

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6871917号
(P6871917)

(45) 発行日 令和3年5月19日 (2021.5.19)

(24) 登録日 令和3年4月20日 (2021.4.20)

(51) Int. Cl.	F 1	
CO7D 471/04 (2006.01)	CO7D 471/04	1 O 7 Z
CO7D 401/14 (2006.01)	CO7D 401/14	C S P
CO7D 487/04 (2006.01)	CO7D 487/04	1 4 4
AO1N 43/90 (2006.01)	AO1N 43/90	1 O 4
AO1N 43/653 (2006.01)	AO1N 43/653	Q
請求項の数 5 (全 131 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2018-515805 (P2018-515805)	(73) 特許権者	507203353
(86) (22) 出願日	平成28年9月23日 (2016.9.23)		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
(65) 公表番号	特表2018-529702 (P2018-529702A)		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
(43) 公表日	平成30年10月11日 (2018.10.11)	(74) 代理人	100114188
(86) 国際出願番号	PCT/EP2016/072697		弁理士 小野 誠
(87) 国際公開番号	W02017/055185	(74) 代理人	100119253
(87) 国際公開日	平成29年4月6日 (2017.4.6)		弁理士 金山 賢教
審査請求日	令和1年9月18日 (2019.9.18)	(74) 代理人	100124855
(31) 優先権主張番号	15187145.6		弁理士 坪倉 道明
(32) 優先日	平成27年9月28日 (2015.9.28)	(74) 代理人	100129713
(33) 優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁 (EP)		弁理士 重森 一輝
最終頁に続く			

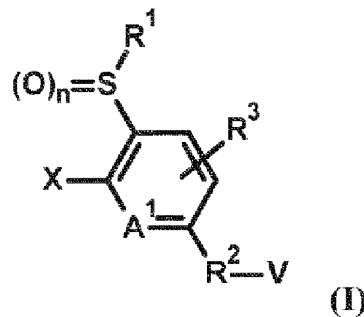
(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての2- (ヘタ) アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 (I)

【化1】



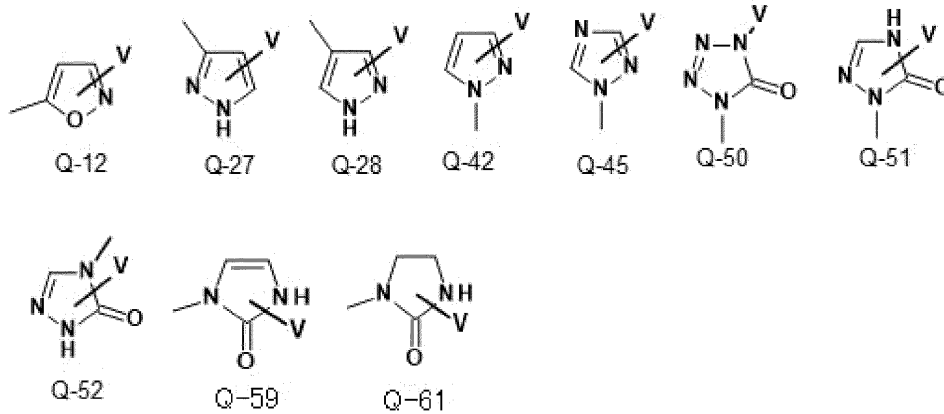
〔式中、

A¹ は、窒素を表し；

R¹ は、エチルを表し；

R² - V は、塩素又はトリフルオロメチルで1置換されていてもよい群 Q - 12、Q - 27、Q - 28、Q - 42、Q - 45、Q - 50、Q - 51、Q - 52、Q - 59又は Q - 61；

【化2】



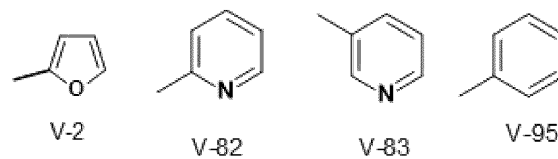
10

から選択される環を表し；

ここで、

Vは、フッ素、塩素又は臭素から選択される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い群V-2、V-82、V-83又はV-95；

【化3】



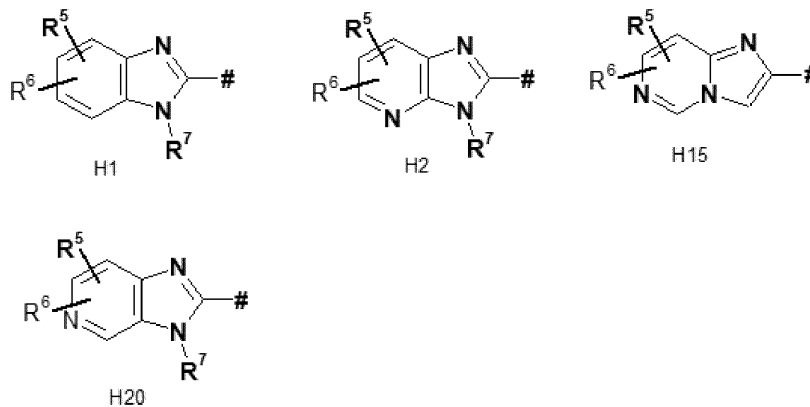
20

から選択される環を表し；

R³は、水素を表し；

Xは、群H1、H2、H15又はH20；

【化4】



30

40

から選択されるヘテロ芳香族環系を表し；

R⁵は、トリフルオロメチルを表し；

R⁶は、水素を表し；

R⁷は、メチルを表し；

nは、2を表す]

で表される化合物。

【請求項2】

農薬製剤であって、請求項1に記載の式(I)で表される化合物を含み、並びに、増量

50

剤及び／又は界面活性剤も含んでいる、前記農薬製剤。

【請求項 3】

さらなる農薬活性化合物を付加的に含んでいる、請求項 2 に記載の農薬製剤。

【請求項 4】

害虫を防除する方法であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 2 若しくは 3 に記載の農薬製剤を該害虫及び／又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする、ただし、人間における害虫を防除する方法を除く、前記方法。

【請求項 5】

害虫を防除するための、ただし、人間への使用を除く、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 2 若しくは 3 に記載の農薬製剤の使用。

10

【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 2 - (ヘタ) アリール置換縮合ヘテロ環誘導体、害虫 (animal pest) を防除するための、特に、節足動物 (とりわけ、昆虫類及びクモ形類動物) を防除するための、殺ダニ剤及び／又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを調製するための調製方法及び中間体に関する。

【0002】

殺虫特性を有している縮合ヘテロ環誘導体は、文献中に、例えば、WO 2010/125985、WO 2012/074135、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2013/191113、WO 2014/142292、WO 2014/148451、WO 2015/000715、EP 15153943.4、EP 15153948.3、WO 2015/121136、WO 2015/133603、WO 2015/198859、WO 2015/002211、WO 2015/071180、WO 2015/091945、WO 2016/005263、WO 2015/198817、WO 2016/041819、WO 2016/039441、WO 2016/026848、WO 2016/023954、WO 2016/020286 及び WO 2016/046071 などの中に、既に記載されている。

20

【先行技術文献】

30

【特許文献】

【0003】

【特許文献 1】国際特許出願公開第 2010/125985 号

【特許文献 2】国際特許出願公開第 2012/074135 号

【特許文献 3】国際特許出願公開第 2012/086848 号

【特許文献 4】国際特許出願公開第 2013/018928 号

【特許文献 5】国際特許出願公開第 2013/191113 号

【特許文献 6】国際特許出願公開第 2014/142292 号

【特許文献 7】国際特許出願公開第 2014/148451 号

【特許文献 8】国際特許出願公開第 2015/000715 号

40

【特許文献 9】欧州特許出願公開第 15153943.4 号

【特許文献 10】欧州特許出願公開第 15153948.3 号

【特許文献 11】国際特許出願公開第 2015/121136 号

【特許文献 12】国際特許出願公開第 2015/133603 号

【特許文献 13】国際特許出願公開第 2015/198859 号

【特許文献 14】国際特許出願公開第 2015/002211 号

【特許文献 15】国際特許出願公開第 2015/071180 号

【特許文献 16】国際特許出願公開第 2015/091945 号

【特許文献 17】国際特許出願公開第 2016/005263 号

【特許文献 18】国際特許出願公開第 2015/198817 号

50

【特許文献19】国際特許出願公開第2016/041819号
 【特許文献20】国際特許出願公開第2016/039441号
 【特許文献21】国際特許出願公開第2016/026848号
 【特許文献22】国際特許出願公開第2016/023954号
 【特許文献23】国際特許出願公開第2016/020286号
 【特許文献24】国際特許出願公開第2016/046071号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

しかしながら、上記で引用されている文献によって既に知られている活性化合物は、狭い適用範囲しか示さないという理由で、又は、十分な殺虫活性若しくは殺ダニ活性を有していないという理由で、施用において幾つか不利点を有している。

10

【課題を解決するための手段】

【0005】

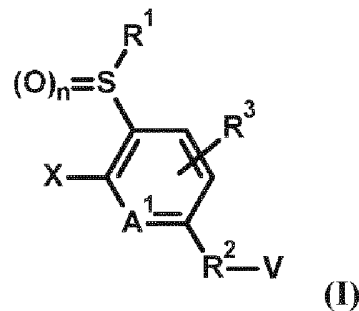
新規2-(ヘタ)アリール置換縮合ヘテロ環誘導体が見いだされ、そして、これらは、既に知られている化合物よりも有利点を有している。そのような有利点の例は、より良好な生物学的特性又は環境に関する特性、より広い範囲の施用方法、向上した殺虫活性又は殺ダニ活性、及び、さらに、作物植物との良好な適合性である。該2-(ヘタ)アリール置換縮合ヘテロ環誘導体は、効力(特に、防除が困難な昆虫類に対する効力)を向上させるための別の作用剤と組合せて使用することが可能である。

20

【0006】

従って、本発明は、式(I)

【化1】



30

【0007】

〔式中(形態1)〕、

A¹は、窒素、=N⁺(O⁻)-又は=C(R⁴)-を表し；

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

40

50

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

10

いずれの場合にも同一であるか又は異なっているアリール置換基、ヘタリール置換基又はヘテロシクリル置換基で1置換又は多置換されていてもよい下記基($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_2 - C_6$) アルケニル、($C_2 - C_6$) アルキニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキルを表し、ここで、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、いずれの場合にも、同一であるか又は異なっている下記置換基で1置換又は多置換されることができ：ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) トリアルキルシリル、又は、ベンジル；又は、

20

R^1 は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルを表し、ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) トリアルキルシリル、($=O$) (ヘテロシクリルの場合のみ) 及び($=O$)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) からなる群から選択される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；

30

40

R^2 は、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよい飽和、部分的飽和又はヘテロ芳香族の環を表し、ここで、少なくとも1個の炭素原子はヘテロ原子で置き換えられており、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することができ、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り：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、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 - ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキル、

50

(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、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル (C₁ - 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 - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、-N=C(H)-O(C₁ - C₆)アルキル、-C(H)=N-O(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル - (C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆)アルキル - アミノカルボニル、(C₂ - C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ；

Vは、同一であるか若しくは異なっている置換基で1置換若しくは多置換されていてもよい飽和、部分的飽和若しくはヘテロ芳香族の環[ここで、少なくとも1個の炭素原子はヘテロ原子で置き換えられている]を表すか、又は、同一であるか若しくは異なっている置換基で1置換若しくは多置換されていてもよい芳香族環を表し、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することができ、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り：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、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 - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)ハロアルケニル、(C₂ - C₆)シアノアルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₂ - C₆)ハロアルキニル、(C₂ - C₆)シアノアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル (C₁ - 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 - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、-N=C(H)-O(C₁ - C₆)アルキル、-C(H)=N-O(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル - (C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁

10

20

30

40

50

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

R³ 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(C₁ - C₆) アルキルシリル、(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₃ - C₈) シクロアルキル - (C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) アルキル - (C₃ - C₈) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル、(C₁ - C₆) シアノアルキル、(C₁ - C₆) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) ハロアルケニル、(C₂ - C₆) シアノアルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) 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 - C₆) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆) アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) アルキル - (C₁ - C₆) アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキル - (C₁ - C₆) アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₁ - C₆) アルキルチオ - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) ハロゲンアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、(C₂ - C₆) アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキル - アミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノ、NHCO - (C₁ - C₆) アルキル(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ)を表し；

10

20

30

40

50

アリアル又はヘタリアルを表し、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、(ヘタリアルの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在することができ、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り：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、アミノ、SCN、トリ-(C₁-C₆)アルキルシリル、(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₃-C₈)シクロアルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)ハロアルキル、(C₁-C₆)シアノアルキル、(C₁-C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)ハロアルケニル、(C₂-C₆)シアノアルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)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-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)ハロアルキル-(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)ハロアルキルチオ、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルチオ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルカルボニル、(C₁-C₆)ハロアルキルカルボニル、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、(C₁-C₆)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₂-C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ-(C₂-C₆)-アルケニルアミノカルボニル、(C₃-C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁-C₆)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁-C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ-(C₁-C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₃-C₈)シクロアルキルアミノ、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ；

R⁴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(C₁-C₆)アルキルシリル、(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₃-C₈)シクロアルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)ハロアルキル、(C₁-C₆)シアノアルキル、(C₁-C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)ハロアルケニル、(C₂-C₆)シアノアルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)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-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)ハロアルキル-(C₁-C₆)アル

10

20

30

40

50

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

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

10

20

30

40

50

6) アルキルカルボニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、(C₂ - C₆) アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホキシミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノ、NHCO - (C₁ - C₆) アルキル ((C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ) から選択されることができ、又は、ここで、該置換基は互いに独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環 (ここで、フェニル又は該環は、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシからなる群から選択される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い) から選択されることができ；

10

20

n は、0、1又は2を表す]

で表される新規化合物を提供する。

【0008】

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、及び、さらに、概して、植物との極めて良好な適合性、特に、作物植物に関して、植物との極めて良好な適合性を示すということが、見いだされた。

【発明を実施するための形態】

【0009】

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。上記及び下記に記載されている式の中で与えられている好ましい置換基又はラジカルのは好ましい範囲について、以下で説明する。

30

【0010】

形態2

A¹ は、窒素、= N⁺ (O⁻) - 又は = C (R⁴) - を表し；

R¹ は、好ましくは、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) アルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(

40

50

$C_1 - C_4$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニル - ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルカルボニル - ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルアミノを表し；又は、

($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_3 - C_6$) シクロアルキルを表し、ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール及びヘテロシクリルからなる群から選択される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、ここで、アリール、ヘタリール及びヘテロシクリルは、いずれの場合にも、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_3 - C_4$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィミノからなる群から選択される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；又は、

R^1 は、好ましくは、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルを表し、ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、($C_1 - C_4$) アルキル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_4$) アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニル、($C_3 - C_4$) トリアルキルシリル、($=O$) (ヘテロシクリルの場合のみ) 及び($=O$)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) からなる群から選択される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；

R^2 は、好ましくは、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い飽和、部分的飽和又はヘテロ芳香族の環を表し、ここで、少なくとも1個の炭素原子はN、O及びSからなる群から選択されるヘテロ原子で置き換えられており、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することができ、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り：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) シアノアルキル、($C_1 - C_4$) ヒドロキシアルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ - ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) ハロアルケニル、($C_2 - C_4$) シアノアルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_2 - C_4$) ハロアルキニル、($C_2 - C_4$) シアノアルキニル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル - ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルキル - ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) シアノアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルコキシ - ($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) アルコキシイミノ、 $-N=C(H)-O$ ($C_1 - C_4$) アルキル、 $-C(H)=N-O$ ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキル - ($C_1 - C_4$) アルコキシイミノ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ - ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノカルボニル、ジ - ($C_1 - C_4$) アルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、ジ - ($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノスルホニル、ジ - ($C_1 - C_4$) アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニルアミノ；

Vは、好ましくは、同一であるか若しくは異なっている置換基で1置換若しくは2置換されていてもよい飽和、部分的飽和若しくはヘテロ芳香族の環 [ここで、少なくとも1個

10

20

30

40

50

の炭素原子はN、O又はSの群から選択されるヘテロ原子で置き換えられている]を表すか、又は、同一であるか若しくは異なっている置換基で1置換若しくは2置換されていてもよい芳香族環を表し、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することができ、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り：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₂ - C₄)シアノアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)シアノアルコキシ、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)アルコキシイミノ、-N=C(H)-O(C₁ - C₄)アルキル、-C(H)=N-O(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル - (C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルカルボニルアミノ；

R³は、好ましくは、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(C₁ - C₄)アルキルシリル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₂ - C₄)シアノアルキニル、(C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)シアノアルコキシ、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキル - (C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキル - (C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、NHCO - (C₁ - C₄)アルキル(C₁ - C₄)アルキルカルボニルアミノ)を表し；

10

20

30

40

50

さらにまた、好ましくは、フェニル又はヘタリールを表し、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、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することができ、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り：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)シアノアルキル、(C₁-C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)シアノアルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルチオ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、NHCO-(C₁-C₄)アルキル((C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノ)；

R⁴は、好ましくは、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(C₁-C₄)アルキルシリル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)シアノアルキル、(C₁-C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)シアノアルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルチオ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル又はNHCO-(C₁-C₄)アルキル((C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノ)を表し；

10

20

30

40

50

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

nは、好ましくは、0、1又は2を表す。

【0011】

形態3-1

A¹は、特に好ましくは、窒素又は=C(R⁴)-を表し;

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

10

20

30

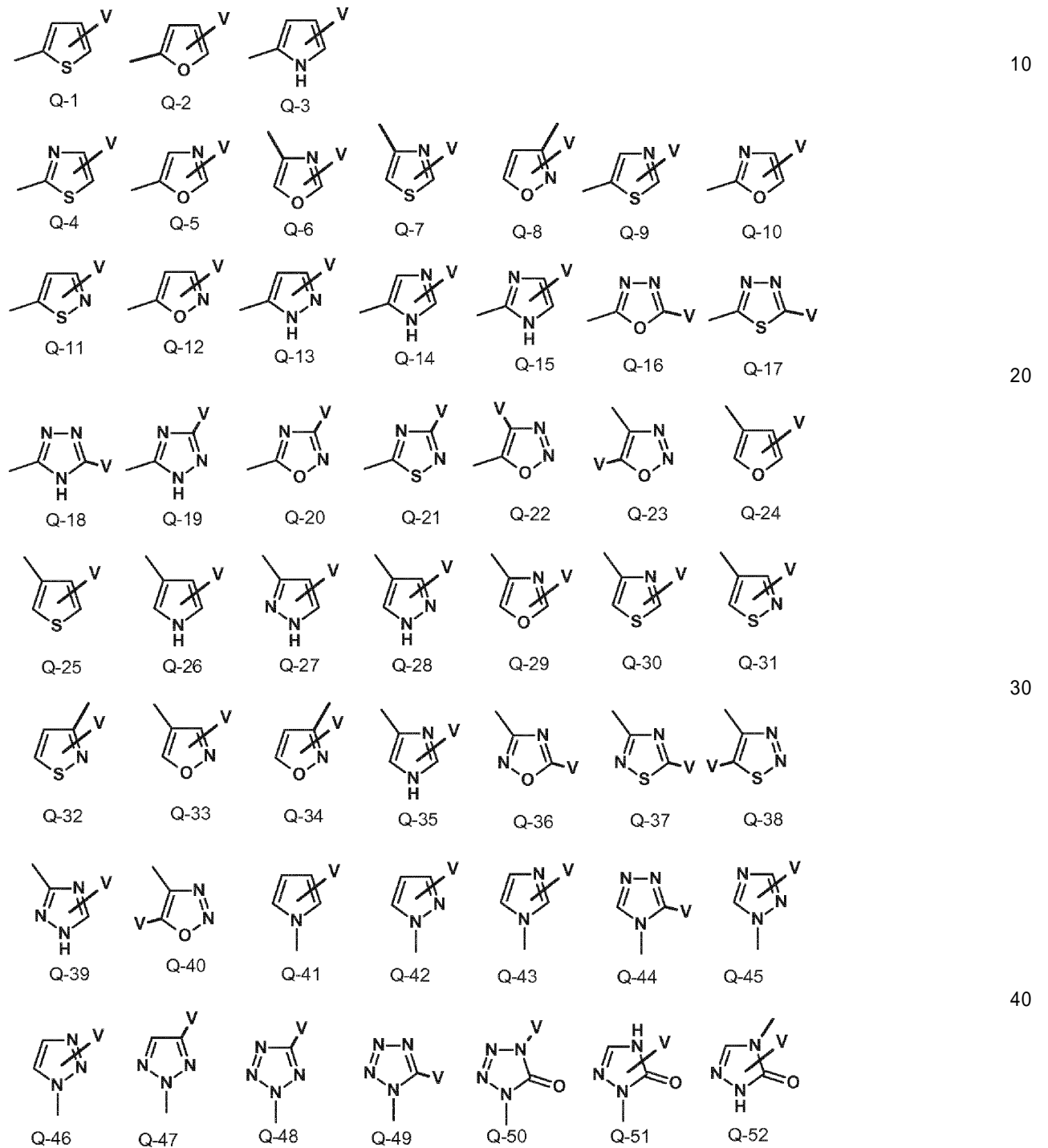
40

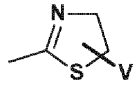
50

ケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル又は(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキルを表し；

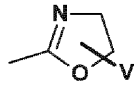
R² - Vは、特に好ましくは、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されていてもよい群Q - 1 ~ Q - 8 0

【化2】

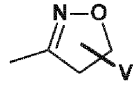




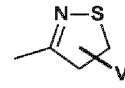
Q-53



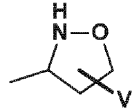
Q-54



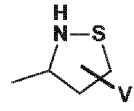
Q-55



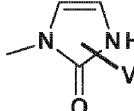
Q-56



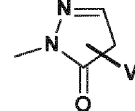
Q-57



Q-58

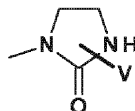


Q-59

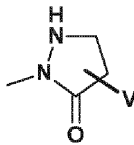


Q-60

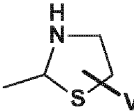
10



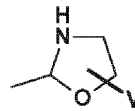
Q-61



Q-62

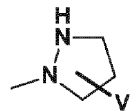


Q-63

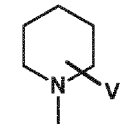


Q-64

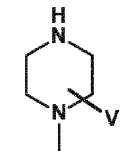
20



Q-65

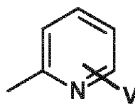


Q-66

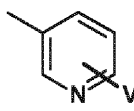


Q-67

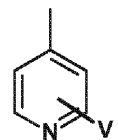
30



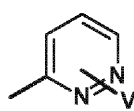
Q-68



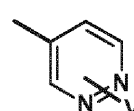
Q-69



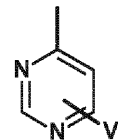
Q-70



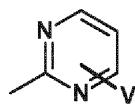
Q-71



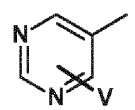
Q-72



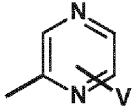
Q-73



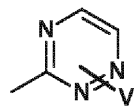
Q-74



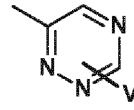
Q-75



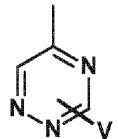
Q-76



Q-77

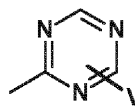


Q-78



Q-79

40



Q-80

【 0 0 1 2 】

から選択される 5 員又は 6 員の環 [ここで、可能な置換基はいずれの場合にも以下のとお

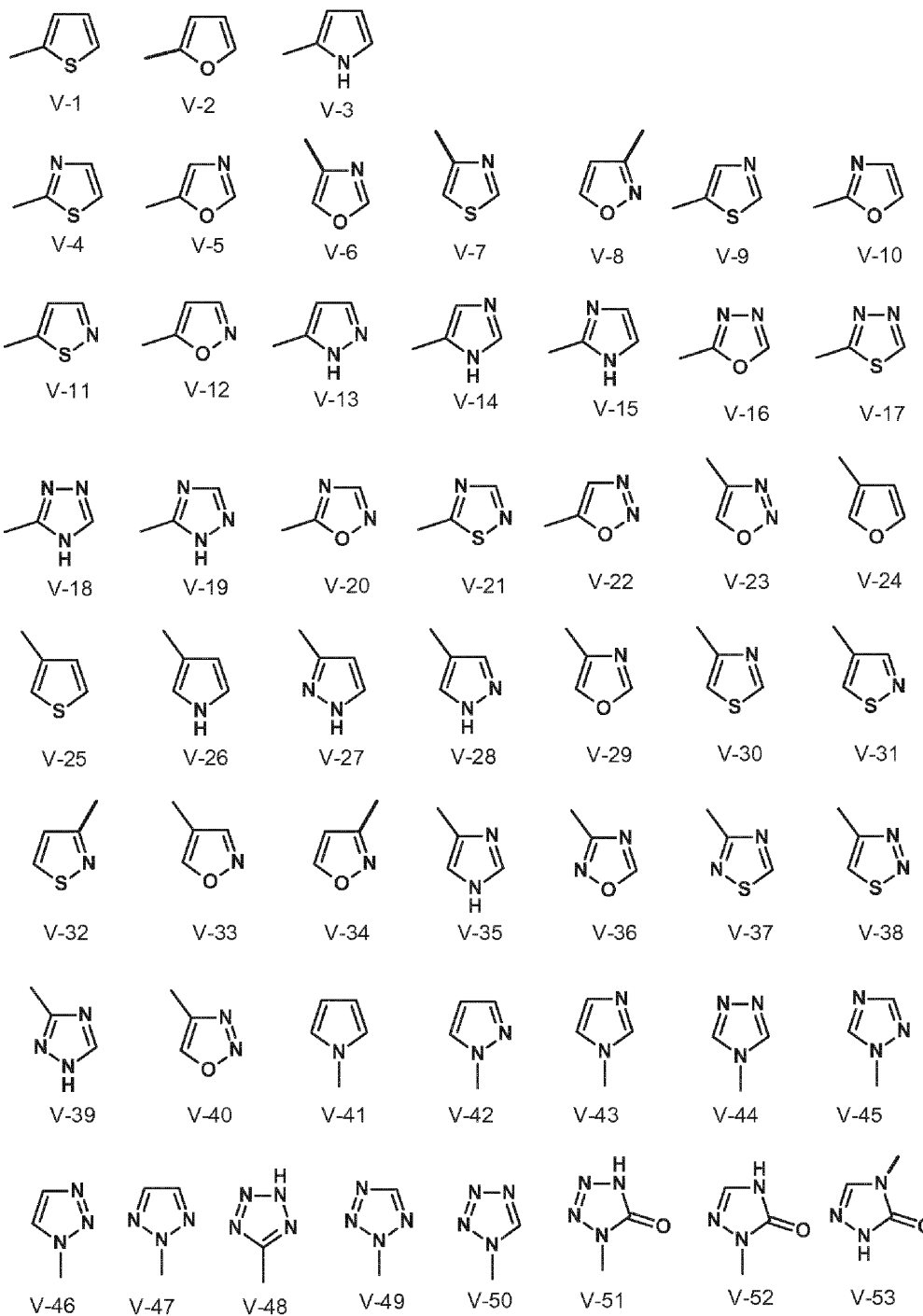
50

りである：シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ又は(C₁ - C₄)ハロアルコキシ]を表し；

ここで、

Vは、特に好ましくは、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い群V - 1 ~ V - 101

