

(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2017-512190

(P2017-512190A)

(43) 公表日 平成29年5月18日(2017.5.18)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 209/42 (2006.01)	C O 7 D 209/42 C S P	2 B 1 2 1
C07D 235/24 (2006.01)	C O 7 D 235/24	4 C 2 0 4
A01P 7/02 (2006.01)	A O 1 P 7/02	4 H O 1 1
A01P 7/04 (2006.01)	A O 1 P 7/04	
A01N 43/52 (2006.01)	A O 1 N 43/52	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 91 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2016-552275 (P2016-552275)
 (86) (22) 出願日 平成27年2月13日 (2015. 2. 13)
 (85) 翻訳文提出日 平成28年10月7日 (2016. 10. 7)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2015/053065
 (87) 国際公開番号 W02015/121406
 (87) 国際公開日 平成27年8月20日 (2015. 8. 20)
 (31) 優先権主張番号 14155320.6
 (32) 優先日 平成26年2月17日 (2014. 2. 17)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アクチュエ
 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

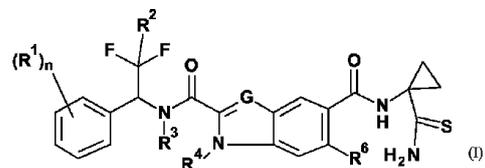
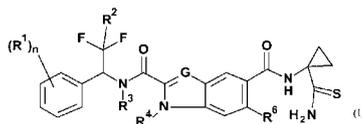
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺虫剤及び殺ダニ剤としてのインドールカルボキサミド類及びベンゾイミダゾールカルボキサミド類

(57) 【要約】

本発明は、一般式 (I) [式中、R¹ ~ R⁶, G及びnは、明細書中で与えられている意味を有する] で表される化合物、並びに、それらを製造する方法、並びに、殺虫剤及び殺ダニ剤としてのそれらの使用に関する。

【化1】

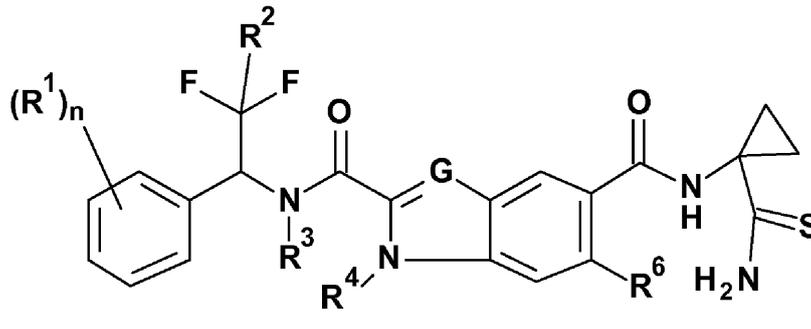


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I)

【化 1】



10

〔式中、

R¹ は、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、クロロテトラフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシを表し；

ここで、少なくとも 1 の置換基 R¹ は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し；

R² は、フッ素、トリフルオロメチル又は水素を表し；

n は、2、3、4 又は 5 を表し；

20

R³ は、水素を表し；

R⁴ は、水素、メチル、エチル、プロパ - 1 - イル、プロパ - 2 - エン - 1 - イル、プロパ - 2 - イン - 1 - イル、エテニル、ブタ - 2 - イン - 1 - イルを表し；

G は、CH 又は N を表し；

R⁶ は、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表す

で表される化合物、並びに、さらに、式 (I) で表される化合物の塩及び N - オキシド。

【請求項 2】

R¹ が、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメチルを表し；

ここで、少なくとも 1 の置換基 R¹ は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し；

30

R² が、フッ素又は水素を表し；

n が、2、3 又は 4 を表し；

R³ が、水素を表し；

R⁴ が、水素、メチル、エチル又はプロパ - 2 - イン - 1 - イルを表し；

G が、CH 又は N を表し；

R⁶ が、塩素、臭素、メチル又はトリフルオロメチルを表す；

請求項 1 に記載の一般式 (I) で表される化合物、並びに、さらに、式 (I) で表される化合物の塩及び N - オキシド。

【請求項 3】

R¹ が、フッ素、塩素、臭素又はトリフルオロメチルを表し；

40

ここで、少なくとも 1 の置換基 R¹ は、フッ素又は塩素を表し；及び、

n が、2、3 又は 4 を表す；

請求項 1 又は 2 に記載の一般式 (I) で表される化合物、並びに、さらに、式 (I) で表される化合物の塩及び N - オキシド。

【請求項 4】

R⁶ が、塩素又はメチルを表す；

請求項 1、2 又は 3 に記載の一般式 (I) で表される化合物、並びに、さらに、式 (I) で表される化合物の塩及び N - オキシド。

【請求項 5】

農薬製剤であって、その農薬製剤の重量に基づいて 0.00000001 ~ 98 重量%

50

の生物学的に有効な量の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物及び / 又はその塩を含み、並びに、さらに、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 6】

さらなる農薬活性化合物を付加的に含んでいる、請求項に記載の農薬製剤。

【請求項 7】

害虫を防除する方法であって、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物及び / 又はその塩を害虫及び / 又はそれらの生息環境に作用させることを含む、前記方法、但し、ヒト又は動物の身体を処置する方法は除外する。

【請求項 8】

植物の繁殖器官 (propagation material) を保護するための、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規殺有害生物剤 (pesticide)、それらを調製する方法、及び、活性化合物としてのそれらの使用、特に、殺虫剤及び殺ダニ剤としてのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

インドール - 2 - カルボキサミド類及びベンゾイミダゾール - 2 - カルボキサミド類並びにそれらの薬物としての使用については、既に文献に記載されている。例えば、WO - A - 2010 / 126164、WO - A - 2010 / 054138、US 2009 / 0041722、WO - A - 2007 / 115938、EP 1460064、WO - A - 2004 - A - 056768、WO - A - 2004 / 032921、WO - A - 20010 / 32622を参照されたい。WO - A - 2012 / 119984には、インドール - 2 - カルボキサミド類及びベンゾイミダゾール - 2 - カルボキサミド類並びにそれらの作物保護剤としての使用が開示されている。この刊行物の中で、実施例 273には、6員インドール環におけるアミドラジカルのアミノチオカルボニルシクロプロピル置換を有する化合物が開示されている。しかしながら、この化合物は、そのフェニル環においてはトリフルオロメチルで 1 置換されているのみである。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献 1】国際特許出願公開第 2010 / 126164号

【特許文献 2】国際特許出願公開第 2010 / 054138号

【特許文献 3】米国特許出願公開第 2009 / 0041722号

【特許文献 4】国際特許出願公開第 2007 / 115938号

【特許文献 5】欧州特許出願公開第 1460064号

【特許文献 6】国際特許出願公開第 2004 - A - 056768号

【特許文献 7】国際特許出願公開第 2004 / 032921号

【特許文献 8】国際特許出願公開第 20010 / 32622号

【特許文献 9】国際特許出願公開第 2012 / 119984号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

驚くべきことに、特定の新規インドール - カルボキサミド類及びベンゾイミダゾールカルボキサミド類が、強力な殺虫特性及び殺ダニ特性を有していて、同時に、植物が十分な耐性を示し、恒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ということが見いだされた。本発明による新規化合物は、今日に至るまで開示されてい

10

20

30

40

50

ない。

【0005】

現代の作物保護組成物は、例えば、それらの作用の効力、作用の持続性及び作用スペクトル並びに可能性のある用途などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。毒性の問題及び別の活性化合物又は製剤助剤との組合せ可能性についての問題は、活性化合物の合成に必要とされる費用の問題と同様に、ある種の役割を果たす。さらに、抵抗性も生じ得る。これら全ての理由により、新規作物保護剤の探求は、既に完結したものとは決して考えられ得ず、既知化合物と比較して少なくとも個々の態様に関して改善された特性を有する新規化合物が絶えず求められている。

【0006】

本発明の目的は、さまざまな局面下において殺有害生物剤のスペクトルを拡大させる化合物及び/又はそれらの活性を向上させる化合物を提供することであった。

【課題を解決するための手段】

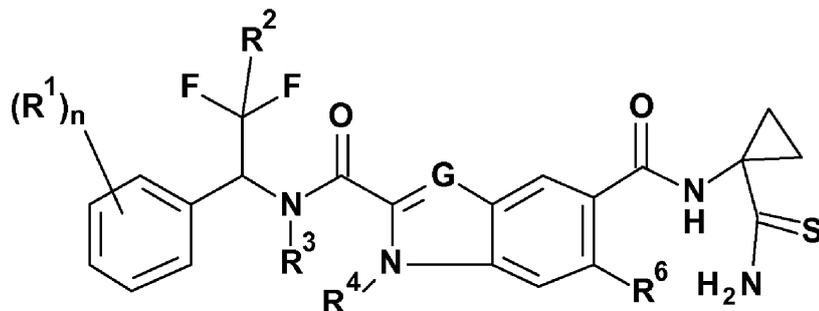
【0007】

式(I)で表される新規化合物は、特に、6員インドール環におけるアミドラジカルのアミノチオカルボニルシクロプロピル置換を有していることによって、及び、フェニル環が多置換(ここで、それら置換基のうちの少なくとも1はハロゲンである)されていることによって、特徴付けられる。驚くべきことに、これら2つの特徴が組み合わされることによって、生物学的効力が改善される。このことは、以下に示されている生物学的な使用実施例において示されている。

【0008】

従って、本発明は、一般式(I)

【化1】



(I),

【0009】

〔式中、

R¹ は、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、クロロテトラフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシを表し；

ここで、少なくとも1の置換基R¹ は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し；

R² は、フッ素、トリフルオロメチル又は水素を表し；

n は、2、3、4又は5を表し；

R³ は、水素を表し；

R⁴ は、水素、メチル、エチル、プロパ-1-イル、プロパ-2-エン-1-イル、プロパ-2-イン-1-イル、エテニル、ブタ-2-イン-1-イルを表し；

G は、CH又はNを表し；

R⁶ は、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表す]

で表される化合物、及び、さらに、式(I)で表される化合物の塩及びN-オキシド、並びに、害虫(animal pest)を防除するためのそれらの使用を提供する。

【発明を実施するための形態】

【0010】

10

20

30

40

50

本発明の好ましい実施形態(2-1)では、

R¹は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメチルを表し；

ここで、少なくとも1の置換基R¹は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し；

R²は、フッ素又は水素を表し；

nは、2、3又は4を表し；

R³は、水素を表し；

R⁴は、水素、メチル、エチル又はプロパ-2-イン-1-イルを表し；

Gは、CH又はNを表し；

R⁶は、塩素、臭素、メチル又はトリフルオロメチルを表す；

及び、さらに、式(I)で表される化合物の塩及びN-オキシド、並びに、害虫を防除するためのそれらの使用。

10

【0011】

特に好ましい実施形態(3-1)では、R¹は、フッ素、塩素、臭素又はトリフルオロメチルを表し、及び、nは、2、3又は4を表し、ここで、少なくとも1の置換基R¹は、フッ素又は塩素を表し、及び、他の全ての基、ラジカル及び置換基は、好ましい実施形態(2-1)に関して上記で挙げられている意味を有する。

【0012】

特に好ましいさらなる実施形態(3-2)では、R⁶は、塩素又はメチルを表し、ここで、他の全ての基、ラジカル及び置換基は、好ましい実施形態(2-1)に関して上記で挙げられている意味又は特に好ましい実施形態(3-1)に関して上記で挙げられている意味を有する。

20

【0013】

特に好ましいさらなる実施形態(3-3)では、GはCHを表し、ここで、他の全ての基、ラジカル及び置換基は、好ましい実施形態(2-1)に関して上記で挙げられている意味又は特に好ましい実施形態(3-1)に関して上記で挙げられている意味又は特に好ましい実施形態(3-2)に関して上記で挙げられている意味を有する。

【0014】

特に好ましいさらなる実施形態(3-4)では、GはNを表し、ここで、他の全ての基、ラジカル及び置換基は、好ましい実施形態(2-1)に関して上記で挙げられている意味又は特に好ましい実施形態(3-1)に関して上記で挙げられている意味又は特に好ましい実施形態(3-2)に関して上記で挙げられている意味を有する。

30

【0015】

本発明によれば、式(I)で表される化合物は、同一であるか又は異なっている置換基R¹で置換され得る。

【0016】

適切な場合には、式(I)で表される化合物は、種々の多形形態で存在し得るか、又は、種々の多形形態の混合物として存在し得る。純粋な多形と多形混合物の両方が、本発明の対象の一部を構成し、そして、本発明に従って使用され得る。

【0017】

式(I)で表される化合物は、存在する任意のE/Z異性体及びジアステレオマー又はエナンチオマーを包含する。

40

【0018】

該置換されているインドールカルボキサミド類及びベンゾイミダゾールカルボキサミド類は、式(I)によって概括的に定義される。上記及び下記で特定されている式に関するラジカルの好ましい定義を、以下に記載する。これらの定義は、式(I)で表される最終生成物に当てはまり、同様に、全ての中間体にも当てはまる。

【0019】

式(I)における置換基の特定の数nは、水素以外の置換基のみを包含する。この理由によって、水素もR¹の定義には含まれていない。もちろん、R¹置換基が当該部位に存在していない場合には、水素が置換基として常に存在している。

50

【0020】

好ましい定義においては、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。

【0021】

特に好ましい定義においては、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。

【0022】

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、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、特に、フッ素、塩素又は臭素である。

10

【0023】

飽和又は不飽和のヒドロカルビルラジカル（例えば、アルキル、アルケニル又はアルキニル）は、それぞれ、可能な範囲において、直鎖又は分枝鎖であることができ、このことは、例えばアルコキシにおけるように、ヘテロ原子と組み合わせられている場合を包含する。

【0024】

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、多置換の場合には、該置換基は、同一であっても又は異なってもよい。

20

【0025】

概括的に又は好ましい範囲内において上記で与えられているラジカルの定義又は説明は、最終生成物に当てはまり、及び、対応するように、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。

【0026】

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が存在している、式(I)で表される化合物である。

30

【0027】

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が存在している、式(I)で表される化合物である。

【0028】

同様に好ましい本発明の化合物は、表1中に示されている一般式(I)で表される化合物である。

【0029】

一般式(I)で表される本発明化合物は、キラル炭素原子を含み得る。

【0030】

カーン、インゴールド及びプレローグの規則(CIP則)によれば、これらの置換基は、(R)配置又は(S)配置のいずれかを有し得る。

40

【0031】

本発明は、特定のキラル炭素原子において(S)配置を有する一般式(I)で表される化合物と(R)配置を有する一般式(I)で表される化合物の両方を包含する。即ち、本発明は、当該炭素原子が、それぞれ独立して、

(1) (R)配置；又は、

(2) (S)配置

を有している、一般式(I)で表される化合物を包含する。

【0032】

一般式(I)で表される化合物の中に2以上のキラル中心が存在している場合、そのキ

50

ラル中心における配置の望ましい任意の組合せが可能であり、このことは、

(1) 1つのキラル中心が(R)配置を有することができ、且つ、残りのキラル中心が(S)配置を有することができる；

(2) 1つのキラル中心が(R)配置を有することができ、且つ、残りのキラル中心が(R)配置を有することができる；及び、

(3) 1つのキラル中心が(S)配置を有することができ、且つ、残りのキラル中心が(S)配置を有することができる；

ことを意味する。

【0033】

式(I)で表される化合物は、同様に、存在する任意のジアステレオマー又はエナンチオマー及びE/Z異性体も包含し、さらに、式(I)で表される化合物の塩及びN-オキシドも包含し、及び、害虫を防除するためのそれらの使用も包含する。

【0034】

本発明は、さらに、殺有害生物剤を製造するための、本発明による一般式(I)で表される化合物の使用にも関する。

【0035】

異性体

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/又は、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、純粋な異性体とそれら異性体の望ましい任意の混合物の両方を包含する。

【0036】

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、該方法から、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、除外される。

【0037】

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。

【0038】

本出願に関連して、用語「殺有害生物剤(pesticide)」は、常に、用語「作物保護剤」も包含する。

【0039】

式(I)で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、温血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、畜産業において、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、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。それらは、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、通常的感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、全ての発育段階又は一部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 sheldoni)、アクロプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Acul

10

20

30

40

50

us 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.)、アマフィテトラニクス・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・グラミヌム (*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・ドメスチクス (*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.)、イキソデス属種 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクツス属種 (*Latrodectus* spp.)、ロキソスケレス属種 (*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 (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yothersi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニクス属種 (*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 (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、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 (*Rhipicephalus* 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* spp.)、ステネオタルソネムス・スピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば

10

20

30

40

50

、タルソネムス・コンフスス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズス (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、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、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 (*Sminthurus viridis*)；

ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus 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 (*Blattella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクローラ属種 (*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 americana*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、スペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*)；

コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種 (*Adoretus* spp.)、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 lineatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィットビウス・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.)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulescens*)、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 (*Ceutorrhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Cha*

10

20

30

40

50

etocnema 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*)、シリンドロコブツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコブツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコブツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属種 (*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシムブクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムブクタタ・ウンデシムブクタタ (*Diabrotica undecimpunctata 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 zeaee*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis* spp.)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロポデルス属種 (*Diloboderus* 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*)、エピトリキス属種 (*Epitrix* spp.)、例えば、エピトリキス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エピトリキス・フスクラ (*Epitrix fuscula*)、エピトリキス・ヒルチペンニス (*Epitrix hirtipennis*)、エピトリキス・スブクリニタ (*Epitrix subcrinita*)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faustinus* spp.)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronyx arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx* spp.)、ヒラモルファ・エレガン (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・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・プベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサンガイネア (*Lachnosterna consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザエ (*La*

theticus 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)、リクス属種(Lixus spp.)、ルペロモルファ・キサントデラ(Luperomorpha xanthodera)、ルペロデス属種(Luperodes spp.)、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.)、ナウパクツス・キサントグラフス(Naupactus xanthographus)、ネクロビア属種(Necrobia 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(Otiorthynchus ligustici)、オチオリンクス・オバツス(Otiorthynchus ovatus)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス(Otiorthynchus rugosostriarius)、オチオリンクス・スルカツス(Otiorthynchus sulcatus)、オキシセトニア・ジュンクンダ(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)、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.)、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 dilat

icollis)、タニメクス・インジクス (*Tanymericus indicus*)、
 タニメクス・パリアツス (*Tanymericus 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 (*T
 enebriooides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribol
 ium spp.*)、例えば、トリボリウム・アウダキス (*Tribolium aud
 ax*)、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*) ;

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes spp.*)、例え
 ば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス
 (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes stic
 ticus*)、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・パルビコルニス (*Agromyza parvi
 cornis*)、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 (*Asphondyli
 a 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 hort
 ulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythro
 cephalae*)、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 (*Chir
 onomus spp.*)、クリソミア属種 (*Chrysomya spp.*)、クリソ
 プス属種 (*Chrysops spp.*)、クリソゾナ・ブルビアリス (*Chrysoz
 ona 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 (*C
 ontarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contari
 nia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia sch
 ulzi*)、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・ピピエンズ (*Culex pipien
 s*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciat
 us*)、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

10

20

30

40

50

(*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 melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、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 (*Hydrellia 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 (*Hypoderma* 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 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 domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella 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 (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミア属種 (*Pegomya* spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒオシヤミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophilala casei*)、プロジプロシス属種 (*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、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 (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種 (*Tetanops* spp.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チブラ・シムプレキス (*Tipula simplex*) ;

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 (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*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、アシルトシポン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonosceana* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes prolella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridar*

a malayensis)、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 (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、(*Aonidiella aurantii*)、(*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフィス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフィス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、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 glycines*)、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 illinoisensis*)、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*)、アリタイニラ属種 (*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.)、アウラコルツム・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 melaleucae*)、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*)、カコブシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコブシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala 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 (*Chlorिता 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・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・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis* 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・アパイホリア (*Dysaphis apiifol*

