

(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2016-536302

(P2016-536302A)

(43) 公表日 平成28年11月24日(2016.11.24)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 401/04 (2006.01)	C07D 401/04	4C050
C07D 241/40 (2006.01)	C07D 241/40 CSP	4C055
C07D 213/30 (2006.01)	C07D 213/30	4C063
C07D 491/056 (2006.01)	C07D 491/056	4C086
A61K 31/4985 (2006.01)	A61K 31/4985	4H011
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 148 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2016-525575 (P2016-525575)
 (86) (22) 出願日 平成26年10月20日 (2014.10.20)
 (85) 翻訳文提出日 平成28年6月9日 (2016.6.9)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2014/072432
 (87) 国際公開番号 W02015/059088
 (87) 国際公開日 平成27年4月30日 (2015.4.30)
 (31) 優先権主張番号 13189894.2
 (32) 優先日 平成25年10月23日 (2013.10.23)
 (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

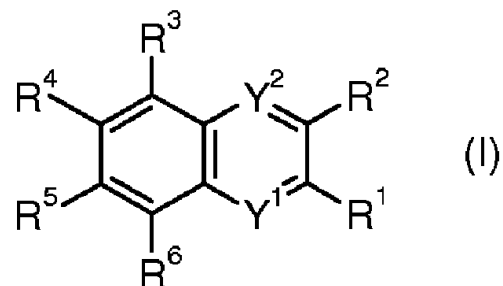
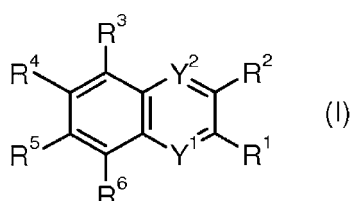
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての置換されているキノキサリン誘導体

(57) 【要約】

本発明は、式(I)〔式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 Y^1 及び Y^2 は、上記で示されている意味を有する〕で表される新規化合物、該化合物を製造するための複数の方法及び中間体生成物、並びに、害虫と闘うための殺ダニ剤及び/又は殺虫剤としてのそれらの使用に関する。式(I)で表される化合物は、植物に損傷を与える有害生物に対する殺線虫剤としても、並びに/又は、ヒト及び動物における内部寄生虫に対する駆虫薬としても、適している。

【化1】

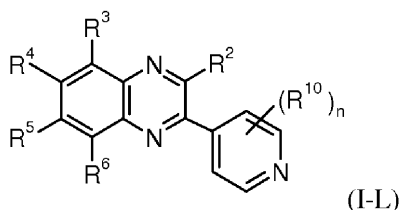


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I - L)

【化 1】



10

〔式中、

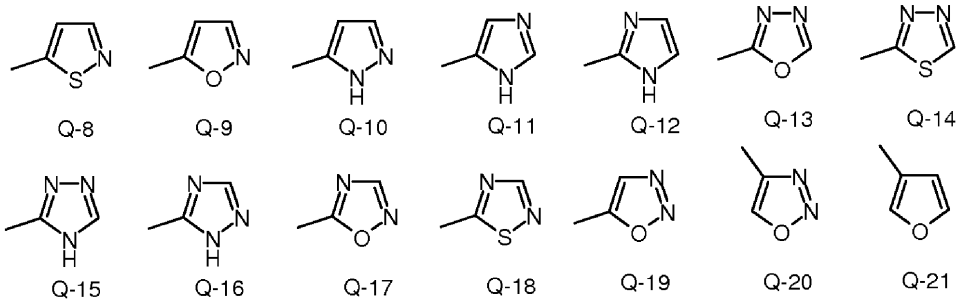
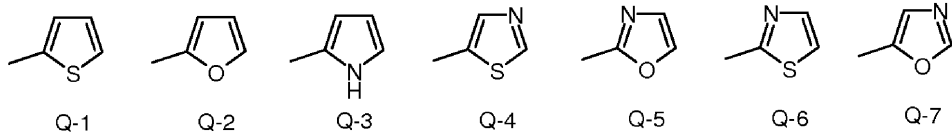
R^2 は、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、トリ - ($C_1 - C_3$)
 - アルキルシリル、シクロ - ($C_3 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_1 - C_3$) - シアノアルキル、($C_1 - C_3$) - ヒド
 ロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$)
 - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニ
 ル、($C_2 - C_3$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル、($C_2 - C_3$)
 - ハロアルキニル、($C_2 - C_3$) - シアノアルキニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、
 ($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_3$) - シアノアルコキシ、($C_1 - C_3$)
 - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ -
 ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルヒドロキシイミノ、($C_1 - C_3$)
 - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミ
 ノ、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$)
) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ -
 ($C_1 - C_3$) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ - ($C_1 - C_3$) - アル
 キル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルフィ
 ニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$)
 - アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキル
 スルホニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ -
 ($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル - ($C_1 - C_3$)
 - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_3$) - アル
 キルカルボニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキル
 カルボニルオキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル、($C_1 - C_3$) - ハロアル
 コキシカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノカルボニル、ジ
 - ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノカルボニル、($C_2 - C_3$) - アルケニルアミノカル
 ボニル、ジ - ($C_2 - C_3$) - アルケニルアミノカルボニル、($C_3 - C_6$) - シクロア
 ルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_3$)
 - アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノスルホニル、ジ
 - ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホキシイ
 ミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_3$) - アルキル - アミノチオカルボニルを表し；又は、
 フェニル又は群 Q - 1 ~ Q - 6 9

20

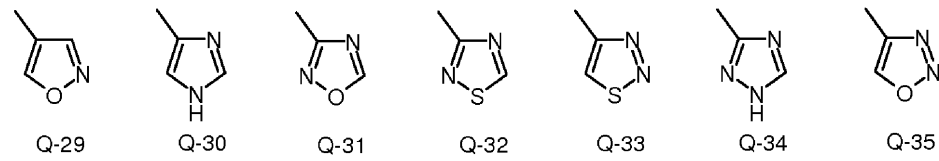
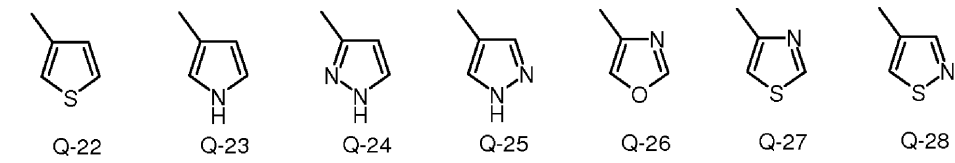
30

40

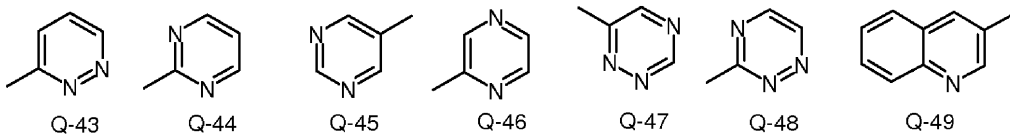
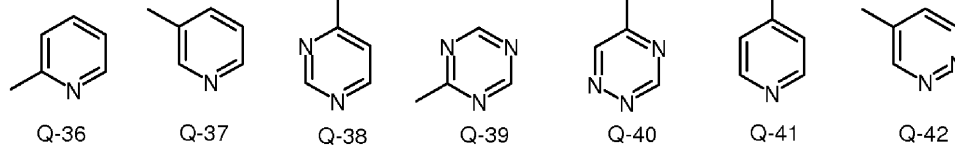
【化 2】



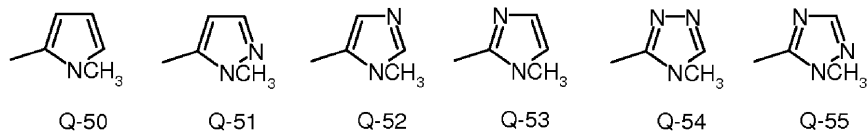
10

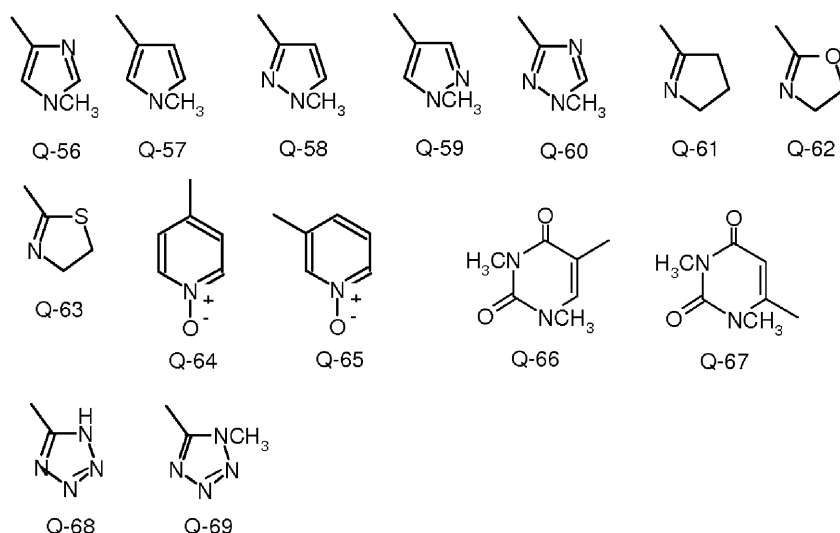


20



30





10

から選択されるヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく (これは、フェニルには当てはまらない)、及び/又は、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、ハロゲン、アミノ、

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

R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノアルキル、(

20

30

40

50

$C_1 - C_3$) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_3$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルキニル、($C_2 - C_3$) - シアノアルキニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_3$) - シアノアルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルヒドロキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキルカルボニルオキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノカルボニル、ジ - ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノカルボニル、($C_2 - C_3$) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - ($C_2 - C_3$) - アルケニルアミノカルボニル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノスルホニル、ジ - ($C_1 - C_3$) - アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_3$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_3$) - アルキル - アミノチオカルボニル、 $C(O)NR^8R^9$ 、 $C(S)NR^8R^9$ を表し；

但し、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同時に水素を表すことはなく；

又は、
 R^3 と R^4 、又は、 R^4 と R^5 、又は、 R^5 と R^6 は、それらが結合している原子と一緒に、ハロゲン - 又は ($C_1 - C_3$) - アルキル - で置換されていてもよい5員又は6員の飽和環 [ここで、該環は、1個又は2個の酸素原子を含んでいてもよい(ここで、該ヘテロ原子は、互いに直接隣接してはならない)] を形成し；
 R^8 及び R^9 は、互いに独立して、水素、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル又は ($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニルを表し；
 R^{10} は、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_1 - C_3$) - シアノアルキル、($C_1 - C_3$) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_3$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルキニル、($C_2 - C_3$) - シアノアルキニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_3$) - シアノアルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルヒドロキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 -$

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

n は、0 又は 1 を表す]

で表される化合物。

【請求項 2】

R^2 は、水素、シアノ、ハロゲン、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルキニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルホニルを表し；又は、

フェニル又は群 Q - 1、Q - 22、Q - 36、Q - 37、Q - 41、Q - 44、Q - 45、Q - 51、Q - 64、Q - 66、Q - 67 から選択されるヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で 1 置換又は 2 置換されていてもよく、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、ハロゲン、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ] を表し；

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、互いに独立して、水素、シアノ、ハロゲン、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルキニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルホニルを表し；

但し、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R^3 と R^4 、又は、 R^4 と R^5 、又は、 R^5 と R^6 は、それらが結合している原子と一緒に、フッ素 -、塩素 - 又は ($C_1 - C_3$) - アルキル - で置換されていてもよい 5 員飽和環 [ここで、該環は、1 個又は 2 個の酸素原子を含んでいてもよい (ここで、該ヘテロ原子は、互いに直接隣接してはならない)] を形成し；

R^{10} は、シアノ、ハロゲン、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニル、($C_1 - C_3$)

10

20

30

40

50

- アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルチオを表し；

n は、0 又は 1 を表す；

請求項 1 に記載の式 (I - L) で表される化合物。

【請求項 3】

R² は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルを表し、又は、いずれの場合にも塩素で置換されていてもよいフェニル若しくは群 Q - 41 から選択されるヘタリールを表し；

R³ は、水素を表し；

R⁴ は、水素、塩素、フッ素、シアノ、SO₂CH₃、SO₂C₂H₅、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

R⁵ は、水素、塩素、フッ素、シアノ、SO₂CH₃、SO₂C₂H₅、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

R⁶ は、水素を表し；

但し、R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³ と R⁴、又は、R⁴ と R⁵、又は、R⁵ と R⁶ は、フッ素で 1 置換又は 2 置換されていてもよい以下の 5 員環

【化 3】



を形成し；

R¹⁰ は、メチル、エチル、塩素、フッ素、シアノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、SCH₃、SOCH₃、SO₂CH₃、SC₂H₅、SOC₂H₅、SO₂C₂H₅、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

n は、0 又は 1 を表す；

請求項 1 に記載の式 (I - L) で表される化合物。

【請求項 4】

R² は、水素、塩素、メチルを表し、又は、群 Q - 41 から選択されるヘタリールを表し、又は、塩素で 1 置換されていてもよいフェニルを表し；

R³ は、水素を表し；

R⁴ は、水素、フッ素、塩素、シアノ又はトリフルオロメチルを表し；

R⁵ は、水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又は SO₂CH₃ を表し；又は、

R⁴ と R⁵ は、一緒に、-O-CF₂-O- を表し；

R⁶ は、水素を表し；

但し、R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、同時に水素を表すことはなく；

R¹⁰ は、メチル、エチル、塩素、フッ素、トリフルオロメチル、SCH₃、SO₂CH₃、SC₂H₅、SOC₂H₅、SO₂C₂H₅、メトキシ又はエトキシを表し；

n は、0 又は 1 を表す；

請求項 1 に記載の式 (I - L) で表される化合物。

【請求項 5】

組成物であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される少なくとも 1 種類の化合物並びに慣習的な増量剤及び / 又は界面活性剤を含んでいることを特徴とする、前記組成物。

【請求項 6】

有害生物を防除する方法であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請

10

20

30

40

50

求項 5 に記載の組成物を該有害生物及び / 又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする、前記方法。

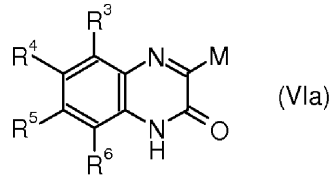
【請求項 7】

有害生物を防除するための、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 5 に記載の組成物の使用。

【請求項 8】

式 (V I a)

【表 1】



10

式中、置換基は表中で与えられている意味を有する：

R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	M
H	-O-CF ₂ -O-		H	H
H	-O-CF ₂ -O-		H	CH ₃

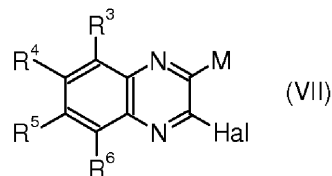
20

で表される化合物。

【請求項 9】

式 (V I I)

【表 2】



30

式中、置換基は表中で与えられている意味を有する：

R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	M	Hal
H	Cl	Cl	H	H	I
H	Cl	H	H	H	I
H	CF ₃	H	H	H	I
H	-O-CF ₂ -O-		H	H	Cl
H	-O-CF ₂ -O-		H	CH ₃	Cl
H	OCF ₂ H	H	H	H	Cl
H	H	OCF ₂ H	H	H	Cl

40

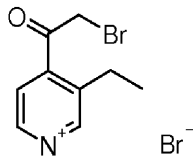
で表される化合物。

【請求項 10】

50

式 (I I I - 0 1)

【化 4】

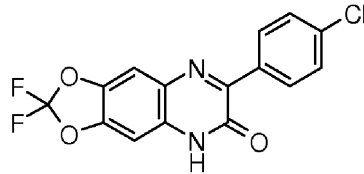


で表される化合物。

【請求項 1 1】

式 (V I b - 0 1)

【化 5】



で表される化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式 (I) で表される新規置換されている 2 - (ヘタ) アリールキノキサリン誘導体、害虫 (a n i m a l p e s t) を防除するための殺ダニ剤及び / 又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを調製するための調製方法及び中間体に関する。式 (I) で表される化合物は、植物に損傷を与える有害生物に対する殺線虫剤としても、並びに、ヒト及び動物における内部寄生虫に対する駆虫薬としても、適している。

【背景技術】

【0002】

DD262790 には、2 - アリールキノキサリン類及び 2 - ヘタリールキノキサリン類の殺ダニ剤としての使用が開示されている。日本国特許出願第 JP2004346016 には、殺有害生物剤としてのトリフルオロメチルで置換されているキノキサリン類が開示されている。

【0003】

DD258165 には、2 - ヘタリールキノキサリン類の殺藻剤及び除草剤としての使用が開示されている。

【0004】

WO2013/19112 には、ヘテロ環式化合物及びそれらの殺虫作用が開示されている。

【0005】

上記刊行物から既に知られている活性化合物は、施用に際して、特に比較的低施用量においては、害虫に対して不十分な殺ダニ活性しかし示さない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0006】

【特許文献 1】 DD262790

【特許文献 2】 日本国特許出願公開第 2004346016 号

【特許文献 3】 DD258165

【特許文献 4】 国際特許出願公開第 2013/19112 号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

10

20

30

40

50

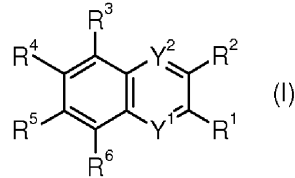
従って、本発明の目的は、高い選択性及び有用な植物の作物における改善された適合性を有していながら、特に比較的低用量において、害虫に対して十分な殺虫活性及び/又は殺ダニ活性を有している殺虫剤及び/又は殺ダニ剤として使用することが可能な、置換されている2-(ヘタ)アリールキノキサリン誘導体を提供することである。本発明の別の目的は、殺線虫剤及び/又は駆虫薬として使用することが可能な、置換されている適切な2-(ヘタ)アリールキノキサリン誘導体を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0008】

驚くべきことに、本発明者らは、本発明は、式(I)

【化1】



【0009】

〔式中、

Y¹及びY²は、互いに独立して、N又はN⁺-O⁻を表し；

R¹は、アリール又はヘタリール〔ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、SF₅、トリ-(C₁-C₆)-アルキルシリル、(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-ハロアルキル、(C₁-C₆)-シアノアルキル、(C₁-C₆)-ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルコキシカルボニル-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₆)-ハロアルケニル、(C₂-C₆)-シアノアルケニル、(C₂-C₆)-アルキニル、(C₂-C₆)-ハロアルキニル、(C₂-C₆)-シアノアルキニル、(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-ハロアルコキシ、(C₁-C₆)-シアノアルコキシ、(C₁-C₇)-アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₇)-アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₇)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-アルキル-(C₁-C₇)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-ハロアルキル-(C₁-C₇)-アルコキシイミノ、(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-ハロアルキルチオ、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキルチオ、(C₁-C₆)-アルキルチオ-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)-アルキルスルフィニル-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルコキシ-(C₁-C₆)-アルキルスルホニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニル-(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₇)-アルキルカルボニル、(C₁-C₇)-ハロアルキルカルボニル、(C₁-C₇)-アルキルカルボニルオキシ、(C₁-C₇)-アルコキシカルボニル、(C₁-C₇)-ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₇)-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁-C₇)-アルキルアミノカルボニル、(C₂-C₇)-アルケニルアミノカルボニル、ジ-(C₂-C₇)-アルケニルアミノカルボニル、(C₃-C₈)-シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)-アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₆)-アルキルアミノ、アミノスルホニル、(

10

20

30

40

50

$C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキルアミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルアミノ]を表し、又は、フェニル、ピリジル若しくはフェノキシ[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルコキシ又は($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシで置換されていてもよい]を表し；

R^2 は、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ - ($C_1 - C_6$) - アルキルシリル、シクロ - ($C_3 - C_8$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - シアノアルキル、($C_1 - C_6$) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) - アルキニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルキニル、($C_2 - C_6$) - シアノアルキニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) - シアノアルコキシ、($C_1 - C_7$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_7$) - アルキルヒドロキシイミノ、($C_1 - C_7$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) - アルキル - ($C_1 - C_7$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル - ($C_1 - C_7$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルチオ、($C_1 - C_6$) - アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_7$) - アルキルカルボニル、($C_1 - C_7$) - ハロアルキルカルボニル、($C_1 - C_7$) - アルキルカルボニルオキシ、($C_1 - C_7$) - アルコキシカルボニル、($C_1 - C_7$) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_7$) - アルキルアミノカルボニル、ジ - ($C_1 - C_7$) - アルキル - アミノカルボニル、($C_2 - C_7$) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - ($C_2 - C_7$) - アルケニルアミノカルボニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ($C_1 - C_6$) - アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) - シクロアルキルアミノ、($C_1 - C_6$) - アルキルスルホニルアミノを表し；又は、

アリール又はヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - ($C_1 - C_6$) - アルキルシリル、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - ハロアルキル、($C_1 - C_6$) - シアノアルキル、($C_1 - C_6$) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_2 - C_6$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) -

10

20

30

40

50

アルキニル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₂ - C₆) - シアノアルキニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₇) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₇) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₇) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₁ - C₇) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル - (C₁ - C₇) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₇) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₇) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₇) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₇) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₇) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₇) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₇) - アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₇) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₇) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ]を表し、又は、フェニル、ピリジル若しくはフェノキシ[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルコキシ又は(C₁ - C₆) - ハロアルコキシで置換されていてもよい]を表し；

10

20

30

40

50

ここで、該キノキサリン誘導体へのR¹の結合は、炭素原子を介してのみ可能であり；R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、互いに独立して、水素、シアノ、カルボキシ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシ、アミノ、SCN、トリ - (C₁ - C₆) - アルキルシリル、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₁ - C₆) - シアノアルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニル、(C₂ - C₆) - シアノアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₂ - C₆) - シアノアルキニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₇) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₇) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₇) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキル - (C₁ - C₇) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - ハロアルキル - (C₁ - C₇) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルチオ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₆) - アルキルスルホニル、(C₁ - C

6) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₇) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₇) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₇) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₇) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₇) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₇) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₇) - アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₇) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₇) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) - アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) - シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルアミノ、C(O)NR⁸R⁹、C(S)NR⁸R⁹を表し；

但し、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³とR⁴、又は、R⁴とR⁵、又は、R⁵とR⁶は、それらが結合している原子と一緒に、(C₁ - C₆) - アルキル - 又はハロゲン - で置換されていてもよい5員又は6員の飽和又は不飽和の環 [ここで、該環は、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいてもよく (ここで、該ヘテロ原子は、互いに直接隣接してはならない)、及び/又は、少なくとも1のカルボニル基を含んでいてもよい] を形成し；

R⁸及びR⁹は、互いに独立して、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキルチオ、(C₁ - C₆) - アルキルスルフィニル又は(C₁ - C₆) - アルキルスルホニルを表す] で表される新規化合物を見いだした。

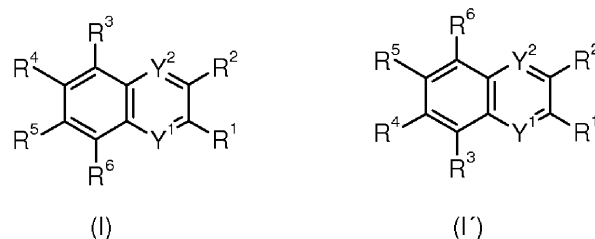
【0010】

本発明による化合物は、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混合物の両方を包含する。

【0011】

R³がR⁶とは異なっている場合、及び、R⁴がR⁵とは異なっている場合、式(I)で表される化合物は、混合物として、又は、それらの純粋な異性体(位置異性体)の形態で存在し得る。混合物は、場合により、物理的な方法によって、例えば、クロマトグラフ法によって、分離することができる。

【化2】



【0012】

以下の記載においては、いずれの場合にも、明瞭さのために、可能な異性体のうちの1種類についてのみ言及されている。これは、当該化合物が、異性体混合物として、又は、別のそれぞれの異性体形態で、存在し得るということを包含している。

【0013】

さらに、式(I)で表される化合物が、殺有害生物剤として、好ましくは、殺虫剤及び/又は殺ダニ剤として、極めて優れた効力を有しているということが見いだされ、並びに

、特に作物植物に対して、概して極めて良好な植物適合性を有しているということも見いだされた。さらに、式(I)で表される化合物が、殺線虫剤及び/又は駆虫薬として極めて優れた活性を有しているということも見いだされた。

【発明を実施するための形態】

【0014】

本発明の化合物の一般的な定義は、式(I)によって与えられる。上記及び下記において言及されている式の中で与えられているラジカルの好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。

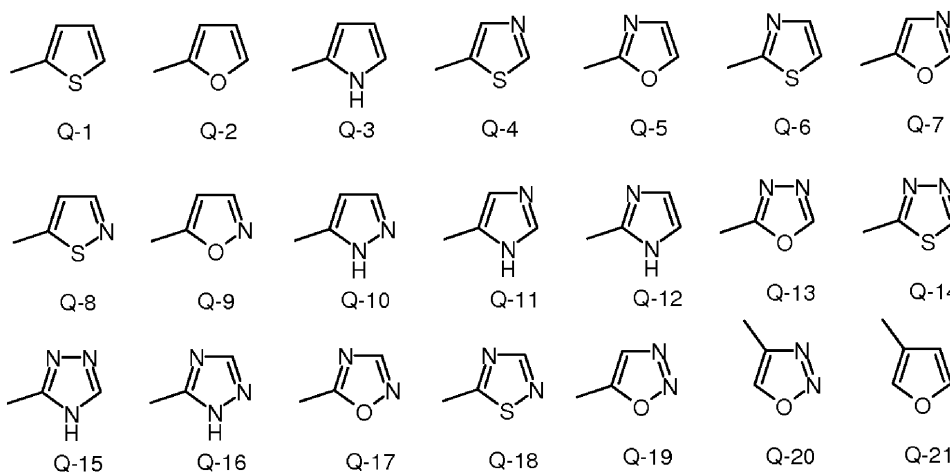
【0015】

Y^1 及び Y^2 は、互いに独立して、好ましくは、N又は $N^+ - O^-$ を表し；

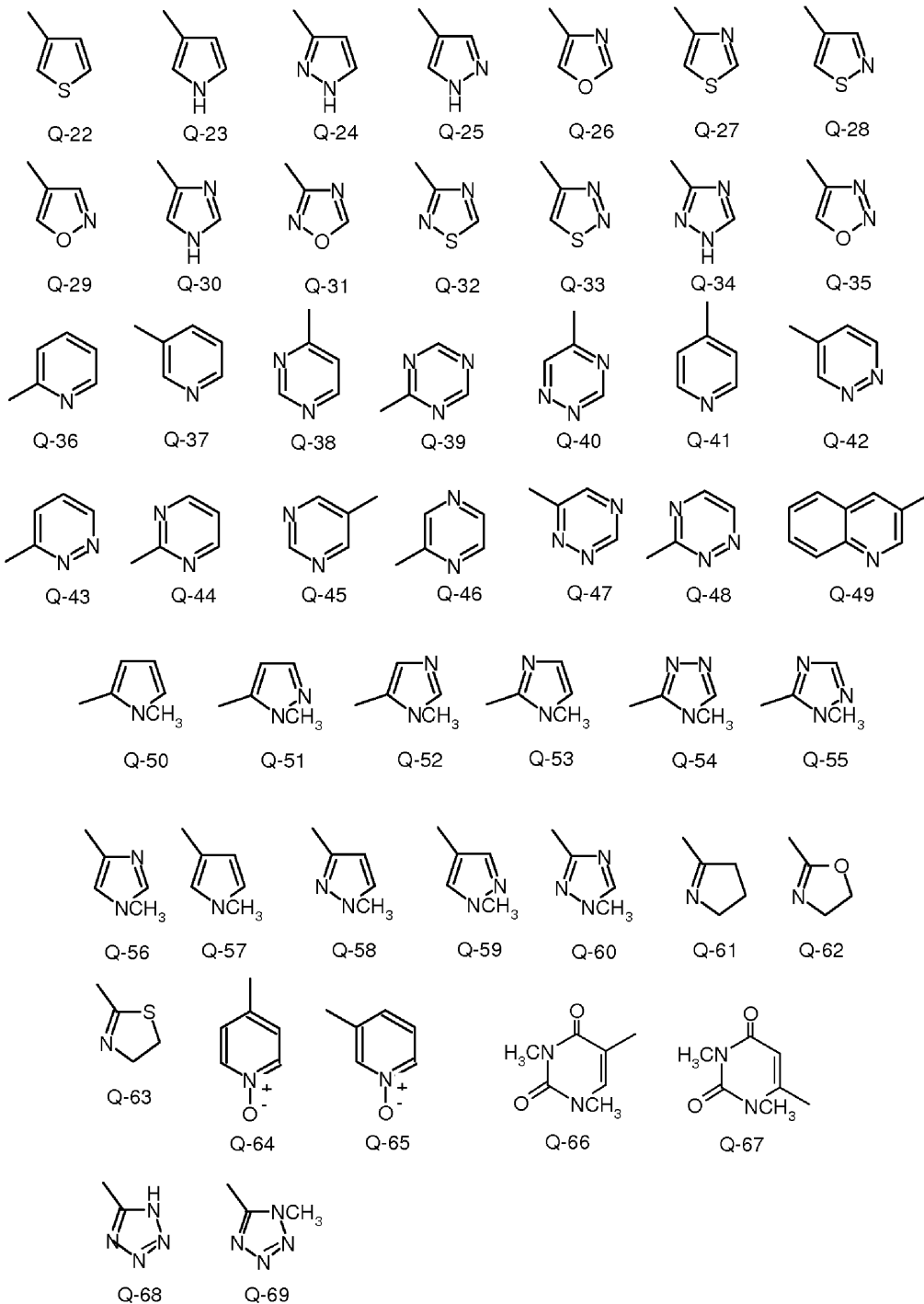
R^1 は、好ましくは、フェニル又は群Q-1~Q-9

10

【化3】



20



10

20

30

40

50

【 0 0 1 6 】

から選択されるヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、いずれの場合にも、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく (これは、フェニルには当てはまらない)、及び/又は、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノアルキル、(C₁ - C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - シアノアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカル

