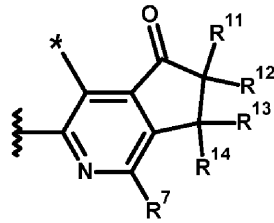
ここで、置換基 A_b 、 A_c 及び A_d のうちの1つのみが、酸素、 $-S(O)_m-$ 又は $-C(=O)-$ を表すことができ；

その結果、好ましくは、下記構造単位 $A_1 \sim A_{14}$ ：

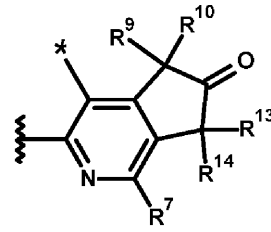
【化3】



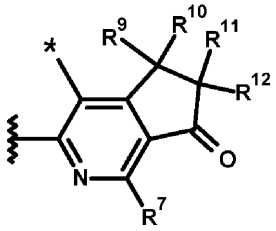
A1



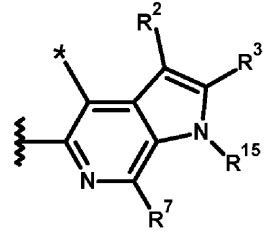
A2



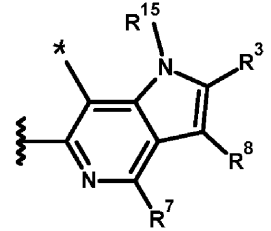
A3



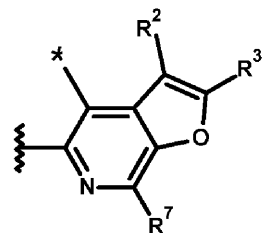
A4



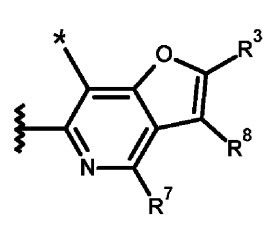
A5



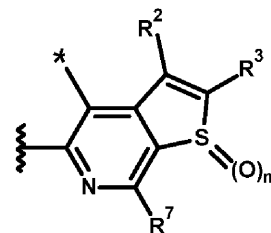
A6



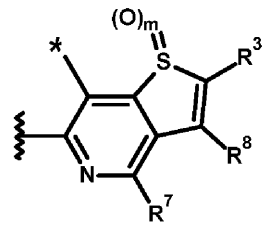
A7



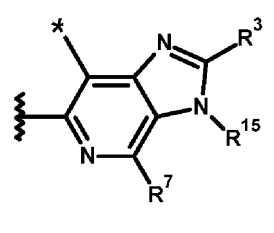
A8



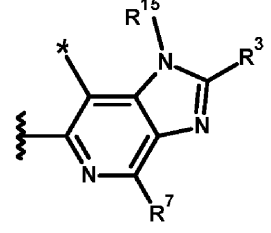
A9



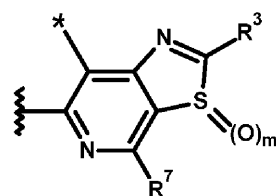
A10



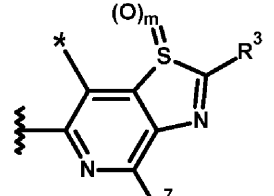
A11



A12



A13



A14

【0012】

[ここで、置換基Qへの結合は波線によって識別されており、及び、硫黄原子への結合は星印*によって識別されている]

をもたらす；

R¹は、好ましくは、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ヒドロキシアルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-ハ

10

20

30

40

50

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、(C₁ - C₄) - アルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；又は、

(C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているアリール又はヘテロシクリル置換基で1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール又はヘテロシクリルは、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっているハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ又は(C₁ - C₄) - アルキルチオ置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し；又は、

R¹ は、好ましくは、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっているハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は (=O)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) 置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し；

R²、R³、R⁸ は、互いに独立して、好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - 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、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル又はNHCO - (C₁ - C₄) - アルキル (C₁ - C₄) - アルキルカルボニルアミノ)を表し；

R⁷ は、好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル、(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、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル又は(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルホニルを表し；

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ は、互いに独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル又は(C₁ - C₄) - ハロアルキルを表し；

R¹⁵ は、好ましくは、水素、アセチル、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - シアノアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキルチオ - (

10

20

30

40

50

$C_1 - C_4$) - アルキルを表し；又は、

($C_1 - C_4$) - アルキル [ここで、これは、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっているアリール又はヘテロシクリル置換基で1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール又はヘテロシクリルは、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっているハロゲン、($C_1 - C_4$) - アルキル、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル又は($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシ置換基で1置換又は2置換されていてもよい]を表し；

Qは、好ましくは、ヘテロ芳香族の8員、9員、10員、11員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系 [ここで、該環系は、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、及び、その際、該置換基は、互いに独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ - ($C_1 - C_6$) - アルキルシリル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキル - ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル - ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、ハロ - ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - シアノアルキル、($C_1 - C_6$) - ヒドロキシアルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) - アルキニル、($C_2 - C_6$) - アルキニルオキシ - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - ハロアルキニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニルオキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - ハロアルケニルオキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - シアノアルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルキルヒドロキシイミノ、($C_1 - C_6$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) - アルキル - ($C_1 - C_6$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルチオカルボニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニルオキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノ、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキルアミノ、NHCO - ($C_1 - C_6$) - アルキル ($C_1 - C_6$) - アルキルカルボニルアミノ) から選択されることができ、又は、該置換基は、互いに独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環 (ここで、フェニル又は該環は、同一であるか又は異なっている $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、ハロ

10

20

30

40

50

ゲン、CN、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ置換基で1置換又は多置換されていてもよい)から選択されることができる]を表し;

mは、好ましくは、0、1又は2を表し;

nは、好ましくは、0、1又は2を表す。

【0013】

構成3

A_a は、特に好ましくは、 $= C(R^7)$ -を表し;

A_b は、特に好ましくは、 $= N-$ 、 $-S(O)_m-$ 、 $-N(R^{15})-$ 、 $= C(R^2)$ -、 $-C(=O)-$ 又は $-C(R^9)(R^{10})-$ を表し;

A_c は、特に好ましくは、 $= C(R^3)$ -又は $-C(R^{11})(R^{12})-$ を表し;

10

A_d は、特に好ましくは、 $= N-$ 、 $-S(O)_m-$ 、 $-N(R^{15})-$ 、 $= C(R^8)$ -又は $-C(R^{13})(R^{14})-$ を表し;

ここで、置換基 A_b 及び A_d のうちの一つのみが、酸素、 $-S(O)_m-$ 又は $-C(=O)-$ を表すことができ;

その結果、さらに好ましくは、以下の構造単位をもたらす： A_1 、 A_2 、 A_5 、 A_6 、 A_9 、 A_{10} 、 A_{11} 、 A_{12} 、 A_{13} 、 A_{14} ;

R^1 は、特に好ましくは、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_2 - C_4)$ -アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ -ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ -アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ -ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ -アルキル又は $(C_1 - C_4)$ -アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ -アルキルを表し;

20

R^2 、 R^3 、 R^8 は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル- $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、ハロ- $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルスルホニル、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルアミノスルホニル、ジ- $(C_1 - C_4)$ -アルキルアミノスルホニル又は $NHCO-$ $(C_1 - C_4)$ -アルキル($(C_1 - C_4)$ -アルキルカルボニルアミノ)を表し;

30

R^7 は、特に好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル又は $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルを表し;

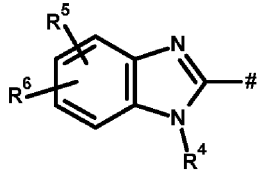
R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル又は $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルを表し;

R^{15} は、特に好ましくは、水素、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -シアノアルキル又は $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ -アルキルを表し;

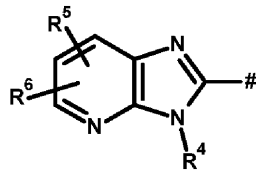
40

Qは、特に好ましくは、 $Q_1 \sim Q_{20}$

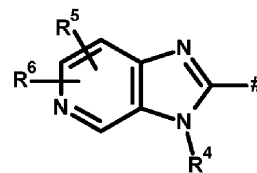
【化 4】



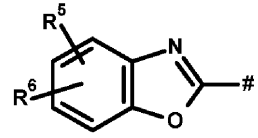
Q1



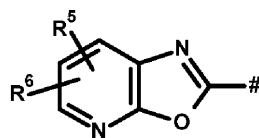
Q2



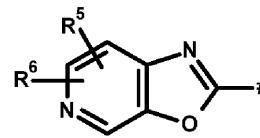
Q3



Q4

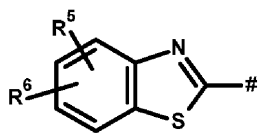


Q5

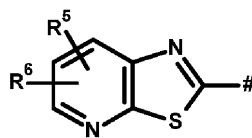


Q6

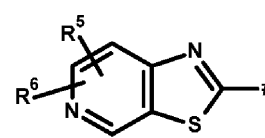
10



Q7

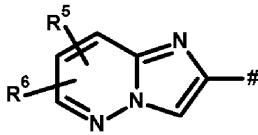


Q8

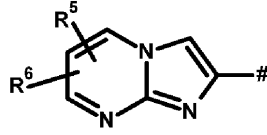


Q9

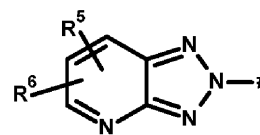
20



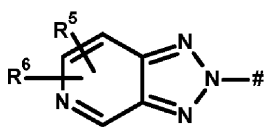
Q10



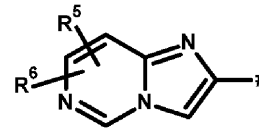
Q11



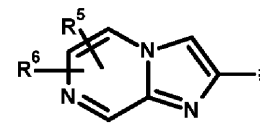
Q12



Q13

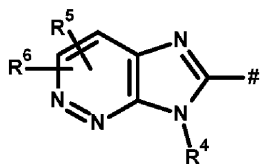


Q14

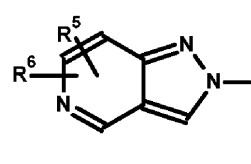


Q15

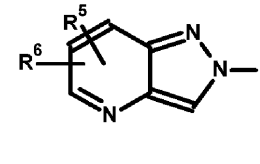
30



Q16

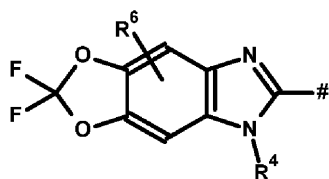


Q17

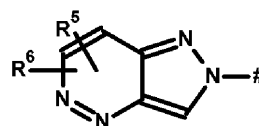


Q18

40



Q19



Q20

【0014】

からなる群から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系を表し；

R⁴は、特に好ましくは、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-シアノアルキル、(C₁-C₄)-ヒドロキシアルキル、(C₁-C

50

4) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルケニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル、(C₂ - C₄) - アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - ハロアルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキルチオ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) - アルキル又は (C₁ - C₄) - アルキルカルボニル - (C₁ - C₄) - アルキルを表し；

R⁵、R⁶ は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(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) - シクロアルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキル - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) - ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニル又はジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノスルホニルを表し；

m は、特に好ましくは、0、1 又は 2 を表し；

n は、特に好ましくは、0、1 又は 2 を表す。

【0015】

構成 4

A_a は、極めて特に好ましくは、= C (R⁷) - 表し；

A_b は、極めて特に好ましくは、= N -、- S (O)_m -、- N (R¹⁵) -、= C (R²) -、- C (=O) - 又は - C (R⁹) (R¹⁰) - を表し；

A_c は、極めて特に好ましくは、= C (R³) - 又は - C (R¹¹) (R¹²) - を表し；

A_d は、極めて特に好ましくは、= N -、- S (O)_m -、- N (R¹⁵) -、= C (R⁸) - 又は - C (R¹³) (R¹⁴) - を表し；

ここで、置換基 A_b 及び A_d のうちの 1 つのみが、酸素、- S (O)_m - 又は - C (=O) - を表すことができ；

その結果、一層さらに好ましくは、以下の構造単位をもたらす：A₁、A₂、A₅、A₆、A₉、A₁₀、A₁₁、A₁₂、A₁₃、A₁₄；

R¹ は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル又はシクロプロピルを表し；

R²、R³、R⁸ は、互いに独立して、極めて特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、メチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又はトリフルオロメチルチオを表し；

R⁷ は、極めて特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル又はトリフルオロメチルを表し；

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ は、互いに独立して、極めて特に好ま

10

20

30

40

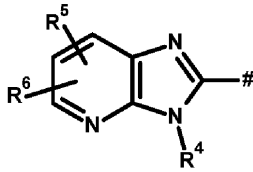
50

しくは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又はトリフルオロメチルを表し；

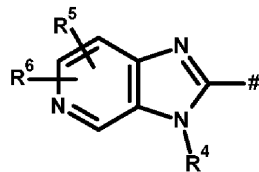
R^{1-5} は、極めて特に好ましくは、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*sec*-プロピル又は*tert*-ブチルを表し；

Q は、極めて特に好ましくは、Q 2、Q 3、Q 10、Q 14 及び Q 16

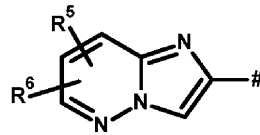
【化 5】



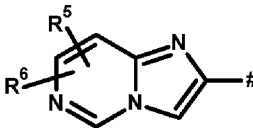
Q2



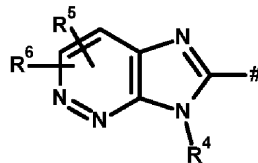
Q3



Q10



Q14



Q16

10

20

【0016】

からなる群から選択されるヘテロ芳香族の9員縮合二環式環系を表し；

R^4 は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルを表し；

R^5 は、極めて特に好ましくは、フッ素、塩素、臭素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル (CH_2CFH_2 、 CHFCH_3)、ジフルオロエチル (CF_2CH_3 、 CH_2CHF_2 、 CHFCHF_2)、トリフルオロエチル (CH_2CF_3 、 CHFCHF_2 、 CF_2CFH_2)、テトラフルオロエチル (CHF CF_3 、 CF_2CHF_2)、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルを表し；

R^6 は、極めて特に好ましくは、水素を表し；

m は、極めて特に好ましくは、0を表し；

n は、極めて特に好ましくは、0、1又は2を表す。

30

【0017】

構成 5

A_a は、最も好ましくは、 $=\text{C}(\text{R}^7)-$ を表し；

A_b は、最も好ましくは、 $-\text{S}(\text{O})_m-$ 又は $=\text{C}(\text{R}^2)-$ を表し；

A_c は、最も好ましくは、 $=\text{C}(\text{R}^3)-$ を表し；

A_d は、最も好ましくは、 $=\text{N}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m-$ 又は $=\text{C}(\text{R}^8)-$ を表し；

40

その結果、最も好ましくは、以下の構造単位をもたらす： A_9 、 A_{10} 、 A_{14} ；

R^1 は、最も好ましくは、エチルを表し；

R^2 は、最も好ましくは、水素を表し；

R^3 は、最も好ましくは、水素を表し；

R^7 は、最も好ましくは、水素を表し；

R^8 は、最も好ましくは、水素を表し；

Q は、最も好ましくは、Q 2 及び Q 3 からなる群から選択されるヘテロ芳香族の9員縮合二環式環系を表し；

R^4 は、最も好ましくは、メチルを表し；

R^5 は、最も好ましくは、トリフルオロメチルを表し；

50

R⁶ は、最も好ましくは、水素を表し；
 m は、最も好ましくは、0を表し；
 n は、最も好ましくは、0、1又は2を表す。

【0018】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、Q2又はQ3を表し；並びに、A_a、A_b、A_c、A_d、R¹、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、実施形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0019】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、Q2を表し；並びに、A_a、A_b、A_c、A_d、R¹、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、実施形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

10

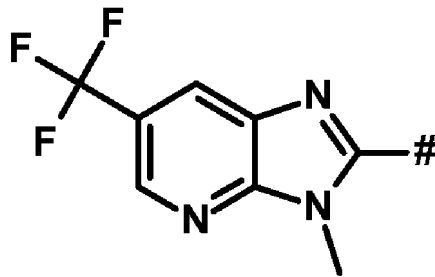
【0020】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、Q3を表し；並びに、A_a、A_b、A_c、A_d、R¹、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、実施形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0021】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、
 【化6】

20



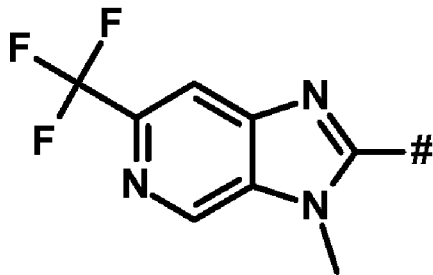
30

【0022】

を表し；並びに、A_a、A_b、A_c、A_d、R¹及びnは、実施形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0023】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、
 【化7】



40

【0024】

を表し；並びに、A_a、A_b、A_c、A_d、R¹及びnは、実施形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

50

【0025】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、
 A_a は、 $=C(R^7)$ - を表し；
 A_b は、 $-S(O)_m$ - 又は $=C(R^2)$ - を表し；
 A_c は、 $=C(R^3)$ - を表し；
 A_d は、 $=N-$ 、 $-S(O)_m$ - 又は $=C(R^8)$ - を表し；
 その結果、以下の構造単位をもたらす：A9、A10、A14；
 並びに、ここで、Q、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、m及びnは、実施形態(1)又は
 実施形態(2)又は実施形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与え
 られている意味を有する〕で表される化合物に関する。

10

【0026】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、
 A_a は、 $=C(R^7)$ - を表し；
 A_b は、 $-S(O)_m$ - 又は $=C(R^2)$ - を表し；
 A_c は、 $=C(R^3)$ - を表し；
 A_d は、 $=N-$ 、 $-S(O)_m$ - 又は $=C(R^8)$ - を表し；
 その結果、以下の構造単位をもたらす：A9、A10、A14；
 及び、Qは、Q2又はQ3を表し；
 並びに、ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、m及びnは、実施
 形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与えられている意味を有する
 〕で表される化合物に関する。

20

【0027】

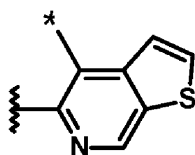
好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、
 A_a は、 $=C(R^7)$ - を表し；
 A_b は、 $=C(R^2)$ - を表し；
 A_c は、 $=C(R^3)$ - を表し；
 A_d は、 $-S(O)_m$ - を表し；
 その結果、以下の構造単位をもたらす：A9；
 並びに、Q、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、m及びnは、実施形態(1)又は実施形態(2)
 又は実施形態(3)又は実施形態(4)又は実施形態(5)において与えられている意味
 を有する〕で表される化合物に関する。

30

【0028】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、
 A_a は、 $=C(H)$ - を表し；
 A_b は、 $=C(H)$ - を表し；
 A_c は、 $=C(H)$ - を表し；
 A_d は、 $-S-$ を表し；
 その結果、以下の構造単位をもたらす：

【化8】



40

【0029】

及び、Qは、Q2又はQ3を表し；
 並びに、ここで、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及びnは、実施形態(3)又は実施形態(4)
 又は実施形態(5)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0030】

50

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I)〔式中、

A_a は、 $=C(R^7)-$ を表し；

A_b は、 $-S(O)_m-$ を表し；

A_c は、 $=C(R^3)-$ を表し；

A_d は、 $=C(R^8)-$ を表し；

その結果、以下の構造単位をもたらす：A 1 0；

並びに、 Q 、 R^1 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、 m 及び n は、実施形態 (1) 又は実施形態 (2) 又は実施形態 (3) 又は実施形態 (4) 又は実施形態 (5) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0031】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I)〔式中、

A_a は、 $=C(H)-$ を表し；

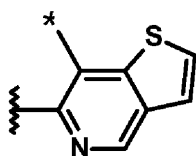
A_b は、 $-S-$ を表し；

A_c は、 $=C(H)-$ を表し；

A_d は、 $=C(H)-$ を表し；

その結果、以下の構造単位をもたらす：

【化9】



【0032】

及び、 Q は、 Q_2 又は Q_3 を表し；

並びに、ここで、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び n は、実施形態 (3) 又は実施形態 (4) 又は実施形態 (5) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0033】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I)〔式中、

A_a は、 $=C(R^7)-$ を表し；

A_b は、 $-S(O)_m-$ を表し；

A_c は、 $=C(R^3)-$ を表し；

A_d は、 $=N-$ を表し；

その結果、以下の構造単位をもたらす：A 1 4；

並びに、 Q 、 R^1 、 R^3 、 R^7 、 m 及び n は、実施形態 (1) 又は実施形態 (2) 又は実施形態 (3) 又は実施形態 (4) 又は実施形態 (5) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0034】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I)〔式中、

A_a は、 $=C(H)-$ を表し；

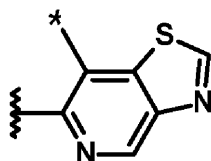
A_b は、 $-S-$ を表し；

A_c は、 $=C(H)-$ を表し；

A_d は、 $=N-$ を表し；

その結果、以下の構造単位をもたらす：

【化10】



10

20

30

40

50

【 0 0 3 5 】

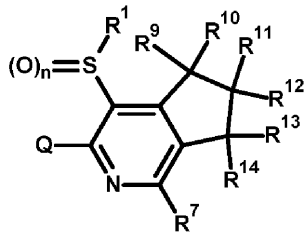
及び、Q は、Q 2 又は Q 3 を表し；

並びに、ここで、R¹、R⁴、R⁵、R⁶ 及び n は、実施形態（3）又は実施形態（4）又は実施形態（5）において与えられている意味を有する）で表される化合物に関する。

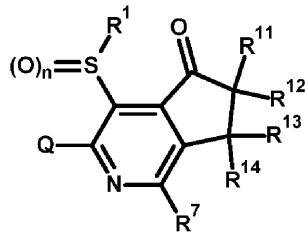
【 0 0 3 6 】

構造単位 A 1 ~ A 1 4 を含んでいることによって、これは、式（I）で表される下記主要構造をもたらす：

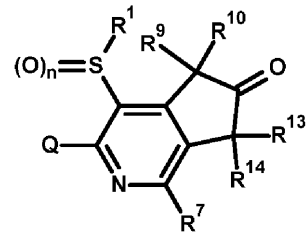
【化 1 1】



I(A1)

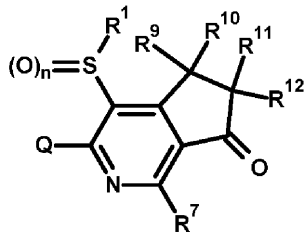


I(A2)

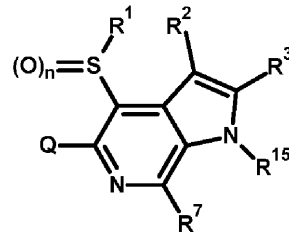


I(A3)

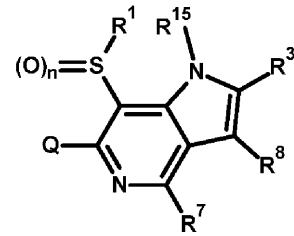
10



I(A4)

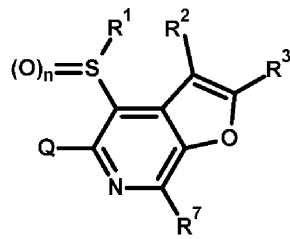


I(A5)

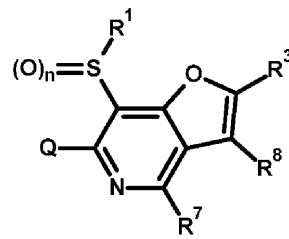


I(A6)

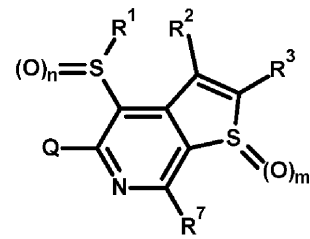
20



I(A7)

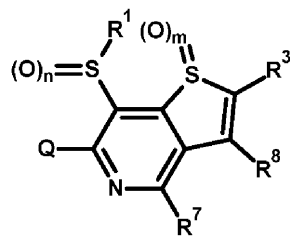


I(A8)

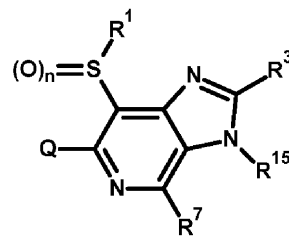


I(A9)

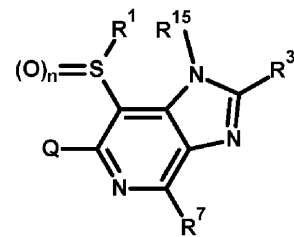
30



I(A10)

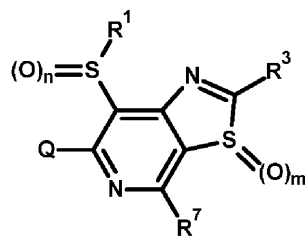


I(A11)

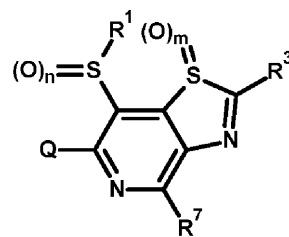


I(A12)

40



I(A13)



I(A14)

【 0 0 3 7】

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 Q 、 m 及び n は、上記で与えられている定義を有する。

【 0 0 3 8】

50

好ましい定義において、別途示されていない限り：

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択される。

【0039】

特に好ましい定義において、別途示されていない限り：

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択される。

【0040】

本発明に関連して、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロアルキル）、1～12個の炭素原子を有する飽和脂肪族炭化水素基のラジカルを意味するものと理解され、そして、分枝鎖又は非分枝鎖であることができる。C₁-C₁₂-アルキルラジカルの例は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、1-エチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、n-デシル、n-ウンデシル及びn-ドデシルである。これらのアルキルラジカルの中で、特に好ましいのは、C₁-C₆-アルキルラジカルである。特別に好ましいのは、C₁-C₄-アルキルラジカルである。

10

【0041】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルケニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の二重結合を有している直鎖又は分枝鎖のC₂-C₁₂-アルケニルラジカル、例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ペンタジエニル、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-ヘキセニル及び1,4-ヘキサジエニルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、C₂-C₆-アルケニルラジカルであり、特に好ましいのは、C₂-C₄-アルケニルラジカルである。

20

【0042】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の三重結合を有している直鎖又は分枝鎖のC₂-C₁₂-アルキニルラジカル、例えば、エチニル、1-プロピニル及びプロパルギルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、C₃-C₆-アルキニルラジカルであり、特に好ましいのは、C₃-C₄-アルキニルラジカルである。該アルキニルラジカルは、少なくとも1の二重結合も含むことができる。

30

【0043】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「シクロアルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、C₃-C₈-シクロアルキルラジカル、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル及びシクロオクチルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、C₃-C₆-シクロアルキルラジカルである。