ia)、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 (*Empo
 asca 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・アメリカヌム (*Eriosoma
 americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanig
 erum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリト
 10
 ロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Euc
 alyptolyma* 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.)、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 (*Hyalopteru
 s arundinis*)、ヒアロプテルス・ブルニ (*Hyalopterus
 pruni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・ブル
 20
 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 cor
 ni*) (= パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium cor
 ni*))、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*)、リコルマ・デリカツラ (*Lycorma de
 licatula*)、マクロシフム属種 (*Macrosiphum* spp.)、例えば
 30
 、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 (*Macr
 osteles 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 (*M
 etcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolo
 phium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia cost
 alis*)、モネリオブシス・ペカニス (*Monelliopsis pecanis*)
 、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
 40
 リグストリ (*Myzus ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus or
 natus*)、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 (*Nason
 ovia ribisnigri*)、ネホテッチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、
 50
 10
 15
 20
 25
 30
 35
 40
 45
 50
 55
 60
 65
 70
 75
 80
 85
 90
 95
 100
 105
 110
 115
 120
 125
 130
 135
 140
 145
 150
 155
 160
 165
 170
 175
 180
 185
 190
 195
 200
 205
 210
 215
 220
 225
 230
 235
 240
 245
 250
 255
 260
 265
 270
 275
 280
 285
 290
 295
 300
 305
 310
 315
 320
 325
 330
 335
 340
 345
 350
 355
 360
 365
 370
 375
 380
 385
 390
 395
 400
 405
 410
 415
 420
 425
 430
 435
 440
 445
 450
 455
 460
 465
 470
 475
 480
 485
 490
 495
 500
 505
 510
 515
 520
 525
 530
 535
 540
 545
 550
 555
 560
 565
 570
 575
 580
 585
 590
 595
 600
 605
 610
 615
 620
 625
 630
 635
 640
 645
 650
 655
 660
 665
 670
 675
 680
 685
 690
 695
 700
 705
 710
 715
 720
 725
 730
 735
 740
 745
 750
 755
 760
 765
 770
 775
 780
 785
 790
 795
 800
 805
 810
 815
 820
 825
 830
 835
 840
 845
 850
 855
 860
 865
 870
 875
 880
 885
 890
 895
 900
 905
 910
 915
 920
 925
 930
 935
 940
 945
 950
 955
 960
 965
 970
 975
 980
 985
 990
 995
 1000
 1005
 1010
 1015
 1020
 1025
 1030
 1035
 1040
 1045
 1050
 1055
 1060
 1065
 1070
 1075
 1080
 1085
 1090
 1095
 1100
 1105
 1110
 1115
 1120
 1125
 1130
 1135
 1140
 1145
 1150
 1155
 1160
 1165
 1170
 1175
 1180
 1185
 1190
 1195
 1200
 1205
 1210
 1215
 1220
 1225
 1230
 1235
 1240
 1245
 1250
 1255
 1260
 1265
 1270
 1275
 1280
 1285
 1290
 1295
 1300
 1305
 1310
 1315
 1320
 1325
 1330
 1335
 1340
 1345
 1350
 1355
 1360
 1365
 1370
 1375
 1380
 1385
 1390
 1395
 1400
 1405
 1410
 1415
 1420
 1425
 1430
 1435
 1440
 1445
 1450
 1455
 1460
 1465
 1470
 1475
 1480
 1485
 1490
 1495
 1500
 1505
 1510
 1515
 1520
 1525
 1530
 1535
 1540
 1545
 1550
 1555
 1560
 1565
 1570
 1575
 1580
 1585
 1590
 1595
 1600
 1605
 1610
 1615
 1620
 1625
 1630
 1635
 1640
 1645
 1650
 1655
 1660
 1665
 1670
 1675
 1680
 1685
 1690
 1695
 1700
 1705
 1710
 1715
 1720
 1725
 1730
 1735
 1740
 1745
 1750
 1755
 1760
 1765
 1770
 1775
 1780
 1785
 1790
 1795
 1800
 1805
 1810
 1815
 1820
 1825
 1830
 1835
 1840
 1845
 1850
 1855
 1860
 1865
 1870
 1875
 1880
 1885
 1890
 1895
 1900
 1905
 1910
 1915
 1920
 1925
 1930
 1935
 1940
 1945
 1950
 1955
 1960
 1965
 1970
 1975
 1980
 1985
 1990
 1995
 2000
 2005
 2010
 2015
 2020
 2025
 2030
 2035
 2040
 2045
 2050
 2055
 2060
 2065
 2070
 2075
 2080
 2085
 2090
 2095
 2100
 2105
 2110
 2115
 2120
 2125
 2130
 2135
 2140
 2145
 2150
 2155
 2160
 2165
 2170
 2175
 2180
 2185
 2190
 2195
 2200
 2205
 2210
 2215
 2220
 2225
 2230
 2235
 2240
 2245
 2250
 2255
 2260
 2265
 2270
 2275
 2280
 2285
 2290
 2295
 2300
 2305
 2310
 2315
 2320
 2325
 2330
 2335
 2340
 2345
 2350
 2355
 2360
 2365
 2370
 2375
 2380
 2385
 2390
 2395
 2400
 2405
 2410
 2415
 2420
 2425
 2430
 2435
 2440
 2445
 2450
 2455
 2460
 2465
 2470
 2475
 2480
 2485
 2490
 2495
 2500
 2505
 2510
 2515
 2520
 2525
 2530
 2535
 2540
 2545
 2550
 2555
 2560
 2565
 2570
 2575
 2580
 2585
 2590
 2595
 2600
 2605
 2610
 2615
 2620
 2625
 2630
 2635
 2640
 2645
 2650
 2655
 2660
 2665
 2670
 2675
 2680
 2685
 2690
 2695
 2700
 2705
 2710
 2715
 2720
 2725
 2730
 2735
 2740
 2745
 2750
 2755
 2760
 2765
 2770
 2775
 2780
 2785
 2790
 2795
 2800
 2805
 2810
 2815
 2820
 2825
 2830
 2835
 2840
 2845
 2850
 2855
 2860
 2865
 2870
 2875
 2880
 2885
 2890
 2895
 2900
 2905
 2910
 2915
 2920
 2925
 2930
 2935
 2940
 2945
 2950
 2955
 2960
 2965
 2970
 2975
 2980
 2985
 2990
 2995
 3000
 3005
 3010
 3015
 3020
 3025
 3030
 3035
 3040
 3045
 3050
 3055
 3060
 3065
 3070
 3075
 3080
 3085
 3090
 3095
 3100
 3105
 3110
 3115
 3120
 3125
 3130
 3135
 3140
 3145
 3150
 3155
 3160
 3165
 3170
 3175
 3180
 3185
 3190
 3195
 3200
 3205
 3210
 3215
 3220
 3225
 3230
 3235
 3240
 3245
 3250
 3255
 3260
 3265
 3270
 3275
 3280
 3285
 3290
 3295
 3300
 3305
 3310
 3315
 3320
 3325
 3330
 3335
 3340
 3345
 3350
 3355
 3360
 3365
 3370
 3375
 3380
 3385
 3390
 3395
 3400
 3405
 3410
 3415
 3420
 3425
 3430
 3435
 3440
 3445
 3450
 3455
 3460
 3465
 3470
 3475
 3480
 3485
 3490
 3495
 3500
 3505
 3510
 3515
 3520
 3525
 3530
 3535
 3540
 3545
 3550
 3555
 3560
 3565
 3570
 3575
 3580
 3585
 3590
 3595
 3600
 3605
 3610
 3615
 3620
 3625
 3630
 3635
 3640
 3645
 3650
 3655
 3660
 3665
 3670
 3675
 3680
 3685
 3690
 3695
 3700
 3705
 3710
 3715
 3720
 3725
 3730
 3735
 3740
 3745
 3750
 3755
 3760
 3765
 3770
 3775
 3780
 3785
 3790
 3795
 3800
 3805
 3810
 3815
 3820
 3825
 3830
 3835
 3840
 3845
 3850
 3855
 3860
 3865
 3870
 3875
 3880
 3885
 3890
 3895
 3900
 3905
 3910
 3915
 3920
 3925
 3930
 3935
 3940
 3945
 3950
 3955
 3960
 3965
 3970
 3975
 3980
 3985
 3990
 3995
 4000
 4005
 4010
 4015
 4020
 4025
 4030
 4035
 4040
 4045
 4050
 4055
 4060
 4065
 4070
 4075
 4080
 4085
 4090
 4095
 4100
 4105
 4110
 4115
 4120
 4125
 4130
 4135
 4140
 4145
 4150
 4155
 4160
 4165
 4170
 4175
 4180
 4185
 4190
 4195
 4200
 4205
 4210
 4215
 4220
 4225
 4230
 4235
 4240
 4245
 4250
 4255
 4260
 4265
 4270
 4275
 4280
 4285
 4290
 4295
 4300
 4305
 4310
 4315
 4320
 4325
 4330
 4335
 4340
 4345
 4350
 4355
 4360
 4365
 4370
 4375
 4380
 4385
 4390
 4395
 4400
 4405
 4410
 4415
 4420
 4425
 4430
 4435
 4440
 4445
 4450
 4455
 4460
 4465
 4470
 4475
 4480
 4485
 4490
 4495
 4500
 4505
 4510
 4515
 4520
 4525
 4530
 4535
 4540
 4545
 4550
 4555
 4560
 4565
 4570
 4575
 4580
 4585
 4590
 4595
 4600
 4605
 4610
 4615
 4620
 4625
 4630
 4635
 4640
 4645
 4650
 4655
 4660
 4665
 4670
 4675
 4680
 4685
 4690
 4695
 4700
 4705
 4710
 4715
 4720
 4725
 4730
 4735
 4740
 4745
 4750
 4755
 4760
 4765
 4770
 4775
 4780
 4785
 4790
 4795
 4800
 4805
 4810
 4815
 4820
 4825
 4830
 4835
 4840
 4845
 4850
 4855
 4860
 4865
 4870
 4875
 4880
 4885
 4890
 4895
 4900
 4905
 4910
 4915
 4920
 4925
 4930
 4935
 4940
 4945
 4950
 4955
 4960
 4965
 4970
 4975
 4980
 4985
 4990
 4995
 5000
 5005
 5010
 5015
 5020
 5025
 5030
 5035
 5040
 5045
 5050
 5055
 5060
 5065
 5070
 5075
 5080
 5085
 5090
 5095
 5100
 5105
 5110
 5115
 5120
 5125
 5130
 5135
 5140
 5145
 5150
 5155
 5160
 5165
 5170
 5175
 5180
 5185
 5190
 5195
 5200
 5205
 5210
 5215
 5220
 5225
 5230
 5235
 5240
 5245
 5250
 5255
 5260
 5265
 5270
 5275
 5280
 5285
 5290
 5295
 5300
 5305
 5310
 5315
 5320
 5325
 5330
 5335
 5340
 5345
 5350
 5355
 5360
 5365
 5370
 5375
 5380
 5385
 5390
 5395
 5400
 5405
 5410
 5415
 5420
 5425
 5430
 5435
 5440
 5445
 5450
 5455
 5460
 5465
 5470
 5475
 5480
 5485
 5490
 5495
 5500
 5505
 5510
 5515
 5520
 5525
 5530
 5535
 5540
 5545
 5550
 5555
 5560
 5565
 5570
 5575
 5580
 5585
 5590
 5595
 5600
 5605
 5610
 5615
 5620
 5625
 5630
 5635
 5640
 5645
 5650
 5655
 5660
 5665
 5670
 5675
 5680
 5685
 5690
 5695
 5700
 5705
 5710
 5715
 5720
 5725
 5730
 5735
 5740
 5745
 5750
 5755
 5760
 5765
 5770
 5775
 5780
 5785
 5790
 5795
 5800
 5805
 5810
 5815
 5820
 5825
 5830
 5835
 5840
 5845
 5850
 5855
 5860
 5865
 5870
 5875
 5880
 5885
 5890
 5895
 5900
 5905
 5910
 5915
 5920
 5925
 5930
 5935
 5940
 5945
 5950
 5955
 5960
 5965
 5970
 5975
 5980
 5985
 5990
 5995
 6000
 6005
 6010
 6015
 6020
 6025
 6030
 6035
 6040
 6045
 6050
 6055
 6060
 6065
 6070
 6075
 6080
 6085
 6090
 6095
 6100
 6105
 6110
 6115
 6120
 6125
 6130
 6135

シア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*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*)、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.)、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 oxyacanthae*)、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・ネグレクトア (*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・グラミンム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus articulatus*)、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.)、スチクトセファラ・フェスチナ (*Stictocephala festina*)、シホニヌス・フィ

10

20

30

40

50

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 (*Tetr
 agocephela spp.*)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tin
 ocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種 (*Tomaspis s
 pp.*)、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
 (*Trialeurodes 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.*)、ウナスピス属種 (*Unaspis
 spp.*)、ビテウス・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、アナサ・トリスチス (*Anas
 a 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 (*Ca
 mpylomma 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 (*C
 imex adjunctus*)、シメキス・ヘミプテルス (*Cimex hemip
 terus*)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、シ
 メキス・ピロセルス (*Cimex pilosellus*)、コラリア属種 (*Colla
 ria spp.*)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilu
 tus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フル
 カツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウエッチ (*Dic
 onocoris hewetti*)、ジスデルクス属種 (*Dysdercus spp
 .*)、エウスキスツス属種 (*Euschistus spp.*)、例えば、エウスキスツ
 ス・ヘロス (*Euschistus heros*)、エウスキスツス・セルプス (*Eus
 chistus servus*)、エウスキスツス・トリスチグムス (*Euschist
 us tristigmus*)、エウスキスツス・バリオラリウス (*Euschistu
 s variolarius*)、エウリガステル属種 (*Eurygaster spp.
 .*)、ハリオモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオバルチス
 属種 (*Heliopeletis spp.*)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias
 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 occidentalis
 .*)、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 (*Ly
 gocoris 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 (*Lygu
 s hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)
 、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、モナロニオ
 ン・アトラツム (*Monalonia atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara
 spp.*)、例えば、ネザラ・ビリズラ (*Nezara viridula*)、オエバ
 ルス属種 (*Oebalus spp.*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma qua
 drata*)、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 guildinii*)、プサルス属種 (*Psallu
 s spp.*)、プセウダシスタ・ベルセア (*Pseudacysta p
 ersea*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius spp.*)、サーベルゲラ・シン
 グラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カス
 タネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scoti*

nophora 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 (*Triatom*
a spp.) ;

ハチ目 (*Hymenoptera*) の、例えば、アクロミルメキス属種 (*Acromy*
rmex 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.)、ジブリ
オン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジブリオン・シミリス (*Dipri*
on 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
スツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasi*
us spp.)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharao*
nis)、シレキス属種 (*Sirex* spp.)、ソレノプシス・インビクタ (*Sol*
enopsis invicta)、タピノマ属種 (*Tapinoma* spp.)、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*)、キセリス属種 (*Xeris*
spp.) ;

10

ワラジムシ目 (*Isopoda*) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Arma*
dillidium vulgare)、オニスクス・アセルス (*Oniscus as*
ellus)、ボルセリオ・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 (*Coptoter*
mes spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (*Coptoter*
mes formosanus)、コルニテルメス・クムランス (*Cornitermes c*
umulans)、クリプトテルメス属種 (*Cryptotermes* spp.)、イ
ンシシテルメス属種 (*Incisitermes* spp.)、マイクロテルメス・オベシ
(*Microtermes obesi*)、オドントテルメス属種 (*Odontoter*
mes 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 flav*
ipes)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesp*
erus) ;

20

チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achro*
ia grisella)、アクロニクタ・マジョル (*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 (*Aed*
ia 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 epsilon*)、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*
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 (*Argyroproce* spp.)、バラトラ・ブラシカ
エ (*Barathra brassicae*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cin*
nara)、ブククラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurbe*
riella)、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* s
pp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプ
ア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルボカプサ・ポモネラ (*Ca*
rpocapsa pomonella)、カルボシナ・ニボネンシス (*Carposi*
na niponensis)、ケイマトビア・ブルマタ (*Cheimatobia b*
rumata)、キロ属種 (*Chilo* spp.)、例えば、キロ・ブレジャデルス (

30

40

50

Mocis spp.)、モノピス・オブイエラ (*Monopis obviella*)、
 ミチムナ・セパラタ (*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.*)、オリア属種 (*Or*
ia spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga spp.*)、オストリニア属種 (*O*
strinia spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia*
nubilalis)、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、
 オウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、パノリス・フランメア (*Pano*
lis 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 (10
Pectinophora gossypiella)、ペリレウコプテラ属種 (*Per*
ileucoptera spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea s*
pp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operc*
ulella)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citr*
ella)、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 blanca*
rdella)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonorycter c*
rataegella)、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 (*Platynota*
stultana)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia interp*
nctella)、ブルシア属種 (*Plusia spp.*)、ブルテラ・キシロステラ (20
Plutella xylostella) (=ブルテラ・マクリペンニス (*Plut*
ella maculipennis))、プライス属種 (*Prays spp.*)、プ
 ロデニア属種 (*Prodenia spp.*)、プロトバルセ属種 (*Protoparc*
e 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 unipuncta*)、プセ
 ウドブルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピ
 ラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキブルシア・ヌ (30
Rachiplusia nu)、スコエノビウス属種 (*Schoenobius sp*
pp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (*Schoenobius bip*
unctifer)、シルポファガ属種 (*Scirpophaga spp.*)、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 (*Sparganotheris spp.*)、スポドプテラ属種 (*Spod*
optera 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 exigu*
a)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*)、
 スポドプテラ・ブラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモボ
 ダ属種 (*Stathmopoda spp.*)、ストモプテリキス・スブセシベラ (40
Stomopteryx subsecivella)、シナンテドン属種 (*Synanth*
edon spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、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 pel*
lionella)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、
 トルトリキス属種 (*Tortrix spp.*)、トリコファガ・タペトゼラ (
Trichophaga tapetzella)、トリコブルシア属種 (*Tricho*
plusia spp.)、例えば、トリコブルシア・ニ (*Trichoplusia*
ni)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、
 ッタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ピラコラ属種 (*Virachola* 50

spp.);

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Acheta 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*)、パラトランチクス・ウスリエンシス (*Paratlanticus ussuriensis*)、スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*);

10

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・バスタトリキス (*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.)、リボセリス属種 (*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*)、プレクス・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*);

20

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*)、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 fuscata*)、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*)、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*)、リビホトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニノトリプス・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*);

30

40

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*

50

lla spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ (*Scutigereella 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.) ;

扁形動物門 (*Platyhelminthes*) 及び線形動物門 (*Nematoda*) の、動物及びヒトの寄生生物、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.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala* spp.)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、アスカリジア属種 (*Ascaridia* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、クロノルキス属種 (*Clonorchis* spp.)、コオペリア属種 (*Cooperia* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、シアトストマ属種 (*Cyathostoma* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、ジフィリジウム属種 (*Dipylidium* spp.)、ジロフィラリア (*Dirofilaria* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、エキノコックス属種 (*Echinococcus* spp.)、エキノストマ属種 (*Echinostoma* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス属種 (*Fascioloides* spp.)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、フィロロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ハプロネマ属種 (*Habronema* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostromylus* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、メトルキス属種 (*Metorchis* spp.)、メソセストイデス属種 (*Mesocestoides* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* 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.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、オスレルス属種 (*Osleru*

10

20

30

40

50

s spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パッサルルス属種 (*Passalurus* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スキストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* 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.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* 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.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)、トリコビルハルジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* 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・ロンギカウザツス (*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・スキシロフィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属種 (*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 (*Criconemoiides* spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemoiides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoiides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoiides 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 (*Globode*

ra 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 (*Hemicriconemoides* 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*)、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*)、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 (*Quinisulcius* 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・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*)。

【0040】

さらにまた、原生動物亜界 (*Protozoa*) の、コクシジウム目 (*Coccidia*)、例えば、エイメリア属種 (*Eimeria* spp.) なども防除することができる。

【0041】

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、ウイ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。適切な場合には、式 (I) で表される化合

物は、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。

【0042】

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。

10

【0043】

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）、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。

20

【0044】

これらは、好ましくは、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 protectant）、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増強する成分であって、その成分自体が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。

30

【0045】

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調製する。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。

40

【0046】

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。

【0047】

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

50

イン類、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、置換されていない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)。

【0048】

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、鉱油留分、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。

10

【0049】

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、芳香族炭化水素又は脂肪族炭化水素、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、さらに、水である。

20

【0050】

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。有用な担体としては、特に、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、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリン、クレー、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、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ、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、無機及び有機の粗びき粉からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料(例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄など)からなる顆粒。

30

【0051】

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、周囲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、エアゾル噴射剤ガス、例えば、ハロ炭化水素類、並びに、さらに、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

40

【0052】

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、これらの界面活性剤の混合物の例は、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ールフェノール)の重縮合物、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導體(好ましくは、アルキルタウレ

50

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。

【0053】

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(P r u s s i a n B l u e)、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。

10

【0054】

付加的な成分は、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り得る。泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

【0055】

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。さらなる可能な補助剤は、鉱油及び植物油である。

20

【0056】

場合により、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。

30

【0057】

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。

【0058】

本発明に関連して適切な浸透剤は、植物体内への農薬活性化合物の浸透を促進するために通常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(cocconut 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。

40

【0059】

50

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、特に好ましくは、0.01重量%～95重量%の式(I)で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.5重量%～90重量%の式(I)で表される化合物を含んでいる。

【0060】

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。

10

【0061】

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、作用の持続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(repulsion)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)、有益種、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として使用することも可能である。さらに、この種の活性化化合物組合せは、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、湧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。

20

【0062】

さらに、式(I)で表される化合物は、別の活性化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(bird repellent)、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ができる。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)を向上させるための作用剤と混合して使用することも可能である。

30

【0063】

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、以下に記載されている化合物)と混合された状態で存在している。

【0064】

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。有用な混合成分の例は、以下の化合物である。

40

【0065】

殺虫剤/殺ダニ剤/殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって識別されている活性化化合物は、既知であり、そして、例えば、農薬ハンドブック("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見いだすことができる(例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」)

50

【 0 0 6 6 】

(1) アセチルコリンエステラーゼ (A C h E) 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、カルパリル、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、X M C、及び、キシリルカルブ；又は、

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、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、E P N、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、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、パラチオン - メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロベタムホス、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、テメホス、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、パミドチオン；

(2) G A B A 制御塩化物チャンネル拮抗薬、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；

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター / 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、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 [(1 R) - トランス異性体]、デルタメトリン、エムペントリン [(E Z) - (1 R) 異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルパリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1 R) - トランス異性体]、プラレトリン、ピレトリン類 (除虫菊 (p y r e t h r u m))、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 [(1 R) 異性体]、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

D D T；又は、メトキシクロル；

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (n A C h R) 作動薬、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；

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (n A C h R) のアロステリック活性化薬、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；

10

20

30

40

50

- (6) 塩化物チャンネル活性化薬、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；
- (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；
- (8) 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、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、フッ化スルフルル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石；
- (9) 選択的摂食阻害薬、例えば、ピメトロジン；又は、フロニカミド；
- (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；
- (11) 昆虫腸管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植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1；
- (12) 酸化的リン酸化阻害薬、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；
- (13) Hプロトン勾配を遮断する酸化的リン酸化デカップラー、例えば、クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルラミド；
- (14) ニコチン作動性アセチルコリン受容体拮抗薬、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；
- (15) キチン生合成阻害薬(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、ノピフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン；
- (16) キチン生合成阻害薬(タイプ1)、例えば、ブプロフェジン；
- (17) 脱皮阻害薬(特に、双翅目(即ち、双翅類)に関する)、例えば、シロマジン；
- (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、テプフェノジド；
- (19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、アミトラズ；
- (20) 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；

(21) 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)；

(22) 電位制御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；

(23) アセチル CoA カルボキシラーゼの阻害薬、例えば、
テ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；

(24) 複合体 IV 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；

(25) 複合体 II 電子伝達阻害薬、例えば、
シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン；

(28) リアノジン受容体エフェクター、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；

さらなる活性化合物、例えば、アフィドピロベン、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、プロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石 (
cryolite)、ジコホル、ジフロピダジン、フルエンシルボン、フロメトキン、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、フルオピラム、フルピラ
ジフロン、フフェノジド (fufenozide)、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ
、イプロジオン、メベルフルトリン、パイコングディング (paichongding)
、ピフルブミド、ピリフルキナゾン、ピリミノストロピン、テトラメチルフルトリン、及
び、ヨードメタン；並びに、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、
さらに、以下の化合物：3-プロモ-N-{2-プロモ-4-クロロ-6-[(1-シク
ロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)
-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (WO2005/077934 から既知)、及び
1-{2-フルオロ-4-メチル-5-[(2,2,2-トリフルオロエチル)スル
フィニル]フェニル}-3-(トリフルオロメチル)-1H-1,2,4-トリアゾール
-5-アミン (WO2006/043635 から既知)、{1'-[(2E)-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(2H)-イル}(2-クロロピリジン-4-イル)メタノ
ン (WO2003/106457 から既知)、2-クロロ-N-[2-{1-[(2E)
-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 (WO2006/00349
4 から既知)、3-(2,5-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 (WO2009/049851
から既知)、3-(2,5-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 (WO2009
/049851 から既知)、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 (WO2004/09916
0 から既知)、4-(ブタ-2-イン-1-イルオキシ)-6-(3-クロロフェニル)
ピリミジン (WO2003/076415 から既知)、PF1364 (CAS-Reg.
No. 1204776-60-2)、4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(
トリフルオロメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-2-メ
チル-N-{2-オキソ-2-[(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ]エチル}
ベンズアミド (WO2005/085216 から既知)、4-{5-[3-クロロ-5-

10

20

30

40

50

(トリフルオロメチル)フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル} - N - { 2 - オキソ - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)アミノ]エチル} - 1 - ナフタミド (WO 2009/002809 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]カルボニル}アミノ) - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]カルボニル}アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]カルボニル}アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、2 - [3, 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]カルボニル}アミノ)ベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2005/085216 から既知)、1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - N - [4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル)フェニル] - 3 - {[5 - (トリフルオロメチル) - 2 H - テトラゾール - 2 - イル]メチル} - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010/069502 から既知)、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 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (CN 102057925 から既知)、3 - クロロ - N - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N - [4 - (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘプタフルオロプロパン - 2 - イル) - 2 - メチルフェニル]フタルアミド (WO 2012/034472 から既知)、8 - クロロ - N - [(2 - クロロ - 5 - メトキシフェニル)スルホニル] - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [1, 2 - a]ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2010/129500 から既知)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチエタン - 3 - イル)ベンズアミド (WO 2009/080250 から既知)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチエタン - 3 - イル)ベンズアミド (WO 2012/029672 から既知)、1 - [(2 - クロロ - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル)メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H - ピリド [1, 2 - a]ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2009/099929 から既知)、1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル)メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H - ピリド [1, 2 - a]ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2009/099929 から既知)、(5S, 8R) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル)メチル] - 9 - ニトロ - 2, 3, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - 1 H - 5, 8 - エポキシイミダゾ [1, 2 - a]アゼピン (WO 2010/069266 から既知)、(2E) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル)メチル] - N' - ニトロ - 2 - ペンチリデンヒドラジンカルボキシイミドアミド (WO 2010/060231 から既知)、4 - (3 - {2, 6 - ジクロロ - 4 - [(3, 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン - 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)ピリミジン (CN 101337940 から既知)、N - [2 - (tert - ブチルカルバモイル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 3 - (フルオロメトキシ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2008/134969 から既知)。