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

10

20

R² は、好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、トリ - (C₁ - C₃) -
 アルキルシリル、シクロ - (C₃ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₃) -
 アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノアルキル、(C₁ -
 C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) -
 アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ア
 ルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) -
 ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - シアノアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) -
 ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル、(C₁ - C₃) -
 アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₃) -
 アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) -
 アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルヒドロキシイミノ
 、(C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキル - (C₁ - C₃) - ア
 ルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - ハロアルキル - (C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、
 (C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₃) -
 アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ - (C₁ -
 C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアル
 キルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルフィニ
 ル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃)
) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) -
 アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニ
 ル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ -
 C₃) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₃)
) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₃)
) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノカ
 ルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₃) - アルケニ
 ルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₆)
) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₃) -
 アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノス

30

40

50

ルホニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキル
 スルホキシミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボ
 ニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニルを表し；又は、

フェニル又は群 Q - 1 ~ Q - 69 から選択されるヘタリアル [ここで、これらは、それ
 ぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で 1 置換又は多置換されていてもよく、ここ
 で、少なくとも 1 のカルボニル基が存在していてもよく (これは、フェニルには当てはま
 らない)、及び / 又は、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりであ
 る： シアノ、ハロゲン、アミノ、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアル
 キル、(C₁ - C₃) - シアノアルキル、(C₁ - C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒド
 ロキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル
 - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキ
 ル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) -
 シアノアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロ
 アルコキシ、(C₁ - C₃) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニ
 ル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アル
 コキシ、(C₁ - C₃) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルコキシイミ
 ノ、(C₁ - C₃) - アルキル - (C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) -
 ハロアルキル - (C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アル
 キルチオ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃)
 - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃)
 - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスル
 フィニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ -
 C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アル
 キルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシカルボニル、ア
 ミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アル
 キルアミノカルボニル、(C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ -
 C₃) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルアミノカルボニ
 ル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₃) - アルキルアミノ、ア
 ミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₃) - アル
 キルアミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホキシイミノ、(C₁ - C₃)
 - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニル
] を表し；

R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、互いに独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ
 、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノ
 アルキル、(C₁ - C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₃)
) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルキル、
 (C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル
 、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - シアノアルケニル、(C₂ - C₃)
) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル
 、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - シ
 アノアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ
 、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキ
 ルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキル -
 (C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - ハロアルキル - (C₁ - C₃) -
 アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - ハロアルキルチオ

10

20

30

40

50

、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₃) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニル、C(O)NR⁸R⁹、C(S)NR⁸R⁹を表し；

但し、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³とR⁴、又は、R⁴とR⁵、又は、R⁵とR⁶は、それらが結合している原子と一緒に、好ましくは、ハロゲン - 又は(C₁ - C₃) - アルキル - で置換されていてもよい5員又は6員の飽和環[ここで、該環は、1個又は2個の酸素原子を含んでいてもよい(ここで、該ヘテロ原子は、互いに直接隣接してはならない)]を形成し；

R⁸及びR⁹は、互いに独立して、好ましくは、水素、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル又は(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルを表す。

【0017】

Y¹及びY²は、互いに独立して、特に好ましくは、N又はN⁺ - O⁻を表し；

R¹は、特に好ましくは、フェニル又は群Q - 1、Q - 22、Q - 36、Q - 37、Q - 41、Q - 44、Q - 45、Q - 51、Q - 64、Q - 66、Q - 67から選択されるヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されていてもよく、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルチオ]を表し；

R²は、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニルを表し；又は、

フェニル又は群Q - 1、Q - 22、Q - 36、Q - 37、Q - 41、Q - 44、Q - 45、Q - 51、Q - 64、Q - 66、Q - 67から選択されるヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されていてもよく、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) -

10

20

30

40

50

ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルチオ]を表し；

R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニルを表し；

但し、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³とR⁴、又は、R⁴とR⁵、又は、R⁵とR⁶は、それらが結合している原子と一緒に、特に好ましくは、フッ素 -、塩素 - 又は(C₁ - C₃) - アルキル - で置換されていてもよい5員飽和環[ここで、該環は、1個又は2個の酸素原子を含んでいてもよい(ここで、該ヘテロ原子は、互いに直接隣接してはならない)]を形成する。

【0018】

Y¹及びY²は、互いに独立して、極めて特に好ましくは、N又はN⁺ - O⁻を表し；

R¹は、極めて特に好ましくは、フェニル又は群Q - 1、Q - 22、Q - 36、Q - 37、Q - 41、Q - 45、Q - 51、Q - 64から選択されるヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されていてもよく、可能な置換基は、以下のとおりである：メチル、エチル、塩素、フッ素、シアノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、SCH₃、SOCH₃、SO₂CH₃、SC₂H₅、SOC₂H₅、SO₂C₂H₅、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ]を表し；

R²は、極めて特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルを表し、又は、いずれの場合にも塩素で置換されていてもよいフェニル若しくは群Q - 41から選択されるヘタリールを表し；

R³は、極めて特に好ましくは、水素を表し；

R⁴は、極めて特に好ましくは、水素、塩素、フッ素、シアノ、SO₂CH₃、SO₂C₂H₅、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

R⁵は、極めて特に好ましくは、水素、塩素、フッ素、シアノ、SO₂CH₃、SO₂C₂H₅、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

R⁶は、極めて特に好ましくは、水素を表し；

但し、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³とR⁴、又は、R⁴とR⁵、又は、R⁵とR⁶は、フッ素で1置換又は2置換されていてもよい以下の5員環

【化4】



【0019】

を形成する。

【0020】

Y¹及びY²は、最も好ましくは、それぞれ、Nを表し；

R¹は、最も好ましくは、群Q - 1又はQ - 22から選択されるヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、メチルで1置換されていてもよい]を表し；又は、

10

20

30

40

50

群 Q - 36 から選択されるヘタリール [ここで、該ヘタリールは、メチル、エチル、塩素、フッ素、トリフルオロメチル、 SCH_3 、 SC_2H_5 、 SOC_2H_5 、 SO_2CH_3 、 $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$ で 1 置換又は 2 置換 (異なるように) 置換されていてもよい] を表し; 又は、

群 Q - 37 から選択されるヘタリール [ここで、該ヘタリールは、エトキシで 1 置換されていてもよい] を表し; 又は、

群 Q - 41 から選択されるヘタリール [ここで、該ヘタリールは、メチル、エチル、塩素、メトキシで 1 置換されていてもよい] を表し; 又は、

群 Q - 45 又は Q - 51 から選択されるヘタリールを表し; 又は、

フェニル [ここで、該フェニルは、メチル、エチル、塩素、フッ素、トリフルオロメチル、 SCH_3 、 SC_2H_5 、 SOC_2H_5 、 SO_2CH_3 、 $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$ で 1 置換又は 2 置換 (異なるように) 置換されていてもよい] を表し;

R^2 は、最も好ましくは、水素、塩素、メチルを表し、又は、群 Q - 41 から選択されるヘタリールを表し、又は、塩素で 1 置換されていてもよいフェニルを表し;

R^3 は、最も好ましくは、水素を表し;

R^4 は、最も好ましくは、水素、塩素、シアノ又はトリフルオロメチルを表し;

R^5 は、最も好ましくは、水素、塩素、トリフルオロメチル又は SO_2CH_3 を表し;

又は、

R^4 と R^5 は、一緒に、最も好ましくは、 $-\text{O}-\text{CF}_2-\text{O}-$ を表し;

R^6 は、最も好ましくは、水素を表し;

但し、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同時に水素を表すことはない。

【0021】

Y^1 は、同様に、最も好ましくは、N を表し、且つ、 Y^2 は、同様に、最も好ましくは、 N^+-O^- を表し;

R^1 は、同様に、最も好ましくは、フェニル [ここで、該フェニルは、トリフルオロメチル、フッ素又はメチルで 1 置換又は 2 置換 (異なるように) 置換されていてもよい] を表し、又は、群 Q - 64 から選択されるヘタリール [ここで、該ヘタリールは、メチルで 1 置換されていてもよい] を表し;

R^2 は、同様に、最も好ましくは、水素を表し;

R^3 は、同様に、最も好ましくは、水素を表し;

R^4 は、同様に、最も好ましくは、水素又はトリフルオロメチルを表し;

R^5 は、同様に、最も好ましくは、水素又はトリフルオロメチルを表し; 又は、

R^4 と R^5 は、一緒に、同様に、最も好ましくは、 $-\text{O}-\text{CF}_2-\text{O}-$ を表し;

R^6 は、同様に、最も好ましくは、水素を表し;

但し、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同時に水素を表すことはない。

【0022】

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

【0023】

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

【0024】

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

【0025】

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

【0026】

特に重要なのは、 Y^1 及び Y^2 がそれぞれ N を表す式 (I) で表される化合物である。

【0027】

10

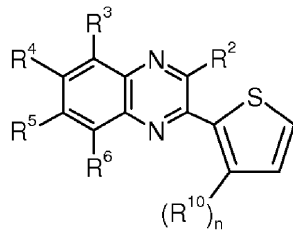
20

30

40

50

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - A)
【化 5】

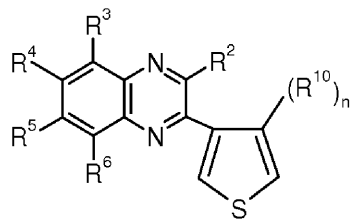


【 0 0 2 8 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 2 9 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - B)
【化 6】

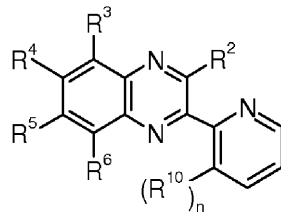


【 0 0 3 0 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 3 1 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - C)
【化 7】

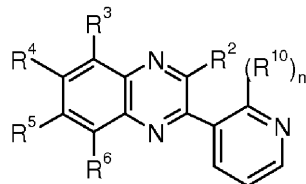


【 0 0 3 2 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 3 3 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - D)
【化 8】



【 0 0 3 4 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 3 5 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - E)

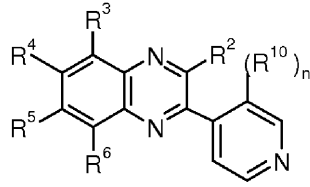
10

20

30

40

【化 9】



【0036】

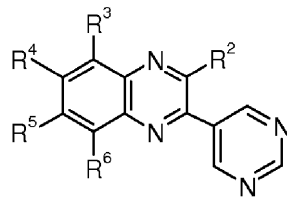
で表される化合物に関する。

【0037】

10

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - F)

【化 10】



【0038】

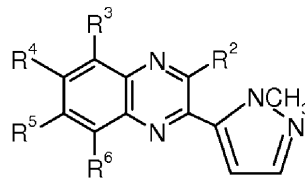
で表される化合物に関する。

20

【0039】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - G)

【化 11】



【0040】

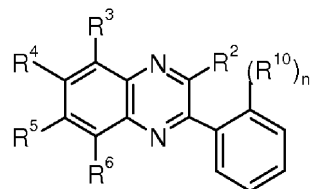
で表される化合物に関する。

30

【0041】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - H)

【化 12】



40

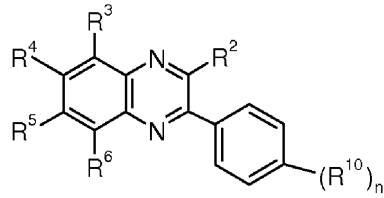
【0042】

で表される化合物に関する。

【0043】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - I)

【化 1 3】



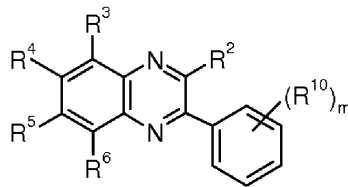
【 0 0 4 4 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 4 5 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - J)

【化 1 4】



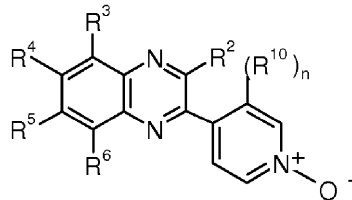
【 0 0 4 6 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 4 7 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - K)

【化 1 5】



【 0 0 4 8 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 4 9 】

式 (I - A) ~ 式 (I - K) において、ラジカル R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、上記で与えられている意味を有し、そして、

R^{10} は、好ましくは、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル、($C_1 - C_3$) - シアノアルキル、($C_1 - C_3$) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルケニル、($C_2 - C_3$) - シアノアルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル、($C_2 - C_3$) - ハロアルキニル、($C_2 - C_3$) - シアノアルキニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_3$) - シアノアルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_1 - C_3$) - アルキルヒドロキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - ハロアルキル - ($C_1 - C_3$) - アルコキシイミノ、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルチオ、($C_1 - C_3$) - アルキルチオ - ($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ - ($C_1 - C_3$) - アルキルスル

10

20

30

40

50

イニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₃) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニルを表し；

10

n は、0 又は 1 を表し、m は、0、1 又は 2 を表し；

R¹⁰ は、特に好ましくは、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルチオを表し；

20

n は、0 又は 1 を表し、m は、0、1 又は 2 を表し；

R¹⁰ は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、塩素、フッ素、シアノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、SCH₃、SOCH₃、SO₂CH₃、SC₂H₅、SOC₂H₅、SO₂C₂H₅、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

n は、0 又は 1 を表し、m は、0、1 又は 2 を表し；

R¹⁰ は、最も好ましくは、メチル、エチル、塩素、フッ素、トリフルオロメチル、SCH₃、SO₂CH₃、SC₂H₅、SOC₂H₅、SO₂C₂H₅、メトキシ又はエトキシを表し；

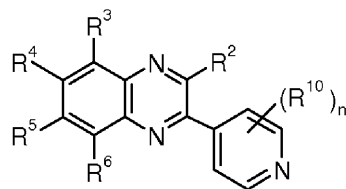
30

n は、0 又は 1 を表し、m は、0、1 又は 2 を表す。

【0050】

重要なのは、さらにまた、式 (I - L)

【化16】



40

【0051】

〔式中、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰ 及び n は、以下の意味を有する：

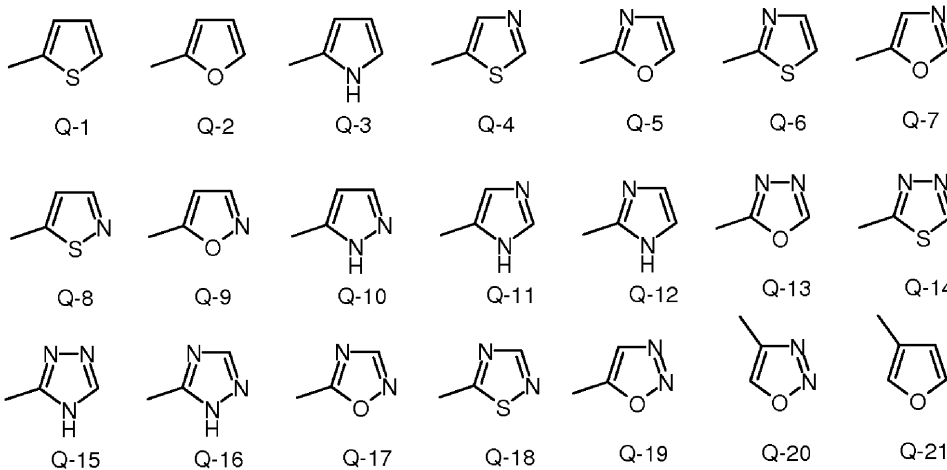
R² は、好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、トリ - (C₁ - C₃) - アルキルシリル、シクロ - (C₃ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノアルキル、(C₁ - C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - シアノアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル、(C₁ - C₃) -

50

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

フェニル又は群 Q - 1 ~ Q - 6 9

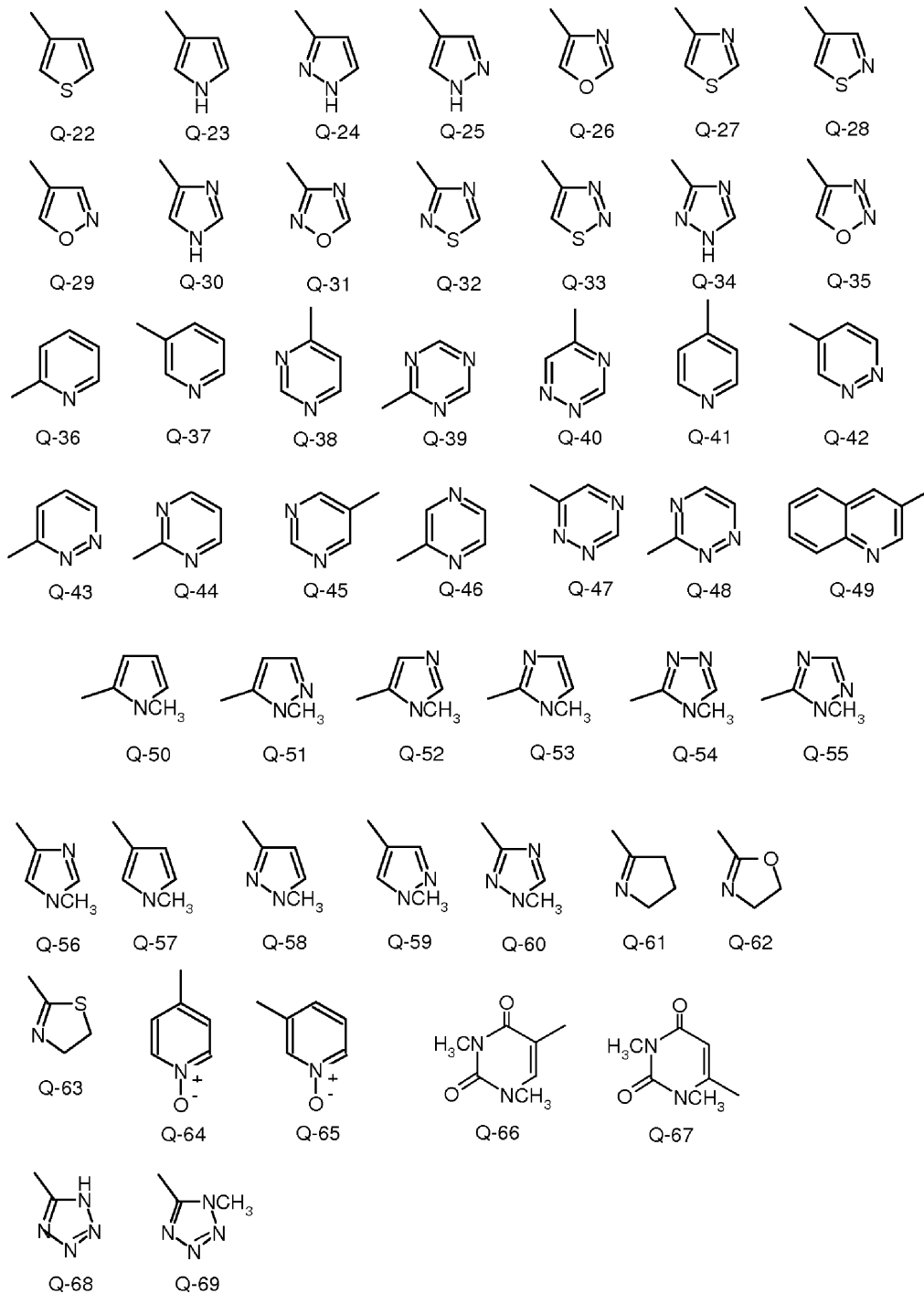
【化 1 7】



10

20

30



10

20

30

40

50

【 0 0 5 2 】

から選択されるヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく (これは、フェニルには当てはまらない)、及び/又は、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、ハロゲン、アミノ、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノアルキル、(C₁ - C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒドロシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - シアノアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、

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

R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、互いに独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ
 、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノ
 アルキル、(C₁ - C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₃)
) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルキル、
 (C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル
 、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - シアノアルケニル、(C₂ - C₃)
) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル
 、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - シ
 アノアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ
 、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキ
 ルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキル -
 (C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - ハロアルキル - (C₁ - C₃) -
 アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - ハロアルキルチオ
 、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - アル
 キルチオ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁
 - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) -
 アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₃) - アル
 キル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル
 、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃)
 - アルキルスルホニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニ
 ルオキシ、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルカルボ
 ニル、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボ
 ニル、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₃)
 - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、(C₂
 - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボ
 ニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルス
 ルホニルアミノ、(C₁ - C₃) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₃)
 - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、(C₁
 - C₃) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキ

10

20

30

40

50

ルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニル、C(O)NR⁸R⁹、C(S)NR⁸R⁹を表し；

但し、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³とR⁴、又は、R⁴とR⁵、又は、R⁵とR⁶は、それらが結合している原子と一緒に、好ましくは、ハロゲン - 又は (C₁ - C₃) - アルキル - で置換されていてもよい5員又は6員の飽和環 [ここで、該環は、1個又は2個の酸素原子を含んでいてもよい(ここで、該ヘテロ原子は、互いに直接隣接してはならない)]を形成し；

R⁸及びR⁹は、互いに独立して、好ましくは、水素、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル又は(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルを表し；

R¹⁰は、好ましくは、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₁ - C₃) - シアノアルキル、(C₁ - C₃) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - シアノアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₂ - C₃) - シアノアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - シアノアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキル - (C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - ハロアルキル - (C₁ - C₃) - アルコキシイミノ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルチオ、(C₁ - C₃) - アルキルチオ - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ - (C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル - (C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₃) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₃) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₃) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₃) - アルキルアミノチオカルボニルを表し；

nは、0又は1を表す)

で表される化合物である。

【0053】

R²は、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニルを表し；又は、

10

20

30

40

50

フェニル又は群 Q - 1、Q - 2 2、Q - 3 6、Q - 3 7、Q - 4 1、Q - 4 4、Q - 4 5、Q - 5 1、Q - 6 4、Q - 6 6、Q - 6 7 から選択されるヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で 1 置換又は 2 置換されていてもよく、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである： シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルチオ] を表し；

R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル、(C₂ - C₃) - ハロアルキニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニルを表し；

但し、R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³ と R⁴、又は、R⁴ と R⁵、又は、R⁵ と R⁶ は、それらが結合している原子と一緒に、特に好ましくは、フッ素 -、塩素 - 又は (C₁ - C₃) - アルキル - で置換されていてもよい 5 員飽和環 [ここで、該環は、1 個又は 2 個の酸素原子を含んでいてもよい (ここで、該ヘテロ原子は、互いに直接隣接してはならない)] を形成し；

R¹⁰ は、特に好ましくは、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - ハロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - ハロアルケニル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₁ - C₃) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₃) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₃) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₃) - アルキルチオを表し；

n は、0 又は 1 を表す。

【0054】

R² は、極めて特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルを表し、又は、いずれの場合にも塩素で置換されていてもよいフェニル若しくは群 Q - 4 1 から選択されるヘタリールを表し；

R³ は、極めて特に好ましくは、水素を表し；

R⁴ は、極めて特に好ましくは、水素、塩素、フッ素、シアノ、SO₂CH₃、SO₂C₂H₅、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

R⁵ は、極めて特に好ましくは、水素、塩素、フッ素、シアノ、SO₂CH₃、SO₂C₂H₅、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

R⁶ は、極めて特に好ましくは、水素を表し；

但し、R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、同時に水素を表すことはなく；

又は、

R³ と R⁴、又は、R⁴ と R⁵、又は、R⁵ と R⁶ は、極めて特に好ましくは、フッ素で 1 置換又は 2 置換されていてもよい以下の 5 員環

【化 18】



【0055】

10

20

30

40

50

を形成し；

R^{10} は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、塩素、フッ素、シアノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、 SC_2H_5 、 $SOCH_3$ 、 SO_2CH_3 、 SC_2H_5 、 SOC_2H_5 、 $SO_2C_2H_5$ 、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2, 2, 2 - トリフルオロエトキシを表し；

n は、0又は1を表す。

【0056】

R^2 は、最も好ましくは、水素、塩素、メチルを表し、又は、群Q - 41から選択されるヘタリールを表し、又は、塩素で1置換されていてもよいフェニルを表し；

R^3 は、最も好ましくは、水素を表し；

R^4 は、最も好ましくは、水素、フッ素、塩素、シアノ又はトリフルオロメチルを表し；

R^5 は、最も好ましくは、水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又は SO_2CH_3 を表し；又は、

R^4 と R^5 は、一緒に、最も好ましくは、 $-O-CF_2-O-$ を表し；

R^6 は、最も好ましくは、水素を表し；

但し、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同時に水素を表すことはなく；

R^{10} は、最も好ましくは、メチル、エチル、塩素、フッ素、トリフルオロメチル、 SC_2H_5 、 SO_2CH_3 、 SC_2H_5 、 SOC_2H_5 、 $SO_2C_2H_5$ 、メトキシ又はエトキシを表し（ここで、特に重要には、メチル、エチル、塩素又はメトキシを表し）；

n は、0又は1を表す。

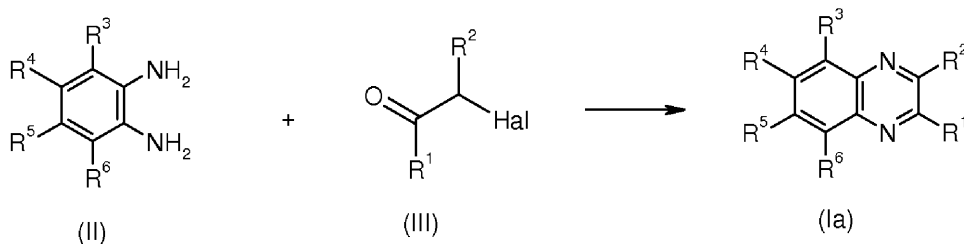
【0057】

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

【0058】

調製方法A

【化19】



【0059】

ラジカル R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、上記意味を有し、Hal は、ハロゲンを表す。