【化3】

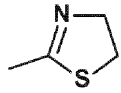


10

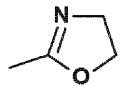
20

30

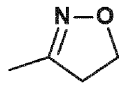
40



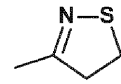
V-54



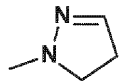
V-55



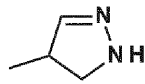
V-56



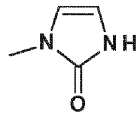
V-57



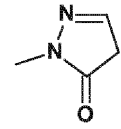
V-58



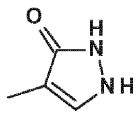
V-59



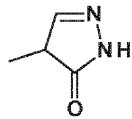
V-60



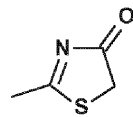
V-61



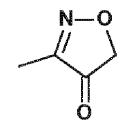
V-62



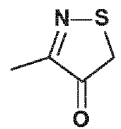
V-63



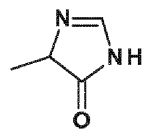
V-64



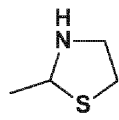
V-65



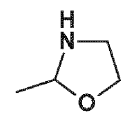
V-66



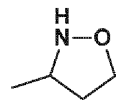
V-67



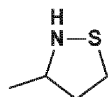
V-68



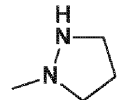
V-69



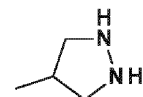
V-70



V-71



V-72



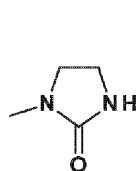
V-73

10

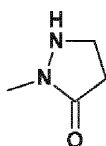
20

30

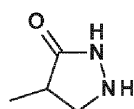
40



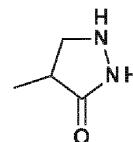
V-74



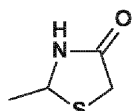
V-75



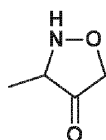
V-76



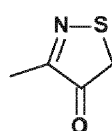
V-77



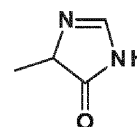
V-78



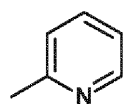
V-79



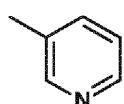
V-80



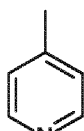
V-81



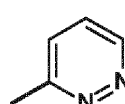
V-82



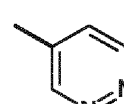
V-83



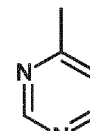
V-84



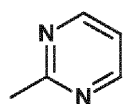
V-85



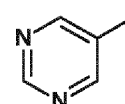
V-86



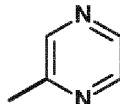
V-87



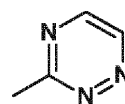
V-88



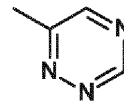
V-89



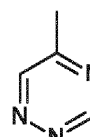
V-90



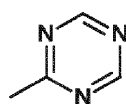
V-91



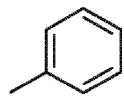
V-92



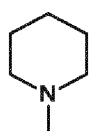
V-93



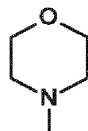
V-94



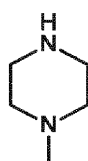
V-95



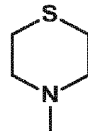
V-96



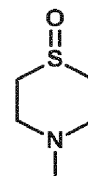
V-97



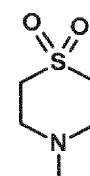
V-98



V-99



V-100



V-101

【 0 0 1 3 】

から選択される5員又は6員の環[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、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルコキシ又は(C₁-C₄)ハロアルコキシ]を表し；

R³は、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、S

10

20

30

40

50

CN、トリ - (C₁ - C₄) アルキルシリル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) シアノアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキル - (C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル又はNHCO - (C₁ - C₄) アルキル((C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ)を表し；

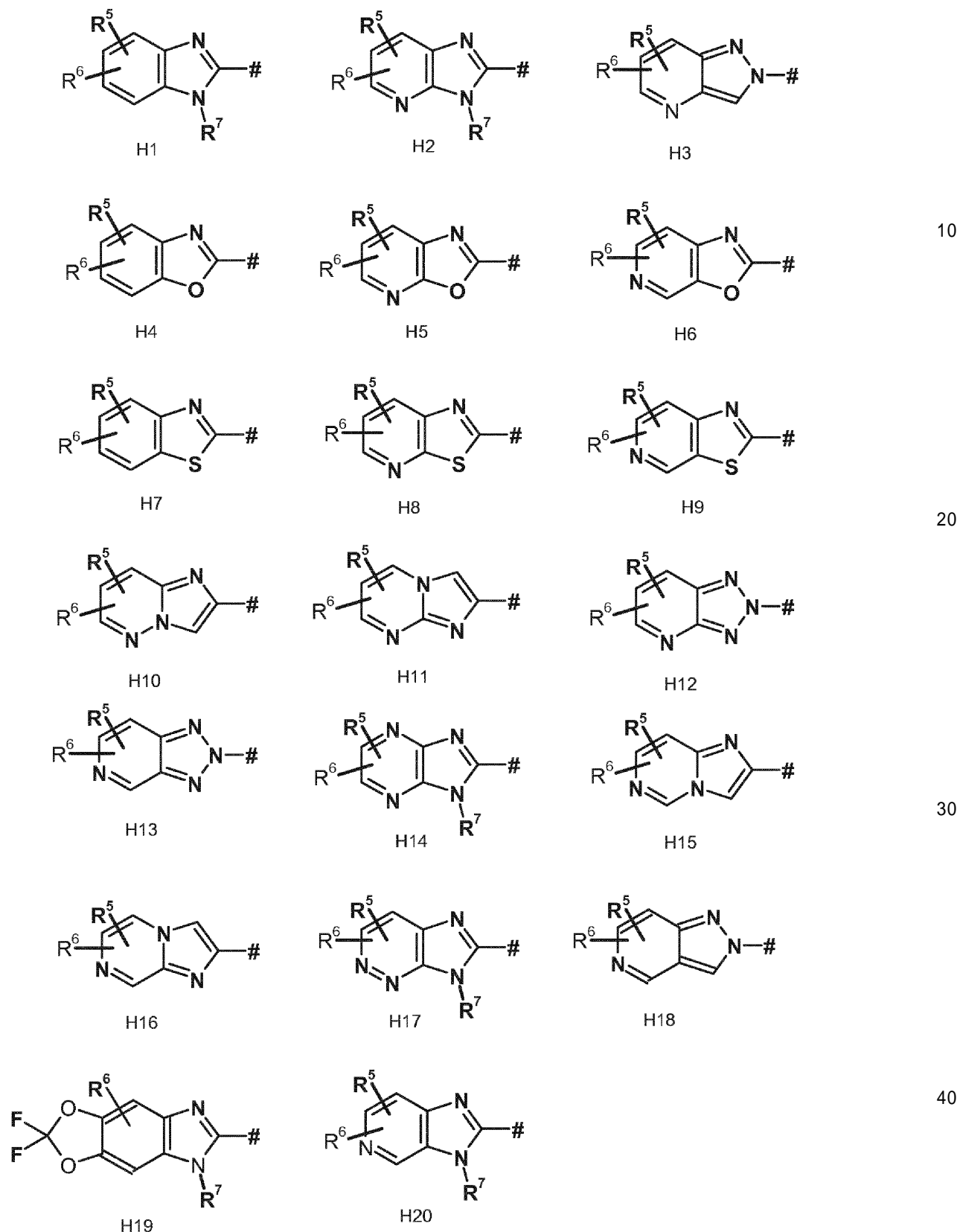
10

R⁴ は、特に好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ又は(C₁ - C₄) アルキルを表し；

20

X は、特に好ましくは、H₁ ~ H₂₀

【化4】



【0014】

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

R⁵、R⁶は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C

4) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル又はジ - (C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニルを表し；

10

R⁷ は、特に好ましくは、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) アルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキル又は(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキルを表し；

20

n は、特に好ましくは、0、1又は2を表す。

【0015】

上記特に好ましい実施形態では、R² は、Vに加えて、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ又は(C₁ - C₄) ハロアルコキシから選択される同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されることができ、

30

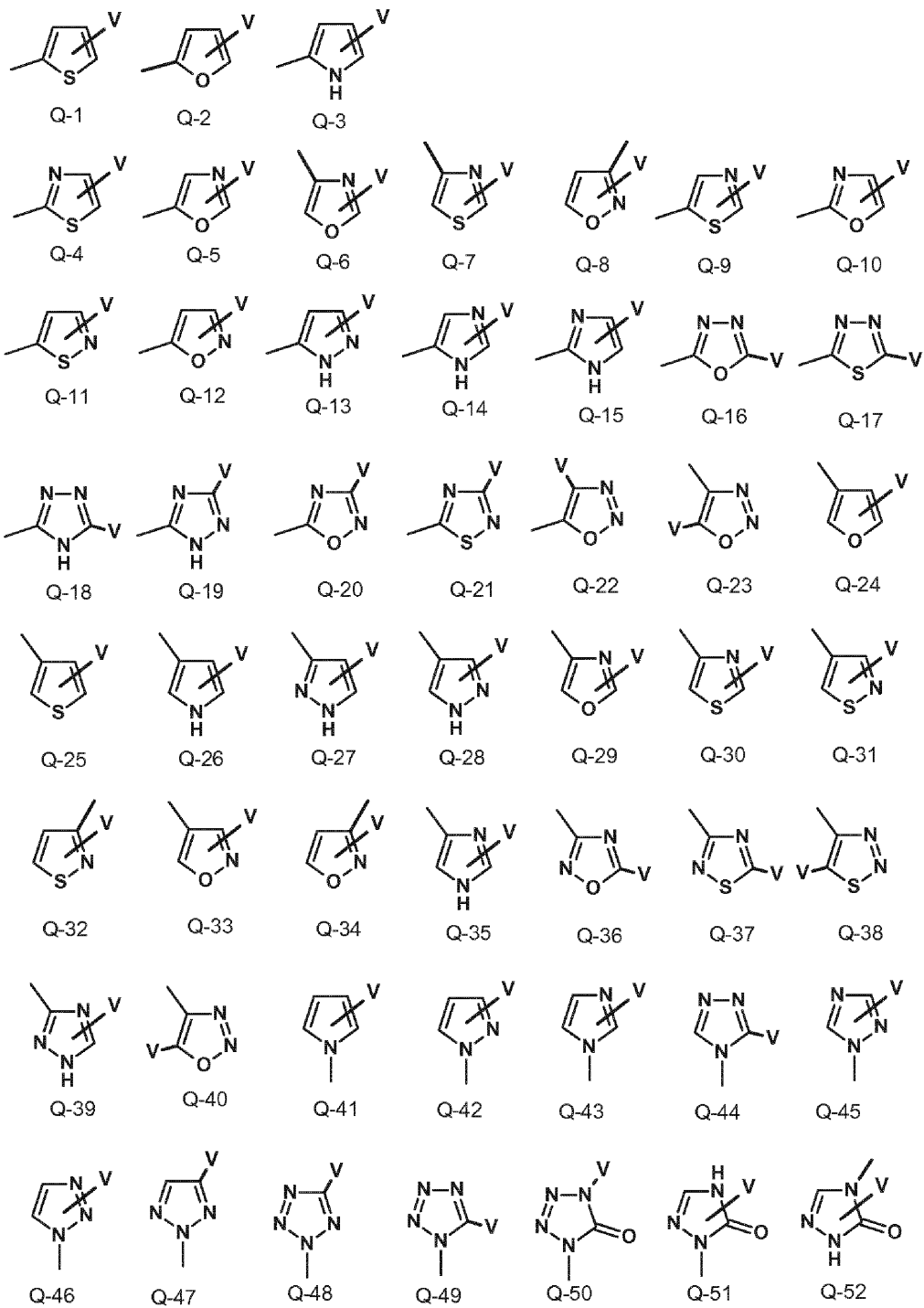
【0016】

形態3 - 2

A¹、R¹、R³、R⁴、X、R⁵、R⁶、R⁷及びnは、形態3 - 1において与えられている意味を有し；及び、

R² - Vは、特に好ましくは、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い群Q - 1 ~ Q - 80

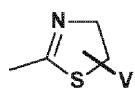
【化 5】



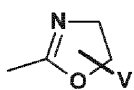
10

20

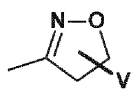
30



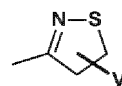
Q-53



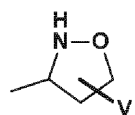
Q-54



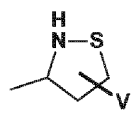
Q-55



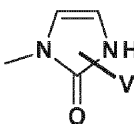
Q-56



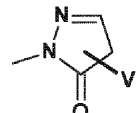
Q-57



Q-58

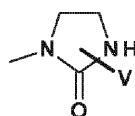


Q-59

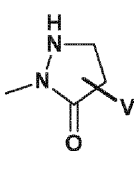


Q-60

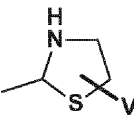
10



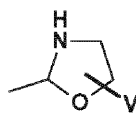
Q-61



Q-62

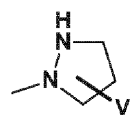


Q-63

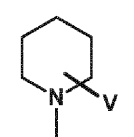


Q-64

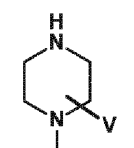
20



Q-65

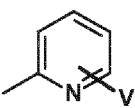


Q-66

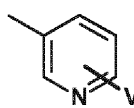


Q-67

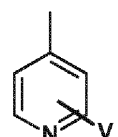
30



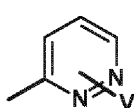
Q-68



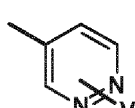
Q-69



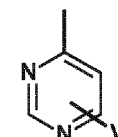
Q-70



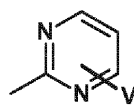
Q-71



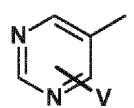
Q-72



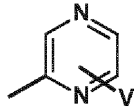
Q-73



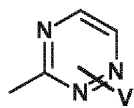
Q-74



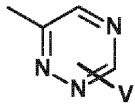
Q-75



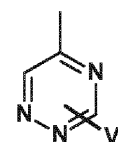
Q-76



Q-77

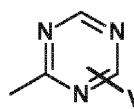


Q-78



Q-79

40



Q-80

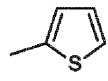
50

から選択される5員又は6員の環[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、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ又は(C₁-C₄)ハロアルコキシ]を表し；

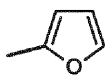
ここで、

Vは、特に好ましくは、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い群V-1~V-101

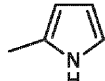
【化6】



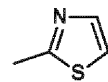
V-1



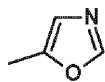
V-2



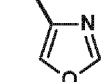
V-3



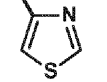
V-4



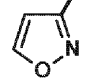
V-5



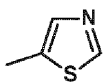
V-6



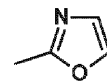
V-7



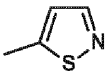
V-8



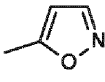
V-9



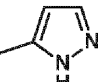
V-10



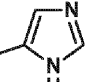
V-11



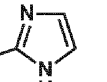
V-12



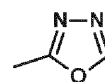
V-13



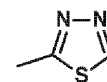
V-14



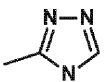
V-15



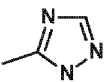
V-16



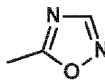
V-17



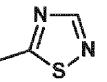
V-18



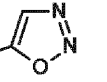
V-19



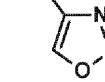
V-20



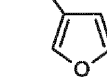
V-21



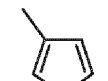
V-22



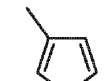
V-23



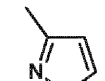
V-24



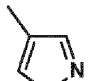
V-25



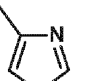
V-26



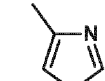
V-27



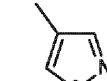
V-28



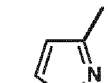
V-29



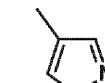
V-30



V-31



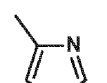
V-32



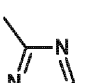
V-33



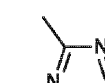
V-34



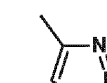
V-35



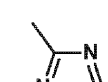
V-36



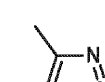
V-37



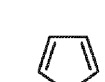
V-38



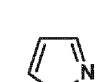
V-39



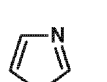
V-40



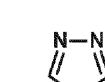
V-41



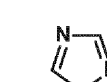
V-42



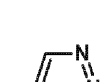
V-43



V-44



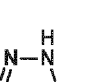
V-45



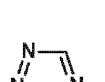
V-46



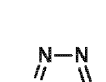
V-47



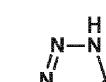
V-48



V-49



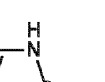
V-50



V-51



V-52



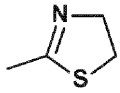
V-53

10

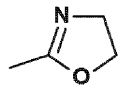
20

30

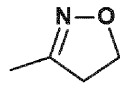
40



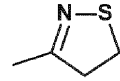
V-54



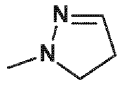
V-55



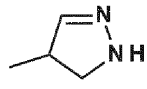
V-56



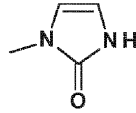
V-57



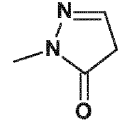
V-58



V-59

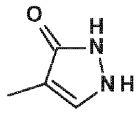


V-60

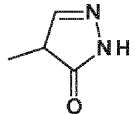


V-61

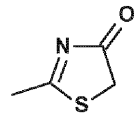
10



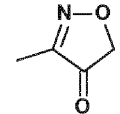
V-62



V-63

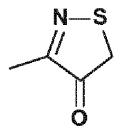


V-64

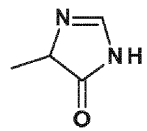


V-65

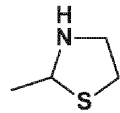
20



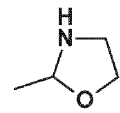
V-66



V-67

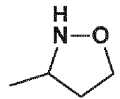


V-68

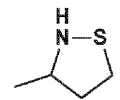


V-69

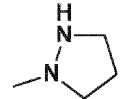
30



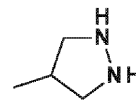
V-70



V-71

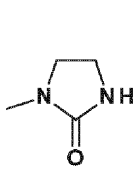


V-72

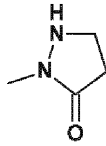


V-73

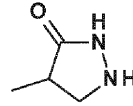
40



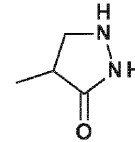
V-74



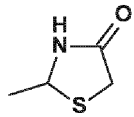
V-75



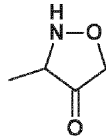
V-76



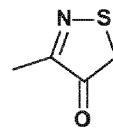
V-77



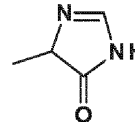
V-78



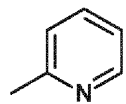
V-79



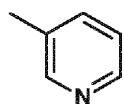
V-80



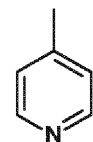
V-81



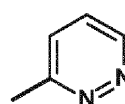
V-82



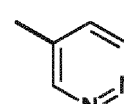
V-83



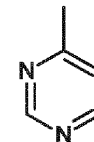
V-84



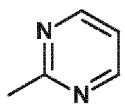
V-85



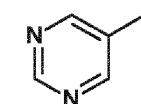
V-86



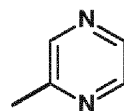
V-87



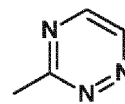
V-88



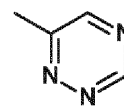
V-89



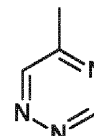
V-90



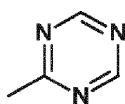
V-91



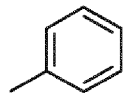
V-92



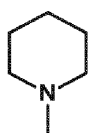
V-93



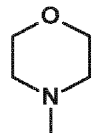
V-94



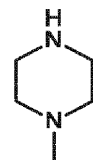
V-95



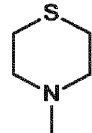
V-96



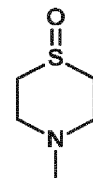
V-97



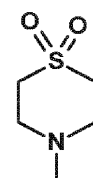
V-98



V-99



V-100



V-101

【 0 0 1 8 】

から選択される5員又は6員の環[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、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ又は(C₁-C₄)ハロアルコキシ]を表す。

【 0 0 1 9 】

上記特に好ましい実施形態では、R²は、Vに加えて、シアノ、ハロゲン、(C₁-C

10

20

30

40

50

4) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ又は(C₁ - C₄) ハロアルコキシから選択される同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されることができる。

【0020】

形態4-1

A¹ は、極めて特に好ましくは、窒素又は=C(R⁴)-を表し；

R¹ は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、シクロブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルを表し；

R²-Vは、極めて特に好ましくは、1置換されていてもよい群Q-1、Q-2、Q-3、Q-4、Q-5、Q-6、Q-7、Q-8、Q-9、Q-10、Q-12、Q-13、Q-14、Q-15、Q-16、Q-17、Q-24、Q-25、Q-26、Q-27、Q-28、Q-29、Q-30、Q-34、Q-35、Q-41、Q-42、Q-43、Q-44、Q-45、Q-46、Q-47、Q-48、Q-49、Q-50、Q-51、Q-52、Q-55、Q-59、Q-61、Q-66、Q-67、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-74又はQ-75から選択される5員又は6員の環[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、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、メトキシ又はトリフルオロメトキシ]を表し；

ここで、

Vは、極めて特に好ましくは、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、メトキシ又はトリフルオロメトキシから選択される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いV-1、V-2、V-3、V-4、V-5、V-6、V-7、V-9、V-10、V-16、V-17、V-18、V-19、V-20、V-21、V-24、V-25、V-27、V-28、V-29、V-30、V-35、V-36、V-39、V-42、V-43、V-44、V-45、V-46、V-47、V-48、V-49、V-50、V-51、V-52、V-53、V-60、V-82、V-83、V-84、V-85、V-86、V-87、V-88、V-89、V-90、V-91、V-92、V-93、V-94、V-95、V-96、V-97、V-98、V-99、V-100又はV-101から選択される環を表し；

R³ は、極めて特に好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル又はNHCO-(C₁ - C₄) アルキル((C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ)を表し；

Xは、極めて特に好ましくは、群H1、H2、H3、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H10、H11、H12、H13、H14、H15、H16、H17、H18、H19又はH20から選択される、ヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系を表し；

R⁴ は、極めて特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素又はシアノを表し；

R⁵ は、極めて特に好ましくは、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルフィニルを表し；

R⁶ は、極めて特に好ましくは、水素を表し；

R⁷ は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-

10

20

30

40

50

ブチル、イソブチル、tert-ブチル、メトキシメチル又はメトキシエチルを表し；
nは、極めて特に好ましくは、0、1又は2を表す。

【0021】

上記極めて特に好ましい実施形態では、R²は、Vに加えて、シアノ、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、メトキシ又はトリフルオロメトキシで1置換されることができる。

【0022】

形態4-2

A¹、R¹、R³、R⁴、X、R⁵、R⁶、R⁷及びnは、形態4-1において与えられている意味を有し；及び、

R²-Vは、極めて特に好ましくは、1置換されていてよい群Q-1、Q-2、Q-3、Q-4、Q-5、Q-6、Q-7、Q-8、Q-9、Q-10、Q-12、Q-13、Q-14、Q-15、Q-16、Q-17、Q-24、Q-25、Q-26、Q-27、Q-28、Q-29、Q-30、Q-34、Q-35、Q-41、Q-42、Q-43、Q-44、Q-45、Q-46、Q-47、Q-48、Q-49、Q-50、Q-51、Q-52、Q-55、Q-59、Q-61、Q-66、Q-67、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-74又はQ-75から選択される5員又は6員の環[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、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ又はトリフルオロメトキシ]を表し；

ここで、

Vは、極めて特に好ましくは、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ又はトリフルオロメトキシから選択される同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されていてよいV-1、V-2、V-3、V-4、V-5、V-6、V-7、V-9、V-10、V-16、V-17、V-18、V-19、V-20、V-21、V-24、V-25、V-27、V-28、V-29、V-30、V-35、V-36、V-39、V-42、V-43、V-44、V-45、V-46、V-47、V-48、V-49、V-50、V-51、V-52、V-53、V-60、V-82、V-83、V-84、V-85、V-86、V-87、V-88、V-89、V-90、V-91、V-92、V-93、V-94、V-95、V-96、V-97、V-98、V-99、V-100又はV-101から選択される環を表す。

【0023】

上記極めて特に好ましい実施形態では、R²は、Vに加えて、シアノ、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ又はトリフルオロメトキシで1置換されることができる。

【0024】

形態5-1

A¹は、重要的には、窒素を表し；

R¹は、重要的には、エチルを表し；

R²-Vは、重要的には、群Q-42、Q-50、Q-51、Q-52、Q-59又はQ-61から選択される環を表し；

ここで、

Vは、重要的には、フッ素、塩素又は臭素から選択される同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は2置換されていてよい群V-82又はV-95から選択される環を表し；

R³は、重要的には、水素を表し；

Xは、重要的には、群H20から選択されるヘテロ芳香族環系を表し；

10

20

30

40

50

R⁵ は、重要的には、トリフルオロメチルを表し；

R⁶ は、重要的には、水素を表し；

R⁷ は、重要的には、メチルを表し；

n は、重要的には、2を表す。

【0025】

形態5-2

A¹ は、重要的には、窒素を表し；

R¹ は、重要的には、エチルを表し；

R² - V は、重要的には、塩素又はトリフルオロメチルで1置換されていてもよい群 Q - 12、Q - 27、Q - 28、Q - 42、Q - 45、Q - 50、Q - 51、Q - 52、Q - 59又はQ - 61から選択される環を表し；

10

ここで、

V は、重要的には、フッ素、塩素又は臭素から選択される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い群 V - 2、V - 82、V - 83又はV - 95から選択される環を表し；

R³ は、重要的には、水素を表し；

X は、重要的には、群 H 1、H 2、H 15又はH 20から選択されるヘテロ芳香族環系を表し；

R⁵ は、重要的には、トリフルオロメチルを表し；

R⁶ は、重要的には、水素を表し；

20

R⁷ は、重要的には、メチルを表し；

n は、重要的には、2を表す。

【0026】

重要な実施形態では、R² は、Vに加えて、塩素又はトリフルオロメチルで1置換されることができる。

【0027】

環 Q - 1 ~ Q - 80における置換は、及び、環 V - 1 ~ V - 101における置換も、炭素原子及び/又は窒素原子における水素の置換であり得る。

【0028】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、H1を表し、並びに、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹、V、X及びnは、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

30

【0029】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、H2を表し、並びに、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶、R⁷、A¹、V、X及びnは、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0030】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、H3を表し、並びに、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶、V、X及びnは、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

40

【0031】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、H4を表し、並びに、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶、A¹、V、X及びnは、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0032】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、H5を表し、並びに、R¹

50

、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0033】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_6 を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0034】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_7 を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

10

【0035】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_8 を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0036】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_9 を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

20

【0037】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_{10} を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0038】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_{11} を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

30

【0039】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_{12} を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0040】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_{13} を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

40

【0041】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_{14} を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0042】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、 H_{15} を表し、並びに、 R

50

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0043】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、H16を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0044】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、H17を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

10

【0045】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、H18を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0046】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、H19を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

20

【0047】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 X は、H20を表し、並びに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 A^1 、 V 、 X 及び n は、形態(3-1)又は形態(3-2)又は形態(4-1)又は形態(4-2)又は形態(5-1)又は形態(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0048】

好ましい定義において、別途示されていない限り：

30

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

【0049】

特に好ましい定義において、別途示されていない限り：

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

【0050】

本発明に関連して、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて(例えば、ハロアルキル)、1~12個の炭素原子を有する飽和脂肪族炭化水素基のラジカルを意味するものと理解され、そして、直鎖又は分枝鎖であることができる。 C_1 - C_{12} -アルキルラジカルの例は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、 n -ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、*tert*-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、1-エチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、 n -ヘプチル、 n -オクチル、 n -ノニル、 n -デシル、 n -ウンデシル及び n -ドデシルである。これらのアルキルラジカルの中で、特に好ましいのは、 C_1 - C_6 -アルキルラジカルである。特別に好ましいのは、 C_1 - C_4 -アルキルラジカルである。

40

【0051】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルケニル」

50

は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の二重結合を有している直鎖又は分枝鎖の $C_2 - C_{12}$ -アルケニルラジカル、例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ペンタジエニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル及び1,4-ヘキサジエニルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、 $C_2 - C_6$ -アルケニルラジカルであり、特に好ましいのは、 $C_2 - C_4$ -アルケニルラジカルである。