【0067】

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」に記載されているか、又は、イン

10

20

30

40

50

ターネット上に記載されている（例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」）。

【0068】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.1)アルジモルフ、(1.2)アザコナゾール、(1.3)ビテルタノール、(1.4)プロムコナゾール、(1.5)シプロコナゾール、(1.6)ジクロブトラゾール、(1.7)ジフェノコナゾール、(1.8)ジニコナゾール、(1.9)ジニコナゾール-M、(1.10)ドデモルフ、(1.11)酢酸ドデモルフ、(1.12)エポキシコナゾール、(1.13)エタコナゾール、(1.14)フェナリモール、(1.15)フェンブコナゾール、(1.16)フェンヘキサミド、(1.17)フェンプロピジン、(1.18)フェンプロピモルフ、(1.19)フルキンコナゾール、(1.20)フルルプリミドール、(1.21)フルシラゾール、(1.22)フルトリアホール、(1.23)フルコナゾール、(1.24)フルコナゾール-シス、(1.25)ヘキサコナゾール、(1.26)イマザリル、(1.27)硫酸イマザリル、(1.28)イミベンコナゾール、(1.29)イブコナゾール、(1.30)メトコナゾール、(1.31)マイクロブタニル、(1.32)ナフチフィン、(1.33)ヌアリモール、(1.34)オキシポコナゾール、(1.35)パクロブトラゾール、(1.36)ペフラゾエート、(1.37)ペンコナゾール、(1.38)ピペラリン、(1.39)プロクロラズ、(1.40)プロピコナゾール、(1.41)プロチオコナゾール、(1.42)ピリブチカルブ、(1.43)ピリフェノックス、(1.44)キンコナゾール、(1.45)シメコナゾール、(1.46)スピロキサミン、(1.47)テブコナゾール、(1.48)テルピナフィン、(1.49)テトラコナゾール、(1.50)トリアジメホン、(1.51)トリアジメノール、(1.52)トリデモルフ、(1.53)トリフルミゾール、(1.54)トリホリン、(1.55)トリチコナゾール、(1.56)ウニコナゾール、(1.57)ウニコナゾール-P、(1.58)ビニコナゾール、(1.59)ポリコナゾール、(1.60)1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタノール、(1.61)1-(2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル、(1.62)N'-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロボキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.63)N-エチル-N-メチル-N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)プロボキシ]フェニル}イミドホルムアミド、及び、(1.64)O-[1-(4-メトキシフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-イル]1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、(1.65)ピリソキサゾール；

(2) 呼吸阻害薬（呼吸鎖阻害薬）、例えば、(2.1)ピキサフェン、(2.2)ボスカリド、(2.3)カルボキシシン、(2.4)ジフルメトリム、(2.5)フェンフラム、(2.6)フルオピラム、(2.7)フルトラニル、(2.8)フルキサピロキサド、(2.9)フラメトピル、(2.10)フルメシクロックス、(2.11)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）、(2.12)イソピラザム（アンチ-エピマー性ラセミ化合物）、(2.13)イソピラザム（アンチ-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9S）、(2.14)イソピラザム（アンチ-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9R）、(2.15)イソピラザム（シン-エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9RS）、(2.16)イソピラザム（シン-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9R）、(2.17)イソピラザム（シン-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9S）、(2.18)メプロニル、(2.19)オキシカルボキシシン、(2.20)ペンフルフェン、(2.21)ペンチオピラド、(2.22)セダキサシン、(2.23)チフルザミド、(2.24)1-メチル-N-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.25)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[

10

20

30

40

50

2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 2 6) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロポキシ) フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 2 7) 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 . 2 8) 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 . 2 9) ベンゾビンジフルピル、 (2 . 3 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、及び、 (2 . 3 1) 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 . 3 2) 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 - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 3) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 4) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 5) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 6) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 7) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 8) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 9) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 4 0) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 4 1) ベノダニル、 (2 . 4 2) 2 - クロロ - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド、 (2 . 4 3) イソフェタミド ;

(3) 呼吸鎖の複合体 I I I に対して作用する呼吸阻害薬 (呼吸鎖阻害薬) 、例えば、 (3 . 1) アメトクトラジン、 (3 . 2) アミスルプロム、 (3 . 3) アゾキシストロビン、 (3 . 4) シアゾファミド、 (3 . 5) クメトキシストロビン (coumethoxytrobilin) 、 (3 . 6) クモキシストロビン、 (3 . 5) ジモキシストロビン、 (3 . 8) ネンストロブリン、 (3 . 9) ファモキサドン、 (3 . 1 0) フェンアミドン、 (3 . 1 1) フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobilin) 、 (3 . 1 2) フルオキサストロビン、 (3 . 1 3) クレソキシム - メチル、 (3 . 1 4) メトミノストロビン、 (3 . 1 5) オリサストロビン、 (3 . 1 6) ピコキシストロビン、 (3 . 1 7) ピラクロストロビン、 (3 . 1 8) ピラメトストロビン、 (3 . 1 9) ピラオキシストロビン、 (3 . 2 0) ピリベンカルブ、 (3 . 2 1) トリクロピリカルブ、 (3 . 2 2) トリフロキシストロビン、 (3 . 2 3) (2 E) - 2 - (2 - { [6 - (3 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ) - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル] オキシ } フェニル) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルエタンアミド、 (3 . 2 4) (2 E) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - (2 - { [({ (1 E) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン } アミノ) オキシ] メチル } フェニル) エタンアミド

、(3.25)(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル]フェニル}エタンアミド、(3.26)(2E)-2-{2-[({[(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルエチル]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-メチルエタンアミド、(3.27)(2E)-2-{2-[({[(2E,3E)-4-(2,6-ジクロロフェニル)ブタ-3-エン-2-イリデン]アミノ}オキシ)メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3.28)2-クロロ-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、(3.29)5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン]アミノ}オキシ)メチル}フェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(3.30)(2E)-2-{2-[({シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}スルファニル)メチル]フェニル}-3-メトキシプロパ-2-エン酸メチル、(3.31)N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.32)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；

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.1)ベノミル、(4.2)カルベンダジム、(4.3)クロルフェナゾール、(4.4)ジエトフェンカルブ、(4.5)エタボキサム、(4.6)フルオピコリド、(4.7)フベリダゾール、(4.8)ペンシクロン、(4.9)チアベンダゾール、(4.10)チオファネート-メチル、(4.11)チオファネート、(4.12)ゾキサミド、(4.13)5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、及び、(4.14)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；

(5) 多部位に活性を示す化合物、例えば、(5.1)ボルドー液、(5.2)カプタホール、(5.3)キャプタン、(5.4)クロロタロニル、(5.5)銅剤(例えば、水酸化銅)、(5.6)ナフテン酸銅、(5.7)酸化銅、(5.8)塩基性塩化銅、(5.9)硫酸銅、(5.10)ジクロフルアニド、(5.11)ジチアノン、(5.12)ドジン、(5.13)ドジン遊離塩基、(5.14)ファーバム、(5.15)フルオロホルペット、(5.16)ホルペット、(5.17)グアザチン、(5.18)酢酸グアザチン、(5.19)イミノクタジン、(5.20)イミノクタジンアルベシル酸塩、(5.21)イミノクタジン三酢酸塩、(5.22)マンカップー、(5.23)マンゼブ、(5.24)マンネブ、(5.25)メチラム、(5.26)メチラム亜鉛(zinc metiram)、(5.27)オキシシン銅(copper-oxine)、(5.28)プロパミジン(propamidine)、(5.29)プロピネブ、(5.30)硫黄及び硫黄剤(例えば、多硫化カルシウム)、(5.31)チウラム、(5.32)トリルフルアニド、(5.33)ジネブ、(5.34)ジラム、及び、(5.35)アニラジン；

(6) 抵抗性誘導物質、例えば、(6.1)アシベンゾラル-S-メチル、(6.2)イソチアニル、(6.3)プロベナゾール、(6.4)チアジニル、及び、(6.5)ラミナリン(laminarin)；

(7) アミノ酸及びタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.1)、(7.2)ブラストサイジン-S、(7.3)シプロジニル、(7.4)カスガマイシン、(7.5)カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.6)メパニピリム、(7.7)ピリメタニル、(7.8)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、及び、(7.9)オキシテトラサイクリン、及び、(7.10)ストレプトマイシン；

(8) ATP産生阻害薬、例えば、(8.1)酢酸トリフェニルスズ、(8.2)塩

10

20

30

40

50

化トリフェニルスズ、(8 . 3) 水酸化トリフェニルスズ、及び、(8 . 4) シルチオファミン；

(9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9 . 1) ベンチアバリカルブ、(9 . 2) ジメトモルフ、(9 . 3) フルモルフ、(9 . 4) イプロバリカルブ、(9 . 5) マンジプロパミド、(9 . 6) ポリオキシン、(9 . 7) ポリオキシリム、(9 . 8) バリダマイシン、(9 . 9) バリフェナレート、及び、(9 . 10) ポリオキシン B ；

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10 . 1) ビフェニル、(10 . 2) クロロネブ (chlorneb)、(10 . 3) ジクロラン、(10 . 4) エジフェンホス、(10 . 5) エトリジアゾール、(10 . 6) ヨードカルブ (iodocarb)、(10 . 7) イプロベンホス、(10 . 8) イソプロチオラン、(10 . 9) プロパモカルブ、(10 . 10) プロパモカルブ塩酸塩、(10 . 11) プロチオカルブ、(10 . 12) ピラゾホス、(10 . 13) キントゼン、(10 . 14) テクナゼン、及び、(10 . 15) トルクロホス - メチル；

(11) メラニン生合成阻害薬、例えば、(11 . 1) カルプロパミド、(11 . 2) ジクロシメット、(11 . 3) フェノキサニル、(11 . 4) フタリド、(11 . 5) ピロキロン、(11 . 6) トリシクラゾール、及び、(11 . 7) { 3 - メチル - 1 - [(4 - メチルベンゾイル) アミノ] ブタン - 2 - イル } カルバミン酸 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル；

(12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12 . 1) ベナラキシル、(12 . 2) ベナラキシル - M (キララキシル (kiralexyl))、(12 . 3) ブピリメート、(12 . 4) クロジラコン、(12 . 5) ジメチリモール、(12 . 6) エチリモール、(12 . 7) フララキシル、(12 . 8) ヒメキサゾール、(12 . 9) メタラキシル、(12 . 10) メタラキシル - M (メフェノキサム)、(12 . 11) オフラセ、(12 . 12) オキサジキシル、(12 . 13) オキシリン酸、及び、(12 . 14) オクチリノン；

(13) シグナル伝達阻害薬、例えば、(13 . 1) クロゾリネート、(13 . 2) フェンピクロニル、(13 . 3) フルジオキシソニル、(13 . 4) イプロジオン、(13 . 5) プロシミドン、(13 . 6) キノキシフェン、(13 . 7) ピンクロゾリン、及び、(13 . 8) プロキナジド；

(14) デカップラー、例えば、(14 . 1) ビナパクリル、(14 . 2) ジノカップ、(14 . 3) フェリムゾン、(14 . 4) フルアジナム、及び、(14 . 5) メブチルジノカップ；

(15) さらなる化合物、例えば、(15 . 1) ベンチアゾール、(15 . 2) ベトキサジン、(15 . 3) カプシマイシン (capsimycin)、(15 . 4) カルボン、(15 . 5) キノメチオネート、(15 . 6) ピリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、(15 . 7) クフラネブ、(15 . 8) シフルフェナミド、(15 . 9) シモキサニル、(15 . 10) シプロスルファミド、(15 . 11) ダゾメット、(15 . 12) デバカルブ、(15 . 13) ジクロロフェン、(15 . 14) ジクロメジン、(15 . 15) ジフェンゾコート、(15 . 16) ジフェンゾコートメチル硫酸塩、(15 . 17) ジフェニルアミン、(15 . 18) エコメイト、(15 . 19) フェンピラザミン、(15 . 20) フルメトベル、(15 . 21) フルオルイミド、(15 . 22) フルスルファミド、(15 . 23) フルチアニル、(15 . 24) ホセチル - アルミニウム、(15 . 25) ホセチル - カルシウム、(15 . 26) ホセチル - ナトリウム、(15 . 27) ヘキサクロロベンゼン、(15 . 28) イルマイシン、(15 . 29) メタスルホカルブ、(15 . 30) イソチオシアン酸メチル、(15 . 31) メトラフェノン、(15 . 32) ミルディオマイシン、(15 . 33) ナタマイシン、(15 . 34) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15 . 35) ニトロタル - イソプロピル、(15 . 36) オクチリノン、(15 . 37) オキサモカルブ (oxamocarb)、(15 . 38) オキシフェンチン (oxyfenthin)、(15 . 39) ペンタクロロフェノール及びその塩、(15 . 40) フェノトリン、(15 . 41) リン酸

10

20

30

40

50

及びその塩、(15.42)プロパモカルブ - ホセチレート (propamocarb - f o s e t y l a t e)、(15.43)プロパノシン - ナトリウム (propanosine - sodium)、(15.44)ピリモルフ、(15.45)(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、(15.46)(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、(15.47)ピロールニトリン、(15.48)テブフロキン、(15.49)テクロフタラム、(15.50)トルニファニド、(15.51)トリアゾキシド、(15.52)トリクラミド、(15.53)ザリラミド、(15.54)(3S, 6S, 7R, 8R) - 8 - ベンジル - 3 - [({ 3 - [(イソブチルオキシ)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、(15.55)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、(15.56)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、(15.57)1 - (4 - { 4 - [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、(15.58)1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 3, 3 - ジメチルブタン - 2 - イル 1H - イミダゾール - 1 - カルボキシレート、(15.59)2, 3, 5, 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル)ピリジン、(15.60)2, 3 - ジブチル - 6 - クロロチエノ [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン、(15.61)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) - テトロン、(15.62)2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [(5R) - 5 - 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、(15.63)2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [(5S) - 5 - 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、(15.64)2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - { 4 - [4 - (5 - 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、(15.65)2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル - 4H - クロメン - 4 - オン、(15.66)2 - クロロ - 5 - [2 - クロロ - 1 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル]ピリジン、(15.67)2 - フェニルフェノール及び塩、(15.68)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、(15.69)3, 4, 5 - トリクロロピリジン - 2, 6 - ジカルボニトリル、(15.70)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、(15.71)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、(15.72)5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、(15.73)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 - スルホノヒドラジド、(15.74)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、(15.75)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、(15.76)5 - メチル - 6 - オクチ

10

20

30

40

50

ル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、 (1 5 . 7 7) (2 Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリル酸エチル、 (1 5 . 7 8) N ' - (4 - { [3 - (4 - クロロベンジル) - 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - 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 5 . 7 9) N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、 (1 5 . 8 0) N - [(4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、 (1 5 . 8 1) N - [(5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2 , 4 - ジクロロニコチンアミド、 (1 5 . 8 2) N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 , 4 - ジクロロニコチンアミド、 (1 5 . 8 3) N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードニコチンアミド、 (1 5 . 8 4) N - { (E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、 (1 5 . 8 5) N - { (Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、 (1 5 . 8 6) N ' - { 4 - [(3 - t e r t - ブチル - 4 - シアノ - 1 , 2 - チアゾール - 5 - イル) オキシ] - 2 - クロロ - 5 - 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 5 . 8 7) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 8 8) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 R) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 8 9) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 S) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 9 0) { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - 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 } カルバミン酸ペンチル、 (1 5 . 9 1) フェナジン - 1 - カルボン酸、 (1 5 . 9 2) キノリン - 8 - オール、 (1 5 . 9 3) キノリン - 8 - オールスルフェート (2 : 1)、 (1 5 . 9 4) { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - 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 t e r t - ブチル、 (1 5 . 9 5) 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) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 9 6) N - (4 ' - クロロビフェニル - 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、 (1 5 . 9 7) N - (2 ' , 4 ' - ジクロロビフェニル - 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、 (1 5 . 9 8) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 9 9) N - (2 ' , 5 ' - ジフルオロビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 0) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 1) 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 2) 2 - クロロ - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、 (1 5 . 1 0 3) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 4) N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イ

ル) ピフェニル - 2 - イル] - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4
 - カルボキサミド、(15 . 105) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (4 ' - エチニル
 ピフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15
 . 106) N - (4 ' - エチニルピフェニル - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメ
 チル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15 . 107) 2 - クロロ - N - (4
 ' - エチニルピフェニル - 2 - イル) ニコチンアミド、(15 . 108) 2 - クロロ - N
 - [4 ' - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコ
 チンアミド、(15 . 109) 4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - N - [4 ' - (ト
 リフルオロメチル) ピフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 5 - カルボキサミ
 ド、(15 . 110) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ -
 1
 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4
 - カルボキサミド、(15 . 111) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 - ヒドロキシ - 3 -
 メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(15 . 1
 12) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 -
 イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボ
 キキサミド、(15 . 113) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブ
 タ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾー
 ル - 4 - カルボキサミド、(15 . 114) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 - メトキシ -
 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(15
 . 115) (5 - プロモ - 2 - メトキシ - 4 - メチルピリジン - 3 - イル) (2, 3, 4
 - トリメトキシ - 6 - メチルフェニル) メタノン、(15 . 116) N - [2 - (4 - {
 [3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } - 3 - メトキシフ
 ェニル) エチル] - N2 - (メチルスルホニル) バリンアミド、(15 . 117) 4 - オ
 キソ - 4 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] ブタン酸、(15 . 118) ブタ - 3 - イ
 ン - 1 - イル { 6 - [({ [(Z) - (1 - メチル - 1 H - 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 . 119) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール (互変異性体形態 :
 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 (1 H) - オン)、(15 . 120) 3, 4,
 5 - トリヒドロキシ安息香酸プロピル、(15 . 121) 1, 3 - ジメチル - N - (1,
 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾー
 ル - 4 - カルボキサミド、(15 . 122) 1, 3 - ジメチル - N - [(3 R) - 1, 1,
 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール
 - 4 - カルボキサミド、(15 . 123) 1, 3 - ジメチル - N - [(3 S) - 1, 1,
 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール -
 4 - カルボキサミド、(15 . 124) [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、(15 . 125) (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、(15 . 126) (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、(15 . 127) 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、(15 . 128) 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 } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1
 5 . 129) 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 } - 1 H - 1, 2, 4 -
 トリアゾール、(15 . 130) 2 - [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 - 3 H - 1, 2

10

20

30

40

50

, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 3 1) 2 - { [r e l (2 R , 3 S) - 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 5
 . 1 3 2) 2 - { [r e l (2 R , 3 R) - 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 5 . 1 3 3) 1 - { [r e l (2 R , 3 S)
 - 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 } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、 (1 5 .
 1 3 4) 1 - { [r e l (2 R , 3 R) - 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 } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール
 - 5 - イルチオシアネート、 (1 5 . 1 3 5) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r e l (2 R , 3 S) - 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 } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 (1 5 . 1 3 6) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r e l (2 R , 3 R) - 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 } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 (1 5 . 1 3 7) 2 - [(2 S , 4 S , 5 S) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 3 8) 2 - [(2 R , 4 S , 5 S) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 3 9) 2 - [(2 R , 4 R , 5 R) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4 0) 2 - [(2 S , 4 R , 5 R) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4 1) 2 - [(2 S , 4 S , 5 R) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4 2) 2 - [(2 R , 4 S , 5 R) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4 3) 2 - [(2 R , 4 R , 5 S) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4 4) 2 - [(2 S , 4 R , 5 S) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4 5) 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 - 1 H - インデン - 4 - イル)
 ベンズアミド、 (1 5 . 1 4 6) 2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル) キナゾリン、
 (1 5 . 1 4 7) 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、 (1 5 . 1 4 8) 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、 (1 5 . 1 4 9) アブシジン酸、 (1 5 . 1 5 0) 3 - (ジフルオロメチル) - N - メトキシ - 1 - メチル - N - [1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) プロパン - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 5 1) N ' - [5 - プロモ - 6 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 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 5 . 1 5 2) 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、 (1 5 . 1 5 3) N ' - { 5 - プロモ - 6 - [(1 R) - 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 5 . 1 5 4) 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、(15.155) N' - {5 - ブロモ - 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、(15.156) N' - {5 - ブロモ - 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、(15.157) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.158) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.159) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.160) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.161) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.162) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.163) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.164) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.165) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.166) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.167) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.168) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.169) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.170) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.171) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.172) 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] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.173) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.174) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.175) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.176) 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 - 1H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミ

10

20

30

40

50

ド、(15.177)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、(15.178)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-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、(15.179)3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-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、(15.180)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、(15.181)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、(15.182)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-1H-ピラゾール-5-アミン。

【0069】

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し得る。

【0070】

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。

【0071】

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、タンパク質又は二次代謝産物)などがある。

【0072】

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。

【0073】

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CN CM 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・スブチリス(*Bacillus subtilis*)、特に、株GB03(受託番号 ATCC SD-1397)、又は、バシルス・スブチリス(*Bacillus subtilis*)株QST713(受託番号 NRRL B-21661)、又は、バシルス・スブチリス(*Bacillus subtilis*)株OST 30002(受託番号 NRRL B-50421)、又は、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(*Pasteuri*

10

20

30

40

50

a spp.) (ロチレンクルス・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・マイクロフラブス (*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)。

【0074】

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 lecani*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecani*)) 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)、メトスクニコウシア・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 (*Paecilomyces fumosoroseus*) (現在：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 (*Paecilomyces 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)。

【0075】

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。

【0076】

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、それらの特定に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。例としては、以下のものを挙げるができる：

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、プセウドモナス・セパシア (*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.)、ピソリトゥス・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*)、プセウドモナス属種 (*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 (*Sclerotoderma* spp.)、スイルス属種 (*Suillus* spp.)、ストレプトミセス属種 (*Streptomyces* spp.)。

10

【0077】

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*) サポニン抽出物)、除虫菊 (*pyrethrum/pyrethrins*)、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、Regalia、(「RequiemTM Insecticide」)、ロテノン、リアニア/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。

20

30

【0078】

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、クロキントセット (-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)。

40

【0079】

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全ての部分を処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、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物 (果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実を有するもの及びブドウの木) など

50

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含まれ、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含まれる。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、塊茎、根及び根茎などである。収穫物、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。

10

【0080】

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。

20

【0081】

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な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品種又は使用されている慣習的な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。

30

【0082】

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、渇水又は水中若しくは土壌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寿命及び/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に対する (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・ツリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する遺伝物質 (例えば、遺伝子 Cry I A (a)、Cry I A (b)、Cry I A (c)、Cry I I A、Cry I I I A、Cry I I I B 2、Cry 9 c、Cry 2 A b、Cry 3 B b 及び Cry I F 並びにそれらの組合せ) によって植物体内で生成された毒素による、害虫及び有害微生物に対する (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

40

50

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)、システムイン(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、グリホセート類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。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野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの)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。

