

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号  
特許第7214657号  
(P7214657)

(45)発行日 令和5年1月30日(2023.1.30)

(24)登録日 令和5年1月20日(2023.1.20)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 487/04 (2006.01)	C 0 7 D 487/04	1 4 4
A 0 1 N 43/80 (2006.01)	C 0 7 D 487/04	C S P
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	A 0 1 N 43/80	1 0 2
A 0 1 N 47/02 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 4
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 N 47/02	

請求項の数 13 (全115頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2019-561245(P2019-561245)  
 (86)(22)出願日 平成30年5月2日(2018.5.2)  
 (65)公表番号 特表2020-519586(P2020-519586 A)  
 (43)公表日 令和2年7月2日(2020.7.2)  
 (86)国際出願番号 PCT/EP2018/061098  
 (87)国際公開番号 WO2018/206348  
 (87)国際公開日 平成30年11月15日(2018.11.15)  
 審査請求日 令和3年4月28日(2021.4.28)  
 (31)優先権主張番号 17169887.1  
 (32)優先日 平成29年5月8日(2017.5.8)  
 (33)優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 519295993  
 シンジェンタ パーティシペーションズ  
 アーゲー  
 スイス 4 0 5 8 バーゼル ローゼンタ  
 ールシュトラッセ 6 7  
 (74)代理人 100094569  
 弁理士 田中 伸一郎  
 (74)代理人 100103610  
 弁理士 吉 田 和彦  
 (74)代理人 100109070  
 弁理士 須田 洋之  
 (74)代理人 100119013  
 弁理士 山崎 一夫  
 (74)代理人 100123777  
 弁理士 市川 さつき

最終頁に続く

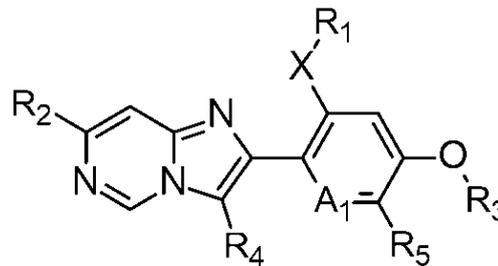
(54)【発明の名称】 硫黄含有フェニル及びピリジル置換基を有するイミダゾピリミジン誘導体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物

【化1】



(I)

(式中、

A<sub>1</sub>はCH又はNであり；

Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>は、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロア

ルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシであり；

$R_3$ は、 $C_1 \sim C_4$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

— $R_4$ は、水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；並びに

$R_5$ は、水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである)

又は、式(I)の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項2】

$R_1$ が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$ アルキルである、請求項1に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項3】

$R_2$ が、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、ハロメチルスルファニル、ハロメチルスルフィニル又はハロメチルスルホニルである、請求項1又は2に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項4】

Xが $SO_2$ である、請求項1、2、又は3のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項5】

$R_4$ 及び $R_5$ が共に水素である、請求項1、2、3、又は4のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項6】

$R_1$ がエチルであり、及び、 $R_2$ が、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル又はトリフルオロメチルスルファニルである、請求項1、2、3、4、又は5のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項7】

$R_3$ が、 $C_1 \sim C_4$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ アルキル又は $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$ アルキルである、請求項1、2、3、4、5、又は6のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項8】

$R_3$ が、 $-CH(CH_3)CN$ 、 $-C(CH_3)_2CN$ 、メチルスルファニルメチル、メチルスルファニルエチル、メチルスルフィニルメチル、メチルスルフィニルエチル、メチルスルホニルメチル又はメチルスルホニルエチルである、請求項1、2、3、4、5、6、又は7のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項9】

Xが $SO_2$ であり；

$R_1$ がエチルであり；

$R_2$ が、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル又はトリフルオロメチルスルファニルであり；並びに

$R_4$ 及び $R_5$ が共に水素である、

請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項10】

$A_1$ がNである、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に

10

20

30

40

50

許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体。

【請求項 1 1】

殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、又は、殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 1.0 のいずれか一項に記載されている式 (I) の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体を含み、及び、助剤又は希釈剤を含んでもよい組成物。

【請求項 1 2】

昆虫、ダニ、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地、又は、有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、又は、殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 1.0 のいずれか一項に記載されている式 (I) の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、若しくは互変異性体、又は、請求項 1.1 に記載されている組成物を適用することを含み、手術又は治療による人体の処置方法及び人体において実施される診断方法を除く、方法。

10

【請求項 1 3】

昆虫、ダニ、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられている場所を、請求項 1.1 に記載の組成物で処理することを含む方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、硫黄置換基を含有する有害生物の防除に活性であり、特に殺虫的に活性である複素環誘導体、これらを調製するためのプロセス、これらの化合物を含む組成物、及び、節足動物及び特に昆虫、又は、ダニ目の代表的なものを含む動物有害生物を防除するためのこれらの使用に関する。

20

【背景技術】

【0002】

有害生物防除作用を有する複素環式化合物が公知であり、例えば、国際公開第 2015/000715 号に記載されている。硫黄含有フェニル及びピリジル置換基を有する、新規の有害生物防除に活性なイミダゾピリミジンがここに見出された。

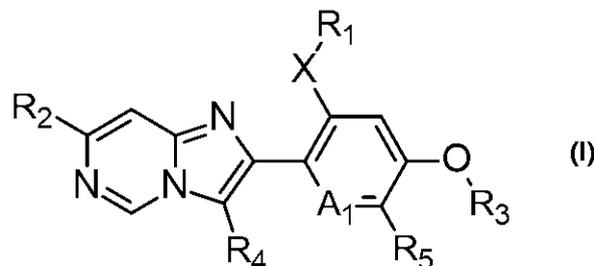
【発明の概要】

30

【0003】

本発明は従って、式 I の化合物

【化 1】



40

(式中、

A<sub>1</sub>はCH又はNであり；

Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>は、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニ

50

ル又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシであり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ハロシクロアルキルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシイミノC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>シアノアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルアミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)アミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>シアノハロアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニイミドイル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルであり；

又は、R<sub>3</sub>は、部分飽和又は完全飽和であることが可能である4～6員複素環系であり、前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1～2個のヘテロ原子を含有し、並びに、前記環系は、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル及びオキソからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されていることが可能であり；ここで、硫黄は、0、1若しくは2の酸化状態で存在していることが可能であり；

R<sub>4</sub>は、水素、ハロゲン又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sub>5</sub>は、水素、ハロゲン又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである)

並びに、式Iの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN - オキシドに関する。

#### 【0004】

例えば、少なくとも1つの塩基中心を有する式Iの化合物は、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、含リン酸若しくはハロゲン化水素酸といった鉱酸などの強無機酸と共に、例えば酢酸といった無置換であるか若しくは例えばハロゲンにより置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルカンカルボン酸など、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸若しくはフタル酸といった飽和若しくは不飽和ジカルボン酸など、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸若しくはクエン酸といったヒドロキシカルボン酸など、又は、安息香酸などの強有機カルボン酸と共に、又は、例えばメタン - 若しくはp - トルエンスルホン酸といった無置換であるか若しくは例えばハロゲンにより置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルカン - 若しくはアリールスルホン酸などの有機スルホン酸と共に例えば酸付加塩を形成することが可能である。例えば、少なくとも1つの酸性基を有する式Iの化合物は、例えばナトリウム、カリウム若しくはマグネシウム塩といったアルカリ金属塩若しくはアルカリ土類金属塩などの例えば無機塩といった塩を塩基と共に形成することが可能であり、又は、例えばエチル - 、ジエチル - 、トリエチル - 若しくはジメチルプロピルアミンといったモルホリン、ペリジン、ピロリジン、モノ - 、ジ - 若しくはトリ - 低級アルキルアミンなど、若しくは、例えばモノ - 、ジ - 若しくはトリエタノールアミンといったモノ - 、ジ - 若しくはトリヒドロキシ - 低級アルキルアミンなどのアンモニア若しくは有機アミンと共に塩を形成することが可能である。

#### 【0005】

置換基の定義中に出現するアルキル基は直鎖又は分岐であることが可能であり、例えば、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、sec - ブチル、イソ - ブチル、t - ブチル、及び、その分岐異性体である。

#### 【0006】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。これはまた、ハロアルキルなどの他の意味と組み合わされているハロゲンについても、それぞれ適用される。

#### 【0007】

10

20

30

40

50

ハロアルキル基は、1～6個の炭素原子の鎖長を有することが好ましい。ハロアルキルは、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2 - フルオロエチル、2 - クロロエチル、ペンタフルオロエチル、1, 1 - ジフルオロ - 2, 2, 2 - トリクロロエチル、2, 2, 3, 3 - テトラフルオロエチル又は2, 2, 2 - トリクロロエチルである。

【0008】

ハロアルキルスルファニル基は、好ましくは、1～4個の炭素原子の鎖長を有する。ハロアルキルスルファニルは、例えば、ジフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル又は2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルファニルである。同様の考察がラジカル $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルに適用され、これらは、例えば、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル又は2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルホニルであり得る。

10

【0009】

アルコキシは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、i - プロポキシ、n - ブトキシ、イソブトキシ、sec - ブトキシ又はt - ブトキシである。

【0010】

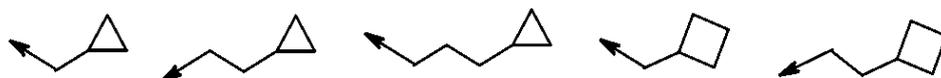
ハロアルコキシ基は、好ましくは、1～6個の炭素原子の鎖長を有する。ハロアルコキシは、例えば、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2, 2, 2 - トリフルオロエトキシである。

20

【0011】

$C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキルは好ましくは、特に、式Iの化合物の酸素原子に結合した1～4個の炭素原子の鎖長を有すると共に、アルキル鎖に結合した $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを有する化合物である。 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキルの典型的な例は：

【化2】



30

(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)である。

【0012】

$C_3 \sim C_6$ アルケニル基は、例えば、アリル、ブタ - 2 - エニル、ブタ - 3 - エニル、2 - メチルアリル又は3 - メチルブタ - 2 - エニルである。

【0013】

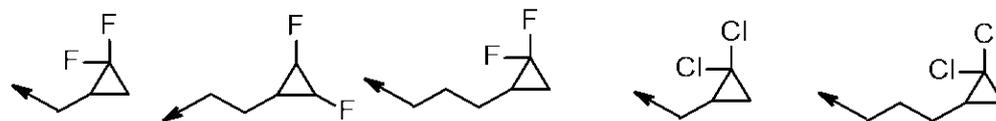
$C_3 \sim C_6$ アルキニル基は、例えば、プロパルギル、ブタ - 2 - イニル、ブタ - 3 - イニル又は1, 1 - ジメチルプロブ - 2 - イニルである。