【0052】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の三重結合を有している直鎖又は分枝鎖の $C_2 - C_{12}$ -アルキニルラジカル、例えば、エチニル、1-プロピニル及びプロパルギルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、 $C_3 - C_6$ -アルキニルラジカルであり、特に好ましいのは、 $C_3 - C_4$ -アルキニルラジカルである。該アルキニルラジカルは、少なくとも1の二重結合も含むことができる。

10

【0053】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「シクロアルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルラジカル、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル及びシクロオクチルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルラジカルである。

20

【0054】

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

【0055】

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

30

【0056】

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

【0057】

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

40

【0058】

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

【0059】

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

【0060】

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)で表される化合物の使用である。

【0061】

50

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

【0062】

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

【0063】

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。

10

【0064】

調製方法 A

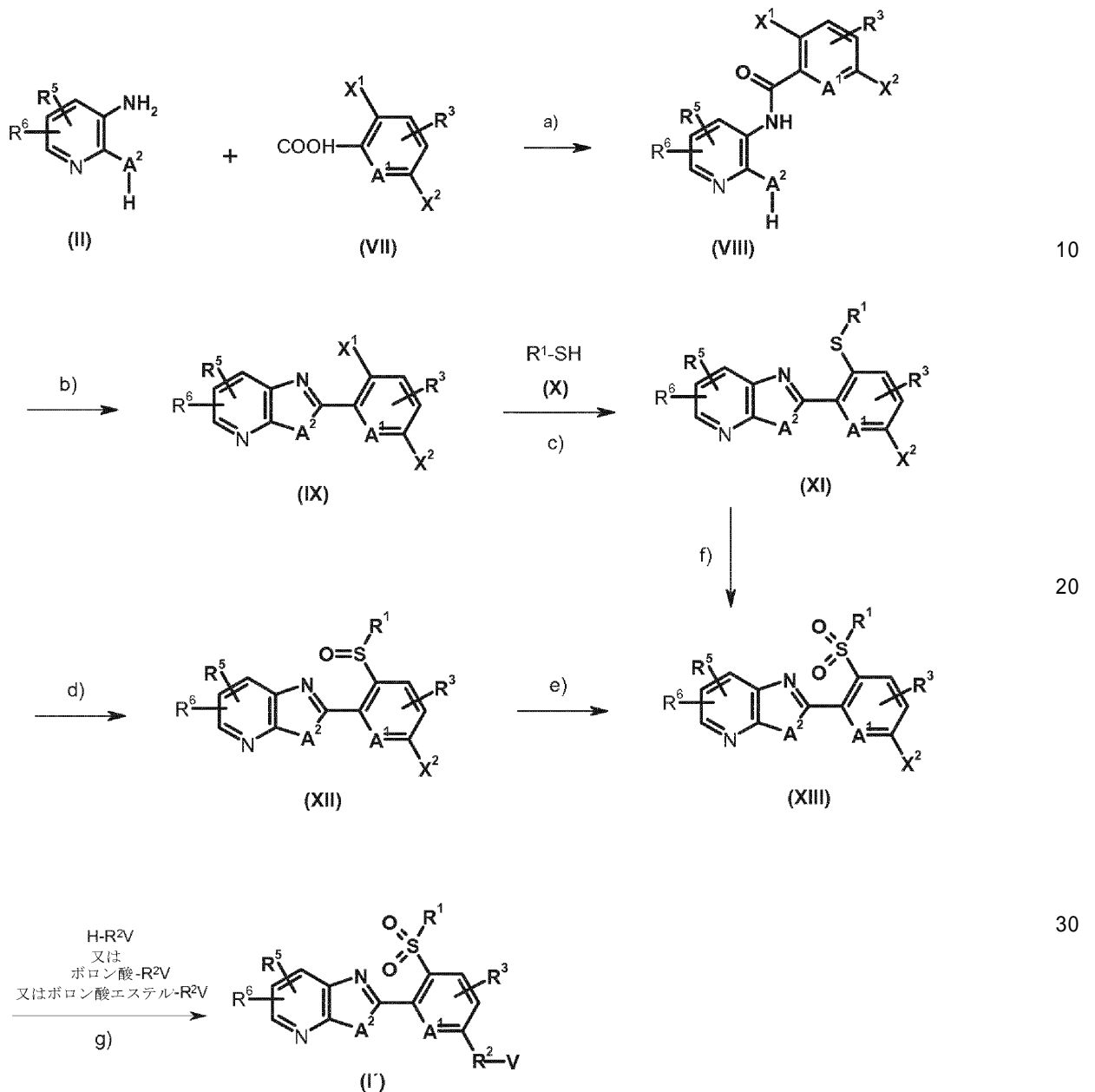
式(I)〔式中、Xは、H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H14、H19又はH20を表す〕で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928又はWO2015/000715に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0065】

式(I)〔式中、Xは、H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H14、H19又はH20を表す〕で表される化合物を調製するための一般的な調製方法は、実施例H2、実施例H5及び実施例H8を参照して以下に記載されている。

20

【化7】



【0066】

ラジカル R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 及び V は、上記で記載されている意味を有し、 A^2 は、 $-N-R^7$ 、 O 又は S を表し、ここで、 R^7 は、上記で記載されている意味を有し、並びに、 X^1 及び X^2 は、ハロゲンを表す。

【0067】

段階 (a)

式 (VII) で表される化合物は、US 5 576 335 に記載されている調製方法と同様にして、式 (II) で表される化合物を、縮合剤又は塩基の存在下で、式 (VII) で表されるカルボン酸と反応させることによって、調製することができる。

【0068】

式 (II) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2 003 / 6 9257 若しくは WO 2 006 / 6 5703 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。

【0069】

式 (VII) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば

、US2010/234604、WO2012/61926若しくは「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18(2008), 5023-5026」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。

【0070】

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

10

【0071】

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

【0072】

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

20

【0073】

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

【0074】

段階(b)

式(IX)で表される化合物は、例えば、WO2012/86848に記載されている調製方法と同様にして、式(VIII)で表される化合物を縮合させることによって、調製することができる。

30

【0075】

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

40

【0076】

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

【0077】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)又は1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリ

50

フェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル（例えば、アゾジカルボン酸ジエチル）の混合物。

【0078】

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

【0079】

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

10

【0080】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

【0081】

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

【0082】

段階(c)

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

20

【0083】

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

【0084】

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

30

【0085】

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

40

【0086】

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

【0087】

段階(d)

式(XII)で表される化合物は、式(XI)で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。この酸化は、一般に、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロ

50

ゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0088】

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

【0089】

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

【0090】

段階 (e)

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

【0091】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【0092】

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

【0093】

段階 (f)

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

【0094】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【0095】

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

【0096】

段階 (g)

式 (I') [式中、 $R^2 - V$ は、当該分子の残部に窒素を介して結合している二環を表す] で表される化合物の調製は、例えば、式 (X I I I) [式中、 X^2 は、好ましくは、群塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す] で表される化合物から、文献 (例えば、以下のものを参照されたい：Journal of Organic Chemistry (2010), 69, 5578) において知られている方法によって、例えば、ヨウ化銅 (I) 及び塩基性反応助剤 (例えば、トランス - N, N' - ジメチルシクロヘキサン - 1, 2 - ジアミン及び炭酸カリウム) の存在下、適切な溶媒又は希釈剤の中で、実施することができる。

【0097】

必要とされる式 $H - R^2 V$ で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。

【0098】

有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒 (例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素) が包含される。好ましくは、トルエンを使用する。さらに、該カップリングは、適切な溶媒又は希釈剤の中で、適切な塩基 (例えば、炭酸カリウム又は炭酸セシウム)

10

20

30

40

50

の存在下、金属触媒を使用せずに、式(XIII)〔式中、X²は、好ましくは、群フッ素、塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す〕で表される化合物から実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒(例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素)が包含される。ここで、好ましくは、アセトニトリル又はジメチルホルムアミドを使用する。

【0099】

式(I')〔式中、R²-Vは、当該分子の残部に炭素を介して結合している二環を表す〕で表される化合物は、例えば、式(XIII)〔式中、X²は、好ましくは、群塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す〕で表される化合物から、概して知られている方法(cf. 「Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483」、10「Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695」、20「Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004」)によって、調製することができる。

【0100】

例えば、式(XIII)〔式中、X²は、好ましくは、塩素又は臭素を表す〕で表される化合物は、既知方法(cf. WO2010071819)によって、遷移金属塩の群から選択される適切な触媒の存在下で、適切なアリールボロン酸又はそのエステルと反応させて、式(I')で表される化合物を生成させることができる。好ましいカップリング触媒の例としては、パラジウム触媒、例えば、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)又はテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムなどを挙げるができる。該調製方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウム又はカリウムの炭酸塩である。

【0101】

必要とされる(ヘテロ)アリールボロン酸又は(ヘテロ)アリールボロン酸エステルの一部は、既知であるか、及び/若しくは、市販されており、又は、それらは、一般的に知られている方法で調製することができる(cf. Boronic Acids (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011)。30

【0102】

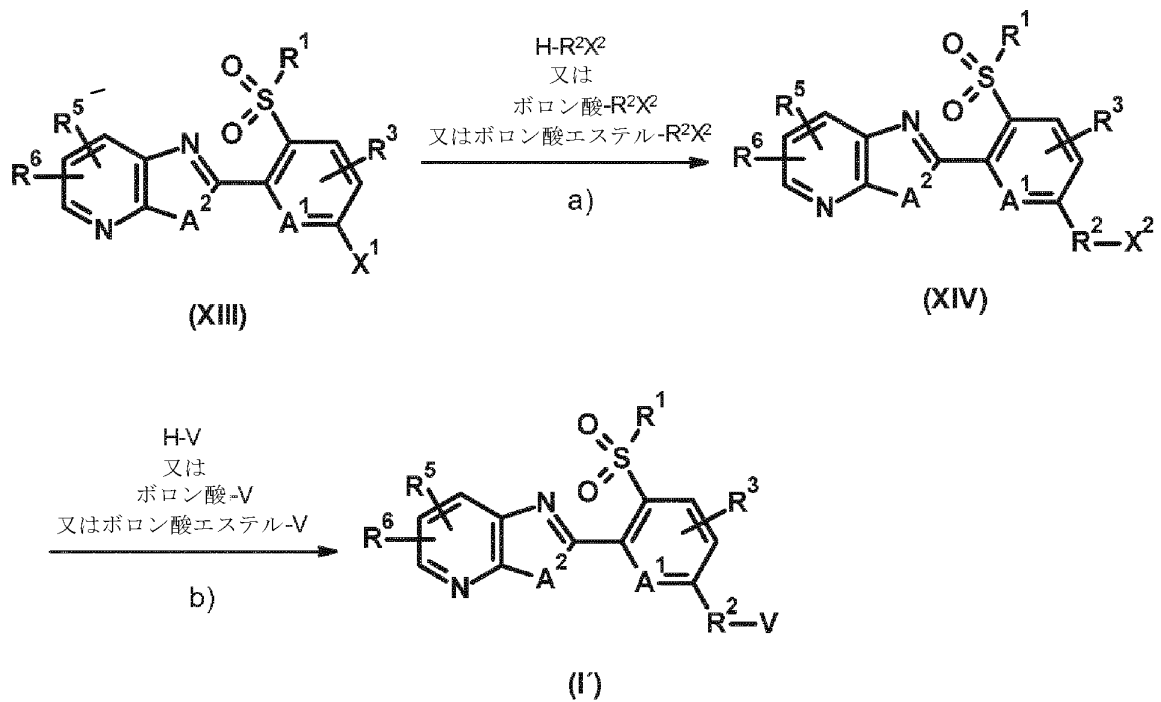
段階(g)の反応は、さらにまた、式(XI)又は式(XII)で表される化合物から出発して実施することも可能である。

【0103】

調製方法B

式(I)〔式中、Xは、H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H14、H19又はH20を表す〕で表される化合物を調製するための一般的な調製方法は、実施例H2、実施例H5及び実施例H8を参照して以下に記載されている。

【化8】



10

20

【0104】

ラジカル R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 A^1 及び V は、上記で記載されている意味を有し、 A^2 は、 $-N-R^7$ 、 O 又は S を表し、ここで、 R^7 は、上記で記載されている意味を有し、並びに、 X^1 及び X^2 は、ハロゲンを表す。

【0105】

段階 (a)

式 (XIV) [式中、 R^2-X^2 は、当該分子の残部に窒素を介して結合している環を表す] で表される化合物の調製は、例えば、式 (XIII) [式中、 X^1 は、好ましくは、群塩素又は臭素から選択されるハロゲンである] で表される化合物から、文献 (例えば、以下のものを参照されたい: *Journal of Organic Chemistry* (2010), 69, 5578) において知られている方法によって、例えば、ヨウ化銅 (I) 及び塩基性反応助剤 (例えば、トランス- N, N' -ジメチルシクロヘキサン-1, 2-ジアミン及び炭酸カリウム) の存在下、適切な溶媒又は希釈剤の中で、実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒 (例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素) が包含される。好ましくは、トルエンを使用する。さらに、該カップリングは、式 (XIII) [式中、 X^1 は、好ましくは、群フッ素、塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す] で表される化合物から、適切な溶媒又は希釈剤の中で、適切な塩基 (例えば、炭酸カリウム又は炭酸セシウム) の存在下、金属触媒を使用せずに、実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒 (例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素) が包含される。ここで、好ましくは、アセトニトリル又はジメチルホルムアミドを使用する。

30

40

【0106】

必要とされる式 $H-R^2X^2$ で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。

【0107】

式 (XIV) [式中、 R^2-X^2 は、当該分子の残部に炭素を介して結合している環を表す] で表される化合物は、例えば、式 (XIII) [式中、 X^1 は、好ましくは、群塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す] で表される化合物から、概して知られている方法 (cf. *Chem. Rev.* 1995, 95, 2457-2483)、

50

「Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695」、*Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004) によって、調製することができる。

【0108】

例えば、式(XIII)〔式中、X¹は、好ましくは、塩素又は臭素を表す〕で表される化合物は、既知方法(c f. WO2010071819)によって、遷移金属塩の群から選択される適切な触媒の存在下で、適切なアリールボロン酸又はそのエステルと反応させて、式(XIV)で表される化合物を生成させることができる。好ましいカップリング触媒の例としては、パラジウム触媒、例えば、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィン)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)又はテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムなどを挙げることができる。該調製方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウム又はカリウムの炭酸塩である。

10

【0109】

必要とされる(ヘテロ)アリールボロン酸又は(ヘテロ)アリールボロン酸エステルの一部は、既知であるか、及び/若しくは、市販されており、又は、それらは、一般的に知られている方法で調製することができる(c f. *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011)。

20

【0110】

段階(b)

式(I')〔式中、R²-Vは、当該分子の残部に窒素を介して結合している二環を表す〕で表される化合物の調製は、例えば、式(XIV)〔式中、X²は、好ましくは、群塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す〕で表される化合物から、文献(例えば、以下のものを参照されたい: *Journal of Organic Chemistry* (2010), 69, 5578)において知られている方法によって、例えば、ヨウ化銅(I)及び塩基性反応助剤(例えば、トランス-N,N'-ジメチルシクロヘキサン-1,2-ジアミン及び炭酸カリウム)の存在下、適切な溶媒又は希釈剤の中で、実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒(例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素)が包含される。好ましくは、トルエンを使用する。さらに、該カップリングは、式(XIV)〔式中、X²は、好ましくは、群フッ素、塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す〕で表される化合物から、適切な溶媒又は希釈剤の中で、適切な塩基(例えば、炭酸カリウム又は炭酸セシウム)の存在下、金属触媒を使用せずに、実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒(例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素)が包含される。ここで、好ましくは、アセトニトリル又はジメチルホルムアミドを使用する。

30

【0111】

必要とされる式H-Vで表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。

40

【0112】

式(I')〔式中、R²-Vは、当該分子の残部に炭素を介して結合している二環を表す〕で表される化合物は、例えば、式(XIV)〔式中、X²は、好ましくは、群塩素又は臭素から選択されるハロゲンを表す〕で表される化合物から、概して知られている方法(c f. 「Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483」、*Tetrahedron* 2002, 58, 9633-9695)、*Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004) によって、調製することができる。

50

【0113】

例えば、式(XIV)〔式中、 X^2 は、好ましくは、塩素又は臭素を表す〕で表される化合物は、既知方法(c.f. WO2010071819)によって、遷移金属塩の群から選択される適切な触媒の存在下で、適切なアリールボロン酸又はそのエステルと反応させて、式(I')で表される化合物を生成させることができる。好ましいカップリング触媒の例としては、パラジウム触媒、例えば、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)又はテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムなどを挙げるができる。該調製方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウム又はカリウムの炭酸塩である。

【0114】

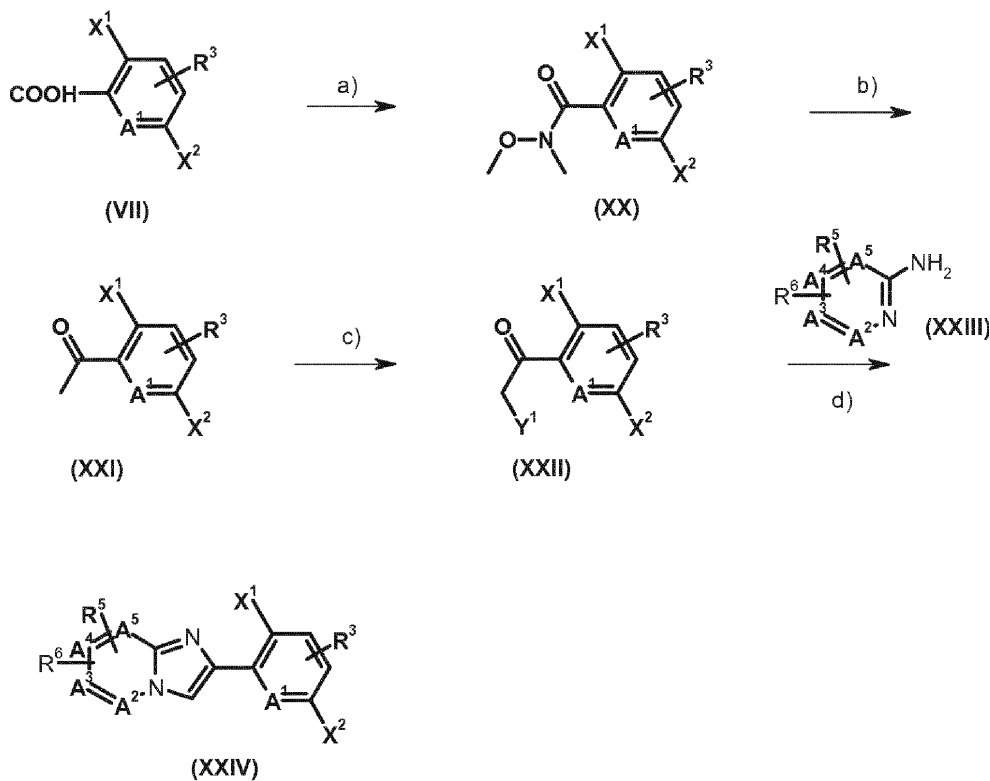
必要とされる(ヘテロ)アリールボロン酸又は(ヘテロ)アリールボロン酸エステルの一部は、既知であるか、及び/若しくは、市販されており、又は、それらは、一般的に知られている方法で調製することができる(c.f. Boronic Acids (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011)。

【0115】

調製方法C

式(I)〔式中、Xは、H10、H11、H15又はH16を表す〕で表される化合物は、既知方法で、例えば、US2009/203705、US2012/258951、WO2013/3298又は「J. Med. Chem. 31, (1988) 1590-1595」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【化9】



【0116】

ラジカル A^1 、 R^3 、 R^5 及び R^6 は、上記に記載されている意味を有する。 X^1 、 X^2 及び Y^1 は、ハロゲンを表す。 A^2 、 A^3 、 A^4 及び A^5 は、互いに独立して、CH又はNを表す(ここで、 A^2 、 A^3 、 A^4 及び A^5 は、同時にNを表すことはない)。

【0117】

段階(a)

10

20

30

40

50

式(VII)で表されるカルボン酸を、WO2011/75643又はEP-A-2671582に記載されている調製方法と同様にして、O,N-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩の存在下で、式(XX)で表されるワインレブアミドに変換させる。

【0118】

式(VII)で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2010/234604、WO2012/61926又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18(2008), 5023-5026」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。

【0119】

段階(b)、(c)

次いで、式(XX)で表される化合物を、既知方法で、例えば、WO2011/75643に記載されている調製方法と同様にして、グリニヤール試薬(例えば、臭化メチルマグネシウム)を用いて、式(XXI)で表されるケトンに変換させることができる。次いで、例えば、US2012/302573又は「Eur. J. Org. Chem. 2013, 1551-1557」に記載されている既知方法と同様にして、ハロゲン化に付すことによって、式(XXII)で表される化合物が得られる。

【0120】

段階(d)

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

【0121】

式(XXIII)で表される化合物は、市販されている。

【0122】

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

【0123】

調製方法D

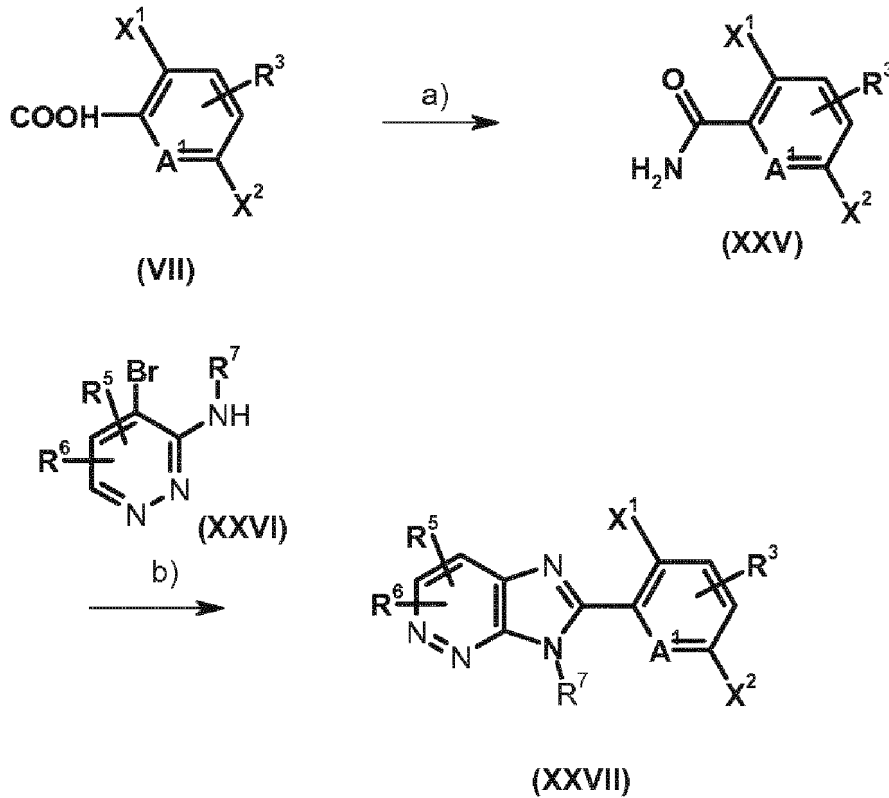
式(I)〔式中、Xは、H17を表す〕で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO2014/142292に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

10

20

30

【化10】



10

20

【0124】

ラジカル A¹、R³、R⁵、R⁶ 及び R⁷ は、上記で記載されている意味を有する。X¹ 及び X² は、ハロゲンを表す。

【0125】

段階 (a)

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

30

【0126】

式 (VII) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2010/234604、WO 2012/61926 又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18(2008), 5023-5026」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。

【0127】

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

40

【0128】

適切な縮合剤は、例えば、カルボニルジイミダゾールなどである。

【0129】

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

【0130】

段階 (b)

50

式 (XXVII) で表される化合物は、WO2014/142292 に記載されている調製方法と同様にして、式 (XXV) で表される化合物を、塩基性媒体の中で、パラジウム触媒の存在下、式 (XXVI) で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

【0131】

式 (XXVI) で表される化合物は、例えば、WO2014/142292 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。パラジウム触媒として使用するのに適しているものは、例えば、[1,1'-ビス-(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム (II) などである。多くの場合、使用する塩基は、無機塩基、例えば、カリウム *tert*-ブトキシドなどである。

10

【0132】

該反応は、溶媒の中で実施する。多くの場合、トルエンを使用する。

【0133】

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

【0134】

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

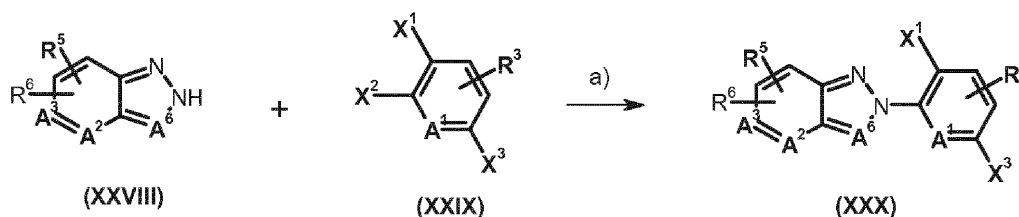
【0135】

調製方法 E

式 (I) [式中、X は、H³、H¹²、H¹³ 又は H¹⁸ を表す] で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO2010/091310、WO2012/66061 又は WO2013/099041 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

20

【化11】



30

【0136】

ラジカル A¹、R³、R⁵ 及び R⁶ は、上記に記載されている意味を有する。A²、A³ 及び A⁶ は、互いに独立して、CH 又は N を表す (ここで、A² 及び A³ は、同時に N を表すことはできない)。X¹、X² 及び X³ は、ハロゲンを表す。

【0137】

段階 (a)

式 (XXX) で表される化合物は、例えば、「Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947」に記載されている調製方法と同様にして、パラジウムが触媒する N-アリール化を用いて、式 (XXVII) で表される化合物を式 (XXIX) で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

40

【0138】

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

【0139】

50

式 (XXIX) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、WO 2013/43518、EP - A - 2168965 又は「Journal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 1449 - 1455」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。

【0140】

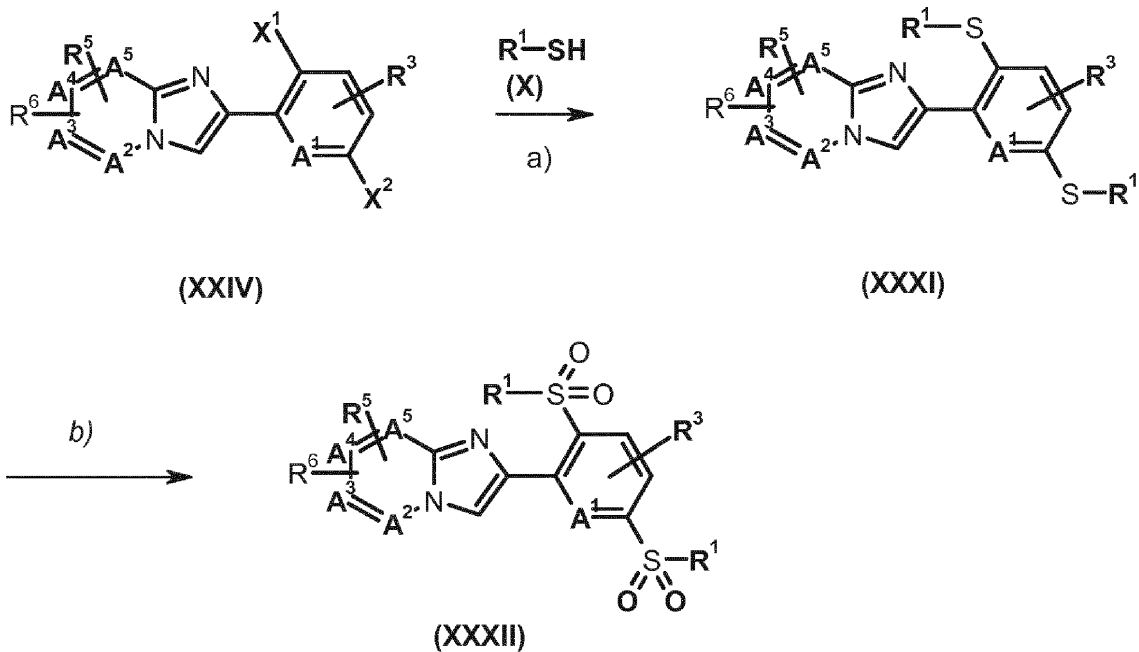
式 (XXX) で表される化合物の式 (I) で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法 A ~ 調製方法 B と同様にして、実施する。