【0060】

式(Ia)で表される化合物は、特許出願DD 0151753に記載されている調製方法と同様にして、式(II)で表されるベンゼン-1, 2-ジアミンを式(III)で表される2-ハロ-1-(ヘタ)アリールエタノンと反応させることによって調製することができる。この調製方法のさらなる例は、「J. Org. Chem., 1966, 31(3), 803-806」、「Pharmazie 40(1985), 384-387」、「Bull. Soc. Chim. Fr., (1950) 753-757」、「Helv. Chim. Acta, 1952, 35, 2301-2314」、「Tetrahedron, 2008, 64, 8676-8684」、「Tetrahedron Lett., 2007, 48, 5371」、「Tetrahedron Lett., 2011, 52, 2862」又は「J. of Chem. and Eng. Data, 1973, 18(1), 102-104」の中で公表されている。

10

20

30

40

50

【0061】

あるいは、「J. Chin. Chem. Soc. 2009, 56(4), 683-687」は、溶媒としてのPEG-400の中で -スルホニルオキシ- (ヘタ)アリアルケトンを使用することを記載している調製方法を実現している。

【0062】

式(II)で表される不斉のベンゼン-1,2-ジアミンを使用する場合、式(Ia)で表される位置異性キノキサリンの混合物が得られ得る。これらは、慣習的なクロマトグラフ法で分離することができる。

【0063】

式(II)で表されるベンゼン-1,2-ジアミンは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「J. Org. Chem., 1969, 384」又は「J. Med. Chem. 1981, 24(1), 93-101」と同様にして、調製することができる。

10

【0064】

式(III)で表される2-ハロ-1-(ヘタ)アリアルエタノンは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「Helv. Chim. Acta, 1955, 38, 1289-1291」、「Pharmazie 40(1985), 384-387」、WO 2009/114552又はDD 0151753に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0065】

式(II)で表されるベンゼン-1,2-ジアミンと式(III)で表される2-ハロ-1-(ヘタ)アリアルエタノンの反応は、何も加えずに実施することができるか、又は、溶媒の中で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、一般的な反応条件下において不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。

20

【0066】

好ましいのは、以下のものである： 脂肪族アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール又はイソプロパノール；エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル。

【0067】

該反応は、好ましくは、塩基の存在下で実施する。適切な塩基は、当該反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、例えば、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から選択される塩基を使用する。特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。

30

【0068】

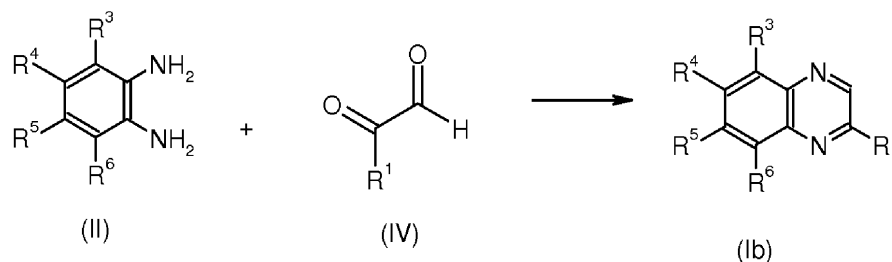
該反応は、0~180の温度で、減圧下、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能であり；好ましくは、該反応は、20~110の温度で、大気圧下で実施する。

【0069】

調製方法B

40

【化20】



【0070】

50

ラジカル R¹、R³、R⁴、R⁵ 及び R⁶ は、上記意味を有する。本発明の 1 実施形態では、式 (I I) で表されるベンゼン - 1, 2 - ジアミンを式 (I V) で表されるグリオキサールと反応させる。これは、式 (I I) で表されるベンゼン - 1, 2 - ジアミンを - ジカルボニル化合物と反応させることによる、キノキサリン類の一般的な合成の特別な場合である。これに関しては、広範囲の文献、例えば、「Synth. Commun. 1995, 25 (15), 2319 - 26」、「Tetrahedron Lett., 2005, 46, 6345」、「Tetrahedron Lett., 2005, 46, 7183」、「J. Med. Chem., 2010, 53, 1128」又は「Bull. Korean Chem. Soc. 2012, 33 (8), 2581」の中で引用されている広範囲の文献が存在している。

10

【0071】

式 (I V) で表されるグリオキサールは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「Bull. Soc. Chim. Fr., (1950) 753 - 757」、「J. Med. Chem. 1979, 22 (6), 687 - 694」、「J. of Chem. and Eng. Data, 1973, 18 (1), 102 - 104」、「Current Chemistry Letters 2012, 1 (3), 139 - 146」又は US 6649768 に記載されている調製方法に準じて、調製することができる。

【0072】

式 (I I) で表される不斉のベンゼン - 1, 2 - ジアミンを使用する場合、式 (I b) で表される位置異性キノキサリンの混合物が得られ得る。これらは、慣習的なクロマトグラフ法で分離することができる。

20

【0073】

該調製方法は、例えば、「Current Chemistry Letters 2012, 1 (3), 139 - 146」、「Bull. Korean Chem. Soc. 2011, 32 (10), 3720」、「J. of Chem. and Eng. Data, 1973, 18 (1), 102 - 104」又は「J. Chem. Research (S), 1986, 16 - 17」に記載されている調製方法と同様にして実施する。

【0074】

式 (I I) で表されるベンゼン - 1, 2 - ジアミンと式 (I V) で表されるグリオキサールの反応は、何も加えずに実施することができるか、又は、溶媒の中で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、一般的な反応条件下において不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。

30

【0075】

好ましいのは、以下のものである： 脂肪族アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、n - プロパノール又はイソプロパノール；エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；極性非プロトン性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N - メチルピロリドン；及び、さらに

40

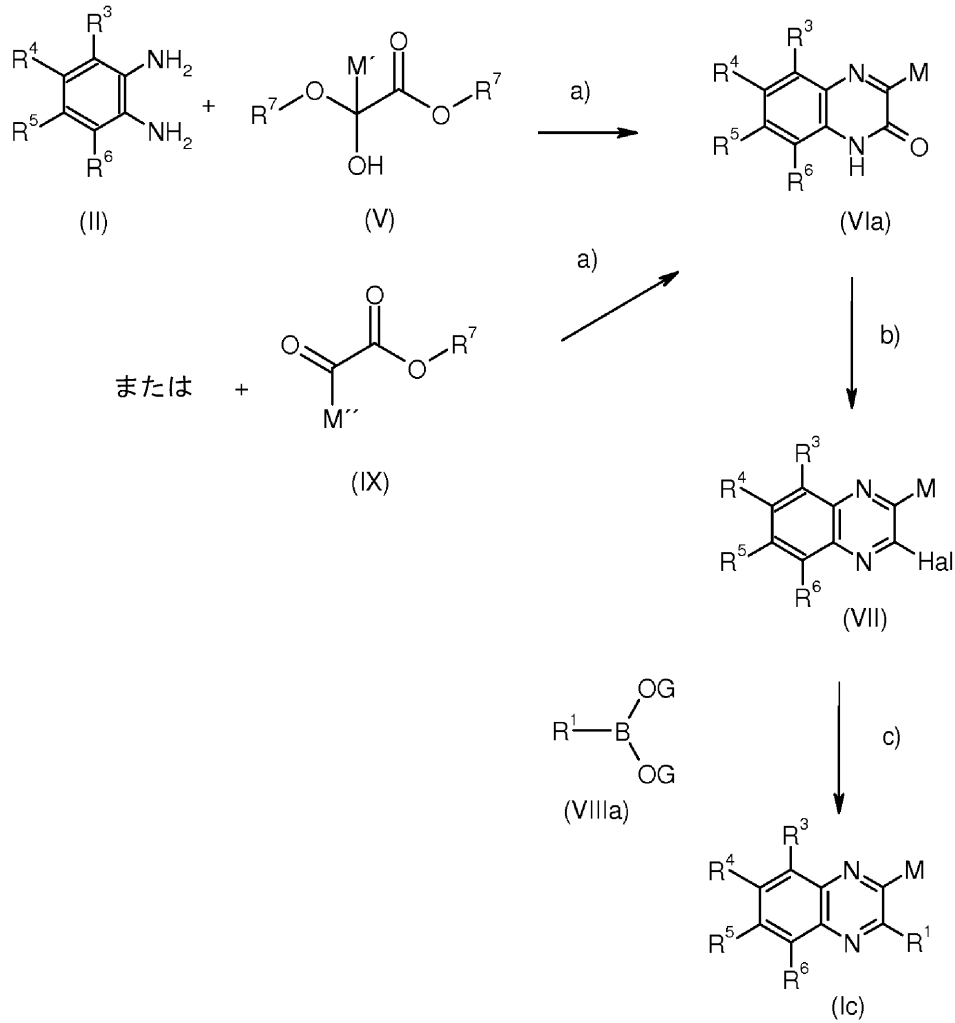
【0076】

該反応は、0 ~ 180 の温度で、減圧下、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能であり；好ましくは、該反応は、20 ~ 110 の温度で、大気圧下で実施する。

【0077】

調製方法 C :

【化 2 1】



10

20

【0078】

30

ラジカル Hal、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、上記意味を有し、
 R^7 は、水素又は ($C_1 - C_6$) - アルキル (好ましくは、水素又は ($C_1 - C_4$) - アルキル; 特に好ましくは、水素又はメチル) を表し;

M' は、水素又は ($C_1 - C_6$) - アルキル (好ましくは、水素又は ($C_1 - C_4$) - アルキル; 特に好ましくは、水素、メチル又はトリフルオロメチル) を表し;

M'' は、水素、($C_1 - C_6$) - アルキル又は ($C_3 - C_8$) - シクロアルキル (好ましくは、水素、($C_1 - C_4$) - アルキル又は ($C_3 - C_6$) - シクロアルキル; 特に好ましくは、水素又はメチル) を表し;

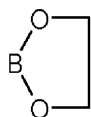
M は、 M' 又は M'' を表し;

G は、水素、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル又はアリール (好ましくは、水素、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_2 - C_4$) - アルケニル又はフェニル; 特に好ましくは、水素) を表し; 又は、

40

$B(OG)_2$ は、一緒に、5員環又は6員環 (好ましくは、5員環、特に好ましくは、

【化 2 2】



【0079】

を形成する。

【0080】

50

段階 (a)

本発明による 1 実施形態では、式 (I I) で表されるベンゼン - 1 , 2 - ジアミンを式 (V) で表されるアルキルヒドロキシ (アルコキシ) アセテートと反応させて、式 (V I a) で表されるキノキサリン - 2 (1 H) - オンを生成させる。

【 0 0 8 1 】

この一般的な合成方法は、例えば、「Chem. Ber. 87, 1062 (1954)」又は「Chem. Ber. 90, 2604 (1957)」に記載されている。グリオキシル酸エステルセミアセタール (V) の代わりにヒドロキシケトン類を使用することは、「Synth. Commun. 2012, 42, 236-245」に記載されている。

10

【 0 0 8 2 】

式 (V) で表される化合物は、市販されている。

【 0 0 8 3 】

あるいは、式 (I I) で表されるベンゼン - 1 , 2 - ジアミンを式 (I X) で表されるカルボニル化合物と反応させて、式 (V I a) で表されるキノキサリン - 2 (1 H) - オンを生成させる。

【 0 0 8 4 】

この一般的な合成方法は、例えば、US 2005/0256000、WO 2011/022439、「Tetrahedron Lett., 2008, 49」、「J. Med. Chem. 1981, 24(1), 93-101」、「J. Heterocycl. Chem. 24, 1771, (1987)」、「J. Heterocyclic Chem. 29, 129, (1992)」又は「Helv. Chim. Acta 2010, 93, 1216-1220」に記載されている。

20

【 0 0 8 5 】

式 (I X) で表されるカルボニル化合物は、市販されている。

【 0 0 8 6 】

式 (I I) で表される不斉のベンゼン - 1 , 2 - ジアミンを使用する場合、式 (V I a) で表される位置異性キノキサリン - 2 (1 H) - オンの混合物が得られ得る。これらは、慣習的なクロマトグラフ法で分離することができる。

30

【 0 0 8 7 】

式 (I I) で表されるベンゼン - 1 , 2 - ジアミンと式 (V) で表されるアルキルヒドロキシ (アルコキシ) アセテート又は式 (I X) で表されるカルボニル化合物の反応は、何も加えずに実施することができるか、又は、溶媒の中で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、一般的な反応条件下において不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。

【 0 0 8 8 】

好ましいのは、以下のものである： 脂肪族アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサソ、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；又は、アミド類、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド (DMF)、N, N - ジメチルアセトアミド又は N - メチルピロリドン；又は、これらと水の混合物；及び、純粋な水又は 1, 2 - ジクロロエタン。

40

【 0 0 8 9 】

該反応は、- 20 ~ 180 の温度で、減圧下、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能であり；好ましくは、該反応は、30 ~ 130 の温度で、大気圧下で実施する。

【 0 0 9 0 】

段階 (b)

本発明によれば、段階 (a) で得られた式 (V I a) で表されるキノキサリン - 2 (1 H) - オンをハロゲン化剤と反応させて、式 (V I I) で表されるキノキサリンを生成さ

50

せる。

【0091】

適切なハロゲン化剤は、例えば、 PCl_3 、 POCl_3 、 PCl_5 、 POBr_3 、 PBr_5 、塩化チオニル又はN-ハロスクシンイミド又はこれら試薬の混合物である。好ましくは、使用するハロゲン剤は、 POCl_3 である。これらの合成変形態様は、WO 95/42463、WO 2008/141065、WO 2008/148867、WO 2011/022439、「Rec. Trav. Chim. Pays-Bas, 1972, 91, 850-860」、「J. Med. Chem., 1981, 24(1), 93-101」、「J. Heterocyclic Chem. 33, 447(1996)」及び「Tetrahedron Lett., 1999, 40, 7477」に記載されている。

10

【0092】

あるいは、該ハロゲン化は、 P_2O_5 の存在下でヨウ化テトラアルキルアンモニウム、臭化テトラアルキルアンモニウム及び塩化テトラアルキルアンモニウムを使用して、段階(b)に従って実施した。この方法は、「Tetrahedron Lett., 2001, 42, 4849-4851」に記載されている。

【0093】

式(VIa)で表される化合物の一部は新規であり、一部は市販されている。

【0094】

式(VIa)で表される化合物とハロゲン化剤の反応は、何も加えずに実施することができるか、又は、溶媒の中で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、一般的な反応条件下において不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。

20

【0095】

好ましいのは、以下のものである：芳香族炭化水素類、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；ハロゲン炭化水素類、例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン又はクロロホルム。

【0096】

該反応は、好ましくは、塩基の存在下で実施する。適切な塩基は、当該反応において典型的に使用される有機塩基及び無機塩基である。好ましくは、例えば、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から選択される塩基を使用する。特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。さらにまた、好ましいのは、第3級アミン類、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、トリエチルアミン塩酸塩、N-エチルジイソプロピルアミン及びピリジンである。

30

【0097】

該反応は、0~180の温度で、減圧下、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能であり；好ましくは、該反応は、30~130の温度で、大気圧下で実施する。

【0098】

段階(c)

段階(b)において得られた式(VII)で表されるキノキサリンを式(VII Ia)で表されるホウ素化合物と反応させる。該反応によって、好ましくは、触媒の存在下、場合により有機溶媒又は溶媒と水の混合物の中における塩基の存在下、周囲温度又は高温における該反応によって、本発明による式(Ic)で表されるキノキサリンが得られる。

40

【0099】

ハロゲン化キノキサリンとホウ素誘導体又は有機スズ化合物とのカップリング(スティルカップリング)に関する多くの例が、文献に記載されている。WO 2008/148867においては、パラジウム触媒の存在下における(モルホリン)アリアルボロン酸又は対応するアリアル-1,3,2-ジオキソボロランとの類似したカップリングが公表されている。さらなる例は、WO 2008/141065、WO 2009/07349

50

7、WO 2011/028947、WO 2012/045196、WO 2012/119046、「J. Org. Chem. 1995, 60, 7508-7510」、「J. Med. Chem. 2005, 48(21), 6632-6642」又は「J. Am. Chem. Soc. 2007, 129(11), 3358-3366」の中に見いだすことができる。

【0100】

「Organic Lett. 2011, 16, 4374-4377」には、Pd触媒を用いたボロン酸のカップリング相手としてのキノキサリントシラート類が記載されている。

【0101】

ハロキノキサリン類とのカップリングのために安定なMIDA-ボロネート類を使用することは、「Angew. Chem. Int. Ed., 2012, 51, 2667-2672」に記載されている。

【0102】

式(VII)で表される化合物の一部は新規であり、一部は市販されている。

【0103】

式(VIIa)で表されるホウ素誘導体は、市販されているか、又は、それらは、既知方法で、例えば、「J. Org. Chem., 1995, 60, 7508-7510」、WO 2011/143495、WO 2011/022439又はWO 2004/01913に記載されている既知方法で、調製することができる。

【0104】

ハロキノキサリン類の反応において使用される触媒は、好ましくは、パラジウム、銅又はニッケルの塩又は錯体からなる。

【0105】

適切なパラジウム触媒は、例えば、リガンド〔例えば、2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ピナフチル、9,9-ジメチル-4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)キサンテン又は1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン〕の存在下における、酢酸パラジウム(II)、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリド、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)である。

【0106】

適切な銅塩は、多くの場合リガンド〔例えば、ジアミンリガンド、例えば、N,N'-ジメチルエチレンジアミン、N,N'-ジメチルエチレンジアミン又はトランス-N,N'-ジメチル-1,2-シクロヘキサレンジアミン〕の存在下における、例えば、ヨウ化銅(I)、塩化銅(I)、酸化銅(I)、銅(I)トリフラート、酢酸銅(II)、銅(II)トリフラートである。

【0107】

適切なニッケル触媒は、例えば、ニッケル(II)アセチルアセトネート単独若しくは上記で記載したホスホルリガンド(phosphor ligand)と組み合わされたニッケル(II)アセチルアセトネート、又は、イミダゾリウムカルベンリガンドと組み合わされたニッケル(II)アセチルアセトネートである。

【0108】

該触媒は、用いられる式(VII)で表されるキノキサリンに基づいて、通常、化学量論的な量(好ましくは、0.01~0.8当量の、特に好ましくは、0.01~0.5の化学量論的な量)で使用する。

【0109】

式(VII)で表されるキノキサリンとボロン酸の反応は、好ましくは、一般的な反応条件下において不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル又は1,2-ジメトキシエタン；芳香族炭化水素類、例えば、ベンゼン、

10

20

30

40

50

トルエン又はキシレン；脂肪族アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；極性非プロトン性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N - メチルピロリドン；及び、これら溶媒と水の混合物。

【0110】

該反応は、好ましくは、塩基の存在下で実施する。適切な塩基は、無機塩基、特に、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩である。特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。該無機塩基は、水溶液として使用することも可能である。

10

【0111】

該反応は、0 ~ 200 の温度で、減圧下、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、場合により不活性ガス雰囲気下で、40 ~ 150 の温度で、大気圧下で実施する。

【0112】

ボロン酸の代わりに、別のホウ素化合物（例えば、トリフルオロホウ酸カリウム、ボロン酸エステル）を使用することも可能であるか、又は、別の有機金属化合物（例えば、スタナン類、シラン類又はビスムタン類）を使用することも可能である。

【0113】

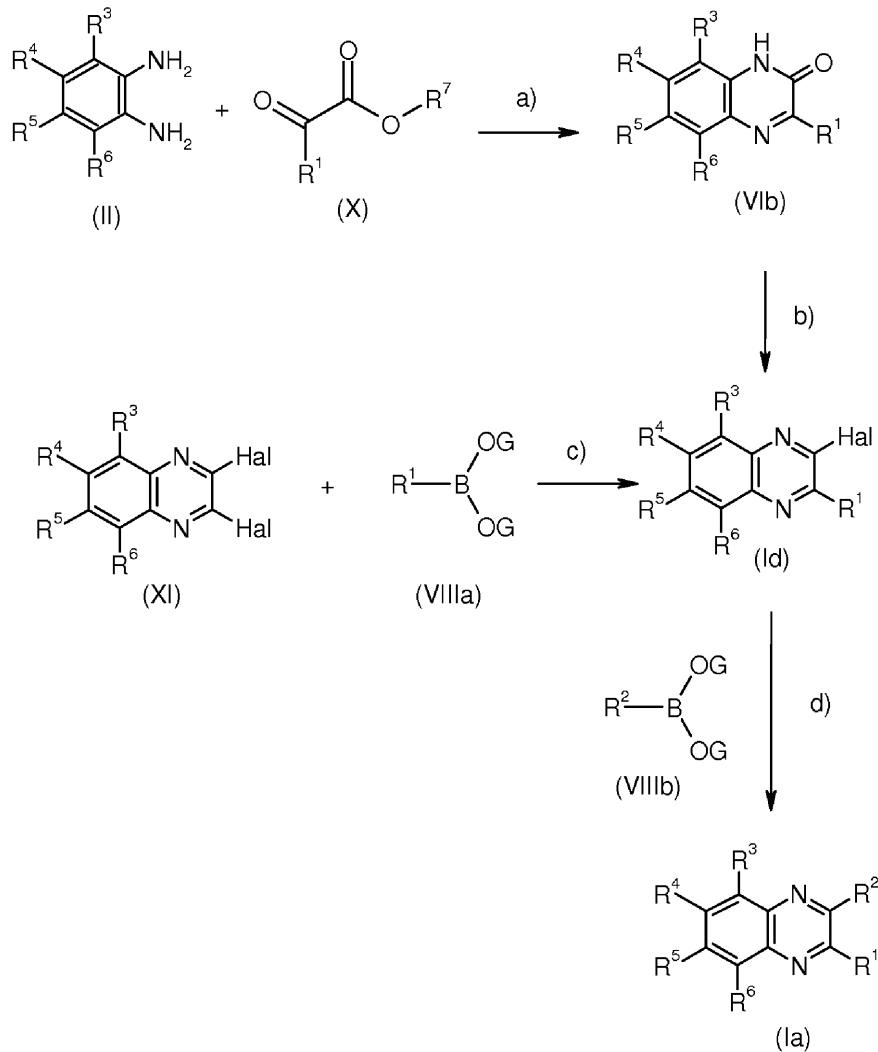
適切な有機スズ化合物は、対応するトリメチルスタニル化合物又はトリブチルスタニル化合物、例えば、WO 2011/22815又はWO 2011/022439に記載されているものである。

20

【0114】

調製方法D

【化 2 3】



10

20

【0115】

30

ラジカル R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、Hal、G 及び B(OG)₂ は、上記意味を有する。

【0116】

段階 (a)

本発明による 1 実施形態では、式 (II) で表されるベンゼン - 1, 2 - ジアミンを式 (X) で表されるカルボニル化合物と反応させて、式 (VIb) で表されるキノキサリン - 2 (1H) - オンを生成させる。

【0117】

40

該反応は、調製方法 C 段階 (a) で用いられている方法と同様に実施するか、又は、「J. Heterocyclic Chem. 29, 129, (1976)」、「J. Heterocyclic Chem. 33, 447, (1996)」、「Helv. Chim. Acta, 93, 1216 - 1220 (2010)」、「J. Chem. Research (S), 1986, 16 - 17」又は US 2005/0256000 に記載されている方法と同様に実施する。

【0118】

不斉のベンゼン - 1, 2 - ジアミン (II) を使用する場合、式 (VIb) で表される位置異性キノキサリン - 2 (1H) - オンの混合物が得られ得る。これらは、慣習的なクロマトグラフ法で分離することができる。

【0119】

式 (X) で表されるカルボニル化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例え

50

ば、「Synth. Commun. 2008, 38(24), 4434-444」、「J. Org. Chem. 1981, 211」、「Tetrahedron Lett., 2002, 43, 5361-5365」、DE 2824407、JP 52027745又はEP-A-512352と同様にして、調製することができる。

【0120】

段階(b)

本発明によれば、段階(a)で得られた式(VIb)で表されるキノキサリン-2(1H)-オンを調製方法C段階(b)と同様にハロゲン化剤と反応させて、式(Id)で表されるキノキサリンを生成させる。

【0121】

式(VIb)で表される化合物の一部は新規であり、一部は市販されている。

【0122】

段階(c)

あるいは、本発明によるさらなる実施形態では、式(Id)で表されるキノキサリンは、調製方法A段階(c)に記載されている当該反応を実施する方法と同様にして、式(XI)で表されるキノキサリンと式(VIIa)で表されるホウ素化合物から得られる。

【0123】

式(XI)で表される1,2-ビスハロキノキサリンは、US 5514680、「J. Med. Chem. 1981, 24(1), 93-101」又は「J. Heterocycl. Chem. 2009, 46, 317-319」の調製方法と同様にして、1,4-ジヒドロキノキサリン-2,3-ジオン類を適切なハロゲン化剤(例えば、POCl₃又は塩化チオニル)と反応させることによって調製する。

【0124】

式(XI)で表される化合物の一部は新規であり、一部は市販されている。

【0125】

段階(d)

段階(b)又は段階(c)において得られた本発明による式(Id)で表されるキノキサリンを、製方法A段階(c)に記載されている実施形態と同様の実施形態において、式(VIIb)で表されるホウ素化合物と反応させることによって、式(Ia)で表されるキノキサリンに変換させる。

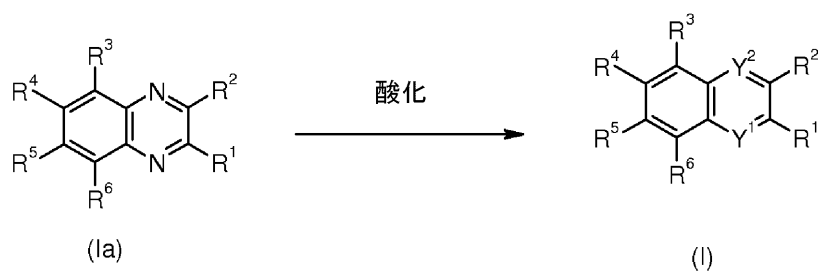
【0126】

式(VIIb)で表されるホウ素誘導体は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「J. Org. Chem., 1995, 60, 7508-7510」、WO 2011/143495又はWO 2004/01913に記載されている既知方法で、調製することができる。

【0127】

調製方法E

【化24】



【0128】

ラジカル Y¹、Y²、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、上記意味を有する。

【0129】

10

20

30

40

50

調製方法 A ~ 調製方法 D において得られた式 (I a) で表されるキノキサリンは、酸化剤と反応させることによって、一般構造 (I) の対応する N - オキシドに変換させることができる。該反応は、「J. Chem. Soc. 479 (1938)」、「J. of Chem. and Eng. Data, 1973, 18 (1), 102 - 104」、「Synlett 2001, (1), 73 - 73」、「WO 2008 / 015423」、「J. Org. Chem. 1977, 1869 - 1871」、「Chem. Pharm. Bull. 1974, 22, 2097 - 2100」又は「J. Chem. Research (S), 1986, 16 - 17」と同様にして実施する。

【0130】

使用する酸化剤は、場合によりモレキュラーシーブ又は触媒（例えば、 Na_2WO_4 二水和物）の存在下における、及び、場合により有機酸（例えば、ギ酸又は酢酸）の存在下における、メタ - クロロ過安息香酸、溶媒としての H_2O_2 とメタノールの存在下におけるレニウム塩（例えば、 MeReO_3 ）、硫酸中の $\text{K}_2\text{S}_2\text{O}_8$ 、又は、30 ~ 70 % 強度の過酸化水素水溶液である。

【0131】

適切な溶媒は、ジクロロメタン、トリクロロメタン、メタノール、ギ酸、酢酸又はトリフルオロ酢酸である。

【0132】

使用する酸化剤は、好ましくは、酢酸中における 35 % 強度過酸化水素水溶液である。

【0133】

該反応は、0 ~ 60 の温度で、大気圧下又は高圧下で、実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、40 ~ 50 の温度で、大気圧下で実施する。

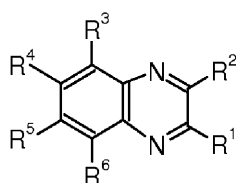
【0134】

式 (I a)、式 (I b)、式 (I c) 及び式 (I d) で表される化合物は、式 (I) で表される化合物の下位構造である。

【0135】

意味「 $Y^1 = Y^2 = N$ 」を考慮して、以下の構造が得られる：

【化25】

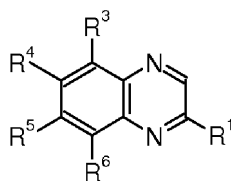


(Ia)