40

【0044】

用語「アルコキシ」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロアルコキシ）、この場合、O-アルキルラジカルを意味するものと理解され、ここで、用語「アルキル」は、上記で定義されているとおりである。

【0045】

ハロゲンで置換されているラジカル（例えば、ハロアルキル）は、モノハロゲン化されているか、又は、置換基の可能な最大数までポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化されている場合、該ハロゲン原子は同一であっても又は異なってもよい。この場合、

50

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し、特に、フッ素、塩素又は臭素を表す。

【0046】

別途示されていない限り、置換されていてもよいラジカルは、1置換又は多置換されることができ、ここで、多置換の場合における該置換基は、同一であっても又は異なってもよい。

【0047】

概括的に与えられているか又は好ましい範囲内において記載されているラジカルの定義又は説明は、対応するように、最終生成物に当てはまり、並びに、出発物質及び中間体に当てはまる。ラジカルについてのこれらの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの好ましい範囲の間の組合せを包含する。

10

【0048】

本発明に従って好ましいのは、好ましいものとして上記で挙げられている意味の組合せを含んでいる式(I)で表される化合物の使用である。

【0049】

本発明に従って特に好ましいのは、特に好ましいものとして上記で挙げられている意味の組合せを含んでいる式(I)で表される化合物の使用である。

【0050】

本発明に従って極めて特に好ましいのは、極めて特に好ましいものとして上記で挙げられている定義の組合せを含んでいる式(I)で表される化合物の使用である。

20

【0051】

本発明に従って最も好ましいのは、最も好ましいものとして上記で挙げられている意味の組合せを含んでいる式(I)で表される化合物の使用である。

【0052】

式(I)で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態でも、及び/若しくは、光学活性異性体の形態でも、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態でも、存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の望ましい混合物を包含する。

【0053】

本発明による式(I)で表される化合物は、下記スキームにおいて示されている調製方法によって得ることができる。

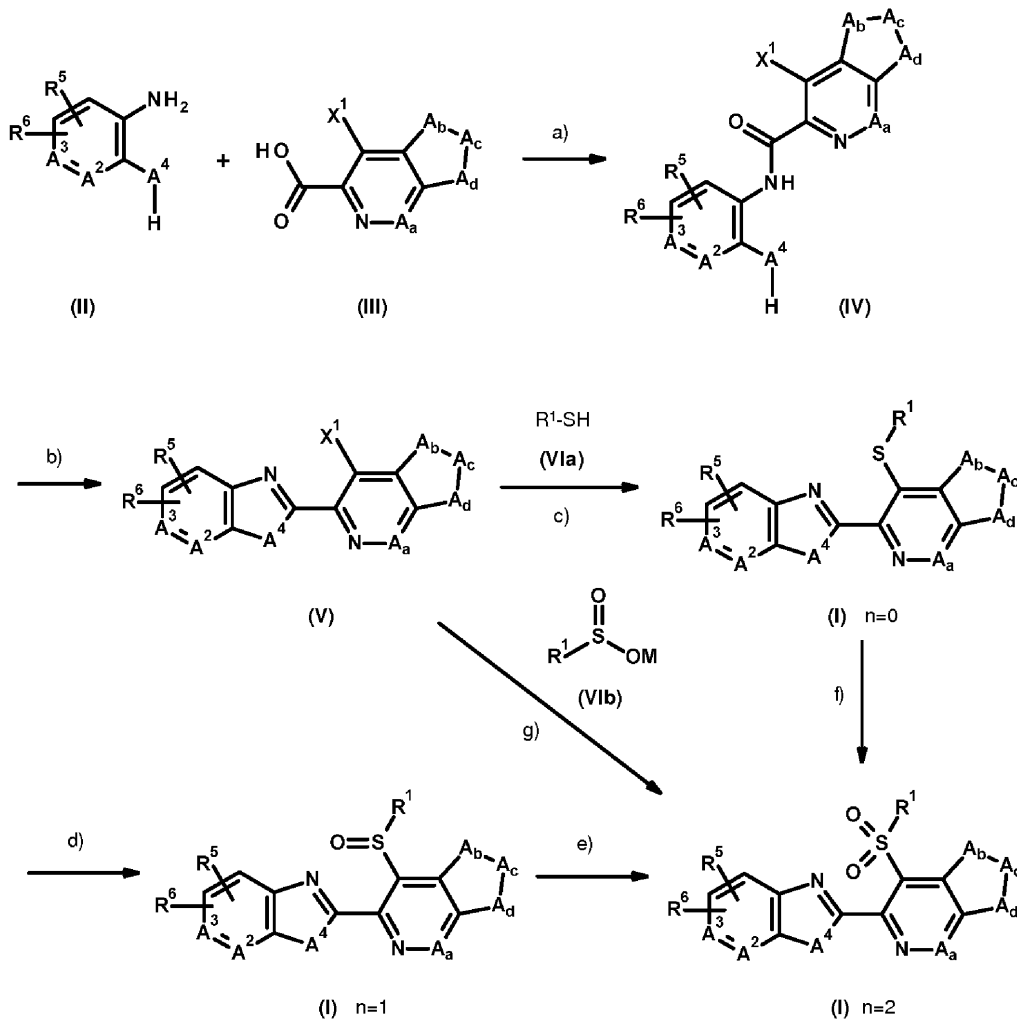
30

【0054】

調製方法 A

式(I)〔式中、Qは、Q1~Q9又はQ16又はQ19を表す〕で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715及びWO2015/121136に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【化 1 2】



10

20

30

【0055】

ラジカル R¹、R⁴、R⁵、R⁶、A_a、A_b、A_c、A_d 及び n は、上記意味を有し、A² 及び A³ は、CH 又は N を表し、A⁴ は、O、S 又は N-R⁴ を表し、X¹ は、ハロゲン又はトリフルオロメチルスルホネートを表し、及び、M は、アルカリ金属（好ましくは、ナトリウム又はカリウム）を表す。

【0056】

段階 (a)

式 (IV) で表される化合物は、US 5576335 に記載されている調製方法と同様にして、式 (II) で表される化合物を、縮合剤又は塩基の存在下で、式 (III) で表されるカルボン酸と反応させることによって、調製することができる。

40

【0057】

式 (II) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2003/69257、WO 2006/65703、WO 2009/131237、WO 2010/125985、WO 2011/043404、WO 2011/040629、WO 2012/086848、WO 2013/018928 若しくは WO 2015/000715 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0058】

式 (III) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。可能な調製経路は、調製方法 E ~ 調製方法 G に記載されている。

【0059】

50

式 (I I) で表される化合物と式 (I I I) で表されるカルボン酸の反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド又はN - メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

10

【 0 0 6 0 】

適切な縮合剤は、例えば、カルボジイミド類、例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (E D C I) 又は1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミドなどである。

【 0 0 6 1 】

適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。ここで、特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。

20

【 0 0 6 2 】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、0 ~ 180 の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、大気圧下、20 ~ 140 の温度で実施する。

【 0 0 6 3 】段階 (b)

式 (V) で表される化合物は、例えば、WO 2 0 0 9 / 1 3 1 2 3 7、WO 2 0 1 0 / 1 2 5 9 8 5、WO 2 0 1 1 / 0 4 3 4 0 4、WO 2 0 1 1 / 0 4 0 6 2 9、WO 2 0 1 2 / 0 8 6 8 4 8、WO 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8、WO 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 及びWO 2 0 1 5 / 1 2 1 1 3 6 に記載されている調製方法と同様にして、式 (I V) で表される化合物を縮合させることによって、調製することができる。

30

【 0 0 6 4 】

式 (V) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン、tert - ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド又はN - メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

40

【 0 0 6 5 】

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

【 0 0 6 6 】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (E D C I) 又は1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル (例えば、ジエチルアゾジカルボン酸) の混合物。

【 0 0 6 7 】

50

記載されている反応において使用することが可能な適切な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、パラ-トルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

【0068】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)；第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN,N-ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

【0069】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

10

【0070】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、0 ~ 200 の温度で実施することが可能である。

【0071】

段階(c)

式(I)〔式中、nは0を表す〕で表される化合物は、式(V)で表される化合物を、塩基の存在下で、式(VIa)で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

【0072】

式(VIa)で表されるメルカプタン誘導体(例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン)は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2006/25633、US2006/111591、US2820062、「Chemical Communications 2000, 13, 1163-1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 1922, 44, 1329」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

20

【0073】

式(I)〔式中、nは0を表す〕で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン又はジメチルスルホキシド。

30

【0074】

適切な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩及び炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。ここで、好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムである。適しているさらなる塩基は、アルカリ金属水素化物、例えば、水素化ナトリウムである。

40

【0075】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、0 ~ 200 の温度で実施することが可能である。

【0076】

上記反応において、X¹は、好ましくは、フッ素原子又は塩素原子である。

【0077】

段階(d)

式(I)〔式中、nは1を表す〕で表される化合物は、式(I)〔式中、nは0を表す〕で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。この酸化は、一般に、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する

50

。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0078】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素、メタ - クロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウムである。

【0079】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、 $-20 \sim 120$ の温度で実施することが可能である。

【0080】

段階 (e)

式 (I) [式中、n は 2 を表す] で表される化合物は、式 (I) [式中、n は 1 を表す] で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0081】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【0082】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、 $-20 \sim 120$ の温度で実施することが可能である。

【0083】

段階 (f)

式 (I) [式中、n は 2 を表す] で表される化合物は、式 (I) [式中、n は 0 を表す] で表される化合物を酸化することによって、1 段階プロセスで調製することもできる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0084】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【0085】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、 $-20 \sim 120$ の温度で実施することが可能である。

【0086】

段階 (g)

あるいは、式 (II) [式中、n は 2 を表す] で表される化合物は、1 段階法で、例えば、「Journal of Organic Chemistry 2005, 70, 2696 - 2700」に記載されている調製方法と同様にして、式 (V) で表される化合物から出発して式 (VIb) で表される化合物を用いたハロゲン - スルホン交換によって、調製することも可能である。該交換は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましくは、極性非プロトン性溶媒（例えば、ジメチルスルホキシド及び N, N - ジメチルホルムアミド）を使用する。

【0087】

式 (VIb) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「Organic Synthesis 1977, 57, 88 - 92」、「Tetrahedron Letters 1979, 9, 821 - 824」及び「Bulletin de la Societe Chimique de France 1958, 4, 447 - 450」に記載されている調製方法と同様にして、調製すること

10

20

30

40

50

ができる。

【0088】

適切な硫黄試薬の例は、スルフィン酸の塩である。

【0089】

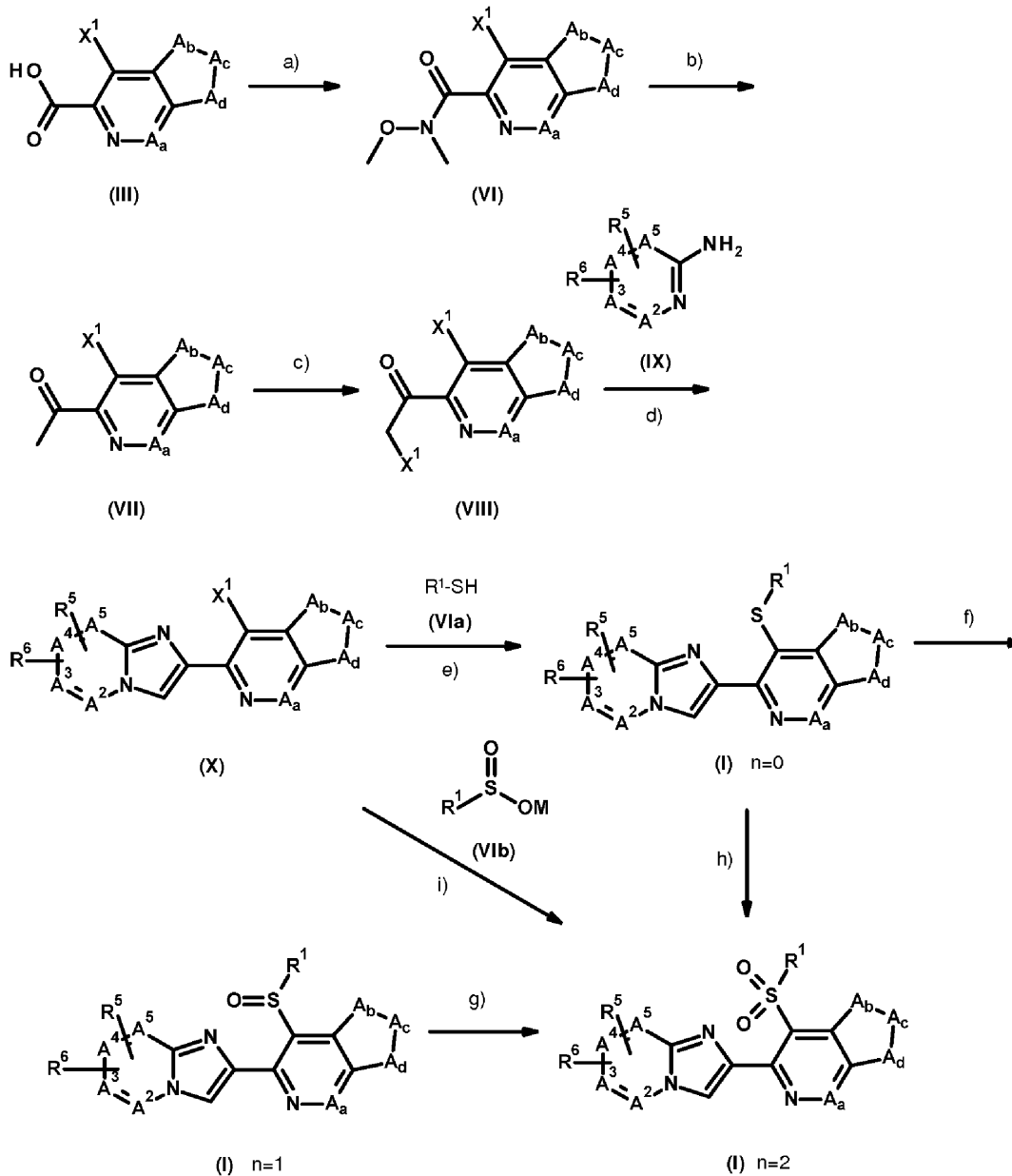
該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、 $-20 \sim 120$ の温度で実施することが可能である。

【0090】

調製方法 B

式 (I) [式中、Q は、Q10、Q11、Q14 又は Q15 を表す] で表される化合物は、既知方法で、例えば、US2009/203705、US2012/258951、WO2013/3298 又は「J. Med. Chem. 1988, 31, 1590-1595」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【化13】



【0091】

ラジカル R^1 、 R^5 、 R^6 、 A_a 、 A_b 、 A_c 、 A_d 及び n は、上記意味を有する。 A^2 、 A^3 、 A^4 及び A^5 は、CH 又は N を表し (ここで、 A^2 、 A^3 、 A^4 及び A^5 は、同時に N を表すことはない)、 X^1 は、ハロゲン又はトリフルオロメチルスルホネートを

表し、及び、Mは、アルカリ金属（好ましくは、ナトリウム又はカリウム）を表す。

【0092】

段階（a）

式（III）で表されるカルボン酸を、WO2011/75643又はEP2671582に記載されている調製方法と同様にして、O，N-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩の存在下で、式（VI）で表されるワインレブアミドに変換させる。

【0093】

式（III）で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。可能な調製経路は、調製方法E～調製方法Gに記載されている。

【0094】

段階（b）及び段階（c）

次いで、式（VI）で表される化合物を、既知方法で、例えば、WO2011/75643に記載されている調製方法と同様にして、グリニャール試薬（例えば、臭化メチルマグネシウム）を用いて、式（VII）で表されるケトンに変換させることができる。次いで、例えば、US2012/302573に記載されている既知方法と同様にして、ハロゲン化に付すことによって、式（VIII）で表される化合物を得ることができる。

【0095】

段階（d）

式（X）で表される化合物は、式（VIII）で表される化合物を式（IX）で表されるアミンを用いて環化させることによって、調製することができる。該環化は、既知方法で、例えば、WO2005/66177、WO2012/88411、WO2013/3298、US2009/203705、US2012/258951、WO2012/168733、WO2014/187762又は「J. Med. Chem. 1988, 31, 1590-1595」に記載されている調製方法と同様にして、例えば、エタノール、アセトニトリル又はN，N-ジメチルホルムアミドの中で、実施する。

【0096】

式（IX）で表される化合物は、市販されている。

【0097】

段階（e）

式（I）〔式中、nは0を表す〕で表される化合物は、式（X）で表される化合物を、塩基の存在下で、式（VIa）で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。式（VIa）で表されるメルカプタン誘導体（例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン）は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2006/25633、US2006/111591、US2820062、「Chemical Communications 2000, 13, 1163-1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 1922, 44, 1329」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0098】

段階（f）及び段階（g）

式（I）〔式中、nは1を表す〕で表される化合物は、式（I）〔式中、nは0を表す〕で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。該酸化は、既知方法で、適切な酸化剤（例えば、過酸化水素、メタ-クロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウム）を用いて実施する。

【0099】

式（I）〔式中、nは2を表す〕で表される化合物は、式（I）〔式中、nは1を表す〕で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。

【0100】

この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1，2-ジクロロ

10

20

30

40

50

エタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ-クロロ過安息香酸である。

【0101】

段階(h)

式(I)〔式中、nは2を表す〕で表される化合物は、式(I)〔式中、nは0を表す〕で表される化合物を酸化することによって、1段階プロセスで調製することもできる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ-クロロ過安息香酸である。

10

【0102】

段階(i)

あるいは、式(II)〔式中、nは2を表す〕で表される化合物は、1段階法で、例えば、「Journal of Organic Chemistry 2005, 70, 2696-2700」に記載されている調製方法と同様にして、式(X)で表される化合物から出発して式(VIb)で表される化合物を用いたハロゲン-スルホン交換によって、調製することも可能である。該交換は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましくは、極性非プロトン性溶媒（例えば、ジメチルスルホキシド及びN,N-ジメチルホルムアミド）を使用する。

20

【0103】

式(VIb)で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「Organic Synthesis 1977, 57, 88-92」、「Tetrahedron Letters 1979, 9, 821-824」及び「Bulletin de la Societe Chimique de France 1958, 4, 447-450」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0104】

適切な硫黄試薬の例は、スルフィン酸の塩である。

30

【0105】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、-20 ~ 120 の温度で実施することが可能である。

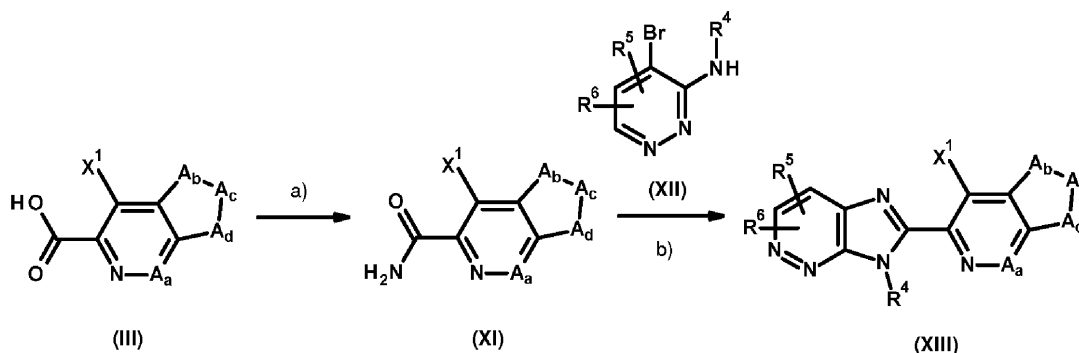
【0106】

調製方法C

式(I)〔式中、QはQ16を表す〕で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO 2014/142292に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【化14】

40



50

【0107】

ラジカル R^4 、 R^5 、 R^6 、 A_a 、 A_b 、 A_c 及び A_d は、上記意味を有する。 X^1 は、ハロゲンを表す。

【0108】

段階 (a)

式 (XI) で表される化合物は、US 5374646 又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093-1096」に記載されている調製方法と同様にして、式 (III) で表される化合物を、縮合剤の存在下でアンモニア源と反応させることによって、調製することができる。

10

【0109】

式 (III) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。可能な調製経路は、調製方法 E ~ 調製方法 G に記載されている。

【0110】

式 (III) で表される化合物とアンモニア源の該反応は、好ましくは、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で、実施する。好ましいのは、エーテル類、例えば、ジオキサン又はテトラヒドロフランなどである。

【0111】

適切な縮合剤は、例えば、カルボニルジイミダゾールなどである。

【0112】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能である。好ましくは、該反応は、大気圧下、20 ~ 70 の温度で実施する。

20

【0113】

段階 (b)

式 (XIII) で表される化合物は、WO 2014 / 142292 に記載されている調製方法と同様にして、式 (XI) で表される化合物を、塩基性媒体の中で、パラジウム触媒の存在下、式 (XII) で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

【0114】

式 (XIII) で表される化合物は、例えば、WO 2014 / 142292 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。使用するパラジウム触媒は、例えば、[1, 1'-ビス-(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム (III) などであり得る。多くの場合、使用する塩基は、無機塩基、例えば、カリウム tert - ブトキシドなどである。

30

【0115】

該反応は、溶媒の中で実施する。多くの場合、トルエンを使用する。

【0116】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能である。好ましくは、該反応は、大気圧下、20 ~ 110 の温度で実施する。

【0117】

式 (XIII) で表される化合物の式 (I) で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法 A と同様にして、実施する。

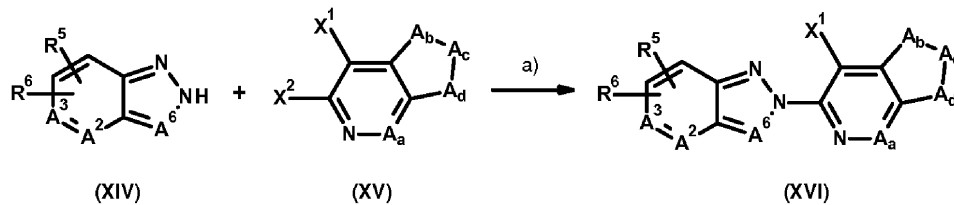
40

【0118】

調製方法 D

式 (I) [式中、Q は、Q12、Q13、Q17、Q18 又は Q20 を表す] で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO 2010 / 091310、WO 2012 / 66061 又は WO 2013 / 099041 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【化 15】



【0119】

ラジカル R⁵、R⁶、A_a、A_b、A_c 及び A_d は、上記意味を有する。A²、A³ 及び A⁶ は、CH 又は N を表す（ここで、A²、A³ 及び A⁶ は、同時に N を表すことはできない）。X¹ 及び X² は、ハロゲンを表す。

10

【0120】

段階 (a)

式 (XVI) で表される化合物は、例えば、WO2010/091310、WO2012/66061、WO2013/099041 又は「Tetrahedron 1993, 49, 10997-11008」に記載されている調製方法と同様にして、式 (XIV) で表される化合物を、塩基性条件下で式 (XV) で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

【0121】

式 (XIV) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、WO2005/100353、WO2012/66061 若しくは「European Journal of Medicinal Chemistry 2010, 45, 2214-2222」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

20

【0122】

式 (XV) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、調製方法 E 及び調製方法 G と同様にして、調製することができる。

【0123】

使用する塩基は、通常、無機塩基、例えば、水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムである。

30

【0124】

式 (XVI) で表される化合物への該変換は、通常、溶媒の中で、好ましくは、ニトリル（例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル）の中で、又は、非プロトン性極性溶媒（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン）の中で、実施する。

【0125】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、0 ~ 200 の温度で実施することができる。

【0126】

あるいは、式 (XVI) で表される化合物を生成させるための式 (XIV) で表される化合物と式 (XV) で表される化合物の反応は、例えば、「Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947」に記載されている調製方法と同様にして、パラジウムが触媒するN-アリアル化によって実施することも可能である。

40

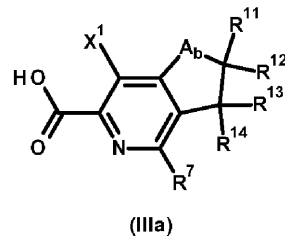
【0127】

式 (XVI) で表される化合物の式 (I) で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法 A と同様にして実施する。

【0128】

調製方法 E

【化16】

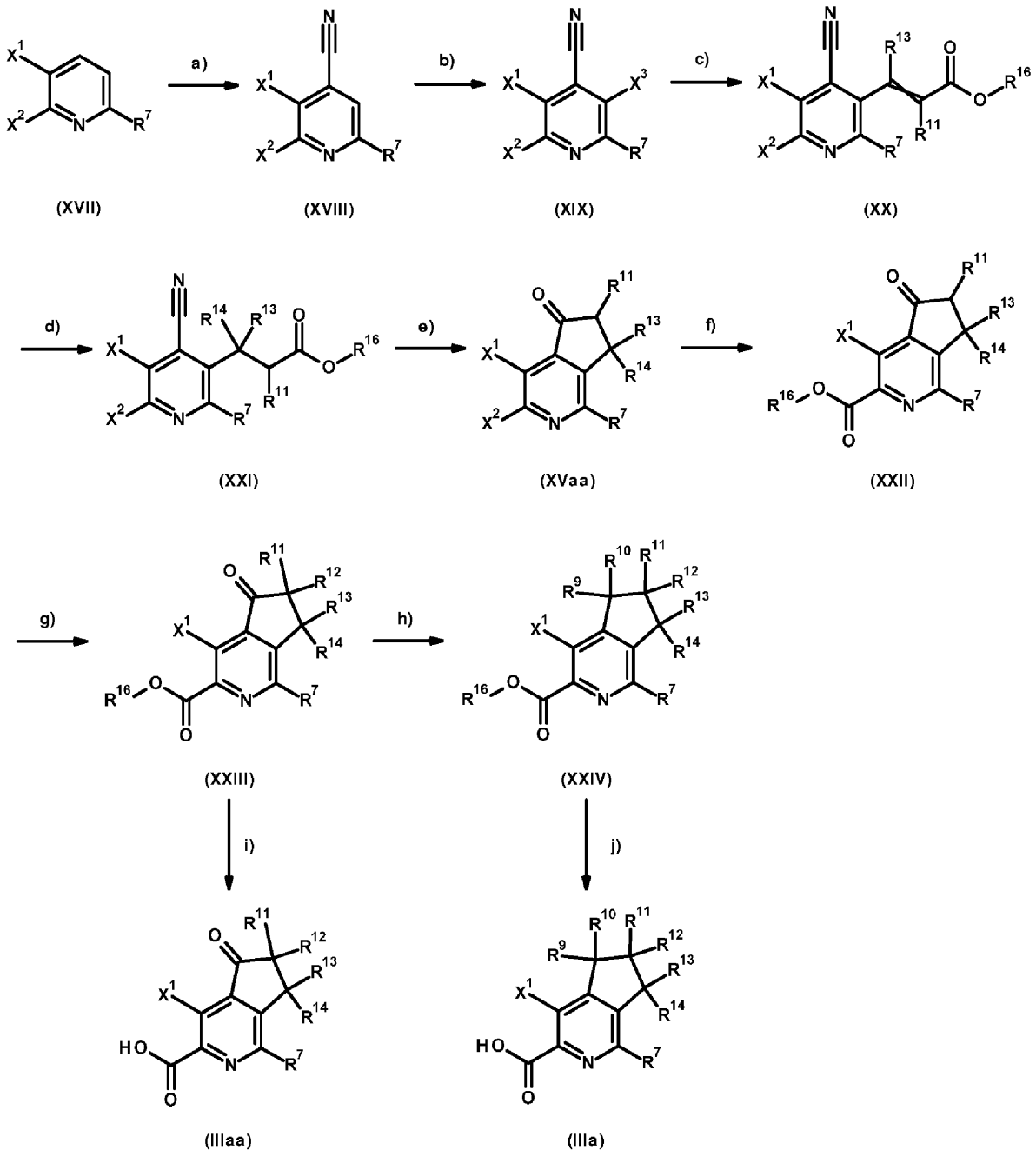


【0129】

10

構造単位 A1 又は A2 (A_b は、-C(=O)- 又は -C(R⁹)(R¹⁰)- を表す) を有する式 (IIIa) で表されるカルボン酸は、下記方法で調製することができる：