10

【0083】

作物保護 - 処理の種類

式(I)で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の処理は、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)、注入、灌水(灌漑(drenching))、点滴灌漑などによって、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、乾式種子処理用の粉末として、液体種子処理用の溶液として、スラリー処理用の水溶性粉末として、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても行う。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。

20

【0084】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用である。即ち、式(I)で表される化合物を茎葉部に施用し、その際、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。

30

【0085】

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。従って、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、灌漑(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、式(I)で表される化合物を固体形態で(例えば、顆粒形態)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。水稻作物の場合には、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。〕

40

【0086】

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。しかしながら、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、

50

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及び発芽中の植物の最適な保護を達成するために、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。

【0087】

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。

10

【0088】

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。

【0089】

さらに、本発明は、害虫に対して保護されるように、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。

20

【0090】

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。

30

【0091】

式(I)で表される浸透移行性化合物による有利な点の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事実である。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。

【0092】

別の有利な点は、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。

【0093】

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。

40

【0094】

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又は化合物と組合せて使用することが可能であり、その結果として、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。

【0095】

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

50

、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を包含する。穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンパク）、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネ及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

【0096】

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。

10

【0097】

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、
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、収穫と播種の間の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
。かくして、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。

20

【0098】

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、種子から生じた植
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、概して注意しなければならない。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。

30

【0099】

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。

【0100】

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、エマルション
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
変換することが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換することも可能である。

【0101】

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、さらに、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、接着剤、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。

40

【0102】

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
ことができる。

50

【0103】

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。

【0104】

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。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。

10

【0105】

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。

【0106】

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ールなどを挙げるができる。

20

【0107】

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、キサントラン、変性クレー及び微粉化シリカなどを挙げるができる。

【0108】

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接着剤は、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ができる。

30

【0109】

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)。

40

【0110】

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

50

って使用することが可能な種子粉衣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。

【0111】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤又はその種子粉衣剤から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剤を、そのままで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。

10

【0112】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤の施用量は、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1kg当たり0.001~50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01~15gである。

【0113】

動物衛生

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、昆虫類及びダニ類である。

20

【0114】

獣医学の分野において、恒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。

【0115】

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；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；魚類及び甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類及び甲殻類の動物；及び、さらに、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

30

【0116】

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、テンジクネズミ、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。

【0117】

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

【0118】

好ましい別の実施形態では、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。

40

【0119】

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。

【0120】

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（c

50

controlling)」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が可能であること、その成長を阻害することが可能であること、又は、その増殖を阻害することが可能であることを意味する。

【0121】

節足動物としては、以下のものを挙げるができる：

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(Phthirus spp.)、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、トリメノポン属種(Trimenopon spp.)、メノポン属種(Menopon spp.)、トリノトン属種(Trinoton spp.)、ボビコラ属種(Bovicola spp.)、ウェルネキエラ属種(Werneckiella spp.)、レピケントロン属種(Lepikentron spp.)、ダマリナ属種(Damalina spp.)、トリコデクテス属種(Trichodectes spp.)、フェリコラ属種(Felicola 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.)、クレキス属種(Culex spp.)、シムリウム属種(Simulium spp.)、エウシムリウム属種(Eusimulium spp.)、フレボトムス属種(Phlebotomus spp.)、ルトゾミイア属種(Lutzomyia spp.)、クリコイデス属種(Culicoides spp.)、クリソプス属種(Chrysops spp.)、オダグミア属種(Odagmia spp.)、ウィルヘルミア属種(Wilhelmia spp.)、ヒボミトラ属種(Hybomitra spp.)、アチロツス属種(Atylotus spp.)、タバヌス属種(Tabanus spp.)、ハエマトポタ属種(Haematopota spp.)、フィリポミイア属種(Philipomyia spp.)、ブラウラ属種(Braula spp.)、ムスカ属種(Musca spp.)、ヒドロタエア属種(Hydrotaea spp.)、ストモキス属種(Stomoxys spp.)、ハエマトピア属種(Haematobia spp.)、モレリア属種(Morellia spp.)、ファンニア属種(Fannia spp.)、グロシナ属種(Glossina spp.)、カリホラ属種(Calliphora spp.)、ルシリア属種(Lucilia spp.)、クリソミイア属種(Chrysomyia spp.)、ウォールファールチア属種(Wohlfahrtia spp.)、サルコファガ属種(Sarcophaga spp.)、オエストルス属種(Oestrus spp.)、ヒポデルマ属種(Hypoderma spp.)、ガステロフィルス属種(Gasterophilus spp.)、ヒポボスカ属種(Hippobosca spp.)、リポプテナ属種(Lipoptena spp.)、メロファグス属種(Melophagus spp.)、リノエストルス属種(Rhinoestrus spp.)、チブラ属種(Tipula spp.)；ノミ目(Siphonapterida)の、例えば、ブレキス属種(Pulex spp.)、クテノセファリデス属種(Ctenocephalides spp.)、ツンガ属種(Tunga spp.)、キセノプシラ属種(Xenopsylla spp.)、セラトフィルス属種(Ceratophyllus spp.)；

ヘテロプテリダ目(Heteropterida)の、例えば、シメキス属種(Cimex spp.)、トリアトマ属種(Triatoma spp.)、ロドニウス属種(Rhodnius spp.)、パンストロンギルス属種(Panstrongylus

spp.) ; 並びに、さらに、ゴキブリ目 (Blattarida) の有害害虫及び衛生害虫。

【0122】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げる事ができる：

ダニ亜綱 (Acarari (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、イキシデス属種 (Ixodes spp.)、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (Rhipicephalus (Boophilus) 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.)、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 (Mesostigmata) の、例えば、デルマニスス属種 (Dermanyssus spp.)、オルニトニスス属種 (Ornithonyssus spp.)、プネウモニスス属種 (Pneumonyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、プネウモニスス属種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属種 (Sternostoma spp.)、パロア属種 (Varroa spp.)、アカラピス属種 (Acarapis 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.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオピア属種 (Myobia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、デモデクス属種 (Demodex spp.)、トロムビクラ属種 (Trombicula spp.)、ネオトロムビクラ属種 (Neotrombiculla spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.)；及び、アカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、アカルス属種 (Acarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、クネミドコプテス属種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス属種 (Cytodites spp.)、ラミノシオプテス属種 (Laminosioptes spp.)。

【0123】

寄生性原生動物としては、以下のものを挙げる事ができる：

鞭毛虫亜門 (Mastigophora) (鞭毛虫類 (Flagellata))、例えば、トリパノソーマ科 (Trypanosomatidae)、例えば、トリパノソーマ・b・ブルセイ (Trypanosoma b. brucei)、トリパノソーマ・b・ガムビエンセ (T. b. gambiense)、トリパノソーマ・b・ロデシエンセ (T. b. rhodesiense)、トリパノソーマ・コンゴレンセ (T. congolense)、トリパノソーマ・クルジ (T. cruzi)、トリパノソーマ・エバンシ (T. evansi)、トリパノソーマ・エクイヌム (T. equinum)、トリパノソーマ・レウイシ (T. lewisi)、トリパノソーマ・ペルカエ (T. percae)、トリパノソーマ・シミアエ (T. simiae)、トリパノソーマ・ビバキス (T. vivax)、レイスマニア・ブラシリエンシス (Leishmania brasiliensis)、レイスマニア・ドノバニ (L. donovani)、レイスマニア・トロピカ (L. tropica)；例えば、トリコモナス

科 (*Trichomonadidae*)、例えば、ギアルジア・ラムブリア (*Giardia lamblia*)、ギアルジア・カニス (*G. canis*) ;

有毛根足虫亜門 (*Sarcomastigophora*) (根足虫類 (*Rhizopoda*)) ; 例えば、エントアメーバ科 (*Entamoebidae*)、例えば、エントアメーバ・ヒストリチカ (*Entamoeba histolytica*) ; ハルトマネリダ工科 (*Hartmannellidae*)、例えば、アカンタモエバ属種 (*Acanthamoeba* sp.)、ハルマレラ属種 (*Harmanella* sp.) ;

アピコンプレックス門 (*Apicomplexa*) (孢子虫類 (*Sporozoa*))、例えば、エイメリア科 (*Eimeriidae*)、例えば、エイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、エイメリア・アデノイデス (*E. adenoides*)、エイメリア・アラバメンシス (*E. alabamensis*)、エイメリア・アナチス (*E. anatis*)、エイメリア・アンセリナ (*E. anserina*)、エイメリア・アルロインギ (*E. arloingi*)、エイメリア・アシャタ (*E. ashata*)、エイメリア・アウブルネンシス (*E. auburnensis*)、エイメリア・ボビス (*E. bovis*)、エイメリア・ブルネッチ (*E. brunetti*)、エイメリア・カニス (*E. canis*)、エイメリア・キンキラエ (*E. chinchillae*)、エイメリア・クルペアルム (*E. clupearum*)、エイメリア・コルムバエ (*E. columbae*)、エイメリア・コントルタ (*E. contorta*)、エイメリア・クランダリス (*E. crandallii*)、エイメリア・デブリエクキ (*E. deblickei*)、エイメリア・ジスペルサ (*E. dispersa*)、エイメリア・エリプソイダレス (*E. ellipsooidales*)、エイメリア・ファルシホルミス (*E. falciiformis*)、エイメリア・ファウレイ (*E. faurei*)、エイメリア・フラベセンス (*E. flavescens*)、エイメリア・ガロパボニス (*E. gallopavonis*)、エイメリア・ハガニ (*E. hageni*)、エイメリア・インテスチナリス (*E. intestinalis*)、エイメリア・イロクオイナ (*E. iroquoiana*)、エイメリア・イレシズア (*E. irresidua*)、エイメリア・ラベアナ (*E. labeanana*)、エイメリア・レウカルチ (*E. leucarti*)、エイメリア・マグナ (*E. magna*)、エイメリア・マキシマ (*E. maxima*)、エイメリア・メジア (*E. media*)、エイメリア・メレアグリジス (*E. meleagridis*)、エイメリア・メレアグリミチス (*E. meleagrimitis*)、エイメリア・ミチス (*E. mitis*)、エイメリア・ネカトリキス (*E. necatrix*)、エイメリア・ニナコーリアキモバエ (*E. ninakohlyakimovae*)、エイメリア・オビス (*E. ovis*)、エイメリア・パルバ (*E. parva*)、エイメリア・パボニス (*E. pavonis*)、エイメリア・ペルホランス (*E. perforans*)、エイメリア・ファサニ (*E. phasani*)、エイメリア・ピリホルミス (*E. piriformis*)、エイメリア・プラエコキス (*E. praecox*)、エイメリア・レシズア (*E. residua*)、エイメリア・スカブラ (*E. scabra*)、エイメリア属種 (*E. spec.*)、エイメリア・スチエダイ (*E. stiedai*)、エイメリア・スイス (*E. suis*)、エイメリア・テネラ (*E. tenella*)、エイメリア・ツルンカタ (*E. truncata*)、エイメリア・ツルッタエ (*E. truttae*)、エイメリア・ズエルニイ (*E. zuernii*)、グロビジウム属種 (*Globidium spec.*)、イソスポラ・ベリ (*Isospora belli*)、イソスポラ・カニス (*I. canis*)、イソスポラ・フェリス (*I. felis*)、イソスポラ・オヒオエンシス (*I. ohioensis*)、イソスポラ・リボルタ (*I. rivolta*)、イソスポラ属種 (*I. spec.*)、イソスポラ・スイス (*I. suis*)、シスチソスポラ属種 (*Cystisospora spec.*)、クリプトスポリジウム属種 (*Cryptosporidium spec.*)、特に、クリプトスポリジウム・パルブム (*C. parvum*) ; 例えば、トキソプラズマ科 (*Toxoplasmodidae*)、例えば、トキ

10

20

30

40

50

ソプラズマ・ゴンジイ (*Toxoplasma gondii*)、ハモンジア・ヘイドル
 ニイ (*Hammondia heydorni*)、ネオスポラ・カニヌム (*Neospora*
caninum)、ベスノイチア・ベスノイチイ (*Besnoitia bes-*
noitii) ; 例えば、肉孢子虫科 (*Sarcocystidae*)、例えば、サルコ
 シスチス・ボビカニス (*Sarcocystis bovicanis*)、サルコシスチ
 ス・ボビホルミス (*S. bovihominis*)、サルコシスチス・オビカニス (*S.*
ovicanis)、サルコシスチス・オビフェリス (*S. ovifelis*)、
 サルコシスチス・ネウロナ (*S. neurona*)、サルコシスチス属種 (*S. sp-*
ec.)、サルコシスチス・スイホミニス (*S. sui hominis*) ; 例えば、レ
 ウコゾイダエ科 (*Leucozooidae*)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ (*L*
eucozytozoon simondi) ; 例えば、プラスモジウム科 (*Plas-*
modiidae)、例えば、プラスモジウム・ベルゲイ (*Plasmodium be-*
rghei)、プラスモジウム・ファルシパルム (*P. falciparum*)、プラ
 スモジウム・マラリアエ (*P. malariae*)、プラスモジウム・オバレ (*P.*
ovale)、プラスモジウム・ビバキス (*P. vivax*)、プラスモジウム属種 (*P.*
spec.) ; 例えば、ピロプラズマ亜目 (*Piroplasmea*)、例えば、
 バベシア・アルゲンチナ (*Babesia argentina*)、バベシア・ボビス (*B.*
bovis)、バベシア・カニス (*B. canis*)、バベシア属種 (*B. s-*
pec.)、テイレリア・パルバ (*Theileria parva*)、テイレリア属種
 (*Theileria spec.*) ; 例えば、アデレア亜目 (*Adeleina*)、例
 えば、ヘパトゾオン・カニス (*Hepatozoon canis*)、ヘパトゾオン属種
 (*H. spec.*)。

【0124】

病原性内部寄生生物 (これは、蠕虫類である) としては、扁形動物門 (*Platyhel-*
mintha) [例えば、単生類 (*Monogenea*)、条虫類 (*cestodes*
) 及び吸虫類 (*trematodes*)]、線形動物 (*roundworms*)、鉤頭動
 物門 (*Acanthocephala*) 及び舌形動物門 (*Pentastoma*) などがある。
 これらのものとしては、以下のものを挙げるができる :

単生綱 (*monogenea*) : 例えば : ギロダクチルス属種 (*Gyrodactyl*
us spp.)、ダクチロギルス属種 (*Dactylogyrus spp.*)、ポリ
 ストマ属種 (*Polystoma spp.*) ;

条虫類 (*cestodes*) : ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllide*
a) の、例えば : ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium spp.*
)、スピロメトラ属種 (*Spirometra spp.*)、シストセファルス属種 (*S-*
Schistocephalus spp.)、リグラ属種 (*Ligula spp.*)
 、ボトリジウム属種 (*Bothridium spp.*)、ジプロゴノボルス属種 (*D-*
iplogonoporus spp.) ;

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllide*) の、例えば : メソセストイデ
 ス属種 (*Mesocestoides spp.*)、アノプロセファラ属種 (*Anopl*
ocephala spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoploceph*
ala spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia spp.*)、チサノソマ属種
 (*Thysanosoma spp.*)、チサニエジア属種 (*Thysaniezia*
spp.)、アビテリナ属種 (*Avitellina spp.*)、スチレシア属種 (*S-*
tillesia spp.)、シトタエニア属種 (*Cittotaenia spp.*)
 、アンジラ属種 (*Andyra spp.*)、ベルチエラ属種 (*Bertiella*
spp.)、タエニア属種 (*Taenia spp.*)、エキノコックス属種 (*Echin*
ococcus spp.)、ヒダチゲラ属種 (*Hydatigera spp.*)、ダ
 バイネア属種 (*Davainea spp.*)、ライリエチナ属種 (*Railliet*
ina spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis spp.*)、エキノレ
 ピス属種 (*Echinolepis spp.*)、エキノコチレ属種 (*Echinoco*

tyl e spp.)、ジオルキス属種 (Diorchis spp.)、ジピリジウム属種 (Dipylidium spp.)、ジョイエウキシエラ属種 (Joyeuxiella spp.)、ジプロピリジウム属種 (Diplopylidium spp.) ;

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

線虫類 : ベンチュウ目 (Trichinellida) の、例えば : トリクリス属種 (Trichuris spp.)、カピラリア属種 (Capillaria spp.)、パラカピラリア属種 (Paracapillaria spp.)、エウコレウス属種 (Eucoleus spp.)、トリコモソイデス属種 (Trichomosoides spp.)、トリキネラ属種 (Trichinella spp.) ;

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

カンセンチュウ目 (Rhabditida) の、例えば : ストロンギルス属種 (Strongylus spp.)、トリオドントホルス属種 (Triodontophorus spp.)、オエソファゴドンツス属種 (Oesophagodontus spp.)、トリコネマ属種 (Trichonema spp.)、ギアロセファルス属種 (Gyaloccephalus spp.)、シリンドロファリンキス属種 (Cylindropharynx spp.)、ポテリオストムム属種 (Poteriosostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cyclococercus spp.)、シリコステファヌス属種 (Cylicostephanus spp.)、オエソファゴストム

10

20

30

40

50

ム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、アンシロstroma属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globocephalus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、シアトstroma属種 (*Cyathostoma* spp.)、メタstromongylus属種 (*Metastrongylus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、ムエレリウス属種 (*Muellerius* spp.)、プロstromongylus属種 (*Protostrongylus* spp.)、ネオstromongylus属種 (*Neostromongylus* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、ブネウモstromongylus属種 (*Pneumostromongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、エラホstromongylus属種 (*Elaphostromongylus* spp.)、パレラホstromongylus属種 (*Paraelaphostromongylus* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、アンギオstromongylus属種 (*Angiostrongylus* spp.)、アエルロstromongylus属種 (*Aelurostrongylus* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、トリコstromongylus属種 (*Trichostrongylus* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marshallagia* spp.)、クーペリア属種 (*Cooperia* spp.)、ニッポstromongylus属種 (*Nippostrongylus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ヒオstromongylus属種 (*Hyostromongylus* spp.)、オベリスコイデス属種 (*Obeliscooides* spp.)、アミドstromum属種 (*Amidostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.) ;

センピセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、パスサルルス属種 (*Passalurus* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジヤ属種、(*Ascaridia* spp.)、グナトstroma属種 (*Gnathostoma* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、テラジヤ属種 (*Thelazia* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハブロネマ属種 (*Habronema* spp.)、パラブロネマ属種 (*Parabronema* spp.)、ドラスキヤ属種 (*Draschia* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ブルギヤ属種 (*Brugia* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、スピロセルカ属種 (*Sp*

irocerca 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.*); ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば: フィリコリス属種 (*Filicollis 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.*);

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.*)。

【0125】

獣医学の分野において、及び、動物飼育において、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、予防的又は治療的であり得る。

【0126】

かくして、本発明の一実施形態は、薬物としての式 (I) で表される化合物の使用である。

【0127】

さらなる態様は、坑内部寄生生物剤としての、特に、殺蠕虫剤 (*helminthical agent*) 又は坑原生動物剤 (*antiprotozoic agent*) としての、式 (I) で表される化合物の使用である。式 (I) で表される化合物は、例えば、畜産業において、動物育種において、家畜用の建物の中で、及び、衛生学の分野において、坑内部寄生生物剤として使用するのに、特に、殺蠕虫剤又は坑原生動物剤として使用するのに、適している。

【0128】

さらなる態様は、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) で表される化合物の使用に関する。さらなる態様は、例えば、畜産業における、動物育種における、家畜用の建物の中における、又は、衛生学の分野における、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) で表される化合物の使用に関する。

【0129】

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)。

【0130】

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

10

20

30

40

50

;

・ ブユ (Simuliidae) : 蠅虫類 (特に、回旋系状虫 (Onchocerca volvulus)) の運搬 ;

(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 ;

(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、野兎病、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、ダットン回帰熱ボレリア (Borrelia duttoni) 、ダニ媒介脳炎、Q熱 (Coxiella burnetii) 、パベシア症 (Babesia canis canis) 。

10

【0131】

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。

【0132】

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. gambiiae) 、アノフェレス・アラビエンシス (A. arabiensis) 、アノフェレス・フネスツス (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] 、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。

20

【0133】

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

【0134】

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、林業において、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。

30

【0135】

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。

40

【0136】

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。

【0137】

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。

【0138】

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) 殺有害生物剤として存在している。即ち、それは、さらなる変更を加える

50

ことなく、当該材料物質に施用することが可能である。適切なさらなる殺虫剤又は殺菌剤は、特に、上記で挙げたものである。

【0139】

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、別の活性化合物と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【0140】

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10
 特定的には、本発明は、家庭内の分野において、衛生の分野において、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、オフィス及び車両の客室)において遭遇する昆虫類、クモ形類動物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。

【0141】

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(Saltatoria 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。20

【0142】

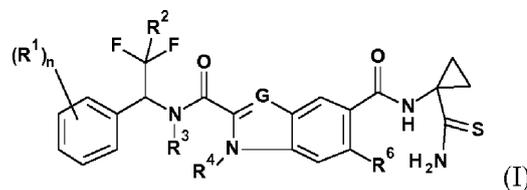
施用は、例えば、エアゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム(automatic fogging system)、噴霧器(fogger)、泡、ゲル、セルローズ製又はプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙(moth papers)、防虫バッグ(moth bags)及び防虫ゲル(moth gels)において実施するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、又は、ベイトステーションで実施する。30

【0143】

調製方法及び中間体に関する記述

一般式(I)

【化2】



【0144】

で表される化合物は、一般式(II)

10

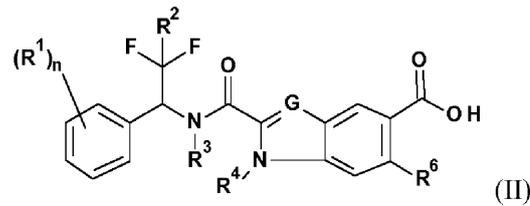
20

30

40

50

【化3】

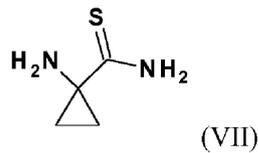


【0145】

で表されるカルボン酸を、縮合剤（例えば、[ベンズトリアゾール-1-イルオキシ(ジメチルアミノ)メチレン]ジメチルアンモニウムヘキサフルオロホスフェート)の存在下で、式(VII)

10

【化4】



【0146】

で表される1-アミノシクロプロパンカルボチオアミドと反応させることによって得ることができる。

20

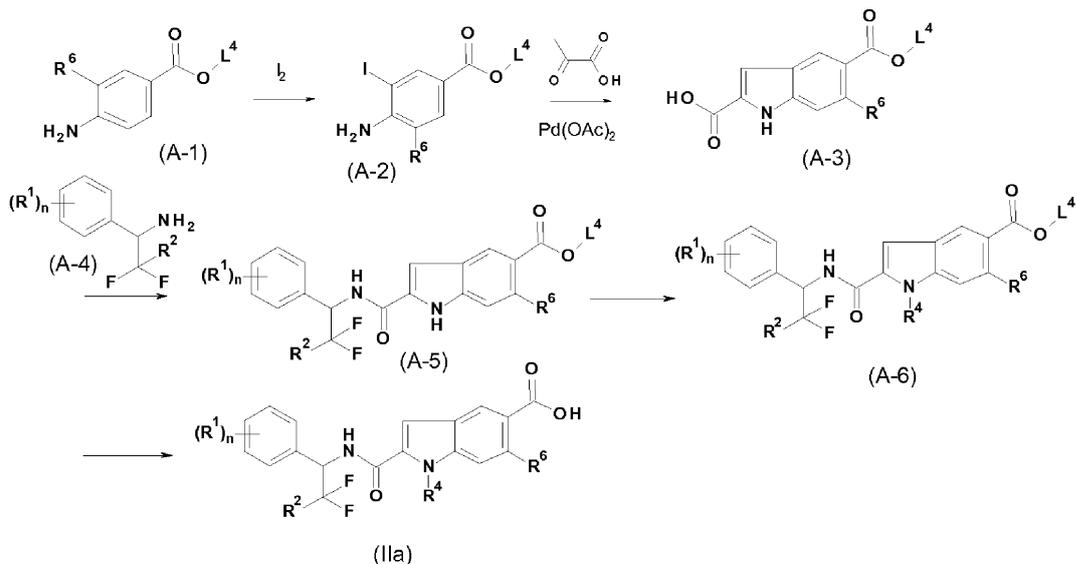
【0147】

式(IIa)で表される一部のインドールカルボン酸は、知られている(c.f.、例えば、WO-A-2012/119984)。WO-A-2012/119984に記載されている調製方法と同様にして、スキーム1に従って、式(IIa)で表される新規化合物を得ることができる。ここで、L⁴は水素を表す。