【0136】

意味「 $Y^1 = Y^2 = N$ 、及び、 $R^2 = \text{水素}$ 」を考慮して、以下の構造が得られる：

【化26】



(Ib)

【0137】

意味「 $Y^1 = Y^2 = N$ 、及び、 $R^2 = M$ 」を考慮して、以下の構造が得られる：

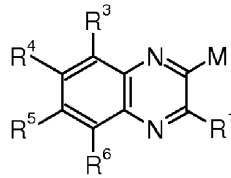
10

20

30

40

【化27】



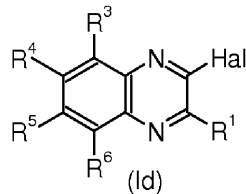
(Ic)

【0138】

10

意味「 $Y^1 = Y^2 = N$ 、及び、 $R^2 = Hal$ 」を考慮して、以下の構造が得られる：

【化28】



(Id)

【0139】

20

ここで、M、Hal、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、上記意味を有する。

【0140】

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。

【0141】

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。

30

【0142】

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。

【0143】

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ことができる：

40

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(Aculus spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ(Aculus fockeui)、アクルス・シュレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、アン

50

ブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス (*Amphitetranychus viennensis*)、アルガス属種 (*Argas* spp.)、ボオフィルス属種 (*Boophilus* spp.)、ブレビバルプス属種 (*Brevipalpus* spp.)、例えば、ブレビバルプス・ホエニシス (*Brevipalpus phoenicis*)、ブリオビア・グラミンム (*Bryobia graminum*)、ブリオビア・プラエチオサ (*Bryobia praetiosa*)、セントルロイデス属種 (*Centruroides* spp.)、コリオプテス属種 (*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.)、ロキソスケルス属種 (*Loxosceles* spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・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 yotherysi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニクス属種 (*Panonychus* spp.)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*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.)、リビセファルス属種 (*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、タルソネムス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tet*

ranychus 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cant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*)、アルフィトビウス・ジアベリヌス (*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 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema*

10

20

30

40

50

denticulata)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus spp.*)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites spp.*)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera spp.*)、クルクリオ属種 (*Curculio spp.*)、例えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus spp.*)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adpersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*Dermestes spp.*)、ジアプロチカ属種 (*Diabrotica spp.*)、例えば、ジアプロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアプロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアプロチカ・ウンデシムブクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアプロチカ・ウンデシムブクタタ・ウンデシムブクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアプロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアプロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zea*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis spp.*)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロポデルス属種 (*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・パリーブスチス (*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 (*Heteronychus arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx spp.*)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポストチカ (*Hypopomeces 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 (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius spp.*)、レマ属種 (*Lema spp.*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Lepti*

10

20

30

40

50

notarsa 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 (*Lycetus* spp.)、メガセルス属種 (*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・キサントグラフィス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属種 (*Necrobia* spp.)、ニプツス・ホロレウス (*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 (*Otiornynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiornynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiornynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiornynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiornynchus rugosostriarius*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiornynchus 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・ジャボニカ (*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 dilaticollis*)、タニメクス・インジクス (*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パリアツス (*Tanymecus palliatus*)、テネブリオ・モ

リトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebrio ides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium spp.*)、例えば、トリボリウム・アウダキス (*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム (*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma spp.*)、チキウス属種 (*Tychius spp.*)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus spp.*)、ザブルス属種 (*Zabrus spp.*)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrio ides*) ;

10

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 sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種 (*Agromyza spp.*)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha spp.*)、アノフェレス属種 (*Anopheles spp.*)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属種 (*Asphondylia spp.*)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera spp.*)、例えば、バクトロセラ・ククルビタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレアエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus spp.*)、クリソミア属種 (*Chrysomya spp.*)、クリソプス属種 (*Chrysops spp.*)、クリソゾナ・ブルビアリス (*Chrysozona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya spp.*)、コンタリニア属種 (*Contarinia spp.*)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロピア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex spp.*)、例えば、クレキス・ピピエン (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides spp.*)、クリセタ属種 (*Culiseta 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 antiqua*)、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 platyura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトピア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila spp.*)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*) ;

20

30

40

50

nogaster)、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・ヒオシアミ (*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 (*Piophilica 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 (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca spp.*)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca biguttula*)、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・ミドレットニ (*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 (*Chloritona 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 (*Cocomytilus 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 (*Tenartaria* 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・アピイホリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*D*

10

20

30

40

50

ysmicoccus 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
 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 10
 .)、エウセルリス・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 (*Hom
 alodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopt
 erus arundinis*)、ヒアロプテルス・ブルニ (*Hyalopter
 us pruni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・ブル
 カシ (*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* s
 pp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス 20
 ・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 c
 ornii*) (= パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium c
 ornii*))、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
 、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 lilii*)、マクロシフム・ロサエ
 (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンス (*Macr
 osteles facifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp 30
 .)、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・
 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 40
 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* s
 pp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cin
 cticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephotettix nig
 ropictus*)、ニラバルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*
)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロ
 ンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya c
 hinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミ
 シア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Pa
 ratrionia* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrio 50*

za 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 (*P
 emphigus populiveneae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregr
 inus 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 madeire
 nsis*)、プロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passeri
 nii*)、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 (*Ph
 ylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phyll
 oxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnasp
 is aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* sp
 p.)、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 pentagon
 a*)、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 longisp
 inus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritim
 us*)、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* s
 pp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psy
 lla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*P
 teromalus* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラ
 スピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、例えば、クアドラス
 ピジオツス・ジュグランスレギアエ (*Quadraspidiotus juglans
 regiae*)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Quadraspid
 iotus ostreaeformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオスス (
 Quadraspidiotus perniciosus)、クエサダ・ギガス (*Qu
 esada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp
 .)、ロパロシウム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシ
 フム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシウム・オキシ
 アカンタエ (*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、ロパロシウム・
 パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシウム・ルフニアブドミナレ
 (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属種 (*S
 aissetia* 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・チタヌス (*Scaphoi
 deus titanus*)、スキザフィス・グラミンム (*Schizaphis gr
 aminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus art
 iculatus*)、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 f
 urcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセフ
 アラ・フェスチナ (*Stictoccephala festina*)、シホニヌス・フィ
 リリアエ (*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 (*T*

10

20

30

40

50

etragonocephela spp.)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種 (*Tomaspis* spp.)、トキシプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、例えば、トキシプテラ・アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキシプテラ・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.) ;

10

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属種 (*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)、ブリスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp.)、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、例えば、シメキス・アドジュンクツス (*Cimex adjunctus*)、シメキス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、シメキス・ピロセルス (*Cimex pilosellus*)、コラリア属種 (*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・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 (*Diconocoris 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 (*Euschistus servus*)、エウスキスツス・トリスチグムス (*Euschistus tristigmus*)、エウスキスツス・バリオラリウス (*Euschistus 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 (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus 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 (*Monalonion 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 quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・ゲイルジニイ (*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ベルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatom*

20

30

40

50

a spp.) ;

ハチ目 (Hymenoptera) の、例えば、アクロミルメキス属種 (Acromyrmex spp.)、アタリア属種 (Athalia spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (Athalia rosae)、アッタ属種 (Atta spp.)、ジブリオン属種 (Diprion spp.)、例えば、ジブリオン・シミリス (Diprion similis)、ホプロカムパ属種 (Hopllocampa spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (Hopllocampa cookei)、ホプロカムパ・テスツジネア (Hopllocampa testudinea)、ラシウス属種 (Lasius spp.)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、シレクス属種 (Sirex spp.)、ソレノプシス・インビクタ (Solenoopsis 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)、キシリス属種 (Xeris spp.) ;

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

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、コプトテルメス属種 (Coptotermes spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (Coptotermes formosanus)、コルニテルメス・クムランス (Cornitermes cumulans)、クリプトテルメス属種 (Cryptotermes spp.)、インシテルメス属種 (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 (Odontotermes spp.)、レチクリテルメス属種 (Reticulitermes spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (Reticulitermes flavipes)、レチクリテルメス・ヘスペルス (Reticulitermes hesperus) ;

チョウ目 (Lepidoptera) 、例えば、アクロイア・グリセラ (Achroia grisella)、アクロニクタ・マジヨル (Acronicta major)、アドキソフィエス属種 (Adoxophyes spp.)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (Adoxophyes orana)、アエジア・レウコメラス (Aedia leucomelas)、アグロチス属種 (Agrotis spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (Agrotis segetum)、アグロチス・イプシロン (Agrotis ipsilon)、アラバマ属種 (Alabama spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (Alabama argillacea)、アミエロイス・トランシテラ (Amyelois transitella)、アナルシア属種 (Anarsia 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 cinnara)、ブクラトリキス・ツルベリエラ (Bucculatrix thurberielia)、ブパルス・ピニアリウス (Bupalus piniarius)、ブッセオラ属種 (Busseola spp.)、カコエシア属種 (Cacoecia spp.)、カロプチリア・テイボラ (Caloptilia theivora)、カプア・レチクラナ (Capua reticulana)、カルボカプサ・ポモネラ (Carpocapsa pomonella)、カルボシナ・ニポネンシス (Carposina niponensis)、ケイマトビア・ブルマタ (Cheimatomibia brumata)、キロ属種 (Chilo spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス (Chilo plejadellus)、キロ・スプレッサリス (Chilo suppressalis)、コリストネウラ属種 (Choristoneura spp.)、ク

リシア・アムビグエラ (*Clyisia ambiguella*)、クナファロセルス属種
 (*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (*Cna
 phalocrocis medicinalis*)、クネファシア属種 (*Cnephasi
 a* spp.)、コノボモルファ属種 (*Conopomorpha* spp.)、コノト
 ラケルス属種 (*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属種 (*Copi
 tarsia* spp.)、シジア属種 (*Cydia* spp.)、例えば、シジア・ニ
 グリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pom
 onella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*)、ジアフ
 アニア属種 (*Diaphania* spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diat
 raea saccharalis*)、エアリアス属種 (*Earias* spp.)、エ
 クジトロファ・アウランチュム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラ
 スモバルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、
 エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*E
 phestia* spp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia e
 lutella*)、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniel
 la*)、エピノチア属種 (*Epinothia* spp.)、エピフィアス・ポストビッタ
 ナ (*Epiphyas postvittana*)、エチエラ属種 (*Etiella* s
 pp.)、エウリア属種 (*Eulia* spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ (*E
 upoecilia ambiguella*)、エウプロクチス属種 (*Euprocti
 s* spp.)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chr
 ysorrhoea*)、エウキソア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*F
 eltia* spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonell
 a*)、グラシラリア属種 (*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属種 (*Gr
 apholitha* spp.)、例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholit
 a molesta*)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholita pruniv
 ora*)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*He
 licoverpa* spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicov
 erpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*
)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセン
 ス (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテ
 ラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属
 種 (*Homoeosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒボ
 ノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボフ
 アシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ラフィグマ属種 (*La
 phygma* spp.)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes or
 bonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レ
 ウコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス
 属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデ
 ラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテン
 ナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア属種 (*Lobesia*
 spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサ
 グロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア
 属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスバル (*Lyman
 tria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、
 リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウ
 ストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テスツラリス (*Mar
 uca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra bra
 ssicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*M
 ocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、
 ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata*)、ネマボゴン・クロアセル

10

20

30

40

50

ス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketeticus* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、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 (*Panolis flammea*)、バルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonorycter crataegella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、ブラチノタ・スツルタナ (*Platynota stultana*)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia interpunctella*)、ブルシア属種 (*Plusia* spp.)、ブルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (=ブルテラ・マクリペンニス (*Plutella 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 (*Protoparce* 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 (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobius* spp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (*Schoenobius bipunctifer*)、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 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・プラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ストモプテリキス・スブセシベラ (*Stomopteryx subsecivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペツェラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコブルシア属種 (*Trichoplusia* 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*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属種 (*Virachola* spp.) ;

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*)、例えば、アケタ・

10

20

30

40

50

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 (*Grylotalpa* spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Grylotalpa grylotalpa*)、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*) ;

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*)、プレキス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、ксеノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*) ;

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、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*)、リピホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニトリプス・カルダモミ (*Taeniothrips cardamomi*)、トリプス属種 (*Thrips* spp.)、例えば、トリプス・パルミ (*Thrips palmi*)、トリプスタバシ (*Thrips tabaci*) ;

シミ目 (*Zygentoma* (= *Thysanura*))、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*)、例えば、スクチゲレラ属種 (*Scutigerebella* spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ (*Scutigerebella immaculata*) ;

10

20

30

40

50

軟体動物門 (Mollusca) の害虫、特に、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 (Cha 20
bertia 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 30
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 40
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.)、ニツ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 (Oslerus 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 (Paracapillar 50

ia 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 (Para
 mphistomum spp.)、パラノプロセファラ属種 (Paranoploce
 phala spp.)、パラスカリス属種 (Parascaris spp.)、パツ
 サルス属種 (Passalurus spp.)、プロトストロンギルス属種 (Pro
 tostrongylus 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 (Spir
 ocerca spp.)、ステファノフィラリア属種 (Stephanofilari
 a 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 (St
 rongylus 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 (T
 oxascaris 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 (Tri
 chobilharzia spp.)、トリコストロンギルス属種 (Trichost
 rongylus 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 (Wucherer
 ia 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 (A
 glenchus 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 nortonii) 、ブルサフェレンクス属種 (Bur
 saphelenchus spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (B
 ursaphelenchus 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 (Cacopaaurus spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (Cacop
 aaurus 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 (Cr
 iconemella xenoplax) (=メソクリコネマ・キセノブラキス (Me
 socriconema xenoplax))、クリコネモイデス属種 (Cricon
 emoides spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (Cricon
 emoides ferniae) 、クリコネモイデス・オノエンセ (Criconem
 oides onoense) 、クリコネモイデス・オルナツム (Criconemoi
 des 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 (Dolichodoros 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 dihytera*)、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・キトウオオジ (*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*)、ブラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、例えば、ブラチレンクス・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*)。

【0144】

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。

【0145】

線虫類

本発明に関連して、用語「線虫類」は、線形動物門の全ての種を包含し、ここで、特に、植物若しくは菌類に対する寄生性生物として作用するか又はこれらの生物の体内若しくは表面上に損傷を引き起こす種 (例えば、アフエレンキダ目 (*Aphelenchida*)、メロイドギネ目 (*Meloidogyne*)、チレンキダ目 (*Tylenchida*) などの目の各種)、又は、ヒト及び動物に対する寄生性生物として作用するか又はこれらの生物の体内若しくは表面上に損傷を引き起こす種 (例えば、トリキネリダ目 (*Trichinellida*)、チレンキダ目 (*Tylenchida*)、ラブジチナ目 (*Rhabditina*) 及びスピルリダ目 (*Spirurida*) などの目の各種) を包含し

、及び、さらに、別の寄生性の蠕虫類も包含する。

【0146】

作物保護における殺線虫剤は、本明細書中に記載されている場合、線虫類を防除することが可能である。

【0147】

用語「線虫類を防除する (controlling nematodes)」は、線虫類を殺すことを意味するか、又は、線虫類の発育若しくは成長を妨げるか若しくは遅延させることを意味するか、又は、線虫類が植物組織の中に侵入するか若しくは植物組織から吸汁することを妨げるか若しくは遅延させることを意味する。

【0148】

ここで、当該化合物の効力は、式 (I) で表される化合物で処理された植物若しくは植物の部分又は処理された土壌と処理されていない植物若しくは植物の部分又は処理されていない土壌 (100%) の間で、線虫類の死虫率、こぶの形成、シストの形成、土壌の単位体積当たりの線虫類の密度、根 1 本当たりの線虫類の密度、土壌の単位体積当たりの線虫の卵の数、線虫類の運動性を比較することによって、確認される。好ましくは、処理されていない植物、植物の部分又は処理されていない土壌と比較して、25 ~ 50% の低減が達成され、さらに好ましくは、51 ~ 79% の低減が達成され、及び、最も好ましくは、完全に殺すこと、又は、線虫類の発育及び成長を完全な防止 (80% ~ 100% 低減) が達成される。本明細書中に記載されている「線虫類の防除」は、線虫類の増殖 (シスト及び / 又は卵の発育) を防除することも意味する。さらにまた、式 (I) で表される化合物は、植物又は動物を健康な状態に維持するために使用することも可能であり、及び、線虫類を防除するために、治療的に、予防的に又は全身的に使用することも可能である。

【0149】

当業者は、線虫類の死虫率、こぶの形成、シストの形成、土壌の単位体積当たりの線虫類の密度、根 1 本当たりの線虫類の密度、土壌の単位体積当たりの線虫の卵の数、線虫類の運動性について確認する方法を知っている。

【0150】

式 (I) で表される化合物を使用することで、植物を健康な状態に維持することが可能であり、また、式 (I) で表される化合物を使用することは、線虫類に起因する損傷を低減させること及び収穫量を増大させることも包含する。

【0151】

本発明に関連して、用語「線虫類」は、植物に対して損傷を引き起こす全ての線虫を包含する植物線虫類を示している。植物線虫類は、植物寄生性線虫類及び土壌介在性線虫類を包含する。植物寄生性線虫類としては、以下のものを挙げることができる：外部寄生虫、例えば、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、ロングドルス属種 (*Longidorus* spp.) 及びトリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)；半寄生虫、例えば、チレンクス属種 (*Tylenchulus* spp.)；移動性内部寄生虫 (migratory endoparasite)、例えば、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、ラドホルス属種 (*Radopholus* spp.) 及びスクテロネマ属種 (*Scutellonema* spp.)；非移動性寄生虫 (non-migratory parasite)、例えば、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.) 及びメロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)；及び、さらに、茎及び葉内部寄生虫、例えば、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.) 及びヒルシュマニエラ属種 (*Hirschmaniella* spp.)。特に有害な根寄生性土壌線虫類は、例えば、ヘテロデラ属 (*Heterodera*) 若しくはグロボデラ属 (*Globodera*) のシスト形成性線虫類、及び / 又は、メロイドギネ属 (*Meloidogyne*) のネコブ線虫類などである。これらの属の有害な種は、例えば、以下のものである：メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、ヘテ

10

20

30

40

50

ロデラ・グリシネス (*Heterodera glycines*) (ダイズシストセンチュウ)、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*) 及びグロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*) (ジャガイモシストセンチュウ) ; これらの種は、本明細書中に記載されている化合物で効果的に防除される。しかしながら、本明細書中に記載されている化合物を使用することは、決してこれらの属又は種に限定されるものではなく、さらに、他の線虫類にも同様に及ぶ。

【0152】

植物線虫類としては、例えば、以下のものを挙げるができる： アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、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 (*Aphelenchoides fragariae*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、及び、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaaurus pestis*)、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・キセノプラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノプラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、及び、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、クリコネモイデス・フェルニア (*Criconemoides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoides ornatum*)、及び、クリコネモイデス属種 (*Criconemoides* spp.)、ジチレンクス・デストルクトル (*Ditylenchus destructor*)、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ジチレンクス・ミセリオファグス (*Ditylenchus myceliophagus*)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、ドリコドルス・ヘテロセファルス (*Dolichodorus heterocephalus*)、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*) (=ヘテロデラ・パリダ (*Heterodera pallida*))、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*) (ジャガイモシストセンチュウ)、グロボデラ・ソラナセアルム (*Globodera solanacearum*)、グロボデラ・タバクム (*Globodera tabacum*)、グロボデラ・ビルギニア (*Globodera virginia*)、並びに、非移動性シスト形成性寄生虫、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、ヘリコチレンクス・ジゴニクス (*Helicotylenchus digonicus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystra*)、ヘリコチレンクス・エリトリネ (*Helicotylenchus erythrine*)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*)、ヘリコチレンクス・ナンヌス (*Helicotylenchus nannus*)、ヘリコチレンクス・プセウドロボツス (*Helicotylenchus pseudorobustus*)、及び、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、ヘミクリコネモイデス (*Hemicriconemoid*

es)、ヘミシクリオホラ・アレナリア (*Hemicycliophora arena-*
ria)、ヘミシクリオホラ・ヌダタ (*Hemicycliophora nudata*
)、ヘミシクリオホラ・パルバナ (*Hemicycliophora parvana*)
 、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・クルシ
 フェラエ (*Heterodera cruciferae*)、ヘテロデラ・グリシネス (*Heterodera gly-*
cines) (ダイズシストセンチュウ)、ヘテロデラ・
 オリザエ (*Heterodera oryzae*)、ヘテロデラ・スカハクチイ (*Het-*
erodera schachtii)、ヘテロデラ・ゼアエ (*Heterodera*
zea)、並びに、非移動性シスト形成性線虫、ヘテロデラ属種 (*Heteroder-*
a spp.)、ヒルシュマニエラ・グラシリス (*Hirschmaniella gr-*
acilis)、ヒルシュマニエラ・オリザエ (*Hirschmaniella ory-*
zae)、ヒルシュマニエラ・スピニカウダタ (*Hirschmaniella spi-*
nicaudata)、並びに、茎及び葉内部寄生虫、ヒルシュマニエラ属種、ホプロラ
 イムス・アエギブチイ (*Hoplolaimus aegyptii*)、ホプロライムス
 ・カリホルニクス (*Hoplolaimus californicus*)、ホプロライ
 ムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガ
 レアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、ホプロライムス・インジクス
 (*Hoplolaimus indicus*)、ホプロライムス・マグニスタイルス (*Ho-*
plolaimus magnistylus)、ホプロライムス・バラロボスツス (*H-*
oplolaimus pararobustus)、ロンギドルス・アフリカヌス (*L-*
ongidorus africanus)、ロンギドルス・ブレビアンヌラツス (*Lo-*
ngidorus breviannulatus)、ロンギドルス・エロンガツス (*L-*
ongidorus elongatus)、ロンギドルス・ラエビカピタツス (*Lon-*
gidorus laevicapitatus)、ロンギドルス・ピネアコラ (*Lon-*
gidorus vineacola)、及び、外部寄生虫、ロンギドルス属種 (*Lon-*
gidorus spp.)、メロイドギネ・アクロネア (*Meloidogyne a-*
cronea)、メロイドギネ・アフリカナ (*Meloidogyne african-*
a)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロ
 イドギネ・アレナリア・タメシ (*Meloidogyne arenaria thames-*
esi)、メロイドギネ・アルチエラ (*Meloidogyne artiella*)、
 メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイ
 ドギネ・コフェイコラ (*Meloidogyne coffeicola*)、メロイドギ
 ネ・エチオピカ (*Meloidogyne ethiopica*)、メロイドギネ・エキ
 シグア (*Meloidogyne exigua*)、メロイドギネ・ファラキス (*Mel-*
oidogyne fallax)、メロイドギネ・グラミニコラ (*Meloidogy-*
ne graminicola)、メロイドギネ・グラミニス (*Meloidogyne*
graminis)、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
 イドギネ・インコグニタ・アクリタ (*Meloidogyne incognita a-*
crita)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*
)、メロイドギネ・クイエンシス (*Meloidogyne kikuyensis*)
 、メロイドギネ・ミノル (*Meloidogyne minor*)、メロイドギネ・ナア
 シ (*Meloidogyne naasi*)、メロイドギネ・パラナエンシス (*Melo-*
idogyne paranaensis)、メロイドギネ・タメシ (*Meloidog-*
gyne thamesi)、及び、非移動性寄生虫、メロイドギネ属種 (*Meloido-*
gyne spp.)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコブス・
 アベルランス (*Nacobbus aberrans*)、ネオチレンクス・ビギシ (*Ne-*
otylenchus vigissi)、パラフェレンクス・プセウドパリエチヌス (*Par-*
aphelenchus pseudoparietinus)、パラトリコドル
 ス・アリウス (*Paratrichodorus allius*)、パラトリコドルス・

10

20

30

40

50

ロバツス (*Paratrichodorus lobatus*)、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラトリコドルス・ナヌス (*Paratrichodorus nanus*)、パラトリコドルス・ポロス (*Paratrichodorus porosus*)、パラトリコドルス・テレス (*Paratrichodorus teres*)、及び、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus spp.*)、パラチレンクス・ハマツス (*Paratylenchus hamatus*)、パラチレンクス・ミヌツス (*Paratylenchus minutus*)、パラチレンクス・プロジェクトス (*Paratylenchus projectus*)、及び、パラチレンクス属種 (*Paratylenchus spp.*)、ブラチレンクス・アギリス (*Pratylenchus agilis*)、ブラチレンクス・アレニ (*Pratylenchus allenii*)、ブラチレンクス・アンジヌス (*Pratylenchus andinus*)、ブラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、ブラチレンクス・セラリス (*Pratylenchus cerealis*)、ブラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、ブラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、ブラチレンクス・デラトレイ (*Pratylenchus delattrei*)、ブラチレンクス・ギイビカウダツス (*Pratylenchus giibbicaudatus*)、ブラチレンクス・ゴオデイイ (*Pratylenchus goodeyi*)、ブラチレンクス・ハマツス (*Pratylenchus hamatus*)、ブラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、ブラチレンクス・ロオシ (*Pratylenchus loosii*)、ブラチレンクス・ネグレクトス (*Pratylenchus neglectus*)、ブラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、ブラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、ブラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribnerii*)、ブラチレンクス・テレス (*Pratylenchus teres*)、ブラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus thornei*)、ブラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、ブラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、及び、移動性内部寄生虫、ブラチレンクス属種 (*Pratylenchus spp.*)、プセウドハレンクス・ミヌツス (*Pseudohalenchus minutus*)、プシレンクス・マグニデンス (*Psilenchus magnidensis*)、プシレンクス・ツミズ (*Psilenchus tumidus*)、プンクトデラ・カルコエンシス (*Punctodera chalconensis*)、キニスルシウス・アクツス (*Quinisulcius acutus*)、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*)、移動性内部寄生虫、ラドホルス属種 (*Radopholus spp.*)、ロチレンクルス・ボレアリス (*Rotylenchulus borealis*)、ロチレンクルス・パルプス (*Rotylenchulus parvus*)、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)、及び、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus spp.*)、ロチレンクス・ラウレンチヌス (*Rotylenchus laurentinus*)、ロチレンクス・マクロドラツス (*Rotylenchus macrodoratus*)、ロチレンクス・ロブスツス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクス・ユニホルミス (*Rotylenchus uniformis*)、及び、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus spp.*)、スクテロネマ・ブラキウルム (*Scutellonema brachyurum*)、スクテロネマ・ブラジス (*Scutellonema bradys*)、スクテロネマ・クラトリカウダツム (*Scutellonema clathricaudatum*)、及び、移動性内部寄生虫、スクテロネマ属種 (*Scutellonema spp.*)、スバングイナ・ラジシオラ (*Subang*

10

20

30

40

50

uina radiciola)、テチレンクス・ニコチアナエ (*Tetylenchus nicotianae*)、トリコドルス・シリンダリクス (*Trichodorus cylindricus*)、トリコドルス・ミノル (*Trichodorus minor*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、トリコドルス・プロキシムス (*Trichodorus proximus*)、トリコドルス・シミリス (*Trichodorus similis*)、トリコドルス・スパルス (*Trichodorus sparsus*)、及び、外部寄生虫、トリコドルス属種 (*Trichodorus spp.*)、チレンコリンクス・アグリ (*Tylenchorhynchus agri*)、チレンコリンクス・ブラシカエ (*Tylenchorhynchus brassicae*)、チレンコリンクス・クラルス (*Tylenchorhynchus clarus*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・ジギタツス (*Tylenchorhynchus digitatus*)、チレンコリンクス・エブリエンシス (*Tylenchorhynchus eabriensis*)、チレンコリンクス・マキシムス (*Tylenchorhynchus maximus*)、チレンコリンクス・ヌズ (*Tylenchorhynchus nudus*)、チレンコリンクス・ブルガリス (*Tylenchorhynchus vulgaris*)、及び、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus spp.*)、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、及び、半寄生虫、チレンクルス属種 (*Tylenchulus spp.*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、キシフィネマ・ブレビコレ (*Xiphinema brevicolle*)、キシフィネマ・ジモルフィカウダツム (*Xiphinema dimorphicaudatum*)、キシフィネマ・インデクス (*Xiphinema index*)、及び、外部寄生虫、キシフィネマ属種 (*Xiphinema spp.*)。