【0014】

$C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキルは好ましくは、特に、式Iの化合物の酸素原子に結合した1～4個の炭素原子の鎖長を有すると共に、アルキル鎖に結合した $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキルを有する化合物である。 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキルの典型的な例は：

40

【化3】



である。

50

## 【0015】

$C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル基は好ましくは、1～8個の炭素原子の鎖長を有する。

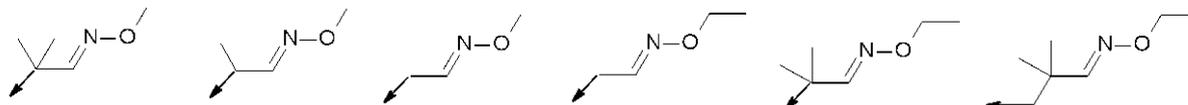
## 【0016】

$C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキルは、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、*n*-プロポキシメチル、*n*-プロポキシエチル、イソプロポキシメチル又はイソプロポキシエチルである。

## 【0017】

$C_1 \sim C_4$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_4$ アルキルは好ましくは、1～8個の炭素原子を含有する。 $C_1 \sim C_4$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_4$ アルキルは、例えば：

## 【化4】



(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)である。

## 【0018】

$C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基は、1～8個の炭素原子を含有する。 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基の例は、メチルスルファニル、2-メチルスルファニル、1-メチルスルファニル、1,1-ジメチル-2-メチルスルファニル、2-メチル-2-メチルスルファニル又は1-メチル-1-メチルスルファニルである。

## 【0019】

$C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基は1～8個の炭素原子を含有する。 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基の例は、メチルスルフィニル、2-メチルスルフィニル、1-メチルスルフィニル、1,1-ジメチル-2-メチルスルフィニル、2-メチル-2-メチルスルフィニル又は1-メチル-1-メチルスルフィニルである。

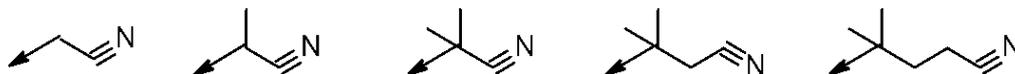
## 【0020】

$C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基は好ましくは1～8個の炭素原子を含有する。 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基の例は、メチルスルホニル、2-メチルスルホニル、1-メチルスルホニル、1,1-ジメチル-2-メチルスルホニル、2-メチル-2-メチルスルホニル又は1-メチル-1-メチルスルホニルである。

## 【0021】

$C_1 \sim C_6$ シアノアルキル基は好ましくは1～7個の炭素を含有し、シアノ基を含み、例えば

## 【化5】



(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)である。

## 【0022】

$C_1 \sim C_6$ シアノハロアルキル基は上記に定義されているとおりであるが、好ましくは1～9個のハロゲン原子によって置換されていることが可能である。

## 【0023】

アミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基は、アミノカルボニル基が結合している1～4個

10

20

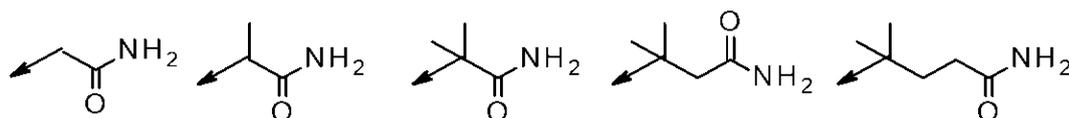
30

40

50

の炭素原子を含有する。アミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキルの例は：

【化6】



(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)

である。

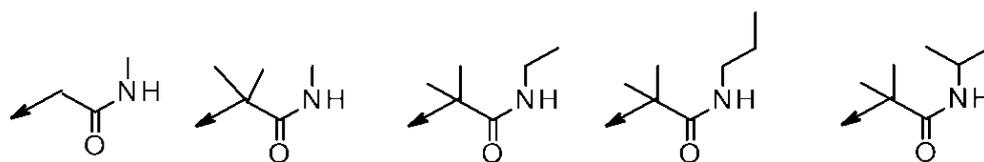
【0024】

アミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基は上記のとおりであるが、炭素鎖において1～9個のハロゲン原子によって置換されていることが可能である。

【0025】

$C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル基が結合している1～4個の炭素原子を含有する。 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキルの例は；

【化7】



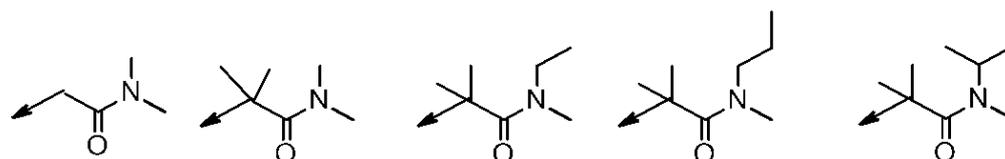
(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)

である。

【0026】

ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキルは、ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノカルボニル基が結合している1～4個の炭素原子を含有する。ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキルの例は；

【化8】



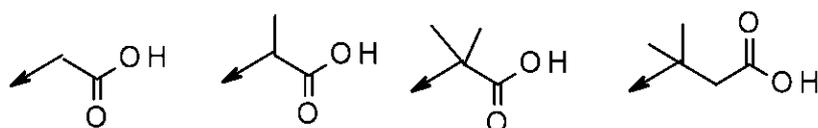
(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)

である。

【0027】

ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基は、ヒドロキシカルボニル基が結合している1～4個の炭素原子を含有する。ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基の例は：

【化9】



(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)

である。

【0028】

10

20

30

40

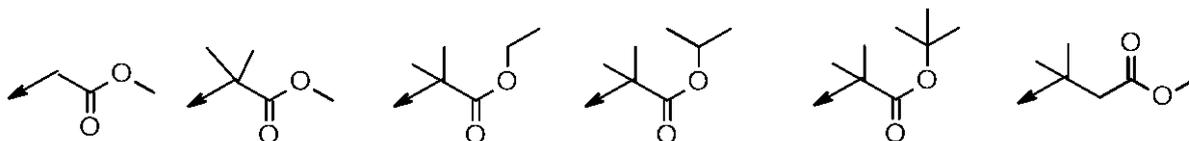
50

ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基は上記のとおりであるが、炭素鎖において1～9個のハロゲン原子によって置換されていることが可能である。

【0029】

$C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキル基は典型的には、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基が結合している $C_1 \sim C_4$ アルキル基である。 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ アルキルの例は：

【化10】



10

(式中、矢印は式Iにおける酸素原子に対する結合点を表す)である。

【0030】

ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基は上記のとおりであるが、炭素鎖において1～9個のハロゲン原子によって置換されていることが可能である。

【0031】

$C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基は、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル又はイソプロピルスルホニルである。

20

【0032】

$C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルは、例えば、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、フルオロメチルスルホニル又はペンタフルオロエチルスルホニルである。

【0033】

シクロアルキル基は、好ましくは、3～6個の環炭素原子を有し、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルである。

【0034】

本発明によれば、部分飽和又は完全飽和であることが可能である4～6員複素環系(前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1～2個のヘテロ原子を含有する)は、環員の数に応じて、例えば、以下の複素環系：

30

オキセタン-3-イル、オキセタン-2-イル、チエタン-3-イル、チエタン-2-イル、1-オキソチエタン-3-イル、1,1-ジオキソチエタン-3-イル、アゼチジン-3-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロチオフェン-3-イル、テトラヒドロチオフェン-2-イル、1-オキソチオラン-3-イル、1-オキソチオラン-2-イル、1,1-ジオキソチオラン-3-イル、1,1-ジオキソチオラン-2-イル、4,5-ジヒドロ-イソオキサゾリル、ピロリジニル、[1,3]ジオキサニル、ピペリジニル、ピペラジニル、[1,4]ジオキサニル、イミダゾリジニル、[1,3,5]オキサジアジナニル、ヘキサヒドロ-ピリミジニル、[1,3,5]トリアジナニル及びモルホリニルからなる群から選択される。

40

【0035】

本発明の文脈において、置換基の定義中における「単置換～多置換とされ」とは、典型的には、置換基の化学構造に応じて、1～4置換、好ましくは、1～3置換、より好ましくは、一又は二置換であることを意味する。

【0036】

フリーラジカルはメチル基を表す。

【0037】

式Iの本発明に係る化合物はまた、塩形成の最中に形成され得る水和物を含む。

【0038】

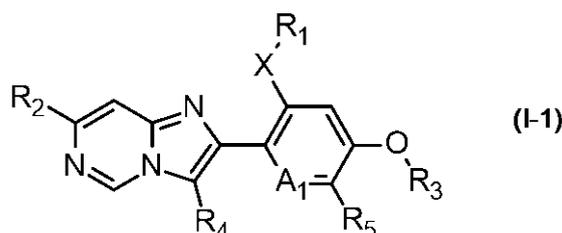
本発明に係る式Iの化合物はまた、塩形成の最中に形成され得る水和物を含む。

50

## 【 0 0 3 9 】

式 I の化合物の好ましい群は、式 I - 1 の化合物

## 【 化 1 1 】



10

によって表され、

A<sub>1</sub>はCH又はNであり；

Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>は、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシであり；

20

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ハロシクロアルキルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシイミノC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>シアノアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルアミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)アミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>シアノハロアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニイミドイル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルであり；

30

又は、R<sub>3</sub>は、部分飽和又は完全飽和であることが可能である4～6員複素環系であり、前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1～2個のヘテロ原子を含有し、並びに、前記環系は、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル及びオキソからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されていることが可能であり、ここで、硫黄は、0、1若しくは2の酸化状態で存在していることが可能であり；並びに

R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は独立して、水素、ハロゲン又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである。

40

## 【 0 0 4 0 】

式 I - 1 の化合物の前記好ましい群において、

R<sub>1</sub>は好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル又はシクロプロピルメチルであり；

R<sub>2</sub>は好ましくは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルであり；及び、Xは好ましくはSO<sub>2</sub>であり；並びに