【0141】

調製方法 F

式 (I) [式中、X は、H1、H2、H4、H5、H6、H7、H8、H9、H10、H11、H14、H15、H16、H17、H19 又は H20 を表す] で表される化合物は、代替的に、下記方法によって調製することも可能である。該方法は、実施例 H10、実施例 H11、実施例 H15 及び実施例 H16 を参照して以下に記載されている。

【化12】



10

20

30

【0142】

ラジカル A¹、R³、R⁵ 及び R⁶ は、上記に記載されている意味を有する。X¹ 及び X² は、ハロゲンを表す。A²、A³、A⁴ 及び A⁵ は、互いに独立して、CH 又は N を表す (ここで、A²、A³、A⁴ 及び A⁵ は、同時に N を表すことはない)。

【0143】

段階 (a)

調製方法 A 段階 (c) と同様にして、式 (XXIV) で表される化合物から、スルフィドの代わりに、式 (XXXI) で表されるジスルフィドを形成させることも可能である。

40

【0144】

段階 (b)

式 (XXXI) で表されるジスルフィドを、調製方法 A 段階 (f) と同様にして、式 (XXXII) で表されるジスルホンに変換させることができる。

【0145】

式 (XXXII) で表される化合物の式 (I) [式中、R² - V は、当該分子の残部に窒素を介して結合している二環を表す] で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法 A 段階 (g) と同様にして、適切な溶媒又は希釈剤 (例えば、アセトニトリル又はジメチルホルムアミド) の中で、適切な塩基 (例えば、炭酸カリウム又は炭酸セシウム) の存在

50

下で、実施する。

【0146】

方法及び使用

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

【0147】

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。

10

【0148】

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。

【0149】

式(I)で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、恒温動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、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

20

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。

【0150】

本特許出願に関連して、用語「衛生学(hygiene)」は、疾患(特に、感染症)を予防すること、並びに、ヒト、動物及び/若しくは環境を健康に保つのに役立つこと、並びに/又は、清潔を維持することを目的とする、全ての手段、プロセス及び方法の全体を意味するものと理解される。本発明によれば、これには、特に、きれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、例えば、繊維又は硬質表面(主に、ガラス製、木製、コンクリート製、磁器製、セラミック製、プラスチック製の表面、又は、金属(類)製の表面)をきれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、並びに、それらを衛生害虫及び/又はその排泄物が存在していない状態に維持することが包含される。本発明によれば、再度これに関連して、ヒト又は動物の身体を外科的に又は治療的に処置する方法、及び、ヒト又は動物の身体に対してなされる診断プロセスは、除外される。

30

【0151】

かくして、用語「衛生学の分野」には、そのような衛生学的な手段、プロセス及び方法が重要である全ての領域、技術分野及び商業的な利用、例えば、調理場、パン屋、空港、浴場、スイミングプール、ショッピングセンター、ホテル、病院、畜舎などの衛生が包含される。

【0152】

40

従って、用語「衛生害虫」は、衛生学の分野におけるその存在が問題である(特に、健康上の理由で問題である)1種類以上の害虫を意味するものと理解される。従って、主な目的は、衛生害虫を最小限に抑制するか若しくは防止すること、又は、衛生学の分野において衛生害虫との接触を最小限に抑制するか若しくは防止することである。このことは、特に、殺害虫剤を使用することによって達成することが可能であり、ここで、該殺害虫剤は、予防的に使用することが可能であり、及び、害虫が発生している場合においてのみ、その害虫を防除するために使用することが可能である。害虫との接触を回避するか又は低減させることによって作用する薬剤を使用することも可能である。衛生害虫は、例えば、以下に挙げられている生物である。

【0153】

50

かくして、用語「衛生学的な保護」には、そのような衛生学的な手段、プロセス及び方法を維持及び/又は改善するのに役立つ全ての行為が包含される。

【0154】

式(I)で表される化合物は、好ましくは、殺有害生物剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、さらに、全ての発育段階又は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：

節足動物門の害虫、特に、クモ綱(Arachnida)の、例えば、アカルス属種(Acarus spp.)、例えば、アカルス・シロ(Acarus siro)、アケリア・クコ(Aceria kuko)、アケリア・シェルドニ(Aceria she 10
ldoni)、アクトプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Aculus spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ(Aculus fockeui)、アクルス・シュレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス(Amphitetranychus viennensis)、アルガス属種(Argas spp.)、ボオフィルス属種(Boophilus spp.)、ブレビバルプス属種(Brevipalpus spp.)、例えば、ブレビバルプス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis)、ブリオビア・グラミナム(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 20
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(Epitimerus 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(Eriophy 30
es 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 40
ゴニクス・コフェアエ(Oligonychus coffeae)、オリゴニクス・コニフェラルム(Oligonychus coniferarum)、オリゴニクス・イリシス(Oligonychus ilicis)、オリゴニクス・インジクス(Oligonychus indicus)、オリゴニクス・マンギフェルス(Oligonychus mangiferus)、オリゴニクス・プラテンシス(Oligonychus pratensis)、オリゴニクス・プニカエ(Oligonychus punicae)、オリゴニクス・イオテルシ(Oligonychus yothersi)、オルニトドルス属種(Ornithodoros spp.)、オルニトニスス属種(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 50

タテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*)、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピッキ (*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 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコペルシシ (*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 (*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 (*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*)、ロボプテラ・デシピエンス (*Loboptera decipiens*)、ネオスチロピガ・ロムビフォリア (*Neostylopyga rhombifolia*)、パンクロラ属種 (*Panchlora* spp.)、パルコブラッタ属種 (*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・オーストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus surinamensis*)、スベラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) ;

コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツ (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種 (*Adoretus* spp.)、アエチナ・ツミダ (*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリオテス属種 (*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・リンネアツ (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・ブクタク (*Anobium punctatum*) ;

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 caerulelescens*)、ブルキジウス・オブテクトゥス (*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・ルフィマヌス (*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 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・カリアトリベス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adspersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属種 (*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zeae*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis* spp.)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボデルス属種 (*Diloboderus* spp.)、エピカエルス属種 (*Epicaerus* spp.)、エピラクナ属種 (*Epilachna* spp.)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilachna borealis*)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna varivestis*)、エピトリキス属種 (*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 (*E*

10

20

30

40

50

pitrix 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 subcristata*)、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・ポストカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムベイ (*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 serricornis*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius* spp.)、レマ属種 (*Lema* spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera coffeella*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リストロノツス属種 (*Listronotus* spp.) (=ヒペロデス属種 (*Hyperodes* spp.)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、ルペロデス属種 (*Luperodes* spp.)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、リクツス属種 (*Lyctus* spp.)、メガセリス属種 (*Megascelis* spp.)、メラノツス属種 (*Melanotus* spp.)、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属種 (*Melolontha* spp.)、例えば、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属種 (*Monochamus* spp.)、ナウパクツス・キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属種 (*Necrobia* spp.)、ネオガレルセラ属種 (*Neogalerucella* spp.)、ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナムシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Otiiorhynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiiorhynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiiorhynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiiorhynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiiorhynchus rugosostriarius*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiiorhynchus sulcatus*)、オウレマ属種 (*Oulema* spp.)、例えば、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、オキシセトニア・ジユクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllorhaga* spp.)、フィロファガ・ヘレリ (*Phyllorhaga 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 armo*

10

20

30

40

50

raciae)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)、
 フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・スト
 リオラタ (*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ (*P*
*opil**lia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrype*
s spp.)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus tru*
ncatus)、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 (*Ptin*
us spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventrali* 10
s)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、リンコホル
 ルス属種 (*Rhynchophorus* spp.)、リンコホルス・フェルギネウス (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パルマルム (*Rhynchophorus palmarum*)、シノキシロン・ペルホランス (*Sinoxylon perforans*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマ
 イス (*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種 (*Sphenop*
h 20
orus 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 30
 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 tenebrioides*) ;
 ハサミムシ目 (*Dermaptera*) の、例えば、アニソラビス・マリチメ (*Anisolabis maritime*)、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)、ラビズラ・リパリア (*Labidura riparia*) ;
 ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes* spp.)、例
 えば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス 40
 (*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 50

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・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya* spp.)、コンタリニア属種 (*Contarinia* spp.)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*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*)、コルジロビア・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・ピピエンシ (*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 platura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトビア・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*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、エウレイア・ヘラクレイ (*Euleia heraclei*)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種 (*Glossina* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*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 (*Mansonina* 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*)、ペゴミア又はペゴミア属種 (*Pegomya* or *Pegomyia* spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya bet*

10

20

30

40

50

ae)、ペゴミア・ヒオシアミ(*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ(*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種(*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(*Piophila casei*)、プラチパレア・ポエシロプテラ(*Platyparea poeciloptera*)、プロジプロシス属種(*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ(*Psila 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.)、チプラ属種(*Tipula* spp.)、例えば、チプラ・パルドサ(*Tipula paludosa*)、チプラ・シムプレキス(*Tipula simplex*)、トキシトリパナ・クルビカウダ(*Toxotrypana curvicauda*);

カメムシ目(Hemiptera)の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ(*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*)、アシルトシホン属種(*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシホン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種(*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種(*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種(*Agonosцена* spp.)、アレウロカンツス属種(*Aleurocanthus* 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 bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス(*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ(*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種(*Aonidiella* spp.)、例えば、(*Aonidiella aurantii*)、(*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ(*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ(*Aphanostigma piri*)、アフィス属種(*Aphis* spp.)、例えば、アフィス・シトリコラ(*Aphis citricola*)、アフィス・クラシボラ(*Aphis craccivora*)、アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ(*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス(*Aphis glycyines*)、アフィス・ゴシピイ(*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘデラエ(*Aphis hederiae*)、アフィス・イリノイセンシス(*Aphis illinoisensis*)、アフィス・ミドレトニ(*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ(*Aphis nasturtii*)、アフィス・ネリイ(*Aphis nerii*)、アフィス・ポミ(*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*)、アフィス・ビブルニフィラ(*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス(*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種(*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種(*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属

10

20

30

40

50

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 (*Boreiogyaspis 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*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capulinia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*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 (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*Chrysomphalus aonidum*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccomytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・キテンデニ (*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ジウラフィス属種 (*Diuraphis* spp.)、ドラリス属種 (*Doralis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムポアスカ属種 (*Empoasca* spp.)、例えば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ (*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エムポアスカ・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 lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura* spp.)、エウセリス・ピロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、フィオリニア属種 (*Fiorinia* spp.)、フルカスピス・オセアニカ (*Furcaspis oceanica*)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus coff*

10

20

30

40

50

feae)、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 (*Hete
 ropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalod
 isca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopter
 us arundinis*)、ヒアロプテルス・ブルニ (*Hyalopterus pr
 uni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・プルカシ (*I
 cerya purchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* spp.)
 、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリ
 アテルス (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種 (*Lec
 anium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium corni* 10
) (= パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium corni*)
)、レピドサフェス属種 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフ
 エス・ウルミ (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lip
 aphis erysimi*)、ロホレウカスピス・ジャポニカ (*Lopholeuca
 spis japonica*)、リコルマ・デリカツラ (*Lycorma delica
 tula*)、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 (*Mac
 rosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンス (*Macroste
 les facifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メ 20
 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・プルイノサ (*Metca
 lfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophiu
 m dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*
)、モネリオプシス・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 asc
 alonicus*)、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 ornatu
 s*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*My
 zus nicotianae*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia* 30
ribisnigri)、ネオマスケリア属種 (*Neomaskellia* spp.)
)、ネホテッチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキ
 ス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネホテッチキ
 ス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ネチゴニセ
 ラ・スペクトラ (*Nettigoniclla spectra*)、ニラパルバタ・ルゲ
 ンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncomet
 opia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ (*Orthezia praelon
 ga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*P
 achypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia*
myricae)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp.)、例えば、 40
 パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラト
 リア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus*
 spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursa
 rius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivena
 e*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエ
 ラ属種 (*Perkinsiella* spp.)、フェナコックス属種 (*Phenaco
 ccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoc
 ccu
 s madeirensis*)、フロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzu
 s passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、 50

フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flav*
 10
va)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロンギスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、
 プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、プルビナリア属種 (*Pulvinaria* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツ
 20
s juglansregiae)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Quadraspidiotus ostreaeformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidiotus perniciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシウム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシウム・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・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクトア (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミンム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus articulatus*)、シファ・フラバ (*Sipha flava*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属種 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (*Stictoccephala festina*)、シホニヌス・フィリレアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴノセフェラ属種 (*Tetragonocephela* 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.)、トキシソプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、例えば、トキシソプテラ・アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキシソプテラ・シトリシズス (*Toxoptera citricidus*)、
 30
 トリアレウロデス・バポラリオルム (*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.

10

20

30

40

50

)、ウナスピス属種 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種 (*Zygina* spp.) ;

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アエリア属種 (*Aelia* spp.)、アナサ・トリステス (*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・トリステグムス (*Euschistus tristigma*)、エウスキスツス・バリオラリウス (*Euschistus variolarius*)、エウリデマ属種 (*Eurydema* spp.)、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・エクスカバツス (*Macropes excavatus*)、メガコプタ・クリブラリア (*Megacopta cribraria*)、ミリダエ (*Miridae*)、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・ピリズラ (*Nezara viridula*)、ニシウス属種 (*Nysius* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、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・グイルジニイ (*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 (*Triatoma* spp.) ;

ハチ目 (*Hymenoptera*) の、例えば、アクロミルメキス属種 (*Acromyrmex* spp.)、アタリア属種 (*Athalia* spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ属種 (*Atta* spp.)、カムボノツス属種 (*Camponotus* spp.)、ドリコベスブラ属種 (*Dolicho*

10

20

30

40

50

vespula spp.)、ジブリオン属種 (Diprion spp.)、例えば、ジブリオン・シミリス (Diprion similis)、ホプロカムパ属種 (Hoplocampa spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (Hoplocampa cookei)、ホプロカムパ・テスツジネア (Hoplocampa testudinea)、ラシウス属種 (Lasius spp.)、リネピテマ (イリジオミルメクス)・フミレ (Linepithema (Iridiomyrmex) humile)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、パラトレキナ属種 (Paratrechina spp.)、パラベスブラ属種 (Paravespula spp.)、プラギオレピス属種 (Plagiolepis spp.)、シレクス属種 (Sirex spp.)、ソレノプシス・インビクタ (Solenopsis invicta)、タピノマ属種 (Tapinoma spp.)、テクノミルメクス・アルビペス (Technomyrmex albipes)、ウロセルス属種 (Urocerus spp.)、ベスパ属種 (Vespa spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (Vespa crabro)、ワスマンニア・アウロプンクタタ (Wasmannia auropunctata)、キセリス属種 (Xeris spp.) ;

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

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

チョウ目 (Lepidoptera) の、例えば、アクロイア・グリセラ (Achroia grisella)、アクロニクタ・マジョル (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.)、アウトグラフィア属種 (Autographa spp.)、バラトラ・ブラシカエ (Barathra brassicae)、ブラストデクナ・アトラ (Blastodacna atra)、ボルボ・シンナラ (Borbo cinnara)、ブックラトリキス・ツルベリエラ (Bucculatrix thurberiella)、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 (*Cheimatobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo spp.*)
 、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプ
 レッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Cho
 reutis pariana*)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura
 spp.*)、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcit
 es*)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロ
 セルス属種 (*Cnaphalocerus spp.*)、クナファロクロシス・メジナリ
 ス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cne
 phasia spp.*)、コノボモルファ属種 (*Conopomorpha spp.*) 10
)、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus spp.*)、コピタルシア属種
 (*Copitarsia spp.*)、シジア属種 (*Cydia spp.*)、例えば、
 シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydi
 a pomonella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*
)、ジアファニア属種 (*Diaphania spp.*)、ジパロブシス属種 (*Dipa
 ropsis spp.*)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea sacc
 haralis*)、エアリアス属種 (*Earias spp.*)、エクジトロファ・アウ
 ランチウム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモバルプス・リグ
 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 (*Ephestia s
 pp.*)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、
 エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア
 属種 (*Epinotia spp.*)、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphyas
 postvittana*)、エランニス属種 (*Erannis spp.*)、エルス
 コビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana*)、エチエラ属
 種 (*Etiella spp.*)、エウドシマ属種 (*Eudocima spp.*)、エ
 ウリア属種 (*Eulia spp.*)、エウポエシリア・アムビグエラ (*Eupoeci
 lia ambiguella*)、エウプロクチス属種 (*Euproctis spp.
)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrh
 oea*)、エウキソア属種 (*Euxoa spp.*)、フェルチア属種 (*Feltia
 spp.*)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラシ
 ラリア属種 (*Gracillaria spp.*)、グラホリタ属種 (*Grapholi
 tha spp.*)、例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholita mole
 sta*)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholita prunivora*)、ヘ
 ジレプタ属種 (*Hedylepta spp.*)、ヘリコベルパ属種 (*Helicove
 rpa spp.*)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa a
 rmigera*)、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 (*Heli
 othis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofm
 annophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homo
 eosoma spp.*)、ホモナ属種 (*Homona spp.*)、ヒポノメウタ・パ
 デラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Ka
 kivoria flavofasciata*)、ランピデス属種 (*Lampides
 spp.*)、ラフィグマ属種 (*Laphygma spp.*)、ラスペイレシア・モレ
 スタ (*Laspeyresia molesta*)、レウシノデス・オルボナリス (*Le
 ucinodes orbonalis*)、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 coffe
 ella*)、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・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア 50*

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・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セバラタ (*Mythimna separata*)、
 10
 ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketeticus* spp.)、オンフィサ属種 (*Omphisa* spp.)、オペロフテラ属種 (*Operophtera* 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*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*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、
 20
 ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Platynota stultana*)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia interpunctella*)、プルシア属種 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (= プルテラ・マクリペンニス (*Plutella maculipennis*))、プライス属種 (*Prays* spp.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プロトパルセ属種 (*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*)、プセウドプルシア・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*)、
 30
 40
 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*)、スタトモボダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ステノマ属種 (*Stenomoma* spp.)、ストモプテリキス・スプセシベラ (*Stomopteryx subsceivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthedon* spp.)、テシア
 50

・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、タウメトポエア属種 (*Thaumetopoea* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)、例えば、トリコプルシア・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*)、ピラ
10 コラ属種 (*Virachola* spp.) ;

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

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalinia* spp.)、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus* spp.)、リノ
グナツス属種 (*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種 (*Pediculus* spp.)、フィロキセラ・バスタトリキス (*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.)、リポセリス属種 (*Liposcelis* spp.) ;

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

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、カエタナホトリプス・レエウウェニ (*Chaetanaphothrips leeuweni*)、ドレパノトリプス・レウテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エンネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella* spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ (*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オッシデンタリス (*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・スクルトゼイ (*Frankliniella schultzei*)、フランクリニエラ・トリチシ (*Frankliniella tritici*)、フランクリニエラ・バシニイ (*Frankliniella vaccini*)、フランクリニエラ・ウィリアムシ (*Frankliniella williamsi*)、ハプロトリプス属種 (*Haplothrips* spp.)、ヘ
40 リオトリプス属種 (*Heliothrips* spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラ
50

リス (*Hercinothrips femoralis*)、カコトリプス属種 (*Kakothrips*)、リピホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニトリプス・カルダモミ (*Taeniothrips cardamomi*)、トリプス属種 (*Thrips* spp.)、例えば、トリプス・パルミ (*Thrips palmi*)、トリプス・タバシ (*Thrips tabaci*) ;

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

10

コムカデ綱 (*Symphyla*) の、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*) ;

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.) ;

20

扁形動物門 (*Platyhelminthes*) 及び線形動物門 (*Nematoda*) の、動物及びヒトの寄生物、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.)、例えば、アンシロストマ・ズオデナレ (*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストマ・セイラニクム (*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロストマ・ブラジリエンス (*Ancylostoma braziliensis*)、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.)、例えば、ブルギア・マライイ (*Brugia malayi*)、ブルギア・チモリ (*Brugia timori*)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、クロノルキス属種 (*Clonorchis* spp.)、コオペリア属種 (*Cooperia* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、シアトストマ属種 (*Cyathostoma* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、例えば、ジクチオカウルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、例えば、ジフィロボトリウム・ラツム (*Diphyllobothrium latum*)、ジピリジウム属種 (*Dipylidium* spp.)、ジロフィラリア (*Dirofilaria* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、例えば、ドラクンクルス・メジネンシス (*Dracunculus medinensis*)、エキノコックス属種 (*Echinococcus* spp.)、例えば、エキノコックス・グラヌロルス (*Ech*

30

40

50

inococcus granulosis)、エキノコックス・マルチロクラリス (*Echinococcus multilocularis*)、エキノストマ属種 (*Echinostoma* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、例えば、エンテロビウス・ベルミクラリス (*Enterobius vermicularis*)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス属種 (*Fascioloides* spp.)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、フィロロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ハブロンネマ属種 (*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.)、例えば、ヒメノレピス・ナナ (*Hymenolepis nana*)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostromylylus* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、例えば、ロア・ロア (*Loa loa*)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、メトルキス属種 (*Metorchis* spp.)、メソセストイデス属種 (*Mesocestoides* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* spp.)、ムエレリウス属種 (*Muellerius* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、例えば、オンコセルカ・ボルブルス (*Onchocerca volvulus*)、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 (*Paracapillaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パッサルルス属種 (*Passalurus* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スキストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)、例えば、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、例えば、タエニア・サギナタ (*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム (*Taenia solium*)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)、例えば、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・プセウドプシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコビルハル

10

20

30

40

50

ジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、例えば、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria*)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、例えば、ウケレリア・バンククロフチ (*Wuchereria bancrofti*) ;

線形動物門 (*Nematoda*) の植物害虫 (即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレンクス属種 (*Aglenchus* spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ属種 (*Anguina* spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライムス属種 (*Belonolaimus* spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウザツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンク・スキシロフィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属種 (*Cacopaurus* spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノプラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノプラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Criconemoides* spp.)、例えば、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*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoides ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、例えば、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコドルス属種 (*Dolichodorus* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystera*)、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*)、ヒルスクマニエラ属種 (*Hirschmaniella* spp.)、ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longidorus* spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、例えば、メロイドギネ・キトウオオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloi*

10

20

30

40

50

dogyne hapla)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、メロイネマ属種(Meloinema spp.)、ナコブス属種(Nacobbus spp.)、ネオチレンクス属種(Neotylenchus spp.)、パラロンギドルス属種(Paralongidorus spp.)、パラフェレンクス属種(Paraphelenchus spp.)、パラトリコドルス属種(Paratrichodorus spp.)、例えば、パラトリコドルス・ミノル(Paratrichodorus minor)、パラチレンクス属種(Paratylenchus spp.)、プラチレンクス属種(Pratylenchus spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス(Pratylenchus penetrans)、プセウドハレンクス属種(Pseudohalenchus spp.)、プシレンクス属種(Psilenchus spp.)、プンクトデラ属種(Punctodera spp.)、クイニスルシウス属種(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)。

【0155】

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。

【0156】

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、それらは、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。

【0157】

製剤

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

10

20

30

40

50

oter) (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。

【0158】

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

10

【0159】

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も高める成分であって、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。

20

【0160】

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。

30

【0161】

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/又は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。

【0162】

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

40

【0163】

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

50

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、水。

【 0 1 6 4 】

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。

10

【 0 1 6 5 】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げるができる： 例えば、アンモニウム塩、及び、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及びノ又は、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、トウモロコシの穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

20

【 0 1 6 6 】

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、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、及び、さらに、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【 0 1 6 7 】

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、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである： ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリアルフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリアルスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式（I）で表される化合物のうちの1種類及び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。

30

40

【 0 1 6 8 】

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

50

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。

【0169】

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

【0170】

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

10

【0171】

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

【0172】

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-

20

【0173】

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向上させるために一般的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、（一般には、水性の）施用液から、及び/又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性化合物のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献(Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152)に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナツ脂肪エトキシレート(cocconut fatty ethoxylate)(10)若しくはイソトリデシルエトキシレート(12)、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート(15)、又は、アンモニウム塩及び/若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げることができる。

30

【0174】

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。

40

【0175】

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%~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。

【0176】

混合物

50

式(I)で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、又は、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤(microbiological agent)、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤(phytonic)、不妊剤、葉害軽減剤、情報化学物質及び/又は植物成長調節剤との混合物において使用することもできる。さらに、この種の活性化化合物組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、及び/又は、非生物的要因(例えば、高温又は低温)に対する耐性、湯水に対する耐性又は水中若しくは土壤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

【0177】

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もできる。同様に、式(I)で表される化合物は、植物の特性(例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質)を向上させるための作用剤と混合して使用することも可能である。

20

【0178】

本発明による特定の実施形態では、式(I)で表される化合物は、製剤の中に、又は、そのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物(好ましくは、以下に記載されている化合物)と混合された状態で存在している。

【0179】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。

【0180】

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」)。

30

【0181】

(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、エチオフェンカルブ、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、チオファノックス、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、

40

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシ

50

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、メビンホス、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、バミドチオン。

【0182】

(2) GABA 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。

10

【0183】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター / 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シペルメトリン、アルファ - シペルメトリン、ベータ - シペルメトリン、シータ - シペルメトリン、ゼータ - シペルメトリン、シフェノトリン [(1R) - トランス異性体]、デルタメトリン、エムペントリン [(EZ) - (1R) 異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロバトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1R) - トランス異性体]、プラレトリン、ピレトリン類（除虫菊 (pyrethrum)）、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [(1R) 異性体]、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

20

DDT；又は、メトキシクロル。

30

【0184】

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (nAChR) 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、又は、フルピラジフロル。

【0185】

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (nAChR) 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

【0186】

(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。

【0187】

(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、ハイドロプレレン、キノプレレン、及び、メトプレレン；又は、フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン。

【0188】

50

(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、フッ化スルフリル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石。

【0189】

(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。

【0190】

(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。

10

【0191】

(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。

20

【0192】

(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。

【0193】

(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。

30

【0194】

(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。

【0195】

(15) キチン生合成阻害薬(タイプ0)、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン。

40

【0196】

(16) キチン生合成阻害薬(タイプ1)、例えば、ブプロフェジン。

【0197】

(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。

【0198】

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テプフェノジド。

【0199】

50

(19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、アミトラズ。

【0200】

(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。

【0201】

(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)。

10

【0202】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン。

【0203】

(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。

【0204】

(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。

20

【0205】

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

【0206】

(28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、及び、フルベンジアミド。

【0207】

作用機序が知られていないか又は不明瞭であるさらなる活性化合物、例えば、アフィドピロベン、アフォキソレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロフラニリド(broflaniide)、プロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石(cryolite)、シクラニリプロール、シクロキサプリド(cyclozaprid)、シハロジアミド(cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)、ジコホル、ジフロビダジン、フロメトキン、フルアザインドリジン(fluaazaindolizine)、フルエンシルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロピン、フルフィプロール、フルヘキサホン(fluhexafon)、フルオピラム、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノジド(fufenozide)、グアジピル(guadipyr)、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、ロチラネル(lotilaner)、メペルフルトリン、パイコングディング(paichongding)、ピフルブミド、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロピン、サロラネル(sarolaner)、テトラメチルフルトリン、テトラニリプロール(tetraniliprole)、テトラクロラントラニリプロール(tetrachlorantraniliprole)、チオキサザフェン、チオフルオキシメート(thiofluoximate)、トリフルメゾピリム、及び、ヨードメタン；並びに、さらに、バシルス・フィルムス(Bacillus firmus)に基づく調製物(I-1582, BioNeem, Votivo)、及び、以下の活性化合物： 1 - { 2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル } - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - 1 , 2