【0153】

防除するために式 (I) で表される化合物を使用することが可能な線虫類としては、以下のものを挙げることができる： メロイドギネ属の線虫、例えば、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、カタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、及び、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*)； ジチレンクス属の線虫、例えば、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、及び、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*)； プラチレンクス属の線虫、例えば、カタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、キクネグサレセンチュウ (*Pratylenchus fallax*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、チャネグサレセンチュウ (*Pratylenchus loosii*)、及び、クルミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus vulnus*)； グロボデラ属の線虫、例えば、ジャガイモシストセンチュウ (*yellow potato cyst nematode*) (*Globodera rostochiensis*)、及び、ジャガイモシストセンチュウ (*white potato cyst nematode*) (*Globodera pallida*)； ヘテロデラ属の線虫、例えば、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、及び、テンサイシストセンチュウ (*beet cyst eelworm*) (*Heterodera schachtii*)； アフェレンコイデス属の線虫、例えば、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、ハガレセンチュウ (*chrysanthemum nematode*) (*Aphelenchoides ritzemabosi*)、及び、イチゴセンチュウ (*Aphelenchoides fragariae*)； アフェレンクス属の線虫、例えば、ニセネグサレセンチュウ (*fungivorous nematode*) (*Aphelenchus avena*

e) ; ラドホルス属の線虫、例えば、ネモグリセンチュウ (*burrowing nematode*) (*Radopholus similis*) ; チレンクルス属の線虫、例えば、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*) ; ロチレンクルス属の線虫、例えば、ニセフクロセンチュウ (*Rotylenchulus reniformis*) ; 樹木に生息する線虫、例えば、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*)、及び、赤輪病センチュウ (*red ring nematode*) (*Bursaphelenchus cocoophilus*) ; など。

【0154】

保護するために式 (I) で表される化合物を使用することが可能な植物としては、例えば、以下のものを挙げることができる： 禾穀類 (例えば、イネ、オオムギ、コムギ、ライムギ、エンバク、トウモロコシなど)、マメ類 (ダイズ、アズキ、ソラマメ、エンドウマメ、ピーナッツなど)、果樹/果実 (リンゴ、柑橘類、ナシ、ブドウの木、モモ、ウメ、サクラ、クルミ、アーモンド、バナナ、イチゴなど)、野菜種 (キャベツ、トマト、ホウレンソウ、ブロッコリー、レタス、タマネギ、ネギ、コショウなど)、根菜類 (ニンジン、ジャガイモ、サツマイモ、ラディッシュ、レンコン、カブなど)、工業原料用の植物 (ワタ、アサ、カジノキ、ミツマタ、アブラナ、ビート、ホップ、サトウキビ、テンサイ、オリーブ、ゴム、ヤシ、コーヒー、タバコ、チャなど)、ウリ科植物 (カボチャ、キュウリ、スイカ、メロンなど)、牧草類 (カモガヤ、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファなど)、芝草類 (コウシュンシバ (*mascarene grass*))、ベントグラスなど)、香料植物など (ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、コショウ、ショウガなど)、及び、花卉類 (キク、バラ、ランなど)。

【0155】

式 (I) で表される化合物は、コーヒーの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、メロイドギネ・エキシグア (*Meloidogyne exigua*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・コフェイコラ (*Meloidogyne coffeicola*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus spp.*)、及び、さらに、メロイドギネ・パラナエンシス (*Meloidogyne paranaensis*)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus spp.*)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema spp.*)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus spp.*)、及び、スクテロネマ属種 (*Scutellonema spp.*)。

【0156】

式 (I) で表される化合物は、ジャガイモの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・ブラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、ジチレンクス・ジプサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、及び、さらに、プラチレンクス・アレニ (*Pratylenchus allenii*)、プラチレンクス・アンジヌス (*Pratylenchus andinus*)、プラチレンクス・セラリス (*Pratylenchus cerealis*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ロオシ (*Pratylenchus loosii*)、プラチレンクス・ネグレクツス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・テレス (*Pratylenchus teres*)、プラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus tho*

10

20

30

40

50

rnei)、プラチレンクス・ブルヌス(Pratylenchus vulnus)、ベロノライムス・ロングカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)、トリコドルス・シリンドリクス(Trichodorus cylindricus)、トリコドルス・プリミチブス(Trichodorus primitivus)、トリコドルス・プロキシムス(Trichodorus proximus)、トリコドルス・シミリス(Trichodorus similis)、トリコドルス・スパルス(Trichodorus sparsus)、パラトリコドルス・ミノル(Paratrichodorus minor)、パラトリコドルス・アリウス(Paratrichodorus allius)、パラトリコドルス・ナヌス(Paratrichodorus nanus)、パラトリコドルス・テレス(Paratrichodorus teres)、メロイドギネ・アレナリア(Meloidogyne arenaria)、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・タメシ(Meloidogyne thamesi)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、メロイドギネ・キトウオオジ(Meloidogyne chitwoodi)、メロイドギネ・ジャバニカ(Meloidogyne javanica)、ナコブス・アベルランス(Nacobbus aberrans)、グロボデラ・ロストキエンシス(Globodera rostochiensis)、グロボデラ・パリダ(Globodera pallida)、ジチレンクス・デストラクトル(Ditylenchus destructor)、ラドホルス・シミリス(Radopholus similis)、ロチレンクルス・レニホルミス(Rotylenchulus reniformis)、ネオチレンクス・ビギシ(Neotylenchus vigissi)、パラフェレンクス・プセウドパリエチヌス(Paraphelenchus pseudoparietinus)、アフエレンコイデス・フラガリアエ(Aphelenchoides fragariae)、及び、メロイネマ属種(Meloinema spp.)。

【0157】

式(I)で表される化合物は、トマトの線虫類、特に、以下のものを防除するのことに特に適している：メロイドギネ・アレナリア(Meloidogyne arenaria)、メロイドギネ・ハブラ(Meloidogyne hapla)、メロイドギネ・ジャバニカ(Meloidogyne javanica)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、プラチレンクス・ペネトランス(Pratylenchus penetrans)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス(Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・コフエアエ(Pratylenchus coffeae)、プラチレンクス・スクリブネリ(Pratylenchus scribneri)、プラチレンクス・ブルヌス(Pratylenchus vulnus)、パラトリコドルス・ミノル(Paratrichodorus minor)、メロイドギネ・エキシグア(Meloidogyne exigua)、ナコブス・アベルランス(Nacobbus aberrans)、グロボデラ・ソラナセアルム(Globodera solanacearum)、ドリコドルス・ヘテロセファルス(Dolichodorus heterocephalus)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス(Rotylenchulus reniformis)。

【0158】

式(I)で表される化合物は、ウリ科植物の線虫類、特に、以下のものを防除するのことに特に適している：メロイドギネ・アレナリア(Meloidogyne arenaria)、メロイドギネ・ハブラ(Meloidogyne hapla)、メロイドギネ・ジャバニカ(Meloidogyne javanica)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、ロチレンクルス・レニホルミス(Rotylenchulus reniformis)、及び、プラチレンクス・

10

20

30

40

50

トルネイ (*Pratylenchus thornei*)。

【0159】

式 (I) で表される化合物は、ワタの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)。

【0160】

式 (I) で表される化合物は、トウモロコシの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、及び、さらに、ブラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、ブラチレンクス・デラトレイ (*Pratylenchus delattrei*)、ブラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、ブラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、ブラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeae*)、(ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*))、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus norton*)、ロンギドルス・ブレビアンヌラツス (*Longidorus breviannulatus*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・アレナリア・タメシ (*Meloidogyne arenaria thamesi*)、メロイドギネ・グラミニス (*Meloidogyne graminis*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ (*Meloidogyne incognita acrita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・ナアシ (*Meloidogyne naasi*)、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・オリザエ (*Heterodera oryzae*)、ヘテロデラ・ゼアエ (*Heterodera zeae*)、プンクトデラ・カルコエンシス (*Punctodera chalconensis*)、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ホプロライムス・アエギプチイ (*Hoplolaimus aegyptii*)、ホプロライムス・マグニスタイルス (*Hoplolaimus magnistylus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、ホプロライムス・インジクス (*Hoplolaimus indicus*)、ヘリコチレンクス・ジゴニクス (*Helicotylenchus digonicus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystrera*)、ヘリコチレンクス・プセウドロボスツス (*Helicotylenchus pseudorobustus*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、ドリコドルス・ヘテロセファルス (*Dolichodorus heterocephalus*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス・ボレアリス (*Rotylenchulus borealis*)、ロチレンクルス・バルブス (*Rotylenchulus parvus*)、チレンコリンクス・アグリ (*Tylenchorhynchus agri*)、チレンコリンクス・クラルス (*Tylenchorhynchus clarus*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・マキシムス (*Tylenchorhynchus maximus*)、チレンコリンクス・ヌズス (*Tylenchorhynchus*

10

20

30

40

50

nudus)、チレンコリンクス・ブルガリス (*Tylenchorhynchus vulgaris*)、キニスルシウス・アクツス (*Quinisolcius acutus*)、パラチレンクス・ミヌツス (*Paratylenchus minutus*)、ヘミシクリオホラ・パルバナ (*Hemicycliophora parvana*)、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、スクテロネマ・ブラキウルム (*Scutellonema brachyurum*)、及び、スバングイナ・ラジシオラ (*Subanguina radiciola*)。

【0161】

式 (I) で表される化合物は、ダイズの線虫類、特に、以下のものを防除するのことに特に適している： プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、ベロノライムス・ロングカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ヘテロデラ・グリシネス (*Heterodera glycines*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、及び、さらに、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ネグレクトゥス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・アレニ (*Pratylenchus allenii*)、プラチレンクス・アギリス (*Pratylenchus agilis*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeaee*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、(ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*))、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、ホプロライムス・コルムブス (*Hoplolaimus columbus*)、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)、及び、ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*)。

【0162】

式 (I) で表される化合物は、タバコの線虫類、特に、以下のものを防除するのことに特に適している： メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・プラテンシス (*Pratylenchus pratensis*)、プラチレンクス・ヘキシシス (*Pratylenchus hexincisus*)、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・ネグレクトゥス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンクス・クレナツス (*Pratylenchus crenatus*)、プラチレンクス・トルネイ (*Pratylenchus thornei*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zeaee*)、ロングドルス・エロンガツ (*Longidorus elongatus*)、パラトリコドルス・ロバツス (*Paratrichodorus lobatus*)、トリコドルス属種 (*Trichodorus spp.*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、グロボデラ・タバクム (*G*

10

20

30

40

50

lobodera tabacum)、グロボデラ・ソラナセアルム (Globodera solanacearum)、グロボデラ・ビルギニアエ (Globodera virginiae)、ジチレンクス・ジブサシ (Ditylenchus dipsaci)、ロチレンクス属種 (Rotylenchus spp.)、ヘリコチレンクス属種 (Helicotylenchus spp.)、キシフィネマ・アメリカヌム (Xiphinema americanum)、クリコネメラ属種 (Criconemella spp.)、ロチレンクルス・レニホルミス (Rotylenchulus reniformis)、チレンコリンクス・クライトニ (Tylenchorhynchus claytoni)、パラチレンクス属種 (Paratylenchus spp.)、及び、テチレンクス・ニコチアナエ (Tetylenchus nicotianae)

10

【0163】

式 (I) で表される化合物は、柑橘類の線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・コフェアエ (Pratylenchus coffeae)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・ブルヌス (Pratylenchus vulnus)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (Belonolaimus longicaudatus)、パラトリコドルス・ミノル (Paratrichodorus minor)、パラトリコドルス・ポロス (Paratrichodorus porosus)、トリコドルス (Trichodorus)、メロイドギネ・インコグニタ (Meloidogyne incognita)、メロイドギネ・インコグニタ・アクリタ (Meloidogyne incognita acrita)、メロイドギネ・ジャバニカ (Meloidogyne javanica)、ロチレンクス・マクロドラツス (Rotylenchus macrodoratus)、キシフィネマ・アメリカヌム (Xiphinema americanum)、キシフィネマ・ブレビコレ (Xiphinema brevicolle)、キシフィネマ・インデキス (Xiphinema index)、クリコネメラ属種 (Criconemella spp.)、ヘミクリコネモイデス (Hemicriconemoides)、ラドホルス・シミリス (Radopholus similis)、及び、ラドホルス・シトロフィルス (Radopholus citrophilus)、ヘミシクリオホラ・アレナリア (Hemicycliophora arenaria)、ヘミシクリオホラ・ヌダタ (Hemicycliophora nudata)、及び、チレンクルス・セミペネトランス (Tylenchulus semipenetrans)。

20

30

【0164】

式 (I) で表される化合物は、バナナの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・コフェアエ (Pratylenchus coffeae)、ラドホルス・シミリス (Radopholus similis)、及び、さらに、プラチレンクス・ギイビカウダツス (Pratylenchus giibbicaudatus)、プラチレンクス・ロオシ (Pratylenchus loosii)、メロイドギネ属種 (Meloidogyne spp.)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス (Helicotylenchus multicinctus)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (Helicotylenchus dihyssera)、及び、ロチレンクルス属種 (Rotylenchulus spp.)。

40

【0165】

式 (I) で表される化合物は、パイナップルの線虫類、特に、以下のものを防除するするのに特に適している： プラチレンクス・ゼアエ (Pratylenchus zeaee)、プラチレンクス・プラテンシス (Pratylenchus pratensis)、プラチレンクス・ブラキウルス (Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・ゴオデイイ (Pratylenchus goodeyi)、メロイドギネ属種 (Meloidogyne spp.)、ロチレンクルス・レニホルミス (

50

Rotylenchulus reniformis)、及び、さらに、ロンギドルス・エロンガツス(Longidorus elongatus)、ロンギドルス・ラエビカピタツス(Longidorus laevicapitatus)、トリコドルス・ブリミチプス(Trichodorus primitivus)、トリコドルス・ミノル(Trichodorus minor)、ヘテロデラ属種(Heterodera spp.)、ジチレンクス・ミセリオファグス(Ditylenchus myceliophagus)、ホプロライムス・カリホルニクス(Hoplolaimus californicus)、ホプロライムス・パラロブスツス(Hoplolaimus pararobustus)、ホプロライムス・インジクス(Hoplolaimus indicus)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ(Helicotylenchus dihystera)、ヘリコチレンクス・ナンヌス(Helicotylenchus nannus)、ヘリコチレンクス・マルチシンクツス(Helicotylenchus multicinctus)、ヘリコチレンクス・エリトリネ(Helicotylenchus erythrine)、キシフィネマ・ジモルフィカウダツム(Xiphinema dimorphicaudatum)、ラドホルス・シミリス(Radopholus similis)、チレンコリンクス・ジギタツス(Tylenchorhynchus digitatus)、チレンコリンクス・エブリエンシス(Tylenchorhynchus ebricensis)、パラチレンクス・ミヌツス(Pratylenchus minutus)、スクテロネマ・クラトリカウダツム(Scutellonema clathricaudatum)、スクテロネマ・ブラジス(Scutellonema bradys)、プシレンクス・ツミズス(Psilenchus tumidus)、プシレンクス・マグニデンス(Psilenchus magnidens)、プセウドハレンクス・ミヌツス(Pseudohalenchus minutus)、クリコネモイデス・フェルニアエ(Criconemoides ferniae)、クリコネモイデス・オノエンセ(Criconemoides onoense)、及び、クリコネモイデス・オルナツム(Criconemoides ornatum)。

【0166】

式(I)で表される化合物は、ブドウの木の線虫類、特に、以下のものを防除するのことに特に適している： プラチレンクス・ブルヌス(Pratylenchus vulnus)、メロイドギネ・アレナリア(Meloidogyne arenaria)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、メロイドギネ・ジャバニカ(Meloidogyne javanica)、キシフィネマ・アメリカヌム(Xiphinema americanum)、キシフィネマ・インデキス(Xiphinema index)、及び、さらに、プラチレンクス・プラテンシス(Pratylenchus pratensis)、プラチレンクス・スクリブネリ(Pratylenchus scribneri)、プラチレンクス・ネグレクツス(Pratylenchus neglectus)、プラチレンクス・ブラキウルス(Pratylenchus brachyurus)、プラチレンクス・トルネイ(Pratylenchus thornei)、及び、チレンクルス・セミペネトランス(Tylenchulus semipenetrans)。

【0167】

式(I)で表される化合物は、樹木作物 - 仁果類の線虫類、特に、以下のものを防除するのことに特に適している： プラチレンクス・ペネトランス(Pratylenchus penetrans)、及び、さらに、プラチレンクス・ブルヌス(Pratylenchus vulnus)、ロンギドルス・エロンガツス(Longidorus elongatus)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、及び、メロイドギネ・ハブラ(Meloidogyne hapla)。

【0168】

式(I)で表される化合物は、樹木作物 - 核果類の線虫類、特に、以下のものを防除す

10

20

30

40

50

るするのに特に適している： プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・ブルヌス (*Pratylenchus vulnus*)、メロイドギネ・アレナリア (*Meloidogyne arenaria*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、クリコネメラ・キセノブラキス (*Criconemella xenoplax*)、及び、さらに、プラチレンクス・ブラキウルス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチレンクス・コフェアエ (*Pratylenchus coffeae*)、プラチレンクス・スクリブネリ (*Pratylenchus scribneri*)、プラチレンクス・ゼアエ (*Pratylenchus zea*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystera*)、キシフィネマ・アメリカヌム (*Xiphinema americanum*)、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、チレンコリンクス・クライトニ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、パラチレンクス・ハマツス (*Paratylenchus hamatus*)、パラチレンクス・プロジェクトス (*Paratylenchus projectus*)、スクテロネマ・ブラキウルム (*Scutellonema brachyurum*)、及び、ホプロライムス・ガレアツス (*Hoplolaimus galeatus*)。

10

20

【0169】

式 (I) で表される化合物は、樹木作物、サトウキビ及びイネの線虫類、特に、以下のものを防除するのに特に適している： トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、及び、さらに、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus* spp.)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、アフエレンコイデス (*Aphelenchoides* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、及び、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)。

30

【0170】

本発明に関連して、用語「線虫類」は、ヒト又は動物に対して損傷を引き起こす線虫類も示している。

【0171】

ヒト又は動物に対して有害な特定の線虫種は、以下のものである：

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.)；

40

クキセンチュウ目 (*Tylenchida*) の、例えば：ミクロネマ属種 (*Micronema* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*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.)、シンドロファリンキス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum* s

50

pp.)、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
 ロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ネカトル (*Necator* spp.)、ブノストムム属種 (*Bu
 nostomum* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globocephalus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、シアトストマ属種 (*Cy
 athostoma* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、ム 10
 エレリウス属種 (*Muellerius* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、ネオストロンギルス属種 (*Neostron
 gylus* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、
 プネウモストロンギルス属種 (*Pneumostrongylus* spp.)、スピコ
 カウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、エラホストロンギルス属種 (*El
 aphostrongylus* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Parel
 aphostrongylus* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* s
 pp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、オスレルス
 属種 (*Oslerus* spp.)、アンギオストロンギルス属種 (*Angiostro
 ngylus* spp.)、アエルロストロンギルス属種 (*Aelurostrongy 20
 lus* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、パラフ
 イラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、トリコストロンギルス
 属種 (*Trichostrongylus* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemo
 nchus* 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 (*Ma
 rshallagia* spp.)、クーベリア属種 (*Cooperia* spp.)、
 ニッポストロンギルス (*Nippostrongylus* spp.)、ヘリグモソモイ
 デス (*Heligmosomoides* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nemato
 dirus* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostrongylus* sp
 p.)、オベリスコイデス属種 (*Obeliscoides* spp.)、アミドストム 30
 ム属種 (*Amidostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus*
 spp.) ;
 センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：オキシウリス属種 (*Oxyur
 is* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、パスルル
 ス属種 (*Passalurus* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* sp
 p.)、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 (*Anisaki 40
 s* spp.) アスカリジア属種、 (*Ascaridia* spp.)、グナトストマ属
 種 (*Gnathostoma* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physalopte
 ra* spp.)、テラジア属種 (*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.)、ドラスキア属種 (*Dra
 schia* 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* sp
 p.)、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.)、ブルギア 50

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 (*Spirocerca* spp.)。

【0172】

多くの種類の既知殺線虫剤は、別の寄生性蠕虫類に対しても活性を示し、従って、ヒト及び動物における寄生虫である蠕虫類（これらは、必ずしも線虫の群に属する必要はない）を防除するために使用される。本発明は、式 (I) で表される化合物の駆虫薬としての使用にも関する。病原性を有する内部寄生性蠕虫類としては、扁形動物門 (*Platyhelmintha*) [例えば、単生類 (*monogenea*)、条虫類 (*cestodes*) 及び吸虫類 (*trematodes*)]、鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) 及び舌形動物門 (*Pentastoma*) などがある。以下の蠕虫類を、例として及び好ましいものとして、挙げる事ができる：

単生類 (*Monogenea*) : 例えば：ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* 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 (*Pseudophyllidea*) 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 (*Schistocephalus* spp.)、リグラ属種 (*Ligula* spp.)、ボトリジウム属種 (*Bothridium* spp.)、ジプロゴノポルス属種 (*Diplogonoporus* spp.) ;

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllyda*) 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 (*Anoplocephala* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* 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 (*Stilesia* 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 (*Echinococcus* 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 (*Raillietina* 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 (*Echinocotyle* 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 (*Brachylaima* 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 (*Echinocasmus* spp.)、ヒポデラエウム属種 (*Hypoderaeum* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス属種 (*Fascioloides* spp.)、ファシオロブシス属種 (*Fasciolo*

10

20

30

40

50

psis 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 (Catatropis 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.);

10

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.);

20

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) : シタムシ目 (Porocephalida) の、例えば：リングアツラ属種 (Linguatula spp.)。

30

【0173】

獣医学の分野において、また、畜産において、式 (I) で表される化合物の投与は、既知方法で、直接行うか、又は、適切な使用形態で、経腸的に、非経口的に、経皮的に若しくは経鼻的に行う。投与は、予防的又は治療的であり得る。

【0174】

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。

40

【0175】

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

50

、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。

【0176】

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合物を含有する。

10

20

【0177】

好ましいのは、補助剤〔例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤(spontaneity promoter)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤(frost protection agent)、殺生物剤、増粘剤及び/又は他の補助剤(例えば、アジュバント)など〕を含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的効果を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

【0178】

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。

【0179】

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。

40

【0180】

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

【0181】

50

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。

【 0 1 8 2 】

原則として、適切な全ての溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、鉱油留分、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。

【 0 1 8 3 】

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、本質的に、以下のものを挙げるができる： 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、アルムナ及び天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及びノ又は、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ができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

【 0 1 8 4 】

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。特に適しているのは、標準温度及び大気圧下では気体である増量剤又は担体、例えば、エアゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、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。

【 0 1 8 5 】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及びノ若しくは泡形成剤、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、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリー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、アリールスルホネート類、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種類及びノ又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

10

20

30

40

50

【0186】

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は、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー (Prussian Blue)、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などである。

【0187】

存在させ得る付加的な成分は、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。

10

【0188】

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

【0189】

適切な場合には、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤及び展着剤である。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。

20

【0190】

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。

【0191】

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 (coconut fatty ethoxylate) (10) 若しくはイソトリデシルエトキシレート (12)、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート (15)、又は、アンモニウム塩及び/若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げる

30

40

【0192】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量% ~ 98重量%の式 (I) で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.01重量% ~ 95重量%の式 (I) で表される化合物を含んでおり、最も好ましくは、0.5重量% ~ 90重量%の式 (I) で表される化合物を含んでいる。

【0193】

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、0.00000001重量% ~

50

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。

【0194】

混合物

式(I)で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、又は、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、殺微生物剤、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤(phytonic)、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質及び/又は植物成長調節剤との混合物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、渇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。

10

【0195】

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、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。

20

【0196】

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。

【0197】

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、それらの形態は、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。

30

【0198】

殺虫剤/殺ダニ剤/殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化化合物は、既知であり、そして、例えば、「The Pesticide Manual」16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「http://www.alanwood.net/pesticides」)。

40

【0199】

(1) アセチルコリンエステラーゼ(AChE)阻害薬、例えば、

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

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

50

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、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、O - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン - メチル、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、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；

10

(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、シベルメトリン、アルファ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベルメトリン、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 (pyrethrum))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [(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、

20

30

DDT；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；

40

(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；

50

- (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、テブフェノジド；
- (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、
テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシ
フェン、及び、スピロテトラマト；
- (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 I I 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、シアントラニリプロール、及び、フルベンジアミド。

【0200】

さらなる活性化合物、例えば、アフィドピロペン、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、フルエンズルホン、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、メペルフルトリン、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) に基づくさらなる調製物 (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 (WO2006/003494 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 (WO2004/099160 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-(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 (WO2009/002809 から既知)、2-[2-({[3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-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 (WO2005/085216 から既知)、2-[2-({[3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)-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 (WO2005/085216 から既知)、2-[2-(

10

20

30

40

50

{ [3 - ブロモ - 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 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、2 - [3 , 5 - ジブロモ - 2 - ({ [3 - ブロモ - 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 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 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 2 0 1 0 / 0 6 9 5 0 2 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 - ブロモ - 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 1 0 2 0 5 7 9 2 5 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 2 0 1 2 / 0 3 4 4 7 2 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 2 0 1 0 / 1 2 9 5 0 0 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 2 0 0 9 / 0 8 0 2 5 0 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 2 0 1 2 / 0 2 9 6 7 2 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 2 0 0 9 / 0 9 9 9 2 9 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 2 0 0 9 / 0 9 9 9 2 9 から既知)、(5 S , 8 R) - 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 2 0 1 0 / 0 6 9 2 6 6 から既知)、(2 E) - 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 2 0 1 0 / 0 6 0 2 3 1 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 1 0 1 3 3 7 9 4 0 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 2 0 0 8 / 1 3 4 9 6 9 から既知)。

【 0 2 0 1 】

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

【 0 2 0 2 】

(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 . 1 0) ドデモルフ、(1 . 1 1) 酢酸ドデモルフ、(1 . 1 2) エポキシコナゾール、(1 . 1 3) エタコナゾール、(1 . 1 4) フェナリモール、(1 . 1 5) フェンブコナゾール、(1 . 1 6

)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)オキシボコナゾール、(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)ピニコナゾール、(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)プロポキシ]}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)プロポキシ]}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、(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、(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、(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-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.26)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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.27)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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.28)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、(2.29)ベンゾペンジフルピル、(2.30)N-[(1S,4R)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-

10

20

30

40

50

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、(2.31) N - [(1R, 4S) - 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、(2.32) 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、(2.33) 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、(2.34) 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、(2.35) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3R) - 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、(2.36) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3S) - 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、(2.37) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.38) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.39) 1, 3, 5 - トリメチル - N - [(3R) - 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、(2.40) 1, 3, 5 - トリメチル - N - [(3S) - 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、(2.41) ベノダニル、(2.42) 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、(2.43) 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) アゾキシストロピン、(3.4) シアゾファミド、(3.5) クメトキシストロピン (coumethoxytrobilin)、(3.6) クモキシストロピン、(3.5) ジモキシストロピン、(3.8) ネンストロプリン、(3.9) ファモキサドン、(3.10) フェンアミドン、(3.11) フルフェノキシストロピン (flufenoxystrobilin)、(3.12) フルオキサストロピン、(3.13) クレソキシム - メチル、(3.14) メトミノストロピン、(3.15) オリサストロピン、(3.16) ピコキシストロピン、(3.17) ピラクロストロピン、(3.18) ピラメトストロピン、(3.19) ピラオキシストロピン、(3.20) ピリベンカルブ、(3.21) トリクロピリカルブ、(3.22) トリフロキシストロピン、(3.23) (2E) - 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、(3.24) (2E) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - (2 - { [({ (1E) - 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 - フェニルエテニル] オキシ } フェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) メチル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルエタンアミド、(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 - 1 H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキ

10

20

30

40

50

サミド、(3.29) 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2 - { [({ (1 E) - 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 - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - オン、(3.30) (2 E) - 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) ゴキサミド、(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) フルオロホルベット、(5.16) ホルベット、(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 (z i n c m e t i r a m)、(5.27) オキシシン銅 (c o p p e r - o x i n e)、(5.28) プロパミジン (p r o p a m i d i n e)、(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 (l a m i n a r i n) ;