R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は好ましくは水素である。

## 【 0 0 4 1 】

特に好ましい式 I - 1 の化合物は、R<sub>1</sub>がエチルであり、及び、XがSO<sub>2</sub>であるもので

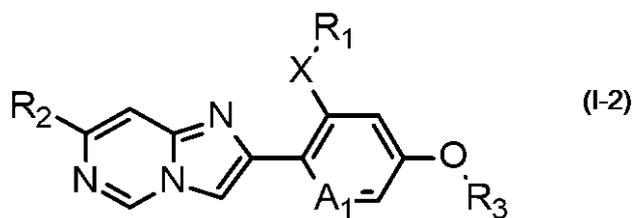
50

ある。

【 0 0 4 2 】

式 I の化合物のさらに好ましい群は、式 I - 2 の化合物

【 化 1 2 】



10

(式中、 $A_1$ 、 $X$ 、 $R_1$ 及び $R_2$ は上記の式 I において定義されており、及び、 $R_3$ は I - 1 において定義されている) によって表される。式 I - 2 の化合物の前記好ましい群において、

$R_1$ は好ましくは、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $i$ -プロピル又はシクロプロピルメチルであり；

$R_2$ は好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり；及び、 $X$ は好ましくは $SO_2$ である。

20

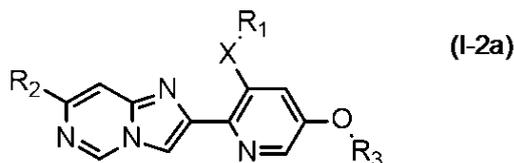
【 0 0 4 3 】

特に好ましい式 I - 2 の化合物は、 $R_1$ がエチルであり、及び、 $X$ が $SO_2$ であるものである。

【 0 0 4 4 】

式 I - 2 の化合物のさらに好ましい群は、式 I - 2 a の化合物

【 化 1 3 】



30

(式中、 $X$ 、 $R_1$ 及び $R_2$ は上記の式 I において定義されており、及び、 $R_3$ は I - 1 において定義されている)

によって表される。

【 0 0 4 5 】

式 I - 2 a の化合物の前記好ましい群において、

$R_1$ は好ましくは、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $i$ -プロピル又はシクロプロピルメチルであり；

$R_2$ は好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり；及び、 $X$ は好ましくは $SO_2$ である。

40

【 0 0 4 6 】

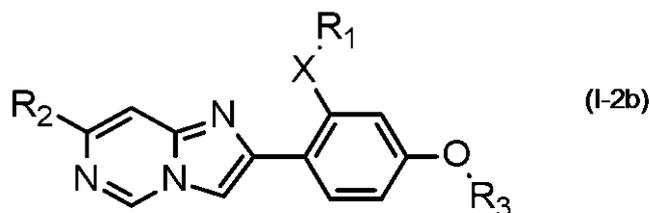
特に好ましい式 I - 2 a の化合物は、 $R_1$ がエチルであり、及び、 $X$ が $SO_2$ であるものである。

【 0 0 4 7 】

式 I - 2 の化合物の他のさらに好ましい群は、式 I - 2 b の化合物

50

## 【化 1 4】



(式中、X、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は上記の式 I において定義されており、及び、R<sub>3</sub>は I - 1 において定義されている)

によって表される。

## 【0048】

式 I - 2 b の化合物の前記好ましい群において、

R<sub>1</sub>は好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル又はシクロプロピルメチルであり；

R<sub>2</sub>は好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルであり；及び、Xは好ましくはSO<sub>2</sub>である。

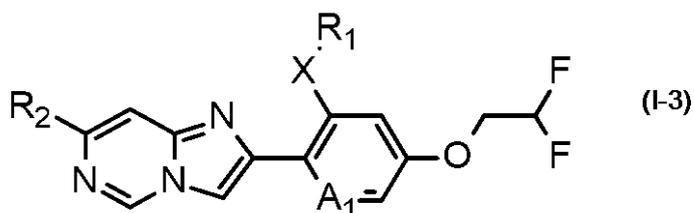
## 【0049】

特に好ましい式 I - 2 b の化合物は、R<sub>1</sub>がエチルであり、及び、XがSO<sub>2</sub>であるものである。

## 【0050】

式 I の化合物のさらに好ましい群は、式 I - 3 の化合物

## 【化 1 5】



(式中、A<sub>1</sub>、X、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は、上記の式 I に定義されているとおりである)

によって表される。

## 【0051】

式 I - 3 の化合物の前記好ましい群において、

R<sub>1</sub>は好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル又はシクロプロピルメチルであり；

R<sub>2</sub>は好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルであり；及び、Xは好ましくはSO<sub>2</sub>である。

## 【0052】

特に好ましい式 I - 3 の化合物は、R<sub>1</sub>がエチルであり、及び、XがSO<sub>2</sub>であるものである。

## 【0053】

式 I の化合物のさらに好ましい群は、式 I - 4 の化合物

10

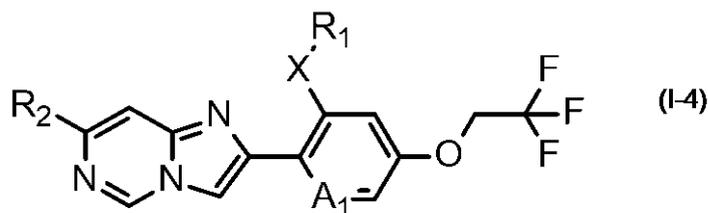
20

30

40

50

## 【化 1 6】



(式中、 $A_1$ 、 $X$ 、 $R_1$ 及び $R_2$ は、上記の式 I に定義されているとおりである) によって表される。

## 【0054】

式 I - 4 の化合物の前記好ましい群において、  
 $R_1$ は好ましくは、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $i$ -プロピル又はシクロプロピルメチルであり；

$R_2$ は好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり；及び、 $X$ は好ましくは $SO_2$ である。

## 【0055】

特に好ましい式 I - 4 の化合物は、 $R_1$ がエチルであり、及び、 $X$ が $SO_2$ であるものである。

## 【0056】

特に好ましい式 I の化合物において、

$R_1$ は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、好ましくはエチルであり；

$R_2$ は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり、好ましくはトリフルオロメチルであり；

$A_1$ は $CH$ 又は $N$ であり；

$X$ は $S$ 又は $SO_2$ であり；及び

$R_3$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルによって単置換されていることが可能であるオキセタニルであるか、又は、シアノによって置換されていることが可能である $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、又は、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$ アルキル、ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル -  $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ -  $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；好ましくは、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ジエチルミノカルボニル -  $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、メトキシ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル、メチルチオ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、プロパルギル若しくはシクロプロピル -  $C_1 \sim C_4$ アルキルによって単置換されていることが可能であるオキセタニルである。

## 【0057】

他の特定の好ましい式 I の化合物において、

$R_1$ は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、好ましくはエチルであり；

$R_2$ は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり、好ましくはトリフルオロメチルであり；

$A_1$ は $CH$ 又は $N$ であり；

$X$ は $S$ 又は $SO_2$ であり；及び

$R_3$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルによって単置換されていることが可能であるオキセタニルであるか、又は、シアノによって置換されていることが可能である $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、又は、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$ アルキル、ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノカルボニル $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル -  $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ

10

20

30

40

50

- C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル；好ましくは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、ジエチルミノカルボニル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキル、メトキシ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、メチルチオ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、プロパルギル若しくはシクロプロピル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルによって単置換されていることが可能であるオキセタンニルである。

【0058】

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、X及びA<sub>1</sub>の好ましい値は、いずれかのこれらの組み合わせで以下に記載されているとおりである。

【0059】

好ましくは、R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルである。

10

【0060】

より好ましくは、R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル又はシクロプロピルメチルである。

【0061】

さらにより好ましくは、R<sub>1</sub>は、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル又はシクロプロピルメチルである。

【0062】

もっとも好ましくは、R<sub>1</sub>はエチルである。

【0063】

好ましくは、R<sub>2</sub>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ハロアルキル、ハロメチルスルファニル、ハロメチルスルフィニル又はハロメチルスルホニルである。

20

【0064】

より好ましくは、R<sub>2</sub>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>フルオロアルキル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルである。

【0065】

さらにより好ましくは、R<sub>2</sub>は、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルである。

【0066】

もっとも好ましくは、R<sub>2</sub>は、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル又はトリフルオロメチルスルファニルである。

30

【0067】

好ましくは、R<sub>3</sub>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルである。

【0068】

より好ましくは、R<sub>3</sub>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルである。

【0069】

さらにより好ましくは、R<sub>3</sub>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>シアノアルキル、メチルスルファニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル、メチルスルフィニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキル又はメチルスルホニルC<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>アルキルである。

40

【0070】

もっとも好ましくは、R<sub>3</sub>は、-CH(CH<sub>3</sub>)CN、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CN、メチルスルファニルメチル、メチルスルファニルエチル、メチルスルフィニルメチル、メチルスルフィニルエチル、メチルスルホニルメチル又はメチルスルホニルエチルである。

【0071】

好ましくは、R<sub>4</sub>は水素である。

【0072】

好ましくは、R<sub>5</sub>は水素である。

50

## 【0073】

好ましくは、XはS又はSO<sub>2</sub>である。

## 【0074】

もっとも好ましくは、XはSO<sub>2</sub>である。

## 【0075】

好ましくは、A<sub>1</sub>はNである。

## 【0076】

本発明に係る実施形態が以下に記載されているとおり提供されている。

## 【0077】

実施形態1は、上記に定義されている、式Iの化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

10

## 【0078】

実施形態2は、R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである、実施形態1に係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

## 【0079】

実施形態3は、R<sub>2</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキル、ハロメチルスルファニル、ハロメチルスルフィニル又はハロメチルスルホニルである、実施形態1又は2に係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

20

## 【0080】

実施形態4は、R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである、実施形態1、2又は3のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

## 【0081】

実施形態5は、R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル又はシクロプロピルメチルである、実施形態1、2、3又は4のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

30

## 【0082】

実施形態6は、R<sub>2</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>フルオロアルキル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルである、実施形態1、2、3、4又は5のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

## 【0083】

実施形態7は、R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルである、実施形態1、2、3、4、5又は6のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

40

## 【0084】

実施形態8は、R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル又はシクロプロピルメチルである、実施形態1、2、3、4、5、6又は7のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

## 【0085】

実施形態9は、R<sub>2</sub>が、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルである、実施形態1、2、3、4、5、6、7又は8のいずれか一つに係る、化合物、又は

50

、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0086】

実施形態10は、 $R_3$ が、 $C_1 \sim C_3$ シアノアルキル、メチルスルファニル $C_1 \sim C_2$ アルキル、メチルスルフィニル $C_1 \sim C_2$ アルキル又はメチルスルホニル $C_1 \sim C_2$ アルキルである、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8又は9のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0087】

実施形態11は、 $X$ が $S$ 又は $SO_2$ である、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9又は10のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

10

【0088】

実施形態12は、 $R_1$ が、エチルである、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10又は11のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0089】