【0148】

スキーム1

【化5】



30

40

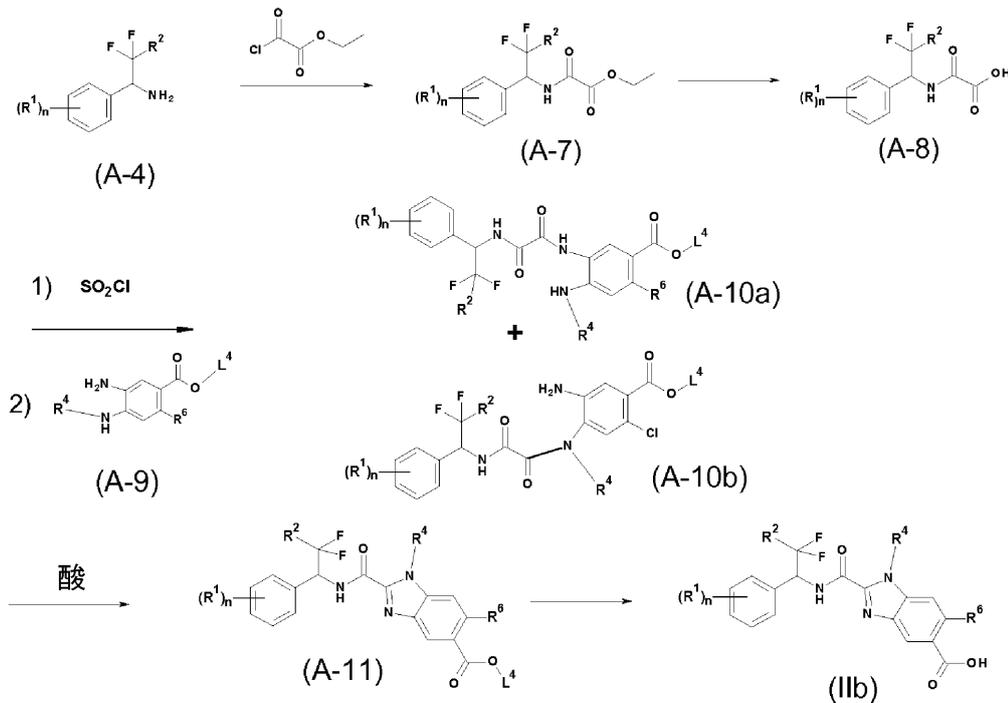
【0149】

式(IIb)で表されるベンゾイミダゾールカルボン酸は、新規であり、そして、例えばスキーム2に従って、得ることができ得る。

【0150】

スキーム2

【化6】



10

20

【0151】

式 (IIb) で表されるベンゾイミダゾール誘導体は、加水分解 (例えば、NaOH を使用する加水分解) によって、式 (A-11) で表される化合物から得られる。式 (A-11) で表される化合物は、式 (A-10b) で表される化合物から、酸性触媒 (例えば、4-トルエンスルホン酸水和物、塩酸又は酢酸) の存在下における反応によって、得ることができる。該反応は、類似した化合物に関する文献に開示されている条件下で実施する (cf.、例えば、EP1602648、実施例4; Journal of Medicinal Chemistry, 55 (2012) 9089-9106)。

【0152】

式 (A-10b) で表される化合物は、最初に、式 (A-8) で表される化合物を塩化チオニルと反応させ、次いで、その中間体 (これは、単離しない) を式 (A-9) で表される 1,2-ジアミノフェニル誘導体と反応させることによって、式 (A-10a) で表される化合物と一緒に得ることができる。該反応は、類似した化合物に関する文献に開示されている条件下で実施する (cf.、例えば、EP1602648、実施例4; Journal of Medicinal Chemistry, 55 (2012) 9089-9106)。

30

【0153】

式 (A-9) で表される 1,2-ジアミノフェニル誘導体は、既知である (cf.、例えば、WO2012/119984)。式 (A-8) で表されるカルボン酸は、式 (A-7) で表されるエステルを加水分解することによって得ることができる。

40

【0154】

式 (A-8) で表されるカルボン酸は、文献から知られている方法と同様に、エステル加水分解によって、一般構造 (A-7) を有する化合物から調製することができる (例えば、NaOH 又は LiOH を使用するエステル加水分解; さらなる方法に関しては、例えば、以下のものを参照されたい: Tetrahedron 49 (1993) 3691-3748)。

【0155】

式 (A-7) で表される化合物は、式 (A-4) で表されるアミンを 2-クロロ-2-オキソ酢酸エチルと反応させることによって得ることができる。該反応は、類似した化合物に関する文献に開示されている条件下で実施する (cf.、例えば、EP199781

50

3、第210頁、実施例8、段階1)。

【0156】

一般式(A-4)で表されるハロアルキルで置換されているアミンは、市販されているか、文献から知られているか、又は、文献から知られている調製方法を用いて合成することができる(c.f.、例えば、WO2012/119984)。

【0157】

式(VII)で表される1-アミノシクロプロパンカルボチオアミド(CAS No. 1159877-97-0; WO2009/070485)は、市販されている。

【0158】

式(I)で表される新規化合物を調製するための本発明による調製方法は、好ましくは、希釈剤を用いて実施する。本発明による調製方法を実施するのに有用な希釈剤は、水に加えて、全ての不活性溶媒である。挙げることができる例は、以下のものである：ハロ炭化水素類(例えば、クロロ炭化水素類、例えば、テトラクロロエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、四塩化炭素、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼン)、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)、エーテル類(例えば、エチルプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ-n-ブチルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジクロロジエチルエーテル、並びに、エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシドのポリエーテル類)、アミン類(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、及び、テトラメチレンジアミン)、ニトロ炭化水素類(例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、o-ニトロトルエン)、ニトリル類(例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、m-クロロベンゾニトリル)、テトラヒドロチオフェンジオキシド、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシド、スルホン類(例えば、ジメチルスルホン、ジエチルスルホン、ジプロピルスルホン、ジブチルスルホン、ジフェニルスルホン、ジヘキシルスルホン、メチルエチルスルホン、エチルプロピルスルホン、エチルイソブチルスルホン、及び、ペンタメチレンスルホン)、脂肪族、シクロ脂肪族又は芳香族の炭化水素類(例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、ノナン、及び、工業用炭化水素類)、さらに、沸点が例えば40~250の範囲内にある成分を含んでいる、いわゆる、「ホワイトスピリット」、シメン、沸騰範囲が70~190の範囲内にある石油フラクション、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタン、ベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ニトロベンゼン、キシレン、エステル類(例えば、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル、酢酸イソブチル、炭酸ジメチル、炭酸ジブチル、及び、炭酸エチレン)、アミド類(例えば、ヘキサメチルホスホルアミド、ホルムアミド、N-メチルホルムアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジプロピルホルムアミド、N,N-ジブチルホルムアミド、N-メチル-ピロリジン、N-メチルカプロラクタム、1,3-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジン、オクチルピロリドン、オクチルカプロラクタム、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジンジオン、N-ホルミルピペリジン、N,N'-ジホルミルピペラジン)、及び、ケトン類(例えば、アセトン、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチルブチルケトン)。

【0159】

もちろん、本発明による調製方法は、上記で挙げた溶媒及び希釈剤の混合物の中で実施

することも可能である。

【0160】

本発明による調製方法を実施する場合、その反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、該調製方法は、 $-30 \sim +150$ の温度で、好ましくは、 $-10 \sim +100$ の温度で、実施する。

【0161】

本発明による調製方法は、一般に、大気圧下で実施する。しかしながら、本発明による調製方法は、高圧下又は減圧下（概して、 $0.1 \text{ bar} \sim 15 \text{ bar}$ の絶対圧力）で実施することも可能である。

【0162】

本発明による調製方法を実施するために、該出発物質は、一般に、ほぼ等モル量で使用する。しかしながら、その成分のうちの1種類を比較的大過剰量で使用することも可能である。該反応は、一般に、適切な希釈剤の中で、反応助剤の存在下、場合により、保護ガス（例えば、窒素、アルゴン、又は、ヘリウム）雰囲気下で、実施し、そして、その反応混合物を、一般に、必要とされる温度で数時間攪拌する。後処理は、慣習的な方法で実施する（cf. 調製実施例）。

【0163】

本発明による調製方法を実施するために使用される塩基性反応助剤は、全ての適切な酸結合剤であり得る。その例としては、以下のものを挙げるができる：アルカリ土類金属化合物又はアルカリ金属化合物（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウム及びバリウムの水酸化物、水素化物、酸化物及び炭酸塩）、アミジン塩基又はグアニジン塩基（例えば、7-メチル-1,5,7-トリアザビシクロ[4.4.0]デカ-5-エン（MTBD）；ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン（DBN）、ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン（DABCO）、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン（DBU）、シクロヘキシルテトラブチルグアニジン（CyTBG）、シクロヘキシルテトラメチルグアニジン（CyTMG）、N,N,N,N-テトラメチル-1,8-ナフタレンジアミン、ペンタメチルピペリジン）、並びに、アミン、特に、第3級アミン（例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、トリベンジルアミン、トリイソプロピルアミン、トリブチルアミン、トリシクロヘキシルアミン、トリアミルアミン、トリヘキシルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルトルイジン、N,N-ジメチル-p-アミノピリジン、N-メチルピロリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルイミダゾール、N-メチルピラゾール、N-メチルモルホリン、N-メチルヘキサメチレンジアミン、ピリジン、4-ピロリジノピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、キノリン、-ピコリン、-ピコリン、ピリミジン、アクリジン、N,N,N',N'-テトラメチレンジアミン、N,N,N',N'-テトラエチレンジアミン、キノキサリン、N-プロピルジイソプロピルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン、N,N'-ジメチルシクロヘキシルアミン、2,6-ルチジン、2,4-ルチジン、又は、トリエチルジアミン）。

【0164】

本発明による調製方法を実施するために使用される酸性反応助剤には、全ての鉱酸（例えば、ハロゲン化水素酸、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸又はヨウ化水素酸、及び、さらに、硫酸、リン酸、亜リン酸、硝酸）、ルイス酸（例えば、塩化アルミニウム（III）、三フッ化ホウ素又はそのエーテラート、塩化チタン（IV）、塩化スズ（V））、及び、有機酸（例えば、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、マロン酸、乳酸、シュウ酸、フマル酸、アジピン酸、ステアリン酸、酒石酸、オレイン酸、メタンスルホン酸、安息香酸、ベンゼンスルホン酸、又は、パラ-トルエンスルホン酸）が包含される。

【0165】

以下の調製実施例及び使用実施例によって本発明について例証するが、それらの実施例は、本発明を限定するものではない。

【実施例】

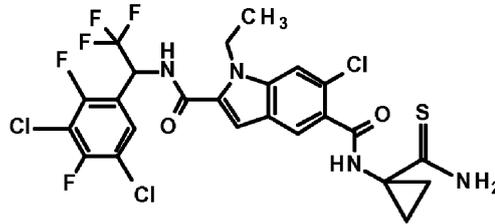
【0166】

調製実施例

合成実施例 1

N5 - (1 - カルバモチオイルシクロプロピル) - 6 - クロロ - N2 - [1 - (3, 5 - ジクロロ - 2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2, 2, 2 - トリフルオロエチル] - 1 - エチルインドール - 2, 5 - ジカルボキサミド (化合物 No. I - 01)

【化7】



10

【0167】

6 - クロロ - 1 - エチル - 2 - ({ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [3, 5 - ジクロロ - 2, 4 - ジフルオロフェニル] エチル } カルバモイル) - 1H - インドール - 5 - カルボン酸 (WO - A - 2012 / 119984 による調製方法で調製したもの ; cf . 第 64 頁、第 16 行 ~ 第 65 頁第 1 行、及び、第 66 頁、第 8 ~ 11 行) (0.523 g、0.98 mmol) を DMF (9 mL) に溶解させた。1 - アミノシクロプロパンカルボチオアミド (0.150 mg、0.98 mmol)、[ベンゾトリアゾール - 1 - イルオキシ (ジメチルアミノ) メチレン] ジメチルアンモニウムヘキサフルオロホスフェート (0.374 g、0.98 mmol) 及び N - メチルモルホリン (0.200 g、1.97 mmol) を順次添加し、次いで、その反応混合物を室温で 15 時間攪拌した。酢酸エチルを添加し、その反応混合物を、順次、塩酸 (1.0 M) 及び飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで脱水し、次いで、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を移動相シクロヘキサン / 酢酸エチル (60 : 40) を使用するシリカゲルクロマトグラフィーに付し、これによって、0.430 g (理論値の 67 %) の N5 - (1 - カルバモチオイルシクロプロピル) - 6 - クロロ - N2 - [1 - (3, 5 - ジクロロ - 2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2, 2, 2 - トリフルオロエチル] - 1 - エチルインドール - 2, 5 - ジカルボキサミドが得られた。

20

30

【0168】

HPLC - MS : log P = 4.25 ; 質量 (m / z) : 627.0 (M + H)⁺。

【0169】

合成実施例 2

以下の条件を使用して、キラル固定相上での分取順相クロマトグラフィーによって、合成実施例 1 (化合物 No. I - 01) のエナンチオマー分離を実施した :

カラム : CHIRALPAK AS - H 5 μm - 250 × 4.6 mm ;

移動相 : A = n - ヘプタン、B = メタノール + エタノール (1 : 1)、A : B = 85 : 15 ;

流量 : 0.8 mL / 分 ; 25 。

40

【0170】

430 mg の N5 - (1 - カルバモチオイルシクロプロピル) - 6 - クロロ - N2 - [1 - (3, 5 - ジクロロ - 2, 4 - ジフルオロフェニル) - 2, 2, 2 - トリフルオロエチル] - 1 - エチルインドール - 2, 5 - ジカルボキサミド (合成実施例 1、化合物 No. I - 01) から、以下のものが得られた :

171 mg の化合物 (I - 18)、(+) - エナンチオマー (保持時間 : 7.5 分、ee > 99 %、旋光 : + 112.9 °) ;

172 mg の化合物 (I - 17)、(-) - エナンチオマー (保持時間 : 9.8 分、ee > 99 %、旋光 : - 103.1 °)。

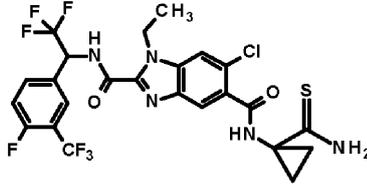
50

【0171】

合成実施例 3

N5 - (1 - カルバモチオイルシクロプロピル) - 6 - クロロ - 1 - エチル - N2 - { 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル} - 1H - ベンゾイミダゾール - 2, 5 - ジカルボキサミド (化合物 No. I - 30)

【化 8】



10

【0172】

段階 1 : オキシ ({ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) 酢酸エチル

トリクロロメタン (200 mL) の中の 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エタンアミン (15.0 g、57.4 mmol) と 4 - メチルモルホリン (7.58 mL、68.9 mmol) の混合物を 0 °C まで冷却し、エチルオキサリルクロリド (8.23 g、60.3 mmol) をクロロホルム (100 mL) に溶解させた溶液をゆっくりと滴下して加え、次いで、その混合物を室温まで昇温させながら 15 時間攪拌した。その反応混合物を水の上に注ぎ、5% 強度リン酸水素ナトリウム溶液で 2 回抽出し、その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去した。これによって、20.4 g (理論値の 99%) のオキシ ({ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) 酢酸エチルが得られた。これは、それ以上精製することなくさらに処理した。

20

【0173】

HPLC - MS : $\log P = 3.17$; 質量 (m/z) : 362.0 (M + H)⁺。

【0174】

段階 2 : オキシ ({ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) 酢酸

メタノール (200 mL) と水 (26 mL) の混合物の中にオキシ ({ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) 酢酸エチル (20.42 g、56.0 mmol) を最初に装入し、攪拌しながら、水酸化ナトリウム (8.97 g、224 mmol) を添加した。その反応混合物を室温で 15 時間攪拌し、次いで、溶媒の大部分を減圧下で留去した。その残渣を取って水 / tert - ブチルメチルエーテルの中に入れ、相を分離させ、その水相を tert - ブチルメチルエーテルで 2 回抽出した。次いで、その水相を 10% 強度塩酸を用いて酸性化して pH 3 とし、酢酸エチルで繰り返し抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去した。これによって、19.55 g (理論値の 85%) のオキシ ({ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) 酢酸が得られた。これは、それ以上精製することなくさらに処理した。

40

【0175】

HPLC - MS : $\log P = 1.84$; 質量 (m/z) : 332.0 (M + H)⁺。

【0176】

段階 3 a : 5 - アミノ - 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) 安息香酸エチル
2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) - 5 - ニトロ安息香酸エチル : THF (28 mL)
) の中に 2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - ニトロ安息香酸エチル (3.60 g、14.5 mmol) を最初に装入し、THF 中のエチルアミンの 2 M 溶液 (14.5 mL、29 m

50

m o l) を添加した。次いで、その混合物を室温で 15 時間攪拌した。後処理のために、その反応混合物を水に添加し、酢酸エチルで 2 回抽出した。その有機相を合して水及び 5 % 強度リン酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去した。その残渣をシクロヘキサン / 酢酸エチルを使用するシリカゲルクロマトグラフィに付し、これによって、2.80 g (理論値の 71.3%) の 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) - 5 - ニトロ安息香酸エチルが得られた。

【0177】

HPLC - MS : log P = 3.49 ; 質量 (m/z) : 273.0 (M + H)⁺。

【0178】

5 - アミノ - 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) 安息香酸エチル : エタノール (86 mL) / 水 (14 mL) の中に 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) - 5 - ニトロ安息香酸エチル (2.47 g、9.05 mmol) を最初に装入し、塩化アンモニウム (775.2 mg、14.4 mmol) を添加した。その反応混合物を 60 °C まで昇温させ、鉄粉 (5.06 g、90.5 mmol) を添加し、次いで、その混合物を環流温度で 3 時間攪拌した。冷却後、その混合物をケイ藻土を通して濾過し、その濾過ケーキをエタノールで繰り返し洗浄し、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を取って酢酸エチルの中に入れ、その溶液を水及び飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を留去した。これによって、2.16 g (理論値の 83%) の 5 - アミノ - 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) 安息香酸エチルが得られた。

10

【0179】

HPLC - MS : log P = 2.31 ; 質量 (m/z) : 243.0 (M + H)⁺。

20

【0180】

段階 3 : 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) - 5 - { [オキシ ({ 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) アセチル] アミノ } 安息香酸エチル

オキシ ({ 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) 酢酸 (2.30 g、6.90 mmol) をトリクロロメタン (50 mL) に溶解させ、塩化チオニル (2.05 g、17.2 mmol) 及び 2 滴の DMF を添加し、その混合物を 50 °C で 15 時間攪拌した。溶媒を減圧下で留去し、その残渣を取って少量のトリクロロメタンの中に入れ、段階 3 a からの 5 - アミノ - 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) 安息香酸エチル (2.16 g、7.59 mmol) とトリエチルアミン (2.4 mL、17.2 mmol) をトリクロロメタン (25 mL) に溶解させた溶液に滴下して加えた。室温で 48 時間攪拌した後、溶媒の大部分を減圧下で留去し、その残渣を取って水 / 酢酸エチルの中に入れた。相を分離させ、その水相を酢酸エチルで 2 回抽出した。その有機相を合して 5 % 強度リン酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去した。これによって、4.5 g (理論値の 54%) の 2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) - 5 - { [オキシ ({ 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) アセチル] アミノ } 安息香酸エチルが得られた。これは、精製することなくさらに反応させた。

30

40

【0181】

HPLC - MS : log P = 4.36 ; 質量 (m/z) : 558.0 (M + H)⁺。

【0182】

段階 4 : 6 - クロロ - 1 - エチル - 2 - ({ 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } カルバモイル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸エチル

2 - クロロ - 4 - (エチルアミノ) - 5 - { [オキシ ({ 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } アミノ) アセチル] アミノ } 安息香酸エチル (4.50 g、8.06 mmol) をトルエン (90 mL) に溶解させ、p - トルエンスルホン酸一水和物 (0.30 g、1.61 mmol) を添加し、

50

その混合物を水分離器上で環流温度で15時間攪拌した。冷却後、その混合物を飽和炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を移動相シクロヘキサン/酢酸エチル(80:20)を使用するシリカゲルクロマトグラフィーに付した。これによって、0.99g(理論値の20%)の6-クロロ-1-エチル-2-({ 2, 2, 2-トリフルオロ-1-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル } カルバモイル)-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチルが得られた。

【0183】

HPLC-MS: $\log P = 5.03$; 質量(m/z): 541.0 (M+H)⁺;

¹H NMR (D₃-DMSO): 1.33 (t, 3H), 1.37 (t, 3H), 4.37 (q, 2H), 4.60 (q, 2H), 6.36 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.21 (m, 2H), 8.42 (m, 1H), 8.62 (s, 1H)。

10

【0184】

段階5: 6-クロロ-1-エチル-2-({ 2, 2, 2-トリフルオロ-1-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル } カルバモイル)-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸

ジオキサン(25mL)/水(2.8mL)の中に6-クロロ-1-エチル-2-({ 2, 2, 2-トリフルオロ-1-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル } カルバモイル)-1H-ベンゾイミダゾール-5-カルボン酸エチル(0.495g、0.81mmol)を最初に装入し、水酸化リチウム(58.3mg、2.43mmol)を添加した。その反応混合物を室温で48時間攪拌し、その後、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を取って水の中に入れ、濃塩酸を用いてpHを1に調節した。沈澱した固体を濾過し、乾燥させた。これによって、366mg(理論値の83%)の6-クロロ-1-エチル-2-({ 2, 2, 2-トリフルオロ-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル } カルバモイル)-1H-インドール-5-カルボン酸が得られた。

20

【0185】

HPLC-MS: $\log P = 3.66$; 質量(m/z): 512.1 (M+H)⁺;

¹H NMR (D₃-DMSO): 1.31 (t, 3H), 4.60 (q, 2H), 6.30 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 8.2-8.3 (m, 3H), 8.43 (m, 1H)。

30

段階6: N5-(1-カルバモチオイルシクロプロピル)-6-クロロ-1-エチル-N2-{2, 2, 2-トリフルオロ-1-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル}-1H-ベンゾイミダゾール-2, 5-ジカルボキサミド(化合物No. I-30)