(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) プラストサイジン - 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) ポリオキシシン、(9.7) ポリオキシソリム、(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 (c h l o r n e b)、(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 (i o d o c a r b)

10

20

30

40

50

、(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)カルプロバミド、(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(kiralaxyl))、(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)オキソリン酸、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)ピナバクリル、(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)メプチルジノカップ(131-72-6)；

(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)リン酸及びその塩、(15.42)プロパモカルブ-ホセチレート(propamocarb-fosetilate)、(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

10

20

30

40

50

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 - オクチル[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリミジン - 7 - アミン、(15.77) (2Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリル酸エチル、(15.78) 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、(15.79) 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、(15.80) 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、(15.81) N - [(5 - プロモ - 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、(15.82) N - [

10

20

30

40

50

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、 (15 . 83) 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、 (15 . 84) 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、 (15 . 85) 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、 (15 . 86) 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、 (15 . 87) 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、 (15 . 88) 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、 (15
 . 89) 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、 (15 . 90) { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェ
 ニル) メチリデン] 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、 (15 . 91) フェナジン - 1 - カルボン酸、 (15 . 92) キノリン - 8 - オー
 ル、 (15 . 93) キノリン - 8 - オールスルフェート (2 : 1)、 (15 . 94) { 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、 (15 . 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) ピ
 フェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15 . 96) N - (4
 ' - クロロピフェニル - 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、 (15 . 97) N - (2 ' , 4 ' - ジクロロピフェニ
 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、 (15 . 98) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (ト
 リフルオロメチル) ピフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、
 (15 . 99) N - (2 ' , 5 ' - ジフルオロピフェニル - 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、 (15 . 100)
 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル)
 ピフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15 . 101) 5
 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェ
 ニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (15 . 102) 2 - クロロ
 - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ピフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド
 、 (15 . 103) 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) 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 . 104) 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、 (1
 5 . 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

10

20

30

40

50

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-1H-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.
 112)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-1H-ピラゾール-4-カル
 ボキサミド、(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-1H-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、(1
 5.115)(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-1H-テトラゾール-5-イル
)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメート
 、(15.119)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(1H)-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-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15.122)1,3-ジメチル-N-[(3R)-1,
 1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(15.123)1,3-ジメチル-N-[(3S)-1,
 1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾ
 ール-4-カルボキサミド、(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-3H-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}-1H-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}-1H-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-3H-1,
 2,4-トリアゾール-3-チオン、(15.131)2-{[rel(2R,3S)-
 3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イ
 ル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1
 5.132)2-{[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,
 4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-
 1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(15.133)1-{[rel(2R,3S)
]-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2
 -イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(15
 .134)1-{[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4

- ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル} - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、 (15 . 135) 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、 (15 . 136) 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、 (15 . 137) 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、 (15 . 138) 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、 (15 . 139) 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、 (15 . 140) 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、 (15 . 141) 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、 (15 . 142) 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、 (15 . 143) 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、 (15 . 144) 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、 (15 . 145) 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、 (15 . 146) 2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル) キナゾリン、 (15 . 147) 2 - [6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル] キナゾリン、 (15 . 148) 3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、 (15 . 149) アブシジン酸、 (15 . 150) 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、 (15 . 151) 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、 (15 . 152) 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、 (15 . 153) 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、 (15 . 154) N' - { 5 - プロモ - 6 - [(1 S) - 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 - プロモ - 6 - [(シス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (15 . 156) N' - { 5 - プロモ - 6 - [(トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (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 - 1 H - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 5 9) N - (2 - t e r t - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 0) N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 1) N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 2) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 3) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 4) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 5) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 6) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 7) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 8) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 6 9) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 0) N - (2 - t e r t - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 1) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 2) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 3) N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 4) N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 5) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 6) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド、 (1 5 . 1 7 7) 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 - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 8) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 7 9) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 8 0) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 5 . 1 8 1) 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン。

【 0203 】

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。

【 0204 】

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。

10

【 0205 】

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。

【 0206 】

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。

【 0207 】

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 F Z B 4 2 (D S M 2 3 1 1 7 9)、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 C N C M I - 1 5 6 2、又は、バシルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) 株 I - 1 5 8 2 (受託番号 C N C M I - 1 5 8 2)、又は、バシルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、株 G B 3 4 (受託番号 A T C C 7 0 0 8 1 4) 及び株 Q S T 2 8 0 8 (受託番号 N R R L B - 3 0 0 8 7)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*)、特に、株 G B 0 3 (受託番号 A T C C S D - 1 3 9 7)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*) 株 Q S T 7 1 3 (受託番号 N R R L B - 2 1 6 6 1)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*) 株 O S T 3 0 0 0 2 (受託番号 N R R L B - 5 0 4 2 1)、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 - 1 4) 株 A M 6 5 - 5 2 (受託番号 A T C C 1 2 7 6)、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 A B T S - 1 8 5 7 (S D - 1 3 7 2)、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 H D - 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 N B 1 7 6 (S D - 5 4 2 8)、パステウリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種 (*Pasteuria* spp.) (ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*) 線虫) - P R 3 (受託番号 A T C C S D - 5 8 3 4)、ストレプトミセス・マイクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) 株 A Q 6 1 2 1 (= Q R D 3 1 . 0 1 3、N R R L B - 5 0 5 5 0)、ストレプトミセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) 株 A Q 6 0 4 7 (受託番号 N R R L 3 0 2 3 2)。

20

30

40

【 0208 】

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 :

50

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)、メトスクニコウイア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に、株 NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (新: 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・アトロピリデ (*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)。

【0209】

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。

【0210】

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。挙げるができる例は、以下のものである：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種 (*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、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thus・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 (*Scleroderma* spp.)、スイルス属種 (*Suillus* spp.)

)、ストレプトミセス (*Streptomyces* spp.)。

【0211】

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

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

10

20

【0212】

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、クロキントセプト (-メキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミド、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)。

30

【0213】

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)などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などである。収穫物、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation materia

40

50

1) 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。

【0214】

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。

10

【0215】

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

20

【0216】

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壤中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開能力、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形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、特定の除草活性化化合物 (例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシン) に対する植物の向上した耐性である (例えば、「PAT」遺伝子)。望まれる当該特性 (「形質」) を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。挙げることができるトランスジェニック植物の例としては、重要な作物

30

40

50

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、柑橘類果実を有するもの及びブドウの木）などであり、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。

【0217】

作物保護 - 処理の種類

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

10

【0218】

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、当該害虫の発生のレベルに従って適合させるべきである。

20

【0219】

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、灌注（drenching）によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させる〔即ち、植物の成育場所（例えば、土壌、又は、水耕系）に式（I）で表される化合物の液体形態を含浸させる〕ことによって、又は、土壌施用〔即ち、式（I）で表される化合物を固体形態で（例えば、顆粒形態で）植物の成育場所に導入する〕ことによって、達成することができる。水稻作物の場合には、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。

30

【0220】

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、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。

40

【0221】

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

50

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。

【0222】

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。

【0223】

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。

10

【0224】

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。

20

【0225】

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。

【0226】

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。

【0227】

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。

30

【0228】

さらに、式(I)で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、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。

【0229】

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

40

【0230】

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、この

50

場合、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。

【0231】

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。

10

【0232】

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。

20

【0233】

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。

【0234】

式 (I) で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換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。

【0235】

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

30

【0236】

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ることができる。

40

【0237】

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に使用される、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。

【0238】

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に使用される非イオン性、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。

50

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。

【0239】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣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中に関して慣習的に使用される全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用する。

【0240】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣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ことができる。

【0241】

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

【0242】

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

【0243】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣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(c f . R . Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" vol . 2 , Springer Verlag , 1970 , pp . 401 - 412) 。

【0244】

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

【0245】

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、そのまま添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

10

20

30

40

50

【0246】

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。

【0247】

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。

10

【0248】

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。

【0249】

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。

20

【0250】

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。

【0251】

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。

【0252】

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。

30

【0253】

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。

【0254】

動物衛生の分野に関連して、用語「防除する(control)」又は「防除する(controlling)」は、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。

40

【0255】

節足動物としては、以下のものを挙げることができる：

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

50

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。

【0256】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げるができる :

ダニ亜綱 (*Acarari* (*Acarina*)) 及びメタスティグマタ目 (*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 (ポオフィルス) 属種 (*Rhipicephalu*

s (*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.)。

【0257】

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*)；ハルトマネリダエ科 (*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. aden*

oides)、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・克蘭ダリス(E. crandalis)、エイメリア・デブリエクキ(E. debliecki)、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. ellipsoidales)、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. hagai)、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. iroquoina)、エイメリア・イレシズア(E. irresidua)、エイメリア・ラベアナ(E. labbeana)、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・バルバ(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. piriiformis)、エイメリア・ブラエコキス(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・ステイダイ(E. stiedai)、エイメリア・スイス(E. suis)、エイメリア・テナラ(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. truttiae)、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、トキソプラズマ・ゴンジイ(Toxoplasma gondii)、ハモンジア・ヘイドルニイ(Hammondia heydornii)、ネオスポラ・カニヌム(Neospora caninum)、ベスノイチア・ベスノイチイ(Besnoitia besnoitii); 例えば、肉胞子虫科(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. bovi-hominis)、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・ニューロナ(S. neurona)、サルコシスチス属種(S. spec.)、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(Leucozoidae)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ(L

eucozytozoon simondi); 例え、プラズモディウム科 (*Plasmodiidae*)、例え、プラズモジウム・ベルゲイ (*Plasmodium berghei*)、プラズモジウム・ファルシパルム (*P. falciparum*)、プラズモジウム・マラリアエ (*P. malariae*)、プラズモジウム・オバレ (*P. ovale*)、プラズモジウム・ビバキス (*P. vivax*)、プラズモジウム属種 (*P. spec.*); 例え、ピロプラズマ亜目 (*Piroplasmea*)、例え、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. spec.*)、テイレリア・パルバ (*Theileria parva*)、テイレリア属種 (*Theileria spec.*); 例え、アデレア亜目 (*Adeleina*)、例え、ヘパトゾオン・カニス (*Hepatozoon canis*)、ヘパトゾオン属種 (*H. spec.*)。

10

【0258】

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 (*Platyhelmintha*) [例え、単生類 (*Monogenea*)、条虫類 (*cestodes*) 及び吸虫類 (*trematodes*)]、線形動物 (*nematodes*)、鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) 及び舌形動物門 (*Pentastoma*) などがある。さらなる蠕虫類としては、以下のものを挙げるができる:

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

20

条虫類 (*Cestodes*): ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllidea*) の、例え: 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 (*Schistocephalus spp.*)、リグラ属種 (*Ligula spp.*)、ボトリジウム属種 (*Bothridium spp.*)、ジプロゴノポルス属種 (*Diplogonoporus spp.*);

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllide*) の、例え: メソセストイデス属種 (*Mesocestoides spp.*)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala spp.*)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala 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 (*Stilesia 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 (*Echinococcus 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 (*Raillietina 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 (*Echinocotyle 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.*);

30

40

吸虫類 (*Trematodes*): 二生亜綱 (*Digenea*) の、例え: 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

50

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 (*Brachyla
ima* 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 (*Hypoderae
um* 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 (*Fasciolop
sis* 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 (*P
aramphistomum* spp.)、カリコホロン属種 (*Calicophoro
n* 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 (*Fi
schoederius* spp.)、ガストロチラクス属種 (*Gastrothyla
cus* spp.)、ノトコチルス属種 (*Notocotylus* spp.)、カタト
ロピス属種 (*Catatropis* spp.)、ブラギオルキス属種 (*Plagior
chis* 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 (*Nanophyetu
s* 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.)
、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 (*Micro
nema* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp
.) ;

カンセンチュウ目 (*Rhabditida*) の、例えば：ストロンギルス属種 (*Str
ongylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophoru
s* 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 (*G
yalocephalus* spp.)、シリンドロファリンキス属種 (*Cylindr
opharynx* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum
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
ム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chaber
tia* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、アン
シロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncin
aria* 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 (*Syng
amus* spp.)、シアトストマ属種 (*Cyathostoma* spp.)、メタ
ストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ジクチオカウルス属
種 (*Dictyocaulus* spp.)、ムエレリウス属種 (*Muellerius
spp.*)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.
.)、ネオストロンギルス属種 (*Neoststrongylus* spp.)、シストカウル
ス属種 (*Cystocaulus* spp.)、プネウモストロンギルス属種 (*Pneu*

10

20

30

40

50

mostrostrongylus spp.)、スピコカウルス属種 (Spicocaulus spp.)、エラホストロンギルス属種 (Elaphostrostrongylus spp.)、パレラホストロンギルス属種 (Parelaphostrostrongylus spp.)、クレノソマ属種 (Crenosoma spp.)、パラクレノソマ属種 (Paracrenosoma spp.)、アングオストロンギルス属種 (Angiostrongylus spp.)、アエルロストロンギルス属種 (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.)、トリコストロンギルス属種 (Trichostrongylus spp.)、ハエモンクス属種 (Haemonchus spp.)、オステルタギア属種 (Ostertagia spp.)、マルシャラギア属種 (Marshallagia spp.)、クーペリア属種 (Cooperia spp.)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、ヒオストロンギルス属種 (Hyostrostrongylus spp.)、オベリスコイデス属種 (Obeliscooides spp.)、アミドストムム属種 (Amidostomum spp.)、オルラヌス属種 (Ollulanus spp.) ;

センビセンチュウ目 (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.)、アスカリジア属種 (Ascaridia spp.)、グナトストマ属種 (Gnathostoma spp.)、フィサロプテラ属種 (Physaloptera spp.)、テラジア属種 (Thelazia spp.)、ゴンギロネマ属種 (Gongylonema spp.)、ハプロネマ属種 (Habronema spp.)、パラプロネマ属種 (Parabronema spp.)、ドラスキア属種 (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.)、ブルギア属種 (Brugia spp.)、ウケレリア属種 (Wuchereria spp.)、オンコセルカ属種 (Onchocerca 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.) ; サジヨ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.)。

【0259】

獣医学の分野において、及び、畜産において、式 (I) で表される化合物は、当技術分

10

20

30

40

50

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。

【0260】

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。

【0261】

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(helminthicidal 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、動物育種において、畜産業において、動物小屋の中で、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。

10

【0262】

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、畜産業において、動物育種において、動物小屋の中で、衛生学の分野において、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。

20

【0263】

駆虫性混合成分

以下の駆虫性混合成分を例として挙げる事ができる：

殺吸虫活性化合物(trematocidally active compound)及び殺条虫活性化合物(cestocidally active compound)を包含する駆虫活性化合物：

大環状ラクトン系の、例えば、アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン、エブリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシン、モキシデクチン、ネマデクチン、セラメクチン；

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

30

シクロオクタデプシペプチド系(cyclooctadepsipeptides)の、例えば、エモデプシド(emodepside)、PF1022；

アミノアセトニトリル誘導体系の、例えば、モネパンテル(monepantel)；

テトラヒドロピリミジン系の、例えば、モランテル、ピランテル、オキサニテル；

イミダゾチアゾール系の、例えば、ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

40

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

パラヘルクアミド系の、例えば、デルクアンテル、パラヘルクアミド；

アミノフェニルアミジン系の、例えば、アミダンテル、デアシル化アミダンテル(dAMD)、トリベンジミジン；

有機リン酸エステル系の、例えば、クマホス、クルホメート、ジクロルボス、ハロキソン、ナフタロホス(naphthalofos)、トリクロルホン；

置換フェノール系の、例えば、ピチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン(meniclopholan)、ニトロキシニル；

ピペラジノン系の、例えば、プラジクアンテル(praziquantel)、エブシ

50

ブランテル；

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

【0264】

媒介動物の防除

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

10

【0265】

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；

20

- ・ ブユ (Simuliidae)： 蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (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、野兔病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症 (borreliosis)；

30

(6) マダニ類： ボレリア症 (borrelioses)、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)。

【0266】

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。

【0267】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物及び/又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、例えば、蚊類 [特に、ヤブカ属 (Aedes) の蚊、ハマダラカ属 (Anopheles) の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ (A. gambiae)、アノフェレス・アラビエンシス (A. arabiensis)、アノフェレス・フネスツス (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。

40

【0268】

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。

【0269】

50

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。

【 0 2 7 0 】

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。

【 0 2 7 1 】

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。

【 0 2 7 2 】

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。

【 0 2 7 3 】

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。

【 0 2 7 4 】

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

【 0 2 7 5 】

衛生分野における害虫の防除

式 (I) で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内保護の分野において、衛生保護の分野において、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。

【 0 2 7 6 】

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

10

20

30

40

50

ワラジムシ目 (Isopoda) の害虫などをあげることができる。

【0277】

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

10

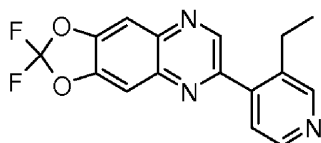
【0278】

[実施例]

調製実施例：

調製実施例 1：6 - (3 - エチルピリジン - 4 - イル) - 2, 2 - ジフルオロ [1, 3] ジオキソロ [4, 5 - g] キノキサリン (I - 1)

【化29】



20

【0279】

20 mL のエタノールの中の 100 mg (0.532 mmol) の 2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5, 6 - ジアミンと 180 mg (0.583 mmol) の 4 - (プロモアセチル) - 3 - エチルピリジニウムブロミド (III - 01) を環流しながら 18 時間攪拌し、次いで、溶媒を減圧下で除去する。その残渣を濃アンモニアを用いてアルカリ性とし、次いで、ジクロロメタンで抽出する。その有機相を合して分離し、硫酸マグネシウムで脱水し、溶媒を減圧下で除去する。

【0280】

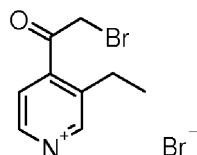
移動相としてシクロヘキサン / 酢酸エチル (1 : 1 v / v) を使用するシリカゲル 60 (Merck) でのカラムクロマトグラフィーで精製して、21 mg の生成物がベージュ色の固体 (理論値の 12.5%、LC / MS による純度 93%) として得られる。

30

【0281】

4 - (プロモアセチル) - 3 - エチルピリジニウムブロミド (III - 01) の調製

【化30】



40

【0282】

500 mg (3.35 mmol) の 1 - (3 - エチルピリジン - 4 - イル) エタノンを 15 mL のクロロホルムに溶解させ、5 mL のクロロホルムに溶解させた 600 mg (3.76 mmol) の臭素を添加した後、室温で 18 時間攪拌する。次いで、その混合物を 40 でさらに 2 時間攪拌し、溶媒を減圧下で除去する。1 g (理論値の 96.6%、¹H - NMR による純度約 85%) の生成物が暗褐色の固体として残る。

【0283】

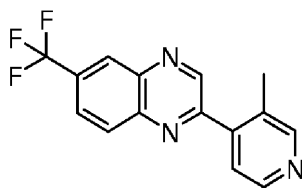
¹H - NMR (D₆ - DMSO) ppm : 8.74 - 8.68 (m, 2H), 7.85 - 7.84 (m, 1H), 4.94 (s, 2H), 2.73 (q, 2H), 1.17 (t, 3H)。

50

【0284】

調製実施例 2 : 2 - (3 - メチルピリジン - 4 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) キノキサリン (I - 2)

【化 3 1】



10

【0285】

室温で、30 mL のジオキサンの中の 190 mg (0.82 mmol) の 2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) キノキサリン (V I I - 0 1) と 110 mg (0.157 mmol) のビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (I I) ジクロリドを 3 時間攪拌する。

【0286】

次いで、170 mg (1.24 mmol) の (3 - メチルピリジン - 4 - イル) ボロン酸及び 3.5 mL の 2 モル炭酸ナトリウム溶液を添加し、その混合物を環流しながら 18 時間加熱する。冷却後、水を添加し、その反応混合物をジクロロメタンで抽出する。その有機相を合して $MgSO_4$ で脱水し、溶媒を減圧下で除去する。

20

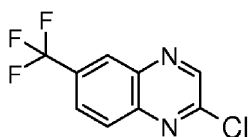
【0287】

移動相としてシクロヘキサン / 酢酸エチル (1 : 1 v / v) を使用するシリカゲル 60 (Merck) のカラムクロマトグラフィーで精製して、39.2 mg の生成物がベージュ色の固体 (理論値の 24.2%、LC / MS による純度 94.6%) として得られる。

【0288】

2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) キノキサリン (V I I - 0 1) の調製

【化 3 2】



30

【0289】

30 mL のトルエンの中の 1.40 g (6.54 mmol) の 6 - (トリフルオロメチル) キノキサリン - 2 (1 H) - オン (V I a - 0 1) と 2.1 g (16.25 mmol) の N - エチルジイソプロピルアミンに、8.4 g (54.78 mmol) の塩化ホスホリルを滴下して加え、その混合物を 95 °C でさらに 18 時間攪拌する。ロータリーエバポレーションに付した後で残った残渣を水と一緒に攪拌し、固体炭酸カリウムを用いてアルカリ性とし、ジクロロメタンで抽出する。その有機相を合して分離し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で除去する。これによって、1.37 g の生成物 (理論値の 90.1%、¹H - NMR による純度 90%) が残渣として残る。

40

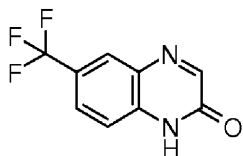
【0290】

¹H - NMR (D_6 - DMSO) ppm : 9.17 (s , 1 H) , 8.57 (s , 1 H) , 8.29 - 8.28 (m , 1 H) , 8.22 - 8.20 (m , 1 H) 。

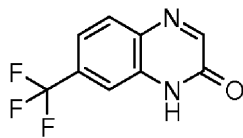
【0291】

6 - (トリフルオロメチル) キノキサリン - 2 (1 H) - オン (V I a - 0 1) 及び 7 - (トリフルオロメチル) キノキサリン - 2 (1 H) - オン (V I a - 0 2) の調製

【化33】



(VIa-01)



(VIa-02)

【0292】

10

7.30 g (41.4 mmol) の 4-(トリフルオロメチル)ベンゼン-1,2-ジアミン及び 5.9 g (64.1 mmol) のグリオキシル酸水和物を 100 mL のイソプロパノールの中に入れ、2 g の酢酸を添加した後、50 で 18 時間攪拌し、次いで、溶媒を減圧下で除去する。その残渣を水と一緒に攪拌し、固体を吸引濾過する。残っているものは、38.9% (VIa-01) と 61.1% (VIa-02) からなる 7.8 g (理論値の 87.9%) の異性体混合物である。その異性体は、分取 HPLC で分離させる。注入体積：いずれの場合にも、1 g の異性体混合物を取って 21 mL のアセトニトリル / 35 mL の水 / 7 mL の THF の中に入れ、濾過後、Chromasil 100 (C18 7 μm 250 × 50 mm 32 / 68 アセトニトリル / 水 無勾配、流量：100 mL / 分) で分離させる。

20

【0293】

総量で 1.4 g (VIa-01) (理論値の 15.8%、HPLC による純度 97.7%) 及び 3.8 g (VIa-02) (理論値の 42.8%、HPLC による純度 97.7%) が単離される。

【0294】

(VIa-01) : ¹³C-NMR (D₆-DMSO) ppm : 154.8, 153.5, 134.8, 131.2, 126.9, 125.9, 123.4, 116.9 ;

log P (中性) : 1.71 ;

(VIa-02) : ¹³C-NMR (D₆-DMSO) ppm : 154.6, 154.5, 133.7, 132.0, 130.1, 130.0, 119.2, 112.7 ;

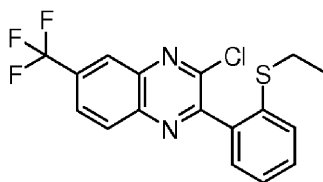
30

log P (中性) : 1.65。

【0295】

調製実施例 3 : 3-クロロ-2-[2-(エチルスルファニル)フェニル]-6-(トリフルオロメチル)キノキサリン(I-3)

【化34】



40

【0296】

室温で、20 mL のジオキサンの中の 100 mg (0.374 mmol) の 2,3-ジクロロ-6-(トリフルオロメチル)キノキサリンと 35 mg (0.05 mmol) のビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリドを 2 時間攪拌する。

【0297】

次いで、75 mg (0.412 mmol) の [2-(エチルスルファニル)フェニル]ボロン酸及び 1.7 mL の 2 モル炭酸ナトリウム溶液を添加し、その混合物を環流しながら 18 時間加熱する。冷却後、水を添加し、その反応混合物をジクロロメタンで抽出する。その有機相を合して MgSO₄ で脱水し、溶媒を減圧下で除去する。

50

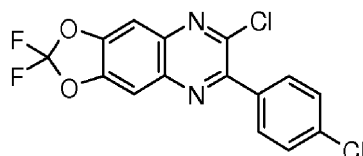
【0298】

移動相としてシクロヘキサン/酢酸エチル(1:1 v/v)を使用するシリカゲル60(Merck)でのカラムクロマトグラフィーで精製して、7mgの生成物(理論値の5.1%、LC/MSによる純度100%)がえら得れる。

【0299】

調製実施例4: 6-クロロ-7-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロ[1,3]ジオキサソロ[4,5-g]キノキサリン(I-4)

【化35】



10

【0300】

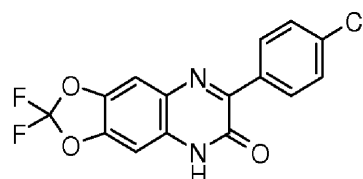
220mg(0.65mmol)の7-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロ[1,3]ジオキサソロ[4,5-g]キノキサリン-6(5H)-オン(VIb-01)及び150mg(1.09mmol)のトリエチルアミン塩酸塩に1g(6.52mmol)の塩化ホスホリルを滴下して加え、その混合物を95でさらに18時間攪拌する。ロータリーエバポレーションに付した後で残った残渣を水と一緒に攪拌し、固体炭酸カリウムを用いてアルカリ性とし、ジクロロメタンで抽出する。その有機相を合して分離し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で除去する。これによって、残渣として、97mgの生成物(理論値の41.8%、LC/MSによる純度84.6%)が褐色の固体として得られる。

20

【0301】

7-(4-クロロフェニル)-2,2-ジフルオロ[1,3]ジオキサソロ[4,5-g]キノキサリン-6(5H)-オン(VIb-01)の調製

【化36】



30

【0302】

20mLのイソプロパノールと5mLのジメチルホルムアミドと3mLの水の混合物の中の300mg(1.59mmol)の2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキサソール-5,6-ジアミンと300mg(1.63mmol)の(4-クロロフェニル)(オキソ)酢酸を100で18時間攪拌する。次いで、冷却後、溶媒を減圧下で留去する。その残渣を水と一緒に攪拌し、褐色の固体を吸引濾過する。

【0303】

残っているのは、450mgの生成物(理論値の83.8%)であり、これは、精製することなく、直接、さらに反応させる。

40

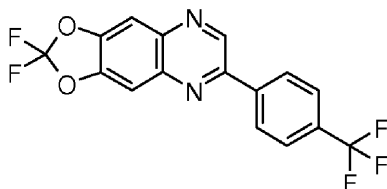
【0304】

log P(HCOOH): 2.96。

【0305】

調製実施例5: 2,2-ジフルオロ-6-[4-(トリフルオロメチル)フェニル][1,3]ジオキサソロ[4,5-g]キノキサリン(I-5)

【化 3 7】



【 0 3 0 6 】

5 mL のジメチルホルムアミドと 1 mL の水の混合物の中の 200 mg (1 . 0 6 mmol) の 2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 , 6 - ジアミンと 220 mg (1 . 0 9 mmol) のオキソ [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] アセトアルデヒドを 130 で 18 時間攪拌する。次いで、冷却後、溶媒を減圧下で留去する。その残渣を水と一緒に攪拌し、暗褐色の固体を吸引濾過する。

10

【 0 3 0 7 】

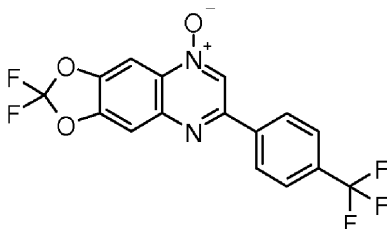
これによって、300 mg の生成物 (理論値の 79 . 7 % 、 LC / MS による純度 93 . 1 %) が残る。