30

40

50

, 4 - トリアゾール - 5 - アミン (WO 2 0 0 6 / 0 4 3 6 3 5 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 (WO 2 0 0 3 / 1 0 6 4 5 7 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 (WO 2
 0 0 6 / 0 0 3 4 9 4 から既知)、3 - (2, 5 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ
 - 8 - メトキシ - 1, 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (WO 2 0
 0 9 / 0 4 9 8 5 1 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 (WO 2 0 0 9 / 0 4 9 8 5 1 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 (WO 2 0
 0 4 / 0 9 9 1 6 0 から既知)、4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 -
 クロロフェニル) ピリミジン (WO 2 0 0 3 / 0 7 6 4 1 5 から既知)、P F 1 3 6 4 (C A S
 R e g . N o . 1 2 0 4 7 7 6 - 6 0 - 2)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1
 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミ
 ノ) - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (W
 O 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロ
 ロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - シ
 アノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5
 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン -
 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メ
 チルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1
 6 から既知)、2 - [3, 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリ
 ジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) ベンゾイル] -
 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、N -
 [2 - (5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチ
 ルフェニル] - 3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール
 - 5 - カルボキサミド (CN 1 0 2 0 5 7 9 2 5 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 (W
 O 2 0 0 9 / 0 8 0 2 5 0 から既知)、N - [(2E) - 1 - [(6 - クロロピリジン
 - 3 - イル) メチル] ピリジン - 2 (1H) - イリデン] - 2, 2, 2 - トリフルオロア
 セトアミド (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)、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)、[2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 3 - オキソ
 - 4 - オキサスピロ [4 . 5] デカ - 1 - エン - 1 - イル] 炭酸ブチル (CN 1 0 2 0 6
 0 8 1 8 から既知)、(3E) - 3 - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] -
 2 - ピリジリデン] - 1, 1, 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オン (WO 2 0 1 3 / 1
 4 4 2 1 3 から既知)、N - (メチルスルホニル) - 6 - [2 - (ピリジン - 3 - イル)
 - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル] ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2 0 1 2 / 0 0
 0 8 9 6 から既知)、N - [3 - (ベンジルカルバモイル) - 4 - クロロフェニル] - 1

10

20

30

40

50

-メチル-3-(ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2010/051926から既知)、5-プロモ-4-クロロ-N-[4-クロロ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)ピラゾール-3-カルボキサミド(CN103232431から既知)。

【0208】

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」に記載されているか、又は、インターネット上に記載されている(例えば、「http://www.alanwood.net/pesticides」)。

10

【0209】

クラス(1)~(15)に記載されている全ての殺菌剤混合成分は、適切な官能基が存在している場合には、対応する塩基又は酸と塩を形成し得る。さらに、クラス(1)~(15)に記載されている殺菌剤混合成分は、互変異性が可能である場合には、互変異性体形態も包含する。

【0210】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.01)アルジモルフ、(1.02)アザコナゾール、(1.03)ビテルタノール、(1.04)プロムコナゾール、(1.05)シプロコナゾール、(1.06)ジクロブトラゾール、(1.07)ジフェノコナゾール、(1.08)ジニコナゾール、(1.09)ジニコナゾール-M、(1.10)ドデモルフ、(1.11)酢酸ドデモルフ、(1.12)エポキシコナゾール、(1.13)エタコナゾール、(1.14)フェナリモール、(1.15)フェンブコナゾール、(1.16)フェンヘキサミド、(1.17)フェンプロピジン、(1.18)フェンプロピモルフ、(1.19)フルキンコナゾール、(1.20)フルルプリミドール、(1.21)フルシラゾール、(1.22)フルトリアホル、(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)ミクロブタニル、(1.32)ナフチフィン、(1.33)ヌアリモール、(1.34)オキシポコナゾール、(1.35)パクロブトラゾール、(1.36)ペフラゾエート、(1.37)ペンコナゾール、(1.38)ピペラリン、(1.39)プロクロラズ、(1.40)プロピコナゾール、(1.41)プロチオコナゾール、(1.42)ピリブチカルブ、(1.43)ピリフェノックス、(1.44)キンコナゾール、(1.45)シメコナゾール、(1.46)スピロキサミン、(1.47)テブコナゾール、(1.48)テルピナフィン、(1.49)テトラコナゾール、(1.50)トリアジメホン、(1.51)トリアジメノール、(1.52)トリデモルフ、(1.53)トリフルミゾール、(1.54)トリホリン、(1.55)トリチコナゾール、(1.56)ウニコナゾール、(1.57)ウニコナゾール-p、(1.58)ビニコナゾール、(1.59)ポリコナゾール、(1.60)1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタノール、(1.61)1-(2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチルエステル、(1.62)N'-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロボキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.63)N-エチル-N-メチル-N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)プロボキシ]フェニル}イミドホルムアミド、(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、(1.66)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

20

30

40

50

、(1.67) 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.68) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、(1.69) 2 - [1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.70) 2 - { [r e l (2 R , 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.71) 2 - { [r e l (2 R , 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.72) 1 - { [r e l (2 R , 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.73) 1 - { [r e l (2 R , 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.74) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r e l (2 R , 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、(1.75) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r e l (2 R , 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、(1.76) 2 - [(2 S , 4 S , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.77) 2 - [(2 R , 4 S , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.78) 2 - [(2 R , 4 R , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.79) 2 - [(2 S , 4 R , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.80) 2 - [(2 S , 4 S , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.81) 2 - [(2 R , 4 S , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.82) 2 - [(2 R , 4 R , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.83) 2 - [(2 S , 4 R , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.84) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.85) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.86) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ペンタン - 2 - オール、(1.87) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.88) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2 , 4 - ジクロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2

- オール、(1.89)(2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-2,2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.90)(2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1S)-2,2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.91)(2S)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1S)-2,2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.92)(2S)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-2,2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.93)(1S,2R,5R)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.94)(1R,2S,5S)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.95)5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール。

10

【0211】

(2) 複合体 I 又は複合体 II における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2.01)ピキサフェン、(2.02)ボスカリド、(2.03)カルボキシシ、(2.04)ジフルメトリン、(2.05)フェンフラム、(2.06)フルオピラム、(2.07)フルトラニル、(2.08)フルキサピロキサド、(2.09)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 1RS、4SR、9SR)、(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)ベンゾピンジフルピル、(2.30)N-[(1S,4R)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタリン-5-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、(2.31)N-[(1R,4S)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタリン-5-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、(2.32)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-1H-インデン-4-イル)-1H-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-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.34)1-メチル-3-

20

30

40

50

(トリフルオロメチル) - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 5) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 6) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 7) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 8) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 9) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 4 0) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 4 1) ベノダニル、 (2 . 4 2) 2 - クロロ - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド、 (2 . 4 3) イソフェタミド、 (2 . 4 4) 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、 (2 . 4 5) 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、 (2 . 4 6) 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、 (2 . 4 7) 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、 (2 . 4 8) 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、 (2 . 4 9) 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、 (2 . 5 0) 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、 (2 . 5 1) 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、 (2 . 5 2) 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、 (2 . 5 3) 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、 (2 . 5 4) 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、 (2 . 5 5) 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、 (2 . 5 6) 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、 (2 . 5 7) 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、 (2 . 5 8) 4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル)ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキサミド、 (2 . 5 9) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル)ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 6 0) 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、 (2 . 6 1) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル)ピフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 6 2) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル)ピフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピ

10

20

30

40

50

ラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.63) 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、(2.64) 1, 3 - ジメチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.65) 1, 3 - ジメチル - 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、(2.66) 1, 3 - ジメチル - 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、(2.67) 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、(2.68) 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、(2.69) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.70) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3S) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 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。

【0212】

(3) 複合体 III における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3.01) アメトクトラジン、(3.02) アミスルブロム、(3.03) アゾキシストロビン、(3.04) シアゾファミド、(3.05) クメトキシストロビン (coumethoxystrobin)、(3.06) クモキシストロビン、(3.07) ジモキシストロビン、(3.08) エノキサストロビン、(3.09) 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ビン (flufenoxystrobin)、(3.12) フルオキサストロビン、(3.13) クレソキシム - メチル、(3.14) メトミノストロビン、(3.15) オリサストロビン、(3.16) ピコキシストロビン、(3.17) ピラクロストロビン、(3.18) ピラメトストロビン、(3.19) ピラオキシストロビン、(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ビン、(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 - メチルアセトアミド、(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) アセトアミド、(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 } アセトアミド、(3.26) (2E) - 2 - { 2 - [({ [(1E) - 1 - (3 - { [(E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル] オキシ } フェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) メチル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(3.27) フェナミノストロビン (fenaminostrobilin)、(3.28) 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2 - { [({ (1E) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン } 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、(3.29) (2E) - 2 - { 2 - [({ シクロプロピル [(4 - メトキシフェニル) イミノ] メチル } スルファニル) メチル] フェニル } - 3 - メトキシアクリル酸メチルエステル、(3.30) N - (3 - エチル - 3, 5, 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミド、(3.31) 2 - { 2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、(3.32) 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、(3.33) (2E, 3Z) - 5 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] オキシ } - 2 - (メトキシイミノ) - N, 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド。

10

20

30

40

50

【0213】

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.01)ベノミル、(4.02)カルベンダジム、(4.03)クロルフェナゾール、(4.04)ジエトフェンカルブ、(4.05)エタボキサム、(4.06)フルオピコリド、(4.07)フベリダゾール、(4.08)ペンシクロン、(4.09)チアベンダゾール、(4.10)チオファネート-メチル、(4.11)チオファネート、(4.12)ゾキサミド、(4.13)5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、(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。

10

【0214】

(5) 多部位に作用し得る化合物、例えば、(5.01)ボルドー液、(5.02)カプタホール、(5.03)キャプタン、(5.04)クロロタロニル、(5.05)水酸化銅、(5.06)ナフテン酸銅、(5.07)酸化銅、(5.08)塩基性塩化銅、(5.09)硫酸銅(2+)、(5.10)ジクロフルアニド、(5.11)ジチアノン、(5.12)ドジン、(5.13)ドジン遊離塩基、(5.14)ファーバム、(5.15)フルオロホルペット、(5.16)ホルペット、(5.17)グアザチン、(5.18)酢酸グアザチン、(5.19)イミノクタジン、(5.20)イミノクタジンアルベシル酸塩、(5.21)イミノクタジン三酢酸塩、(5.22)マンカップー、(5.23)マンゼブ、(5.24)マンネブ、(5.25)メチラム、(5.26)メチラム

20

亜鉛(metiram zinc)、(5.27)オキシシン銅、(5.28)プロパミジン(propamidine)、(5.29)プロピネブ、(5.30)硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5.31)チウラム、(5.32)トリルフルアニド、(5.33)ジネブ、(5.34)ジラム、(5.35)アニラジン。

【0215】

(6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6.01)アシベンゾラル-S-メチル、(6.02)イソチアニル、(6.03)プロベナゾール、(6.04)チアジニル、(6.05)ラミナリン(laminarin)。

【0216】

(7) アミノ酸及び/又はタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.01)アンドプリム(andonprim)、(7.02)プラストサイジン-S、(7.03)シプロジニル、(7.04)カスガマイシン、(7.05)カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.06)メパニピリム、(7.07)ピリメタニル、(7.08)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、(7.09)オキシテトラサイクリン、(7.10)ストレプトマイシン。

30

【0217】

(8) ATP産生の阻害薬、例えば、(8.01)酢酸トリフェニルスズ、(8.02)塩化トリフェニルスズ、(8.03)水酸化トリフェニルスズ、(8.04)シルチオファム。

【0218】

(9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9.01)ベンチアバリカルブ、(9.02)ジメトモルフ、(9.03)フルモルフ、(9.04)イプロバリカルブ、(9.05)マンジプロパミド、(9.06)ポリオキシシン、(9.07)ポリオキシソリム、(9.08)バリダマイシン、(9.09)バリフェナレート、(9.10)ポリオキシシンB、(9.11)(2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン、(9.12)(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。

40

【0219】

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10.01)ピフェニル、(10.

50

02) クロロネブ、(10.03) ジクロラン、(10.04) エジフェンホス、(10.05) エトリジアゾール、(10.06) ヨードカルブ(iodocarb)、(10.07) イプロベンホス、(10.08) イソプロチオラン、(10.09) 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、(10.15) トルクロホス-メチル。

【0220】

(11)メラニン生合成の阻害薬、例えば、(11.01)カルプロパミド、(11.02)ジクロシメット、(11.03)フェノキサニル、(11.04)フタリド、(11.05)ピロキロン、(11.06)トリシクラゾール、(11.07){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。

10

【0221】

(12)核酸合成の阻害薬、例えば、(12.01)ベナラキシル、(12.02)ベナラキシル-M(キララキシル(kiralaxy1))、(12.03)ブピリメート、(12.04)クロジラコン、(12.05)ジメチリモール、(12.06)エチリモール、(12.07)フララキシル、(12.08)ヒメキサゾール、(12.09)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、(12.14)オクチリノン。

20

【0222】

(13)シグナル伝達の阻害薬、例えば、(13.01)クロゾリネート、(13.02)フェンピクロニル、(13.03)フルジオキソニル、(13.04)イプロジオン、(13.05)プロシミドン、(13.06)キノキシフェン、(13.07)ピンクロゾリン、(13.08)プロキナジド。

【0223】

(14)脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.01)ビナパクリル、(14.02)ジノカップ、(14.03)フェリムゾン、(14.04)フルアジナム、(14.05)メプチルジノカップ。

【0224】

(15)さらなる化合物、例えば、(15.001)ベンチアゾール、(15.002)ベトキサジン、(15.003)カプシマイシン(capsimycin)、(15.004)カルボン、(15.005)キノメチオネート、(15.006)ピリオフェノン(クラザフェノン(chlazaferone))、(15.007)クフラネブ、(15.008)シフルフェナミド、(15.009)シモキサニル、(15.010)シプロスルファミド、(15.011)ダゾメット、(15.012)デバカルブ、(15.013)ジクロロフェン、(15.014)ジクロメジン、(15.015)ジフェンゾコート、(15.016)ジフェンゾコートメチル硫酸塩、(15.017)ジフェニルアミン、(15.018)エコメイト、(15.019)フェンピラザミン、(15.020)フルメトベル、(15.021)フルオルイミド、(15.022)フルスルファミド、(15.023)フルチアニル、(15.024)ホセチル-アルミニウム、(15.025)ホセチル-カルシウム、(15.026)ホセチル-ナトリウム、(15.027)ヘキサクロロベンゼン、(15.028)イルママイシン、(15.029)メタスルホカルブ、(15.030)イソチオシアン酸メチル、(15.031)メトラフェノン、(15.032)ミルディオマイシン、(15.033)ナタマイシン、(15.034)ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.035)ニトロタル-イソプロピル、(15.036)オキサモカルブ(oxamocarb)、(15.037)オキシフェンチン(oxyfenthin)、(15.038)ペンタクロロフェノール及び塩、(15.039)フェノトリン、(15.040)亜リン酸及びその塩、(15.041)プロパモカルブ-ホセチレート(propamocarb-foset

30

40

50

ylate)、(15.042)プロパノシン-ナトリウム(propanosin-sodium)、(15.043)ピリモルフ、(15.044)ピロールニトリン、(15.045)テブフロキン、(15.046)テクロフタラム、(15.047)トルニファニド、(15.048)トリアゾキシド、(15.049)トリクラミド、(15.050)ザリラミド、(15.051)2-メチルプロパン酸(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル}カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イルエステル、(15.052)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、(15.053)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、(15.054)オキサチアピプロリン、(15.055)1H-イミダゾール-1-カルボン酸1-(4-メトキシフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-イルエステル、(15.056)2,3,5,6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(15.057)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、(15.058)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、(15.059)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、(15.060)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、(15.061)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、(15.062)2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、(15.063)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、(15.064)2-フェニルフェノール及び塩、(15.065)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、(15.066)3,4,5-トリクロロピリジン-2,6-ジカルボン酸ニトリル、(15.067)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、(15.068)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、(15.069)5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-チオール、(15.070)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、(15.071)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、(15.072)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、(15.073)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、(15.074)(2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチルエステル、(15.075)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、(15.076)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、(15.077)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、(15.078)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、(15.079)N-[1 - (5 - プロモ - 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、(15.080)N-[1 - (5 - プロモ - 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、(15.081)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、(15.082)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、(15.083)N' - { 4 - [(3 - tert - 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、(15.084)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リン - 1 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.085)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 - [(1R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタリン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.086)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 - [(1S) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタリン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.087){ 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン - 2 - イル}カルバミン酸ペンチルエステル、(15.088)フェナジン - 1 - カルボン酸、(15.089)キノリン - 8 - オール、(15.090)キノリン - 8 - オールスルフェート(2 : 1)、(15.091){ 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tert - ブチルエステル、(15.092)(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、(15.093)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] - N 2 - (メチルスルホニル)パリンアミド、(15.094)4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15.095){ 6 - [({ [(Z) - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン - 2 - イル}カルバミン酸ブタ - 3 - イン - 1 - イルエステル、(15.096)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)、(15.097)3, 4, 5 - トリヒドロキシ安息香酸プロピルエステル、(15.098)[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、(15.099)(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、(15.100)(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、(15.101)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、(15.102)2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル)キナゾリン、(15.103)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、(15.104)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、(15.105)アブシジン酸、(15.106)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 -

10

20

30

40

50

エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15.107) N' - {5 - ブロモ - 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 - メチルイミドホルミアミド、(15.108) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(1R) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N
 - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15.109) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(1S) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N
 - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15.110) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(シス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メ
 チルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15.111) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、(15.112) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.113) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.114) N - (2 - tert - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.115) N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.116) N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.117) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.118) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.119) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.120) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.121) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.122) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.123) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.124) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.125) N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.126) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.127) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.128) N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.129) 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

10

20

30

40

50

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 3 0) 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 3 1) 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 3 2) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル)
 - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 3 3) 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 - メチルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 3 4) 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、 (1 5 . 1 3 5) 9 - フルオロ - 2 , 2 - ジメ
 チル - 5 - (キノリン - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾオキサアゼピン
 、 (1 5 . 1 3 6) 2 - { 2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン -
 3 - イル) オキシ] フェニル } プロパン - 2 - オール、 (1 5 . 1 3 7) 2 - { 2 - [(7 ,
 8 - ジフルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] - 6 - フルオロフェニル }
 プロパン - 2 - オール、 (1 5 . 1 3 8) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)
 - N - (2 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 (1 5 . 1 3 9) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 , 6 - ジフルオ
 ロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4 0) 4
 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル)
 - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4 1) 4 - (2 - プロ
 モ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジ
 メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4 2) N - (2 - プロモ - 6 - フル
 オロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H
 - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4 3) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル)
 - N - (2 - プロモフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 (1 5 . 1 4 4) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - プロモ - 6 -
 フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4
 5) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロフェニル) - 1 , 3
 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4 6) N - (2 - プロモフェニ
 ル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾ
 ール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4 7) 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2
 - クロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1
 4 8) 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 , 6 - ジフルオロフェニル)
 - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 4 9) 4 - (2 - プロ
 モ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1
 H - ピラゾール - 5 - アミン、 (1 5 . 1 5 0) N ' - (4 - { 3 - [(ジフルオロメチ
 ル) スルファニル] フェノキシ } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチ
 ルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 5 1) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(1
 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ } フェニル) - N - エ
 チル - N - メチルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 5 2) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4
 - { 3 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ } フェニル)
 - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 5 3) N ' - (2 , 5 - ジメ
 チル - 4 - { 3 - [(2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロピル) スルファニル] フェノ
 キシ } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 5 4) N '
 - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(ペンタフルオロエチル) スルファニル] フェノキ
 シ } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 5 5) N '
 - (4 - { [3 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] スルファニル } - 2 , 5 - ジメチルフ
 ェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルミアミド、 (1 5 . 1 5 6) N ' - (2 ,
 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] ス

ルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15.157)
)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)フェ
 ニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミアミド、(15
 .158)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(2,2,3,3-テトラフルオロ
 プロボキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホル
 ミアミド、(15.159)N'-(2,5-ジメチル-4-{[3-(ペンタフルオロ
 エトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルミ
 アミド、(15.160)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール
 -1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェ
 ニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール
 -2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.161)2-[3,5-ビス(ジ
 フルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フル
 オロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1
 ,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル
]エタノン、(15.162)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラ
 ザール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-
 1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-
 1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.163)2
 -{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-
 イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-
 ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニルメタンスルホネート、(15.1
 64)2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-
 イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-
 ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスル
 ホネート、(15.165)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-
 イル]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(プロパ-2-イン-1-イル
 オキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-
 チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.166)2-[3
 ,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{
 (5R)-5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒ
 ドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン
 -1-イル]エタノン、(15.167)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1
 H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-フルオロ-6-
 (プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサ
 ザール-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
 、(15.168)2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-
 イル]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-
 1
 -イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1
 ,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.169)2-
 [3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-
 -(4-{(5S)-5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-
 イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.170)2-[3,5-ビス(ジフル
 オロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-
 クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-
 1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-
 イル]エタノン、(15.171)2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-ビス
 (ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル
)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-
 10
 20
 30
 40
 50

イル}フェニルメタンスルホネート、(15.172)2-{(5R)-3-[2-(1-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニルメタンスルホネート、(15.173)2-{(5S)-3-[2-(1-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.174)2-{(5R)-3-[2-(1-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート。

10

【0225】

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。

【0226】

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。

【0227】

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。

20

【0228】

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

30

40

50

L 30232)。

【0229】

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

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に、株 CON/M/91-8 (受託番号 DSM-9660)、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium* spp.)、特に、株 HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*)) として知られていた)、特に、株 KV01、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 / ATCC 90448)、メトスクニコウィア・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 (*Paeciomyces 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 (*Paeciomyces 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)。

【0230】

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。

【0231】

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

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.)、ピソリツス・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*)

、*Pseudomonas* spp.）、*Rhizobium* spp.）、特に、*Rhizobium trifolii*）、*Rhizopogon* spp.）、*Scleroderma* spp.）、*Suillus* spp.）、*Streptomyces* spp.）。

【0232】

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

ニンク（*Allium sativum*）、ニガヨモギ（*Artemisia absinthium*）、アザジラクチン（*azadirachtin*）、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス（*Cassia nigricans*）、セラストルス・アングラツス（*Celastrus angulatus*）、アメリカアリタソウ（*Chenopodium anthelminticum*）、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ（*Dryopteris filix-mas*）、スギナ（*Equisetum arvense*）、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up（キノア（*Chenopodium quinoa*）サポニン抽出物）、除虫菊（*Pyrethrum/Pyrethrins*）、スリナムニガキ（*Quassia amara*）、コナラ属（*Quercus*）、キラヤ属（*Quillaja*）、Regalia、(「*RequiemTM Insecticide*」)、ロテノン、リアニアノリアノジン、ヒレハリソウ（*Symphytum officinale*）、ヨモギギク（*Tanacetum vulgare*）、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ（*Tropaeolum majus*）、セイヨウイラクサ（*Urtica dioica*）、Veratrin、セイヨウヤドリギ（*Viscum album*）、アブラナ科（*Brassicaceae*）抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。

【0233】

混合成分としての薬害軽減剤

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

【0234】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の部分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、ピーマン及びトウガラシ、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、ホウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物（*Brassica oleracea*）（例えば、キャベツ）及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（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、生物工学的的方法と遺伝子工学的的方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得る

ことができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物は、植物の全ての成育段階、例えば、種子、挿穂 (cutting)、及び、幼植物 (未成熟植物) から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などである。収穫物 (収穫された植物又は植物の部分)、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) 及び生殖繁殖器官 (generative propagation material)、例えば、挿穂 (cutting)、塊茎、根茎、かき苗 (slip) 及び種子なども、植物の部分に包含される。

10

【0235】

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。

【0236】

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

30

【0237】

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

特に有利で有益な特性 (「形質」) を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種 (遺伝子工学により得られたもの) に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、湯水又は水中若しくは土壌中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び / 又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵寿命及び / 又は改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物 (例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類) に対する植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する遺伝物質 (例えば、遺伝子 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産生された毒素による、害虫及び有害微生物 (例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類) に対する植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び / 又はウイルス類に対

40

50

する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性 (SAR)、システミン (systemin)、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及びノ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、グリホセート類又はホスフィノトリシン) に対する植物の向上した耐性である (例えば、「PAT」遺伝子)。望まれる当該特性 (「形質」) を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類 (コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物 (果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの) などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性 (「形質」) は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

10

【0238】

作物保護 - 処理の種類

植物及び植物の部分、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散 (spreading-on)、注入、灌水 (灌漑 (drenching))、点滴灌漑などによって、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って処理し、また、繁殖器官 (propagation material) の場合、特に種子の場合、さらに、乾式種子処理、液体種子処理、スラリー処理によっても処理し、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。

20

【0239】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用である。即ち、式 (I) で表される化合物を茎葉部に施用し、その際、処理頻度及び施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

30

【0240】

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

40

【0241】

種子の処理

植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。それにもかかわらず、種子の処理には、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が伴っている。かくして、植物の貯蔵中、播種後又は出芽後に殺有害生物剤を追加で施用することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性化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、使用する活性化化合物の量を最適

50

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。

【0242】

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

10

【0243】

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。

【0244】

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

20

【0245】

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。

【0246】

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

30

【0247】

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。

【0248】

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。

【0249】

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。

40

【0250】

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、

50

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、野菜類及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

【0251】

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、この場合、バシルス(*Bacillus*)種、リゾビウム(*Rhizobium*)種、 pseudomonas (*Pseudomonas*)種、セラチア(*Serratia*)種、トリコデルマ(*Trichoderma*)種、クラビバクテル(*Clavibacter*)種、グロムス(*Glomus*)種又はグリオクラジウム(*Gliocladium*)種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種(*Bacillus* sp.)に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する。

10

【0252】

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、収穫と播種の間任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子(例えば、ブライミング)を使用することもできる。イネの種子の場合、例えば、特定の段階(鳩胸段階)に達するまで水中で予め膨潤させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が改善され、及び、出芽がより均一になる。

20

【0253】

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

30

【0254】

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。

【0255】

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。

【0256】

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

40

【0257】

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

50

【0258】

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

【0259】

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

【0260】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用することができる。

【0261】

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

【0262】

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

【0263】

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

【0264】

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

【0265】

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

10

20

30

40

50

って使用することが可能な種子粉衣製剤又はそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。

【0266】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又はその種子粉衣製剤から調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機（これは、バッチ式又は連続的に作動される）の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのままで添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該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

【0267】

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

【0268】

動物衛生

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

20

【0269】

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、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物（domestic animal）において発生する寄生生物を防除するのに適している。

【0270】

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

30

【0271】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げるができる：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。

【0272】

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。

【0273】

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

40

【0274】

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

【0275】

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

50

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

【0276】

節足動物としては、以下のものを挙げることができる：

アノプブリダ目(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.)、ベジクルス属種(Pediculus spp.)、プチルス属種(Phtirus 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.)、ウエルネキエラ属種(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.)、ルトゾミイヤ属種(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.)、チプラ属種(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.)、キセノブシラ属種(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。