【化17】



20

30

40

【0130】

ラジカル R⁷、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³ 及び R¹⁴ は、上記意味を有す

50

る。A_bは、-C(=O)-又は-C(R⁹)(R¹⁰)-を表す。X¹、X²及びX³は、ハロゲンを表す。R¹⁶は、(C₁-C₄)-アルキル又はアリール-(C₁-C₂)-アルキルを表す。

【0131】

段階(a)

式(XVII)で表される化合物は、市販されているか、又は、US2008/003949に記載されている調製方法と同様にして、例えば、溶媒としてのテトラヒドロフランの中で、塩基としてのリチウムジイソプロピルアミン及び求電子物質としてのp-トルエンスルホニルシアニドを使用して、式(XVII)で表される化合物から既知方法で調製することができる。

10

【0132】

式(XVII)で表される化合物は、市販されている。

【0133】

最初のリチウム化段階に関する反応温度は、-100 ~ -75 であることができる。

【0134】

段階(b)

式(XIX)で表される化合物は、市販されているか、又は、「Tetrahedron 2009, 65, 748-751」に記載されている調製方法と同様にして、ハロゲン化によって、例えば、溶媒としてのテトラヒドロフランの中で、塩基としてのリチウムジイソプロピルアミン及びハロゲン化剤としてのヨウ素を使用して、式(XVII)で表される化合物から既知方法で合成することができる。

20

【0135】

最初のリチウム化段階に関する反応温度は、-100 ~ -75 であることができる。

【0136】

段階(c)

式(XX)で表される化合物は、市販されているか、又は、「Tetrahedron 2009, 65, 748-751」に記載されている調製方法と同様にして、ヘックカップリングによって、例えば、溶媒としてのアセトニトリルの中で、アクリル酸メチル、テトラブチルアンモニウムブロミド、触媒としての酢酸パラジウム(II)、塩基としての炭酸カリウムを使用して、式(XIX)で表される化合物から既知方法で合成することができる。

30

【0137】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0138】

段階(d)

式(XXI)で表される化合物は、市販されているか、又は、例えば、「Tetrahedron 2009, 65, 748-751」及び「Journal of the American Chemical Society 2002, 124, 13097-13105」に記載されている調製方法と同様にして、水素化若しくは求核置換反応によって、式(XX)で表される化合物から既知方法で調製することができる。

40

【0139】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0140】

段階(e)

式(XVaa)で表される化合物は、市販されているか、又は、「Tetrahedron 2009, 65, 748-751」に記載されている調製方法と同様にして、

50

例えば、溶媒としてのテトラヒドロフランの中で塩基としてカリウム *tert*-ブトキシドを使用し、その後、酸性条件下、例えば、メタノール中の塩酸を使用して、式 (X X I) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

【0141】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0142】

段階 (f)

式 (X X I I) で表される化合物は、「European Journal of Organic Chemistry 2013, 4174 - 4180」及び「Organic Process Research and Development 2001, 5, 572 - 574」に記載されている調製方法と同様にして、カルボニル化によって、式 (X V a a) で表される化合物から既知方法で合成することができる。官能基化は、遷移金属が触媒する条件下又は触媒しない条件下で、求電子物質としての二酸化炭素又はアルキル炭酸金属塩を使用して、実施することができる。

10

【0143】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0144】

段階 (g)

式 (X X I I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、EP 1 491 531 に記載されている調製方法と同様にして、例えば、溶媒としてのテトラヒドロフランの中で、塩基としてのリチウムヘキサメチルジシラジド及び求電子試薬としての *N*-フルオロベンゼンスルホンアミドを使用して、式 (X X I I) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

20

【0145】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0146】

段階 (h)

式 (X X I V) で表される化合物は、例えば、WO 2015 / 024878、「Synthesis 1986, 770 - 772」及び WO 2015 / 176267 に記載されている調製方法と同様にして、還元又はハロゲン化によって、式 (X X I I I) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

30

【0147】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、-20 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0148】

段階 (i) 及び段階 (j)

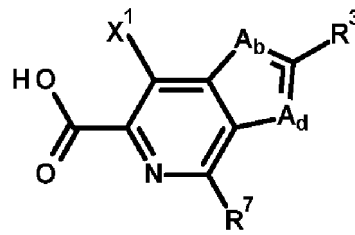
式 (I I I a a) 又は式 (I I I a) で表される化合物は、酸性条件下、塩基性条件下、温熱条件下又は水素化分解条件下におけるエステル加水分解によって、式 (X X I I I) 又は式 (X X I V) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

40

【0149】

調製方法 F

【化 1 8】



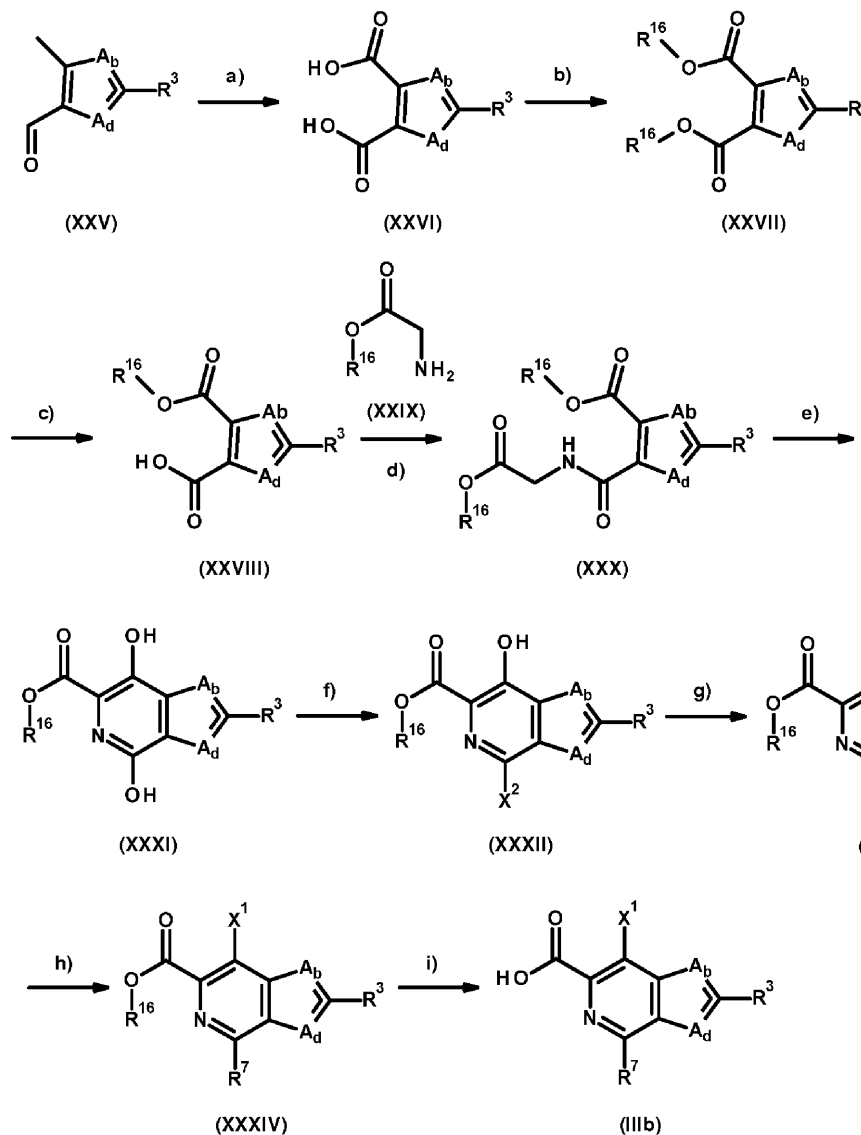
(IIIb)

10

【 0 1 5 0】

構造単位 A 5、A 6、A 9、A 10、A 13 又は A 14 (A_b は、= N -、- S (O)_m -、- N (R¹⁵) - 又は = C (R²) - を表し、及び、A_d は、= N -、- S (O)_m -、- N (R¹⁵) - 又は = C (R⁸) - を表す) を有する式 (IIIb) で表されるカルボン酸は、下記方法によって調製することができる。

【化 1 9】



20

30

40

【 0 1 5 1】

ラジカル R²、R³、R⁷、R⁸ 及び R¹⁵ は、上記意味を有する。A_b は、= N -、

50

- S (O)_m、 - N (R^{1 5}) - 又は = C (R²) - を表す。A_d は、 = N -、 - S (O)_m -、 - N (R^{1 5}) - 又は = C (R⁸) - を表す。X は、ハロゲン又はトリフルオロメタンスルホネートを表す。X² は、ハロゲンを表す。R^{1 6} は、(C₁ - C₄) - アルキルを表す。

【 0 1 5 2 】

段階 (a)

式 (X X V I) で表される化合物は、市販されているか、又は、US 2 0 0 6 / 0 1 9 9 8 3 6 に記載されている調製方法と同様にして、酸化によって、例えば、溶媒としての水の中で、酸化剤としての炭酸カリウムを使用して、式 (X X V) で表される化合物から既知方法で合成することができる。

10

【 0 1 5 3 】

式 (X X V) で表される化合物は、市販されている。

【 0 1 5 4 】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 2 0 0 の温度で、実施することができる。

【 0 1 5 5 】

段階 (b)

式 (X X V I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、US 2 0 0 6 / 0 1 9 9 8 3 6 に記載されている調製方法と同様にして、エステル化によって、例えば、溶媒としての R^{1 6} - O H の中で塩化チオニルを使用して、式 (X X V I) で表される化合物から既知方法で合成することができる。

20

【 0 1 5 6 】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 2 0 0 の温度で、実施することができる。

【 0 1 5 7 】

段階 (c)

式 (X X V I I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、US 2 0 0 6 / 0 1 9 9 8 3 6 及び US 2 0 0 8 / 0 0 0 4 3 0 9 に記載されている調製方法と同様にして、例えば、メタノール中で水酸化ナトリウムを使用して、式 (X X V I I) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

30

【 0 1 5 8 】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 2 0 0 の温度で、実施することができる。

【 0 1 5 9 】

段階 (d)

式 (X X X) で表される化合物は、市販されているか、又は、US 2 0 0 6 / 0 1 9 9 8 3 6 及び US 2 0 0 8 / 0 0 0 4 3 0 9 に記載されている調製方法と同様にして、式 (X X I X) で表される化合物を用いるアミド化によって、例えば、当該カルボン酸に関する活性化剤としての塩化オキサリル及び塩基としてのトリエチルアミンを使用して、式 (X X V I I I) で表される化合物から既知方法で合成することができる。

40

【 0 1 6 0 】

式 (X X I X) で表される化合物は、市販されている。

【 0 1 6 1 】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 2 0 0 の温度で、実施することができる。

【 0 1 6 2 】

段階 (e)

式 (X X X I) で表される化合物は、市販されているか、又は、US 2 0 0 6 / 0 1 9 9 8 3 6 及び US 2 0 0 8 / 0 0 0 4 3 0 9 に記載されている調製方法と同様にして、アミド化によって、例えば、エタノール中でナトリウムエトキシドを使用して、式 (X X X

50

)で表される化合物から既知方法で合成することができる。

【0163】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0164】

段階 (f)

式 (X X X I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、US 2006 / 0199836 及び US 2008 / 0004309 に記載されている調製方法と同様にして、ハロゲン化によって、例えば、オキシ塩化リン又はオキシ臭化リンを使用して、式 (X X X I) で表される化合物から既知方法で合成することができる。

10

【0165】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0166】

段階 (g)

式 (X X X I I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、US 2006 / 0199836 及び US 2008 / 0004309 に記載されている調製方法と同様にして、水素化、スズキカップリング若しくはスティルカップリングによって、例えば、溶媒としての酢酸エチルの中で活性炭担持パラジウム及び水素を使用して、又は、溶媒としての1,4-ジキサン若しくはN,N-ジメチルホルムアミドの中で、R⁷-B(OH)₂若しくはSn(R⁷)₄、触媒としてのテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)若しくはジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)及び塩基としての炭酸セシウムを使用して、式 (X X I I) で表される化合物から既知方法で合成することができる。

20

【0167】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0168】

段階 (h)

式 (X X X I V) で表される化合物は、市販されているか、又は、WO 2005 / 103003 に記載されている調製方法と同様にして、例えば、溶媒としてのジクロロメタンの中でトリフルオロメタンスルホン酸無水物及びトリエチルミンを使用して、式 (X X X I I I) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

30

【0169】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0170】

段階 (i)

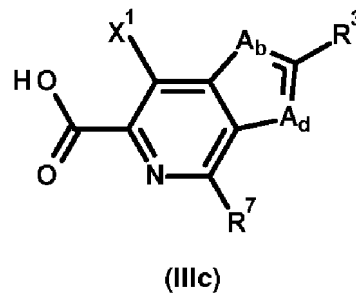
式 (I I I b) で表される化合物は、市販されているか、又は、酸性条件下、塩基性条件下、温熱条件下若しくは水素化分解条件下におけるエステル加水分解によって、式 (X X X I V) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

40

【0171】

調製方法 G

【化20】

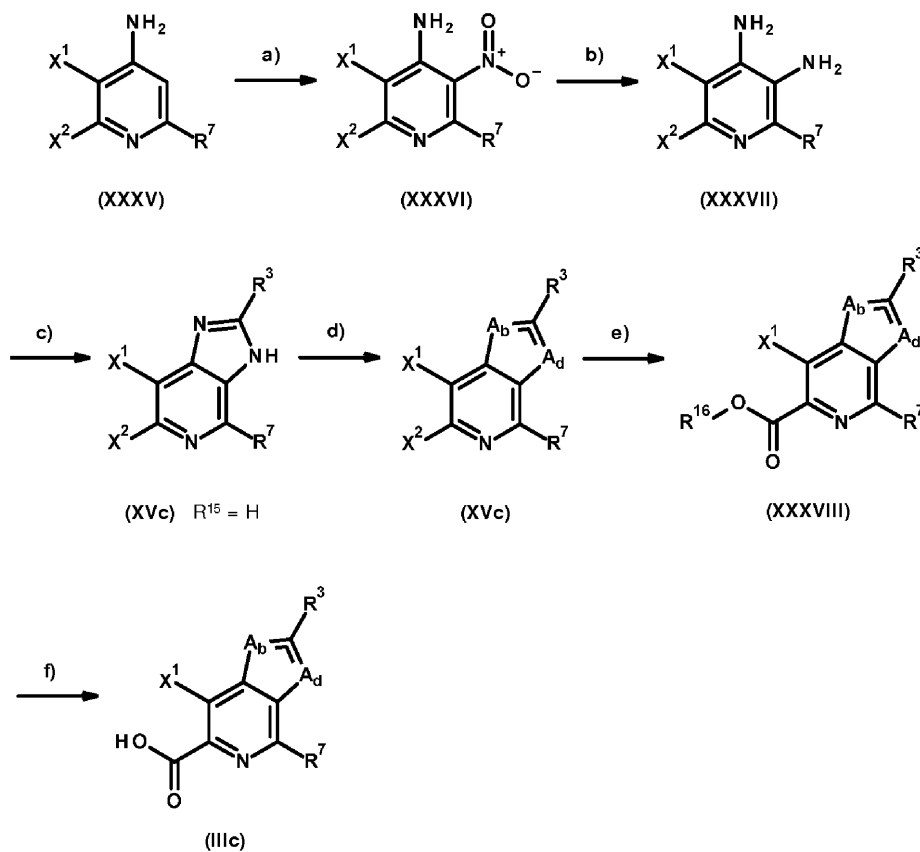


10

【0172】

構造単位 A11 又は A12 (Ab は、=N- 又は -N(R¹⁵)- を表し、及び、Ad は、=N- 又は -N(R¹⁵)- を表す) を有する式 (IIIc) で表される化合物は、市販されているか、又は、下記方法によって調製することができる。

【化21】



20

30

【0173】

ラジカル R³、R⁷ 及び R¹⁵ は、上記意味を有する。Ab は、=N- 又は -N(R¹⁵)- を表す。Ad は、=N- 又は -N(R¹⁵)- を表す。X¹ 及び X² は、ハロゲンを表す。R¹⁶ は、(C₁-C₄)-アルキル又はアリール-(C₁-C₂)-アルキルを表す。

40

【0174】

段階 (a)

式 (XXXVI) で表される化合物は、市販されているか、又は、WO2013/007765 に記載されている調製方法と同様にして、例えば、硫酸の中で硝酸カリウムを使用して、式 (XXXV) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

【0175】

50

式 (XXXV) で表される化合物は、市販されている。

【0176】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0177】

段階 (b)

式 (XXXVII) で表される化合物は、市販されているか、又は、「Tetrahedron Letters 2013, 54, 4054-4057」及び「Medicinal Chemical Communications 2013, 709-719」に記載されている調製方法と同様にして、還元によって、例えば、溶媒としてのメタノール、エタノール又は酢酸エチルの中で鉄及び酢酸を使用して、式 (XXVI) で表される化合物から既知方法で合成することができる。

10

【0178】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0179】

段階 (c)

式 (XVc) [式中、R¹⁵ は、水素を表す] で表される化合物は、市販されているか、又は、「Bioorganic Medicinal Chemistry 2012, 1644-1658」に記載されている調製方法と同様にして、環化によって、式 (XXXVII) で表される化合物から既知方法で合成することができる。官能基化は、酸 R³-COOH 又はこの酸の類似物 (例えば、酸無水物、酸塩化物、オルトエステル) を使用して、酸性条件下で実施することができる。

20

【0180】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0181】

段階 (d)

式 (XVc) で表される化合物は、市販されているか、又は、WO2005/111047、WO2008/59238 若しくは WO2009/16119 に記載されている調製方法と同様にして、例えば、溶媒としてのジメチルホルムアミド又はジメチルスルホキシドの中でアルカリ金属水酸化物 (例えば、水酸化ナトリウム) 又は無機塩基 (例えば、炭酸カリウム) 及び R¹⁵-X³ で表されるアルキル化剤 (例えば、ヨウ化メチル、臭化エチル又は硫酸ジメチル) を使用して、式 (XVc) [式中、R¹⁵ は、水素を表す] で表される化合物から既知方法で調製することができる。

30

【0182】

段階 (e)

式 (XXXVIII) で表される化合物は、市販されているか、又は、「European Journal of Organic Chemistry 2013, 4174-4180」及び「Organic Process Research and Development 2001, 5, 572-574」に記載されている調製方法と同様にして、カルボニル化によって、式 (XVc) で表される化合物から既知方法で合成することができる。官能基化は、遷移金属が触媒する条件下又は触媒しない条件下で、求電子物質としての二酸化炭素又はアルキル炭酸金属塩を使用して、実施することができる。

40

【0183】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0184】

段階 (f)

50

式 (I I I c) で表される化合物は、市販されているか、又は、酸性条件下、塩基性条件下、温熱条件下若しくは水素化分解条件下におけるエステル加水分解によって、式 (X X V I I I) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

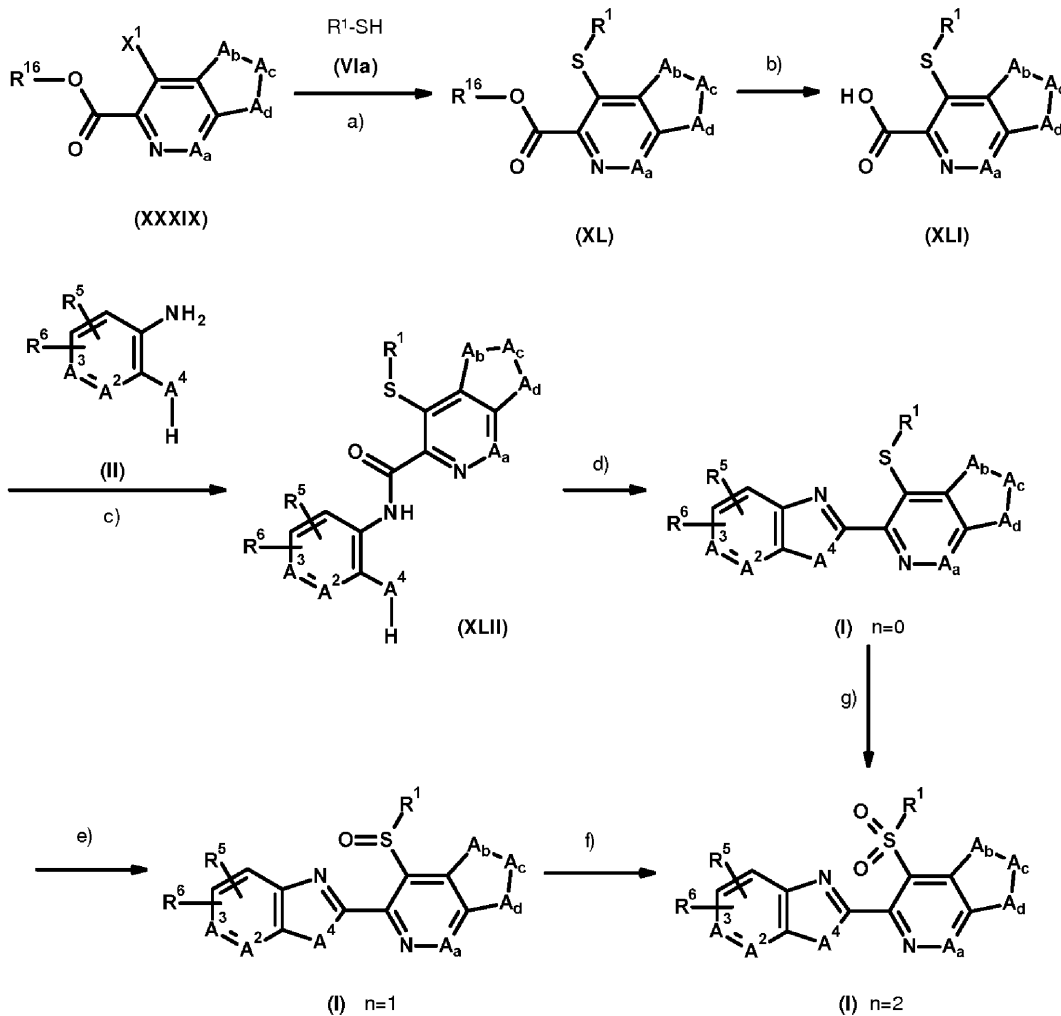
【 0 1 8 5 】

調製方法 H

式 (I) [式中、Q は、Q 1 ~ Q 9 又は Q 1 6 又は Q 1 9 を表す] で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO 2 0 0 9 / 1 3 1 2 3 7、WO 2 0 1 0 / 1 2 5 9 8 5、WO 2 0 1 1 / 0 4 3 4 0 4、WO 2 0 1 1 / 0 4 0 6 2 9、WO 2 0 1 2 / 0 8 6 8 4 8、WO 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8、WO 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 及び WO 2 0 1 5 / 1 2 1 1 3 6 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

10

【 化 2 2 】



20

30

【 0 1 8 6 】

ラジカル R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A_a 、 A_b 、 A_c 、 A_d 及び n は、上記意味を有し、 A^2 及び A^3 は、CH 又は N を表し、 A^4 は、O、S 又は N - R^4 を表し、 X^1 は、ハロゲン又はトリフルオロメチルスルホネートを表し、及び、 R^{16} は、($C_1 - C_4$) - アルキル又はアリール - ($C_1 - C_2$) - アルキルを表す。

40

【 0 1 8 7 】

段階 (a)

式 (X L) で表される化合物は、式 (X X X I X) で表される化合物を、塩基の存在下で、式 (V I a) で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

【 0 1 8 8 】

式 (X X X I X) で表されるエステルは、市販されているか、又は、既知方法で調製す

50

ることができる。可能な調製経路は、調製方法 E ~ 調製方法 G に記載されている。

【0189】

式 (V I a) で表されるメルカプタン誘導体 (例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン) は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2006/25633、US 2006/111591、US 2820062、「Chemical Communications 2000, 13, 1163-1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 1922, 44, 1329」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0190】

式 (X L) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン又はジメチルスルホキシド。

【0191】

適切な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩及び炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。ここで、好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムである。適しているさらなる塩基は、アルカリ金属水素化物、例えば、水素化ナトリウムである。

【0192】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

【0193】

上記反応において、X¹ は、好ましくは、フッ素原子又は塩素原子を表す。

【0194】

あるいは、式 (X L) で表される化合物は、1段階法で、例えば、US 2008/0171732 に記載されている調製方法と同様にして、式 (X X X I X) で表される化合物から出発して式 (V I a) で表される化合物を用いたハロゲン-硫黄交換によって、調製することも可能である。該交換は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましくは、極性非プロトン性溶媒 (例えば、ジメチルスルホキシド及び N,N-ジメチルホルムアミド) を使用する。

【0195】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、-20 ~ 120 の温度で実施することが可能である。

【0196】

上記反応において、X¹ は、好ましくは、臭素原子又はトリフルオロメチルスルホネートを表す。

【0197】

段階 (b)

式 (X L I) で表される化合物は、市販されているか、又は、酸性条件下、塩基性条件下、温熱条件下若しくは水素化分解条件下におけるエステル加水分解によって、式 (X L) で表される化合物から既知方法で調製することができる。

【0198】

段階 (c)

式 (X L I I) で表される化合物は、US 5576335 に記載されている調製方法と同様にして、式 (I I) で表される化合物を、縮合剤又は塩基の存在下で、式 (X L I)

10

20

30

40

50

で表されるカルボン酸と反応させることによって、調製することができる。

【0199】

式(II)で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2003/69257、WO2006/65703、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928若しくはWO2015/000715に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0200】

式(II)で表される化合物と式(XLI)で表されるカルボン酸の反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

10

【0201】

適切な縮合剤は、例えば、カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)又は1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミドなどである。

20

【0202】

適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。ここで、特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。

【0203】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、0 ~ 180 の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、大気圧下、20 ~ 140 の温度で実施する。

30

【0204】

段階(d)