【 0 3 0 8 】

調製実施例 6 : 2 , 2 - ジフルオロ - 7 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] [1 , 3] ジオキソロ [4 , 5 - g] キノキサリン 5 - オキシド (I - 6)

【化 3 8】

20



【 0 3 0 9 】

115 mg (0 . 33 mmol) の 2 , 2 - ジフルオロ - 6 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] [1 , 3] ジオキソロ [4 , 5 - g] キノキサリンと 3 g (30 . 87 mmol) の 35 % 強度過酸化水素水溶液を 7 mL の酢酸の中で 50 で 18 時間攪拌する。

30

【 0 3 1 0 】

冷却後、その混合物を水と一緒に攪拌し、得られた固体を吸引濾過する。

【 0 3 1 1 】

移動相として酢酸エチル / シクロヘキサン (勾配 13 - 50 % の酢酸エチル) を使用する 25 g の Chromabond フラッシュカラムでのカラムクロマトグラフィーで精製して、28 mg の生成物が白色の固体 (理論値の 23 . 3 % 、 LC / MS による純度 93 . 1 %) として得られる。

【 0 3 1 2 】

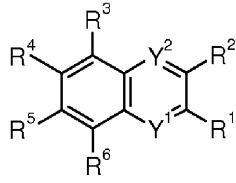
40

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) : 9 . 48 (s , 1 H) , 8 . 49 - 8 . 47 (m , 2 H) , 8 . 42 (s , 1 H) , 8 . 25 (s , 1 H) , 7 . 97 - 7 . 95 (m , 2 H) 。

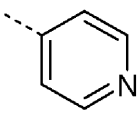
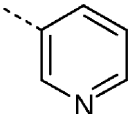
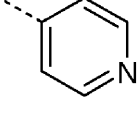
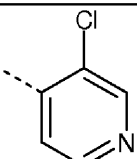
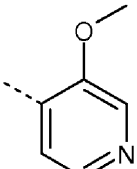
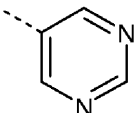
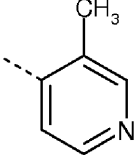
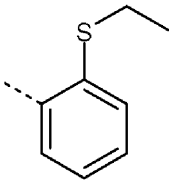
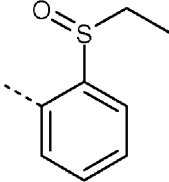
【 0 3 1 3 】

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

【表 1】



(I) 式中、Y¹=Y²=N

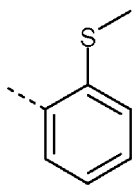
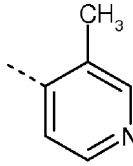
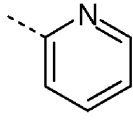
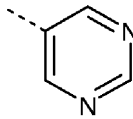
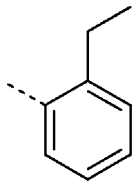
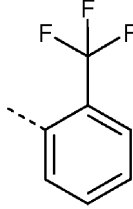
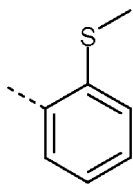
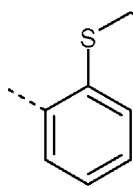
実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-7		H	H	CF ₃	H	H
I-8		H	H	CF ₃	H	H
I-9		H	H	H	CF ₃	H
I-10		H	H	CF ₃	H	H
I-11		H	H	CF ₃	H	H
I-12		H	H	CF ₃	H	H
I-13		H	H	H	-SO ₂ CH ₃	H
I-14		H	H	CF ₃	H	H
I-15		H	H	CF ₃	H	H

10

20

30

40

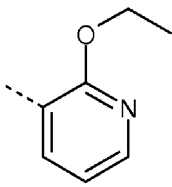
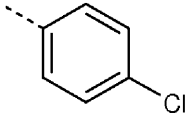
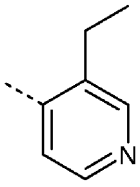
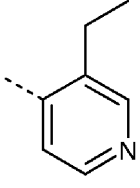
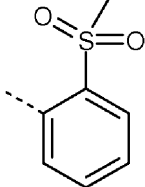
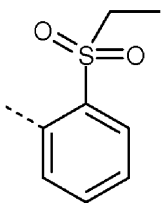
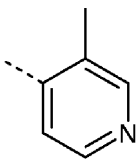
実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-16		H	H	CF ₃	H	H
I-17		H	H	Cl	H	H
I-18		H	H	CF ₃	H	H
I-19		H	H	Cl	H	H
I-20		H	H	Cl	H	H
I-21		H	H	Cl	H	H
I-22		H	H	Cl	H	H
I-23		H	H	Cl	H	H

10

20

30

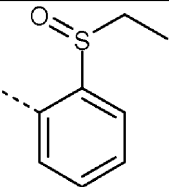
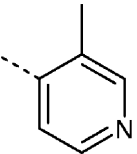
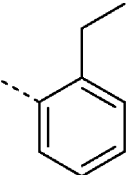
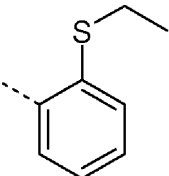
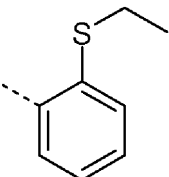
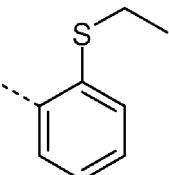
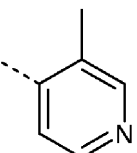
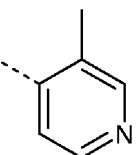
40

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-24		H	H	CF ₃	H	H
I-25		H	H	CF ₃	H	H
I-26		H	H	CF ₃	H	H
I-27		H	H	H	CF ₃	H
I-28		H	H	Cl	H	H
I-29		H	H	Cl	H	H
I-30		H	H	H	CF ₃	H

10

20

30

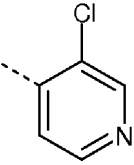
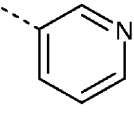
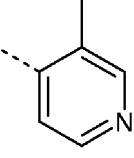
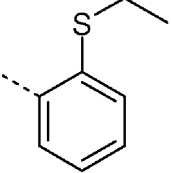
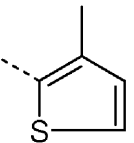
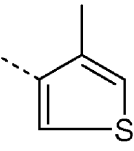
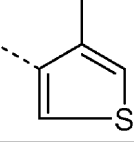
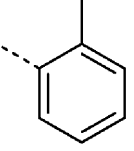
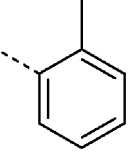
実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-31		H	H	Cl	H	H
I-32		H	H	-O-CF ₂ -O-		H
I-33		H	H	CF ₃	H	H
I-34		H	H	-O-CF ₂ -O-		H
I-35		H	H	H	-SO ₂ CH ₃	H
I-36		H	H	H	CF ₃	H
I-37		Cl	H	CF ₃	H	H
I-38		Cl	H	H	CF ₃	H

10

20

30

40

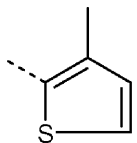
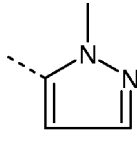
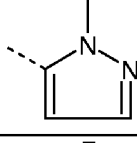
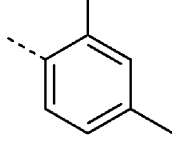
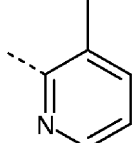
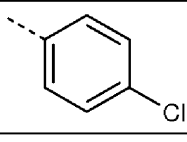
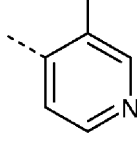
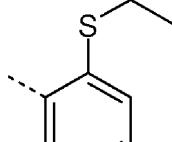
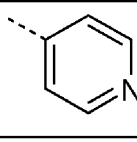
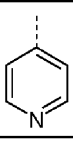
実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-39		H	H	Cl	H	H
I-40		H	H	Cl	H	H
I-41		H	H	Cl	Cl	H
I-42		H	H	Cl	Cl	H
I-43		H	H	H	CF ₃	H
I-44		H	H	H	CF ₃	H
I-45		H	H	CF ₃	H	H
I-46		H	H	CF ₃	H	H
I-47		H	H	H	CF ₃	H

10

20

30

40

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-48		H	H	CF ₃	H	H
I-49		H	H	CF ₃	H	H
I-50		H	H	H	CF ₃	H
I-51		H	H	H	CF ₃	H
I-52		H	H	CF ₃	H	H
I-53		Cl	H	H	CF ₃	H
I-56		H	H	CN	H	H
I-57		H	H	CN	H	H
I-58			H	CF ₃	H	H

10

20

30

40

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-59			H	-O-CF ₂ -O-		H
I-60		CH ₃	H	CF ₃	H	H
I-61		H	H	CN	H	H
I-62		H	H	H	CF ₃	H
I-63		H	H	F	F	H
I-64			H	CF ₃	H	H
I-65		CH ₃	H	F	F	H
I-66		CH ₃	H	CF ₃	H	H
I-67		CH ₃	H	-O-CF ₂ -O-		H

10

20

30

40

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-68			H	H	CF ₃	H
I-69		H	H	Cl	H	H
I-70		H	H	F	F	H
I-71		H	H	Cl	Cl	H
I-72		H	H	-O-CF ₂ -O-		H
I-73		H	H	Cl	Cl	H
I-74		H	H	-O-CF ₂ -O-		H

10

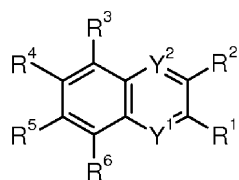
20

30

【 0 3 1 4 】

実施例 (I - 6) と同様にして、及び、上記で記載した調製方法に準じて、式 (I) で表される以下の化合物を得ることができる。

【表 2】



(I)

式中、Y¹=N 及び Y²=N⁺-O⁻

実施例 No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-54		H	H	H	CF ₃	H
I-55		H	H	CF ₃	H	H

10

20

【0315】

破線は、キノキサリン誘導体に対する結合を示している。

【0316】

NMRデータ及びlog P値：

log P (HCOOH) = log P [a] ; log P (中性) = log P [b]

【表 3】

実施例 No.	LogP[b]	LogP[a]	NMR [δ ppm]
I-1	3,23	2,34	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,18(s,1H), 8,68(s,1H), 8,62-8,61(m,1H), 8,18(s,1H), 8,14(s,1H), 7,62-7,61(m,1H), 2,84-2,81(q,2H), 1,09(t,3H)
I-2	2,89	2,14	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,41(s,1H),), 8,68(s,1H), 8,65-8,64(m,1H), 8,59(s,1H),8,41-8,39(m,1H), 8,22-8,20(m,1H), 7,73-7,72(m,1H), 2,50(s,3H, DMSO シグナルの中)
I-3		5,20	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 8,60-8,58(m,1H), 8,40-8,35(m,1H), 8,26-8,20(m,1H), 7,65-7,63(m,1H), 7,59-7,53(m,2H), 7,46-7,42(m,1H), 2,92-2,87(q,2H), 1,11(t,3H)
I-4		5,27	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 8,20-8,16(m,2H), 7,88-7,86(m,2H), 7,66-7,64(m,2H)
I-5		5,02	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,65(s,1H), 8,54-8,52(m,2H), 8,15-8,13(m,2H), 7,98-7,96(m,2H)
I-6		4,12	¹³ C-NMR(D ₆ -DMSO): 151,8; 146,5; 145,2; 142,8; 138,6; 133,7; 130,6; 128,0; 127,8; 125,9; 124,0; 108,9; 98,7
I-7	2,75	2,17	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,84(s,1H), 8,88-8,86(m,2H), 8,58(s,1H), 8,45-8,42(m,1H), 8,36-8,34(m,2H), 8,22-8,20(m,1H)
I-8		2,46	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,83(s,1H), 9,56-9,55(m,1H), 8,81-8,72(m,2H), 8,57(s,1H), 8,40-8,37(m,1H), 8,17-8,14(m,1H), 7,69-7,66(m,1H)
I-9	2,75	2,13	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,84(s,1H), 8,87-8,86(m,2H), 8,60(s,1H), 8,41-8,40(m,1H), 8,34-8,33(m,2H), 8,20(m,1H)
I-10		3,27	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,48(s,1H), 8,92(s,1H), 8,80-8,79(m,1H), 8,62(s,1H), 8,46-8,43(m,1H), 8,27-8,24(m,1H), 7,88-7,86(m,1H)
I-11		2,59	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,55(s,1H), 8,70(s,1H), 8,56(s,1H), 8,48-8,47(m,1H), 8,42-8,40(m,1H), 8,20-8,18(m,1H), 7,86(m,1H), 4,05(s,3H)
I-12		2,33	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,87-9,86(m,1H), 9,73-9,72(m,2H), 9,41(m,1H), 8,60-8,58(m,1H), 8,44-8,39(m,1H), 8,22-8,18(m,1H)
I-13	1,34	0,72	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,44(s,1H), 8,71-8,66(m,3H), 8,46-8,44(m,1H), 8,38-8,36(m,1H), 7,75-7,74(m,1H), 3,43(s,3H),

10

20

30

40

実施例 No.	LogP[b]	LogP[a]	NMR [δ ppm]
			2,50(s,3H, DMSO シグナルの中)
I-14	4,78	4,80	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,35-9,34(m,1H), 8,54-8,51(m,1H), 8,39-8,34(m,1H), 8,19-8,16(m,1H), 7,74-7,56(m,3H), 7,47-7,43(m,1H), 2,96-2,91(q,2H), 1,14(t,3H)
I-15	2,78	2,79	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,74(s,1H), 8,58-7,79(m,7H), 3,64-3,57(m,1H), 3,04-2,95(m,1H), 1,28(t,3H)
I-16	4,31	4,45	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,38(s,1H), 8,50(s,1H), 8,40-8,37(m,1H), 8,19-8,16(m,1H), 7,75-7,74(m,1H), 7,60-7,58(m,2H), 7,43-7,39(m,1H), 2,46(s,3H)
I-17	2,58	1,69	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,28(s,1H), 8,65(s,1H), 8,63-8,61(m,1H), 8,32-8,29(m,1H), 8,22-8,20(m,1H), 7,99-7,96(m,1H), 7,70-7,68(m,1H), 2,46(s,3H)
I-18	3,75	3,72	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 10,03-10,02(m,1H), 8,87-8,86(m,1H), 8,61-8,55(m,2H), 8,42-8,38(m,1H), 8,21-8,09(m,2H), 7,67-7,63(m,1H)
I-19		2,01	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,74(s,1H), 9,68(s,1H), 9,38(s,1H), 8,29-8,23(m,2H), 7,99-7,96(m,1H), 7,65-7,55(m,1H)
I-20		4,73	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,16(s,1H), 8,26(m,1H), 8,16-8,14(m,1H), 7,96-7,93(m,1H), 7,60-7,58(m,1H), 7,52-7,38(m,3H), 2,79-2,73(q,2H), 1,10(t,3H)
I-21		4,17	¹ H-NMR(CDCl ₃): 8,99(s,1H), 8,19-8,18(m,1H), 8,11-8,09(m,1H), 7,88-7,86(m,1H), 7,79-7,61(m,4H)
I-22		4,08	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,24(s,1H), 8,26-8,25(m,1H), 8,16-8,14(m,1H), 7,95-7,92(m,1H), 7,71-7,69(m,1H), 7,57-7,56(m,2H), 7,41-7,37(m,1H), 2,45(s,3H)
I-23		4,56	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,21(s,1H), 8,25(m,1H), 8,17-8,15(m,1H), 7,95-7,92(m,1H), 7,69-7,53(m,3H), 7,44-7,40(m,1H), 2,95-2,90(q,2H), 1,14(t,3H)
I-24		4,59	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,63-9,62(m,1H), 8,53-8,52(m,1H), 8,41-8,34(m,3H), 8,18-8,14(m,1H), 7,29-7,25(m,1H), 4,54-4,48(q,2H), 1,39(t,3H)
I-25		4,99	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,78(s,1H), 8,53(s,1H), 8,45-8,41(m,2H),

10

20

30

40

実施例 No.	LogP[b]	LogP[a]	NMR [δ ppm]
			8,37-8,35(m,1H), 8,14-8,11(m,1H), 7,73-7,70(m,2H)
I-26	3,28	2,53	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,37(s,1H), 8,71(s,1H), 8,65-8,64(m,1H), 8,60(s,1H), 8,40-8,38(m,1H), 8,23-8,20(m,1H), 7,69-7,67(m,1H), 2,84(q,2H), 1,12(t,3H)
I-27			¹ H-NMR(CDCl ₃): 9,11(s,1H), 8,72(s,1H), 8,66(m,1H), 8,51(s,1H), 8,29(m,1H), 8,04-8,02(m,1H), 7,45-7,44(m,1H), 2,90-2,84(q,2H), 1,22(t,3H)
I-28	2,52	2,52	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,15(s,1H), 8,32-8,30(m,1H), 8,20-8,17(m,2H), 7,99-7,82(m,4H), 3,47(s,3H)
I-29	2,82	2,81	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,14(s,1H), 8,30(m,1H), 8,19-7,82(m,6H), 3,64-3,57(m,2H), 1,17(t,3H)
I-30	2,89	2,12	¹³ C-NMR(D ₆ -DMSO): 153,5; 151,8; 148,0; 147,7; 142,8; 142,0; 140,0; 131,4; 130,9; 127,2; 126,0; 125,9; 123,7; 123,5; 16,6
I-31	2,65	2,66	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,62(s,1H), 8,37-7,76(m,7H), 3,63-3,54(m,1H), 3,00-2,91(m,1H), 1,32(t,3H)
I-32	2,85	1,99	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,23(s,1H), 8,65(s,1H), 8,62-8,61(m,1H), 8,18-8,16(m,2H), 7,68-7,66(m,1H), 2,46(s,3H)
I-33	4,89	4,92	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,30-9,29(m,1H), 8,51(s,1H), 8,41-8,38(m,1H), 8,19-8,15(m,1H), 7,63-7,62(m,1H), 7,54-7,41(m,3H), 2,82-2,74(q,2H), 1,11(t,3H)
I-34		4,73	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,15(s,1H), 8,13(s,1H), 8,10(s,1H), 7,66-7,61(m,2H), 7,56-7,52(m,1H), 7,43-7,41(m,1H), 2,95-2,89(q,2H), 1,14(t,3H)
I-35	2,78	2,85	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,38(s,1H), 8,65-8,64(m,1H), 8,42-8,40(m,1H), 8,35-8,32(m,1H), 7,75-7,73(m,1H), 7,67-7,66(m,1H), 7,60-7,56(m,1H), 7,47-7,43(m,1H), 3,43(s,3H), 2,97-2,91(q,2H), 1,15(t,3H)
I-36		4,79	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,35(s,1H), 8,51(s,1H), 8,39-8,37(m,1H), 8,19-8,16(m,1H), 7,73-7,56(m,3H), 7,47-7,43(m,1H), 2,96-2,91(q,2H), 2,16-2,10(m,1H), 1,14(t,3H)
I-37		2,94	¹³ C-NMR(CD ₃ CN): 155,0; 152,6; 148,0; 148,6; 148,3;

10

20

30

40

実施例 No.	LogP[b]	LogP[a]	NMR [δ ppm]
			144,6; 142,9; 141,6; 133,2; 132,3; 131,8; 127,3; 124,7; 123,9; 16,5
I-38		2,88	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 8,67(s,1H), 8,63-8,61(m,2H), 8,40-8,38(m,1H), 8,29-8,26(m,1H), 7,56-7,55(m,1H) 2,19(s,3H)
I-39		2,99	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,35(s,1H), 8,90(s,1H), 8,77-8,76(m,1H), 8,33-8,32(m,1H), 8,25-8,23(m,1H), 8,02-7,99(m,1H), 7,85-7,84(m,1H)
I-40	2,43	2,01	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,70(s,1H), 9,51(m,1H), 8,78-8,77(m,1H), 8,71-8,68(m,1H), 8,26-8,20(m,2H), 7,96-7,93(m,1H), 7,67-7,63(m,1H)
I-41	3,29	2,51	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,31(s,1H), 8,66(s,1H), 8,64-8,62(m,1H), 8,55-8,53(m,2H), 7,70-7,69(m,1H), 2,46(s,3H)
I-42	5,48	5,38	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,24(s,1H), 8,49(s,1H), 8,45(s,1H), 7,70-7,63(m,2H), 7,59-7,54(m,1H), 7,45-7,41(m,1H), 2,96-2,90(q,2H), 1,14(t,3H)
I-43	4,66	4,65	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,43(s,1H), 8,42(s,1H), 8,32-8,30(m,1H), 8,09-8,06(m,1H), 7,82-7,81(m,1H), 7,17-7,16(m,1H), 2,69(s,3H)
I-44		4,57	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,53(s,1H), 8,52(m,1H), 8,44(s,1H), 8,33-8,31(m,1H), 8,10-8,07(m,1H), 7,44-7,43(m,1H), 2,61(s,3H)
I-45		4,57	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,52(s,1H), 8,54(m,1H), 8,47(m,1H), 8,30-8,28(m,1H), 8,14-8,11(m,1H), 7,44-7,43(m,1H), 2,61(d,3H)
I-46		4,48	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,33(s,1H), 8,55(s,1H), 8,37-8,34(m,1H), 8,19-8,16(m,1H), 7,70-7,68(m,1H), 7,51-7,41(m,3H), 2,47(s,3H)
I-47	4,41	4,47	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,34(s,1H), 8,53(s,1H), 8,40-8,37(m,1H), 8,17-8,15(m,1H), 7,70-7,68(m,1H), 7,50-7,41(m,3H), 2,47(s,3H)
I-48		4,67	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,42(s,1H), 8,47(s,1H), 8,27-8,25(m,1H), 8,13-8,10(m,1H), 7,84-7,83(m,1H), 7,18-7,16(m,1H), 2,70(s,3H)
I-49	3,05	3,07	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,57(s,1H), 8,50(s,1H), 8,36-8,34(m,1H), 8,18-8,15(m,1H), 7,68-7,67(d,1H), 7,41(d,1H), 4,36(s,3H)
I-50	3,00	3,02	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,58(s,1H), 8,54(s,1H), 8,35-8,33(m,1H), 8,14-8,11(m,1H), 7,67(d,1H), 7,40-7,39(d,1H), 4,36(s,3H)

10

20

30

40

実施例 No.	LogP[b]	LogP[a]	NMR [δ ppm]
I-51		4,97	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,46-9,45(m,1H), 8,54(s,1H), 8,38-8,36(m,1H), 8,17-8,14(m,1H), 8,04-8,00(d,1H), 7,34-7,29(m,2H), 2,45(s,3H)
I-52		3,69	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,64(s,1H), 8,69-8,68(m,1H), 8,55(s,1H), 8,38-8,36(m,1H), 8,20-8,18(m,1H), 7,92-7,90(m,1H), 7,54-7,51(m,1H), 2,70(s,3H)
I-53		5,31	¹ H-NMR(CDCl ₃): 8,37(m,1H), 8,28-8,26(m,1H), 8,00(m,1H), 7,86-7,85(m,2H), 7,55-7,53(m,2H)
I-54	4,00	4,04	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,07(m,1H), 8,66-8,65(m,1H), 8,58(s,1H), 8,14-8,11(m,1H), 8,05-8,01(m,1H), 7,32-7,28(m,2H), 2,43(s,3H)
I-55		1,59	¹³ C-NMR(D ₆ -DMSO): 155,5; 155,4; 139,8; 136,8; 135,9; 135,1; 132,2; 131,9; 131,0; 127,8; 127,2; 123,5; 116,6; 17,1
I-56	1,81	1,17	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,40(s,1H), 8,84-8,82(m,1H), 8,67-8,64(m,2H), 8,37-8,33(m,1H), 8,26-8,23(m,1H), 7,73-7,71(m,1H), 2,47(s,3H)
I-57	3,55	3,60	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,33(s,1H), 8,75(m,1H), 8,33-8,27(m,2H), 7,71-7,44(m,4H), 2,93(q,2H), 1,14(t,3H)
I-58		2,06	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 8,65-8,64(m,4H), 8,48-8,46(m,1H), 8,26-8,24(m,1H), 7,84-7,83(m,1H), 7,53-7,51(m,4H)
I-59		6,23	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 8,17(s,1H), 8,14(s,1H), 7,52-7,07(m,8H), 2,85-2,80(q,1H), 1,14(t,3H)
I-60		2,39	¹ H-NMR(CDCl ₃): 8,98(s,1H), 8,79-8,78(m,1H), 8,45(s,1H), 8,21-8,19(m,1H), 8,07-8,04(m,1H), 7,97-7,94(m,1H), 7,53-7,52(m,1H), 2,87(s,3H)
I-61		1,19	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,83(s,1H), 8,87-8,82(m,3H), 8,38 8,31(m,3H), 8,26-8,22(m,1H)
I-62		2,60	¹ H-NMR(CDCl ₃): 9,54(s,1H), 8,56-8,50(m,3H), 8,30-8,27(m,1H), 7,99-7,97(m,1H), 7,92-7,90(m,1H), 4,08(s,3H)
I-63		1,55	¹ H-NMR(CDCl ₃): 9,01(s,1H), 8,66(breit,2H), 7,96-7,89(m,2H), 7,49-7,47(m,1H), 2,49(s,3H)
I-64		4,03	¹ H-NMR(CDCl ₃): 8,56-8,52(m,2H), 8,30-8,28(m,1H), 8,02-

10

20

30

40

実施例 No.	LogP[b]	LogP[a]	NMR [δ ppm]
			7,99(m,1H), 7,46-7,44(m,2H), 7,33-7,26(m,4H), 2,04(s,3H)
I-65		1,58	¹ H-NMR(CDCl ₃): 8,65-8,64(m,2H), 7,86-7,81(m,2H), 7,23-7,21(m,1H), 2,54(s,3H), 2,15(s,3H)
I-66		2,15	¹ H-NMR(CDCl ₃): 8,67(s,1H), 8,65-8,63(m,1H), 8,42(m,1H), 8,23-8,21(m,1H), 7,97-7,93(m,1H), 7,25-7,23(m,1H), 2,60(s,3H), 2,17(s,3H)
I-67		2,02	¹ H-NMR(CDCl ₃): 8,65(s,1H), 8,62(m,1H), 7,67-7,66(m,2H), 7,22(m,1H), 2,54(s,3H), 2,15(s,3H)
I-68		3,94	¹³ C-NMR(CDCl ₃): 153,3; 152,4; 151,6; 147,4; 145,3; 142,4; 139,4; 136,1; 135,4; 131,8; 130,5; 130,3; 128,5; 126,9; 126,2; 123,5; 123,2; 16,2
I-69		3,52	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,76(s,1H), 8,68-8,67(m,1H), 8,42(s,1H), 8,34-8,25(m,3H), 8,01-7,98(m,1H)
I-70		2,72	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,35(s,1H), 8,91(s,1H), 8,78-8,77(m,1H), 8,36-8,31(m,2H), 7,84-7,83(m,1H)
I-71		3,78	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,38(s,1H), 8,91(s,1H), 8,79-8,78(m,1H), 8,59-8,58(m,2H), 7,85-7,84(m,1H)
I-72		3,24	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,31(s,1H), 8,90(s,1H), 8,77-8,76(m,1H), 8,21(m,2H), 7,84-7,83(m,1H)
I-73		2,53	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,74(s,1H), 8,86-8,84(m,2H), 8,55-8,53(m,2H), 8,30-8,29(m,2H)
I-74		1,98	¹ H-NMR(D ₆ -DMSO): 9,67(s,1H), 8,83-8,82(m,2H), 8,29-8,27(m,2H), 8,18-8,16(m,2H)

10

20

30

【0317】

log P値は、「EEC Directive 79/831 Annex V.A8」に従い、下記方法によって、逆相カラム(C18)を使用するHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)で測定する:

[a] 酸性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.1%水性ギ酸及びアセトニトリル(0.1%ギ酸含有)(10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配)を使用し、pH2.7で実施する。表中では、「log P(COOH)」と称されている。

40

【0318】

[b] 中性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.001モル炭酸水素アンモニウム水溶液及びアセトニトリル(10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配)を使用し、pH7.8で実施する。表中では、「log P(中性)」と称されている。