実施形態13は、 $R_2$ が、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル又はトリフルオロメチルスルファニルである、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11又は12のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

20

【0090】

実施形態14は、 $R_3$ が、 $-CH(CH_3)CN$ 、 $-C(CH_3)_2CN$ 、メチルスルファニルメチル、メチルスルファニルエチル、メチルスルフィニルメチル、メチルスルフィニルエチル、メチルスルホニルメチル又はメチルスルホニルエチルである、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12又は13のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0091】

実施形態15は、 $X$ が $SO_2$ である、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13又は14のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

30

【0092】

実施形態16は、 $R_4$ が水素である、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14又は15のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0093】

実施形態17は、 $R_5$ が水素である、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15又は16のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

40

【0094】

実施形態18は、 $A_1$ が $N$ である、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16又は17のいずれか一つに係る、化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0095】

実施形態19は、 $A_1$ が $CH$ である、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16又は17のいずれか一つに係る、化合物、又は

50

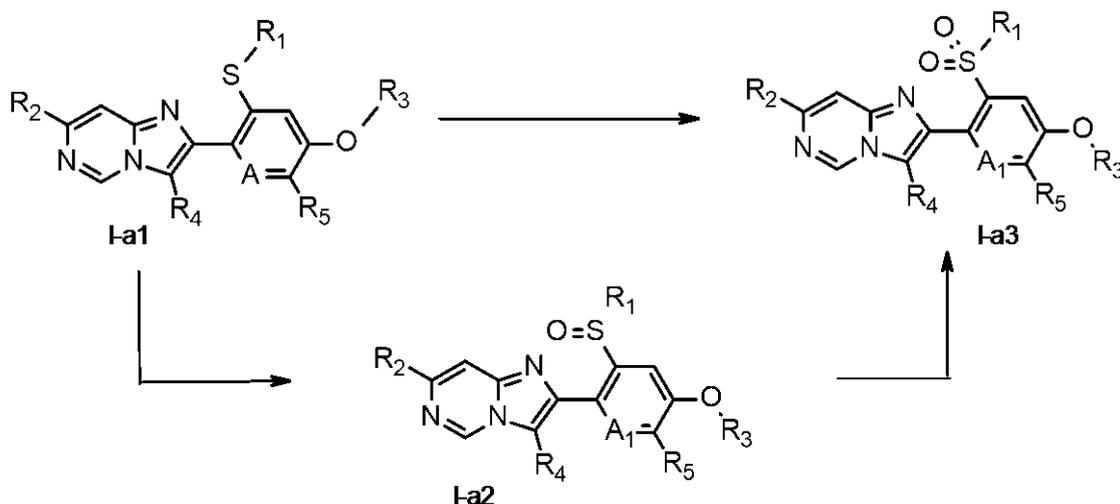
、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0096】

本発明に係る式Iの化合物の調製プロセスは、当業者に公知の方法によって実施される。式I - a3の化合物(式中、XはSO<sub>2</sub>であり、及び、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、上記の式Iにおいて定義されているとおりである)は、式I - a2の化合物(式中、XはSOであり、及び、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、上記の式Iにおいて定義されているとおりである)の酸化によって調製され得る。この反応は、例えばペルオキシ酢酸若しくはm - クロロ過安息香酸といった過酸、又は、例えば過酸化水素若しくはt - ブチルヒドロペルオキシドといったヒドロ過酸化物、又は、モノペルオキシ - 二硫酸塩若しくは過マンガン酸カリウムなどの無機酸化剤などの試薬を用いて行うことが可能である。同様の方法で、式I - a2の化合物(式中、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、上記の式Iにおいて定義されているとおりである)は、上記のものと同様の条件下における、式I - a1の化合物(式中、XはSであり、及び、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、上記の式Iにおいて定義されているとおりである)の酸化によって調製され得る。これらの反応は、これらの条件に適合する種々の有機又は水性溶剤中において、0 未満 - 溶剤系の沸点以下の温度により行うことが可能である。式I - a2及びI - a3の化合物への式I - a1の化合物の変換は、スキーム1によって表される。

スキーム1

【化17】



【0097】

式Iの化合物は、式IIの化合物(式中、X、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は、式Iにおいて定義されているとおりであり、並びに、X a<sub>1</sub>はハロゲンであり、好ましくはI、Br若しくはCl又はOtfである)から、種々の方法により調製されることが可能である(スキーム2)。例えば、式Iの化合物は、式IVの化合物(式中、X、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は、式Iにおいて定義されているとおりである)から、式Iの化合物を得るために、水素化ナトリウム、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>又はCs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>などの塩基の存在下に、THF、DMF又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中において、一般式Vのアルキル化試薬(式中、X a<sub>2</sub>は好ましくは、Br、I又はOtfであり、及び、R<sub>3</sub>は式Iにおいて定義されている)による処理により得ることが可能である。このようなアルキル化反応は当業者に周知である。

スキーム2

10

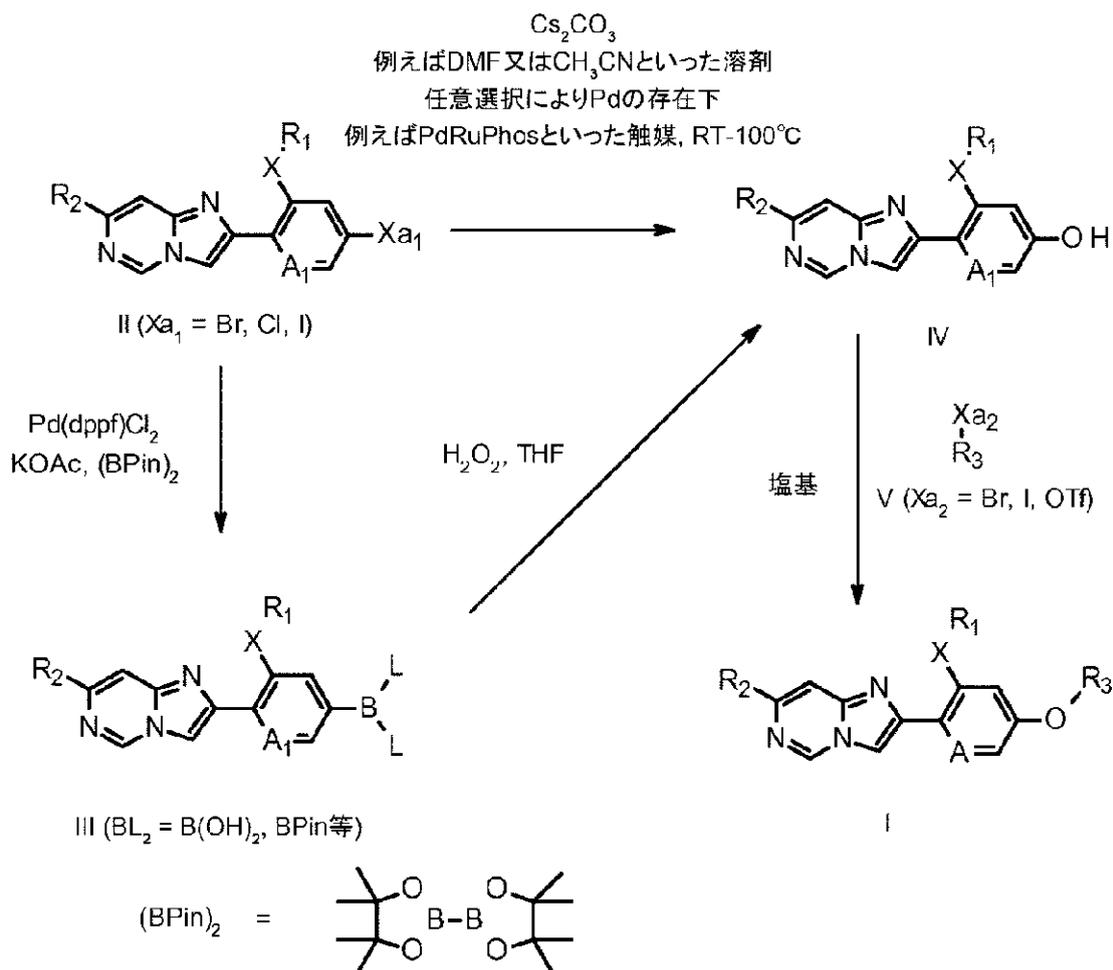
20

30

40

50

## 【化18】



10

20

## 【0098】

式IVの化合物は、式IIの化合物のMiyuraホウ素化により得ることが可能である。式IIIの中間体(式中、 $\text{A}_1$ 、 $\text{X}$ 、 $\text{R}_1$ 及び $\text{R}_2$ は、式Iにおいて定義されており、並びに、 $\text{BL}_2$ は、ボロン酸誘導体、好ましくは4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イルを指す)は、パラジウム触媒反応におけるビスピナコールジボラン( $\text{BPin})_2$ による式IIの化合物の処理によって得ることが可能である。この反応は、非プロトン性溶剤中において、塩基、好ましくは酢酸カリウム $\text{KOAc}$ などの弱塩基、及び、この種の反応に係る一般的な触媒として $\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$ の存在下に行うことが可能である。この反応の温度は、好ましくは、0 ~ 反応混合物の沸点とされる。得られる式IIIの中間体は、酸化試薬、好ましくは過酸化水素又はその尿素錯体を伴う処理によって式IVの化合物に転換可能である。式IIの化合物はまた、アセトニトリル又はDMFなどの非プロトン性溶剤中、カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意選択によりRockPhos-G3-パラダサイクル([ (2-ジ-t-ブチルホスフィノ-3-メトキシ-6-メチル-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)-2-(2-アミノビフェニル)]パラジウム(II)メタンсульホン酸)などのパラジウム触媒の存在下、25 ~ 100 の温度における(E)-ベンズアルデヒドオキシムとの反応により式IVの化合物に転換可能である。このようにして得られた式IVの化合物は、既述のとおりアルキル化により式Iの化合物に転換される。このような反応は文献中において公知であり、例えばAng. Chem. Int. Ed. 56, (16) 4478-4482, 2017において記載されている。