【0277】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げる事ができる：

ダニ亜綱 (Acarari (Acarina)) 及びメタスティグマ目 (Metastigmata) の、例えば、ヒメダニ科 (Argasidae) の、例えば、アルガス属種 (Argas spp.)、オルニトドルス属種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属種 (Otobius spp.)、マダニ科 (Ixodidae) の、例えば、イキソデス属種 (Ixodes spp.)、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (Rhipicephalus (Boophilus) spp.)、デルマセントル属種 (Dermacentor spp.)、ハエマフィサリス属種 (Haemaphysalis spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp.) (多宿主ダニの原属)；メソスティグマ目 (Mesostigmata) の、例えば、デルマニッス属種 (Dermanyssus spp.)、オルニトニッス属種 (Ornithonyssus spp.)、プネウモニッス属種 (Pneumonyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、プネウモニッス属種 (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.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、デモデキス属種 (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.)。

【0278】

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)) の、例えば、トリパノソーマ科 (Trypanosomatidae) の、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

10

20

30

40

50

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、エントモエバ・ヒストリチカ (*Entamoeba histolytica*) ; ハルトマネリダエ科 (*Hartmannellidae*)、例えば、アcantamoeba 属種 (*Acanthamoeba* sp.)、ハルマレラ属種 (*Harmanella* sp.) ;

アピコンプレックス門 (*Apicomplexa*) (孢子虫類 (*Sporozoa*))、

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

10

20

30

40

50

ソプラズマ・ゴンジイ (*Toxoplasma gondii*)、ハモンジア・ヘイドル
 ニイ (*Hammondia heydorni*)、ネオスポラ・カニヌム (*Neospora caninum*)、ベスノイチア・ベスノイチイ (*Besnoitia 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・ネウロナ (*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 (*Leucozooidae*)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ (*Leucozytozoon simondi*)；例えば、プラスモディウム科 (*Plasmodiidae*)、例えば、プラスモジウム・ベルゲイ (*Plasmodium berghei*)、プラスモジウム・ファルシパルム (*P. falciparum*)、プラ
 スモジウム・マラリアエ (*P. malariae*)、プラスモジウム・オバレ (*P.
 ovale*)、プラスモジウム・ビバキス (*P. vivax*)、プラスモジウム属種 (*P. spec.*)；例えば、ピロプラズマ亜目 (*Piroplasmea*)、例えば、
 バベシア・アルゲンチナ (*Babesia argentina*)、バベシア・ボビス (*B. bovis*)、バベシア・カニス (*B. canis*)、バベシア属種 (*B. spec.*)、テイレリア・パルバ (*Theileria parva*)、テイレリア属種 (*Theileria spec.*)；例えば、アデレア亜目 (*Adeleina*)、例
 えば、ヘパトゾオン・カニス (*Hepatozoon canis*)、ヘパトゾオン属種 (*H. spec.*)。

10

20

【0279】

病原性内部寄生物 (これは、蠕虫類である) 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*)]、線虫類、鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) 及び舌形動物門 (*Pentastoma*) などがある。これらのものとしては、以下のものを挙げるができる：

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

30

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.*)、ジフロゴノボルス属種 (*Diphlogonoporus spp.*)；

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllidea*) 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 (*Echinoco*

40

50

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

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

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

クキセンチュウ目 (Tylenchida) の、例えば : ミクロネマ属種 (Micronema spp.)、ストロンギロイデス属種 (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 (Gyalocephalus spp.)、シリンドロファリンキス属種 (Cylindropharynx spp.)、ポテリオストムム属種 (Poteriosostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cyclococercus spp.)、シリコステファヌス属種 (Cyllicostephanus spp.)、オエソファゴストム

10

20

30

40

50

ム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、アンシロスタマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globocephalus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、シアトストマ属種 (*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 (*Neostromstrongylus* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、ブネウモストロンギルス属種 (*Pneumostromstrongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、エラホストロンギルス属種 (*Elaphostromstrongylus* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Paraelaphostromstrongylus* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、アンギオ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.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marshallagia* spp.)、クーペリア属種 (*Cooperia* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostromstrongylus* 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.)、ハブロンエマ属種 (*Habronema* spp.)、パラブロンエマ属種 (*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.)、スピロセルカ属種 (*Sp*

10

20

30

40

50

irocerca spp.);

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*): ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば: マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus spp.*)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorhynchis 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 (*Moniliiformida*) の、例えば: モニリホルミス属種 (*Moniliiformis 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.*)。 10

【0280】

獣医学の分野において、及び、畜産業において、式 (I) で表される化合物は、当技術分野において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸経路、非経口の経路、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。

【0281】

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。 20

【0282】

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 (*helminthidal 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、動物舎の中で、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。

【0283】

さらなる態様は、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) で表される化合物の使用に関する。さらなる態様は、例えば、畜産業における、動物育種における、動物舎の中における、又は、衛生学の分野における、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式 (I) で表される化合物の使用に関する。 30

【0284】

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: 40

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、エプリノメクチン、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 (*netobimin*)、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*) 50

)、トリクラベンダゾール (tr ic cl ab en d az o le) ;
シクロオクタデプシペプチド系 (c y c l o o c t a d e p s i p e p t i d e s) の
 、例えば、エモデプシド (e m o d e p s i d e)、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 (m o n e p a n t e l) ;
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、オキサントル ;
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 ;
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 (d A 10
 MD)、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 (n a p h t h a l o f o s)、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 (m e n i c l o p h o l a n)、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 (p r a z i q u a n t e l)、エプシ
 プランテル ;
さまざまな別の系の、例えば、アモスカネート (a m o s c a n a t e)、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 (h e t o l i n)、ヒカントン、ルカントン 20
 、ミラシル (M i r a c i l)、ミラサン (m i r a s a n)、ニクロサミド、ニリダゾ
 ール、ニトロキシニル (n i t r o x y n i l)、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。

【0285】

媒介動物の防除

式(I)で表される化合物は、媒介動物 (v e c t o r) 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 (30
 w o r m s)、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)。

【0286】

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 (A n o p h e l e s) : マラリア、フィラリア症 ;
 - ・ アカイエカ (C u l e x) : 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 (A e d e s) : 黄熱病、デング熱、フィラリア症、別のウイルス性疾患
 ;
 - ・ ブユ (S i m u l i i d a e) : 蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (O n c h o c e r 40
 c a v o l v u l u s)) 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 (a c a r i o s i s)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、
 野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (T B E)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリ
 ア症 (b o r r e l i o s i s) ;
- (6) マダニ類 : ボレリア症 (b o r e l l i o s e s)、例えば、ダットン回帰熱ボ
 レリア (B o r r e l i a d u t t o n i)、ダニ媒介脳炎、Q熱 (C o x i e l l a
 b u r n e t i i)、パベシア症 (B a b e s i a c a n i s c a n i s)。 50

【0287】

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。

【0288】

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

10

【0289】

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。

【0290】

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

20

【0291】

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。

【0292】

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。

30

【0293】

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。

【0294】

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。

40

【0295】

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

【0296】

衛生分野における害虫の防除

式 (I) で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内保護分野において、衛生保護分野において、及び、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間 (例えば、住居、工場の通路、オフィス及び車両の

50

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。

【0297】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱(Arachnida)のサソリ目(Scorpiones)、クモ目(Araneae)及びザトウムシ目(Opiliones)の害虫、ムカデ綱(Chilopoda)及びヤスデ綱(Diplopoda)の害虫、昆虫綱(Insecta)のゴキブリ目(Blattodea)、コウチュウ目(Coleoptera)、ハサミムシ目(Dermaptera)、ハエ目(Diptera)、カメムシ亜目(Heteroptera)、ハチ目(Hymenoptera)、シロアリ目(Isoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、シラミ目(Phthiraptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)、バッタ目(Saltatoria 又は Orthoptera)、ノミ目(Siphonaptera)及びシミ目(Zygentoma)の害虫、並びに、軟甲綱(Malacostraca)のワラジムシ目(Isopoda)の害虫などをあげることができる。

【0298】

施用は、例えば、エーロゾル、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)において実施するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、又は、ベイトステーションで実施する。

【実施例】

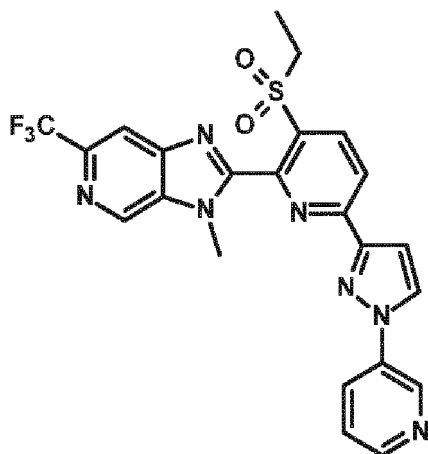
【0299】

調製実施例：

実施例 I - 30

2 - { 3 - (エチルスルホニル) - 6 - [1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] ピリジン - 2 - イル } - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン

【化13】



【0300】

脱ガスしたジオキサン(2 mL)と脱ガスした炭酸ナトリウム溶液(1 M、1 mL)の混合物に、アルゴン雰囲気下、100 mg(0.24 mmol)の2 - (6 - クロロ - 3

- エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン、 47 mg (0 . 24 mmol) の [1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] ホウ酸 (対応するボロン酸エステルの合成に関しては、 「 Tetrahedron Letters 2011 , 52 , 1506 - 1508 」 を参照されたい) 及び 9 mg (0 . 01 mmol) のテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) を最初に添加し、 96 で 14 時間攪拌した。次いで、その反応混合物を室温まで冷却し、減圧下で濃縮し、その残渣を取って水とジクロロメタンの中に入れた。相を分離し、その水相をジクロロメタンで 3 回抽出し、その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過した。溶媒を減圧下で留去し、その残渣を、移動相として水 / アセトニトリルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィーで精製した。

10

【 0301 】

log P (中性) : 2 , 73 ; MH⁺ : 514 ; ¹H - NMR (400 MHz , D₆ - DMSO) ppm : 1 , 23 (t , 3H) , 3 , 82 (q , 2H) , 3 , 97 (s , 3H) , 7 , 31 (d , 1H) , 7 , 62 - 7 , 65 (m , 1H) , 8 , 33 (s , 1H) , 8 , 39 - 8 , 41 (m , 1H) , 8 , 58 - 8 , 65 (m , 3H) , 8 , 81 (d , 1H) , 9 , 26 (d , 1H) , 9 , 33 (s , 1H) 。

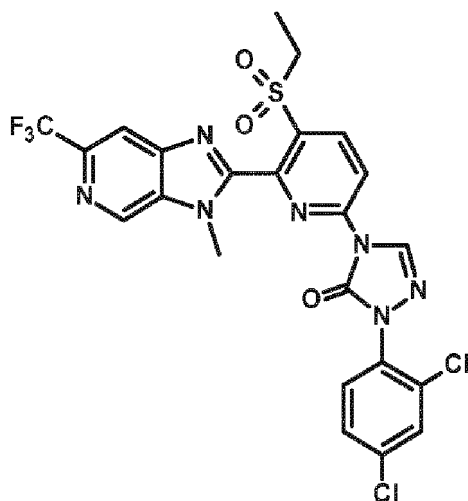
【 0302 】

実施例 I - 2

2 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 2 - ピリ
ジル] - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - オン

20

【 化 14 】



30

【 0303 】

50 mg (0 . 12 mmol) の 2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジンを 5 mL のアセトニトリルに溶解させ ; 85 . 25 mg (0 . 37 mmol) の 2 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - オン、 20 . 49 mg (0 . 14 mmol) の炭酸カリウム及び 32 . 19 mg (0 . 09 mmol) の炭酸セシウムを添加し、その混合物を 65 - 70 で 16 時間攪拌した。次いで、その反応混合物を濾過し、その母液から溶媒を減圧下で除去し、その残渣を、移動相として水 / アセトニトリルの勾配を使用する分取 HPLC によるカラムクロマトグラフィーで精製した。

40

【 0304 】

log P (中性) : 3 , 71 ; MH⁺ : 598 ; ¹H - NMR (400 MHz , D₆ - DMSO) ppm : 1 , 23 (t , 3H) , 3 , 84 (q , 2H) , 4 , 00 (s , 3H) , 7 , 65 - 7 , 73 (m , 2H) , 7 , 94 (d , 1H) , 8 , 34 (s , 1H) , 8 , 70 , (d , 1H) , 8 , 78 (d , 1H) , 9 , 09 (s , 1H) , 9 , 3

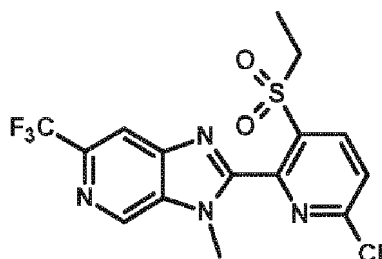
50

5 (s, 1H)。

【0305】

2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン

【化15】



10

【0306】

900 mg (2.41 mmol) の 2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン を 50 mL のジクロロメタンに溶解させ、555.6 mg (12.0 mmol) のギ酸及び 1.64 mg (16.8 mmol) の 35% 強度過酸化水素を室温で添加し、次いで、その混合物を室温で 5 時間攪拌した。その混合物を水で稀釈し、重亜硫酸ナトリウム溶液を添加し、その混合物を 1 時間攪拌し、次いで、飽和炭酸水素ナトリウム溶液を添加した。その有機相を分離し、その水相をジクロロメタンで 2 回抽出し、次いで、その有機相を合して溶媒を減圧下で除去した。その残渣を、移動相として水 / アセトニトリルの勾配を使用する分取 HPLC を用いて、カラムクロマトグラフィー精製で精製した。

20

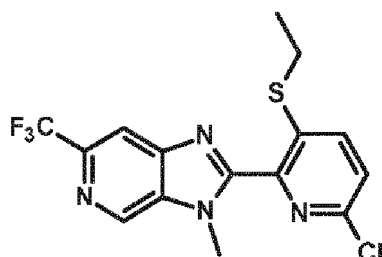
【0307】

log P (中性) : 2.54 ; MH⁺ : 405 ; ¹H - NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm : 1.20 (t, 3H), 3.77 (q, 2H), 3.91 (s, 3H), 8.13 (d, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.56 (d, 1H), 9.30 (s, 1H)。

【0308】

2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン

【化16】



40

【0309】

4.00 g (10.7 mmol) の 2 - (3, 6 - ジクロロ - 2 - ピリジル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン を 60 mL のテトラヒドロフランに溶解させ、446 mg (11.1 mmol) の水素化ナトリウムを -5 で添加し、その混合物を 0 で 30 分間攪拌した。次いで、733 mg (11.8 mmol) のエタンチオールを -5 で 30 分間かけて滴下して加え、冷却浴を除去し、その混合物を室温で 2 時間、後攪拌した。その反応混合物を水を用いて加水分解し、その有機相を分離し、その水相を酢酸エチルで 2 回抽出した。その有機相を合し、塩化ナトリウム溶

50

液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を、メチル *tert*-ブチルケトン/ジクロロメタン(25:1)を用いて摩擦することによって精製した。

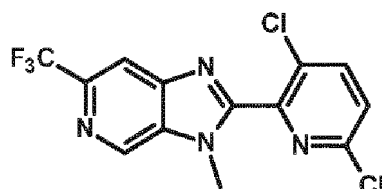
【0310】

$\log P$ (中性): 3.06; MH^+ : 373。

【0311】

2-(3,6-ジクロロ-2-ピリジル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)
イミダゾ[4,5-c]ピリジン

【化17】



10

【0312】

20g (104.6 mmol) の N^3 -メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3,4-ジアミン、25.11g (130.8 mmol) の 3,6-ジクロロピリジン-2-カルボン酸及び 20.06g (104.6 mmol) の 1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)を、200mLのピリジンの中で、120 で8時間撹拌した。その反応混合物から溶媒を減圧下で除去し、水を添加し、その混合物を酢酸エチルで3回抽出した。その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を、シクロヘキサン/酢酸エチルの勾配を移動相として使用するカラムクロマトグラフィーで精製した。

20

【0313】

$\log P$ (中性): 2.81; MH^+ : 347; 1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) ppm: 3.99 (s, 3H), 7.89 (d, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.35 (d, 1H), 9.28 (s, 1H)。

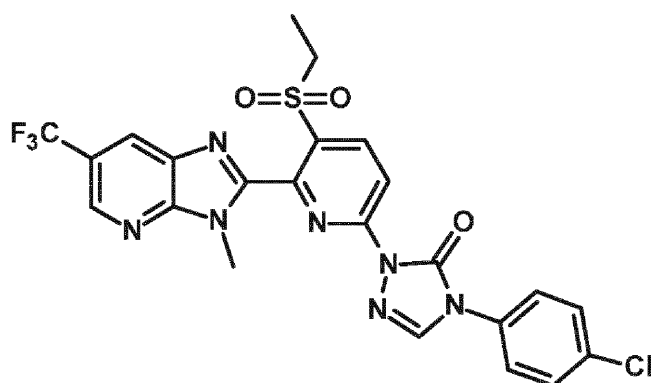
30

【0314】

実施例 I - 33

4-(4-クロロフェニル)-2-{5-(エチルスルホニル)-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-2-イル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン

【化18】



40

【0315】

アルゴン雰囲気下、2-[3-(エチルスルホニル)-6-フルオロピリジン-2-イ

50

ル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン (50 mg、0.12 mmol、1 eq.) を 8 mL のアセトニトリルに溶解させた。炭酸セシウム (62 mg、0.19 mmol、1.5 eq.)、ヨウ化カリウム (11 mg、0.06 mmol、0.5 eq.) 及び 4 - (4 - クロロフェニル) - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - オン (50 mg、0.25 mmol、2 eq.) を添加し、その混合物を 65 - 70 で 4 時間加熱した。室温まで冷却した後、濾過によって全ての固体を除去し、その反応溶液にシリカゲルを添加した。その有機溶媒をロータリーエバポレーターで除去し、その残渣を、クロマトグラフィー (移動相: シクロヘキサン、酢酸エチル) で精製した。

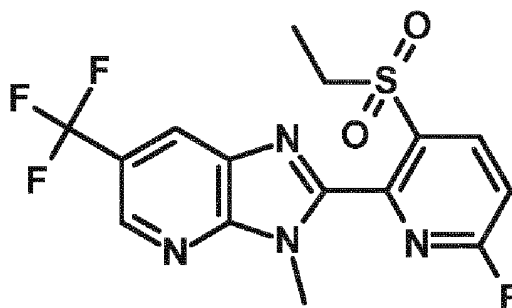
【0316】

log P (中性): 3.52; MH⁺: 564; ¹H - NMR (400 MHz, D₆ - DMSO) ppm: 8.92 (s, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.72 - 8.70 (m, 1H), 8.50 - 8.48 (m, 1H), 7.80 - 7.77 (m, 2H), 7.67 - 7.65 (m, 2H), 3.90 - 3.85 (m, 5H), 1.27 - 1.23 (m, 3H)。

【0317】

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

【化19】



【0318】

2 - [3 - (エチルスルファニル) - 6 - フルオロピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン (5.0 g、14 mmol) を室温で 144 mL のジクロロメタンに溶解させた。ギ酸 (3.2 g、70 mmol) 及び過酸化水素水溶液 (35%、9.5 g、98 mmol) を添加した。室温で 12 時間攪拌した後、20 mL の水を添加し、次いで、反応を終了させるために 20 mL の 40% 重亜硫酸ナトリウム溶液をゆっくりと添加した。その混合物を 1 時間攪拌し、次いで、相を分離した。その水相をジクロロメタンで 3 回抽出し、次いで、その有機抽出物を合して飽和 NaHCO₃ 溶液で洗浄した。その有機相を MgSO₄ で脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。

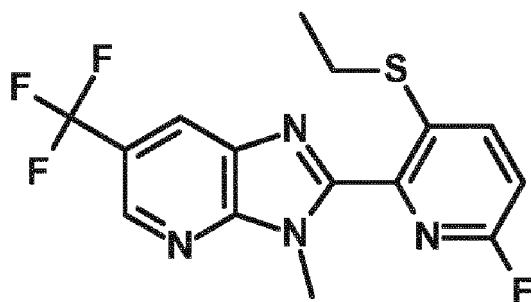
【0319】

log P (中性): 2.80; MH⁺: 389; ¹H - NMR (400 MHz, D₆ - DMSO) ppm: 8.91 (m, 1H), 8.70 (m, 2H), 7.81 (dd, 1H), 3.82 (m, 5H), 1.22 (t, 3H)。

【0320】

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

【化20】



10

【0321】

2-(3,6-ジフルオロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(2.5g、8.17mmol)を19mLの乾燥THFに溶解させ、-10℃に冷却した。NaH(60%、340mg、8.5mmol)を添加し、その混合物を攪拌しながら室温まで昇温させた。10mLの乾燥THFに溶解させたエチルメルカプタン(559mg、9.0mmol)を極めてゆっくりと滴下して加え、その混合物を室温で3時間攪拌した。その反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和NaCl溶液で2回洗浄した。その有機相を脱水した後、減圧下で濃縮し、その残渣をカラムクロマトグラフィー(移動相:勾配 シクロヘキサン/酢酸エチル)で精製した。

20

【0322】

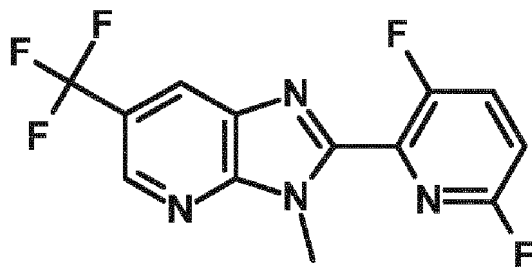
log P(中性): 3.45; MH⁺: 357; ¹H-NMR(400MHz, D₆-DMSO) ppm: 8.87(s, 1H), 8.68(m, 1H), 8.29(m, 1H), 7.49(dd, 1H), 3.94(s, 3H), 3.01(q, 2H), 1.19(t, 3H)。

【0323】

2-(3,6-ジフルオロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン

【化21】

30



【0324】

40

アルゴン下、N2-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2,3-ジアミン(5.0g、18.3mmol)を100mLの乾燥ピリジンに溶解させ、3,6-ジフルオロピリジン-2-カルボン酸(2.9g、18.3mmol)及びN-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド塩酸塩(3.5g、18.3mmol)を添加した。その混合物を120℃で9時間攪拌した。室温まで冷却した後、その混合物を減圧下で濃縮し、次いで、酢酸エチルで希釈した。その有機相を水で洗浄し、MgSO₄で脱水し、減圧下で濃縮した。その生成物は、メチルtert-ブチルエーテルから再結晶させることによって、部分的に精製することができる。

【0325】

(log P(中性): 2.72; MH⁺: 315; ¹H-NMR(400MHz, D

50

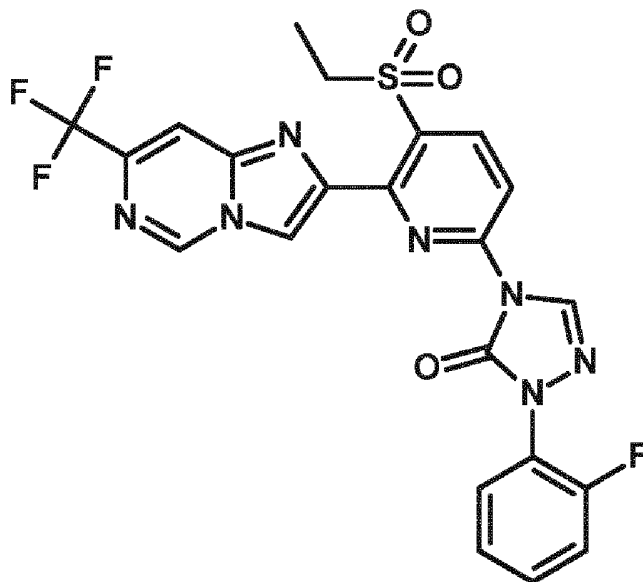
δ - DMSO) ppm: 8.88 (m, 1H), 8.70 (m, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.60 (m, 1H), 4.07 (s, 3H)。

【0326】

実施例 I - 35

4 - { 5 - (エチルスルホニル) - 6 - [7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - イル] ピリジン - 2 - イル } - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - オン

【化22】



10

20

【0327】

2 - [3 , 6 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン - 2 - イル] - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン (46 mg、0.1 mmol、1 eq.) を、アルゴン雰囲気下、3 mL のアセトニトリルに溶解させ、炭酸セシウム (50 mg、0.15 mmol、1.5 eq.)、ヨウ化カリウム (8 mg、0.05 mmol、0.5 eq.) 及び 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - オン (37 mg、0.2 mmol、2 eq.) を添加した。その混合物を室温で 12 時間攪拌し、次いで、環流温度に 1 時間加熱した。室温まで冷却した後、濾過によって固体成分を全て除去し、その溶液をロータリーエバポレーターで濃縮した。その残渣をクロマトグラフィー (移動相: シクロヘキサン、酢酸エチル) で精製した。

30

【0328】

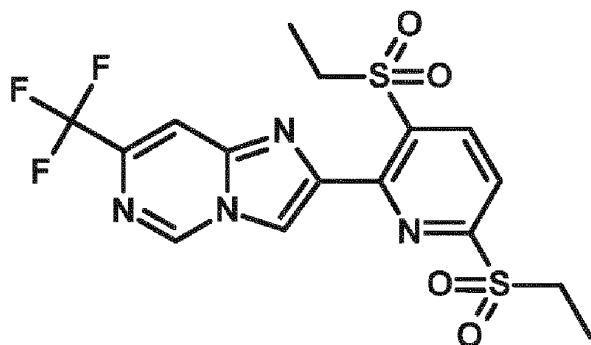
log P (中性): 3.16; MH⁺: 534; ¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 9.65 (s, 1H), 9.17 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.72 - 8.67 (m, 1H), 8.48 - 8.46 (m, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.70 - 7.65 (m, 1H), 7.60 - 7.54 (m, 1H), 7.52 - 7.45 (m, 1H), 7.42 - 7.39 (m, 1H), 4.22 - 4.17 (m, 2H), 1.30 - 1.27 (m, 3H)。

40

【0329】

2 - [3 , 6 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン - 2 - イル] - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン

【化23】



10

【0330】

2-[3,6-ビス(エチルスルファニル)ピリジン-2-イル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン(100mg、0.33mmol、1eq.)を、アルゴン雰囲気下、2mLの乾燥DMFに溶解させた。ナトリウムエタンチオラート(168mg、1.99mmol、6eq.)を添加し、その混合物を室温で12時間撹拌した。その混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄した。その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒をロータリーエバポレーターで除去した。その粗製生成物は、それ以上精製することなく次の反応で使用した。

20

【0331】

2-[3,6-ビス(エチルスルファニル)ピリジン-2-イル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン(75mg、0.19mmol、1eq.)を9mLのジクロロメタンに溶解させた。室温で、ギ酸(90mg、1.95mmol、10eq.)及び過酸化水素溶液(35%、265mg、12.7mmol、14eq.)を添加し、その混合物を12時間撹拌した。1mLの水を添加した後、3mLの40%重亜硫酸ナトリウム溶液をゆっくりと滴下して加え、その混合物を1時間撹拌した。次いで、その有機相を分離し、飽和炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。その残渣を、クロマトグラフィー(移動相:シクロヘキサン、酢酸エチル)で精製した。

30

【0332】

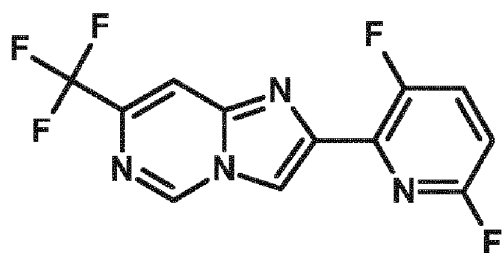
$\log P$ (中性): 2.28; MH^+ : 449; 1H -NMR(400MHz, D_6 -DMSO) ppm: 9.67(s, 1H), 8.86(s, 1H), 8.82-8.80(m, 1H), 8.41(s, 1H), 8.36-8.34(m, 1H), 4.23-4.18(m, 2H), 3.64-3.59(m, 2H), 1.30-1.23(m, 6H)。