式(I)〔式中、nは0を表す〕で表される化合物は、例えば、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715及びWO2015/121136に記載されている調製方法と同様にして、式(XLII)で表される化合物を縮合させることによって、調製することができる。

【0205】

式(I)〔式中、nは0を表す〕で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

40

【0206】

50

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

【0207】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) 又は 1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル（例えば、ジエチルアゾジカルボン酸）の混合物。

【0208】

記載されている反応において使用することが可能な適切な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、パラ - トルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

10

【0209】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2, 6 - ルチジン、1, 8 - ジアザビシクロ [5.4.0] - 7 - ウンデセン (DBU)；第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及び N, N - ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

【0210】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

【0211】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で、0 ~ 200 の温度で、実施することができる。

20

【0212】

段階 (e)

式 (I) [式中、n は 1 を表す] で表される化合物は、式 (I) [式中、n は 0 を表す] で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。この酸化は、一般に、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0213】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素、メタ - クロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウムである。

30

【0214】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、-20 ~ 120 の温度で実施することが可能である。

【0215】

段階 (f)

式 (I) [式中、n は 2 を表す] で表される化合物は、式 (I) [式中、n は 1 を表す] で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

40

【0216】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【0217】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、-20 ~ 120 の温度で実施することが可能である。

【0218】

段階 (g)

50

式 (I) [式中、 n は 2 を表す] で表される化合物は、式 (I) [式中、 n は 0 を表す] で表される化合物を酸化することによって、 1 段階プロセスで調製することもできる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、 1 , 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【 0 2 1 9 】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【 0 2 2 0 】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下、 - 2 0 ~ 1 2 0 の温度で実施することが可能である。 10

【 0 2 2 1 】

方法及び使用

本発明は、さらに、害虫を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、式 (I) で表される化合物を害虫及び / 又はそれらの生息環境に作用させる。害虫の該防除は、好ましくは、農業及び林業において、並びに、材料物質 (material) の保護において、実施される。好ましくは、ヒト又は動物の身体の外科的な又は治療的な処置方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法は、上記方法から除外される。

【 0 2 2 2 】

本発明は、さらに、殺有害生物剤としての、特に、作物保護剤としての、式 (I) で表される化合物の使用にも関する。 20

【 0 2 2 3 】

本出願に関連して、用語「殺有害生物剤 (pesticide)」は、いずれの場合にも、常に、用語「作物組成物」も包含する。

【 0 2 2 4 】

式 (I) で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、内温動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、生物的ストレス因子及び非生物的ストレス因子に対して植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、特に、線虫類、及び、軟体動物を防除するのに適している。 30

【 0 2 2 5 】

本特許出願に関連して、用語「衛生学 (hygiene)」は、疾患 (特に、感染症) を予防することを目的とする任意の全ての手段、準備及び方法、並びに、ヒト及び動物の健康を保護するのに及び / 又は環境を保護するのに及び / 又は清潔を維持するのに役立つ任意の全ての手段、準備及び方法を意味するものと理解されるべきである。本発明によれば、これには、特に、きれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、例えば、繊維又は硬質表面 (特に、ガラス製、木製、コンクリート製、磁器製、セラミック製、プラスチック製の表面、又は、金属 (類) 製の表面) を衛生害虫及び / 又はその分泌物が存在していない状態に維持するための、それらをきれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段が包含される。これに関連して、ヒト又は動物の身体に対して施される外科的又は治療的な処置方法、及び、ヒト又は動物の身体に対してなされる診断方法は、本発明による保護の範囲から除外される。 40

【 0 2 2 6 】

用語「衛生学の分野」には、そのような衛生学的な手段、準備及び方法が重要である全ての領域、技術分野及び産業上の利用、例えば、調理場、パン屋、空港、浴室、スイミングプール、デパート、ホテル、病院、家畜小屋、動物飼育などにおける衛生に関する全ての領域、技術分野及び産業上の利用が包含される。

【 0 2 2 7 】

従って、用語「衛生害虫」は、衛生学の分野においてその存在が問題である、特に、健康上の理由に関して問題である、1種類以上の害虫を意味するものと理解されるべきである。従って、主な目的は、衛生害虫の存在を回避するか若しくは最小限度に抑制すること、及び/又は、衛生学の分野において衛生害虫との接触を回避するか若しくは最小限度に抑制することである。このことは、特に、発生を予防するため及び既に発生している害虫を阻止するための両方に使用することが可能な殺害虫剤を使用することによって達成することが可能である。害虫との接触を防止するか又は低減させる製剤を使用することも可能である。衛生害虫としては、例えば、以下に記載されている生物などを挙げることができる。

【0228】

かくして、用語「衛生学的な保護」には、そのような衛生学的手段、準備及び方法を維持及び/又は改善する全ての行為が包含される。

【0229】

式(I)で表される化合物は、好ましくは、殺有害生物剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、さらに、全ての発育段階又は特定の発育段階に対して活性を示す。上記害虫としては、以下のものを挙げることができる：

節足動物門の害虫、特に、クモ綱(Arachnida)の、例えば、アカルス属種(Acarus spp.)、例えば、アカルス・シロ(Acarus siro)、アケリア・クコ(Aceria kuko)、アケリア・シェルドニ(Aceria she 20
ldoni)、アクトプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Aculus spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ(Aculus fockeui)、アクルス・シュレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス(Amphitetranychus viennensis)、アルガス属種(Argas spp.)、ボオフィルス属種(Boophilus spp.)、ブレビバルプス属種(Brevipalpus spp.)、例えば、ブレビバルプス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis)、ブリオビア・グラミンム(Bryobia graminum)、ブリオビア・プラエチオサ(Bryobia praetiosa)、セントルロイデス属種(Centruroides spp.)、コリオプ 30
テス属種(Chorioptes spp.)、デルマニクス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス(Dermatophagoides pteronyssinus)、デルマトファゴイデス・ファリナエ(Dermatophagoides farinae)、デルマセントル属種(Dermacentor spp.)、エオテトラニクス属種(Eotetranychus spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ(Eotetranychus hicoriae)、エピトリメルス・ピリ(Epitrimerus pyri)、エウテトラニクス属種(Eutetranychus spp.)、例えば、エウテト 40
ラニクス・バンクシ(Eutetranychus banksi)、エリオフィエス属種(Eriophyes spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ(Eriophyes pyri)、グリシファグス・ドメスティクス(Glycyphagus domesticus)、ハロチデウス・デストルクトル(Halotydeus destructor)、ヘミタロソネムス属種(Hemitarsonemus spp.)、例え ば、ヘミタロソネムス・ラツス(Hemitarsonemus latus)(=ポリ 50
ファゴタルソネムス・ラツス(Polyphagotarsonemus latus))、ヒアロンマ属種(Hyalomma spp.)、イキシデス属種(Ixodes spp.)、ラトロデクトゥス属種(Latrodectus spp.)、ロキソスケルス属種(Loxosceles spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス(Neutrombicula autumnalis)、ヌフェルサ属種(Nuphersa spp.)、オリゴニクス属種(Oligonychus spp.)、例えば、オリ

10

20

30

40

50

ゴニクス・コフェアエ (*Oligonychus coffeae*)、オリゴニクス・コ
 ニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イ
 リシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oli
 gonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligony
 chus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonych
 us pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus pu
 nicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yothersi*
)、オルニトドルス属種 (*Ornithodorus spp.*)、オルニトニスス属種
 (*Ornithonyssus spp.*)、パノニクス属種 (*Panonychus
 spp.*)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メ
 タテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニク
 ス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Met
 atetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyll
 ocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Pl
 atytetranychus multigituli*)、ポリファゴタルソネム
 ス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属
 種 (*Psoroptes spp.*)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalu
 s spp.*)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus spp.*)、サルコプ
 テス属種 (*Sarcoptes spp.*)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio
 maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus sp
 p.*)、ステネオタルソネムス・スピンキ (*Steneotarsonemus spi
 nki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus spp.*)、例えば、タルソネム
 ス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズス
 (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranych
 us spp.*)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus c
 anadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus ci
 nnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus tu
 rkeستاني*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urtic
 ae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfredduge
 si*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis spp.*)、バサテス・リコベルシシ (
Vasates lycopersici) ;
 ムカデ綱 (*Chilopoda*) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus
 spp.*)、スクチゲラ属種 (*Scutigera spp.*) ;
 トビムシ目 (*Collembola*) 又はトビムシ綱の、例えば、オニキウルス・アル
 マツス (*Onychiurus armatus*) ; スミンツルス・ビリジス (*Smi
 nthurus viridis*) ;
 ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blani
 ulus guttulatus*) ;
 昆虫綱 (*Insecta*) の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*) の、例えば
 、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・ア
 サヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Bla
 ttella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophae
 a maderae*)、ロボプテラ・デシピエンス (*Loboptera decipi
 ens*)、ネオスチロピガ・ロムビフォリア (*Neostylopyga rhombi
 folia*)、パンクロラ属種 (*Panchlora spp.*)、バルコブラッタ属種
 (*Parcoblatta spp.*)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta
 spp.*)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta ameri
 cana*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta austr
 alasiae*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus suri
 namensis*)、スベラ・ロンギバルバ (*Supella longipalpa*)

10

20

30

40

50

;

コウチュウ目 (Coleoptera) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アcantセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種 (*Adoretus* spp.)、アエチナ・ツミダ (*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリオテス属種 (*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・リンネアツス (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属種 (*Anoplophora* spp.)、アントノムス属種 (*Anthonomus* spp.)、例えば、アントノムス・グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus* spp.)、アピオン属種 (*Apion* spp.)、アポゴニア属種 (*Apogonia* spp.)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus* spp.)、パリス・カエルレセンス (*Baris caerulea*)、ブルキジウス・オブテクツス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種 (*Bruchus* spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフイマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites* spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera* spp.)、クルクリオ属種 (*Curculio* spp.)、例えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*Dermestes* spp.)、ジアプロチカ属種 (*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアプロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアプロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアプロチカ・ウンデシムプンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアプロチカ・ウンデシムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrotica undecimpunc*

tata undecimpunctata)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zea*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis* spp.)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボデルス属種 (*Diloboderus* spp.)、エピカエルス属種 (*Epicaerus* spp.)、エピラクナ属種 (*Epilachna* spp.)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilachna borealis*)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna varivestis*)、エピトリクス属種 (*Epitrix* spp.)、例えば、エピトリクス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エピトリクス・フスクラ (*Epitrix fuscula*)、エピトリクス・ヒルチペンニス (*Epitrix hirtipennis*)、エピトリクス・スブクリニタ (*Epitrix subcristata*)、エピトリクス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faustinus* spp.)、ギビウム・ブシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウングリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx* spp.)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルベス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・ブベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサンガイネア (*Lachnosteria consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius* spp.)、レマ属種 (*Lema* spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera coffeella*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リストロノツス属種 (*Listronotus* spp.) (=ヒペロデス属種 (*Hyperodes* spp.)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、ルペロデス属種 (*Luperodes* spp.)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、リクツス属種 (*Lyctus* spp.)、メガセリス属種 (*Megascelis* spp.)、メラノツス属種 (*Melanotus* spp.)、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属種 (*Melolontha* spp.)、例えば、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属種 (*Monochamus* spp.)、ナウパクトゥス・キサントグラフィス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属種 (*Necrobria* spp.)、ネオガレルセラ属種 (*Neogalerucella* spp.)、ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Otiorthynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiorthynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorthynch*

us ligustici)、オチオリンクス・オバツス (*Oti or hynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Oti or hynchus rugosostriarus*)、オチオリンクス・スルカツス (*Oti or hynchus sulcatus*)、オウレマ属種 (*Oulema spp.*)、例えば、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、オキシセトニア・ジユクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllophaga spp.*)、フィロファガ・ヘレリ (*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属種 (*Phyllotreta spp.*)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllotreta armoraciae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrypes spp.*)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus truncatus*)、プシリオデス属種 (*Psylliodes spp.*)、例えば、プシリオデス・アフィニス (*Psylliodes affinis*)、プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、プシリオデス・プンクツラタ (*Psylliodes punctulata*)、プチヌス属種 (*Ptinus spp.*)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、リゾベルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、リンコホルス属種 (*Rhynchophorus spp.*)、リンコホルス・フェルギネウス (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パルマルム (*Rhynchophorus palmarum*)、シノキシロン・ペルホランス (*Sinoxylon perforans*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus spp.*)、例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種 (*Sphenophorus spp.*)、例えば、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属種 (*Sternechus spp.*)、例えば、ステルネクス・パルダツス (*Sternechus paludatus*)、シムフィレテス属種 (*Symphyletes spp.*)、タニメクス属種 (*Tanymecus spp.*)、例えば、タニメクス・ジラチコリス (*Tanymecus dilaticollis*)、タニメクス・インジクス (*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パリアツス (*Tanymecus palliatus*)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebrio ides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium spp.*)、例えば、トリボリウム・アウダキス (*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム (*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma spp.*)、チキウス属種 (*Tychius spp.*)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus spp.*)、ザブルス属種 (*Zabrus spp.*)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrio ides*) ;

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

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes spp.*)、例え

10

20

30

40

50

ば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス
 (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種
 (*Agromyza spp.*)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・バルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha spp.*)、アノフェレス属種 (*Anopheles spp.*)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス
 (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属種 (*Asphondylia spp.*)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera spp.*)、例えば、バク
 トロセラ・ククルピタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレアエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチ
 チス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus spp.*)、クリソミア属種 (*Chrysomya spp.*)、クリソ
 プス属種 (*Chrysops spp.*)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya spp.*)
 、コンタリニア属種 (*Contarinia spp.*)、例えば、コンタリニア・ジョ
 ンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contar
 inia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、
 コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロピア
 ・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコト
 プス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種
 (*Culex spp.*)、例えば、クレキス・ピピエン
 ス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides spp.*)、クリセタ属種 (*Cul
 iseta spp.*)、クテレブラ属種 (*Cuterebra spp.*)、ダクス・
 オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura spp.
)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デ
 リア属種 (*Delia spp.*)、例えば、デリア・アントクア (*Delia ant
 iqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロ
 リレガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia plat
 ura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトピア・ホミニス
 (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila
 spp.*)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila mel
 anogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzuki
 i*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus spp.*)、エウレイア・ヘラク
 レイ (*Euleia heraclei*)、ファンニア属種 (*Fannia spp.*)
 、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus spp.*)、グロッシナ属種 (*Glossina spp.*)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota spp.*)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia spp.*)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hy
 drellia griseola*)、ヒレミア属種 (*Hylemya spp.*)、ヒ
 ッポドスカ属種 (*Hippobosca spp.*)、ヒポデルマ属種 (*Hypoder
 ma spp.*)、リリオミザ属種 (*Liriomyza spp.*)、例えば、リリオ
 ミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブ
 レンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza satybae*)*

10

20

30

40

50

Liriomyza sativae)、ルシリア属種 (*Lucilia spp.*)、
 例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミア属種 (*Lutzomyia spp.*)、マンソニア属種 (*Mansonia spp.*)、ム
 スカ属種 (*Musca spp.*)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca dom
 estica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vi
 cina*)、オエストルス属種 (*Oestrus spp.*)、オシネラ・フリト (*Os
 cinella frit*)、パラタニタルス属種 (*Paratanytarsus
 spp.*)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborni
 ella subcincta*)、ペゴミア又はペゴミイア属種 (*Pegomya or
 Pegomyia spp.*)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya bet
 ae*)、ペゴミア・ヒオシアミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ル
 ビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotom
 us spp.*)、ホルビア属種 (*Phorbia spp.*)、ホルミア属種 (*Pho
 rmia spp.*)、ピオフィラ・カセイ (*Piophilala casei*)、プラチ
 パレア・ポエシロプテラ (*Platyparea poeciloptera*)、プロジ
 プロシス属種 (*Prodiplosis spp.*)、プシラ・ロサエ (*Psila r
 osae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis spp.*)、例えば、ラゴレチス
 ・シングラタ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ
 (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagol
 etis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis i
 ndifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis menda
 x*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコフ
 アガ属種 (*Sarcophaga spp.*)、シムリウム属種 (*Simulium s
 pp.*)、例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridiona
 le*)、ストモキス属種 (*Stomoxys spp.*)、タバヌス属種 (*Tabanu
 s spp.*)、テタノポプス属種 (*Tetanops spp.*)、チブラ属種 (*Ti
 pula spp.*)、例えば、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)
 、チブラ・シムプレキス (*Tipula simplex*)、トキシトリパナ・クルビカ
 ウダ (*Toxotrypana curvicauda*) ;
 カメムシ目 (*Hemiptera*) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ 30
 (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia
 dodonaeae*)、アシジア・ウokatoides (*Acizzia
 uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシル
 トシポン属種 (*Acyrtosiphon spp.*)、例えば、アシルトシホン・ピス
 ム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogoni
 a spp.*)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia spp.*)、アゴノセナ
 属種 (*Agonosцена spp.*)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocan
 thus spp.*)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes prolet
 ella*)、アレウロロブス・パロデンシス (*Aleurolobus baroden
 sis*)、アレウロトリクス・フロコスス (*Aleurothrixus flocco
 sus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayen
 sis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca spp.*)、例えば、アムラスカ・ビグツ
 ラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasc
 a devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardu
 i*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella spp.*)、例えば、アオニジエラ・
 アウランチイ (*Aonidiella aurantii*)、アオニジエラ・シトリナ (*Aonidie
 lla citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidie
 lla inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma p
 iri*)、アフィス属種 (*Aphis spp.*)、例えば、アフィス・シトリコラ (*A
 phis citricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis cracciv* 40 50

ora)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス (*Aphis glycyines*)、アフィス・ゴシパイ (*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフィス・イリノイセンシス (*Aphis illinoensis*)、アフィス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフィス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフィス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリティニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルトム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleuciae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capulinia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneosephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*Chrysomphalus aonidum*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccomytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・キテンデニ (*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaaphorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ジウラフィス属種 (*Diuraphis* spp.)、ドラリス属種 (*Doralis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムボアスカ属種 (*Empoasca* spp.)、例えば、エムボアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムボアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エムボアスカ・マリグナ (*Em*

10

20

30

40

50

poasca maligna)、エムボアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エムボアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属種 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカナム (*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura* spp.)、エウセリス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、フィオリニア属種 (*Fiorinia* spp.)、フルカスピス・オセアニカ (*Furcaspis oceanica*)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・ブルカシ (*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種 (*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium corni*) (= パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス属種 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、ロホレウカスピス・ジャポニカ (*Lopholeucaspis japonica*)、リコルマ・デリカツラ (*Lycorma delicatula*)、マクロシフム属種 (*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンズ (*Macrosteles facifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカニス (*Monelliopsis pecan*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotiana*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネオマスクェリア属種 (*Neomaskellia* spp.)、ネホテッチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ネチゴニセラ・スペクトラ (*Nettigoniella spectra*)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・ブラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属

10

20

30

40

50

種 (*Paratrioza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivenae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、ペルクンシエラ属種 (*Perkinsiella* spp.)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、プロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロンギスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ブルビナリア属種 (*Pulvinaria* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidotus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランズレギアエ (*Quadraspidotus juglansregiae*)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Quadraspidotus ostreaeformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidotus perniciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシフム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxycanthae*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクタ (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミナム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus articulatus*)、シファ・フラバ (*Siphia flava*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属種 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセファ

10

20

30

40

50

ラ・フェスチナ (*Stictoccephala festina*)、シホニヌス・フィリ
 レアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシ
 ス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴノセフェラ属種 (*Tetra-
 gonocephala* spp.)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tino-
 callis caryaefoliae*)、トマスビス属種 (*Tomaspis* sp
 p.)、トキソプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、例えば、トキソプテラ・
 アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキソプテラ・シトリシズス
 (*Toxoptera citricidus*)、トリアレウロデス・バボラリオルム (*Trialeu-
 rodes vaporariorum*)、トリオザ属種 (*Trioza*
 spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza diospyri*)、チ
 フロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ウナスビス属種 (*Unaspis*
 spp.)、ピテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種
 (*Zygina* spp.) ;

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アエリア属種 (*Aelia* s
 pp.)、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属
 種 (*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)
 、ブリスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris*
 spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリ
 ウス属種 (*Cavelerius* spp.)、シメキス属種 (*Cimex* spp.)
 、例えば、シメキス・アドジュンクツス (*Cimex adjunctus*)、シメキス
 ・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクツラリウス (*C
 imex lectularius*)、シメキス・ピロセルス (*Cimex pilos
 ellus*)、コラリア属種 (*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジル
 ツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ビペリス (*Dasynu
 s piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatu
 s*)、ジコノコリス・ヘウエッチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデ
 ルクス属種 (*Dysdercus* spp.)、エウスキスツス属種 (*Euschist
 us* spp.)、例えば、エウスキスツス・ヘロス (*Euschistus hero
 s*)、エウスキスツス・セルプス (*Euschistus servus*)、エウスキス
 ツス・トリスチグムス (*Euschistus tristigmus*)、エウスキスツ
 ス・バリオラリウス (*Euschistus variolararius*)、エウリデマ属
 種 (*Eurydema* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* sp
 p.)、ハリオモルファ・ハリス (*Halymomorpha halys*)、ヘリオバル
 チス属種 (*Heliopeltis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horci
 as nobilellus*)、レプトコリサ属種 (*Leptocorisa* spp.
)、レプトコリサ・バリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、
 レプトグロスス・オッシデンタリス (*Leptoglossus occidental
 is*)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*
)、リゴコリス属種 (*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌ
 ス (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)
 、例えば、リグス・エリス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Ly
 gus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolari
 s*)、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、メガコ
 プタ・クリブラリア (*Megacopta cribraria*)、ミリダエ (*Miri
 dae*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonion atratum*)、ネザ
 ラ属種 (*Nezara* spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (*Nezara vir
 idula*)、ニシウス属種 (*Nysius* spp.)、オエバルス属種 (*Oebal
 us* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*P
 iesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.
)、例えば、ピエゾドルス・ギイルジニイ (*Piezodorus guildini*

)、ブサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.) ;

ハチ目 (*Hymenoptera*) の、例えば、アクロミルメキス属種 (*Acromyrmex* spp.)、アタリア属種 (*Athalia* spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ属種 (*Atta* spp.)、カムボノツス属種 (*Camponotus* spp.)、ドリコベスブラ属種 (*Dolichovespula* spp.)、ジブリオン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジブリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカムパ・テストジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、リネピテマ (イリジオミルメキス) ・フミレ (*Linepithema (Iridiomyrmex) humile*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラトレキナ属種 (*Paratrechina* spp.)、パラベスブラ属種 (*Paravespula* spp.)、ブラギオレピス属種 (*Plagiolepis* spp.)、シレキス属種 (*Sirex* spp.)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属種 (*Tapinoma* spp.)、テクノミルメキス・アルビペス (*Technomyrmex albipes*)、ウロセルス属種 (*Urocerus* spp.)、ベスパ属種 (*Vespa* spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (*Vespa crabro*)、ワスマンニア・アウロプンクタタ (*Wasmannia auropunctata*)、キセリス属種 (*Xeris* spp.) ;

ワラジムシ目 (*Isopoda*) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*) ;

シロアリ目 (*Isoptera*) の、例えば、コプトテルメス属種 (*Coptotermes* spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)、コルニテルメス・クムランス (*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属種 (*Cryptotermes* spp.)、インシシテルメス属種 (*Incisitermes* spp.)、カロテルメス属種 (*Kalotermes* spp.)、マイクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、ナスチテルメス属種 (*Nasutitermes* spp.)、オドントテルメス属種 (*Odontotermes* spp.)、ポロテルメス属種 (*Porotermes* spp.)、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes* spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*) ;

チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジヨル (*Acrornicta major*)、アドキソフィエス属種 (*Adoxophyes* spp.)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属種 (*Alabama* spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナルシア属種 (*A*

10

20

30

40

50

narsia spp.)、アンチカルシア属種 (*Anticarsia* spp.)、
 例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、
 アルギロプロセ属種 (*Argyroploce* spp.)、アウトグラフィ属種 (*Autographa* spp.)、
 パラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブラストデクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボル
 ボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブクラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberielia*)、
 ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ブッセオラ属種 (*Busseola* spp.)、カコ
 エシア属種 (*Cacoecia* spp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、
 カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルポシ
 ナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトピア・ブル
 マタ (*Cheimatobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo* spp.)
 、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプ
 レッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Choreutis pariana*)、コリス
 トネウラ属種 (*Choristoneura* spp.)、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcites*)、
 クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロ
 セルス属種 (*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリス
 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cnephasia* spp.)、
 コノボモルファ属種 (*Conopomorpha* spp.)、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus* spp.)、
 コピタルシア属種 (*Copitarsia* spp.)、シジア属種 (*Cydia* spp.)、例えば、
 シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、
 ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*)、ジアファニア属種 (*Diaphania* spp.)、
 ジバロブシス属種 (*Diparopsis* spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*)、
 エアリアス属種 (*Earias* spp.)、エクジトロファ・アウ
 ランチウム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモバルプス・リゲ
 ノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリ
 ナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*Ephestia* spp.)、
 例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、
 エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア
 属種 (*Epinothia* spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphyas postvittana*)、
 エランニス属種 (*Erannis* spp.)、エルスコビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana*)、
 エチエラ属種 (*Etiella* spp.)、エウドシマ属種 (*Eudocima* spp.)、エ
 ウリア属種 (*Eulia* spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ (*Eupoecilia ambiguella*)、
 エウプロクチス属種 (*Euproctis* spp.)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、
 エウキソア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*Feltia* spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、
 グラシ
 ラリア属種 (*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属種 (*Grapholitha* spp.)、
 例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholitha molesta*)、
 グラホリタ・ブルニボラ (*Grapholitha prunivora*)、ヘ
 ジレプタ属種 (*Hedylecta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、
 例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、
 ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチ
 ス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、
 ホフマンノフィラ・ブセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)

10

20

30

40

50

annophila pseudospretella)、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パ
 デラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ランピデス属種 (*Lampides*
 spp.)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、ラスペイレシア・モレ
 スタ (*Laspeyresia molesta*)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera*
 spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リト
 コレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*) 10
 、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア
 属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albico*
 sta)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア
 ・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia*
 spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ
 ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Amestrea brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis le*
 da)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis* 20
 obviella)、ミチムナ・セバラタ (*Mythimna separata*)、
 ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属
 種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketicus* spp.
)、オンフィサ属種 (*Omphisa* spp.)、オペロフテラ属種 (*Operoph*
 tera spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Ortha*
 ga spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オスト
 リニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フランメア
 (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペ
 クチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッ
 シピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属 30
 種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorim*
 aea spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea*
 operculella)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis*
 citrella)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.
)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter* b
 lancardella)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonoryc*
 ter crataegella)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば
 、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Plat*
 ynota stultana)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia in*
 terpunctella)、プルシア属種 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キ 40
 シロステラ (*Plutella xylostella*) (= プルテラ・マクリペンニス
 (*Plutella maculipennis*))、プライス属種 (*Prays* sp
 p.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プロトバルセ属種 (*Prot*
 oparce spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseudaletia* spp.)
 、例えば、プセウダレチア・ウニプンクタ (*Pseudaletia unipunct*
 a)、プセウドプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia include*
 ns)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキブル
 シア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobi*
 us spp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (*Schoenobi*
 us bipunctifer)、シルボファガ属種 (*Scirpophaga* spp. 50