## 【0099】

30

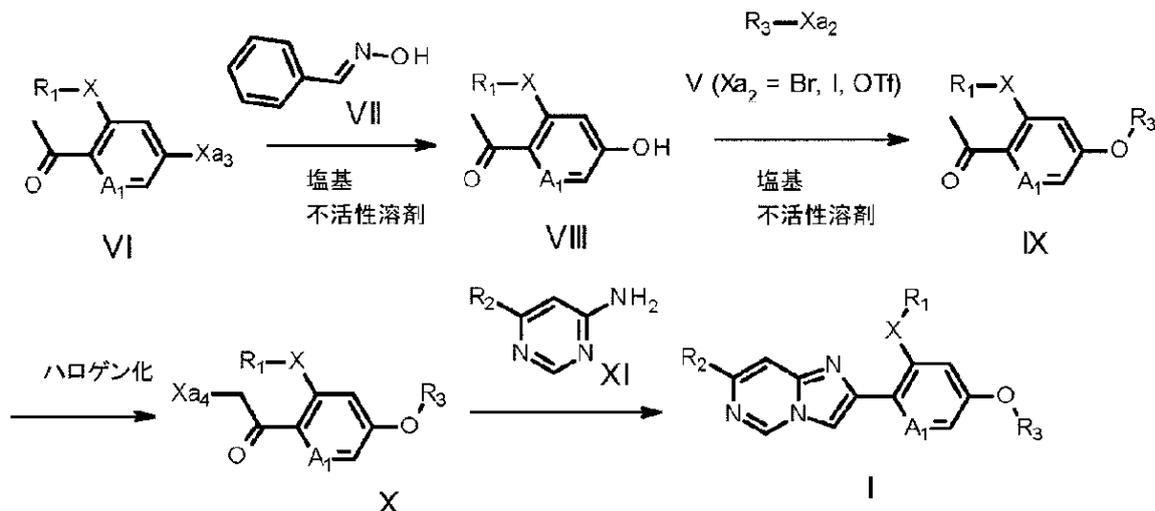
40

50

式 I の化合物のさらなる合成がスキーム 3 に示されている。

スキーム 3 :

【化 19】



10

【0100】

20

スキーム 3 に示されているとおり、式 VI の化合物は、炭酸セシウム又は炭酸カリウムなどの塩基の存在下、任意選択により、Rock Phos Pd G3 などのパラジウムプレ触媒の存在下、DMF 又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中、0 ~ 150 の温度におけるベンズアルデヒドオキシム (VII) を伴う処理により式 VIII の化合物に転換可能である。このような反応は、Angew. Chem. Int. Ed. 2017, 56, 4478 に記載されている。次いで、式 VIII の化合物は、水素化ナトリウム、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> 又は Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> などの塩基の存在下、THF、DMF 又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中における式 V の化合物を伴うアルキル化によって、化合物 IX に転換可能である。式 IX の化合物は、例えば、酢酸中の臭素及び臭化水素酸の混合物 (Phosphorus, Sulfur and Silicon and the Related Elements, 2013, 188 (12), 1835 - 1844 に記載されているとおり) による処理、又は、J. Med. Chem., 2013, 56 (1), 84 - 96 に記載されているとおり、例えばクロロホルム、酢酸エチル等といった不活性溶剤中における、例えば臭化銅 (II) による処理によって、式 X の化合物 (式中、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>、X、R<sub>3</sub> は、式 I において記載されているとおりであり、及び、Xa<sub>4</sub> はハロゲンである) に変換される。このような化合物を調製するためのさらなる手法は、THF 又はシクロペンチルメチルエーテルなどの不活性溶剤中、10 ~ 80 の温度でのフェニルトリメチルアンモニウムペルプロミドによる式 X の化合物の処理を含む。このような反応は、De Kimpel によって e-EROS Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis, 1 - 2, 2001 に記載されている。式 XI の化合物 (式中、R<sub>2</sub> は式 I において記載されているとおりである) は、式 X の化合物 (式中、Xb<sub>4</sub> はハロゲンであり、並びに、X、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub> 及び R<sub>3</sub> は上記に定義されているとおりである) と、例えばエタノール又はアセトニトリルといった不活性溶剤中、任意選択により、酸化マグネシウムなどの好適な塩基の存在下、80 ~ 150 の温度において反応して、式 I の化合物をもたらす。任意選択により、この反応は、任意選択によりマイクロ波中において実施され得る。このような反応は、例えば国際公開第 2016/107742 号、及び、国際公開第 2016/071214 号といった文献中において十分に記載されている。

30

40

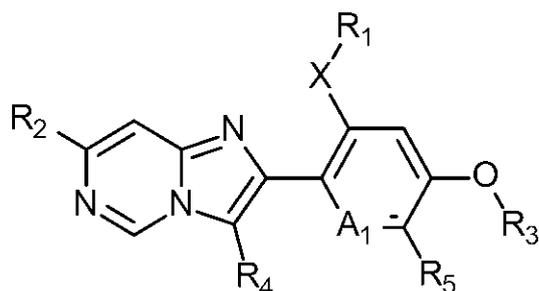
【0101】

N - クロロスクシニアミド、N - ブロモスクシニアミド又は N - ヨードスクシニアミド

50

などのハロゲン化剤による、アセトニトリル又はジメチルホルムアミドなどの極性非プロトン性溶剤中における、周囲温度での式 I の化合物（式中、 $R_4$  は水素である）のハロゲン化で、式 I b の化合物

【化 2 0】



10

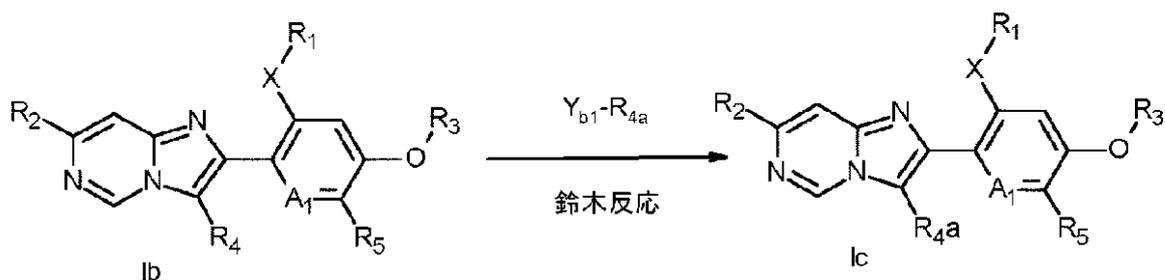
(Ib)

（式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $X$ 、 $R_3$ 、 $A_1$ 及び $R_5$ は、式（I）に記載されているとおりであり、及び、 $R_4$ はハロゲンである）が得られる。式 I b の化合物は、化合物  $R_{4a} - Y_{b1}$ （式中、 $Y_{b1}$ は、例えば  $B(OH)_2$  又は  $B(OR_{b4})_2$ （式中、 $R_{b4}$ は  $C_1 \sim C_4$ アルキル基であることが可能であり、又は、2つの  $OR_{b4}$ 基がホウ素原子と一緒になって5員環を形成していることが可能である）、例えばボロン酸ピナコールエステルといったホウ素由来官能基である）と、パラジウム触媒の存在下で反応して、式 I c の化合物（式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A_1$ 及び $X$ は、式 I に定義されているとおりであり、並びに、 $R_{4a}$ は  $C_1 \sim C_4$ アルキルである）をもたらすことが可能である。この反応は通常、例えば炭酸カリウム、炭酸セシウム又はリン酸カリウムといった塩基の存在下、ジオキサンなどの不活性溶剤中、任意選択により、水の存在下に、例えばテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウムといったパラジウム（0）触媒を伴って、 $80 \sim 120$  の温度で実施される。このような鈴木反応は文献中に先例として十分に記載されており、例えば、増田直之らによる国際公開第 2012133607号を参照のこと。化学をスキーム 4 に図示する。

20

スキーム 4

【化 2 1】



30

【0102】

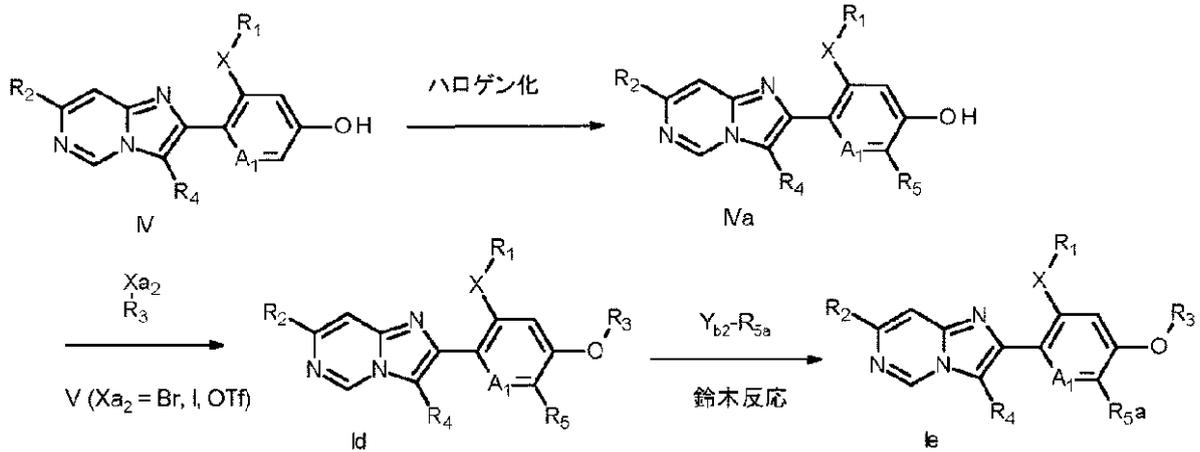
式 1 の化合物（式中、 $R_5$ は、ハロゲン又は  $C_1 \sim C_4$ アルキルである）のさらなる調製をスキーム 5 に図示する。

スキーム 5 .