6-クロロ-1-エチル-2-({ 2, 2, 2-トリフルオロ-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル } カルバモイル)-1H-インドール-5-カルボン酸(200mg、0.37mmol)をDMF(2mL)に溶解させた。1-アミノシクロプロパンカルボチオアミド(62.2mg、0.40mmol)、[ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ(ジメチルアミノ)メチレン]ジメチルアンモニウムヘキサフルオロホスフェート(154mg、0.40mmol)及びN-メチルモルホリン(112mg、1.11mmol)を順次添加し、次いで、その混合物を室温で15時間攪拌した。その反応混合物を水の上に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄した後、その混合物を硫酸マグネシウムで脱水し、次いで、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を移動相シクロヘキサン/酢酸エチル(60:40)を使用するシリカゲルクロマトグラフィーに付し、これによって、0.139g(理論値の54%)のN5-(1-カルバモチオイルシクロプロピル)-6-クロロ-1-エチル-N2-{2, 2, 2-トリフルオロ-1-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル}-1H-ベンゾイミダゾール-2, 5-ジカルボキサミドが得られた。

40

50

【 0 1 8 6 】

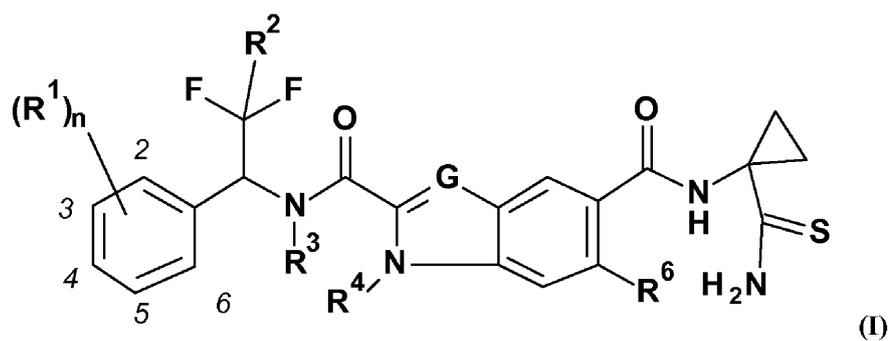
H P L C - M S : $\log P = 3.56$; 質量 (m / z) : $609.9 (M + H)^+$ 。

【 0 1 8 7 】

下記表 1 に記載されている本発明による式 (I) で表される化合物も、同様に、本発明による好ましい化合物であり、上記で記載した合成実施例に準じて又は上記で記載した合成実施例と同様にして、得られる。

【表 1】

表 1



10

20

30

40

No.	(R ¹) _n	R ²	R ³	R ⁴	G	R ⁶	(M+H) ⁺ a)	log p ^{a)}
I-01	2,4-F ₂ ; 3,5-Cl ₂	F	H	Et	CH	Cl	627,0	4,25
I-02	3,5-Cl ₂ ;4-F	F	H	Et	CH	Cl	610,0	4,04
I-03	3-CF ₃ ;4-F	F	H	Et	CH	Cl	609,1	3,70
I-04	3-Cl;4-F	F	H	Et	CH	Cl	575,1	3,57
I-05	3,4,5-Cl ₃	F	H	Et	CH	Cl	625,0	4,33
I-06	3-Br;4-F	F	H	Et	CH	Cl	619,0	3,64
I-07	3-CF ₃ ;4-Cl	F	H	Et	CH	Cl	625,1	3,96
I-08	2,4-F ₂ ; 3,5-Cl ₂	F	H	Me	CH	Cl	613,0	3,94
I-09	3,4-Cl ₂ ;5-F	F	H	Et	CH	Cl	610,0	4,02
I-10	3-F;5-CF ₃	F	H	Et	CH	Cl	609,0	3,81
I-11	2-F;3-Cl	F	H	Et	CH	Cl	575,1	3,69
I-12	2,4-F ₂ ; 3,5-Cl ₂	F	H	7° □Λ° -2- イソ-1-イル	CH	Cl	637,1	3,94
I-13	3-CF ₃ ;4-Cl	F	H	Et	CH	Me	605,0	3,89
I-14	3,5-Cl ₂ ;4-F	F	H	7° □Λ° -2- イソ-1-イル	CH	Cl	618,9	3,81
I-15	3,5-Cl ₂ ;4-F	F	H	Me	CH	Cl	595,0	3,76
I-16	3-CF ₃ ;4-Cl	F	H	Me	CH	Cl	611,1	3,70

No.	(R ¹) _n	R ²	R ³	R ⁴	G	R ⁶	(M+H) ⁺ ^{a)}	log p ^{a)}
I-17	2,4-F ₂ ; 3,5-Cl ₂	F	H	Et	CH	Cl	627,0	4,27; (-)- イソチオマー
I-18	2,4-F ₂ ; 3,5-Cl ₂	F	H	Et	CH	Cl	627,0	4,27; (+)- イソチオマー
I-19	3-CF ₃ ;4-Cl	F	H	7° 口Λ° -2- イソ-1-イル	CH	Cl	635,1	3,73
I-20	3,4,5-Cl ₃	F	H	Me	CH	Cl	612,0	4,07
I-21	3,4,5-Cl ₃	F	H	7° 口Λ° -2- イソ-1-イル	CH	Cl	636,0	4,09
I-22	3-Cl;5-CF ₃	F	H	Et	CH	Cl	625,0	4,11
I-23	3,5-F ₂	H	H	Et	CH	Cl	541,0	3,07
I-24	3,5-Cl ₂	H	H	Et	CH	Cl	573,9	3,65
I-25	3,4-Cl ₂	H	H	Et	CH	Cl	573,9	3,54
I-26	2,3,4-F ₃ ;5-Cl	F	H	Et	CH	Cl	612,1	3,99
I-27	2,5-F ₂ ;3,4-Cl ₂	F	H	Et	CH	Cl	628,1	4,28
I-28	2,4-F ₂ ;3,5-Cl ₂	H	H	Et	CH	Cl	610,1	3,90
I-29	2,3-F ₂ ;4,5-Cl ₂	F	H	Et	CH	Cl	628,1	4,27
I-30	3-CF ₃ ;4-F	F	H	Et	N	Cl	609,9	3,46
I-31	2,3,5-F ₃ ;4-Cl	F	H	Et	CH	Cl	612,3	4,02
I-32	3-CF ₃ ;4-F	H	H	Et	CH	Cl	591,1	3,41

略語 : Et = イソル, Me = メル ;

10

20

30

【表 2】

¹H-NMR データ^{b)}

<p>実施例 I-01: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,775 (7,0); 9,751 (4,4); 8,874 (9,1); 8,768 (3,4); 8,281 (2,3); 8,262 (4,2); 8,244 (2,2); 8,125 (15,4); 7,817 (11,1); 7,406 (11,0); 6,397 (0,4); 6,376 (1,6); 6,355 (2,3); 6,333 (1,7); 6,312 (0,5); 4,544 (1,7); 4,527 (4,9); 4,509 (4,8); 4,491 (1,6); 3,323 (111,7); 2,680 (0,6); 2,676 (1,2); 2,671 (1,6); 2,667 (1,2); 2,662 (0,5); 2,525 (5,4); 2,511 (92,8); 2,507 (182,2); 2,502 (236,5); 2,498 (169,4); 2,493 (80,0); 2,338 (0,6); 2,333 (1,2); 2,329 (1,6); 2,324 (1,1); 2,320 (0,5); 1,858 (3,2); 1,848 (7,1); 1,838 (7,7); 1,829 (3,1); 1,398 (4,8); 1,336 (0,8); 1,273 (3,5); 1,263 (7,6); 1,253 (7,8); 1,243 (3,7); 1,233 (7,8); 1,216 (16,0); 1,198 (7,2); 0,146 (0,5); 0,008 (4,7); 0,000 (125,9); -0,009 (4,0); -0,150 (0,5)</p>	
<p>実施例 I-02: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,771 (2,7); 9,635 (3,4); 9,611 (3,5); 8,871 (7,9); 8,771 (2,7); 8,120 (16,0); 8,115 (10,4); 8,099 (9,8); 7,853 (0,4); 7,806 (9,5); 7,399 (0,4); 7,381 (9,1); 6,323 (0,4); 6,302 (1,3); 6,280 (1,9); 6,258 (1,4); 6,236 (0,4); 4,543 (1,5); 4,526 (4,2); 4,508 (4,2); 4,491 (1,4); 3,790 (0,4); 3,752 (0,3); 3,324 (55,1); 2,680 (0,5); 2,676 (1,1); 2,671 (1,6); 2,667 (1,1); 2,662 (0,5); 2,541 (0,7); 2,525 (5,3); 2,520 (8,1); 2,511 (88,9); 2,507 (178,4); 2,502 (234,2); 2,498 (165,5); 2,493 (76,8); 2,338 (0,5); 2,333 (1,1); 2,329 (1,6); 2,324 (1,1); 2,320 (0,5); 2,075 (0,4); 1,858 (2,7); 1,847 (5,8); 1,838 (6,2); 1,829 (2,5); 1,273 (2,9); 1,263 (6,2); 1,253 (6,3); 1,243 (2,9); 1,231 (6,6); 1,214 (13,9); 1,196 (6,2); 0,146 (0,5); 0,008 (4,2); 0,000 (127,6); -0,009 (3,9); -0,150 (0,5)</p>	10
<p>実施例 I-03: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,765 (7,0); 9,741 (4,3); 8,868 (9,0); 8,772 (3,2); 8,316 (1,0); 8,296 (2,7); 8,283 (2,6); 8,182 (1,4); 8,177 (1,4); 8,171 (1,6); 8,162 (1,8); 8,155 (1,6); 8,149 (1,6); 8,117 (16,0); 7,802 (11,1); 7,688 (2,5); 7,662 (3,1); 7,639 (2,3); 7,370 (10,9); 6,388 (0,4); 6,366 (1,5); 6,344 (2,2); 6,322 (1,6); 6,300 (0,5); 4,542 (1,6); 4,525 (4,6); 4,507 (4,5); 4,489 (1,6); 3,326 (203,7); 3,303 (0,5); 2,681 (0,5); 2,676 (1,0); 2,672 (1,4); 2,667 (1,0); 2,663 (0,5); 2,525 (4,1); 2,520 (6,5); 2,512 (76,5); 2,507 (151,9); 2,503 (198,0); 2,498 (140,5); 2,493 (65,2); 2,338 (0,4); 2,334 (1,0); 2,329 (1,3); 2,325 (0,9); 2,320 (0,4); 2,075 (6,0); 1,858 (3,1); 1,848 (6,9); 1,839 (7,5); 1,829 (3,0); 1,272 (3,2); 1,262 (7,5); 1,253 (7,2); 1,243 (2,9); 1,224 (7,3); 1,207 (15,9); 1,189 (7,0); 0,146 (0,4); 0,008 (3,2); 0,000 (92,3); -0,009 (2,7); -0,150 (0,4)</p>	20
<p>実施例 I-04: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,768 (2,4); 9,666 (3,0); 9,642 (3,1); 8,868 (6,8); 8,776 (2,4); 8,111 (12,3); 8,088 (2,3); 8,083 (2,5); 8,070 (2,4); 8,065 (2,3); 7,801 (9,4); 7,790 (1,7); 7,784 (1,5); 7,778 (1,4); 7,772 (1,3); 7,568 (3,3); 7,545 (4,8); 7,523 (2,8); 7,375 (8,1); 6,234 (1,2); 6,212 (1,7); 6,189 (1,2); 6,167 (0,4); 4,545 (1,3); 4,528 (3,6); 4,510 (3,6); 4,492 (1,2); 3,329 (11,0); 2,676 (0,6); 2,671 (0,9); 2,667 (0,6); 2,525 (3,3); 2,520 (5,3); 2,511 (51,0); 2,507 (101,2); 2,502 (132,5); 2,498 (94,4); 2,493 (44,4); 2,334 (0,6); 2,329 (0,9); 2,324 (0,6); 2,076 (16,0); 1,858 (2,4); 1,847 (5,2); 1,838 (5,7); 1,829 (2,3); 1,273 (2,5); 1,263 (5,6); 1,254 (5,6); 1,243 (2,4); 1,227 (5,7); 1,209 (12,2); 1,191 (5,4); 0,008 (2,6); 0,000 (70,2); -0,009 (2,2)</p>	
<p>実施例 I-05: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,769 (2,3); 9,661 (2,5); 9,637 (2,6); 8,872 (5,6); 8,772 (2,2); 8,150 (16,0); 8,121 (9,0); 7,806 (7,1); 7,383 (6,9); 6,319 (1,0); 6,297 (1,5); 6,274 (1,1); 6,253 (0,3); 4,542 (1,2); 4,525 (3,4); 4,507 (3,4); 4,490 (1,1); 3,325 (179,5); 2,676 (1,0); 2,672 (1,5); 2,667 (1,1); 2,525 (7,4); 2,511 (88,9); 2,507 (176,0); 2,502 (231,2); 2,498 (170,2); 2,494 (85,7); 2,334 (1,2); 2,329 (1,6); 2,325 (1,2); 2,075 (0,8); 1,858 (2,1); 1,847 (4,6); 1,838 (5,0); 1,829 (2,1); 1,355 (1,7); 1,273 (2,6); 1,263 (5,2); 1,254 (5,4); 1,243 (3,1); 1,231 (6,2); 1,214 (10,9); 1,196 (5,5); 0,853 (0,3); 0,785 (0,5); 0,768 (0,6); 0,146 (0,3); 0,008 (3,0); 0,000 (75,9); -0,008 (3,3); -0,149 (0,4)</p>	30
<p>実施例 I-06: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,765 (4,1); 9,662 (4,3); 9,638 (4,4); 8,867 (9,4); 8,773 (4,1); 8,316 (1,3); 8,197 (3,6); 8,192 (3,7); 8,181 (3,7); 8,176 (3,5); 8,111 (14,1); 7,839 (2,0); 7,834 (2,1); 7,828 (2,3); 7,819 (2,7); 7,799 (12,9); 7,524 (3,8); 7,502 (7,0); 7,481 (3,3); 7,373 (11,2); 6,249 (0,5); 6,228 (1,8); 6,206 (2,7); 6,183 (1,9); 6,161 (0,6); 5,757 (2,4); 4,543 (2,1); 4,525 (5,6); 4,508 (5,5); 4,490 (2,0); 4,020 (0,4); 3,405 (0,4); 3,323 (425,4); 2,890 (0,5); 2,731 (0,5); 2,671 (4,3); 2,666 (3,3); 2,624 (0,5); 2,506 (470,3); 2,502 (586,2); 2,497 (445,2); 2,373 (0,3); 2,333 (3,2); 2,328 (4,0); 2,324 (3,1); 2,086 (5,9); 1,989 (1,3); 1,856 (3,5); 1,846 (7,8); 1,837 (8,2); 1,828 (3,5); 1,271 (3,8); 1,261 (8,3); 1,252 (8,3); 1,242 (3,8); 1,225 (8,0); 1,208 (16,0); 1,190 (7,6); 1,175 (1,1); 1,157 (0,6); 1,148 (0,7); 0,146 (0,9); 0,000 (178,6); -0,150 (0,9)</p>	
<p>実施例 I-07: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,797 (4,3); 9,772 (6,8); 8,867 (9,3); 8,773 (3,4); 8,336 (5,8); 8,333 (5,8); 8,317 (0,4); 8,118 (16,0); 8,104 (2,9); 8,082 (3,3); 8,079 (3,2); 7,892 (6,0); 7,871 (5,0); 7,802 (11,1); 7,371 (11,0); 6,405 (0,4); 6,384 (1,6); 6,362 (2,4); 6,340 (1,7); 6,318 (0,5); 4,539 (1,7); 4,522 (4,9); 4,504 (4,8); 4,486 (1,6); 3,324 (238,7); 2,680 (0,7); 2,676 (1,5); 2,671 (2,1); 2,667 (1,5); 2,662 (0,7); 2,524 (7,3); 2,511 (118,7); 2,507 (232,8); 2,502 (302,9); 2,498 (218,1); 2,493 (104,6); 2,338 (0,7); 2,333 (1,5); 2,329 (2,0); 2,324 (1,5); 1,989 (0,7); 1,857 (3,2); 1,847 (6,9); 1,838 (7,5); 1,828 (3,1); 1,397 (14,5); 1,271 (3,3); 1,261 (7,4); 1,252 (7,4); 1,242 (3,1); 1,222 (7,4); 1,204 (15,7); 1,187 (7,1); 1,175 (0,8); 0,008 (1,5); 0,000 (40,3); -0,009 (1,4)</p>	40
<p>実施例 I-08: ¹H-NMR (601,6 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,770 (1,5); 9,757 (1,1); 9,741 (1,0); 8,893 (3,8); 8,776 (1,4); 8,277 (0,9); 8,265 (1,5); 8,252 (0,8); 8,119 (5,9); 7,782 (4,3); 7,421 (4,1); 6,360 (0,5); 6,347 (0,8); 6,332 (0,6); 3,951 (16,0); 3,904 (3,1); 3,355 (1,1); 3,332 (1376,9); 3,296 (0,6); 3,285 (0,4); 3,172 (0,5); 3,163 (0,5); 3,029 (0,4); 2,617 (2,2); 2,614 (3,0); 2,611 (2,2); 2,541 (0,8); 2,523 (4,8); 2,520</p>	

(6,1); 2,517 (6,2); 2,508 (154,6); 2,505 (334,6); 2,502 (461,9); 2,499 (336,2); 2,496 (158,9); 2,389 (2,1); 2,386 (2,9); 2,383 (2,2); 1,902 (0,6); 1,851 (1,2); 1,845 (2,6); 1,839 (3,1); 1,834 (1,3); 1,434 (0,6); 1,298 (0,6); 1,268 (1,4); 1,262 (3,1); 1,255 (3,4); 1,249 (1,6); 1,244 (1,2); 1,235 (0,6); 0,005 (0,6); 0,000 (18,1); -0,006 (0,6)	
<p>実施例 I-09: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,770$ (3,7); 9,661 (4,2); 9,636 (4,3); 8,871 (9,1); 8,774 (3,7); 8,119 (14,6); 8,038 (7,4); 7,958 (3,7); 7,934 (3,7); 7,852 (0,5); 7,807 (11,2); 7,715 (0,5); 7,404 (0,5); 7,386 (11,2); 6,339 (0,4); 6,318 (1,6); 6,296 (2,4); 6,274 (1,7); 6,252 (0,5); 4,545 (1,9); 4,528 (5,2); 4,510 (5,2); 4,493 (1,8); 4,056 (0,9); 4,038 (2,6); 4,020 (2,7); 4,003 (0,9); 3,324 (108,4); 3,031 (1,0); 2,772 (0,9); 2,676 (1,3); 2,671 (1,7); 2,667 (1,2); 2,507 (194,3); 2,502 (247,6); 2,498 (181,1); 2,333 (1,2); 2,329 (1,6); 2,325 (1,2); 1,989 (11,3); 1,858 (3,2); 1,848 (7,2); 1,839 (7,7); 1,830 (3,2); 1,397 (8,7); 1,352 (0,5); 1,335 (0,5); 1,314 (0,4); 1,298 (0,5); 1,273 (3,6); 1,263 (8,0); 1,254 (8,2); 1,243 (4,6); 1,232 (9,7); 1,214 (16,0); 1,197 (7,7); 1,175 (6,2); 1,157 (3,2); 0,853 (0,4); 0,146 (0,7); 0,008 (6,6); 0,000 (149,7); -0,008 (6,4); -0,150 (0,7)</p>	
<p>実施例 I-10: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,768$ (3,2); 9,753 (4,0); 9,729 (3,7); 8,870 (7,9); 8,772 (3,1); 8,316 (0,5); 8,125 (16,0); 8,067 (2,4); 8,044 (2,4); 7,832 (2,6); 7,805 (11,0); 7,388 (9,4); 6,439 (0,4); 6,418 (1,4); 6,397 (2,0); 6,375 (1,5); 6,352 (0,4); 4,544 (1,5); 4,527 (4,2); 4,509 (4,1); 4,492 (1,4); 3,324 (114,8); 2,676 (0,9); 2,672 (1,2); 2,667 (0,9); 2,542 (0,9); 2,511 (72,0); 2,507 (140,1); 2,503 (181,6); 2,498 (131,7); 2,494 (64,1); 2,334 (0,8); 2,329 (1,2); 2,325 (0,8); 2,075 (8,5); 1,858 (2,8); 1,848 (6,1); 1,839 (6,6); 1,830 (2,7); 1,272 (2,9); 1,262 (6,6); 1,253 (6,5); 1,243 (2,8); 1,227 (6,4); 1,209 (13,3); 1,192 (6,1); 0,008 (3,2); 0,000 (73,7); -0,008 (2,8)</p>	10
<p>実施例 I-11: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,851$ (4,3); 9,827 (4,5); 9,765 (4,0); 8,869 (9,6); 8,777 (4,0); 8,106 (15,0); 7,914 (2,0); 7,896 (3,8); 7,878 (2,2); 7,806 (11,6); 7,753 (2,1); 7,750 (2,2); 7,732 (4,4); 7,714 (2,5); 7,711 (2,3); 7,431 (3,1); 7,411 (5,8); 7,399 (11,8); 6,400 (0,5); 6,380 (1,9); 6,358 (2,9); 6,336 (2,0); 6,314 (0,6); 4,544 (1,9); 4,527 (5,3); 4,509 (5,3); 4,491 (1,9); 3,326 (42,0); 2,892 (0,6); 2,732 (0,6); 2,690 (0,6); 2,672 (0,7); 2,507 (82,4); 2,503 (104,7); 2,499 (78,3); 2,330 (0,6); 1,858 (3,3); 1,847 (7,6); 1,838 (8,1); 1,829 (3,3); 1,397 (8,1); 1,273 (3,7); 1,263 (8,1); 1,254 (8,1); 1,244 (3,7); 1,223 (7,8); 1,205 (16,0); 1,188 (7,4); 0,000 (16,5)</p>	20
<p>実施例 I-12: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,841$ (4,0); 9,817 (4,2); 9,774 (3,4); 8,901 (9,2); 8,783 (3,4); 8,315 (0,7); 8,267 (2,4); 8,249 (4,3); 8,230 (2,3); 8,157 (16,0); 7,904 (0,4); 7,848 (11,6); 7,495 (11,1); 6,388 (0,4); 6,368 (1,6); 6,347 (2,4); 6,325 (1,8); 6,303 (0,5); 5,479 (0,3); 5,437 (8,8); 3,321 (44,0); 3,226 (4,1); 3,220 (8,8); 3,214 (3,7); 2,676 (1,1); 2,671 (1,5); 2,667 (1,1); 2,662 (0,5); 2,541 (0,9); 2,524 (3,8); 2,511 (84,2); 2,506 (171,4); 2,502 (225,3); 2,497 (160,4); 2,493 (75,5); 2,338 (0,5); 2,333 (1,1); 2,329 (1,4); 2,324 (1,1); 2,320 (0,5); 2,074 (1,6); 1,861 (3,1); 1,852 (7,0); 1,842 (7,6); 1,833 (3,1); 1,754 (1,4); 1,276 (3,5); 1,267 (7,4); 1,257 (7,4); 1,247 (2,9); 0,146 (0,3); 0,008 (2,6); 0,000 (80,7); -0,009 (2,7); -0,150 (0,3)</p>	20
<p>実施例 I-13: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,685$ (2,5); 9,661 (4,2); 8,872 (2,1); 8,659 (4,8); 8,340 (4,1); 8,104 (2,0); 8,083 (2,3); 7,961 (6,7); 7,887 (3,6); 7,866 (2,9); 7,500 (0,7); 7,466 (0,6); 7,431 (0,3); 7,410 (4,7); 7,331 (6,2); 7,319 (0,9); 6,872 (1,5); 6,642 (0,8); 6,375 (1,0); 6,353 (1,5); 6,330 (1,1); 5,757 (1,6); 4,520 (1,2); 4,503 (3,1); 4,486 (3,1); 4,468 (1,1); 3,602 (0,4); 3,325 (40,5); 3,027 (1,6); 2,759 (1,7); 2,676 (0,4); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,507 (66,9); 2,503 (77,9); 2,499 (52,7); 2,455 (15,7); 2,330 (0,7); 2,320 (1,9); 2,185 (2,3); 1,854 (2,0); 1,844 (4,3); 1,835 (4,3); 1,826 (1,7); 1,760 (0,5); 1,357 (16,0); 1,249 (2,7); 1,239 (6,8); 1,233 (8,1); 1,217 (9,4); 1,199 (4,2); 0,000 (10,5); -0,009 (0,3)</p>	30
<p>実施例 I-14: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,770$ (1,0); 9,685 (1,1); 9,662 (1,1); 8,897 (2,6); 8,783 (1,0); 8,315 (1,0); 8,152 (4,4); 8,109 (3,7); 8,093 (3,6); 7,892 (0,4); 7,853 (0,4); 7,841 (3,3); 7,499 (0,4); 7,480 (3,2); 6,305 (0,6); 6,282 (0,8); 6,263 (0,5); 5,445 (2,9); 5,441 (2,8); 3,790 (0,4); 3,332 (61,7); 3,217 (1,5); 3,211 (2,7); 3,205 (1,1); 2,675 (1,3); 2,671 (1,8); 2,666 (1,3); 2,541 (0,8); 2,524 (4,3); 2,510 (107,0); 2,506 (216,0); 2,502 (283,0); 2,497 (202,9); 2,493 (97,3); 2,333 (1,4); 2,328 (1,9); 2,324 (1,3); 2,196 (0,5); 2,179 (1,1); 2,160 (0,6); 1,861 (0,9); 1,851 (2,0); 1,842 (2,3); 1,832 (1,0); 1,593 (0,4); 1,579 (0,3); 1,506 (1,9); 1,477 (0,4); 1,469 (0,3); 1,276 (1,4); 1,266 (2,7); 1,257 (3,1); 1,235 (16,0); 0,871 (0,5); 0,854 (1,6); 0,837 (0,8); 0,008 (0,3); 0,000 (12,0); -0,008 (0,4)</p>	
<p>実施例 I-15: $^1\text{H-NMR}$ (601,6 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,761$ (1,3); 9,598 (1,6); 9,582 (1,7); 8,883 (3,6); 8,769 (1,3); 8,314 (0,5); 8,112 (9,9); 8,102 (4,2); 8,082 (0,4); 7,766 (4,1); 7,749 (0,3); 7,397 (3,9); 6,286 (0,6); 6,271 (0,9); 6,256 (0,6); 3,972 (0,6); 3,969 (0,9); 3,951 (16,0); 3,866 (0,7); 3,849 (0,4); 3,846 (0,4); 3,840 (1,2); 3,808 (0,7); 3,805 (0,7); 3,796 (0,4); 3,790 (1,0); 3,776 (0,3); 3,339 (15,4); 2,731 (0,4); 2,617 (0,8); 2,614 (1,1); 2,611 (0,8); 2,608 (0,4); 2,541 (0,4); 2,523 (1,7); 2,520 (2,1); 2,517 (1,9); 2,508 (48,3); 2,505 (107,9); 2,502 (152,9); 2,499 (109,9); 2,496 (52,4); 2,392 (0,3); 2,389 (0,7); 2,386 (1,0); 2,383 (0,7); 2,380 (0,4); 1,989 (0,3); 1,853 (1,2); 1,847 (2,8); 1,841 (3,2); 1,834 (1,3); 1,398 (1,0); 1,270 (1,3); 1,264 (2,9); 1,257 (3,3); 1,251 (1,4); 1,236 (1,4); 0,005 (1,0); 0,000 (42,1); -0,006 (1,7)</p>	40
<p>実施例 I-16: $^1\text{H-NMR}$ (400,0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$):</p> <p>$\delta = 9,762$ (3,2); 9,737 (1,9); 8,883 (3,8); 8,777 (1,5); 8,338 (2,6); 8,316 (0,5); 8,113 (6,5); 8,084 (1,5); 7,887 (2,7); 7,866 (2,2); 7,764 (4,9); 7,399 (4,8); 6,378 (0,7); 6,356 (1,1); 6,334 (0,8); 3,947 (16,0); 3,324 (154,0); 2,728 (0,4); 2,676 (1,0); 2,671 (1,4); 2,667 (1,0); 2,541 (1,0); 2,524 (4,4); 2,511 (81,8); 2,506 (161,0); 2,502 (208,9); 2,498 (150,5); 2,333 (1,0);</p>	