)、例えば、シルポファガ・インノタタ (*Scirpophaga innotata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Sesamia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スパルガノチス属種 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・プラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ステノマ属種 (*Stenomoma* spp.)、ストモプテリクス・スブセシベラ (*Stomopteryx subsecivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、タウメトポエア属種 (*Thaumetopoea* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリクス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルスシア属種 (*Trichoplusia* spp.)、例えば、トリコプルスシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ピラコラ属種 (*Virachola* spp.) ;

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Achetia domesticus*)、ジクロプルス属種 (*Dichroplus* spp.)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属種 (*Locusta* spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (*Locusta migratoria*)、メラノプルス属種 (*Melanoplus* spp.)、例えば、メラノプルス・デバスタトル (*Melanoplus devastator*)、パラトランクス・ウスリエンシス (*Paratlanticus ussuriensis*)、スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) ;

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

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

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレキス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*) ;

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、カエタナホトリプス・レエウエニ (*Ch*

aetanaphothrips leeuweni)、ドレパノトリプス・レウテリ(Drepanothrips reuteri)、エンネオトリプス・フラベンス(Enneothrips flavens)、フランクリニエラ属種(Frankliniella spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ(Frankliniella fusca)、フランクリニエラ・オッシデンタリス(Frankliniella occidentalis)、フランクリニエラ・スクルトゼイ(Frankliniella schultzei)、フランクリニエラ・トリチシ(Frankliniella tritici)、フランクリニエラ・バシニイ(Frankliniella vaccini)、フランクリニエラ・ウィリアムシ(Frankliniella williamsi)、ハプロトリプス属種(Haplothrips spp.)、ヘ
 リオトリプス属種(Heliothrips spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス(Hercinothrips femoralis)、カコトリプス属種(Kakothrips)、リピホロトリプス・クルエンタツス(Rhipiphorothrips cruentatus)、シルトトリプス属種(Scirtothrips spp.)、タエニトリプス・カルダモミ(Taeniothrips cardamomi)、トリプス属種(Thrips spp.)、例えば、トリプス・パルミ(Thrips palmi)、トリプス・タバシ(Thrips tabaci);

シミ目(Zygentoma (=Thysanura))の、例えば、クテノレピスマ属種(Ctenolepisma spp.)、レピスマ・サッカリナ(Lepisma saccharina)、レスピモデス・インクイリヌス(Lepismodes inquilinus)、テルモビア・ドメスチカ(Thermobia domestica);

コムカデ綱(Symphyla)の、例えば、スクチゲレラ属種(Scutigere
 lla spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ(Scutigere
 lla immaculata);

軟体動物門(Mollusca)の害虫、例えば、ニマイガイ綱(Bivalvia)の、例えば、ドレイセナ属種(Dreissena spp.);及び、さらに、

マキガイ綱(Gastropoda)の、例えば、アリオン属種(Arion spp.)、例えば、アリオン・アテル・ルフス(Arion ater rufus)、ピオムファラリア属種(Biomphalaria spp.)、ブリヌス属種(Bulinus spp.)、デロセラス属種(Deroceras spp.)、例えば、デロセラス・ラエベ(Deroceras laeve)、ガルバ属種(Galba spp.)、リムナエア属種(Lymnaea spp.)、オンコメラニア属種(Oncomelania spp.)、ポマセア属種(Pomacea spp.)、スクシネア属種(Succinea spp.);

線形動物門(Nematoda)の植物害虫(即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレンクス属種(Aglenchus spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ(Aglenchus agricola)、アングイナ属種(Anguina spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ(Anguina tritici)、アフエレンコイデス属種(Aphelenchoides spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス(Aphelenchoides arachidis)、アフエレンコイデス・フラガリアエ(Aphelenchoides fragariae)、ベロノライムス属種(Belonolaimus spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス(Belonolaimus gracilis)、ベロノライムス・ロンギカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)、ベロノライムス・ノルトニ(Belonolaimus nortoni)、ブルサフェレンクス属種(Bursaphelenchus spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス(Bursaphelenchus cocophilus)、ブルサフェレンクス・エレムス(Bursaphelenchus eremus)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス(Bursaphelenchus xylophilus)、カコバウルス属

10

20

30

40

50

種 (*Cacopaurus* spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノブラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノブラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Criconemooides* spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemooides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemooides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemooides ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、例えば、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコドルス属種 (*Dolichodorus* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystra*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemooides* spp.)、ヘミシクリオホラ属種 (*Hemicycliophora* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycines*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ヒルスクマニエラ属種 (*Hirschmaniella* spp.)、ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longidorus* spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、例えば、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコップス属種 (*Nacobbus* spp.)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus* spp.)、パラロンギドルス属種 (*Paralongidorus* spp.)、パラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus* spp.)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus* spp.)、例えば、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラチレンクス属種 (*Paratylenchus* spp.)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus* spp.)、プシレンクス属種 (*Psilenchus* spp.)、プンクトデラ属種 (*Punctodera* spp.)、クイニスルシウス属種 (*Quinislucius* spp.)、ラドホルス属種 (*Radopholus* spp.)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus* spp.)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus* spp.)、スクテロネマ属種 (*Scutellonema* spp.)、スバングイナ属種 (*Subanguina* spp.)、トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス (*Trichodorus obtusus*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、例えば、チレンコリンクス

10

20

30

40

50

・アンヌラツス (*Tylenchorhynchus annulatus*)、チレンクルス属種 (*Tylenchulus spp.*)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema spp.*)、例えば、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)。

【0230】

式 (I) で表される化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (*microbicide*) 若しくは除雄剤 (*gametocide*) として、例えば、殺菌剤 (*fungicide*)、抗真菌剤 (*antimycotic*)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤 (これは、ウィロイドに対する作用薬も包含する) としても使用し得るか、又は、MLO (マイコプラズマ様生物) 及び RLO (リケッチア様生物) に対する作用薬としても使用し得る。それらは、適切な場合には、別の活性化化合物を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

10

【0231】

製剤

本発明は、さらに、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいる、殺有害生物剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態 (例えば、灌注液、滴下液及び散布液) にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる殺有害生物剤、及び/又は、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油 (例えば、ナタネ油、ヒマワリ油)、鉱油 (例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル (例えば、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル)、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び/又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び/又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩 (例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素二アンモニウム)、及び/又は、保持促進剤 (*retention promoter*) (例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアールポリマー)、及び/又は、湿潤剤 (例えば、グリセロール)、及び/又は、肥料 (例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料) を含有する。

20

【0232】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである: 水溶性液剤 (SL)、乳剤 (EC)、水中油型エマルジョン剤 (EW)、懸濁製剤 (SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤 (WG)、顆粒剤 (GR)、及び、カプセル製剤 (*capsule concentrates*) (CS); これらの製剤型及び別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている: *Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173* (作製元: the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576)。該製剤は、式 (I) で表される1種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性化化合物を含有する。

30

40

【0233】

好ましいのは、補助剤 (例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤 (*spontaneity promoter*)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤 (*frost protection agent*)、殺生物剤、増粘剤及び/又は他の補助剤 (例えば、アジュバント) など) を含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的効果を高める成分であって、その成分自体は生物学的効果を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡張 (*spreading*)、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

50

【0234】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式（I）で表される化合物を補助剤（例えば、増量剤、溶媒及び/若しくは固体担体、並びに/又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤）と混合させることにより製造する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

【0235】

使用する補助剤は、式（I）で表される化合物の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態（例えば、即時使用可能な（ready-to-use）殺有害生物剤、例えば、散布液又は種子粉衣製品）に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び/又生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

10

【0236】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである： 芳香族及び非芳香族の炭化水素類（例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類）、アルコール類及びポリオール類（これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び/又は、エステル化されていてもよい）、ケトン類（例えば、アセトン、シクロヘキサノン）、エステル類（これは、脂肪類及び油類を包含する）及び（ポリ）エーテル類、単純アミン類及び置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類）、及び、ラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）。

20

【0237】

使用する増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒は、本質的に以下のものである： 芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、及び、さらに、水。

30

【0238】

原則として、適切な全ての溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、及び、水である。

【0239】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。適切な担体としては、さらに特定のには、以下のものを挙げることができる： 例えば、アンモニウム塩、及び、微粉碎された天然岩石、例えば、カオリン、アルミナ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、微粉碎された合成岩石、例えば、高分散シリカ、酸化アルミニウム、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及び/又は、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシの穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

40

50

【0240】

液化ガスの増量剤又は溶媒を使用することも可能である。特に適している増量剤又は担体は、標準温度及び大気圧下では気体である増量剤又は担体、例えば、エアロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、及び、さらに、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0241】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び／若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである： ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリアルフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリアルスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式（I）で表される化合物のうちの1種類及び／又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

10

20

【0242】

該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に存在させ得るさらなる補助剤としては、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などがある。

【0243】

存在させ得るさらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び／若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤である。さらに、泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

30

【0244】

さらにまた、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる補助剤は、鉱油及び植物油であり得る。

【0245】

適切な場合には、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式（I）で表される化合物は、製剤を目的として通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

40

【0246】

有用な保持促進剤には、動的表面張力を低減させる全ての物質（例えば、スルホコハク酸ジオクチル）又は粘弾性を増大させる全ての物質（例えば、ヒドロキシプロピルグアールポリマー）が包含される。

【0247】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬活性化合物の浸透を向上させるた

50

めに典型的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、（一般には、水性の）施用液から、及び/又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性化合物のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献（Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152）に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナツ脂肪エトキシレート（coconut fatty ethoxylate）（10）若しくはイソトリデシルエトキシレート（12）、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート（15）、又は、アンモニウム塩及び/若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げることができる。

10

【0248】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.000000001重量%～98重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.01重量%～95重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、最も好ましくは、0.5重量%～90重量%の式（I）で表される化合物を含んでいる。

【0249】

該製剤（特に、殺有害生物剤）から調製された使用形態の中の式（I）で表される化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態中の式（I）で表される化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.000000001重量%～95重量%の式（I）で表される化合物、好ましくは、0.00001重量%～1重量%の式（I）で表される化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。

20

【0250】

混合物

式（I）で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、又は、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤（microbiological agent）、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤（phytonic）、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質及び/又は植物成長調節剤との混合物において使用することもできる。さらに、この種の活性化合物組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、及び/又は、非生物的要因（例えば、高温又は低温）に対する耐性、湯水に対する耐性又は水中若しくは土壌中の塩分の含有量の上昇に対する耐性を向上させることが可能である。さらにまた、開花性能及び結果性能を改善することも可能であり、発芽能力及び根の発達を最適化することも可能であり、収穫を容易にすることも可能であり、収穫高を向上させることも可能であり、成熟に影響を及ぼすことも可能であり、収穫された生産物の品質及び/若しくは栄養価を向上させることも可能であり、収穫された生産物の貯蔵寿命を長くすることも可能であり、並びに/又は、収穫された生産物の加工性を改善することも可能である。

30

40

【0251】

さらに、式（I）で表される化合物は、別の活性化合物又は情報化学物質（例えば、誘引剤、及び/又は、鳥忌避剤、及び/又は、植物活性化剤、及び/又は、成長調節剤、及び/又は、肥料）との混合物の中に存在させることもできる。同様に、式（I）で表される化合物は、植物の特性（例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質）を向上させるために使用することも可能である。

【0252】

本発明による特定の実施形態では、式（I）で表される化合物は、製剤の中に、又は、そのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物（好ましくは、以下に記

50

載されている化合物)と混合された状態で存在している。

【0253】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。

【0254】

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「“The Pesticide Manual”, 16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」)。その分類は、本特許出願の出願時点において適用できる「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいている。

10

【0255】

(1) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害薬、例えば、

カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、及び、キシリルカルブ；又は、

20

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス - メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロルボス / D D V P、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、O - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン - メチル、パラチオン - メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テムホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン。

30

【0256】

(2) GABA 制御塩化物チャンネル遮断薬、例えば、

シクロジエン - 有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系 (フィプロール系)、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル。

40

【0257】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター、例えば、

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シペルメトリン、アルファ - シペルメトリン、ベータ - シペルメトリン、シータ - シペルメトリン、ゼータ - シペルメトリン、シフェノトリン [(1R) - トランス異性体]、デルタメトリン、エムベントリン [(EZ) - (1R) 異性体]、エスフェンバレレート、エトフ

50

エンブロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ-フルバリネート、ハルフェンブロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)-トランス異性体〕、プラレトリン、ピレトリン類(除虫菊(pyrethrum))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)異性体〕、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

DDT；又は、メトキシクロル。

【0258】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)競合的モジュレーター、例えば、

ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、

ニコチン；又は、

スルホキサフロル、又は、フルピラジフロル。

【0259】

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)アロステリックモジュレーター、例えば、

スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド。

【0260】

(6) グルタミン酸制御塩化物チャンネル(GluCl)アロステリックモジュレーター、例えば、

アベルメクチン系/ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン。

【0261】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、

幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロブレン、キノブレン、及び、メトブレン；又は、

フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン。

【0262】

(8) 種々の特定されていない(多部位)阻害薬、例えば、

ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル；又は、クロロピクリン；又は、フッ化スルフリル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石、又は、イソシアン酸メチル生成物質、例えば、ダゾメット(diazomet)及びメタム。

【0263】

(9) 弦音器官モジュレーター、例えば、

ピメトロジン；又は、フロニカミド。

【0264】

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、

クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロピダジン；又は、エトキサゾール。

【0265】

(11) 昆虫中腸膜の微生物ディスラプター、例えば、

バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス(Bacillus thuringiensis subspecies israelensis)、バシルス・スファエリクス(Bacillus sphaericus)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ(Bacillus thuringiensis subspecies aizawai)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ(Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス(Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis)、及び、Bt植物

10

20

30

40

50

タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、VIP3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

【0266】

(12) ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター、例えば、

ジアフェンチウロン；又は、

有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、

プロパルギット；又は、テトラジホン。

10

【0267】

(13) プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルアミド。

【0268】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬、例えば、

ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップ-ナトリウム。

【0269】

(15) キチン生合成の阻害薬(タイプ0)、例えば、

ピストリフルロン、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、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン。

20

【0270】

(16) キチン生合成の阻害薬(タイプ1)、例えば、

ブプロフェジン。

【0271】

(17) 脱皮ディスラプター(特に、双翅目の場合)、例えば、

シロマジン。

【0272】

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、

クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド。

30

【0273】

(19) オクトパミン受容体作動薬、例えば、

アミトラズ。

【0274】

(20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、例えば、

ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム。

【0275】

(21) ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬、例えば、

METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、ロテノン(Derris)。

40

【0276】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、

インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン。

【0277】

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、

テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト。

【0278】

50

(24) ミトコンドリア複合体 I V 電子伝達阻害薬、例えば、ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛；又は、シアン化物、シアン化カルシウム、シアン化カリウム、及び、シアン化ナトリウム。

【0279】

(25) ミトコンドリア複合体 I I 電子伝達阻害薬、例えば、
- ケトニトリル誘導体、例えば、シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン、及び、カルボキシアニリド、例えば、ピフルブミド。

【0280】

(28) リアノジン受容体モジュレーター、例えば、
ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、及び、フルベンジアミド。

【0281】

さらなる活性化合物、例えば、アフィドピロペン、アフォキシレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロフラニリド (brofl anilide)、プロモプロピレート、キノメチオナート、クロロプラレトリン (chloroprallethrin)、氷晶石 (cryolite)、シクラニリプロール、シクロキサプリド (cycloxaprid)、シハロジアミド (cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、ジコホル、
- メトフルトリン (epsilon metofluthrin)、
- モムフルトリン (epsilon momfluthrin)、フロメトキン、フルアザインドリジン (fluaza indolizine)、フルエンスルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロピン、フルフィプロール、フルヘキサホン (fluhexafon)、フルオピラム、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノジド (fufenozide)、グアジピル (guadipyr)、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、
- ビフェントリン、
- テフルトリン、ロチラネル (lotilaner)、メベルフルトリン、パイコングディング (paichongding)、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロピン、スピロブジクロフェン (spirobudiclofen)、テトラメチルフルトリン、テトランリプロール (tetraniliprole)、テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、
チオキサザフェン、チオフルオキシメート (thiofluoximate)、トリフルメゾピリム、及び、ヨードメタン；さらに、バシルス・フィルムス (Bacillus firmus) に基づく調製物 (I - 1582 , BioNeem , Votivo)、
及び、以下の化合物：
1 - { 2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル } - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - アミン (WO2006/043635 から既知) (CAS 885026 - 50 - 6)、{ 1' - [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - フルオロスピロ [インドール - 3 , 4' - ピペリジン] - 1 (2 H) - イル } (2 - クロロピリジン - 4 - イル) メタノン (WO2003/106457 から既知) (CAS 637360 - 23 - 7)、2 - クロロ - N - [2 - { 1 - [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO2006/003494 から既知) (CAS 872999 - 66 - 1)、3 - (4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (WO2010052161 から既知) (CAS 1225292 - 17 - 0)、3 - (4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 2 - オキソ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 4 - イル エチルカルボネート (EP2647626 から既知) (CAS - 1440516 - 42 - 6)、4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) - 5 - フルオロピリミジン (WO2004/099160 から既知) (CAS 792914

10

20

30

40

50

- 58 - 0)、PF1364 (JP2010/018586から既知) (CAS Reg. No. 1204776-60-2)、N-[(2E) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] ピリジン - 2 (1H) - イリデン] - 2, 2, 2 - トリフルオロアセトアミド (WO2012/029672から既知) (CAS 1363400-41-2)、(3E) - 3 - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オン (WO2013/144213から既知) (CAS 1461743-15-6)、N - [3 - (ベンジルカルバモイル) - 4 - クロロフェニル] - 1 - メチル - 3 - (ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO2010/051926から既知) (CAS 1226889-14-0)、5 - プロモ - 4 - クロロ - N - [4 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル) フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド (CN103232431から既知) (CAS 1449220-44-3)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - メチル - N - (シス - 1 - オキシド - 3 - チエタニル) ベンズアミド、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - メチル - N - (トランス - 1 - オキシド - 3 - チエタニル) ベンズアミド及び4 - [(5S) - 5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - メチル - N - (シス - 1 - オキシド - 3 - チエタニル) ベンズアミド (WO2013/050317A1から既知) (CAS 1332628-83-7)、N - [3 - クロロ - 1 - (3 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - N - エチル - 3 - [(3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) スルフィニル] プロパンアミド、(+) - N - [3 - クロロ - 1 - (3 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - N - エチル - 3 - [(3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) スルフィニル] プロパンアミド及び(-) - N - [3 - クロロ - 1 - (3 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル] - N - エチル - 3 - [(3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) スルフィニル] プロパンアミド (WO2013/162715A2、WO2013/162716A2、US2014/0213448A1から既知) (CAS 1477923-37-7)、5 - [[(2E) - 3 - クロロ - 2 - プロペン - 1 - イル] アミノ] - 1 - [2, 6 - ジクロロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 4 - [(トリフルオロメチル) スルフィニル] - 1H - ピラゾール - 3 - カルボニトリル (CN101337937Aから既知) (CAS 1105672-77-2)、3 - プロモ - N - [4 - クロロ - 2 - メチル - 6 - [(メチルアミノ) チオキソメチル] フェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド、(Liudai ben jia x u a n a n、CN103109816Aから既知) (CAS 1232543-85-9); N - [4 - クロロ - 2 - [[(1, 1 - ジメチルエチル) アミノ] カルボニル] - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 3 - (フルオロメトキシ) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO2012/034403A1から既知) (CAS 1268277-22-0)、N - [2 - (5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO2011/085575A1から既知) (CAS 1233882-22-8)、4 - [3 - [2, 6 - ジクロロ - 4 - [(3, 3 - ジクロロ - 2 - プロペン - 1 - イル) オキシ] フェノキシ] プロポキシ] - 2 - メトキシ - 6 - (トリフルオロメチル) ペリミジン (CN101337940A) (CAS 1108184-52-6から既知); (2E) - 及び2 (Z) - 2 - [2 - (4 - シアノフェニル) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン] - N - [4 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] ヒドラジンカルボキサミド (CN101715774Aから既知) (CAS 1232543-85-9); シクロプロパンカルボン酸3 - (2, 2 - ジクロロエチニル) - 2, 2 - ジメチル - 4 - (1H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) フェニルエステル (CN103524422Aから既知

10

20

30

40

50

) (CAS 1542271-46-4); (4aS)-7-クロロ-2,5-ジヒドロ-2-[[(メトキシカルボニル) [4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]アミノ]カルボニル]インデノ[1,2-e][1,3,4]オキサジアジン-4a(3H)-カルボン酸メチルエステル(CN102391261Aから既知)(CAS 1370358-69-2); 6-デオキシ-3-O-エチル-2,4-ジ-O-メチル-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエトキシ)フェニル]-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート]-L-マンノピラノース(US2014/0275503A1から既知)(CAS 1181213-14-8); 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(CAS 1253850-56-4)、(8-アンチ)-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(CAS 933798-27-7)、(8-シン)-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(WO2007040280A1、WO2007040282A1から既知)(CAS 934001-66-8)、及び、N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)チオ]プロパンアミド(WO2015/058021A1、WO2015/058028A1から既知)(CAS 1477919-27-9)。

【0282】

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual”(16th Ed., British Crop Protection Council)」に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「http://www.lanwood.net/pesticides」)。

【0283】

クラス(1)~(15)に記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することができる。クラス(1)~(15)に記載されている全ての殺菌剤混合成分は、場合により、互変異性体形態を包含し得る。

【0284】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.001)シプロコナゾール、(1.002)ジフェノコナゾール、(1.003)エポキシコナゾール、(1.004)フェンヘキサミド、(1.005)フェンプロピジン、(1.006)フェンプロピモルフ、(1.007)フェンピラザミン、(1.008)フルキンコナゾール、(1.009)フルトリアホル、(1.010)イマザリル、(1.011)硫酸イマザリル、(1.012)イブコナゾール、(1.013)メトコナゾール、(1.014)ミクロブタニル、(1.015)パクロブトラゾール、(1.016)プロクロラズ、(1.017)プロピコナゾール、(1.018)プロチオコナゾール、(1.019)ピリソキサゾール、(1.020)スピロキサミン、(1.021)テブコナゾール、(1.022)テトラコナゾール、(1.023)トリアジメノール、(1.024)トリデモルフ、(1.025)トリチコナゾール、(1.026)(1R,2S,5S)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.027)(1S,2R,5R)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.028)(2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-2,2-ジクロロシクロプロ

ピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール (1 . 029) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1 . 030) (2R) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1 . 031) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1 . 032) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1 . 033) (2S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1 . 034) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1 . 035) (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1 . 036) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1 . 037) 1 - ({(2R, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル} メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1 . 038) 1 - ({(2S, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル} メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1 . 039) 1 - {[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1 . 040) 1 - {[rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1 . 041) 1 - {[rel(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1 . 042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 045) 2 - [(2R, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 046) 2 - [(2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 047) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 048) 2 - [(2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 049) 2 - [(2S, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1 . 050) 2 - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 -

10

20

30

40

50

ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H -
 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.051) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2,
 4 - ジクロロフェノキシ)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イ
 ル)プロパン - 2 - オール、(1.052) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノ
 キシ)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オ
 ール、(1.053) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル
)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール
 、(1.054) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フ
 エニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ペンタン - 2 - オール、
 (1.055) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェ
 ニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール、(1
 .056) 2 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル
)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾ
 ール - 3 - チオン、(1.057) 2 - { [rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェ
 ニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4
 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.058) 2 - { [r
 el(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル
)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾ
 ール - 3 - チオン、(1.059) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) -
 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル)シクロペンタノ
 ール、(1.060) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル
) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1,
 2, 4 - トリアゾール、(1.061) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [rel(2
 R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキ
 シラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.062) 5 - (ア
 リルスルファニル) - 1 - { [rel(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) -
 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2,
 4 - トリアゾール、(1.063) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (1, 1,
 2, 2 - テトラフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル -
 N - メチルイミドホルムアミド、(1.064) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { [3
 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エ
 チル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.065) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 -
 { [3 - (2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロポキシ)フェニル]スルファニル}フェ
 ニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.066) N' - (2, 5 - ジ
 メチル - 4 - { [3 - (ペンタフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェ
 ニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.067) N' - (2, 5 - ジ
 メチル - 4 - { 3 - [(1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル)スルファニル]フェ
 ノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.068) N' - (2,
 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)スルファニル]フ
 エノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.069) N
 ' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピル)ス
 ルファニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1
 .070) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(ペンタフルオロエチル)スル
 ファニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1
 .071) N' - (2, 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メ
 チルイミドホルムアミド、(1.072) N' - (4 - { [3 - (ジフルオロメトキシ)フ
 エニル]スルファニル} - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミ
 ドホルムアミド、(1.073) N' - (4 - { 3 - [(ジフルオロメチル)スルファニル
]フェノキシ} - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルム
 アミド、(1.074) N' - [5 - プロモ - 6 - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン -

10

20

30

40

50

2 - イルオキシ) - 2 - メチルピリジン - 3 - イル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.075) N' - { 4 - [(4, 5 - ジクロロ - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) オキシ] - 2, 5 - ジメチルフェニル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.076) N' - { 5 - プロモ - 6 - [(1R) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.077) N' - { 5 - プロモ - 6 - [(1S) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.078) N' - { 5 - プロモ - 6 - [(シス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.079) N' - { 5 - プロモ - 6 - [(トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.080) N' - { 5 - プロモ - 6 - [1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド。

10

【0285】

(2) 複合体 I 又は複合体 II における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2.001) ベンゾピンジフルピル、(2.002) ピキサフェン、(2.003) ポスカリド、(2.004) カルボキシン、(2.005) フルオピラム、(2.006) フルトラニル、(2.007) フルクキサピロキサド、(2.008) フラメトピル、(2.009) イソフエタミド、(2.010) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9S)、(2.011) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9R)、(2.012) イソピラザム (アンチ - エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9SR)、(2.013) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 (1RS, 4SR, 9RS) とアンチ - エピマー性ラセミ化合物 (1RS, 4SR, 9SR) の混合物)、(2.014) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9R)、(2.015) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9S)、(2.016) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9RS)、(2.017) ペンフルフェン、(2.018) ペンチオピラド、(2.019) ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)、(2.020) ピラジフルミド、(2.021) セダキサン、(2.022) 1, 3 - ジメチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.023) 1, 3 - ジメチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.024) 1, 3 - ジメチル - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.025) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [2' - (トリフルオロメチル) ピフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.026) 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) ベンズアミド、(2.027) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.028) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.029) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.030) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.031) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ -

20

30

40

50

1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 3 2) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 3 3) 5 , 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] オキシ } フェニル) エチル] キナゾリン - 4 - アミン、 (2 . 0 3 4) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 3 5) N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 3 6) N - (2 - tert - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 3 7) N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 3 8) N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 3 9) N - [(1 R , 4 S) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 0) N - [(1 S , 4 R) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 1) N - [1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 2) N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 3) N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 4) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 5) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 6) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 7) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 8) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 4 9) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 0) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 1) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 2) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 3) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 0 5 4) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル)

- 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.055) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.056) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド。

【0286】

(3) 複合体 III における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3.001) アメトクトラジン、(3.002) アミスルプロム、(3.003) アゾキシストロビン、(3.004) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3.005) クモキシストロビン、(3.006) シアゾファミド、(3.007) ジモキシストロビン、(3.008) エノキサストロビン、(3.009) ファモキサドン、(3.010) フェンアミドン、(3.011) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、(3.012) フルオキサストロビン、(3.013) クレソキシム - メチル、(3.014) メトミノストロビン、(3.015) オリサストロビン、(3.016) ピコキシストロビン、(3.017) ピラクロストロビン、(3.018) ピラメトストロビン、(3.019) ピラオキシストロビン、(3.020) トリフロキシストロビン、(3.021) (2E) - 2 - {2 - [(1E) - 1 - (3 - {[(E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル] オキシ} フェニル) エチリデン] アミノ} オキシ) メチル] フェニル} - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(3.022) (2E, 3Z) - 5 - {[1 - (4 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] オキシ} - 2 - (メトキシイミノ) - N, 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド、(3.023) (2R) - 2 - {2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル} - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.024) (2S) - 2 - {2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル} - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.025) (3S, 6S, 7R, 8R) - 8 - ベンジル - 3 - [(3 - [(イソブチリルオキシ) メトキシ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル} カルボニル) アミノ] - 6 - メチル - 4, 9 - ジオキソ - 1, 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート、(3.026) 2 - {2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル} - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.027) N - (3 - エチル - 3, 5, 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミド、(3.028) (2E, 3Z) - 5 - {[1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] オキシ} - 2 - (メトキシイミノ) - N, 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド。

【0287】

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.001) カルベンダジム、(4.002) ジエトフェンカルブ、(4.003) エタボキサム、(4.004) フルオピコリド、(4.005) ペンシクロン、(4.006) チアベンダゾール、(4.007) チオファネート - メチル、(4.008) ゾキサミド、(4.009) 3 - クロロ - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニルピリダジン、(4.010) 3 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、(4.011) 3 - クロロ - 5 - (6 - クロロピリジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン、(4.012) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.013) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.014) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.015) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4

10

20

30

40

50

. 016) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.017) 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.018) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.019) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.020) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.021) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.022) 4 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 3, 6 - ジメチルピリダジン、(4.023) N - (2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.024) N - (2 - ブロモフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、(4.025) N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン。

【0288】

(5) 多部位に活性を示し得る化合物、例えば、(5.001) ボルドー液、(5.002) カプタホール、(5.003) キャプタン、(5.004) クロロタロニル (chlorothalonil)、(5.005) 水酸化銅、(5.006) ナフテン酸銅、(5.007) 酸化銅、(5.008) 塩基性塩化銅、(5.009) 硫酸銅 (2+)、(5.010) ジチアノン、(5.011) ドジン、(5.012) ホルベット、(5.013) マンゼブ、(5.014) マンネブ、(5.015) メチラム、(5.016) メチラム亜鉛 (zinc metiram)、(5.017) オキシシン銅 (copper oxine)、(5.018) プロピネブ、(5.019) 硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.020) チウラム、(5.021) ジネブ、(5.022) ジラム。

【0289】

(6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6.001) アシベンゾラル - S - メチル、(6.002) イソチアニル、(6.003) プロベナゾール、(6.004) チアジニル。

【0290】

(7) アミノ酸及び/又はタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.001) シプロジニル、(7.002) カスガマイシン、(7.003) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.004) オキシテトラサイクリン、(7.005) ピリメタニル、(7.006) 3 - (5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン。

【0291】

(8) ATP 産生阻害薬、例えば、(8.001) シルチオファム。

【0292】

(9) 細胞壁合成阻害薬、例えば、(9.001) ベンチアバリカルブ、(9.002) ジメトモルフ、(9.003) フルモルフ、(9.004) イプロバリカルブ、(9.005) マンジプロパミド、(9.006) ピリモルフ (pyrimorph)、(9.007) パリフェナレート、(9.008) (2E) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、(9.009) (2Z) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン。

【0293】

50

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10.001)プロパモカルブ、(10.002)プロパモカルブ塩酸塩、(10.003)トルクロホス-メチル。

【0294】

(11) メラニン生合成阻害薬、例えば、(11.001)トリシクラゾール、(11.002)2,2,2-トリフルオロエチル{3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]ブタン-2-イル}カルバメート。

【0295】

(12) 核酸合成阻害薬、例えば、(12.001)ベナラキシル、(12.002)ベナラキシル-M(キララキシル)、(12.003)メタラキシル、(12.004)メタラキシル-M(メフェノキサム)。

10

【0296】

(13) シグナル伝達阻害薬、例えば、(13.001)フルジオキソニル、(13.002)イプロジオン、(13.003)プロシミドン、(13.004)プロキナジド、(13.005)キノキシフェン、(13.006)ピンクロゾリン。

【0297】

(14) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.001)フルアジナム、(14.002)メブチルジノカップ。

【0298】

(15) さらなる化合物、例えば、(15.001)アブシジン酸、(15.002)ベンチアゾール、(15.003)ベトキサジン、(15.004)カプシマイシン(capsimycin)、(15.005)カルボン、(15.006)キノメチオネート、(15.007)クフラネブ、(15.008)シフルフェナミド、(15.009)シモキサニル、(15.010)シプロスルファミド、(15.011)フルチアニル、(15.012)ホセチル-アルミニウム、(15.013)ホセチル-カルシウム、(15.014)ホセチル-ナトリウム、(15.015)イソチオシアン酸メチル、(15.016)メトラフェノン、(15.017)ミルディオマイシン、(15.018)ナタマイシン、(15.019)ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.020)ニトロタル-イソプロピル、(15.021)オキサモカルブ(oxamocarb)、(15.022)オキサチアピプロリン、(15.023)オキシフェンチン(oxyfenthin)、(15.024)ペンタクロロフェノール及び塩、(15.025)ホスホン酸及びその塩、(15.026)プロパモカルブ-ホセチレート(propamocarb-fosetyl ate)、(15.027)ピリオフェノン(クラザフェノン(chlaza fenone))、(15.028)テブフロキン、(15.029)テクロフタラム、(15.030)トルニファニド、(15.031)1-(4-{4-[(5R) - 5 - (2,6-ジフルオロフェニル) - 4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル] - 1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.032)1-(4-{4-[(5S) - 5 - (2,6-ジフルオロフェニル) - 4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル] - 1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.033)2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、(15.034)2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトロロン、(15.035)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル} - 1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.036)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル} - 1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エ

20

30

40

50

タノン、(15.037)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.038)2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾリン、(15.039)2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.040)2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.041)2-{2-[(7,8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]-6-フルオロフェニル}プロパン-2-オール、(15.042)2-{2-フルオロ-6-[(8-フルオロ-2-メチルキノリン-3-イル)オキシ]フェニル}プロパン-2-オール、(15.043)2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.044)2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニルメタンスルホネート、(15.045)2-フェニルフェノール及びその塩、(15.046)3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.047)3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.048)4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2-オール(互変異性形態:4-アミノ-5-フルオロピリミジン-2(1H)-オン)、(15.049)4-オキソ-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]酪酸、(15.050)5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-チオール、(15.051)5-クロロ-N'-フェニル-N'-[プロパ-2-イン-1-イル]チオフエン2-スルホヒドラジド、(15.052)5-フルオロ-2-[(4-フルオロベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.053)5-フルオロ-2-[(4-メチルベンジル)オキシ]ピリミジン-4-アミン、(15.054)9-フルオロ-2,2-ジメチル-5-(キノリン-3-イル)-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾオキサゼピン、(15.055)ブタ-3-イン-1-イル{6-[(Z)-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメート、(15.056)(2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチル、(15.057)フェナジン-1-カルボン酸、(15.058)3,4,5-トリヒドロキシ安息香酸プロピル、(15.059)キノリン-8-オール、(15.060)キノリン-8-オールスルフェート(2:1)、(15.061){6-[(Z)-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸tert-ブチル。

【0299】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

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

【0300】

生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(例えば、タンパク質及び二次代謝産物)などがある。

【0301】

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

10

20

30

40

50

成する細菌及び生物学的殺虫剤、殺菌剤又は殺線虫剤として作用する細菌などがある。

【0302】

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

バシルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) 株 FZB42 (DSM 231179)、又は、バシルス・セレウス (*Bacillus cereus*)、特に、バシルス・セレウス (*B. cereus*) 株 CNCM I-1562、又は、バシルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) 株 I-1582 (受託番号 CNCM I-1582)、又は、バシルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、株 GB34 (受託番号 ATCC 700814) 及び株 QST2808 (受託番号 NRRL B-30087)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*)、特に、株 GB03 (受託番号 ATCC SD-1397)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*) 株 QST713 (受託番号 NRRL B-21661)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*) 株 OST 30002 (受託番号 NRRL B-50421)、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス (*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (抗原型 H-14) 株 AM65-52 (受託番号 ATCC 1276)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ (*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株 ABTS-1857 (SD-1372)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ (*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 株 HD-1、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス (*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*) 株 NB 176 (SD-5428)、パステウリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種 (*Pasteuria spp.*) (口チレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*) 線虫) - PR3 (受託番号 ATCC SD-5834)、ストレプトミセス・ミクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) 株 AQ6121 (= QRD 31.013、NRRL B-50550)、ストレプトミセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) 株 AQ 6047 (受託番号 NRRL 30232)。

【0303】

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

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に、株 CON/M/91-8 (受託番号 DSM-9660)、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium spp.*)、特に、株 HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) として知られていた)、特に、株 KV01、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 / ATCC 90448)、メトスクニコウイア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に、株 NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paeecilomyces fumosoroseus*) (新規：イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に、株 IFPC 200613 又は株 Apopka 97 (受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス (*Paeecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス (*P. lilacinus*) 株 251 (AGAL 89/030550)、タラロミセス

・フラブス (*Talaromyces flavus*)、特に、株 V117b、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に、株 SC1 (受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*T. harzianum rifai*) T39 (受託番号 CNCM I-952)。

【0304】

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

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) 顆粒病ウイルス (GV)、コドリング (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV。

10

【0305】

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定の特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び菌類も、同様に含まれる。挙げることができる例は、以下のとおりである：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種 (*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、*Pseudomonas cepacia*) として知られていた)、ギガスポラ属種 (*Gigaspora* spp.) 又はギガスポラ・モノスポルム (*Gigaspora monosporum*)、グロムス属種 (*Glomus* spp.)、ラッカリア属種 (*Laccaria* spp.)、ラクトバシルス・ブクネリ (*Lactobacillus buchneri*)、パラグロムス属種 (*Paraglomus* spp.)、ピソリツス・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*)、*Pseudomonas* 属種 (*Pseudomonas* spp.)、リゾビウム属種 (*Rhizobium* spp.)、特に、リゾビウム・トリホリイ (*Rhizobium trifolii*)、リゾポゴン属種 (*Rhizopogon* spp.)、スクレロデルマ属種 (*Scleroderma* spp.)、スイルス属種 (*Suillus* spp.)、ストレプトミセス属種 (*Streptomyces* spp.)。

20

30

【0306】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物 (これは、タンパク質及び二次代謝産物を包含する) の例は、以下のものである：

ニンニク (*Allium sativum*)、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン (*azadirachtin*)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*)、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*)、アメリカアリタソウ (*Chenopodium anthelminticum*)、キチン、 *Armour-Zen*、セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*)、スギナ (*Equisetum arvense*)、 *Fortune Aza*、 *Fungastop*、 *Heads Up* (キノア (*Chenopodium quinoa*) サボニン抽出物)、除虫菊 (*pyrethrum/pyrethrins*)、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、 *Rega*

40

50

lia、(「RequiemTM Insecticide」)、ロテノン、リアニアノリアノジン、ヒレハリソウ(Symphytum officinale)、ヨモギギク(Tanacetum vulgare)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ(Tropaeolum majus)、セイヨウイラクサ(Urtica dioica)、Veratrin、セイヨウヤドリギ(Viscum album)、アブラナ科(Brassicaceae)抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。

【0307】

混合成分としての薬害軽減剤

式(I)で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセツト(-メキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール(-エチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン(-エチル)、メフェンピル(-ジエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N-({ 4-[(メチルカルバモイル)アミノ]フェニル } スルホニル)ベンズアミド(CAS 129531-12-0)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(CAS 71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(CAS 52836-31-4)などと組み合わせることができる。

10

【0308】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の部分进行处理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物(天然に発生している作物植物を包含する)のような全ての植物及び植物個体群、例えば、穀類(コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、ピーマン、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、ハウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物(Brassica oleracea)(例えば、キャベツ)及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(ここで、果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウである)などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物は、全ての成育段階、例えば、種子、実生、及び、幼植物(未成熟植物)から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などである。収穫された植物又は収穫された植物の部分、並びに、栄養繁殖器官(vegetative propagation material)及び生殖繁殖器官(generative propagation material)、例えば、挿穂(cutting)、塊茎、根茎、かき苗(slip)及び種子なども、植物の部分に包含される。

20

30

40

【0309】

式(I)で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、煙霧(fogging)、ばらまき、塗布、注入などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官(propagation material)の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

【0310】

50

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種及び植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的的方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種（遺伝子組換え生物）及びそれらの部分を処理する。用語「部分（parts）」又は「植物の部分（parts of plants）」又は「植物の部分（plant parts）」については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な植物品種又は使用されている慣習的な植物品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた、新しい特性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

10

【0311】

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

特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、湯水又は水中若しくは土壤中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開花能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び/又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵性及び/又は改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類）に対する植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する遺伝物質（例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIB、CryIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIF並びにそれらの組合せ）によって植物体内で形成された毒素による、害虫及び有害微生物（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類）に対する植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び/又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性（SAR）、システミン（systemin）、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び/又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の除草活性化化合物（例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシン）に対する植物の向上した耐性である（例えば、「PAT」遺伝子）。望まれる当該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。上記トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（ここで、該果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウである）などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

20

30

40

【0312】

作物保護 - 処理の種類

植物及び植物の部分は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散（spreading-on）、注

50

入、灌水（灌注（drenching））、点滴灌漑などによって、式（I）で表される化合物で直接処理するか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることによって処理し、また、繁殖器官（propagation material）の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理、液体種子処理、スラリー処理、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても処理する。さらに、式（I）で表される化合物を微量散布法（ultra-low volume method）によって施用することも可能であり、又は、該施用形態若しくは式（I）で表される化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

【0313】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用であり、このことは、式（I）で表される化合物を茎葉部に施用することを意味し、その場合、その処理頻度及び施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

10

【0314】

浸透移行性活性化合物の場合、式（I）で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。その場合、該植物は、その植物の生息環境に対して式（I）で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注（drenching）によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させる〔即ち、植物の成育場所（例えば、土壌、又は、水耕系）に式（I）で表される化合物の液体形態を含浸させる〕ことによって、又は、土壌施用〔即ち、本発明による式（I）で表される化合物を固体形態で（例えば、顆粒形態で）植物の成育場所に導入すること〕によって、達成することができる。水稲作物の場合には、これは、固体施用形態にある式（I）で表される化合物（例えば、粒剤として）を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

20

【0315】

種子の処理

植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。それにもかかわらず、種子の処理には、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が伴っている。かくして、植物の貯蔵中、播種後又は出芽後に殺有害生物剤を追加で施用することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性化合物によって植物自体に損傷を引き起こすことなく、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する活性化合物の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の殺有害生物剤を使用して種子の最適な保護を達成し、及び、さらに、発芽中の植物の最適な保護も達成するために、害虫抵抗性トランスジェニック植物又は害虫耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性又は殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

30

【0316】

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

40

【0317】

本発明は、さらに、種子及びその種子から生じた植物を害虫に対して保護するために種子を処理するための、式（I）で表される化合物の使用にも関する。

【0318】

本発明は、さらに、害虫に対して保護されるように、本発明による式（I）で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混

50

合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式(I)で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式(I)で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式(I)で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式(I)で表される化合物と混合成分が被膜の一部として又は被膜に加えられたさらなる1つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

【0319】

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

10

【0320】

式(I)で表される化合物が浸透移行的に作用する場合に生じる有利な点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなくに作物を直接処理する手間を省くことができる。

【0321】

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

【0322】

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

20

【0323】

さらに、式(I)で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することも可能であり、それによって、共生生物(例えば、根粒菌、菌根菌及び/又は内部寄生性の細菌若しくは菌類)によるコロニー形成が良好になり、及び/又は、窒素固定が最適化される。

【0324】

式(I)で表される化合物は、農業において、温室内で、森林で又は園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワ及びエンバク)、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、カノラ、ナタネ、ビート(例えば、テンサイ及び飼料用ビート)、ラッカセイ、野菜(例えば、トマト、キュウリ、インゲンマメ、アブラナ科野菜、タマネギ及びレタス)、果実植物、芝生及び観賞植物の種子である。穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネ、野菜類及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

30

【0325】

既に上記で記載したように、式(I)で表される化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、ポリペプチド(特に、殺虫特性及び/又は殺線虫特性を有するポリペプチド)の発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子を包含する。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は、バシルス(*Bacillus*)種、リゾビウム(*Rhizobium*)種、プセウドモナス(*Pseudomonas*)種、セラチア(*Serratia*)種、トリコデルマ(*Trichoderma*)種、クラビバクテル(*Clavibacter*)種、グロムス(*Glomus*)種又はグリオクラジウム(*Gliocladium*)種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種(*Bacillus* sp.)に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する。

40

【0326】

本発明に関連して、式(I)で表される化合物は、種子に対して施用する。該種子は、

50

好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子（例えば、プライミング）を使用することもできる。イネの種子の場合、イネ胚の特定の段階（鳩胸段階）に達するまで、例えば水中に、浸漬させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が刺激され、及び、出芽がより均一になる。

【0327】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式（I）で表される化合物の量及び/又はさらなる添加剤の量を選択することに対して、一般的に注意しなくてはならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性化合物の場合に、確実に実施しなければならない。

【0328】

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

【0329】

式（I）で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換させることが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換させることも可能である。

【0330】

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

【0331】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中であまり溶解しない顔料又は水中で溶解する染料を使用することができる。その例としては、「Rhodamin B」、「C.I. Pigment Red 112」及び「C.I. Solvent Red 1」の名称で知られている着色剤などを挙げるができる。

【0332】

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

【0333】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる適切な分散剤及び/又は乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用することができる。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド/プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体又は硫酸化誘導体などがある。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類及びアリアルスルホネート-ホルムアルデヒド縮合物である。

【0334】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡

10

20

30

40

50

剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用することができる。

【0335】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマルなどを挙げることができる。

【0336】

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

10

【0337】

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

【0338】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくは、ジベレリンA1、ジベレリンA3 (=ジベレリン酸)、ジベレリンA4及びジベレリンA7である。特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている (cf. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

20

【0339】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚製剤 (concentrate) 又は水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク及びライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することが可能であり、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズ及びビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、又は、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することが可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又はそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。

30

【0340】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又はその種子粉衣製剤から水を添加することによって調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機 (これは、バッチ式又は連続的に作動される) の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのまま添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

40

【0341】

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

【0342】

動物衛生

50

動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式（I）で表される化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物又は内部寄生生物に対して、活性を示す。用語「内部寄生生物」は、特に、蠕虫類及び原生動物（例えば、コクシジウム）を包含する。外部寄生生物は、典型的には、及び、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類又はダニ類である。

【0343】

獣医学の分野において、内温動物に対する毒性が好ましい程度である式（I）で表される化合物は、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物（domestic animal）において発生する寄生生物を防除するのに適している。それらは、該寄生生物の全ての発育段階又は特定の発育段階に対して活性を示す。

10

【0344】

農業用家畜としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、並びに、特に、ウシ及びブタ；又は、家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、及び、特に、ニワトリ；又は、魚類若しくは甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類若しくは甲殻類の動物；又は、場合により、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0345】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ハムスター、テングネズミ、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、及び、特に、イヌ、ネコ、籠の鳥、爬虫類、両生類、又は、水槽の魚。

20

【0346】

特定の実施形態では、式（I）で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0347】

特定の別の実施形態では、式（I）で表される化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、及び、特に、家禽類に対して、投与される。

【0348】

動物寄生生物を防除するために式（I）で表される化合物を使用することは、上記動物の病気、死亡事例を低減又は予防すること、及び、生産性（performance）（肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）の低下を低減又は予防することが意図され、その結果、より経済的で且つより容易な畜産業が可能となり、及び、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

30

【0349】

動物衛生の分野に関連して、用語「防除する（control）」又は「防除する（controlling）」は、本発明に関連しては、式（I）で表される化合物が、寄生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がない程度にまで低減させることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明に関連して、式（I）で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すこと、その成長を阻害すること、又は、その増殖を阻害することを意味する。

【0350】

節足動物としては、限定するものではないが、例えば、以下のものを挙げることができる：

40

アノプルリダ目（Anoplurida）の、例えば、ハエマトピヌス属種（Haematopinus spp.）、リノグナツス属種（Linognathus spp.）、ペジクルス属種（Pediculus spp.）、プチルス属種（Phtirus spp.）、及び、ソレノポテス属種（Solenopotes spp.）；

マロファギダ目（Mallophagida）並びにアムブリセリナ亜目（Amblycerina）及びイスクノセリナ亜目（Ischnocerina）の、例えば、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ダマリナ属種（Damalina spp.）、フェリコラ属種（Felicola spp.）；レピケントロン属種（Lepik

50

entron spp.)、メノポン属種 (Menopon spp.)、トリコデクテス属種 (Trichodectes spp.)、トリメノポン属種 (Trimenopon spp.)、トリノトン属種 (Trinoton spp.)、ウェルネキエラ属種 (Werneckiella spp.) ;

双翅目 (Diptera) 並びにネマトセリナ亜目 (Nematocerina) 及びブラキセリナ亜目 (Brachycerina) の、例えば、アエデス属種 (Aedes spp.)、アノフェレス属種 (Anopheles spp.)、アチロツス属種 (Atylotus spp.)、ブラウラ属種 (Braula spp.)、カリホラ属種 (Calliphora spp.)、クリソミイア属種 (Chrysomyia spp.)、クリソプス属種 (Chrysops spp.)、クレキス属種 (Culex spp.)、クリコイデス属種 (Culicoides spp.)、エウシムリウム属種 (Eusimulium spp.)、ファンニア属種 (Fannia spp.)、ガステロフィルス属種 (Gasterophilus spp.)、グロシナ属種 (Glossina spp.)、ハエマトピア属種 (Haematobia spp.)、ハエマトポタ属種 (Haematopota spp.)、ヒポボスカ属種 (Hippobosca spp.)、ヒボミトラ属種 (Hybomitra spp.)、ヒドロタエア属種 (Hydrotaea spp.)、ヒポデルマ属種 (Hypoderma spp.)、リポプテナ属種 (Lipoptena spp.)、ルシリア属種 (Lucilia spp.)、ルトゾミイア属種 (Lutzomyia spp.)、メロファグス属種 (Melophagus spp.)、モレリア属種 (Morellia spp.)、ムスカ属種 (Musca spp.)、オダグミア属種 (Odagmia spp.)、オエストルス属種 (Oestrus spp.)、フィリボミイア属種 (Philipomyia spp.)、フレボトムス属種 (Phlebotomus spp.)、リノエストルス属種 (Rhinoestrus spp.)、サルコファガ属種 (Sarcophaga spp.)、シムリウム属種 (Simulium spp.)、ストモキス属種 (Stomoxys spp.)、タバヌス属種 (Tabanus spp.)、チブラ属種 (Tipula spp.)、ウィルヘルミア属種 (Wilhelmia spp.)、ウォールファールチア属種 (Wohlfahrtia spp.) ;

ノミ目 (Siphonapterida) の、例えば、セラトフィルス属種 (Ceratophyllus spp.)、クテノセファリデス属種 (Ctenocephalides spp.)、プレキス属種 (Pulex spp.)、ツンガ属種 (Tunga spp.)、キセノプシラ属種 (Xenopsylla spp.) ;

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

【0351】

さらに、節足動物の場合、限定するものではないが、例として以下のダニ類も挙げるべきである :

ダニ亜綱 (Acarina) 及びメタスティグマ目 (Metastigmata) の、例えば、ヒメダニ科 (Argasidae) の、例えば、アルガス属種 (Argas spp.)、オルニトドルス属種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属種 (Otobius spp.)、マダニ科 (Ixodidae) の、例えば、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、デルマセントル属種 (Dermacentor spp.)、ハエマフィサリス属種 (Haemaphysalis spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、イキシデス属種 (Ixodes spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (Rhipicephalus (Boophilus) spp.)、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp.) (多宿主ダニの原属) ; メソスティグマ目 (Mesostigma

10

20

30

40

50

ta) の、例えば、デルマニスス属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニ
 ニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニスス属種 (*Pneu
 monyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Raillietia* spp.)
 、ステルノストマ属種 (*Sternostoma* spp.)、トロピラエラプス属種 (*Tropilaelaps*
spp.)、バロア属種 (*Varroa* spp.)；ア
 クチネジダ目 (*Actinedida* (*Prostigmata*)) の、例えば、アカラ
 ピス属種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属種 (*Cheyletiella*
spp.)、デモデクス属種 (*Demodex* spp.)、リストロホルス属種 (*Listrophorus*
spp.)、ミオビア属種 (*Myobia* spp.)、ネ
 オトロムビクラ属種 (*Neotrombicula* spp.)、オルニトケイレチア属
 種 (*Ornithocheyletia* spp.)、プソレルガテス属種 (*Psore
 rgates* spp.)、トロムビクラ属種 (*Trombicula* spp.)；及び
 、アカリジダ目 (*Acaridida* (*Astigmata*)) の、例えば、アカルス属
 種 (*Acarus* spp.)、カログリフス属種 (*Caloglyphus* spp.)
 、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、シトジテス属種 (*Cyto
 dites* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、クネ
 ミドコプテス属種 (*Knemidocoptes* spp.)、ラミノシオプテス属種 (*Laminosioptes*
spp.)、ノトエドレス属種 (*Notoedres* s
 pp.)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.)、プソロプテス属種 (*P
 soroptes* spp.)、プテロリクス属種 (*Pterolichus* spp.)
 、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、トリキサカルス属種 (*Tri
 xacarus* spp.)、チロファグス属種 (*Tyrophagus* spp.)。
 【0352】