40

50

## 【化 2 2】



10

## 【0103】

スキーム 5 に示されているとおり、塩基の存在下、アセトニトリルなどの不活性溶剤中における、例えばヨウ素を伴う式 I V の化合物（式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、 $A_1$  及び  $X$  は、式 I に定義されているとおりである）のハロゲン化は、式 I の化合物（式中、 $R_5$  はヨウ素である）をもたらす。式 I V a の化合物は、スキーム 2 において既に記載されているとおり、式 V の化合物によるアリル化によって式 I d の化合物に転換可能である。式 I d の化合物は、化合物  $R_{5a} - Y_{b2}$ （式中、 $Y_{b2}$  は、例えば  $B(OH)_2$  又は  $B(OR_{b4})_2$ （式中、 $R_{b4}$  は  $C_1 \sim C_4$  アルキル基であることが可能であり、又は、2 つの  $OR_{b4}$  基がホウ素原子と一緒に 5 員環を形成していることが可能である）、例えばボロン酸ピナコールエステルといったホウ素由来官能基である）を伴う、パラジウム触媒の存在下における処理により、式 I e の化合物に転換可能であり、これにより、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A_1$  及び  $X$  が式 I に定義されているとおりであり、並びに、 $R_{5a}$  が  $C_1 \sim C_4$  アルキルである式 I e の化合物がもたらされる。この反応は通常、スキーム 4 に記載されているとおり、例えば炭酸カリウム、炭酸セシウム又はリン酸カリウムといった塩基の存在下、ジオキサンなどの不活性溶剤中、任意選択により、水の存在下に、例えばテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウムといったパラジウム（0）触媒を伴って、 $80 \sim 120$  の温度で実施される。

20

30

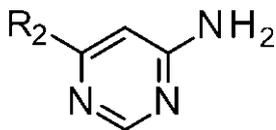
## 【0104】

式 I I の化合物は公知であり、その合成は、例えば国際公開第 2016/071214 号及び国際公開第 2015/000715 号において既に記載されている。

## 【0105】

式 I I I の化合物

## 【化 2 3】



(III)

40

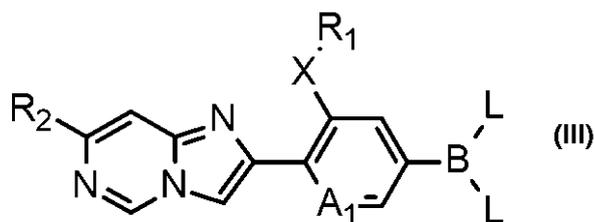
は、公知であり、市販されているか、又は、国際公開第 2016/107742 号若しくは国際公開第 2016/071214 号に記載の方法により調製され得る。

## 【0106】

式 I I I の化合物

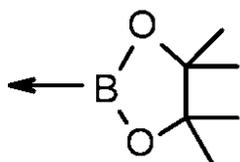
50

## 【化 2 4】



(式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $X$ 及び $A_1$ は、上記の式Iに定義されているとおりであり、並びに基 - B(-L) - Lは、 $B(OH)_2$ を表すか、又は、基

## 【化 2 5】



(ここで、矢印はフェニル又はピリジル環に対する結合点を表す)を表す)は新規であり、式Iの化合物の調製のために特別に開発されたものであり、従って、本発明のさらなる目的を構成する。式Iの化合物の置換基の好ましい実施形態は、式IIIの化合物についても有効である。

## 【0107】

これらの反応体は、塩基の存在下に反応可能である。好適な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属ジアルキルアミド又はアルカリ金属又はアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミン、アルケレンジアミン、遊離又はN-アルキル化飽和若しくは不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウム及び炭素環式アミンである。記載し得る例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムt-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、ベンジルトリメチル水酸化アンモニウム及び1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。

## 【0108】

これらの反応体は、そのまま、すなわち溶剤又は希釈剤を加えることなく相互に反応可能である。しかしながら、ほとんどの場合、不活性溶剤若しくは希釈剤又はこれらの混合物を添加することが有利である。反応が塩基の存在下で実施される場合、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチルモルホリン又はN,N-ジエチルアニリンなどの過剰量で利用される塩基もまた、溶剤又は希釈剤として作用し得る。

## 【0109】

この反応は、およそ - 80 ~ およそ + 140、好ましくはおよそ - 30 ~ およそ + 100 の温度範囲、多くの事例において、周囲温度 ~ およそ + 80 の範囲内で行われることが有利である。

10

20

30

40

50

## 【 0 1 1 0 】

式 I の化合物は、本発明に従い、慣習的な様式で式 I の出発化合物の 1 個以上の置換基を他の置換基で置換することにより、それ自体公知の様式で他の式 I の化合物に転換することが可能である。

## 【 0 1 1 1 】

各事例において好適である反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば、1 つの反応ステップのみで、本発明に従って 1 個の置換基を他の置換基で置換することが可能であり、又は、同一の反応ステップで本発明に従って複数の置換基を他の置換基で置換することが可能である。

## 【 0 1 1 2 】

式 I の化合物の塩は、それ自体公知の様式で調製可能である。それ故、例えば、酸付加式 I の化合物の塩は、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理で得られ、及び、塩基による塩は、好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理で得られる。

## 【 0 1 1 3 】

式 I の化合物の塩は、慣習的な様式で、例えば、好適な塩基化合物又は好適なイオン交換試薬による処理によって遊離化合物 I、酸付加塩に転換し、また、例えば好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって塩基による塩に転換することが可能である。

## 【 0 1 1 4 】

式 I の化合物の塩は、それ自体公知の様式で、例えば塩酸などの無機酸の塩を例えば酢酸銀といった酸のナトリウム、バリウム又は銀塩などの好適な金属塩で、形成される例えば塩化銀といった無機塩が不溶性であって反応混合物から析出される好適な溶剤中において処理することにより、例えば他の酸付加塩といった、式 I の化合物の他の塩（酸付加塩）に転換することが可能である。

## 【 0 1 1 5 】

手法又は反応条件に応じて、塩形成特性を有する式 I の化合物は、遊離形態又は塩の形態で得ることが可能である。

## 【 0 1 1 6 】

式 I の化合物及び適切な場合にはその互変異性体（それぞれの場合において、遊離形態又は塩形態）は、可能な異性体の 1 種の形態で、又は、これらの混合物として、例えば、鏡像異性体及び / 若しくはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態で、又は、例えばラセミ化合物、ジアステレオマー混合物若しくはラセミ化合物混合物といったエナンチオマー混合物などの異性体混合物として、分子中の不斉炭素原子の数、絶対及び相対的立体配置に応じて、並びに / 又は、分子中の非芳香族二重結合の立体配置に応じて存在していることが可能であり；本発明は、純粋な異性体に関すると共に可能性のあるすべての異性体混合物にも関し、また、本発明は、本明細書中上記及び下記において、各事例において特異的に立体化学が詳述されていない場合においても、各事例においてこの意味で理解されるべきである。

## 【 0 1 1 7 】

選択された出発材料及び手法に応じて得られることが可能である遊離形態又は塩形態の式 I の化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ化合物混合物は、コンポーネントの物理化学的差異に基づいて、例えば分別晶出、蒸留及び / 又はクロマトグラフィによる公知の様式で純粋なジアステレオマー又はラセミ化合物に分離可能である。

## 【 0 1 1 8 】

同様に得ることが可能であるラセミ化合物などのエナンチオマー混合物は以下のような公知の方法により光学的鏡像体に分割されることが可能である：例えば、光学的に活性な溶剤からの再結晶化；例えば、好適な微生物により補助されるアセチルセルロースでの高速液体クロマトグラフィ（HPLC）といったキラル吸着媒へのクロマトグラフィ；例えば、1 つのエナンチオマーのみが錯化されるキラルクラウンエーテルを用いる、包接化合物の形成を介した特定の不動化された酵素による開裂；又は、例えば、塩基性最終生成物ラセミ化合物を例えば樟脳酸、酒石酸若しくはリンゴ酸といったカルボン酸又は例えばカ

10

20

30

40

50

ンファースルホン酸といったスルホン酸などの光学的に活性な酸と反応させ、及び、この様式で得ることが可能であるジアステレオマー混合物を、例えば異なる溶解度に基づく分別結晶化によって分離して、例えば塩基性薬剤といった好適な薬剤の作用により所望されるエナンチオマーを遊離させることが可能であるジアステレオマーを得ることによるジアステレオ異性塩への転換。

【0119】

本発明に基づく純粋なジアステレオマー又はエナンチオマーの入手は、好適な異性体混合物の分離のみならず、例えば、好適な立体化学の出発材料が伴う本発明によるプロセスの実施といった、一般に公知のジアステレオ選択的若しくはエナンチオ選択的合成方法によっても可能である。

【0120】

N-オキドは、例えばトリフルオロ酢酸無水物といった酸無水物の存在下で、式Iの化合物を例えばH<sub>2</sub>O<sub>2</sub>/尿素付加物といった好適な酸化剤と反応させることにより調製可能である。このような酸化は、例えばJ. Med. Chem. 32(12), 2561-73, 1989又は国際公開第00/15615号といった文献から公知である。

【0121】

個々の成分が異なる生物学的活性を有している場合には、生物学的により活性である、例えばエナンチオマー若しくはジアステレオマーといった異性体、又は、例えばエナンチオマー混合物若しくはジアステレオマー混合物といった異性体混合物を各事例において単離若しくは合成することが有利である。

【0122】

式Iの化合物及び適切な場合にはその互変異性体は、遊離形態若しくは塩形態の各事例において、適切な、水和物の形態で得られることも可能であり、及び/又は、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に用いられていてもよい他の溶剤を含んでいることも可能である。

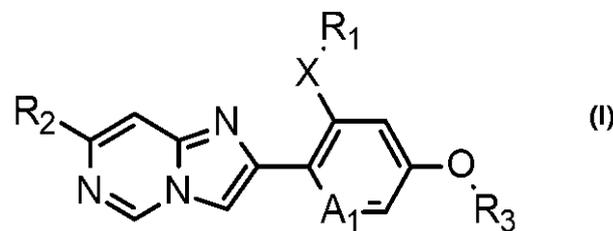
【0123】

以下の表1、2及び3の化合物は、上記の方法に従って調製可能である。以下に続く実施例は、本発明を例示し、好ましい式Iの化合物を示すことを意図している。

【0124】

表X：この表は、式I：

【化26】



(式中、R<sub>2</sub>、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>及びR<sub>3</sub>は以下に定義されているとおりである)

の65種の置換基の定義X.001~X.065、及び表Xの化合物のN-オキドを開示する。

【0125】

表X：

10

20

30

40

50

【表 1 - 1】

表X:

化合物 番号	R <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	R <sub>1</sub>	R <sub>3</sub>
X. 001	CF <sub>3</sub>	N	Et	Me
X. 002	CF <sub>3</sub>	N	Et	Et
X. 003	CF <sub>3</sub>	N	Et	iPr
X. 004	CF <sub>3</sub>	N	Et	tBu
X. 005	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> cPr
X. 006	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>
X. 007	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> C (O) OMe
X. 008	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH (Me) C (O) OMe
X. 009	CF <sub>3</sub>	N	Et	C (Me) <sub>2</sub> C (O) OMe
X. 010	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CN
X. 011	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH (Me) CN
X. 012	CF <sub>3</sub>	N	Et	C (Me) <sub>2</sub> CN
X. 013	CF <sub>3</sub>	CH	Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
X. 014	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
X. 015	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S (O) Me
X. 016	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S (O) <sub>2</sub> Me
X. 017	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
X. 018	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
X. 019	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CCH
X. 020	CF <sub>3</sub>	N	Et	C (Me) <sub>2</sub> C (O) NH <sub>2</sub>
X. 021	CF <sub>3</sub>	N	Et	C (Me) <sub>2</sub> C (O) NHMe
X. 022	CF <sub>3</sub>	N	Et	C (Me) <sub>2</sub> C (O) NMe <sub>2</sub>
X. 023	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 024	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 025	CF <sub>3</sub>	N	Et	