【0319】

較正は、log P値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン(3個~16個の炭素原子含有)を用いて実施する(log P値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間によって、保持時間に基づいて測定)。

50

【0320】

ラムダマックス値は、200 nm ~ 400 nmの紫外線スペクトルを使用し、クロマトグラフシグナルの最大値において測定した。

【0321】

選択された実施例のNMRデータは、古典的な形態（値、水素原子の数、多重項分裂）で示されている。

【0322】

いずれの場合にも、その中でNMRスペクトルを記録した溶媒が記載されている。

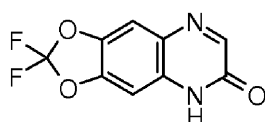
【0323】

出発物質の調製のさらなる例：

式(VIa)で表される化合物の調製：

2,2-ジフルオロ[1,3]ジオキソロ[4,5-g]キノキサリン-6(5H)-オン(VIa-03)の調製

【化39】



【0324】

1.60 g (13.3 mmol)の2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5,6-ジアミン及び1.90 g (10.2 mmol)の2-ヒドロキシ-2-メトキシ酢酸メチルを100 mLのエタノールに溶解させ、その混合物を室温で2時間攪拌する。

【0325】

その混合物を加熱環流し、次いで、35 mLの5.4モルナトリウムメトキシド溶液を滴下して加え、次いで、その混合物を環流しながらさらに18時間加熱する。

【0326】

次いで、冷却後、溶媒を減圧下で除去し、残った残渣に200 mLの水を添加し、その混合物を3時間攪拌する。濃塩酸を用いて酸性化した後、暗褐色の固体を吸引濾過する。これによって、2.2 g (理論値の95.3%、LC/MSによる純度91.1%)が残る。

【0327】

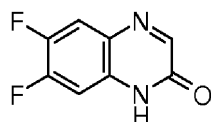
$\log P$ (HCOOH) : 1.49 ; $\log P$ (中性) : 1.33 ;

$^1\text{H-NMR}$ (D_6 -DMSO) ppm : 12.69 (広幅線, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.28 (s, 1H)。

【0328】

6,7-ジフルオロキノキサリン-2(1H)-オン(VIa-04)の調製

【化40】



【0329】

1 mLの酢酸を添加した後、100 mLのイソプロパノールの中の3.00 g (21.1 mmol)の4,5-ジフルオロベンゼン-1,2-ジアミンと3.00 g (32.5 mmol)のグリオキシル酸一水和物を50 で18時間攪拌する。

【0330】

次いで、冷却後、溶媒を減圧下で除去する。その残渣を水と一緒に攪拌し、暗褐色の固体を吸引濾過する。

【0331】

10

20

30

40

50

これによって、3.37 g (理論値の87.7%、¹H-NMRによる純度100%)が残る。

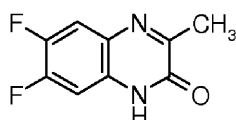
【0332】

¹H-NMR (D₆-DMSO) ppm: 12.54 (broad, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.95 - 7.90 (m, 1H), 7.26 - 7.21 (m, 1H)。

【0333】

6,7-ジフルオロ-3-メチルキノキサリン-2(1H)-オン(VIa-05)の調製

【化41】



10

【0334】

5 mLのジメチルホルムアミドと1 mLの水の混合物の中の700 mg (4.86 mmol)の4,5-ジフルオロベンゼン-1,2-ジアミンと600 mg (6.81 mmol)の2-オキソプロピオン酸を環流しながら18時間攪拌する。

【0335】

次いで、冷却後、溶媒を減圧下で除去する。その残渣を水と一緒に攪拌し、褐色の固体を吸引濾過する。

20

【0336】

これによって、890 mg (理論値の93.4%、¹H-NMRによる純度>95%)が残る。

【0337】

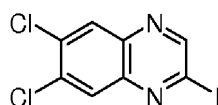
¹H-NMR (D₆-DMSO) ppm: 12.42 (s, 1H), 7.84 - 7.79 (m, 1H), 7.22 - 7.17 (m, 1H), 2.39 (s, 3H)。

【0338】

式(VII)で表される化合物の調製:

6,7-ジクロロ-2-ヨードキノキサリン(VII-02)の調製

【化42】



30

【0339】

7.20 g (33 mmol)の5,6-ジクロロキノキサリン-2(1H)-オン及び12.99 g (35 mmol)のテトラブチルアンモニウムヨードを200 mLのトルエンに溶解させ、12.36 gの五酸化リン(87 mmol)を添加した後、環流しながら18時間攪拌する。冷却後、固体塊が形成される。200 mLの水を添加した後、そのトルエン/水混合物を3時間攪拌し、濾過する。さらに数回、その有機相を水と一緒に攪拌し、抽出する。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で除去する。これによって、6.1 g (理論値の54.1%、GC/MSによる純度96.4%)の生成物が淡黄色の固体として残る。

40

【0340】

¹H-NMR (D₆-DMSO) ppm: 9.15 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.36 (s, 1H)。

【0341】

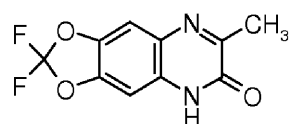
上記で記載した調製方法を用いて、式(VI)で表される化合物、例えば、式(VI)で表される以下の化合物を得ることができる:

2,2-ジフルオロ-7-メチル[1,3]ジオキソロ[4,5-g]キノキサリン-

50

6 (5 H) - オン (V I a - 0 6)

【化 4 3】



【 0 3 4 2 】

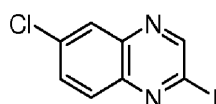
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 12.50 (s, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.19 (s, 1H), 2.39 (s, 3H)。

【 0 3 4 3 】

上記で記載した調製方法を用いて、式 (V I I) で表される化合物、例えば、式 (V I I) で表される以下の化合物を得ることができる：

6 - クロロ - 2 - ヨードキノキサリン (V I I - 0 3)

【化 4 4】



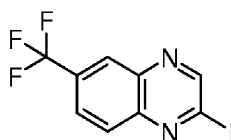
【 0 3 4 4 】

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 9.13 (s, 1H), 8.16 - 8.15 (m, 1H), 8.08 - 8.05 (m, 1H), 7.90 - 7.87 (m, 1H)。

【 0 3 4 5 】

2 - ヨード - 6 - (トリフルオロメチル)キノキサリン (V I I - 0 4)

【化 4 5】



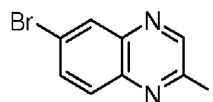
【 0 3 4 6 】

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 9.26 (s, 1H), 8.45 - 8.43 (m, 1H), 8.31 - 8.25 (m, 1H), 8.14 - 8.11 (m, 1H)。

【 0 3 4 7 】

6 - ブロモ - 2 - ヨードキノキサリン (V I I - 0 5)

【化 4 6】



【 0 3 4 8 】

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 9.13 (s, 1H), 8.31 (m, 1H), 7.99 (m, 2H)。

【 0 3 4 9 】

2 - クロロ - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)キノキサリン及び 3 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)キノキサリン (V I I - 0 6)

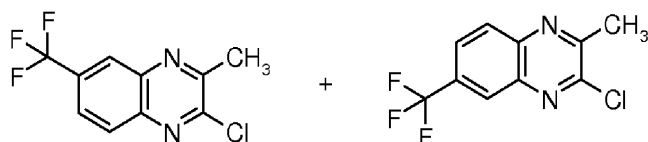
10

20

30

40

【化47】



【0350】

位置異性体の1:1混合物:

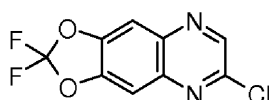
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 8.35 - 7.90 (m, 3H, 両方の位置異性体), 2.89 (s, 3H), 2.88 (s, 3H)。

10

【0351】

6-クロロ-2,2-ジフルオロ[1,3]ジオキサロ[4,5-g]キノキサリン(VII-07)

【化48】



【0352】

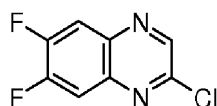
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 9.01 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.10 (s, 1H)。

20

【0353】

2-クロロ-6,7-ジフルオロキノキサリン(VII-08)

【化49】



【0354】

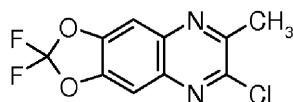
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) ppm: 8.78 (s, 1H), 7.91 - 7.86 (m, 1H), 7.81 - 7.77 (s, 1H)。

30

【0355】

6-クロロ-2,2-ジフルオロ-7-メチル[1,3]ジオキサロ[4,5-g]キノキサリン(VII-09)

【化50】



【0356】

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 8.07 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 2.76 (s, 3H)。

40

【0357】

2-クロロ-6-(ジフルオロメトキシ)キノキサリン及び2-クロロ-7-(ジフルオロメトキシ)キノキサリン(VII-10)

【化51】



50

【0358】

位置異性体の1：5混合物

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) ppm: 8.80 - 7.56 (m, 4H, 両方の位置異性体), 6.72 (t, 1H)。

【0359】

使用実施例オウシマダニ (*Boophilus microplus*) 試験 (BOOPMI 注入)

溶媒: ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、10mgの活性化化合物を0.5mLの溶媒と混合させ、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

10

【0360】

該活性化化合物の溶液を腹部 (オウシマダニ (*Boophilus microplus*)) に注入し、その動物をシャーレの中に移し、人工気象室 (climate-controlled cabinet) の中で保存する。

【0361】

効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明らかではない卵は、約42日後の幼虫孵化まで人工気象室内に保存する。100%の効力は、受精卵を散乱したマダニが無かったことを意味し、0%は、全ての卵が受精卵であることを意味する。

20

【0362】

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20 μg の施用量で80%の効力を示す: I-7。

【0363】

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20 μg の施用量で85%の効力を示す: I-2。

【0364】

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20 μg の施用量で90%の効力を示す: I-36。

【0365】

捻転胃虫 (*Haemonchus contortus*) 試験 (HAEMCO)

30

溶媒: ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、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「リングル液」で希釈して、所望の濃度とする。

【0366】

所望の濃度の該活性化化合物調製物溶液を含んでいる容器の中に約40匹の捻転胃虫 (*Haemonchus contortus*) 幼虫を生息させる。

【0367】

5日間経過した後、殺虫率 (%) を求める。100%は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ幼虫が無かったことを意味する。

40

【0368】

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、80%の効力を示す: I-4、I-32。

【0369】

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-8、I-9。

【0370】

クーペリア・クルチセイ (*Cooperia curticei*) 試験 (COOPCU)

溶媒: ジメチルスルホキシド

50

活性化合物の適切な調製物を調製するために、10 mgの活性化合物を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「リングル液」で希釈して、所望の濃度とする。

【0371】

所望の濃度の該活性化合物調製物溶液を含んでいる容器の中に約40匹の線虫〔クーペリア・クルチセイ (*Cooperia curticei*)〕幼虫を生息させる。

【0372】

5日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ幼虫が無かったことを意味する。

【0373】

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、80%の効力を示す： I - 32。

【0374】

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、90%の効力を示す： I - 40。

【0375】

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%の効力を示す： I - 8、I - 9。

【0376】

ニッポストロンギルス・ブラシリエンシス (*Nippostrongylus brasiliensis*) 試験 (NIPBR)

ニッポストロンギルス・ブラシリエンシス (*Nippostrongylus brasiliensis*) を用いたインビトロ実験に関する試験方法

ニッポストロンギルス・ブラシリエンシス (*Nippostrongylus brasiliensis*) 成虫を雌ウイスターラットの小腸から単離し、100 U/mLのペニシリン、0.1 mg/mLのストレプトマイシン及び2.5 µg/mLのアンホテリシンBを含んでいる緩衝液の中に移す。

【0377】

当該蠕虫(両方の性)のインキュベーションは、アセチルコリンエステラーゼ活性を測定するためにも使用される1.0 mLの培地の中で実施する。

【0378】

当該化合物をDMSOに溶解させ、最終濃度が、それぞれ、10 µg/mL及び1 µg/mLとなるように、インキュベーション培地に添加する。対照は、DMSOのみを含んでいる。

【0379】

インキュベーションは、37 °C、5% CO₂ で実施する。

【0380】

酵素測定は、培地のアリコートを用いて実施する。測定対象のAChEが基質ヨウ化アセチルチオコリン(これは、ヨウ化物塩として存在している)を切断して、生成物アセテート及びチオコリンとする。

【0381】

次の反応において、チオコリンが、ジチオニトロ安息香酸(DTNB、エルマン試薬)、黄色染料(チオニトロベンゾエート)と一緒に形成される。

【0382】

405 nmにおける光学密度(OD)測光によって色の強度(=AChEの活性)を求め、ネガティブ対照のODと比較する。

【0383】

その活性は、以下のカテゴリーに分類する： 84%(60~84%の阻害)、及び、100%(84%を超えて100%までの阻害)。

【0384】

10

20

30

40

50

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、10 ppmの施用量で、84%の効力を示す： I - 8。

【0385】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、10 ppmの施用量で、100%の効力を示す： I - 9。

【0386】

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

溶媒： 125.0重量部のアセトン

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒と混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0387】

容器に、砂、活性化化合物の溶液、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、こぶが発生する。

【0388】

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、こぶが全く見られなかったことを意味し、0%は、処理された植物におけるこぶの数が処理されていない対照におけるこぶの数に相当することを意味する。

【0389】

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、90%の効力を示す： I - 7、I - 74。

【0390】

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

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： 0.5重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

適切な活性化化合物調製物を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合させ、得られた濃厚物を乳化剤を含んでいる水で希釈して、所望の濃度とする。

【0391】

ハクサイ (Brassica pekinensis) の葉のディスクに、所望濃度の活性化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。

【0392】

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。

【0393】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g/haの施用量で83%の効力を示す： I - 15、I - 36。

【0394】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g/haの施用量で100%の効力を示す： I - 7、I - 9、I - 14、I - 34。

【0395】

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

10

20

30

40

50

乳化剤： 0.5重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

適切な活性化合物調製物を調製するために、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させ、得られた濃厚物を乳化剤を含んでいる水で希釈して、所望の濃度とする。

【0396】

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調製物を噴霧し、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。

【0397】

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。

10

【0398】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で83%の効力を示す： I - 29。

【0399】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で100%の効力を示す： I - 14、I - 15。

【0400】

ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) - 7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： 0.5重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

適切な活性化合物調製物を調製するために、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させ、得られた濃厚物を乳化剤を含んでいる水で希釈して、所望の濃度とする。

【0401】

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調製物を噴霧する。

30

【0402】

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。

【0403】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で90%の効力を示す： I - 12、I - 18、I - 25、I - 26、I - 27、I - 34、I - 36、I - 43、I - 46、I - 48、I - 66。

【0404】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で100%の効力を示す： I - 1、I - 14、I - 15、I - 21、I - 24、I - 51。

40

【0405】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験 (MYZUPE)

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： 0.5重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

適切な活性化合物調製物を調製するために、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させ、得られた濃厚物を乳化剤を含んでいる水で希釈して、所望の濃度とする。

50

【0406】

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、所望濃度の活性化化合物調製物を噴霧する。

【0407】

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。

【0408】

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 - 62。

10

【0409】

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 - 10。

【0410】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で90%の効力を示す： 1 - 1、I - 7、I - 9、I - 18、I - 22、I - 31、I - 32、I - 36、I - 63、I - 66。

【0411】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、750g/haの施用量で90%の効力を示す： I - 2、I - 11。

20

【0412】

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) - 噴霧試験

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

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、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。アンモニウム塩又は/及び浸透剤を添加することが必要な場合は、それらは、それぞれ、1000ppmの濃度で当該製剤溶液に添加する。

30

【0413】

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) が重度に発生しているワタ植物 (*Gossypium hirsutum*) に、所望濃度の活性化化合物調製物を噴霧する。

【0414】

6日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのワタアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだワタアブラムシが無かったことを意味する。

【0415】

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85%の効力を示す： I - 1、I - 10。

【0416】

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 - 2。

40

【0417】

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85%の効力を示す： I - 9。

【0418】

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 - 32。

【0419】

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95%の効力を示す： I - 66。

50

【0420】

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97%の効力を示す： I - 62。

【0421】

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%の効力を示す： I - 11、I - 30。

【0422】

ワタコナジラミ (Bemisia tabaci) - 噴霧試験

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

10

活性化合物の適切な調製物を調製するために、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1000 ppm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。アンモニウム塩又は/及び浸透剤を添加することが必要な場合は、それらは、それぞれ、1000 ppmの濃度で当該製剤溶液に添加する。

【0423】

ワタコナジラミ (Bemisia tabaci) の幼虫が発生しているワタ植物 (Gossypium hirsutum) に、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。

【0424】

8日間経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのワタコナジラミが死んだことを意味し、0%は、死んだワタコナジラミが無かったことを意味する。

20

【0425】

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 - 2。

【0426】

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90%の効力を示す： I - 15。

【0427】

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96%の効力を示す： I - 26。

30

【0428】

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%の効力を示す： I - 7、I - 11、I - 30。

【0429】

トビイロウンカ (Nilaparvata lugens) - 噴霧試験

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

40

活性化合物の適切な調製物を調製するために、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1000 ppm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。アンモニウム塩又は/及び浸透剤を添加することが必要な場合は、それらは、それぞれ、1000 ppmの濃度で当該製剤溶液に添加する。

【0430】

イネ植物 (Oryza sativa) に所望濃度の活性化合物調製物を噴霧し、次いで、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens) の幼虫を寄生させる。

【0431】

7日間経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのトビイロウンカが死んだことを意味し、0%は、死んだトビイロウンカが無かったことを意味する。

【0432】

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

50

%の効力を示す： I - 1、I - 2。

【0433】

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 - 26、I - 30。

【0434】

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 - 11。

【0435】

トビイロウンカ (Nilaparvata lugens) - 噴霧試験

溶媒： 52.5重量部のアセトン

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

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

【0436】

イネ植物 (Oryza sativa) に所望濃度の活性化化合物調製物を噴霧し、次いで、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens) の幼虫を寄生させる。

【0437】

4日間経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのトビイロウンカが死んだことを意味し、0%は、死んだトビイロウンカが無かったことを意味する。

【0438】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で90%の効力を示す： I - 7。

【0439】

ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps) 試験 (NEPHCI)

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

活性化化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、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。アンモニウム塩又はノ及び浸透剤 (ナタネ油メチルエステル) を添加することが必要な場合は、それらは、それぞれ、完成された製剤溶液を希釈した後で、1000ppmの濃度でピペットで量って入れる。

【0440】

イネ植物 (Oryza sativa, var. Balilla) を所望濃度の該活性化化合物調製物を噴霧することによって処理し、次いで、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps) の幼虫を寄生させる。

【0441】

14日間経過した後、殺虫率 (%) を求める。100%は、全てのツマグロヨコバイが死んだことを意味し、0%は、死んだツマグロヨコバイが無かったことを意味する。

【0442】

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 - 2。

10

20

30

40

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2014/072432

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D401/04 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		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2012/045196 A1 (ABBOTT LAB [US]; ABBOTT LAB TRADING SHANGHAI COMPANY LTD [CN]; XU XIAN) 12 April 2012 (2012-04-12) cited in the application example 14A, p. 51; example 91, p. 79; -----	1-4
X	WO 2008/148867 A2 (NOVARTIS AG [CH]; GERSPACHER MARC [CH]; FURET PASCAL [FR]; VANGREVELIN) 11 December 2008 (2008-12-11) cited in the application p. 126, 8-bromo-compound middle paragraph; -----	1-4
X	WO 2009/021083 A1 (SMITHKLINE BEECHAM CORP [US]; KNIGHT STEVEN DAVID [US]; PARISH CYNTHIA) 12 February 2009 (2009-02-12) p. 51, compound in line 5; -----	1-4
	-/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
19 November 2014		28/11/2014
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
		Wolf, Claudia

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2014/072432

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	SHILU FAN ET AL: "Pd-Catalyzed Direct Cross-Coupling of Electron-Deficient Polyfluoroarenes with Heteroaromatic Tosylates", ORGANIC LETTERS, vol. 13, no. 16, 19 August 2011 (2011-08-19), pages 4374-4377, XP055153413, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/ol201706t p. 4376, Table 2, compound 3v; -----	1-4
X	PIERRE KOCH ET AL: "Pyridinylquinoxalines and Pyridinylpyridopyrazines as Lead Compounds for Novel p38[alpha] Mitogen-Activated Protein Kinase Inhibitors", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 53, no. 3, 11 February 2010 (2010-02-11), pages 1128-1137, XP055153418, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm901392x compounds in Schemes 1-3; -----	1-4
X,P	JP 2013 246249 A (RICOH CO LTD) 9 December 2013 (2013-12-09) p. 14, compound (16-1); -----	1-4
X	DD 258 165 A1 (FAHLBERG LIST VEB [DD]) 13 July 1988 (1988-07-13) cited in the application Verbindungen (I);; the whole document -----	1-7
X	DD 262 790 A1 (FAHLBERG LIST VEB [DD]) 14 December 1988 (1988-12-14) cited in the application Verbindungen (I);; the whole document -----	1-7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2014/072432

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012045196	A1	12-04-2012	NONE

WO 2008148867	A2	11-12-2008	AR 066879 A1 16-09-2009
		AU 2008258486 A1	11-12-2008
		CA 2690288 A1	11-12-2008
		CN 101678020 A	24-03-2010
		EA 200901608 A1	30-06-2010
		EP 2155201 A2	24-02-2010
		ES 2392570 T3	11-12-2012
		JP 5574957 B2	20-08-2014
		JP 2010529088 A	26-08-2010
		KR 20100020465 A	22-02-2010
		PA 8783501 A1	23-01-2009
		TW 200904814 A	01-02-2009
		US 2010168062 A1	01-07-2010
		UY 31126 A1	30-01-2009
		WO 2008148867 A2	11-12-2008

WO 2009021083	A1	12-02-2009	EP 2173354 A1 14-04-2010
		JP 2010535804 A	25-11-2010
		WO 2009021083 A1	12-02-2009

JP 2013246249	A	09-12-2013	NONE

DD 258165	A1	13-07-1988	NONE

DD 262790	A1	14-12-1988	NONE

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2014/072432

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D401/04 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D		
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, 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 2012/045196 A1 (ABBOTT LAB [US]; ABBOTT LAB TRADING SHANGHAI COMPANY LTD [CN]; XU XIAN) 12. April 2012 (2012-04-12) in der Anmeldung erwähnt example 14A, p. 51; example 91, p. 79; -----	1-4
X	WO 2008/148867 A2 (NOVARTIS AG [CH]; Gerspacher Marc [CH]; Furet Pascal [FR]; Vangrevelin) 11. Dezember 2008 (2008-12-11) in der Anmeldung erwähnt p. 126, 8-bromo-compound middle paragraph; -----	1-4
X	WO 2009/021083 A1 (SMITHKLINE BEECHAM CORP [US]; Knight Steven David [US]; Parish Cynthia) 12. Februar 2009 (2009-02-12) p. 51, compound in line 5; -----	1-4
-/--		
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen		<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		*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
A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist		*X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
E frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		*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
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)		*Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
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		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
19. November 2014		28/11/2014
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 Wolf, Claudia

1

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

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2014/072432

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	SHILU FAN ET AL: "Pd-Catalyzed Direct Cross-Coupling of Electron-Deficient Polyfluoroarenes with Heteroaromatic Tosylates", ORGANIC LETTERS, Bd. 13, Nr. 16, 19. August 2011 (2011-08-19), Seiten 4374-4377, XP055153413, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/ol201706t p. 4376, Table 2, compound 3v; -----	1-4
X	PIERRE KOCH ET AL: "Pyridinylquinoxalines and Pyridinylpyridopyrazines as Lead Compounds for Novel p38[alpha] Mitogen-Activated Protein Kinase Inhibitors", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, Bd. 53, Nr. 3, 11. Februar 2010 (2010-02-11), Seiten 1128-1137, XP055153418, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm901392x compounds in Schemes 1-3; -----	1-4
X,P	JP 2013 246249 A (RICOH CO LTD) 9. Dezember 2013 (2013-12-09) p. 14, compound (16-1); -----	1-4
X	DD 258 165 A1 (FAHLBERG LIST VEB [DD]) 13. Juli 1988 (1988-07-13) in der Anmeldung erwähnt Verbindungen (I);; das ganze Dokument -----	1-7
X	DD 262 790 A1 (FAHLBERG LIST VEB [DD]) 14. Dezember 1988 (1988-12-14) in der Anmeldung erwähnt Verbindungen (I);; das ganze Dokument -----	1-7

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2014/072432

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012045196	A1	12-04-2012	KEINE
WO 2008148867	A2	11-12-2008	AR 066879 A1 16-09-2009 AU 2008258486 A1 11-12-2008 CA 2690288 A1 11-12-2008 CN 101678020 A 24-03-2010 EA 200901608 A1 30-06-2010 EP 2155201 A2 24-02-2010 ES 2392570 T3 11-12-2012 JP 5574957 B2 20-08-2014 JP 2010529088 A 26-08-2010 KR 20100020465 A 22-02-2010 PA 8783501 A1 23-01-2009 TW 200904814 A 01-02-2009 US 2010168062 A1 01-07-2010 UY 31126 A1 30-01-2009 WO 2008148867 A2 11-12-2008
WO 2009021083	A1	12-02-2009	EP 2173354 A1 14-04-2010 JP 2010535804 A 25-11-2010 WO 2009021083 A1 12-02-2009
JP 2013246249	A	09-12-2013	KEINE
DD 258165	A1	13-07-1988	KEINE
DD 262790	A1	14-12-1988	KEINE

フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 K 31/497 (2006.01)	A 6 1 K 31/497	
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 6 1 P 33/10 (2006.01)	A 6 1 P 33/10	
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 3
A 0 1 N 43/60 (2006.01)	A 0 1 N 43/60	1 0 1
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	

(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 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
- (74) 代理人 100127812
弁理士 城山 康文
- (72) 発明者 アリク, ベルント
ドイツ国、5 3 6 3 9・ケーニツヒスヴインター、イム・ロートシーフエン・7
- (72) 発明者 グロイル, ヨルク, ニコ
ドイツ国、5 1 3 8 1・レーバークーゼン、マックス - シエーネンベルク - シュトラーセ・6・アー
- (72) 発明者 フイツシャー, リュデイガー
ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツォー・デン・フースフエレン・2 3
- (72) 発明者 シュヴァルツ, ハンス - ゲオルク

- ドイツ国、4 6 2 8 2・ドルステン、アウフ・デム・ベアーエンカンブ・8 2・ベ
 (72)発明者 プレトシュナイダー、トーマス
 ドイツ国、5 3 7 9 7・ローマー、タールシュトラッセ・2 9・ベ
 (72)発明者 フイツシャー、ライナー
 ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、ネリー - ザツクス - シュトラッセ・2 3
 (72)発明者 ポーツ、ダニエラ
 ドイツ国、5 2 3 9 1・フエツトヴァイス、オストシュトラッセ・1
 (72)発明者 マルサム、オルガ
 ドイツ国、5 1 5 0 3・レスラート、フオア・デム・クロスターホーフ・1 9
 (72)発明者 レーセル、ペーター
 ドイツ国、5 1 3 7 1・レーバークーゼン、アム・シヨツカー・5
 (72)発明者 イルク、ケルシュテイン
 ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、ノイツサー・バール・3 2
 (72)発明者 ベッカー、アンゲラ
 ドイツ国、4 0 2 3 5・デユツセルドルフ、ホーフフェルトシュトラッセ・8 6
 (72)発明者 ゲルゲンス、ウルリヒ
 ドイツ国、4 0 8 8 2・ラテインゲン、フエステルシュトラッセ・3 7
 (72)発明者 ハーマン、シュテファン
 ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ヴイルネブルクシュトラッセ・4・アー
 (72)発明者 ヴエルツ、クラウディア
 ドイツ国、4 0 5 9 7・デユツセルドルフ、カルヴィーンシュトラッセ・1 9
- F ターム(参考) 4C050 AA01 AA08 BB08 CC17 EE02 FF01 GG02 GG03 HH01
 4C055 AA01 BA01 CA02 CA06 DA13 FA06
 4C063 AA01 BB02 CC34 CC92 DD12 DD29 DD34 EE01 EE03
 4C086 AA01 AA02 AA03 BC52 CB22 GA04 GA07 GA08 MA01 MA04
 NA14 ZB37 ZB39
 4H011 AC01 AC04 BB09 BB10