【0333】

2-(3,6-ジフルオロピリジン-2-イル)-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン

【化24】

40



【0334】

第2の反応容器の中で、6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-4-アミン(201

50

mg、1.23 mmol、1 eq.) 及び炭酸水素ナトリウム (155 mg、1.85 mmol、1.5 eq.) を 3 mL のクロロホルムに溶解又は懸濁させた。2 - プロモ - 1 - (3, 6 - ジフルオロピリジン - 2 - イル) エタノン (502 mg、1.23 mmol、1 eq.) を 1 mL のクロロホルムに滴下して加えて溶解させ、次いで、その反応混合物を 60 で 4 時間加熱した。炭酸水素ナトリウムを濾過して除去し、その有機相を濃縮した。その残渣を、クロマトグラフィー (シリカゲル、移動相：シクロヘキサン / 酢酸エチル) で精製した。

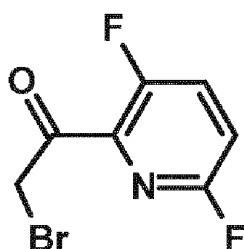
【0335】

log P (中性) : 2.02 ; ; MH⁺ : 301 ; ¹H - NMR (400 MHz, D₆ - DMSO) ppm : 9.64 (s, 1H), 8.77 (d, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.17 - 8.10 (m, 1H), 7.36 - 7.32 (m, 1H)。

10

【0336】

2 - プロモ - 1 - (3, 6 - ジフルオロピリジン - 2 - イル) エタノン
【化25】



20

【0337】

1 - (3, 6 - ジフルオロピリジン - 2 - イル) エタノン (6.4 g、40.7 mmol) を 96 mL のエタノールに溶解させ、臭化銅 (II) (13.7 g、61.1 mmol) を添加した。その反応混合物を 60 で 4 時間加熱した。室温まで冷却した後、溶媒をロータリーエバポレーターで除去し、その残渣を取って飽和塩化アンモニウム溶液及び酢酸エチルと合した。その水相を酢酸エチルで 2 回抽出した。その有機抽出物を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。その生成物は、混合物として単離され、それ以上精製することなく次の反応において使用した。

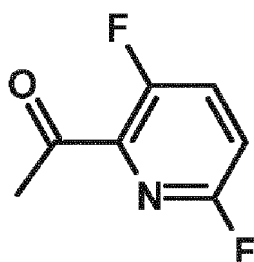
30

【0338】

log P (中性) : 1.95 ; MH⁺ : 2.38 ; ¹H - NMR (400 MHz, CDCl₃) ppm : 8.17 - 8.10 (m, 1H), 7.62 - 7.57 (m, 1H), 2.56 (s, 2H)。

【0339】

1 - (3, 6 - ジフルオロピリジン - 2 - イル) エタノン
【化26】



40

【0340】

アルゴン雰囲気下、3, 6 - ジフルオロ - N - メトキシ - N - メチルピリジン - 2 - カルボキサミド (10.1 g、50.2 mmol) を 270 mL の乾燥 THF に溶解させ、

50

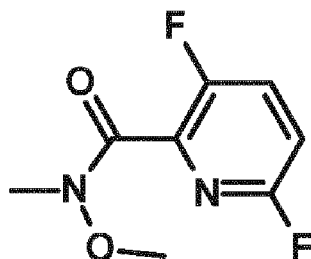
0 に冷却した。メチルマグネシウムブロミド（ジエチルエーテル中 3 M、50 mL、150 mmol）をゆっくりと滴下して加え、次いで、その混合物を 0 で 2 時間攪拌した。反応を終了させるために、冷却しながら 50 mL の塩化アンモニウム溶液をゆっくりと添加した。その有機相を分離し、飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、濃縮した。その生成物は、それ以上精製することなく次の反応において使用した。

【0341】

$\log P$ （中性）：1.24； MH^+ ：158； ^1H-NMR （400 MHz， $CDCl_3$ ） ppm：8.16 - 8.10（m，1H），7.61 - 7.57（m，1H），2.56 - 2.55（m，3H）。

【0342】

3,6-ジフルオロ-N-メトキシ-N-メチルピリジン-2-カルボキサミド
【化27】



【0343】

3,6-ジフルオロピリジン-2-カルボン酸（15 g、94 mmol）及びN,O-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩（9.1 g、94.2 mmol）を600 mLのジクロロメタンに溶解させ、0 に冷却した。4-ジメチルアミノピリジン（DMAP、13.8 g、113 mmol）及びN-(ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド塩酸塩（EDCI、19.9 g、103 mmol）を添加し、その反応混合物を 0 で 2 時間攪拌し、次いで、室温で 12 時間攪拌した。その溶液を、飽和炭酸水素ナトリウム溶液で 1 回洗浄し、塩化ナトリウム溶液で 1 回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。その粗製生成物は、それ以上精製することなく次の反応において使用した。

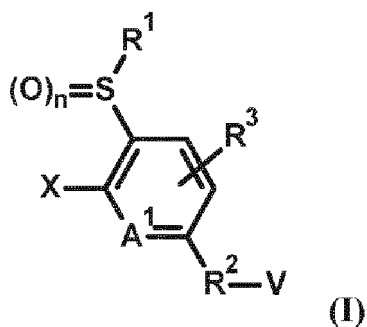
【0344】

$\log P$ （中性）：1.05； MH^+ ：203； ^1H-NMR （400 MHz， $CDCl_3$ ） ppm：8.15 - 8.09（m，1H），7.44 - 7.42（m，1H），3.57（s，3H），3.31（s，3H）。

【0345】

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

【化28】



【0346】

ここで、置換基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 A^1 、 X 、 V 及び n は、下記表において与えられてい

10

20

30

40

50

る意味を有し、並びに、 $R^2 - V$ から当該分子の残部への結合は波線によって記載されており、及び、 X から当該分子の残部への結合は点線によって記載されている：

【表 1】

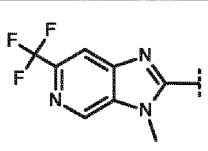
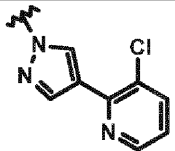
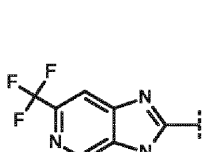
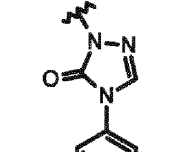
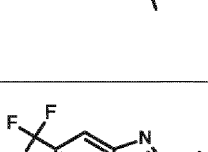
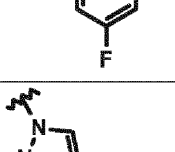
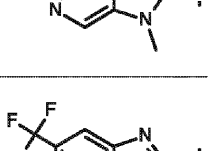
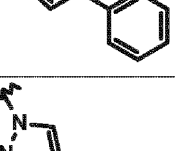
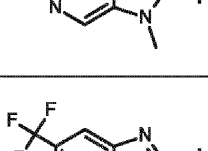
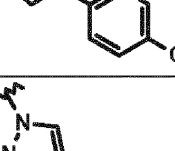
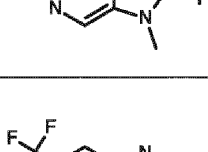
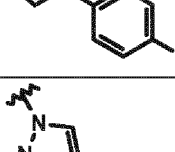
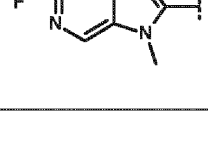
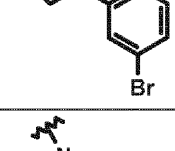
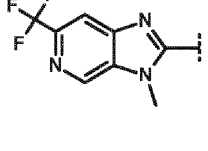
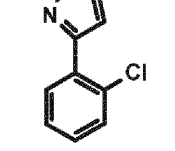
Bsp.	R^1	n	A^1	R^3	X	R^2-V
I-1	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	-H		
I-2	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	H		
I-3	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	-H		
I-4	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	-H		
I-5	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	-H		
I-6	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	2	N	-H		

10

20

30

40

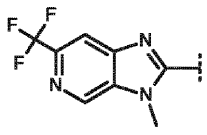
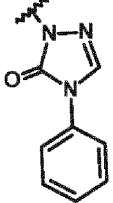
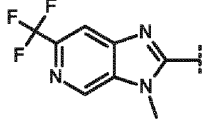
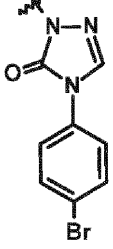
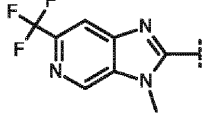
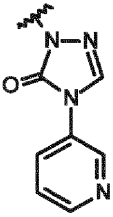
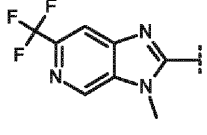
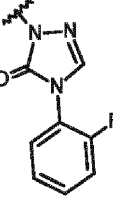
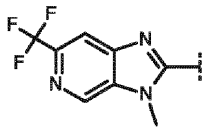
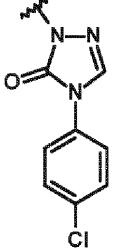
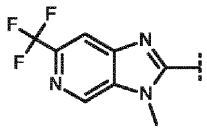
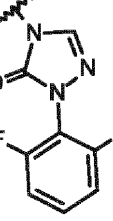
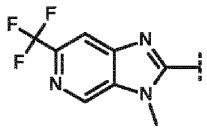
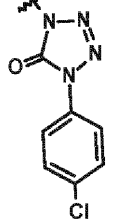
I-7	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-8	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-9	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-10	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-11	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-12	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-13	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-14	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

10

20

30

40

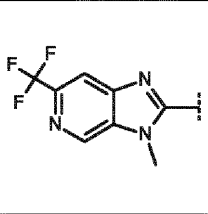
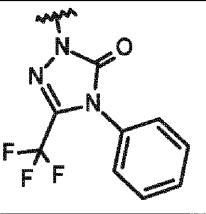
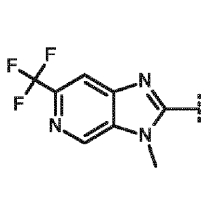
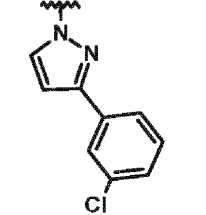
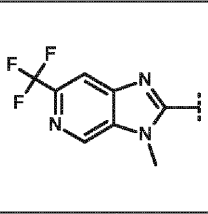
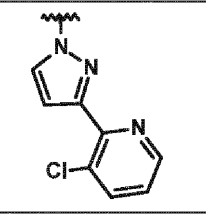
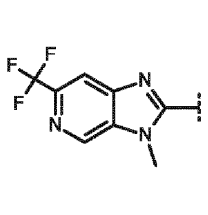
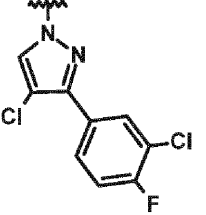
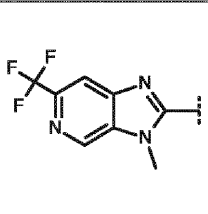
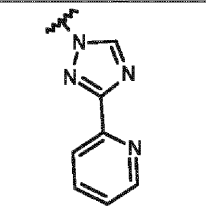
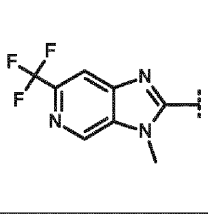
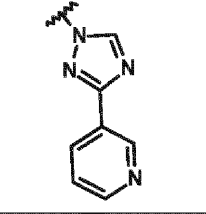
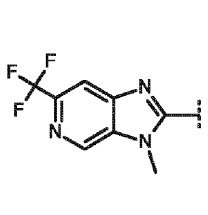
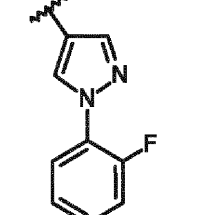
I-15	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-16	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-17	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-18	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-19	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-20	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-21	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

10

20

30

40

I-22	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-23	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-24	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-25	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-26	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-27	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-28	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

10

20

30

40

I-29	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-30	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-31	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-32	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-33	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-34	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-35	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
------	----------------------------------	---	---	---	--	--

10

20

30

40

50

【表 2】

<p>实施例 I-1: logP (中性): 3.03 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,352(4,6);9,070(6,9);8,791(2,3);8,768(4,5);8,724(4,5);8,702(2,4);8,339(4,9);7,677(0,9);7,662(1,6);7,658(1,8);7,642(0,9);7,638(1,0);7,598(0,3);7,581(0,9);7,564(1,1);7,550(0,7);7,546(0,6);7,519(1,3);7,496(1,5);7,474(0,7);7,426(1,2);7,405(1,9);7,388(0,8);4,005(16,0);3,873(1,0);3,855(3,5);3,836(3,5);3,818(1,1);3,315(67,6);2,670(1,0);2,505(123,3);2,501(159,0);2,497(120,2);2,328(1,0);2,324(0,7);2,073(0,6);1,253(3,8);1,235(8,4);1,216(3,7);0,000(11,1)</p>	
<p>实施例 I-3: logP (中性): 3.87 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,326(4,7);9,288(0,5);8,854(3,0);8,832(4,1);8,686(3,8);8,663(3,0);8,324(5,0);8,314(1,1);8,304(0,4);8,291(0,6);8,243(0,4);7,767(2,1);7,744(7,6);7,727(7,5);7,705(2,2);7,664(0,4);7,639(3,7);7,630(4,0);7,616(0,4);7,587(0,4);7,565(0,5);7,548(0,5);7,510(0,6);7,491(0,4);7,446(3,7);7,437(3,6);7,417(0,5);7,368(0,4);7,361(0,3);7,126(0,3);3,980(0,8);3,968(16,0);3,954(0,8);3,902(1,3);3,875(0,5);3,868(0,5);3,823(1,6);3,802(3,6);3,784(3,8);3,766(1,4);3,702(0,3);3,685(0,4);3,385(0,4);3,361(0,7);3,319(476,1);2,671(2,9);2,666(2,1);2,506(375,7);2,501(483,5);2,497(351,0);2,332(2,2);2,328(2,9);1,268(0,4);1,242(4,1);1,223(8,7);1,205(4,3);1,184(1,5);1,166(1,0);1,150(0,6);1,132(0,6);1,115(0,4);1,105(0,4);0,000(25,3);-0,008(1,0)</p>	10
<p>实施例 I-4: logP (中性): 3.34 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,323(4,0);8,866(3,3);8,844(3,9);8,580(3,9);8,558(3,6);8,348(4,3);7,843(3,0);7,839(1,8);7,824(3,9);7,820(2,4);7,737(0,8);7,732(0,9);7,718(1,7);7,713(1,6);7,698(1,2);7,693(1,1);7,678(1,4);7,674(1,4);7,659(1,7);7,655(1,6);7,639(0,6);7,636(0,6);3,998(16,0);3,888(0,9);3,870(3,3);3,851(3,3);3,833(1,0);3,319(75,1);2,676(0,4);2,671(0,6);2,667(0,4);2,524(1,3);2,511(33,7);2,507(71,0);2,502(95,3);2,498(69,4);2,493(34,6);2,333(0,4);2,329(0,6);2,324(0,4);1,263(3,6);1,244(8,1);1,226(3,5);0,008(0,5);0,000(15,8);-0,008(0,7)</p>	
<p>实施例 I-5: logP (中性): 3.86 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,305(4,0);8,681(3,3);8,658(4,4);8,470(3,9);8,447(3,4);8,313(0,5);8,299(4,2);7,735(0,4);7,727(4,0);7,722(1,4);7,710(1,4);7,705(5,0);7,697(0,5);7,502(0,5);7,494(5,2);7,489(1,5);7,477(1,3);7,471(4,4);7,463(0,4);4,162(0,9);4,144(1,9);4,137(1,3);4,122(1,8);4,026(1,7);4,005(1,8);3,985(0,9);3,942(16,0);3,764(1,0);3,745(3,2);3,727(3,3);3,708(0,9);3,317(129,2);2,675(0,7);2,670(1,0);2,666(0,8);2,661(0,4);2,524(2,4);2,519(3,7);2,510(60,0);2,506(128,2);2,501(174,0);2,497(125,1);2,492(59,4);2,337(0,3);2,333(0,7);2,328(1,0);2,323(0,7);2,319(0,3);2,073(3,5);1,234(0,8);1,223(3,6);1,205(8,1);1,186(3,5);0,146(0,4);0,008(2,7);0,000(88,7);-0,008(3,0);-0,150(0,4)</p>	20
<p>实施例 I-6: logP (中性): 4.62 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,344(4,0);8,809(3,9);8,802(4,0);8,705(3,2);8,683(4,0);8,470(3,9);8,448(3,4);8,336(4,2);8,334(4,3);8,313(0,4);8,074(0,6);8,068(4,4);8,063(1,6);8,051(1,6);8,046(5,1);8,040(0,7);7,604(0,7);7,598(5,0);7,593(1,7);7,581(1,5);7,576(4,8);7,259(3,7);7,252(3,7);4,092(0,4);4,003(16,0);3,852(0,9);3,833(3,3);3,815(3,3);3,796(1,0);3,320(150,6);2,675(0,6);2,671(0,9);2,666(0,7);2,524(2,4);2,511(55,3);2,506(116,2);2,502(156,5);2,497(113,1);2,493(54,5);2,333(0,7);2,329(0,9);2,324(0,7);2,074(0,9);1,258(3,5);1,240(8,1);1,221(3,4);0,008(0,9);0,000(25,1);-0,008(1,0)</p>	
<p>实施例 I-7: logP (中性): 3.66 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,389(0,4);9,326(3,9);9,247(5,1);9,246(5,4);9,205(0,4);8,727(3,4);8,705(4,1);8,640(5,3);8,638(5,5);8,611(2,1);8,607(2,3);8,599(2,3);8,596(2,3);8,565(0,4);8,465(3,9);8,457(0,4);8,453(0,4);8,443(3,6);8,346(0,4);8,338(4,1);8,337(4,2);8,048(2,1);8,045(2,2);8,028(2,3);8,024(2,2);7,404(2,2);7,393(2,1);7,384(1,9);7,373(2,0);4,450(1,2);4,093(1,2);4,005(16,0);3,854(0,9);3,835(3,1);3,817(3,2);3,798(0,9);3,321(74,6);2,676(0,5);2,672(0,6);2,667(0,5);2,525(1,5);2,512(38,4);2,507(80,9);2,503(108,5);2,498(78,1);2,494(37,4);2,334(0,4);2,329(0,6);2,325(0,5);1,323(0,6);1,260(3,5);1,242(8,1);1,223(3,5);0,008(0,5);0,000(16,4);-0,009(0,6)</p>	
<p>实施例 I-8: logP (中性): 2.75 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,311(4,0);8,815(9,1);8,710(3,2);8,688(4,2);8,522(4,2);8,500(3,6);8,327(4,2);8,326(4,2);8,313(0,6);8,147(1,2);7,789(2,2);7,783(0,9);7,776(2,4);7,771(1,4);7,766(2,7);7,759(0,9);7,754(2,6);7,462(2,7);7,456(0,8);7,440(4,3);7,423(0,7);7,418(2,4);4,316(0,4);3,977(16,0);3,849(0,9);3,831(3,3);3,812(3,3);3,794(1,0);3,780(0,5);3,317(81,6);2,679(0,5);2,675(1,0);2,670(1,5);2,666(1,1);2,524(3,3);2,519(5,1);2,510(85,2);2,506(183,7);2,501(249,8);2,497(180,2);2,492(85,3);2,332(1,0);2,328(1,5);2,323(1,1);2,073(0,8);1,988(0,4);1,447(0,4);1,430(0,4);1,250(3,6);1,231(8,1);1,213(3,5);1,175(0,4);0,146(1,4);0,008(10,3);0,000(329,0);-0,009(11,3);-0,150(1,4)</p>	30
<p>实施例 I-9: logP (中性): 3.92 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,364(4,1);9,170(5,0);8,683(3,4);8,661(4,1);8,535(5,1);8,409(3,9);8,387(3,6);8,344(4,3);8,312(0,7);7,823(3,2);7,805(3,4);7,420(1,9);7,401(3,8);7,382(2,4);7,302(1,3);7,284(1,9);7,266(0,8);4,454(0,4);4,029(16,0);3,853(0,9);3,834(3,2);3,815(3,3);3,797(1,0);3,324(225,0);2,675(1,2);2,671(1,7);2,666(1,3);2,524(4,2);2,511(103,9);2,506(219,7);2,502(297,2);2,497(215,9);2,493(105,4);2,333(1,2);2,329(1,7);2,324(1,3);1,261(3,6);1,242(8,4);1,224(3,6);0,146(1,3);0,008(10,2);0,000(295,2);-0,008(11,8);-0,150(1,3)</p>	
<p>实施例 I-10: logP (中性): 4.33 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,407(0,7);9,368(4,3);9,341(0,4);9,228(5,1);9,218(1,0);9,140(0,5);8,697(0,6);8,686(3,2);8,675(0,8);8,664(3,9);8,554(5,2);8,508(0,9);8,458(0,5);8,419(0,9);8,407(3,8);8,397(0,6);8,385(3,4);8,365(0,8);8,344(4,6);8,314(3,6);8,218(0,3);7,911(0,7);7,889(0,8);7,874(4,4);7,857(1,9);7,853(5,0);7,837(0,6);7,642(0,4);7,621(0,4);7,513(0,8);7,492(0,7);7,469(5,1);7,464(2,0);7,448(4,7);7,441(1,0);7,403(0,4);7,383(0,3);4,447(2,6);4,113(1,6);4,056(0,4);4,038(1,4);4,027(16,0);4,002(0,6);3,854(1,0);3,835(3,2);3,817(3,3);3,798(1,0);3,317(190,9);3,293(1,8);2,675(1,6);2,670(2,2);2,666(1,6);2,524(5,5);2,510(134,9);2,506(276,1);2,501(366,7);2,497(267,2);2,333(1,5);2,328(2,1);2,324(1,6);2,073(1,5);1,988(4,5);1,337(0,7);1,319(1,3);1,301(0,6);1,259(3,7);1,241(8,3);1,222(3,6);1,193(1,2);1,175(2,4);1,157(1,2);0,146(1,9);0,008(16,5);0,000(418,8);-0,009(19,1);-0,150(1,9)</p>	40
<p>实施例 I-11: logP (中性): 4.17 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,394(0,4);9,343(3,8);8,872(0,3);8,865(0,4);8,795(3,9);8,788(4,1);8,713(0,4);8,700(3,3);8,691(0,5);8,678(4,1);8,472(0,4);8,463(4,0);8,450(0,4);8,441(3,5);8,359(0,4);8,336(3,9);8,334(4,1);8,313(0,7);8,097(2,1);8,092(0,9);8,083(2,4);8,075(2,4);8,067(1,1);8,061(2,0);7,379(2,2);7,357(4,4);7,340(0,7);7,335(2,3);7,238(0,4);7,228(3,6);7,221(3,7);4,430(1,4);4,092(0,6);4,003(16,0);3,848(0,9);3,829(3,2);3,811(3,2);3,792(0,9);3,319(149,9);2,680(0,6);2,675(1,2);2,671(1,7);2,666(1,2);2,662(0,6);2,524(4,3);2,519(6,6);2,511(95,8);2,506(205,5);2,501(279,9);2,497(200,6);2,492(94,3);2,333(1,1);2,328(1,6);2,324(1,1);2,319(0,5);2,073(1,0);1,340(0,4);1,321(0,8);1,303(0,4);1,257(3,5);1,239(8,0);1,220(3,4);0,146(0,7);0,00</p>	