10

20

30

40

50

【表 1 - 2】

X. 026	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 027	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 028	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 029	CF <sub>3</sub>	N	Et	C (Me) <sub>2</sub> C (O) NH <sub>2</sub>
X. 030	CF <sub>3</sub>	N	Et	CF <sub>2</sub> C (O) NMe <sub>2</sub>
X. 031	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> SMe
X. 032	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> S (O) <sub>2</sub> Me
X. 033	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> tBu
X. 034	CF <sub>3</sub>	N	Et	CMe <sub>2</sub> C=NOMe
X. 035	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> C=NOMe
X. 036	CF <sub>3</sub>	N	Et	CHMeC=NOMe
X. 037	CF <sub>3</sub>	N	Et	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
X. 038	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 039	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 040	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 041	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 042	CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 043	CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> tBu
X. 044	CF <sub>3</sub>	CH	Et	iPr
X. 045	CF <sub>3</sub>	CH	Et	C (Me) <sub>2</sub> CN
X. 046	CF <sub>3</sub>	CH	Et	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
X. 047	CF <sub>3</sub>	CH	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

10

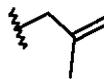
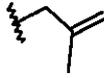
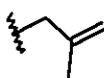
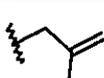
20

30

40

50

【表 1 - 3】

X. 048	CF <sub>3</sub>	CH	Et	
X. 049	CF <sub>3</sub>	CH	Et	
X. 050	SCF <sub>3</sub>	N	Et	iPr
X. 051	S(O)CF <sub>3</sub>	N	Et	iPr
X. 053	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N	Et	iPr
X. 054	SCF <sub>3</sub>	N	Et	C(Me) <sub>2</sub> CN
X. 055	S(O)CF <sub>3</sub>	N	Et	C(Me) <sub>2</sub> CN
X. 056	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N	Et	C(Me) <sub>2</sub> CN
X. 057	SCF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
X. 058	S(O)CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
X. 059	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
X. 060	SCF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
X. 061	S(O)CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
X. 062	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
X. 063	SCF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 064	S(O)CF <sub>3</sub>	N	Et	
X. 065	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N	Et	

## 【0126】

Meはメチル基を表し、Etはエチル基であり、i-Prはイソプロピル基であり、cPrはシクロプロピル基であり、C(O)OMeはメトキシカルボニル基であり、MeOはメトキシ基であり、及び、MeOCH<sub>2</sub>はメトキシメチル基である。

## 【0127】

表1：この表は、XがSであり、並びに、R<sub>2</sub>、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>及びR<sub>3</sub>が表Xに定義されているとおりである、式Iの65種の化合物1.001~1.065を開示する。例えば、化合物1.003は以下の構造を有する。

10

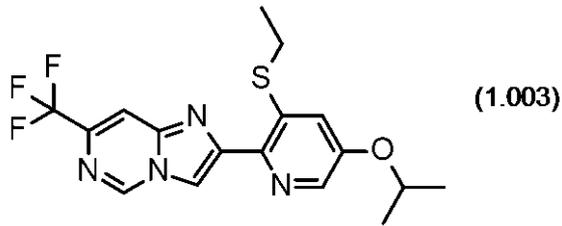
20

30

40

50

## 【化 2 7】

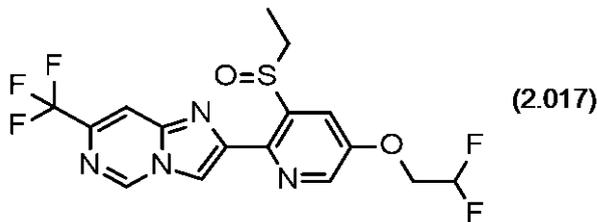


10

## 【 0 1 2 8】

表 2：この表は、X が S O であり、並びに、R<sub>2</sub>、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>及び R<sub>3</sub>が表 X に定義されているとおりである、式 I の 6 5 種の化合物 2 . 0 0 1 ~ 2 . 0 6 5 を開示する。例えば、化合物 2 . 0 1 7 は以下の構造を有する。

## 【化 2 8】

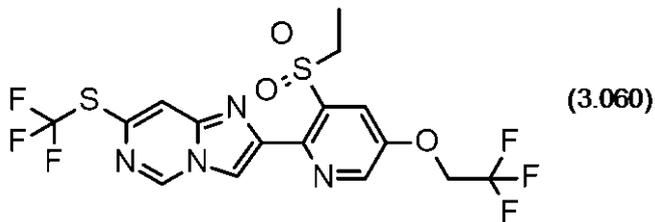


20

## 【 0 1 2 9】

表 3：この表は、X が S O<sub>2</sub> であり、並びに、R<sub>2</sub>、A<sub>1</sub>、R<sub>1</sub>及び R<sub>3</sub>が表 X に定義されているとおりである、式 I の 6 5 種の化合物 3 . 0 0 1 ~ 3 . 0 6 5 を開示する。例えば、化合物 3 . 0 6 0 は以下の構造を有する。

## 【化 2 9】



30

## 【 0 1 3 0】

本発明に係る式 I の化合物は、有害生物防除の分野において、低適用量であっても予防的及び/又は治療的に価値を有する活性成分であり、これらは、きわめて好ましい生物致死範囲を有すると共に、温血動物、魚及び植物が適切な耐性を有する。本発明に係る活性成分は、通常は感受性である（耐性のものも含む）昆虫又は代表的なダニ目（Acarina）などの動物に対する有害生物における発育段階のすべて又は個々に作用する。本発明に係る活性成分の殺虫活性又は殺ダニ活性はそれ自体、直接的に（すなわち、有害生物の駆除において、直ぐに生じるか、又は、例えば脱皮の最中といった一定の時間が経過した後にのみ生じる）、又は、間接的に（例えば産卵率及び/又は孵化率の低減）を明らかにもたらすことが可能である。

40

## 【 0 1 3 1】

上記の動物に対する有害生物のさらなる例は以下のとおりである。

50

ダニ目 (Acarina) から、例えば、アカリツス属の一種 (Acalitus spp)、アカルス属の一種 (Aculus spp)、アカリカルス属の一種 (Acaricalus spp)、アセリア属の一種 (Aceria spp)、アシフトコナダニ (Acarus siro)、アンブリオンマ属の一種 (Amblyomma spp.)、ナガヒメダニ属の一種 (Argas spp.)、ブーフイラス属の一種 (Boophilus spp.)、ブレビパルプス属の一種 (Brevipalpus spp.)、ブリオピア属の一種 (Bryobia spp)、カリピトリメルス属の一種 (Calipitrimerus spp.)、ショクヒヒゼンダニ属の一種 (Chorioptes spp.)、ワクモ (Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス属の一種 (Dermatophagoides spp)、エオテトラニカス属の一種 (Eotetranychus spp)、エリオフィエス属の一種 (Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属の一種 (Hemitarsonemus spp)、イボマダニ属の一種 (Hyalomma spp.)、マダニ属の一種 (Ixodes spp.)、オリゴニクス属の一種 (Olygonychus spp)、カズキダニ属の一種 (Ornithodoros spp.)、ポリファゴタルソネラタス (Polyphagotarsonella latus)、パノニクス属の一種 (Panonychus spp.)、ミカンサビダニ (Phyllocoptruta oleivora)、フィトネムス属の一種 (Phytonemus spp)、ポリファゴタロソネムス属の一種 (Polyphagotarsonemus spp)、キュウセンヒゼンダニ属の一種 (Psoroptes spp.)、コイタマダニ属の一種 (Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス属の一種 (Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属の一種 (Sarcoptes spp.)、ステネオタルソネムス属の一種 (Steneotarsonemus spp.)、ホコリダニ属の一種 (Tarsonemus spp.) 及びテトラニクス属の一種 (Tetranychus spp.) ; シラミ目 (Anoplura) から、例えば、ブタジラミ属の一種 (Haematopinus spp.)、シラミ属の一種 (Linognathus spp.)、ペディクルス属の一種 (Pediculus spp.)、ペムフィグス属の一種 (Pemphigus spp.) 及びネアブラムシ属の一種 (Phylloxera spp.) ;

10

20

【0132】

鞘翅目 (Coleoptera) から、例えば、アグリオテス属の一種 (Agriotes spp.)、アンフィマロンマジャレ (Amphimallon majale)、セマダラコガネ (Anomala orientalis)、アントノムス属の一種 (Anthrenomus spp.)、アンフォディウス属の一種 (Aphodius spp)、アスチラスアトロマクラタス (Astylus atromaculatus)、アテニウス属の一種 (Ataenius spp)、アトマリアリネアリス (aria linearis)、カエトクネマチピアリス (Chaetocnema tibialis)、セロトマ属の一種 (Cerotoma spp)、コノデルス属の一種 (Conoderus spp)、コスモポリテス属の一種 (Cosmopolites spp.)、コチニスニチダ (Cotinis nitida)、クルクリオ属の一種 (Curculio spp.)、シクロセファラ属の一種 (Cyclocephala spp)、デルメステス属の一種 (Dermestes spp.)、ディアプロティカ属の一種 (Diabrotica spp.)、アデルスツノカブト (Diloboderus abderus)、エピラクナ属の一種 (Epilachna spp.)、エレムヌス属の一種 (Eremnus spp.)、ヘテロニクスアラトル (Heteronychus arator)、ヒポテネムスハンペイ (Hypothenemus hampei)、ラグリアフィロサ (Lagria vilosa)、コロラドハムシ (Leptinotarsa decemlineata)、リッソルホプトルス属の一種 (Lissorhopterus spp.)、リオゲニス属の一種 (Liogenys spp)、マエコラスピス属の一種 (Maecolaspis spp)、アカビロウドコガネ (Maladera castanea)、メガセリス属の一種 (Megascelis spp)、メリゲテスア