2,329 (1,3); 2,324 (1,0); 1,989 (1,1); 1,858 (1,3); 1,847 (3,0); 1,838 (3,3); 1,829 (1,3); 1,398 (1,6); 1,273 (1,4); 1,263 (3,2); 1,254 (3,2); 1,243 (1,4); 1,236 (0,8); 1,193 (0,3); 1,175 (0,6); 0,000 (1,1)	
<p>実施例 I-17: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,779 (6,3); 9,755 (3,7); 8,879 (7,9); 8,774 (3,1); 8,317 (0,4); 8,282 (2,1); 8,264 (3,7); 8,245 (2,0); 8,127 (13,3); 7,817 (9,9); 7,407 (10,0); 6,396 (0,4); 6,377 (1,4); 6,356 (2,1); 6,333 (1,5); 6,312 (0,5); 4,544 (1,5); 4,527 (4,4); 4,509 (4,4); 4,492 (1,5); 3,333 (219,9); 2,677 (0,6); 2,672 (0,8); 2,668 (0,6); 2,542 (0,4); 2,525 (2,3); 2,512 (49,8); 2,508 (100,5); 2,503 (132,2); 2,499 (95,0); 2,495 (45,5); 2,335 (0,6); 2,330 (0,8); 2,325 (0,6); 2,076 (16,0); 1,858 (2,8); 1,849 (6,2); 1,839 (6,8); 1,830 (2,8); 1,273 (3,1); 1,263 (6,7); 1,254 (6,8); 1,244 (3,2); 1,234 (7,0); 1,217 (14,0); 1,199 (6,4); 0,008 (1,2); 0,000 (32,7); -0,009 (1,2)</p>	
<p>実施例 I-18: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,774 (7,1); 9,751 (4,4); 8,875 (9,2); 8,767 (3,5); 8,316 (0,5); 8,281 (2,4); 8,263 (4,3); 8,244 (2,3); 8,124 (15,5); 7,815 (11,3); 7,406 (11,3); 6,396 (0,5); 6,376 (1,6); 6,355 (2,4); 6,333 (1,8); 6,311 (0,5); 4,544 (1,8); 4,527 (5,1); 4,509 (5,0); 4,491 (1,7); 3,325 (206,2); 2,676 (1,0); 2,671 (1,4); 2,667 (1,0); 2,542 (0,8); 2,525 (3,9); 2,511 (77,8); 2,507 (157,1); 2,502 (206,8); 2,498 (148,5); 2,494 (71,1); 2,334 (0,9); 2,329 (1,3); 2,325 (0,9); 2,075 (0,5); 1,858 (3,2); 1,848 (7,1); 1,839 (7,7); 1,829 (3,1); 1,273 (3,5); 1,263 (7,6); 1,254 (7,7); 1,243 (3,6); 1,234 (7,8); 1,216 (16,0); 1,199 (7,3); 0,146 (1,2); 0,008 (10,1); 0,000 (270,9); -0,009 (10,2); -0,150 (1,2)</p>	10
<p>実施例 I-19: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,844 (4,6); 9,820 (4,8); 9,774 (4,2); 8,898 (10,1); 8,791 (4,1); 8,332 (7,0); 8,317 (0,6); 8,154 (16,0); 8,103 (3,3); 8,082 (3,9); 7,893 (6,9); 7,872 (5,7); 7,840 (12,7); 7,477 (12,4); 6,414 (0,5); 6,393 (1,8); 6,371 (2,8); 6,348 (2,0); 6,326 (0,5); 5,492 (0,4); 5,486 (0,5); 5,442 (10,6); 5,399 (0,4); 5,393 (0,4); 4,056 (0,5); 4,038 (1,5); 4,020 (1,5); 4,003 (0,5); 3,325 (122,4); 3,212 (4,3); 3,206 (8,6); 3,200 (4,1); 2,676 (0,9); 2,671 (1,3); 2,507 (148,3); 2,502 (190,1); 2,498 (139,2); 2,329 (1,2); 1,989 (6,4); 1,862 (3,5); 1,851 (7,8); 1,843 (8,4); 1,833 (3,5); 1,397 (10,9); 1,275 (3,7); 1,265 (8,3); 1,257 (8,3); 1,246 (3,4); 1,236 (1,4); 1,193 (1,7); 1,175 (3,3); 1,157 (1,7); 0,146 (1,1); 0,007 (11,9); 0,000 (218,0); -0,008 (10,3); -0,150 (1,1)</p>	
<p>実施例 I-20: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,767 (1,6); 9,634 (1,8); 9,609 (1,9); 8,889 (4,1); 8,777 (1,6); 8,154 (10,5); 8,117 (6,5); 7,769 (5,0); 7,401 (4,8); 6,313 (0,7); 6,292 (1,0); 6,270 (0,8); 3,951 (16,0); 3,328 (80,9); 3,309 (0,4); 2,672 (0,4); 2,525 (1,0); 2,507 (49,0); 2,503 (63,9); 2,499 (47,2); 2,330 (0,4); 1,860 (1,4); 1,849 (3,1); 1,840 (3,4); 1,831 (1,4); 1,275 (1,5); 1,266 (3,3); 1,256 (3,3); 1,246 (1,3); 0,008 (1,2); 0,000 (31,6); -0,008 (1,3)</p>	20
<p>実施例 I-21: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,775 (2,2); 9,715 (2,6); 9,691 (2,6); 8,901 (5,8); 8,789 (2,2); 8,316 (0,4); 8,156 (10,7); 8,147 (16,0); 7,844 (7,4); 7,483 (7,0); 6,326 (1,0); 6,304 (1,4); 6,282 (1,1); 5,445 (5,4); 5,442 (5,4); 3,326 (125,1); 3,221 (2,5); 3,215 (5,5); 3,209 (2,4); 2,676 (0,6); 2,672 (0,8); 2,667 (0,6); 2,525 (2,3); 2,512 (44,4); 2,507 (90,3); 2,503 (120,0); 2,498 (87,0); 2,493 (42,0); 2,334 (0,6); 2,329 (0,8); 2,325 (0,6); 1,909 (0,6); 1,862 (2,0); 1,852 (4,4); 1,843 (4,8); 1,833 (2,0); 1,277 (2,1); 1,267 (4,6); 1,258 (4,7); 1,247 (1,9); 1,235 (0,5); 0,008 (2,5); 0,000 (71,1); -0,009 (2,5)</p>	
<p>実施例 I-22: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,799 (0,6); 9,769 (4,5); 9,751 (4,8); 9,727 (4,4); 9,289 (0,6); 8,870 (9,0); 8,769 (4,3); 8,316 (0,9); 8,267 (7,9); 8,231 (7,9); 8,128 (12,7); 8,110 (0,6); 7,992 (7,6); 7,859 (0,9); 7,848 (1,1); 7,803 (10,6); 7,720 (0,5); 7,387 (11,1); 7,318 (0,5); 6,444 (0,5); 6,423 (1,8); 6,402 (2,7); 6,380 (1,9); 6,358 (0,6); 4,540 (2,1); 4,524 (5,8); 4,506 (5,9); 4,489 (2,2); 4,353 (0,4); 4,335 (0,4); 3,979 (0,5); 3,421 (0,4); 3,323 (201,1); 3,031 (1,2); 2,773 (1,1); 2,672 (2,3); 2,565 (0,6); 2,506 (268,9); 2,503 (335,5); 2,329 (2,2); 1,858 (3,2); 1,848 (7,5); 1,839 (8,3); 1,831 (3,9); 1,585 (0,5); 1,580 (0,6); 1,364 (0,5); 1,347 (0,9); 1,329 (0,5); 1,315 (0,4); 1,298 (0,5); 1,272 (4,4); 1,262 (8,9); 1,253 (9,2); 1,236 (6,4); 1,226 (8,7); 1,208 (16,0); 1,191 (7,7); 0,921 (0,5); 0,904 (0,5); 0,854 (0,5); 0,146 (1,3); 0,000 (264,2); -0,059 (0,3); -0,150 (1,3)</p>	30
<p>実施例 I-23: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,767 (0,9); 9,397 (1,0); 9,374 (1,1); 8,868 (2,4); 8,782 (0,9); 8,103 (4,2); 7,785 (2,9); 7,389 (1,5); 7,373 (1,4); 7,368 (1,3); 7,354 (3,1); 7,301 (0,5); 7,284 (0,6); 7,278 (1,0); 7,273 (0,5); 7,261 (0,3); 7,255 (0,5); 6,403 (0,5); 6,392 (0,5); 4,550 (0,4); 4,532 (1,1); 4,513 (1,1); 4,495 (0,4); 3,326 (30,5); 2,525 (0,6); 2,511 (14,5); 2,507 (30,1); 2,502 (40,7); 2,498 (30,4); 2,493 (15,2); 1,989 (0,5); 1,858 (0,8); 1,847 (1,8); 1,838 (2,0); 1,829 (0,8); 1,398 (16,0); 1,273 (0,8); 1,263 (1,9); 1,254 (1,9); 1,243 (0,9); 1,225 (1,9); 1,208 (4,0); 1,190 (1,9); 1,175 (0,4); 0,008 (2,2); 0,000 (61,1); -0,009 (2,6)</p>	
<p>実施例 I-24: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,766 (3,5); 9,406 (3,7); 9,383 (3,8); 8,869 (8,2); 8,779 (3,4); 8,316 (0,6); 8,110 (12,7); 7,831 (0,8); 7,785 (10,0); 7,711 (13,6); 7,707 (16,0); 7,655 (4,3); 7,651 (6,9); 7,646 (3,9); 7,353 (10,4); 6,553 (1,0); 6,544 (0,9); 6,416 (1,9); 6,406 (1,9); 6,279 (1,0); 6,268 (1,1); 5,703 (0,4); 5,693 (0,6); 5,671 (1,2); 5,665 (1,2); 5,650 (1,0); 5,636 (1,2); 5,612 (0,6); 5,603 (0,5); 4,545 (1,7); 4,528 (4,7); 4,510 (4,6); 4,492 (1,7); 3,326 (144,3); 3,030 (2,0); 2,774 (1,9); 2,671 (1,3); 2,667 (1,0); 2,506 (146,9); 2,502 (193,1); 2,498 (149,3); 2,333 (1,0); 2,329 (1,3); 2,325 (1,0); 1,857 (2,9); 1,847 (6,5); 1,838 (7,0); 1,828 (3,0); 1,397 (14,6); 1,272 (3,2); 1,262 (7,0); 1,253 (7,2); 1,242 (3,5); 1,223 (7,0); 1,205 (14,0); 1,188 (6,5); 0,146 (1,2); 0,008 (11,8); 0,000 (239,1); -0,008 (16,1); -0,150 (1,2)</p>	40
<p>実施例 I-25: ¹H-NMR (400,0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,763 (3,4); 9,419 (3,6); 9,396 (3,7); 8,864 (8,1); 8,777 (3,4); 8,316 (0,4); 8,101 (11,8); 8,036 (0,6); 7,952 (0,9); 7,907</p>	

(6,9); 7,903 (7,3); 7,812 (0,6); 7,781 (9,9); 7,727 (5,7); 7,707 (7,8); 7,596 (4,0); 7,592 (4,2); 7,575 (3,1); 7,571 (3,2); 7,340 (10,2); 6,540 (1,0); 6,530 (0,9); 6,403 (1,9); 6,393 (2,0); 6,265 (1,0); 6,254 (1,1); 5,756 (1,8); 5,667 (0,5); 5,657 (0,6); 5,633 (1,3); 5,625 (1,2); 5,612 (1,1); 5,600 (1,4); 5,577 (0,6); 5,566 (0,5); 4,543 (1,7); 4,526 (4,8); 4,508 (4,8); 4,491 (1,8); 4,056 (1,2); 4,038 (3,8); 4,020 (3,9); 4,002 (1,3); 3,325 (169,3); 2,980 (0,3); 2,891 (5,4); 2,732 (4,8); 2,690 (2,1); 2,671 (1,1); 2,506 (124,7); 2,502 (164,1); 2,498 (130,1); 2,329 (1,1); 1,989 (16,0); 1,857 (2,7); 1,847 (6,2); 1,838 (6,8); 1,828 (3,0); 1,335 (0,4); 1,327 (0,5); 1,272 (3,0); 1,262 (6,6); 1,253 (6,8); 1,243 (3,0); 1,220 (6,8); 1,203 (13,9); 1,193 (6,9); 1,185 (6,9); 1,175 (9,1); 1,157 (4,3); 1,006 (0,4); 0,999 (0,4); 0,146 (0,7); 0,000 (137,1); -0,150 (0,7)	
実施例 I-26: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,813 (0,3); 9,784 (5,1); 9,775 (3,9); 9,760 (4,7); 9,298 (0,4); 8,877 (8,7); 8,769 (3,4); 8,317 (0,3); 8,126 (16,0); 8,108 (2,8); 8,094 (1,4); 7,865 (0,9); 7,861 (0,7); 7,817 (10,9); 7,409 (11,0); 6,393 (0,4); 6,373 (1,6); 6,351 (2,4); 6,329 (1,7); 6,308 (0,5); 4,546 (1,7); 4,528 (5,1); 4,511 (5,1); 4,493 (1,7); 3,327 (124,1); 2,676 (0,8); 2,672 (1,2); 2,667 (0,9); 2,525 (2,8); 2,511 (65,9); 2,507 (135,0); 2,503 (180,5); 2,498 (135,1); 2,494 (68,5); 2,334 (0,9); 2,329 (1,2); 2,325 (0,9); 2,075 (8,3); 1,858 (3,0); 1,848 (6,8); 1,839 (7,5); 1,830 (3,1); 1,589 (0,3); 1,582 (0,4); 1,286 (0,4); 1,273 (3,6); 1,263 (7,4); 1,254 (7,5); 1,243 (3,5); 1,234 (7,4); 1,216 (15,5); 1,199 (7,1); 0,000 (2,5)	10
実施例 I-27: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,784 (4,9); 9,773 (3,9); 9,761 (5,0); 8,876 (9,2); 8,776 (3,4); 8,317 (0,4); 8,122 (15,7); 8,113 (2,7); 8,098 (2,6); 8,089 (2,6); 8,074 (2,4); 7,816 (11,4); 7,406 (11,4); 6,416 (0,4); 6,395 (1,6); 6,374 (2,3); 6,352 (1,7); 6,331 (0,5); 4,546 (1,6); 4,528 (4,5); 4,510 (4,4); 4,492 (1,6); 3,327 (71,9); 2,677 (0,6); 2,672 (0,9); 2,668 (0,7); 2,526 (2,1); 2,521 (3,1); 2,512 (46,7); 2,508 (97,2); 2,503 (130,7); 2,499 (96,2); 2,494 (47,1); 2,335 (0,6); 2,330 (0,9); 2,326 (0,6); 2,076 (6,3); 1,859 (3,1); 1,849 (7,1); 1,840 (7,7); 1,830 (3,2); 1,274 (3,4); 1,264 (7,6); 1,255 (7,7); 1,244 (3,5); 1,234 (7,7); 1,217 (16,0); 1,199 (7,3); 0,146 (1,0); 0,008 (7,3); 0,000 (219,6); -0,009 (8,2); -0,150 (1,0)	
実施例 I-28: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,771 (3,5); 9,513 (0,4); 9,491 (0,5); 9,466 (3,9); 9,444 (4,0); 9,293 (0,8); 8,871 (9,2); 8,776 (3,5); 8,317 (0,6); 8,109 (15,2); 8,064 (3,0); 8,045 (5,0); 8,027 (2,9); 7,847 (1,4); 7,836 (1,0); 7,792 (11,2); 7,351 (11,9); 6,626 (1,0); 6,616 (1,0); 6,488 (2,1); 6,478 (2,2); 6,351 (1,1); 6,340 (1,2); 5,885 (0,5); 5,875 (0,6); 5,853 (1,4); 5,843 (1,2); 5,833 (1,1); 5,820 (1,5); 5,798 (0,6); 5,787 (0,5); 4,559 (0,3); 4,541 (1,8); 4,523 (4,6); 4,504 (4,5); 4,486 (1,7); 4,468 (0,3); 3,329 (169,8); 2,676 (0,9); 2,672 (1,2); 2,667 (0,9); 2,525 (3,4); 2,511 (69,6); 2,507 (137,7); 2,503 (180,3); 2,498 (133,2); 2,494 (66,5); 2,334 (0,9); 2,330 (1,2); 2,325 (0,9); 1,857 (3,1); 1,847 (6,9); 1,838 (7,6); 1,829 (3,1); 1,586 (0,7); 1,579 (0,7); 1,286 (0,5); 1,271 (3,9); 1,262 (7,6); 1,252 (7,7); 1,242 (3,2); 1,223 (7,6); 1,205 (16,0); 1,188 (7,3); 0,146 (1,5); 0,008 (13,0); 0,000 (310,8); -0,008 (12,9); -0,150 (1,5)	20
実施例 I-29: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,801 (4,5); 9,777 (7,5); 8,876 (9,7); 8,770 (3,8); 8,165 (3,5); 8,152 (3,3); 8,149 (3,3); 8,127 (15,1); 7,817 (11,7); 7,408 (11,8); 6,410 (0,5); 6,391 (1,8); 6,369 (2,6); 6,348 (1,9); 6,327 (0,6); 4,545 (1,8); 4,528 (5,4); 4,510 (5,4); 4,492 (1,8); 3,325 (124,8); 2,675 (1,1); 2,671 (1,6); 2,667 (1,2); 2,506 (178,5); 2,502 (238,7); 2,498 (184,1); 2,329 (1,5); 2,325 (1,2); 2,075 (7,4); 1,857 (3,2); 1,847 (7,3); 1,838 (8,1); 1,829 (3,3); 1,272 (3,5); 1,262 (7,8); 1,253 (8,0); 1,243 (3,8); 1,233 (7,9); 1,216 (16,0); 1,198 (7,5); 0,000 (3,7)	
実施例 I-30: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,464 (3,7); 10,439 (4,0); 9,761 (4,2); 8,923 (9,7); 8,861 (4,3); 8,429 (3,4); 8,414 (3,3); 8,317 (0,4); 8,240 (16,0); 8,223 (2,6); 8,072 (0,5); 8,009 (13,1); 7,850 (0,4); 7,673 (2,6); 7,648 (3,8); 7,625 (2,5); 6,396 (0,5); 6,376 (1,7); 6,354 (2,6); 6,332 (1,8); 6,311 (0,7); 4,627 (2,0); 4,610 (5,7); 4,592 (5,8); 4,575 (2,0); 3,329 (286,3); 2,672 (1,7); 2,668 (1,4); 2,507 (207,0); 2,503 (266,8); 2,499 (207,6); 2,330 (1,7); 2,326 (1,3); 2,076 (3,7); 1,866 (3,2); 1,856 (7,5); 1,847 (8,2); 1,838 (3,6); 1,330 (7,8); 1,313 (16,0); 1,294 (8,9); 1,280 (8,3); 1,271 (8,1); 1,261 (3,4); 0,146 (0,7); 0,000 (138,4); -0,149 (0,7)	
実施例 I-31: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,793 (2,5); 9,770 (4,0); 8,876 (5,2); 8,776 (2,0); 8,316 (0,5); 8,121 (8,8); 7,974 (0,9); 7,958 (1,0); 7,951 (1,0); 7,941 (0,9); 7,816 (6,4); 7,407 (6,4); 6,400 (0,9); 6,378 (1,3); 6,357 (1,0); 4,547 (0,9); 4,529 (2,6); 4,511 (2,6); 4,493 (0,9); 3,328 (149,6); 2,690 (16,0); 2,681 (0,5); 2,676 (0,8); 2,672 (1,0); 2,667 (0,7); 2,663 (0,4); 2,525 (2,4); 2,520 (3,8); 2,511 (53,7); 2,507 (109,4); 2,503 (145,0); 2,498 (106,4); 2,494 (52,3); 2,334 (0,7); 2,329 (0,9); 2,325 (0,7); 1,858 (1,8); 1,848 (4,0); 1,839 (4,4); 1,829 (1,8); 1,398 (4,0); 1,272 (1,9); 1,262 (4,3); 1,253 (4,4); 1,242 (2,1); 1,233 (4,5); 1,216 (9,0); 1,198 (4,1); 0,146 (1,2); 0,008 (9,0); 0,000 (251,3); -0,009 (9,9); -0,150 (1,1)	30
実施例 I-32: ¹ H-NMR (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,769 (3,6); 9,489 (4,2); 9,466 (4,4); 8,868 (9,5); 8,781 (3,6); 8,317 (0,4); 8,109 (15,9); 8,100 (0,6); 8,076 (3,3); 8,059 (3,2); 7,999 (1,6); 7,994 (1,7); 7,988 (1,9); 7,979 (2,2); 7,973 (1,9); 7,966 (1,9); 7,829 (0,7); 7,783 (11,7); 7,697 (0,9); 7,632 (2,7); 7,606 (3,5); 7,584 (2,5); 7,336 (11,8); 6,562 (1,1); 6,552 (1,0); 6,425 (2,2); 6,414 (2,2); 6,287 (1,1); 6,276 (1,2); 5,769 (0,5); 5,757 (3,8); 5,746 (0,7); 5,736 (1,4); 5,726 (1,1); 5,714 (1,1); 5,702 (1,4); 5,691 (0,7); 5,678 (0,6); 5,669 (0,5); 4,541 (1,8); 4,524 (5,0); 4,506 (5,0); 4,488 (1,8); 4,038 (0,5); 4,020 (0,5); 3,331 (173,5); 3,030 (2,2); 2,774 (1,9); 2,677 (0,7); 2,672 (1,0); 2,668 (0,8); 2,525 (2,5); 2,520 (3,9); 2,512 (55,0); 2,507 (111,8); 2,503 (148,3); 2,498 (109,8); 2,494 (54,5); 2,334 (0,7); 2,330 (1,0); 2,325 (0,7); 2,087 (15,4); 1,989 (2,0); 1,858 (3,2); 1,848 (7,3); 1,839 (7,8); 1,829 (3,2); 1,272 (3,4); 1,262 (7,7); 1,253 (7,8); 1,242 (3,5); 1,215 (7,6); 1,198 (16,0); 1,180 (7,3); 1,158 (0,7); 1,141 (0,5); 0,146 (1,3); 0,008 (9,8); 0,000 (266,0); -0,009 (10,6); -0,150 (1,3)	40