<p>8(6,0);0,000(183,7);-0,009(6,3);-0,150(0,7)</p> <p>实施例 I-12: logP (中性): 4.48 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,372(3,8);9,294(4,6);8,690(3,6);8,668(4,3);8,599(4,7);8,412(4,1);8,390(3,8);8,346(4,0);8,314(0,5);8,103(1,7);8,098(3,0);8,094(1,8);7,855(1,4);7,835(1,5);7,480(0,9);7,478(1,1);7,476(1,0);7,473(1,0);7,458(1,5);7,455(1,6);7,453(1,4);7,376(1,9);7,356(2,9);7,336(1,3);4,451(0,3);4,031(16,0);3,857(0,9);3,839(3,0);3,820(3,1);3,802(0,9);3,316(100,2);2,675(1,0);2,670(1,4);2,666(1,0);2,661(0,5);2,524(3,8);2,519(6,0);2,510(86,0);2,506(182,3);2,501(245,4);2,497(174,9);2,492(82,5);2,337(0,5);2,333(1,1);2,328(1,4);2,323(1,1);2,073(0,4);1,260(3,5);1,242(8,3);1,223(3,5);0,146(1,2);0,008(10,9);0,000(304,0);-0,009(10,9);-0,150(1,2)</p>	
<p>实施例 I-13: logP (中性): 4.58 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,345(4,2);9,323(0,3);8,831(3,8);8,824(4,0);8,708(3,2);8,686(3,9);8,454(4,0);8,432(3,6);8,364(0,3);8,338(4,4);8,312(1,4);7,929(1,5);7,918(1,7);7,911(1,1);7,905(1,7);7,643(1,4);7,637(1,0);7,631(1,6);7,627(1,2);7,620(1,9);7,611(0,5);7,529(0,6);7,514(2,9);7,503(3,1);7,497(1,9);7,491(2,3);7,479(0,6);7,125(3,8);7,118(4,0);4,438(0,6);4,099(1,0);4,009(16,0);3,853(1,0);3,834(3,4);3,816(3,5);3,797(1,2);3,473(0,4);3,436(0,7);3,410(1,1);3,369(4,2);3,330(517,0);3,239(0,6);3,204(0,4);3,167(0,4);3,146(0,3);2,675(2,2);2,671(3,0);2,666(2,2);2,579(0,5);2,555(0,8);2,524(8,3);2,510(185,4);2,506(374,0);2,501(494,0);2,497(366,3);2,493(184,0);2,438(0,4);2,432(0,4);2,333(2,2);2,328(3,2);2,324(2,3);1,320(0,4);1,258(3,6);1,239(8,3);1,220(3,6);0,146(0,4);0,008(3,6);0,000(109,6);-0,008(4,4);-0,150(0,4)</p>	10
<p>实施例 I-14: logP (中性): 3.47 ¹H-NMR(601,6 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,340(4,7);8,781(3,5);8,776(3,5);8,686(3,0);8,672(3,3);8,387(3,4);8,372(3,1);8,329(4,9);8,311(0,4);7,854(3,7);7,067(2,9);7,062(3,0);7,007(3,4);7,003(3,4);6,684(2,2);6,681(2,7);6,678(2,6);6,676(2,2);3,999(16,0);3,835(1,3);3,823(3,6);3,810(3,8);3,798(1,3);3,310(91,2);2,613(1,3);2,501(218,0);2,498(182,8);2,385(1,4);2,072(2,2);1,248(3,8);1,236(8,3);1,224(4,3);0,000(4,6)</p>	
<p>实施例 I-15: logP (中性): 2.70 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,313(4,0);8,851(7,9);8,710(3,2);8,688(4,1);8,534(4,0);8,512(3,4);8,330(4,2);7,746(2,2);7,743(3,0);7,724(3,5);7,601(2,0);7,582(3,5);7,562(2,3);7,478(1,4);7,459(2,0);7,441(0,7);3,979(16,0);3,849(0,9);3,830(3,3);3,812(3,3);3,793(1,0);3,385(0,5);3,370(0,7);3,320(1057,6);2,675(2,2);2,670(3,0);2,665(2,3);2,523(7,4);2,510(181,1);2,505(376,4);2,501(504,7);2,496(370,6);2,492(182,8);2,332(2,2);2,328(3,0);2,323(2,2);1,250(3,6);1,232(8,2);1,213(3,5);0,008(0,9);0,000(28,9);-0,008(1,2)</p>	
<p>实施例 I-16: logP (中性): 3.17 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,310(4,6);8,864(6,6);8,710(3,9);8,688(5,0);8,515(5,1);8,493(4,5);8,323(3,8);8,308(1,5);7,803(3,5);7,798(1,4);7,787(1,8);7,781(6,9);7,775(1,1);7,740(0,9);7,733(6,6);7,728(1,9);7,716(1,3);7,711(3,7);3,977(16,0);3,848(1,1);3,830(3,5);3,811(3,6);3,793(1,2);3,345(291,1);3,340(207,5);3,329(264,8);3,328(285,2);2,676(1,0);2,672(1,4);2,667(1,0);2,663(0,5);2,542(0,6);2,525(3,8);2,520(6,1);2,512(79,3);2,507(163,8);2,503(217,6);2,498(158,0);2,494(76,6);2,339(0,4);2,334(1,0);2,329(1,4);2,325(1,0);1,251(3,9);1,232(8,9);1,214(3,9);0,000(6,7)</p>	20
<p>实施例 I-17: logP (中性): 2.06 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,314(3,7);8,965(2,4);8,958(2,4);8,920(7,7);8,721(3,3);8,699(4,2);8,660(1,8);8,656(1,9);8,648(1,9);8,644(1,9);8,523(4,0);8,501(3,5);8,331(3,9);8,199(1,0);8,196(1,2);8,193(1,1);8,189(1,0);8,179(1,1);8,175(1,2);8,172(1,3);8,168(1,1);7,654(1,3);7,653(1,3);7,642(1,2);7,641(1,3);7,634(1,2);7,632(1,2);7,622(1,2);7,620(1,2);3,979(16,0);3,852(0,9);3,833(3,1);3,815(3,2);3,796(0,9);3,321(215,0);2,675(0,5);2,670(0,7);2,666(0,5);2,524(1,6);2,519(2,4);2,510(40,5);2,506(86,2);2,501(116,3);2,497(84,3);2,492(40,6);2,333(0,5);2,328(0,7);2,323(0,5);1,251(3,7);1,233(8,5);1,214(3,4);0,000(4,4)</p>	
<p>实施例 I-18: logP (中性): 2.73 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,309(4,6);8,713(5,2);8,710(4,5);8,688(3,8);8,499(3,8);8,477(3,2);8,329(4,8);7,753(0,9);7,733(1,9);7,717(1,0);7,713(1,0);7,627(0,4);7,610(0,9);7,592(1,3);7,579(0,8);7,575(0,7);7,559(1,4);7,536(1,6);7,515(0,7);7,447(1,2);7,429(1,9);7,412(0,9);3,977(16,0);3,850(1,1);3,832(3,5);3,813(3,6);3,795(1,2);3,387(0,3);3,324(445,6);2,671(1,2);2,506(151,2);2,502(197,0);2,497(156,1);2,328(1,2);2,073(1,4);1,249(3,9);1,230(8,4);1,212(3,7);0,000(4,5);-0,090(1,4)</p>	30
<p>实施例 I-19: logP (中性): 2.82 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,311(1,8);8,866(2,8);8,712(1,1);8,690(1,4);8,516(1,4);8,494(1,2);8,324(1,9);7,798(1,6);7,776(2,2);7,671(2,2);7,649(1,6);3,978(5,9);3,850(0,5);3,832(1,4);3,813(1,4);3,795(0,6);3,743(0,4);3,725(0,6);3,651(16,0);2,671(0,3);2,506(41,8);2,502(54,1);2,498(43,2);1,251(1,4);1,232(3,0);1,214(1,4);0,000(19,7)</p>	
<p>实施例 I-20: logP (中性): 3.13 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,350(4,2);9,137(7,5);8,788(2,7);8,766(4,4);8,698(4,4);8,676(2,9);8,339(4,5);8,312(0,4);7,736(0,7);7,730(0,6);7,714(1,3);7,698(0,7);7,693(0,8);7,677(0,4);7,454(2,2);7,433(3,7);7,413(1,8);4,038(0,4);4,020(0,7);4,009(16,0);3,875(1,0);3,856(3,4);3,837(3,4);3,819(1,0);3,322(135,3);3,319(117,3);2,675(0,6);2,671(0,8);2,666(0,6);2,524(2,0);2,510(49,1);2,506(98,0);2,502(128,9);2,497(96,7);2,329(0,8);2,324(0,6);2,073(0,7);1,988(1,6);1,252(3,7);1,234(8,2);1,215(3,6);1,193(0,4);1,175(0,8);1,157(0,4);0,008(1,0);0,000(29,7)</p>	
<p>实施例 I-21: logP (中性): 3.71 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,326(4,8);8,875(3,2);8,853(3,7);8,572(3,8);8,550(3,5);8,349(5,0);7,946(4,5);7,924(5,6);7,735(5,5);7,713(4,6);3,991(16,0);3,894(1,1);3,876(3,5);3,857(3,6);3,839(1,1);3,332(358,8);2,671(0,6);2,506(81,6);2,502(105,3);2,498(80,8);2,329(0,6);1,265(3,7);1,247(8,1);1,228(3,7);0,000(2,2)</p>	40
<p>实施例 I-22: logP (中性): 3.44 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,310(1,5);8,782(1,2);8,760(1,5);8,559(1,4);8,537(1,2);8,332(1,4);7,627(6,2);3,965(5,6);3,842(0,4);3,823(1,2);3,805(1,2);3,786(0,4);3,349(49,6);3,339(37,4);3,332(31,4);2,525(0,5);2,512(12,3);2,508(24,2);2,503(31,3);2,499(23,0);2,494(11,6);2,072(16,0);1,246(1,3);1,227(3,0);1,209(1,3);0,000(2,4)</p>	
<p>实施例 I-23: logP (中性): 4.64 ¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ=</p> <p>9,346(3,7);8,820(3,9);8,813(4,1);8,699(3,3);8,677(4,3);8,512(4,2);8,490(3,6);8,345(0,3);8,338(3,9);8,336(3,8);8,313(0,4);8,104(1,7);8,099(2,9);8,095(1,7);8,017(1,0);8,014(1,6);8,010(1,0);7,999(1,1);7,995(1,8);7,992(1,1);7,576(0,9);7,556(2,4);7,537(2,1);7,525(1,5);7,522(2,0);7,517(1,6);7,505(0,7);7,500(0,8);7,497(0,6);7,315(3,5);7,308(3,6);4,432(0,4);4,095(1,0);4,007(16,0);3,857(0,9);3,839(3,1);3,820(3,2);3,802(0,9);3,321(1,1)</p>	

07,8);2,680(0,3);2,675(0,7);2,671(1,0);2,666(0,7);2,524(2,6);2,519(4,2);2,511(60,2);2,506(127,2);2,502(170,9);2,497(121,7);2,493(57,0);2,337(0,3);2,333(0,7);2,328(1,0);2,324(0,7);1,260(3,4);1,241(8,0);1,223(3,3);0,146(0,4);0,008(3,7);0,000(114,6);-0,009(4,2);-0,150(0,4)	
实施例 I-24: logP (中性): 2.80 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,348(4,2);8,840(4,0);8,833(4,1);8,728(3,5);8,706(4,2);8,701(2,3);8,697(2,3);8,689(2,3);8,686(2,2);8,446(4,1);8,424(3,7);8,341(4,5);8,314(0,5);8,139(2,2);8,135(2,1);8,118(2,4);8,115(2,2);7,545(2,2);7,534(2,1);7,525(2,0);7,513(2,0);7,184(4,0);7,177(4,1);4,018(16,0);3,859(0,9);3,841(3,3);3,822(3,3);3,804(1,0);3,316(90,6);2,675(1,0);2,671(1,4);2,666(1,0);2,524(4,0);2,510(81,8);2,506(166,2);2,501(227,2);2,497(168,8);2,493(81,2);2,333(1,0);2,328(1,3);2,324(0,9);2,073(0,5);1,260(3,5);1,241(8,1);1,223(3,4);0,146(0,6);0,008(5,3);0,000(147,0);-0,008(5,0);-0,150(0,6)	
实施例 I-25: logP (中性): 5.23 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,360(4,9);9,136(7,4);8,724(3,3);8,702(3,8);8,512(3,8);8,490(3,2);8,340(5,2);8,313(0,4);8,172(1,7);8,167(1,8);8,154(1,7);8,149(1,8);8,040(0,9);8,035(0,9);8,029(1,0);8,023(1,0);8,019(1,1);8,013(1,1);8,007(1,0);8,002(0,9);7,671(1,7);7,649(2,9);7,626(1,5);4,020(16,0);3,885(1,1);3,867(3,5);3,848(3,6);3,830(1,1);3,320(222,3);2,671(1,0);2,506(121,5);2,502(161,9);2,498(125,0);2,329(1,0);2,073(3,6);1,264(3,7);1,245(8,1);1,227(3,7);0,146(0,7);0,000(130,8);-0,150(0,6)	10
实施例 I-26: logP (中性): 2.43 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,668(7,7);9,367(4,6);9,283(0,4);8,818(3,3);8,796(3,9);8,772(1,7);8,762(1,7);8,461(3,8);8,440(3,6);8,351(4,9);8,318(0,4);8,312(0,8);8,237(2,0);8,218(2,5);8,035(1,0);8,031(1,0);8,016(1,8);8,012(1,8);7,997(1,0);7,992(1,0);7,570(1,2);7,558(1,3);7,551(1,3);7,539(1,1);4,140(1,3);4,087(0,4);4,042(16,0);3,908(1,0);3,890(3,5);3,871(3,5);3,852(1,2);3,315(285,7);2,670(2,0);2,505(255,8);2,501(349,9);2,497(265,6);2,328(2,1);2,073(1,1);1,276(3,7);1,257(8,2);1,239(3,8);-0,001(4,4)	
实施例 I-27: logP (中性): 2.54 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,696(6,7);9,368(4,9);9,347(3,1);9,342(3,1);8,821(3,3);8,799(3,7);8,749(2,1);8,746(2,0);8,737(2,1);8,734(2,0);8,510(1,2);8,506(1,8);8,491(1,3);8,486(1,8);8,460(3,7);8,438(3,4);8,350(5,2);7,635(1,5);7,622(1,5);7,615(1,5);7,603(1,4);4,035(16,0);3,904(1,1);3,885(3,5);3,867(3,6);3,849(1,1);3,319(112,4);2,671(0,9);2,506(119,0);2,502(149,9);2,498(112,5);2,328(0,9);2,073(1,4);1,273(3,9);1,254(8,4);1,236(3,7);0,146(0,6);0,007(7,0);0,000(116,0);-0,150(0,6)	
实施例 I-28: logP (中性): 3.38 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 10,198(0,4);9,323(3,8);9,058(2,7);9,052(2,7);8,565(5,5);8,538(3,3);8,517(4,4);8,363(3,9);8,341(3,3);8,314(4,3);8,312(4,1);7,953(0,4);7,882(0,7);7,878(0,8);7,862(1,5);7,860(1,4);7,842(0,8);7,839(0,8);7,552(0,4);7,536(1,3);7,531(1,9);7,527(1,0);7,513(2,5);7,511(2,4);7,505(1,5);7,500(1,2);7,496(1,0);7,428(1,0);7,421(0,9);7,414(0,5);7,407(1,2);7,402(1,1);7,393(0,5);7,390(0,5);7,386(0,6);5,755(3,2);3,956(16,0);3,818(0,9);3,800(3,2);3,781(3,3);3,763(1,0);3,319(43,5);2,891(3,2);2,732(2,5);2,676(0,3);2,672(0,4);2,525(1,1);2,520(1,8);2,512(22,2);2,507(45,3);2,502(61,5);2,498(44,1);2,493(20,1);2,329(0,4);1,246(3,4);1,227(8,0);1,209(3,3);0,008(1,4);0,000(38,1);-0,009(1,1)	20
实施例 I-29: logP (中性): 3.50 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,340(9,3);8,886(0,8);8,789(11,6);8,558(2,9);8,536(3,6);8,519(5,8);8,477(0,4);8,471(0,4);8,316(5,2);8,290(2,9);8,050(12,8);8,002(2,2);7,990(2,4);7,985(1,6);7,980(2,5);7,968(2,4);7,914(0,9);7,897(0,6);7,888(5,3);7,876(5,6);7,870(3,5);7,865(6,0);7,853(5,7);7,767(0,5);7,755(0,5);7,749(0,4);7,744(0,5);7,734(0,6);7,645(1,1);7,627(2,1);7,615(1,5);7,598(1,6);7,574(1,1);7,566(1,3);7,557(1,0);7,550(1,2);7,537(0,4);7,530(0,4);7,422(2,3);7,416(1,3);7,406(6,3);7,401(5,8);7,384(10,1);7,362(4,9);7,339(1,1);7,322(0,4);7,301(0,4);7,279(0,7);7,257(0,4);6,540(0,4);5,754(3,1);3,985(0,5);3,965(16,0);3,813(1,0);3,794(3,4);3,775(3,4);3,757(1,0);3,568(1,3);3,318(38,0);2,696(0,4);2,671(1,0);2,524(2,8);2,506(126,9);2,502(171,7);2,498(130,6);2,333(0,8);2,329(1,0);1,247(3,8);1,229(8,5);1,210(3,7);0,008(1,6);-0,001(41,9)	
实施例 I-30: logP (中性): 2.73 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,334(4,5);9,266(2,8);9,260(2,9);8,809(3,3);8,802(3,4);8,645(2,0);8,624(7,0);8,616(2,4);8,613(2,3);8,599(4,9);8,578(2,0);8,410(1,1);8,407(1,4);8,404(1,3);8,389(1,2);8,386(1,4);8,383(1,4);8,328(4,8);8,314(0,4);7,650(1,5);7,639(1,5);7,630(1,5);7,618(1,4);7,312(3,5);7,305(3,7);5,754(6,7);3,967(16,0);3,846(1,0);3,827(3,5);3,809(3,5);3,790(1,1);3,318(66,1);2,671(0,9);2,667(0,7);2,506(109,6);2,502(146,9);2,498(115,5);2,329(0,9);1,253(3,7);1,234(8,3);1,216(3,6);0,000(33,2)	30
实施例 I-31: logP (中性): 3.81 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 10,196(0,7);9,356(4,0);9,301(0,5);9,273(0,4);9,267(0,4);8,813(0,4);8,807(0,4);8,770(3,6);8,749(4,2);8,533(3,9);8,512(3,4);8,408(0,4);8,389(0,4);8,344(4,2);8,314(0,9);8,280(0,5);8,198(0,3);8,048(6,6);8,020(2,0);8,011(2,5);8,002(2,5);7,996(2,3);7,988(0,3);7,643(0,4);7,627(0,5);7,609(0,3);7,598(0,3);7,572(1,1);7,564(3,4);7,561(3,3);7,553(4,9);7,547(5,3);7,538(0,6);7,339(0,4);7,333(0,4);5,754(2,6);4,542(1,7);3,990(16,0);3,937(0,4);3,877(1,1);3,872(1,2);3,858(3,3);3,839(3,4);3,821(1,0);3,317(208,5);2,675(1,5);2,671(2,1);2,666(1,5);2,524(5,3);2,519(8,2);2,510(112,3);2,506(235,3);2,501(328,1);2,497(243,9);2,492(116,8);2,337(0,7);2,333(1,4);2,328(2,0);2,324(1,5);1,261(3,7);1,242(8,5);1,224(3,7);0,146(0,7);0,008(5,8);0,000(178,0);-0,009(6,4);-0,150(0,7)	
实施例 I-32: logP (中性): 3.52 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,102(9,2);8,936(2,3);8,932(2,4);8,795(2,5);8,773(4,7);8,726(7,0);8,722(2,8);8,703(2,7);7,683(0,7);7,679(0,7);7,664(1,4);7,660(1,5);7,645(0,8);7,640(0,8);7,589(0,4);7,583(0,6);7,580(0,7);7,566(0,7);7,563(0,9);7,558(0,6);7,549(0,6);7,545(0,5);7,521(1,0);7,518(1,1);7,500(0,7);7,495(1,2);7,492(1,1);7,474(0,6);7,471(0,6);7,426(1,0);7,423(0,9);7,407(1,5);7,404(1,4);7,388(0,7);7,384(0,7);5,754(0,6);4,039(0,6);4,021(0,6);3,910(16,0);3,896(3,3);3,878(3,2);3,859(0,9);3,318(29,5);2,524(0,6);2,511(17,0);2,507(36,1);2,502(48,5);2,497(34,5);2,493(16,1);1,989(2,5);1,268(3,3);1,250(7,7);1,231(3,4);1,193(0,7);1,175(1,4);1,158(0,7);0,146(0,3);0,008(2,7);0,000(79,3);-0,009(2,7);-0,150(0,3)	40
实施例 I-33: logP (中性): 3.52 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 8,923(2,5);8,920(2,7);8,868(7,6);8,718(5,7);8,713(2,9);8,695(3,9);8,506(3,8);8,483(3,3);7,805(0,4);7,798(4,0);7,793(1,4);7,781(1,6);7,776(5,8);7,768(0,7);7,679(0,7);7,671(5,7);7,666(1,7);7,654(1,4);7,649(4,1);7,642(0,4);5,755(9,6);3,896(16,0);3,882(3,3);3,863(3,3);3,845(1,0);3,320(3,5,8);2,676(0,4);2,671(0,5);2,667(0,4);2,525(1,3);2,511(27,8);2,507(57,7);2,502(80,1);2,498(59,9);2,494(29,1);2,333(0,3);2,329(0,5);2,324(0,3);1,398(0,5);1,266(3,5);1,248(7,8);1,230(3,6);0,008(2,5);0,000(67,3);-0,008(2,4)	
实施例 I-34: logP (中性): 3.62 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ =	

9,072(8,5);8,768(2,6);8,746(4,7);8,694(4,6);8,672(2,8);8,158(2,6);8,002(1,7);7,981(2,1);7,762(1,4);7,758(1,5);7,740(1,2);7,737(1,2);7,683(0,7);7,679(0,8);7,663(1,4);7,659(1,6);7,644(0,8);7,640(0,9);7,587(0,4);7,582(0,6);7,578(0,7);7,575(0,6);7,561(0,9);7,556(0,6);7,548(0,6);7,543(0,5);7,520(1,0);7,516(1,1);7,499(0,7);7,494(1,2);7,490(1,2);7,473(0,6);7,469(0,6);7,425(1,0);7,422(0,9);7,405(1,5);7,387(0,7);7,383(0,7);5,753(9,3);3,940(0,9);3,921(3,2);3,902(4,4);3,897(16,0);3,885(1,2);3,322(38,9);2,524(0,6);2,511(15,6);2,507(33,1);2,502(44,5);2,497(32,0);2,493(15,3);1,988(0,6);1,398(0,4);1,259(3,5);1,241(7,8);1,222(3,3);1,175(0,3);0,008(2,3);0,000(68,7);-0,009(2,6)

実施例 I-35: logP (中性): 3.16 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ 9,653(6,9);9,175(13,7);9,022(10,3);8,720(5,8);8,699(7,3);8,481(7,0);8,459(6,1);8,411(6,8);7,697(1,4);7,694(1,6);7,678(3,0);7,674(3,3);7,659(1,7);7,655(1,8);7,602(0,6);7,598(0,6);7,589(0,7);7,581(1,5);7,563(2,0);7,559(1,4);7,550(1,2);7,546(1,2);7,519(2,3);7,496(2,6);7,474(1,3);7,426(2,1);7,408(3,4);7,386(1,5);4,221(2,0);4,203(6,6);4,184(6,7);4,166(2,0);3,319(59,0);2,675(1,4);2,671(1,9);2,667(1,5);2,541(1,3);2,524(4,7);2,506(246,0);2,502(324,7);2,498(236,9);2,333(1,4);2,329(1,9);1,301(7,3);1,282(16,0);1,263(7,2);1,234(0,4);0,146(1,0);0,008(7,9);0,000(220,7);-0,007(9,4);-0,149(1,1)

10

【 0 3 4 7 】

log P 値は、「 E E C D i r e c t i v e 7 9 / 8 3 1 A n n e x V . A 8 」に従い、逆相カラム (C 1 8) での H P L C (高性能液体クロマトグラフィー) によって測定する。温度 : 5 5 。

【 0 3 4 8 】

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

20

【 0 3 4 9 】

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

【 0 3 5 0 】

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

30

【 0 3 5 1 】

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

【 0 3 5 2 】

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

【 0 3 5 3 】

N M R ピークリスト法

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

40

【 0 3 5 4 】

従って、 1 つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる :

δ_1 (強度 δ_1) ; δ_2 (強度 δ_2) ; . . . ; δ_i (強度 δ_i) ; . . . ; δ_n (強度 δ_n) 。

【 0 3 5 5 】

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

50

強いシグナルとの比較で示され得る。

【0356】

¹H NMRスペクトルの化学シフトの較正は、テトラメチルシランを使用して実施するか、及び/又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用して実施する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0357】

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

【0358】

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

【0359】

溶媒及び/又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、¹H NMRピークの本発明者らによるリストは、標準的な溶媒のピーク、例えば、DMSO-D₆中のDMSOのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

【0360】

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

【0361】

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

【0362】

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

【0363】

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

【0364】

応用実施例

ネコノミ（Ctenocephalides felis）- ネコノミ成体を用いたインビトロ接触試験

試験管にコーティングするために、9mgの活性化合物を、最初に、1mLのアセトンp.a.に溶解させ、次いで、アセトンp.a.を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び振動させる（揺動回転30rpmで2時間）ことによって250µLの該溶液を25mL容試験管の内壁及び底面に均一に分配させる。900ppmの活性化合物溶液及び44.7cm²の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5µg/cm²の面積基準薬量が達成される。

【0365】

溶媒を蒸発させた後、該試験管に5~10匹の成体ネコノミ（Ctenocephalides felis）を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室

10

20

30

40

50

温及び周囲湿度で、水平位でインキュベートする。48時間経過した後、効力を求める。この目的のために、該試験管を垂直に立て、トントンと叩いてネコノミを試験管の底に落とす。試験管の底で動かないままにいるか又は動きがギクシャクとしているネコノミは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

【0366】

この試験において、ある物質が、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で少なくとも80%の効力を達成すれば、その物質は、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのネコノミが死んだか又は死にかけていることを意味する。0%の効力は、損傷を受けたネコノミが無かったことを意味する。

【0367】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ (= 500 g / ha) の施用量で、100%の効力を示す： I - 1、I - 15、I - 18、I - 24。

【0368】

オウシマダニ (*Boophilus microplus*) - 注入試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化合物の適切な調製物を製造するために、10 mgの活性化合物を0.5 mL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。

【0369】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ (*Boophilus microplus*) の腹部に1 μL の該活性化合物溶液を注入する。その動物をシャーレの中に移し、人工気象室 (climate - controlled room) の中で維持する。

【0370】

その効力は、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白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室 (climate - controlled cabinet) の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシ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。

【0371】

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、95%の効力を示す： I - 3、I - 18。

【0372】

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 - 12。

【0373】

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 - 1、I - 15、I - 19、I - 32。

【0374】

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - 経口試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化合物の適切な調製物を製造するために、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る。クエン酸塩を添加したウシ血液で希釈して、所望の濃度とする。

【0375】

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

【0376】

2日間経過した後、殺虫率 (%) を求める。100%は、全てのネコノミが死んだこと

10

20

30

40

50

を意味し；0%は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0377】

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%効力を示す： I - 1、I - 3、I - 7、I - 12、I - 15、I - 16、I - 18、I - 19、I - 23、I - 28、I - 29、I - 32。

【0378】

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%効力を示す： I - 17。

【0379】

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%効力を示す： I - 6。 10

【0380】

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%効力を示す： I - 21。

【0381】

ヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) 試験

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

【0382】

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

【0383】

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

【0384】

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 - 1、I - 2、I - 3、I - 6、I - 7、I - 12、I - 15、I - 16、I - 17、I - 18、I - 19、I - 21、I - 23、I - 24、I - 28、I - 29、I - 30、I - 32。 30

【0385】

イエバエ (Musca domestica) 試験

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

【0386】

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

【0387】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのイエバエが死んだことを意味し；0%は、死んだイエバエが無かったことを意味する。 40

【0388】

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 - 32。

【0389】

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 - 2、I - 3。

【0390】

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%効力を示す。 50

5%の効力を示す： I - 18。

【0391】

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 - 1、I - 16、I - 19。

【0392】

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

溶媒： 125.0重量部のアセトン

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記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。

【0393】

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

【0394】

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

【0395】

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、100%の効力を示す： I - 15、I - 17、I - 33。

【0396】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、90%の効力を示す： I - 8、I - 30。

【0397】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 噴霧試験

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリアルポリグリコールエーテル

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

【0398】

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。

【0399】

5 - 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。

【0400】

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、100%の効力を示す： I - 8、I - 30。

【0401】

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 - 1、I - 3、I - 17、I - 18、I - 26、I - 29、I - 32、I - 33。

【0402】

マスタートビートル (Phaedon cochleariae) - 噴霧試験

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

10

20

30

40

50

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

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

【0403】

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

【0404】

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。

【0405】

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、100%の効力を示す： I - 1、I - 2、I - 3、I - 5、I - 6、I - 7、I - 8、I - 9、I - 10、I - 11、I - 12、I - 13、I - 15、I - 16、I - 17、I - 18、I - 19、I - 21、I - 22、I - 23、I - 24、I - 25、I - 26、I - 27、I - 28、I - 29、I - 30、I - 32、I - 33、I - 34、I - 35。

【0406】

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

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

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

【0407】

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 (*armyworm*) (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫を寄生させる。

【0408】

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。

【0409】

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、100%の効力を示す： I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 5、I - 7、I - 8、I - 9、I - 12、I - 15、I - 16、I - 18、I - 19、I - 21、I - 22、I - 23、I - 24、I - 26、I - 27、I - 28、I - 29、I - 30、I - 31、I - 32、I - 33、I - 34、I - 35。

【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、83%の効力を示す： I - 6。

【0411】

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

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

10

20

30

40

50

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

【0412】

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。

【0413】

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。

【0414】

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。

【0415】

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 - 17、I - 33。

【0416】

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、70%の効力を示す： I - 15。

10

20

フロントページの続き

- | | | |
|------------------------|--|--------------|
| (51)Int.Cl. | | F I |
| A 0 1 P 7/02 (2006.01) | | A 0 1 P 7/02 |
| A 0 1 P 7/04 (2006.01) | | A 0 1 P 7/04 |
| A 0 1 P 5/00 (2006.01) | | A 0 1 P 5/00 |
- (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 100196483
弁理士 川崎 洋祐
- (74)代理人 100203035
弁理士 五味淵 琢也
- (74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和
- (74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
- (74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
- (74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩
- (74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
- (74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文
- (72)発明者 ヴィルケ, ダーヴィト
ドイツ国、4 0 2 1 9 ・デュッセルドルフ、フリーデンシュトラッセ・3 9
- (72)発明者 フィッシャー, リュディガー
ドイツ国、5 0 2 5 9 ・ブルハイム、ツォー・デン・フーフフェレン・2 3
- (72)発明者 ヘイガー, ドミニク
ドイツ国、4 0 7 8 9 ・モンハイム、ロッテンシュトラッセ・1 0
- (72)発明者 カウシュ - ビジーズ, ニーナ
ドイツ国、5 1 4 6 7 ・ベルギッシュ・グラートバッハ、イルレンフェルダー・ヴェーク・3 8 ア
ー
- (72)発明者 ホフマイスター, ラウラ
ドイツ国、4 0 5 9 3 ・デュッセルドルフ、ウルデンバッハー・アレー・1 9
- (72)発明者 イルク, ケルシュテイン
ドイツ国、5 0 6 7 0 ・ケルン、ノイッサー・パール・3 2
- (72)発明者 ゲルゲンス, ウルリヒ
ドイツ国、4 0 8 8 2 ・ラティンゲン、フェステル・シュトラッセ・3 7
- (72)発明者 ボーツ, ダニエラ
ドイツ国、5 2 3 9 1 ・フェットヴァイス、オストシュトラッセ・1
- (72)発明者 タルベルク, アンドレアス
ドイツ国、4 2 7 8 1 ・ハーン、ジントーシュトラッセ・8 6

- (56)参考文献 特表2013-521237(JP,A)
国際公開第2015/121136(WO,A1)
特開2014-005263(JP,A)
国際公開第2015/000715(WO,A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D

A01N

CAplus/REGISTRY/MARPAT(STN)