寄生性原生動物の例としては、限定するものではないが、以下のものを挙げるこ
 とができる：

鞭毛虫亜門 (*Mastigophora*) (鞭毛虫類 (*Flagellata*))、例
 えば：

メタモナーダ (*Metamonada*)： ヒゲハラムシ目 (*Diplomonadi
 da*) の、例えば、ギアルジア属種 (*Giardia* spp.)、スピロヌクレウス属
 種 (*Spiroucleus* spp.)；

パラバサラ (*Parabasala*)： トリコモナス目 (*Trichomonadi
 da*) の、例えば、ヒストモナス属種 (*Histomonas* spp.)、ペントトリ
 コモナス属種 (*Pentatrachomonas* spp.)、テトラトリコモナス属
 種 (*Tetratrachomonas* spp.)、トリコモナス属種 (*Tricho
 monas* spp.)、トリトリコモナス属種 (*Tritrachomonas* sp
 p)；

ユーグレノゾア (*Euglenozoa*)： トリパノソーマ目 (*Trypanoso
 matida*) の、例えば、レイスマニア属種 (*Leishmania* spp.)、ト
 リパノソーマ属種 (*Trypanosoma* spp.)；

有毛根足虫亜門 (*Sarcomastigophora*) (根足虫類 (*Rhizopo
 da*))、例えば、エントアメーバ科 (*Entamoebidae*)、例えば、エントモ
 エバ属種 (*Entamoeba* spp.)、セントロアアメーバ科 (*Centramo
 ebidae*)、例えば、アカンタモエバ属種 (*Acanthamoeba* sp.)、
 ユーアメーバ科 (*Euamoebidae*)、例えば、ハルトマネラ属種 (*Hartma
 nella* sp.)；

アルベオラータ (*Alveolata*)、例えば、アピコンプレックス門 (*Apico
 mplexa*) (孢子虫類 (*Sporozoa*))、例えば、クリプトスポリジウム属種
 (*Cryptosporidium* spp.)；エイメリア目 (*Eimeriida*
) の、例えば、ベスノイチア属種 (*Besnoitia* spp.)、シストイソスポラ
 属種 (*Cystoisospora* spp.)、エイメリア属種 (*Eimeria* s

40 50

pp.)、ハモンジア属種 (*Hammondia* spp.)、イソスポラ属種 (*Iso-
spora* spp.)、ネオスポラ属種 (*Neospora* spp.)、サルコシス
チス属種 (*Sarcocystis* spp.)、トキソプラズマ属種 (*Toxopla-
sma* spp.)； アデレイダ目 (*Adeleida*) の、例えば、ヘパトゾオン属
種 (*Hepatozoon* spp.)、クロシエラ属不 (*Klossiella* sp
p.)； ハエモスポリダ目 (*Haemosporida*) の、例えば、レウコシトゾ
オン属種 (*Leucocytozoon* spp.)、プラスモジウム属種 (*Plasmo-
dium* spp.)； ピロプラスミダ目 (*Piroplasmida*) の、例えば、
パベシア属種 (*Babesia* spp.)、シリオホラ属種 (*Ciliophora*
spp.)、エキノゾオン属種 (*Echinozoon* spp.)、テイレリア属種 (10
Theileria spp.)； ベシブリフェリダ目 (*Vesibuliferida*) の、例えば、
パランチジウム属種 (*Balantidium* spp.)、ブキスト
ネラ属種 (*Buxtonella* spp.)；

微孢子虫亜門 (*Microspora*)、例えば、エンセファリトゾオン属種 (*Enc-
ephalitozoon* spp.)、エンテロシトゾオン属種 (*Enterocyt-
ozoon* spp.)、グロビジウム属種 (*Globidium* spp.)、ノセマ
属種 (*Nosema* spp.)、及び、さらに、例えば、ミキソゾア属種 (*Myxoz-
oa* spp.)。

【0353】

ヒト又は動物に対して病原性を示す蠕虫類としては、例えば、鉤頭動物門 (*Acant-
hocephala*)、線形動物 (*nematodes*)、舌形動物門 (*Pentast-
oma*) 及び扁形動物門 (*Platyhelminthes*) [例えば、単生類 (*Mon-
ogenea*)、条虫類 (*cestodes*) 及び吸虫類 (*trematodes*)] な
どがある。 20

【0354】

例証的な蠕虫類としては、限定するものではないが、以下のものを挙げるこ
とができる
:

単生綱 (*Monogenea*) : 例えば: ダクチロギルス属種 (*Dactylogy-
rus* spp.)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ミ
クロボトリウム属種 (*Microbothrium* spp.)、ポリストマ属種 (*Pol-
lystoma* spp.)、トログレセファルス属種 (*Troglecephalus*
spp.) ; 30

条虫類 (*Cestodes*) : ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllid-
ea*) の、例えば、ボトリジウム属種 (*Bothridium* spp.)、ジフィロボ
トリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、ジフロゴノボルス属種
(*Diplogonoporus* spp.)、イクチオボトリウム属種 (*Ichthy-
obothrium* spp.)、リグラ属種 (*Ligula* spp.)、シストセフ
アルス属種 (*Schistocephalus* spp.)、スピロメトラ属種 (*Spi-
rometra* spp.) ;

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllyida*) の、例えば: アンジラ属種 40
(*Andyra* spp.)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala* s
pp.)、アビテリナ属種 (*Avitellina* spp.)、ベルチエラ属種 (*Be-
rtiella* spp.)、シトタエニア属種 (*Cittotaenia* spp.)
、ダバイネア属種 (*Davainea* spp.)、ジオルキス属種 (*Diorchis*
spp.)、ジプロピリジウム属種 (*Diplopylidium* spp.)、ジピ
リジウム属種 (*Dipyloidium* spp.)、エキノコックス属種 (*Echino-
coccus* spp.)、エキノコチレ属種 (*Echinocotyle* spp.)
、エキノレピス属種 (*Echinolepis* spp.)、ヒダチゲラ属種 (*Hyda-
tigeria* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、
ジョイエウキシエラ属種 (*Joyeuxiella* spp.)、メソセストイデス属種 50

(*Mesocestoides* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、ライリエチナ属種 (*Raillietina* spp.)、スチレシア属種 (*Stilesia* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、チサニエジア属種 (*Thysaniezia* spp.)、チサノソマ属種 (*Thysanosoma* spp.) ;

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

線虫類 (*Nematodes*) : ベンチュウ目 (*Trichinellida*) の、例えば： カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)、トリコモソイデス属種 (*Trichomosoides* spp.)、トリクリス属種 (*Trichuris* spp.) ;

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

カンセンチュウ目 (*Rhabditina*) の、例えば： アエルロストロンギルス属種 (*Aelurostrongylus* spp.)、アミドストムム属種 (*Amidostomum* spp.)、アンシロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、アンギオストロンギルス属種 (*Angiostrongylus* spp.)、ブロンコネマ属種 (*Bronchonema* spp.)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、コオペリア属

10

20

30

40

50

種 (*Cooperia* spp.)、コオペリオイデス属種 (*Cooperioides* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、シアトストムム属種 (*Cyathostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cyclocoercus* spp.)、シクロドントストムム属種 (*Cyclodontostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cylicocyclus* spp.)、シリコステファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、シリンドロファリンキス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、エラホストロンギルス属種 (*Elaphostrongylus* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globocephalus* spp.)、グラフィジウム属種 (*Graphidium* spp.)、ギアロセファルス属種 (*Gyalocephalus* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostrongylus* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marshallagia* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ムエレリウス属種 (*Muellerius* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ネオストロンギルス属種 (*Neostrongylus* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、オベリスコイデス属種 (*Obeliscoides* spp.)、オエソファゴドンツス属種 (*Oesophagodontus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.)；オルニトストロンギルス属種 (*Ornithostrongylus* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、パラコオペリア属種 (*Paracooperia* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Parelaphostrongylus* spp.)、プネウモカウルス属種 (*Pneumocaulus* spp.)、プネウモストロンギルス属種 (*Pneumostrongylus* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、トログロストロンギルス属種 (*Trogloststrongylus* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)；

センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば： アカントケイロネマ属種 (*Acanthocheilonema* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属種 (*Ascaridia* spp.)；アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、アスカロプス属種 (*Ascarops* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、セルコピチフィラリア属種 (*Cercopithifilaria* spp.)、クラシカウダ属種 (*Crassicauda* spp.)、ジペタロネマ属種 (*Dipetalonema* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)；ドラスキア属種 (*Draschia* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、フィラリア

属種 (*Filaria* spp.)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハブロネマ属種 (*Habronema* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)；リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、パラブロネマ属種 (*Parabronema* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パスルルス属種 (*Passalurus* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、プロブストマイリア属種 (*Probstmayria* spp.)、プセウドフィラリア属種 (*Pseudofilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、スクジュラビネマ属種 (*Skjrabinema* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、ストロンギルリス (*Strongyluris* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)；

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*)：ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば：マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorchis* spp.)；サジョウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば：モニリホルミス属種 (*Moniliformis* spp.)；

ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば：フィリコリス属種 (*Filicollis* spp.)；コウトウチュウ目 (*Echinorhynchida*) の、例えば、アカントセファルス属種 (*Acanthocephalus* spp.)、エキノリンクス属種 (*Echinorhynchus* spp.)、レプトリンコイデス属種 (*Leptorhynchoides* spp.)；

舌形動物門 (*Pentastoma*)：ポロケファルス目 (*Porocephalida*) の、例えば、リングアツラ属種 (*Linguatula* spp.)。

【0355】

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

【0356】

かくして、本発明の1実施形態は、薬物として使用するための式 (I) で表される化合物である。

【0357】

さらなる態様は、抗内部寄生生物剤として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

【0358】

本発明のさらなる特定の態様は、抗蠕虫剤 (*antihelminthic agent*) として使用するための、特に、殺線虫剤、殺扁形動物剤 (*platyhelminthicide*)、殺鉤頭動物剤 (*acanthocephalicide*) 又は殺舌形動物剤 (*pentastomicide*) として使用するための、式 (I) で表される化合物に関する。

【0359】

本発明のさらなる特定の態様は、抗原生動物剤 (*antiprotozoic agent*) として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

【0360】

さらなる態様は、抗外部寄生生物剤として使用するための、特に、殺節足動物剤 (arthropodicide) として使用するための、極めて特定のには、殺虫剤又は殺ダニ剤として使用するための、式 (I) で表される化合物に関する。

【0361】

本発明のさらなる態様は、有効量の式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物及び以下のもののうちの少なくとも1種類を含んでいる獣医薬剤である：薬学的に許容され得る賦形剤 (例えば、固体希釈剤又は液体希釈剤)、薬学的に許容され得る補助剤 (例えば、界面活性剤)、特に、獣医薬剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、及び/又は、獣医薬剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤。

10

【0362】

本発明の関連する態様は、本明細書中に記載されている獣医薬剤を製造する方法であって、ここで、該方法は、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物を、薬学的に許容され得る賦形剤及び/又は補助剤 (特に、獣医薬剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、及び/又は、獣医薬剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤) と混合させる段階を含んでいる。

【0363】

本発明の別の特定の態様は、上記態様による殺外部寄生生物薬剤 (ectoparasiticidal formulations) 及び殺内部寄生生物薬剤 (endoparasiticidal formulations) の群から選択される獣医薬剤、特に、駆虫薬剤、抗原生動物薬剤 (antiprotozoic formulations) 及び殺節足動物薬剤 (arthropodocidal formulations) の群から選択される獣医薬剤、極めて特に、殺線虫薬剤 (nematocidal formulations)、殺扁形動物薬剤 (platyhelminthicidal formulations)、殺鉤頭動物薬剤 (acanthocephalicidal formulations)、殺舌形動物薬剤 (pentastomicidal formulations)、殺虫薬剤 (insecticidal formulations) 及び殺ダニ薬剤 (acaricidal formulations) の群から選択される獣医薬剤、並びに、それらを製造する方法である。

20

30

【0364】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物 (特に、非ヒト動物) において有効量の式 (I) で表される化合物を使用することによる。

【0365】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物 (特に、非ヒト動物) において本明細書中で定義されている獣医薬剤を使用することによる。

40

【0366】

別の態様は、動物 (特に、非ヒト動物) における寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症の治療における、式 (I) で表される化合物の使用に関する。

【0367】

動物衛生又は獣医学に関連して、用語「処置 (treatment)」は、予防的処置、感染後防御的処置又は治療的処置を包含する。

【0368】

特定の実施形態においては、このようにして、獣医学の分野に対して、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物と別の活性化合物 (特に、殺内部寄生生物薬及び殺外部寄

50

生生物薬)の混合物が提供される。

【0369】

動物衛生の分野においては、「混合物」は、2種類の(又は、それより多い)異なる活性化合物が共有の製剤に製剤され、それによって一緒に使用されることを意味するのみではなく、それぞれの活性化合物に対して独立した製剤を含んでいる製品も意味する。従って、3種類上の活性化合物を使用する場合、全ての活性化合物を共有の製剤に製剤することができるか、又は、全ての活性化合物を別々の製剤に製剤することが可能である;同様に、活性化合物のうちの一部と一緒に製剤し且つ活性化合物のうちの一部を別々に製剤するという混合形態も考えることができる。別々の製剤では、当該複数の活性化合物を別々に施用することが可能であるか、又は、連続して施用することが可能である。

10

【0370】

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」(上記を参照されたい)に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」)。

【0371】

混合成分として該殺外部寄生生物薬の群から選択される例証的な活性化合物としては、決して限定することを意図するものではないが、上記において詳細に記載されている殺虫剤及び殺ダニ剤などを挙げるができる。使用することが可能なさらなる活性化合物について、現在の「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいた上記分類に従って、以下に記載する:(1)アセチルコリンエステラーゼ(AChE)阻害薬;(2)GABA制御塩化物チャンネル遮断薬;(3)ナトリウムチャンネルモジュレーター;(4)ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)競合的モジュレーター;(5)ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)アロステリックモジュレーター;(6)グルタミン酸制御塩化物チャンネル(GluCl)アロステリックモジュレーター;(7)幼若ホルモン模倣物質;(8)種々の特定されていない(多部位)阻害薬;(9)弦音器官モジュレーター;(10)ダニ成長阻害薬;(12)ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター;(13)プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤;(14)ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬;(15)キチン生合成の阻害薬(タイプ0);(16)キチン生合成の阻害薬(タイプ1);(17)脱皮ディスラプター(特に、双翅目の場合);(18)エクジソン受容体作動薬;(19)オクトパミン受容体作動薬;(21)ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬;(25)ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬;(20)ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬;(22)電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬;(23)アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬;(28)リアノジン受容体モジュレーター;

20

30

作用機序が知られていないか又は特定されていない活性化合物、例えば、フェントリファニル、フェノキサクリム、シクロブレン、クロロベンジレート、クロルジメホルム、フルベンジミン、ジシクラニル、アミドフルメト、キノメチオネート、トリアラテン、クロチアゾベン、テトラスル、オレイン酸カリウム、石油、メトキサジアゾン、ゴシブルレ、フルテンジン、プロモプロピレート、氷晶石(cryolite);

40

別のクラスの化合物、例えば、ブタカルブ、ジメチラン、クロエトカルブ、ホスホカルブ、ピリミホス(-エチル)、パラチオン(-エチル)、メタクリホス、o-サリチル酸イソプロピル、トリクロルホン、スルプロホス、プロパホス、セブホス、ピリダチオン、プロトエート、ジクロフェンチオン、ジメトン-S-メチルスルホン、イサゾホス、シアノフェンホス、ジアリホス、カルボフェノチオン、アウトチオホス、アロムフェンピンホス(-メチル)、アジンホス(-エチル)、クロルピリホス(-エチル)、ホスメチラン、ヨードフェンホス、ジオキサベンゾホス、ホルモチオン、ホノホス、フルピラゾホス、フェンスルホチオン、エトリンホス;

有機塩素化合物、例えば、カンフェクロル、リンダン、ヘプタクロル;又は、フェニル

50

ピラゾール系、例えば、アセトプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、バニリプロール、シサプロニル；又は、イソオキサゾリン系、例えば、サロラネル、アフォキサネル、ロチラネル、フルラネル；

ピレスロイド系、例えば、(シス -、トランス -)メトフルトリン、プロフルトリン、フルフェンプロックス、フルプロシトリネート、フブフェンプロックス、フェンフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、RU15525、テラレトリン、シス - レスメトリン、ヘプタフルトリン、ピオエタノメトリン、ピオベルメトリン、フェンピリトリン、シス - シペルメトリン、シス - ペルメトリン、クロシトリン、シハロトリン(ラムダ -)、クロパポルトリン、又は、ハロゲン化炭化水素化合物(HCHs)；

ネオニコチノイド系、例えば、ニチアジン；

ジクロロメゾチアズ(dichloromezotiaz)、トリフルメゾピリム；

大環状ラクトン系、例えば、ネマデクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、モキシデクチン、セラメクチン、エプリノメクチン、ドラメクチン、エマメクチン安息香酸塩；ミルベマイシンオキシム；

トリプレン、エポフェノナン、ジオフェノラン；

生物学的薬剤、ホルモン類、又は、フェロモン類、例えば、天然産物類、例えば、ツリギエンシン(thuringiensin)、コドレモン、又は、ニーム成分；

ジニトロフェノール系、例えば、ジノカップ、ジノプトン、ピナパクリル；

ベンゾイル尿素系、例えば、フルアズロン、ペンフルロン；

アミジン誘導体、例えば、クロロメブホルム(chloromebulfom)、シミアゾール、デミジトラズ；

蜜蜂巣箱ミツバチヘギイタダニ殺ダニ剤(beehive varroa acaricides)、例えば、有機酸、例えば、ギ酸、シュウ酸。

【0372】

混合成分として該殺内部寄生生物薬の群から選択される例示的な活性化化合物としては、限定するものではないが、駆虫活性化化合物及び抗原生動物活性化化合物などを挙げることができる。

【0373】

該駆虫活性化化合物としては、限定するものではないが、以下の殺線虫活性化化合物、殺吸虫活性化化合物及び/又は殺糸虫活性化化合物などを挙げることができる；

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：エプリノメクチン、アバメクチン、ネマデクチン、モキシデクチン、ドラメクチン、セラメクチン、レピメクチン、ラチデクチン、ミルベメクチン、イベルメクチン、エマメクチン、ミルベマイシン；

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

デブシペプチド類のクラスの、好ましくは、環状デブシペプチド類のクラスの、特に、24員の環状デブシペプチド類のクラスの、例えば：エモデプシド(emodepside)、PF1022A；

テトラヒドロピリミジン類のクラスの、例えば：モランテル、ピランテル、オキサントール；

イミダゾチアゾール類のクラスの、例えば：ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

アミノフェニルアミジン類のクラスの、例えば：アミダンテル、デアシル化アミダンテル(dAMD)、トリベンジミジン；

アミノアセトニトリル類のクラスの、例えば：モネバンテル(monepantel)；

10

20

30

40

50

;

パラヘルクアミド類のクラスの、例えば：パラヘルクアミド、デルクアンテル；

サリチルアニリド類のクラスの、例えば：トリプロムサラン、プロモキサニド、プロチアニド、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、ラフォキサニド；

置換フェノール類のクラスの、例えば：ニトロキシニル、ピチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン (menic clo pho lan)；

有機リン酸エステル類のクラスの、例えば：トリクロルホン、ナフタロホス (naphthalofos)、ジクロルボス/DDVP、クルホメート、クマホス、ハロキソン；

ピペラジノン類/キノリン類のクラスの、例えば：プラジクアンテル (praziquantel)、エブシプランテル；

ピペラジン類のクラスの、例えば：ピペラジン、ヒドロキシジン；

テトラサイクリン類のクラスの、例えば：テトラサイクリン、クロロテトラサイクリン、ドキシサイクリン、オキシテトラサイクリン、ロリテトラサイクリン；

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

【0374】

抗原生動物活性化合物としては、限定するものではないが、以下の活性化合物を挙げることができる：

トリアジン類のクラスの、例えば：ジクラズリル、ポナズリル、レトラズリル、トルトラズリル；

ポリエーテルイオノホア類のクラスの、例えば：モネンシン、サリノマイシン、マデュラマイシン、ナラシン；

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：ミルベマイシン、エリスロマイシン；

キノロン類のクラスの、例えば：エンロフロキサシン、ブラドフロキサシン；

キノン類のクラスの、例えば：クロロキン；

ピリミジン類のクラスの、例えば：ピリメタミン；

スルホンアミド類のクラスの、例えば：スルファキノキサリン、トリメトプリム、スルファクロジン；

チアミン類のクラスの、例えば：アンプロリウム；

リンコサミド類のクラスの、例えば：クリンダマイシン；

カルバニリド類のクラスの、例えば：イミドカルブ；

ニトロフラン類のクラスの、例えば：ニフルチモクス；

キナゾリノンアルカロイド類のクラスの、例えば：ハロフギノン；

さまざまな別のクラスの、例えば：オキサムニキン、パロモマイシン；

ワクチン又は微生物の抗原のクラスの、例えば：バベシア・カニス・ロッシ (Babesia canis rossii)、エイメリア・テネラ (Eimeria tenella)、エイメリア・プラエコクス (Eimeria praecox)、エイメリア・ネカトリクス (Eimeria necatrix)、エイメリア・ミチス (Eimeria mitis)、エイメリア・マキシマ (Eimeria maxima)、エイメリア・ブルネッチ (Eimeria brunetti)、エイメリア・アセルブリナ (Eimeria acervulina)、バベシア・カニス・ボゲリ (Babesia canis vogeli)、レイシュマニア・インファンツム (Leishmania infantum)、バベシア・カニス・カニス (Babesia canis canis)、ジクチオカウルス・ビビパルス (Dictyocaulus vivipa

10

20

30

40

50

r u s)。

【0375】

記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。

【0376】

媒介動物の防除

式(I)で表される化合物は、媒介動物(vector)の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体(例えば、ウイルス類、蠕虫類(worms)、単細胞生物及び細菌類)を病原体保有宿主(植物、動物、ヒトなど)から宿主まで運ぶことが可能な節足動物(特に、昆虫又はクモ形類動物)である。該病原体は、宿主に機械的に運ばれ得る(例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ)、又は、宿主体内への注入後に運ばれ得る(例えば、蚊によるマラリア原虫)。

10

【0377】

媒介動物の例及び媒介動物によって運ばれる疾患又は病原体は、以下のとおりである：

(1) 蚊類

・ ハマダラカ(*Anopheles*)： マラリア、フィラリア症；

・ アカイエカ(*Culex*)： 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、別の蠕虫類の運搬；

・ ヤブカ(*Aedes*)： 黄熱病、デング熱、別のウイルス性疾患、フィラリア症；

20

・ ブユ(*Simuliidae*)： 蠕虫類(特に、回旋糸状虫(*Onchocerca volvulus*))の運搬；

・ チョウバエ(*Psychodidae*)： リーシュマニア症の伝染；

(2) シラミ類： 皮膚感染、流行性発疹チフス；

(3) ノミ類： 伝染病、発疹熱、糸虫；

(4) ハエ類： 睡眠病(トリパノソーマ病)；コレラ、別の細菌性疾患；

(5) ダニ類： ダニ症(acariosis)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兔病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎(TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症(borreliosis)；

(6) マダニ類： ボレリア症(borellioses)、例えば、ライム病ボレリア(*Borrelia burgdorferi sensu lato.*)、ダットン回帰熱ボレリア(*Borrelia duttoni*)、ダニ媒介脳炎、Q熱(*Coxiella burnetii*)、バベシア症(*Babesia canis canis*)、エーリキア症(ehrlichiosis)。

30

【0378】

本発明に関連して、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類又はアザミウマ類などである。植物ウイルスを運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類及び線虫類である。

【0379】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物及び/又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、例えば、蚊類〔特に、ヤブカ属(*Aedes*)の蚊、ハマダラカ属(*Anopheles*)の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ(*A. gambiae*)、アノフェレス・アラビエンシス(*A. arabiensis*)、アノフェレス・フネストゥス(*A. funestus*)、アノフェレス・ジルス(*A. dirus*) (マラリア)、及び、アカイエカ属(*Culex*)の蚊〕、チョウバエ(*Psychodidae*)、例えば、サシチョウバエ(*Phlebotomus*)、ルツオミヤ(*Lutzomyia*)、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。

40

【0380】

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

50

【0381】

式(I)で表される化合物は、疾患の予防及び/又は媒介動物によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。かくして、本発明のさらなる態様は、例えば、農業において、園芸において、森林内において、庭園やレジャー施設において、及び、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式(I)で表される化合物の使用である。

【0382】

工業材料の保護

式(I)で表される化合物は、昆虫類〔例えば、コウチュウ目(Coleoptera)、ハチ目(Hymenoptera)、シロアリ目(Isoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)及びシミ目(Zygentoma)の昆虫類〕による攻撃又は破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

10

【0383】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材、加工木材製品及び塗料などを意味するものと理解される。本発明は、木材を保護するために使用するのが特に好ましい。

【0384】

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

20

【0385】

さらなる実施形態では、式(I)で表される化合物は、即時使用可能な(ready-to-use)殺有害生物剤の形態にある。このことは、それらが、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能であるということの意味する。有用なさらなる殺虫剤又は殺菌剤としては、特に、上記で挙げたものなどがある。

【0386】

驚くべきことに、式(I)で表される化合物は、海水又は淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及び信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、式(I)で表される化合物は、単独で、又は、別の活性化化合物と組合せて、防汚剤として使用することができる。

30

【0387】

衛生分野における害虫の防除

式(I)で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内保護分野において、衛生保護分野において、及び、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間(例えば、住居、工場の通路、オフィス、車両の客室、動物飼育施設)において遭遇する昆虫類、クモ形類動物、マダニ類及びダニ類を防除する為に、使用することができる。害虫を防除するために、式(I)で表される化合物は、単独で使用するか、又は、別の活性化化合物及び/又は補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。式(I)で表される化合物は、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

40

【0388】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱(Arachnida)のサソリ目(Scorpiones)、クモ目(Araneae)及びザトウムシ目(Opiliones)の害虫、ムカデ綱(Chilopoda)及びヤスデ綱(Diplopoda)の害虫、昆虫綱(Insecta)のゴキブリ目(Blattodea)、コウチュウ目(Coleoptera)、ハサミムシ目(Dermaptera)、ハエ目(Diptera)、カメムシ亜目(Heteroptera)、ハチ目(Hymenoptera)、シロアリ目(Isoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、シラミ目(Phthiraptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)、バッタ目(Salta

50

toria 又は Orthoptera)、ノミ目(Siphonaptera)及びシミ目(Zygentoma)の害虫、並びに、軟甲綱(Malacostraca)のワラジムシ目(Isopoda)の害虫などをあげることができる。

【0389】

施用は、例えば、エアゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム(automatic fogging system)、噴霧器(fogger)、泡、ゲル、セルロース製又はプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙(moth papers)、防虫バッグ(moth bags)及び防虫ゲル(moth gels)において実施するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、又は、ベイトステーションで実施する。