【 0 1 8 8 】

(a) 酸性範囲内における LC - MS による M⁺ の測定は、pH 2 . 7 実施する、溶離液としてアセトニトリル (0 . 1 % ギ酸含有) 及び水 ; 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、機器 : A g i l e n t 1 1 0 0 L C システム、A g i l e n t M S D システム、H T S P A L 。

【 0 1 8 9 】

表及び調製実施例において報告されている log P 値は、「 E E C d i r e c t i v e 7 9 / 8 3 1 A n n e x V . A 8 」に従い、逆相カラム (C 1 8) を使用する H P L C (高性能液体クロマトグラフィー) によって求めた。温度 4 3 。較正は、log

10

20

30

40

50

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。

【 0 1 9 0 】

(b) ^1H NMR データは、対照標準 (0 . 0) としてのテトラメチルシラン及び溶媒 CD_3CN 、 CDCl_3 、 $\text{D}_6\text{-DMSO}$ を使用して、フロープローブヘッド (容積 $60\ \mu\text{L}$) が装備されている「Bruker Avance 400」を用いて測定する。

【 0 1 9 1 】

選択された実施例に関する NMR 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、NMR ピークリストとして記載されている。

10

【 0 1 9 2 】

NMR ピークリスト法

選択された実施例の ^1H NMR データは、 ^1H NMR 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 (ppm) 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 1 9 3 】

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：

δ_1 (強度 I_1) ; δ_2 (強度 I_2) ; . . . ; δ_i (強度 I_i) ; . . . ; δ_n (強度 I_n) 。

【 0 1 9 4 】

先鋭なシグナルの強度は、NMR スペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ (cm) 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。

20

【 0 1 9 5 】

^1H NMR 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 DMSO 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、NMR 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。

【 0 1 9 6 】

^1H NMR ピークのリストは、従来の ^1H NMR のプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMR 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。

30

【 0 1 9 7 】

さらに、それらは、従来の ^1H NMR 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、本発明の対象の一部を形成する) 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 1 9 8 】

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 NMR ピークの本発明者らによるリストは、通常、溶媒のピーク、例えば、 $\text{DMSO}-\text{D}_6$ 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。

40

【 0 1 9 9 】

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。

【 0 2 0 0 】

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、この場合、「副産物の指紋 (by - product fingerprint) 」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つ。

50

【0201】

目標化合物のピークを既知方法（Mestre C、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ーキングに類似しているであろう。

【0202】

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。

10

【0203】

使用実施例

以下の実施例は、本発明による化合物の殺虫効果及び殺ダニ効果を立証している。これらの実施例において、記載されている本発明化合物は、対応する参照数字（No.）を伴って表1の中に記載されている化合物に関連している。

【0204】

アンブリオンマ・ヘバラエウム（Amblyomma hebraeum）試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化合物の適切な配合物を製造するために、10mgの活性化合物を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

20

【0205】

マダニ（アンブリオンマ・ヘバラエウム（Amblyomma hebraeum））の幼虫を穴があけてあるプラスチック製ピーカーの中に配置し、所望濃度に1分間浸漬する。そのマダニを濾紙に載せてペトリ皿内に移し、人工気象室の中で保存する。

【0206】

42日間経過した後、殺虫率（%）を求める。100%は、全てのマダニが死んだことを意味し；0%は、死んだマダニが無かったことを意味する。

【0207】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-30。

30

【0208】

オウシマダニ（Boophilus microplus）注入試験（BOOPMI inj）

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化合物の適切な配合物を製造するために、10mgの活性化合物を0.5mLの溶媒と混合し、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0209】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ（Boophilus microplus）の腹部に1μLの該活性化合物溶液を注入する。その動物を皿に移し、人工気象室内で維持する。

40

【0210】

効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精したことが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室の中で保存する。100%の効力は、受精卵を産んだマダニが無かったことを意味し；0%は、全ての卵が受精していることを意味する。

【0211】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20μgの施用量で、100%の効力を示す： I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-07、I-08、I-09、I-10、I-11、I-12、I-13、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-22、I-23、I-24、I-25

50

、 I - 26、 I - 27、 I - 29、 I - 30、 I - 31、 I - 32。

【0212】

オウシマダニ (Boophilus microplus) - 浸漬試験

被験動物： オウシマダニ (Boophilus microplus)
Parkhurst 系統，SP - 抵抗性

溶媒： ジメチルスルホキシド

10 mg の活性化化合物を 0.5 mL のジメチルスルホキシドに溶解させる。適切な配合物を製造するために、活性化化合物の該溶液をいずれの場合にも水で希釈して所望の濃度とする。

【0213】

この活性化化合物調製物をピペットで管の中に入れる。8 ~ 10 匹の充血した成体雌オウシマダニ (Boophilus microplus) を穴を有するさらなる管の中に移す。その管を活性化化合物の該配合物の中に浸漬し、全てのマダニを完全に濡らす。当該液体が流れ落ちた後、マダニをプラスチック製皿の中のフィルターディスクに移し、人工気象室の中で保存する。

10

【0214】

効力は、7 日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精したことが明白ではない卵は、約 42 日後に幼虫が孵化するまで人工気象室の中で保存する。100% の効力は、受精卵を産んだマダニが無かったことを意味し；0% は、全ての卵が受精していることを意味する。

20

【0215】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 ppm の施用量で、100% の効力を示す： I - 30。

【0216】

ネコノミ (Ctenocephalides felis) - 経口試験 (CTECFE)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な配合物を製造するために、10 mg の活性化化合物を 0.5 mL のジメチルスルホキシドと混合させる。クエン酸塩を添加したウシ血液で希釈して、所望の濃度とする。

30

【0217】

頂部と底部がガーゼで閉じられているチャンバーの中に、餌を与えていない約 20 匹の成体ネコノミ (Ctenocephalides felis) を入れる。下端部がパラフィルムで閉じられている金属製円筒を該チャンバーの上に配置する。該円筒は、血液 / 活性化化合物調製物を含んでおり、これは、パラフィルム膜を通してネコノミによって摂取され得る。

【0218】

2 日間経過した後、殺虫率 (%) を求める。100% は、全てのネコノミが死んだことを意味し；0% は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0219】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 ppm の施用量で、100% 効力を示す： I - 01、I - 02、I - 03、I - 04、I - 05、I - 07、I - 08、I - 09、I - 10、I - 11、I - 12、I - 13、I - 16、I - 17、I - 18、I - 19、I - 20、I - 22、I - 23、I - 24、I - 25、I - 26、I - 27、I - 29、I - 30、I - 31、I - 32。

40

【0220】

ヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) 試験 (LUCICU)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な配合物を製造するために、10 mg の活性化化合物を 0.5 mL のジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

50

【0221】

約20匹のヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) のL1幼虫を、馬肉の挽肉及び所望濃度の活性化化合物調製物を含んでいる被験容器の中に移す。

【0222】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのヒツジキンバエ幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだヒツジキンバエ幼虫が無かったことを意味する。

【0223】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-07、I-08、I-09、I-10、I-12、I-13、I-16、I-18、I-19、I-20、I-22、I-24、I-25、I-26、I-27、I-29、I-30、I-31、I-32。

10

【0224】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： I-17、I-23。

【0225】

イエバエ (*Musca domestica*) 試験 (MUSCDO)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な配合物を製造するために、10mgの活性化化合物を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

20

【0226】

砂糖溶液と所望濃度の活性化化合物調製物で処理されたスポンジを含んでいる容器に、10匹の成体イエバエ (*Musca domestica*) を生息させる。

【0227】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのイエバエが死んだことを意味し；0%は、死んだイエバエが無かったことを意味する。

【0228】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-01、I-02、I-03、I-04、I-05、I-07、I-09、I-10、I-12、I-13、I-16、I-18、I-19、I-20、I-22、I-26、I-27、I-29、I-30、I-31。

30

【0229】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： I-17、I-24。

【0230】

サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 試験

溶媒： 125.0重量部のアセトン

活性化化合物の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0231】

容器に、砂、活性化化合物溶液、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) の卵/幼虫の懸濁液及びレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、植物が成長する。根では、こぶが形成される。

40

【0232】

14日間経過した後、こぶの形成によって殺線虫効力(%)を求める。100%は、こぶが見られなかったことを意味し；0%は、処理された植物のこぶの数が処理されていない対照のこぶの数に相当することを意味する。

【0233】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、90%の効力を示す： I-19。

50

【0234】

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： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な配合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、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0235】

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。

【0236】

6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。

【0237】

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 - 29。

【0238】

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、90%の効力を示す： I - 20、I - 32。

【0239】

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

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： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な配合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、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0240】

ハクサイ (Brassica pekinensis) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧し、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。

【0241】

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。

【0242】

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 - 01、I - 02、I - 03、I - 04、I - 05、I - 06、I - 07、I - 08、I - 09、I - 10、I - 11、I - 12、I - 13、I - 14、I - 16、I - 17、I - 18、I - 19、I - 20、I - 21、I - 22、I - 23、I - 24、I - 25、I - 26、I - 27、I - 28、I - 29、I - 30、I - 31、I - 32。

【0243】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 15。

10

20

30

40

50

【0244】

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験 (SPODFR)

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配合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、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

10

【0245】

トウモロコシ (Zea mays) 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、ツマジロクサヨトウ (army worm) (Spodoptera frugiperda) の幼虫を寄生させる。

【0246】

7日間経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのツマジロクサヨトウ幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだツマジロクサヨトウ幼虫が無かったことを意味する。

【0247】

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 - 01、I - 02、I - 03、I - 04、I - 05、I - 06、I - 07、I - 08、I - 09、I - 10、I - 11、I - 12、I - 13、I - 14、I - 15、I - 16、I - 17、I - 18、I - 19、I - 20、I - 21、I - 22、I - 24、I - 25、I - 26、I - 27、I - 28、I - 29、I - 30、I - 31、I - 32。

20

【0248】

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 - 23。

【0249】

ナミハダニ (Tetranychus urticae) - 噴霧試験, OP - 抵抗性 (TETRUR)

30

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配合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、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0250】

全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が発生しているインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) 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。

40

【0251】

6日間経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し；0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0252】

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 - 01、I - 02、I - 04、I - 06、I - 07、I - 08、I - 09、I - 10、I - 11、I - 13、I - 14、I - 16、I - 17、I - 1

50

8、I - 19、I - 20、I - 21、I - 22、I - 23、I - 24、I - 25、I - 26、I - 27、I - 28、I - 30、I - 31、I - 32。

【0253】

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、90%の効力を示す： I - 03、I - 05、I - 15、I - 29。

【0254】

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験 (SPODFR)

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配合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、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0255】

トウモロコシ (Zea mays) 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、ツマジロクサヨトウ (army worm) (Spodoptera frugiperda) の幼虫を寄生させる。

【0256】

所望の期間が経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのツマジロクサヨトウ幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだツマジロクサヨトウ幼虫が無かったことを意味する。

【0257】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術よりも優れた効力を示す： 表2を参照されたい。

【0258】

ミカンキイロアザミウマ (Frankliniella occidentalis) - 噴霧試験 (FRANOC)

溶媒： 7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配合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、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤を添加することが必要な場合、それらは、それぞれ、当該配合物の溶液に対して1000ppmの濃度で添加する。

【0259】

ツルナシインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) 植物に、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。乾燥後、その処理された植物に、混合アザミウマ個体群 (Frankliniella occidentalis) を寄生させる。

【0260】

所望の期間が経過した後、植物保護効力 (%) を求める。100%は、明白な損傷が無いことを意味し；0%は、処理された植物に対する損傷が処理されていない対照の損傷に相当することを意味する。

【0261】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術よりも優れた効力を示す： 表2を参照されたい。

【0262】

ハムシの一種 (Diabrotica balteata) - 灌注試験 (DIABBA)

10

20

30

40

50

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 2重量部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配合物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とするが、計算上、水浸しにする土壌の体積を含んでいることが必要である。土壌中の乳化剤の濃度が必ず40ppmを超えないようにすべきである。さらなる試験濃度を得るためには、希釈には水を使用する。

【0263】

いずれの場合にも、5個のトウモロコシ (*Zea mays*) を土壌が充填されているポットに播種し、その翌日、所望濃度の活性化合物調製物を用いてポットに給水する。1日後、25匹のハムシの1種 (*banded cucumber beetle*) (*Diabrotica balteata*) のL2幼虫を加える。

10

【0264】

8日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、5個の植物全てが発芽して生長したことを意味し；0%は、出芽した植物が無かったことを意味する。

【0265】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術よりも優れた効力を示す：表2を参照されたい。

【0266】

ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) - 噴霧試験；OP - 抵抗性 (TETRUR)

20

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配合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、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0267】

全ての成育段階のナミハダニ (*greenhouse red spider mite*) (*Tetranychus urticae*) が発生しているインゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*) 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。

30

【0268】

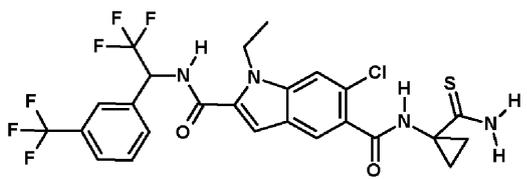
所望の期間が経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し；0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0269】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術よりも優れた効力を示す：表2を参照されたい。

【表 3】

表 2

物質	動物種	濃度	効力 (%) dat ^{a)}
 <p>従来技術 化合物 No. 273 WO-A-2012/119984</p>	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	33 7dat
	FRANOC	4 ppm	98 7dat
	FRANOC	0.8 ppm	60 7dat
	DIABBA	20 ppm	60 8dat
	DIABBA	4 ppm	0 8dat
	TETRUR	20 g/ha	100 6dat
	TETRUR	4 g/ha	70 6dat
本発明による Ex. No. I-01	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-02	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-03	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-04	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-06	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-07	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	67 7dat
本発明による Ex. No. I-08	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat

10

20

30

40

物質	動物種	濃度	効力 (%) dat ^{a)}
本発明による Ex. No. I-10	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-12	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-15	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	83 7dat
本発明による Ex. No. I-16	FRANOC	4 ppm	90 7dat
	FRANOC	0.8 ppm	90 7dat
	DIABBA	20 ppm	100 8dat
	DIABBA	4 ppm	50 8dat
本発明による Ex. No. I-18	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-19	DIABBA	20 ppm	100 8dat
本発明による Ex. No. I-20	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-21	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
本発明による Ex. No. I-22	SPODFR	4 g/ha	100 7dat
	SPODFR	0.8 g/ha	100 7dat
	TETRUR	20 g/ha	100 6dat
	TETRUR	4 g/ha	100 6dat
	DIABBA	20 ppm	100 8dat

10

20

30

40

物質	動物種	濃度	効力(%) dat ^{a)}
	DIABBA	4 ppm	50 8dat

a) 略語 : dat = 処理後日数

【0270】

上記表は、本発明による化合物が、特に低施用濃度において、WO-A-2012/119984から知られている化合物No. 273よりも優れた生物学的効力を有していることを示している。

10

【0271】

このことは、特に、WO-A-2012/119984の化合物No. 273を本発明による化合物No. I-03及び化合物No. I-07（これらは、本発明による該化合物が、フェニル環の4位において、 $R^1 = F$ （化合物No. I-03）又は $R^1 = Cl$ （化合物No. I-07）による付加的な置換を有しているという点のみにおいて、WO-A-2012/119984の化合物No. 273とは異なっている）と比較することによって、明らかとなる。生物学的活性の比較は、最近になって見いだされた化合物の群の有意性を示している。

【0272】

このことは、同様に、WO-A-2012/119984の化合物No. 273と本発明による化合物No. I-10及び化合物No. I-22（これらは、本発明による該化合物が、フェニル環において、 $-CF_3$ による置換に加えてハロゲンによる置換も有しているという点のみにおいて異なっている）との比較にも当てはまる。

20

【0273】

このことは、同様に、WO-A-2012/119984の化合物No. 273と本発明による化合物No. I-16及び化合物No. I-19（これらは、本発明による該化合物が、フェニル環の4位において、 $R^1 = Cl$ による置換を付加的に有しており、その際、 R^4 はエチルではなく、メチル（化合物No. I-16）又はプロパ-2-イン-1-イル（化合物No. I-19）であるという点のみにおいて異なっている）との比較にも当てはまる。

30

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2015/053065

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D209/42 A01N43/38 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, BIOSIS, EMBASE, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2012/119984 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; HEIL MARKUS [DE]; HEILMANN EIKE KEVIN [DE];) 13 September 2012 (2012-09-13) cited in the application the whole document insbesondere Beispiel 9, Verbindung 273 -----	1-8
X,P	WO 2014/026984 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 20 February 2014 (2014-02-20) the whole document insbesondere Zusammenfassung und Tabelle 1: Verbindungen 63-66, 78, 82, 84, 89 und 98 -----	1-8
<input 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 29 April 2015		Date of mailing of the international search report 08/05/2015
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 Papathoma, Sofia

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2015/053065

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012119984 A1	13-09-2012	AR 085509 A1	09-10-2013
		AU 2012224683 A1	26-09-2013
		CA 2829822 A1	13-09-2012
		CN 103502216 A	08-01-2014
		CO 6852083 A2	30-01-2014
		EA 201391265 A1	31-03-2014
		EP 2683688 A1	15-01-2014
		JP 2014508768 A	10-04-2014
		KR 20140022825 A	25-02-2014
		NZ 615219 A	29-08-2014
		US 2014088167 A1	27-03-2014
		WO 2012119984 A1	13-09-2012
		WO 2014026984 A1	20-02-2014
CA 2881995 A1	20-02-2014		
WO 2014026984 A1	20-02-2014		

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/053065

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D209/42 A01N43/38 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchiertes 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, WPI Data, BIOSIS, EMBASE, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 2012/119984 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; HEIL MARKUS [DE]; HEILMANN EIKE KEVIN [DE];) 13. September 2012 (2012-09-13) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument insbesondere Beispiel 9, Verbindung 273 -----	1-8
X,P	WO 2014/026984 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 20. Februar 2014 (2014-02-20) das ganze Dokument insbesondere Zusammenfassung und Tabelle 1: Verbindungen 63-66, 78, 82, 84, 89 und 98 -----	1-8
<input 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 "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "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) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden 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 "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "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 "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
29. April 2015		08/05/2015
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 Papathoma, Sofia

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/053065

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012119984 A1	13-09-2012	AR 085509 A1	09-10-2013
		AU 2012224683 A1	26-09-2013
		CA 2829822 A1	13-09-2012
		CN 103502216 A	08-01-2014
		CO 6852083 A2	30-01-2014
		EA 201391265 A1	31-03-2014
		EP 2683688 A1	15-01-2014
		JP 2014508768 A	10-04-2014
		KR 20140022825 A	25-02-2014
		NZ 615219 A	29-08-2014
		US 2014088167 A1	27-03-2014
		WO 2012119984 A1	13-09-2012
		WO 2014026984 A1	20-02-2014
CA 2881995 A1	20-02-2014		
WO 2014026984 A1	20-02-2014		

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 N 43/38 (2006.01)	A 0 1 N	43/38	
A 0 1 M 1/20 (2006.01)	A 0 1 M	1/20	A

(81) 指定国 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, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, 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, TZ, UA, UG, US

(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 ハイル, マルクス
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アム・ヴァイセン・シュタイン・4 3 アー

(72) 発明者 ハイルマン, アイク・ケヴィン
ドイツ国、4 0 2 2 9・デュッセルドルフ、ヴェッツラーラー・ヴェーク・1 8

(72) 発明者 ハーレンバッハ, ウェルナー
ドイツ国、4 0 7 8 9・マンハイム、リヒテンベルガー・シュトラッセ・6 8

(72) 発明者 イルク, ケルスティン
ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、ノイッサー・ヴァル・3 2

(72) 発明者 ジェルゲン, ウルリッヒ
ドイツ国、4 0 8 8 2・ラーティンゲン、フェスター・シュトラッセ・3 7

F ターム (参考) 2B121 AA11 AA16 CC02
4C204 BB02 CB03 DB26 EB02 FB03 GB22 GB24

4H011 AC01 AC04 BB09 DA13 DA14 DA16