10

【実施例】

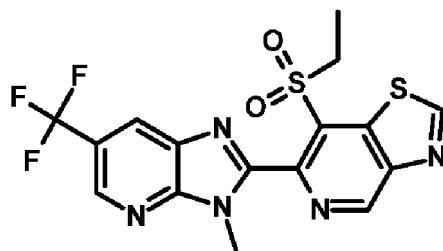
【0390】

調製実施例

7 - (エチルスルホニル) - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル][1, 3]チアゾロ[4, 5 - c]ピリジン(I - 1)

【化23】

20



【0391】

64 mg (0.16 mmol) の 7 - (エチルスルファニル) - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル][1, 3]チアゾロ[4, 5 - c]ピリジンを 7.5 mL のジクロロメタンに溶解させ、37 mg (0.81 mmol) のギ酸及び 110 mg (1.13 mmol) の過酸化水素を室温で添加し、次いで、その混合物を室温で 4 時間攪拌した。その混合物から減圧下で溶媒を除去した。その残渣を、移動相としてアセトニトリル/水 + 0.1%ギ酸を使用する HPLC によって、RP18 で精製した。

30

【0392】

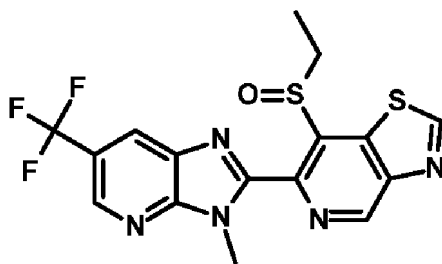
log P [a] : 2.60 ; log P [n] : 2.53 ; MH⁺ : 428 ; ¹H - NMR (400 MHz, CD₃CN) ppm : 1.29 (t, 3H), 3.80 (s, 3H), 3.87 (q, 2H), 8.44 (s, 1H), 8.84 (s, 1H), 9.51 (s, 1H), 9.66 (s, 1H)。

40

【0393】

7 - (エチルスルフィニル) - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル][1, 3]チアゾロ[4, 5 - c]ピリジン(I - 2)

【化24】



10

【0394】

64 mg (0.16 mmol) の 7 - (エチルスルファニル) - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル] [1, 3] チアゾロ - [4, 5 - c] ピリジンを 7.5 mL のジクロロメタンに溶解させ、37 mg (0.81 mmol) のギ酸及び 110 mg (1.13 mmol) の過酸化水素を室温で添加し、次いで、その混合物を室温で 4 時間攪拌した。その混合物から減圧下で溶媒を除去した。その残渣を、移動相としてアセトニトリル / 水 + 0.1% ギ酸を使用する HPLC によって、RP18 で精製した。

【0395】

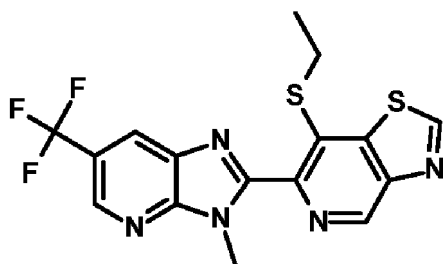
$\log P [a] : 3.09 ; \log P [n] : 2.98 ; MH^+ : 412 ; ^1H - NMR (400 MHz, d_6 - DMSO) \text{ ppm} : 1.43 (t, 3H), 3.70 (m, 2H), 4.24 (s, 3H), 8.73 (s, 1H), 8.91 (s, 1H), 9.68 (s, 1H), 9.77 (s, 1H)。$

20

【0396】

7 - (エチルスルファニル) - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル] [1, 3] チアゾロ [4, 5 - c] ピリジン (I - 3)

【化25】



30

【0397】

68 mg (0.36 mmol) の N^2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2, 3 - ジアミン、121 mg (0.43 mmol) の 7 - (エチルスルファニル) [1, 3] チアゾロ [4, 5 - c] ピリジン - 6 - カルボン酸及び 136 mg (0.71 mmol) の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) を 15 mL のピリジンの中で 120 で 18 時間攪拌した。その混合物をアセトニトリルで希釈し、濾過し、減圧下で溶媒を除去した。その残渣を、移動相として酢酸エチル / メタノール勾配を使用するカラムクロマトグラフィーで精製した。その所望のフラクションを、移動相としてアセトニトリル / 水 + 0.1% ギ酸を使用する HPLC によって RP18 で精製した。

40

【0398】

$\log P [a] : 2.96 ; \log P [n] : 2.94 ; MH^+ : 396 ; ^1H - NMR (400 MHz, CD_3CN) \text{ ppm} : 1.08 (t, 3H), 2.96 (q, 2H), 3.83 (s, 3H), 8.43 (s, 1H), 8.81 (s, 1H), 9.$

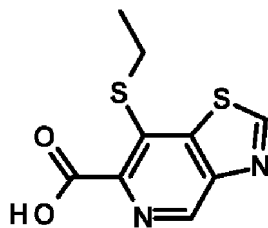
50

3.9 (s, 1H), 9.42 (s, 1H)。

【0399】

7-(エチルスルファニル)[1,3]チアゾロ[4,5-c]ピリジン-6-カルボン酸(XLI-1)

【化26】



10

【0400】

113 mg (0.421 mmol) の 7-(エチルスルファニル)[1,3]チアゾロ[4,5-c]ピリジン-6-カルボン酸エチル及び 20 mg (0.84 mmol) の水酸化リチウムを、2.1 mL のテトラヒドロフランと 0.7 mL の水の中で、室温で 18 時間攪拌した。1 N 塩酸水溶液を添加し、その混合物から減圧下で溶媒を除去した。その残渣にトルエンを 2 回添加し、その混合物から減圧下で溶媒を除去した。

【0401】

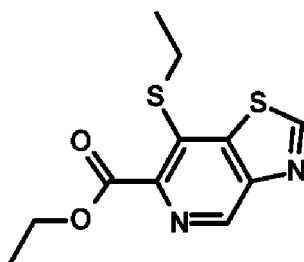
$\log P[a] : 0.88$; $MH^+ : 241$; $^1H-NMR(400 MHz, d_6-DMSO)$ ppm: 1.11 (t, 3H), 3.03 (q, 2H), 9.32 (s, 1H), 9.66 (s, 1H)。

20

【0402】

7-(エチルスルファニル)[1,3]チアゾロ[4,5-c]ピリジン-6-カルボン酸エチル(XL-1)

【化27】



30

【0403】

166 mg (0.47 mmol) の 7-{[(トリフルオロメチル)スルホニル]オキシ}[1,3]チアゾロ[4,5-c]ピリジン-6-カルボン酸エチルと 59 mg のキサントホス(0.10 mmol)と 0.25 mL のエタンチオール(3.36 mmol)と 0.25 mL (1.49 mmol) の N,N-ジイソプロピルエチルアミンを 6.6 mL のジオキサンに溶解させた溶液をアルゴンを用いて脱ガスした。68 mg (0.065 mmol) のトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム/クロロホルム付加体を添加し、その溶液をマイクロ波オープンの中で 160 で 5 分間攪拌した。その混合物から減圧下で溶媒を除去した。その残渣を移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチル勾配を使用するカラムクロマトグラフィーで精製した。

40

【0404】

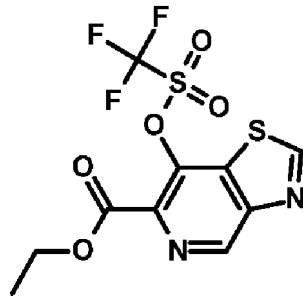
$\log P[a] : 2.23$; $\log P[n] : 2.17$; $MH^+ : 269$; $^1H-NMR(400 MHz, CD_3CN)$ ppm: 1.17 (t, 3H), 1.39 (t, 3H), 3.03 (q, 2H), 4.45 (q, 2H), 9.25 (s, 1H), 9.315 (s, 1H)。

50

【0405】

7 - { [(トリフルオロメチル)スルホニル]オキシ} [1 , 3]チアゾロ [4 , 5 - c]ピリジン - 6 - カルボン酸エチル (X X X I V - 1)

【化28】



10

【0406】

[7 - ヒドロキシ [1 , 3]チアゾロ [4 , 5 - c]ピリジン - 6 - カルボン酸エチルは、US 2008 / 0004309の方法に準じて調製した] 200 mg (0 . 89 mmol) の 7 - ヒドロキシ [1 , 3]チアゾロ [4 , 5 - c]ピリジン - 6 - カルボン酸エチル及び 0 . 62 mL (4 . 46 mmol) のトリエチルアミンを 2 mL のジクロロメタンに溶解させ、0 °C まで冷却した。0 . 45 mL (2 . 68 mmol) のトリフルオロメタンスルホン酸無水物を 0 °C で滴下して加えた。その混合物を 0 °C で 10 分間攪拌し、水 / 酢酸エチルで抽出した。その有機相を硫酸ナトリウムを用いて脱水し、濾過し、減圧下で溶媒を除去した。その残渣を、移動相としてシクロヘキサン / 酢酸エチル勾配を使用するカラムクロマトグラフィーで精製した。

20

【0407】

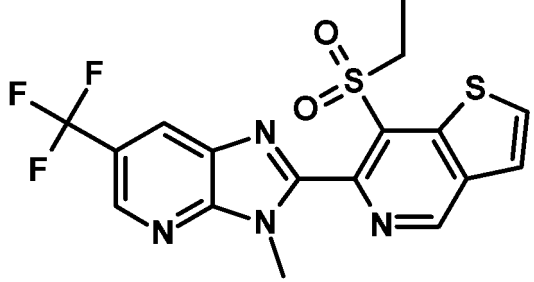
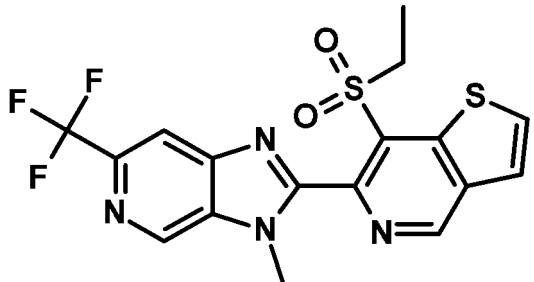
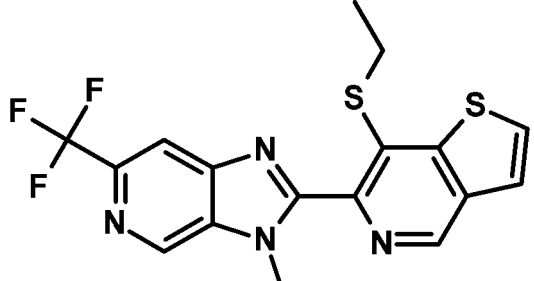
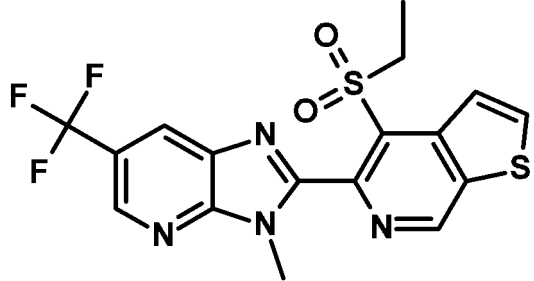
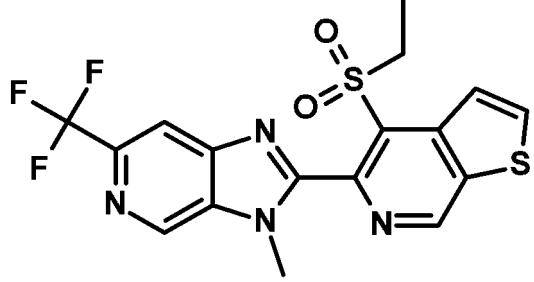
$\log P [a] : 2 . 58 ; \log P [n] : 2 . 57 ; M H ^ + : 357 ; ^1 H - N M R (400 M H z , C D _3 C N) \quad p p m : 1 . 41 (t , 3 H) , 4 . 47 (q , 2 H) , 9 . 42 (s , 1 H) , 9 . 445 (s , 1 H) .$

【0408】

上記実施例と同様にして、及び、上記で記載した調製方法に準じて、式 (I) で表される下記化合物を得ることができる。

30

【表 1】

実施例	構造
I-4	
I-5	
I-6	
I-7	
I-8	

10

20

30

40

【0409】

log P値は、「EEC Directive 79/831 Annex V. A 8 50

」に従い、逆相カラム (C 1 8) での H P L C (高性能液体クロマトグラフィー) によって測定する。温度 : 5 5 。

【 0 4 1 0 】

酸性範囲内における L C - M S の測定は、移動相として 0 . 1 % 水性ギ酸及びアセトニトリル (0 . 1 % ギ酸含有) を使用し、 1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルまでの直線勾配で、 p H 2 . 7 で実施する。表中では、 l o g P (H C O O H) 又は l o g P [a] と称されている。

【 0 4 1 1 】

中性範囲内における L C - M S の測定は、移動相として 0 . 0 0 1 モル重炭酸アンモニウム水溶液及びアセトニトリルを使用し、 1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルまでの直線勾配で、 p H 7 . 8 で実施する。表中では、 l o g P (中性) 又は l o g P [n] と称されている。

10

【 0 4 1 2 】

較正は、 l o g P 値が知られている非分枝鎖アルカン - 2 - オン (3 個 ~ 1 6 個の炭素原子を有している) を用いて実施する (l o g P 値は、連続する 2 種類のアルカノンの間の線形補間によって、保持時間に基づいて決定する) 。

【 0 4 1 3 】

選択された実施例の N M R データは、慣習的な形態 (値、多重項分裂、水素原子の数) で記載されているか、又は、 N M R ピークリストとして記載されている。

【 0 4 1 4 】

いずれの場合にも、その中で N M R スペクトルを記録した溶媒が示されている。

20

【 0 4 1 5 】

N M R ピークリスト法

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

【 0 4 1 6 】

従って、 1 つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる :

ν_1 (強度 ν_1) ; ν_2 (強度 ν_2) ; . . . ; ν_i (強度 ν_i) ; . . . ; ν_n (強度 ν_n) 。

30

【 0 4 1 7 】

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

【 0 4 1 8 】

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

40

【 0 4 1 9 】

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

【 0 4 2 0 】

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

【 0 4 2 1 】

溶媒及び / 又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 ^1H N M R ピークの本発明者らによるリストは、標準的な溶媒のピーク、例えば、 d_6 - D M S O

50

中のDMSOのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

【0422】

目標化合物の立体異性体のピーク及び/又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物（例えば、90%を超える純度を有する目標化合物）のピークよりも低い強度を有している。

【0423】

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

10

【0424】

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

【0425】

¹H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」の中に見いだすことができる。

20

【表 2】

実施例	logP	
I-4	2,88[a];2,82[n]	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.4444(5.0);8.8205(2.2);8.4158(2.2);8.0439(2.8);8.0300(3.2);7.7913(3.3);7.7842(0.4);7.7773(2.9);3.8472(1.0);3.8280(3.2);3.8096(3.2);3.7909(1.2);3.7706(16.0);2.4664(0.3);2.1313(288.9);2.1129(3.1);2.1067(3.3);2.1006(2.9);2.0947(1.7);1.9635(11.4);1.9516(169.6);1.9455(318.5);1.9393(443.6);1.9331(302.4);1.9269(153.8);1.7798(1.1);1.7739(1.7);1.7676(2.4);1.7616(1.7);1.7552(0.9);1.3124(3.9);1.2938(8.3);1.2752(4.3);0.1460(6.2);0.0837(0.4);0.0081(55.2);-0.0001(1347.7);-0.0084(52.7);-0.1495(6.1)
I-5	2,53[a];2,40[n]	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.4441(4.4);9.0828(3.2);8.1523(3.5);8.0510(2.4);8.0369(2.6);7.7958(2.7);7.7817(2.4);5.4475(0.6);3.8234(16.0);3.8025(3.5);3.7839(3.6);3.7654(1.1);2.8787(1.0);2.4692(0.7);2.4645(0.9);2.1614(296.3);2.1194(0.6);2.1134(0.8);2.1072(1.0);2.1012(0.7);2.0950(0.5);1.9640(4.3);1.9578(8.6);1.9522(61.8);1.9460(114.8);1.9399(159.7);1.9337(109.6);1.9275(56.0);1.7748(0.6);1.7683(0.9);1.7621(0.6);1.7564(0.4);1.3038(3.8);1.2852(7.8);1.2667(4.0);1.1835(0.9);1.1672(0.9);0.1462(2.1);0.0079(20.0);-0.0002(452.4);-0.0076(18.8);-0.1494(2.2)
I-6	2,95[a];2,85[n]	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.2250(2.1);9.0643(3.7);8.1583(4.0);7.9330(0.4);7.9195(2.6);7.9058(2.9);7.7287(3.8);7.7150(3.3);4.0685(0.4);4.0495(0.4);3.8557(16.0);2.9580(1.5);2.9393(4.5);2.9211(4.5);2.9025(1.5);2.1336(427.6);2.1131(3.1);2.1066(3.0);2.1008(2.3);2.0507(0.3);1.9940(0.6);1.9712(3.6);1.9633(11.3);1.9515(153.8);1.9454(281.8);1.9393(387.8);1.9331(264.9);1.9269(134.9);1.7799(0.9);1.7741(1.6);1.7676(2.2);1.7614(1.4);1.7553(0.8);1.2725(0.6);1.2221(0.5);1.2038(0.8);1.1865(0.4);1.0866(5.8);1.0682(11.2);1.0498(5.4);0.1462(5.8);0.0077(57.4);-0.0003(1174.2);-0.1494(5.8)
I-7	2,56[a];2,72[n]	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.5398(3.4);8.8100(1.9);8.8069(1.9);8.3933(2.0);8.3895(1.9);8.3081(2.2);8.2943(3.9);8.2619(2.5);8.2479(1.4);3.7752(16.0);3.7451(1.0);3.7265(3.2);3.7079(3.2);3.6893(1.0);2.4636(0.4);2.1481(86.0);2.1453(116.7);2.1194(0.5);2.1133(0.7);2.1072(0.7);2.1009(0.4);1.9639(2.6);1.9578(4.9);1.9520(38.0);1.9459(71.4);1.9397(100.7);1.9335(69.6);1.9273(35.5);1.7743(0.4);1.7681(0.6);1.7620(0.4);1.4959(2.9);1.3136(3.9);1.2950(7.9);1.2764(4.0)

10

20

30

【 0 4 2 6 】

);0.1463(1.3);0.0082(12.2);0.0000(279.8);-0.0082(11.1);-0.1493(1.3)
I-8	2,30[a];2,28[n]	¹ H-NMR(400.0 MHz, CD ₃ CN): δ= 19.9789(0.4);9.5405(3.6);9.0732(3.0);8.3144(2.4);8.3008(3.8);8.2573(3.6);8.2434(2.3);8.1790(0.4);8.1303(3.5);7.5871(0.6);7.2957(0.4);7.2331(0.5);5.4875(0.4);5.4468(0.7);4.1651(0.9);3.8312(16.0);3.7178(1.1);3.6988(3.0);3.6804(2.8);3.6619(1.1);2.4647(3.1);2.4599(2.2);2.3280(0.4);2.2894(0.5);2.1557(1348.2);2.1196(4.2);2.1132(4.5);2.1070(5.7);2.1008(3.8);2.0944(2.2);2.0736(0.6);1.9639(21.4);1.9577(40.4);1.9520(323.1);1.9458(605.1);1.9396(843.9);1.9335(578.7);1.9273(296.1);1.8793(0.6);1.7804(1.8);1.7743(3.5);1.7681(4.8);1.7619(3.3);1.7557(1.6);1.5153(0.5);1.4966(0.4);1.3031(5.0);1.2845(10.4);1.2659(5.2);0.1459(9.7);0.0079(89.1);-0.0003(2229.1);-0.0087(86.4);-0.1497(9.8)

40

【 0 4 2 7 】

使用実施例

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 経口試験

溶媒 : 100重量部のアセトン

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、水を用いて調合する。

【 0 4 2 8 】

50

50 μ L の該活性化合物調製物をマイクロタイタープレートの中に移し、150 μ L の I P L 4 1 昆虫培地 (33% + 15% 糖) を用いて最終体積 200 μ L とする。次いで、そのプレートをパラフィルムで密閉し、第 2 のマイクロタイタープレートの中のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) の混合個体群がそのパラフィルムに孔を開け、そこから上記溶液を吸入することができる。

【0429】

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

【0430】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、4 ppm の施用量で、100% の効力を示す： I - 1、I - 4、I - 7、I - 8。

10

【0431】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験

溶媒： 78 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリアルポリグリコールエーテル

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

20

【0432】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物配合物を噴霧する。

【0433】

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

【0434】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 g / ha の施用量で、100% の効力を示す： I - 7、I - 8。

30

【0435】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 g / ha の施用量で、90% の効力を示す： I - 1、I - 4、I - 5。

【0436】

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

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリアルポリグリコールエーテル

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

40

【0437】

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

【0438】

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

50

【0439】

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

【0440】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、83%の効力を示す： I - 1。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2017/067838

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D519/00 A01N43/90 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2016/091731 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 16 June 2016 (2016-06-16) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele; Seite 142, Reaktionsschema und Zeilen 19, 23-24; Nebenprodukt 14. -----	1-12
Y	WO 2016/107742 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 7 July 2016 (2016-07-07) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele. -----	1-12
Y	WO 2005/066177 A1 (SCHERING PLOUGH LTD [CH]; WINZENBERG KEVIN N [AU]; FRANCIS CRAIG L [AU]) 21 July 2005 (2005-07-21) cited in the application Anspruch 1; Seite 11, Zeilen 2-11. -----	1-12
	-/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> 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		Date of mailing of the international search report
9 August 2017		18/08/2017
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
		Weisbrod, Thomas

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2017/067838

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2016/020286 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 11 February 2016 (2016-02-11) Zusammenfassung; Ansprüche. -----	1-12

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2017/067838

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2016091731 A1	16-06-2016	CN 107001364 A WO 2016091731 A1	01-08-2017 16-06-2016
WO 2016107742 A1	07-07-2016	NONE	
WO 2005066177 A1	21-07-2005	AT 362475 T AU 2004312506 A1 BR PI0418328 A CA 2551867 A1 CN 1922181 A DE 602004006536 T2 EP 1699799 A1 ES 2285565 T3 HK 1091207 A1 JP 4758909 B2 JP 2007517043 A KR 20060110344 A NZ 548098 A US 2005182059 A1 WO 2005066177 A1 ZA 200605299 B	15-06-2007 21-07-2005 02-05-2007 21-07-2005 28-02-2007 31-01-2008 13-09-2006 16-11-2007 03-08-2007 31-08-2011 28-06-2007 24-10-2006 28-05-2010 18-08-2005 21-07-2005 28-03-2007
WO 2016020286 A1	11-02-2016	CN 106661023 A EP 3177620 A1 US 2017215425 A1 WO 2016020286 A1	10-05-2017 14-06-2017 03-08-2017 11-02-2016

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2017/067838

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D519/00 A01N43/90 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 2016/091731 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 16. Juni 2016 (2016-06-16) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele; Seite 142, Reaktionsschema und Zeilen 19, 23-24: Nebenprodukt 14. -----	1-12
Y	WO 2016/107742 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 7. Juli 2016 (2016-07-07) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele. -----	1-12
Y	WO 2005/066177 A1 (SCHERING PLOUGH LTD [CH]; WINZENBERG KEVIN N [AU]; FRANCIS CRAIG L [AU]) 21. Juli 2005 (2005-07-21) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1; Seite 11, Zeilen 2-11. -----	1-12
	-/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		
A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist		*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
E frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		*X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)		*Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht		*Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
9. August 2017		18/08/2017
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Weisbrod, Thomas

1

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (April 2005)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2017/067838

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 2016/020286 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 11. Februar 2016 (2016-02-11) Zusammenfassung; Ansprüche. -----	1-12

1

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2017/067838

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2016091731 A1	16-06-2016	CN 107001364 A WO 2016091731 A1	01-08-2017 16-06-2016
WO 2016107742 A1	07-07-2016	KEINE	
WO 2005066177 A1	21-07-2005	AT 362475 T AU 2004312506 A1 BR PI0418328 A CA 2551867 A1 CN 1922181 A DE 602004006536 T2 EP 1699799 A1 ES 2285565 T3 HK 1091207 A1 JP 4758909 B2 JP 2007517043 A KR 20060110344 A NZ 548098 A US 2005182059 A1 WO 2005066177 A1 ZA 200605299 B	15-06-2007 21-07-2005 02-05-2007 21-07-2005 28-02-2007 31-01-2008 13-09-2006 16-11-2007 03-08-2007 31-08-2011 28-06-2007 24-10-2006 28-05-2010 18-08-2005 21-07-2005 28-03-2007
WO 2016020286 A1	11-02-2016	CN 106661023 A EP 3177620 A1 US 2017215425 A1 WO 2016020286 A1	10-05-2017 14-06-2017 03-08-2017 11-02-2016

フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
	A 0 1 N 43/90	1 0 4

(81) 指定国・地域 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, 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, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT

(74) 代理人 100137213
弁理士 安藤 健司

(74) 代理人 100143823
弁理士 市川 英彦

(74) 代理人 100151448
弁理士 青木 孝博

(74) 代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵

(74) 代理人 100196483
弁理士 川崎 洋祐

(74) 代理人 100203035
弁理士 五味淵 琢也

(74) 代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和

(74) 代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一

(74) 代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔

(74) 代理人 100202267
弁理士 森山 正浩

(74) 代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和

(74) 代理人 100127812
弁理士 城山 康文

(72) 発明者 ウィロット, マシュー
ドイツ国、4 0 2 1 5・デュッセルドルフ、ヤーンシュトラッセ・1 5

(72) 発明者 フィッシャー, リュディガー
ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツォー・デン・フーフフェレン・2 3

(72) 発明者 ヘイガー, ドミニク
ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、ロッテンシュトラッセ・1 0

(72) 発明者 ホフマイスター, ラウラ
ドイツ国、4 0 5 9 3・デュッセルドルフ、ウルデンバッハー・アレー・1 9

(72) 発明者 カウシュ-ビジーズ, ニーナ
ドイツ国、5 1 4 6 7・ベルギッシュ・グラートバッハ、イルレンフェルダール・ヴェーク・3 8 ア

—

(72)発明者 モスリン, マルク
ドイツ国、5 0 9 3 5 ・ケルン、パッヘマー・シュトラーセ・3 4 1 アー

(72)発明者 ヴィルケ, デイビッド
ドイツ国、4 0 2 3 5 ・デユッセルドルフ、デガーシュトラーセ・4

(72)発明者 イルグ, ケルスティン
ドイツ国、5 0 6 7 0 ・ケルン、ノイツサー・ヴァール・3 2

F ターム(参考) 4C072 MM10 UU02

4C084 AA19 NA14 ZB37 ZC75

4C086 AA01 AA02 AA03 CB27 MA01 MA04 NA14 ZB37 ZC75

4H011 AC01 AC04 BB09 BC03 BC05 BC06 DA16 DD03 DE15