30

40

50

エネウス (*Melighetes aeneus*)、メロロンタ属の一種 (*Melolontha* spp.)、マイオクロウスアルマツス (*Myochrous armatus*)、オリジャエフィルス属の一種 (*Orycaephilus* spp.)、オチオリンクス属の一種 (*Otiorynchus* spp.)、フィロファガ属の一種 (*Phyllophaga* spp.)、フリクチヌス属の一種 (*Phlyctinus* spp.)、ポピリア属の一種 (*Popillia* spp.)、プシリオデス属の一種 (*Psylliodes* spp.)、リゾマツスアウブチリス (*Rhysosomatus aubtilis*)、リゾペルタ属の一種 (*Rhizopertha* spp.)、コガネムシ科 (*Scarabeidae*)、シトフィルス属の一種 (*Sitophilus* spp.)、シトトルガ属の一種 (*Sitotroga* spp.)、ソマチカス属の一種 (*Somaticus* spp.)、スフェノフォラス属の一種 (*Sphenophorus* spp.)、ステルネクススブシグナツス (*Sternechus subsignatus*)、ゴミムシダマシ属の一種 (*Tenebrio* spp.)、トリボリウム属の一種 (*Tribolium* spp.) 及びトロゴデルマ属の一種 (*Trogoderma* spp.) ;

10

双翅目 (*Diptera*) から、例えば、ヤブカ属の一種 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属の一種 (*Anopheles* spp.)、アンテリゴナソカタ (*Antherigona soccata*)、バクトロシアオレアエ (*Bactrocea oleae*)、ビビオホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属の一種 (*Bradysia* spp.)、カリホラエリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス属の一種 (*Ceratitis* spp.)、オビキンバエ属の一種 (*Chrysomyia* spp.)、イエカ属の一種 (*Culex* spp.)、クテレブラ属の一種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス属の一種 (*Dacus* spp.)、デリア属の一種 (*Delia* spp.)、キイロシヨウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイエバエ属の一種 (*Fannia* spp.)、ガストロフィルス属の一種 (*Gastrophilus* spp.)、ゲオミザトリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツエツエバエ属の一種 (*Glossina* spp.)、ウシバエ属の一種 (*Hypoderma* spp.)、ヒッポボスカ属の一種 (*Hyppobosca* spp.)、リリオミザ属の一種 (*Liriomyza* spp.)、キンバエ属の一種 (*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属の一種 (*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属の一種 (*Musca* spp.)、ヒツジバエ属の一種 (*Oestrus* spp.)、オルセオリア属の一種 (*Orseolia* spp.)、オシネラフリット (*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属の一種 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属の一種 (*Rhagoletis* spp.)、リベリアクアドリファシアタ (*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属の一種 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属の一種 (*Sciarra* spp.)、サシバエ属の一種 (*Stomoxys* spp.)、アブ属の一種 (*Tabanus* spp.)、タニア属の一種 (*Tannia* spp.) 及びガガンボ属の一種 (*Tipula* spp.) ;

20

30

40

## 【0133】

半翅目 (*Hemiptera*) から、例えば、アcantコリススカブラトル (*Acanthocoris scabrator*)、アクロステルナム属の一種 (*Acrosternum* spp.)、ウススジカスミカメ (*Adelphocoris lineolatus*)、アンプリペルタニチダ (*Amblypelta nitida*)、バチコエリアタラシナ (*Bathycoelia thalassina*)、ブリサス属の一種 (*Blissus* spp.)、トコジラミ属の一種 (*Cimex* spp.)、クラビグララトメントシコリス (*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属の一種 (*Creontiades* spp.)、ジスタンチエラテオブロマ (*Distantiella theobroma*)、ジケロプスフルカツス (*Dichelos*

50

*ps furcatus* )、ジスデルクス属の一種 (*Dysdercus spp.* )、イ  
 デッサ属の一種 (*Edessa spp.* )、オイキスツス属の一種 (*Euchistus*  
*spp.* )、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum* )、エウリガステル属の  
 一種 (*Eurygaster spp.* )、クサギカメムシ (*Halyomorpha h*  
*alyis* )、ホルシアスノビレルス (*Horcias nobilellus* )、レプト  
 コリサ属の一種 (*Leptocorisa spp.* )、メクラカメムシ属の一種 (*Ly*  
*gus spp.* )、マルガロデス属の一種 (*Margarodes spp.* )、ムルガンチ  
 アヒストリオニク (*Murgantia histrionic* )、ネオメガロトムス属  
 の一種 (*Neomegalotomus spp.* )、タバコカスミカメ (*Nesidio*  
*coris tenuis* )、ネザラ属の一種 (*Nezara spp.* )、ニシウスシム 10  
 ランス (*Nysius simulans* )、オエバルスインストラリス (*Oebalus*  
*insularis* )、ピエスマ属の一種 (*Piesma spp.* )、ピエゾドルス属  
 の一種 (*Piezodorus spp.* )、ロドニウス属の一種 (*Rhodnius sp*  
*pp.* )、サールベルゲラシングラリス (*Sahlbergella singulari*  
*s* )、スカプトコリスカスタネア (*Scaptocoris castanea* )、スコ  
 チノファラ属の一種 (*Scotinophara spp.* )、チアンタ属の一種 (*Th*  
*yanta spp.* )、トリアトマ属の一種 (*Triatoma spp.* )、ヴァチガイ  
 ルデンス (*Vatiga illudens* ) ; アシルトシウムピスム (*Acyrttho*  
*sium pisum* )、アダルゲス属の一種 (*Adalges spp.* )、アガリアナエ 20  
 ンシゲラ (*Agalliana ensigera* )、アゴノセナタルギオニイ (*Ago*  
*noscena targionii* )、アレウロジクス属の一種 (*Aleurodic*  
*us spp.* )、アレウロカンツス属の一種 (*Aleurocanthus spp.* )、ア  
 レウロロブスバロデンス (*Aleurolobus barodensis* )、アレウ  
 ロトリキスフロッコス (*Aleurothrixus floccosus* )、アレイ  
 ロデスブラシカエ (*Aleyrodes brassicae* )、フタテンミドリヒメヨ  
 コバイ (*Amarasca biguttula* )、アムリトズスアトキンソニ (*Amr*  
*itodus atkinsoni* )、アオニジエラ属の一種 (*Aonidiella s*  
*pp.* )、アリマキ科 (*Aphididae* )、ワタアブラムシ属の一種 (*Aphis*  
*spp.* )、アスピジオツス属の一種 (*Aspidiotus spp.* )、ジャガイモ 30  
 ヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani* )、バクテリセラコッケレ  
 リ (*Bactericera cockerelli* )、ベミシア属の一種 (*Bemis*  
*ia spp.* )、ブラキカウダス属の一種 (*Brachycaudus spp.* )、ダイコ  
 ンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae* )、カコブシラ属の一種 (  
*Cacopsylla spp.* )、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavariella a*  
*egopodii Scop.* )、セロプラスタ属の一種 (*Ceroplaster sp*  
*pp.* )、クリソムファルスアオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*  
*m* )、オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyosper*  
*mi* )、シカデラ属の一種 (*Cicadella spp.* )、シロオオヨコバイ (*Cof*  
*ana spectra* )、クリプトミズス属の一種 (*Cryptomyzus spp.* )  
 、シカツリナ属の一種 (*Cicadulina spp.* )、ヒラタカタカイガラムシ (*C*  
*occus hesperidum* )、ダルブルスマイジス (*Dalbulus maid*  
*is* )、ジアレウロデス属の一種 (*Dialeurodes spp.* )、ミカンキジラミ 40  
 (*Diaphorina citri* )、ジウラフィスノキシア (*Diuraphis n*  
*oxia* )、ジサフィス属の一種 (*Dysaphis spp.* )、エムボアスカ属の一種  
 (*Empoasca spp.* )、リングワタムシ (*Eriosoma larigeru*  
*m* )、エリスロネウラ属の一種 (*Erythroneura spp.* )、カスカルジア  
 属の一種 (*Gascardia spp.* )、グリカスピスブリンブレコンベイ (*Gly*  
*caspis brimblecombei* )、ヒアダフィスシュードブラシカエ (*Hy*  
*adaphis pseudobrassicae* )、ヒアロプテルス属の一種 (*Hya*  
*lopterus spp.* )、ヒペロミズスパリス (*Hyperomyzus pall* 50

*idus* )、リュウガンズキンヨコバイ (*Idioscopus clypealis* )、ヤコビアスカリビカ (*Jacobiasca lybica* )、ラオデルファクス属の一種 (*Laodelphax spp.* )、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni* )、レピドサフェス属の一種 (*Lepidosaphes spp.* )、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis erysimi* )、リオゲニスマイヂス (*Lyogenys maidis* )、マクロシフム属の一種 (*Macrosiphum spp.* )、マハナルワ属の一種 (*Mahanarva spp.* )、メタカルファプルイノサ (*Metcalfa pruinosa* )、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum* )、ミンズスクルズス (*Myndus crudus* )、ミスス属の一種 (*Myzus spp.* )、ネオトキソプテラ属の一種 (*Neotoxoptera sp.* )、ツماغロヨコバイ属の一種 (*Nephotettix spp.* )、ニラバルバタ属の一種 (*Nilaparvata spp.* )、ナシミドリオオアブラムシ (*Nippolachnus piri Mats.* )、オドナスピスルタエ (*Odonaspis ruthae* )、オレグマラニゲラゼンター (*Oregma lanigera Zehnter* )、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisia myricae* )、パラトリオザコッケレリ (*Paratrioza cockerelli* )、パルラトリア属の一種 (*Parlatoria spp.* )、ペムフィグス属の一種 (*Pemphigus spp.* )、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis* )、ペルクインシエラ属の一種 (*Perkinsiella spp.* )、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli* )、フィロキセラ属の一種 (*Phylloxera spp.* )、プラノコッカス属の一種 (*Planococcus spp.* )、プセウダウラカスピス属の一種 (*Pseudaulacaspis spp.* )、シュードコッカス属の一種 (*Pseudococcus spp.* )、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis seriatus* )、プシラ属の一種 (*Psylla spp.* )、プルビナリアエチオピカ (*Pulvinaria aethiopica* )、クアドラズピジオツス属の一種 (*Quadraspidiotus spp.* )、クエサダギガス (*Quesada gigas* )、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis* )、ロパロシフム属の一種 (*Rhopalosiphum spp.* )、サイセチア属の一種 (*Saissetia spp.* )、スカホイデウス属の一種 (*Scaphoideus spp.* )、スチザフィス属の一種 (*Schizaphis spp.* )、シトビオン属の一種 (*Sitobion spp.* )、セジロウンカ (*Sogatella furcifera* )、スピシスチルスフェスチヌス (*Spissistilus festinus* )、タロファガスプロセルピナ (*Tarophagus Proserpina* )、トキソプテラ属の一種 (*Toxoptera spp.* )、トリアロイデス属の一種 (*Trialeurodes spp.* )、トリジスカスポロボリ (*Tridiscus sporoboli* )、トリオニムス属の一種 (*Trionymus spp.* )、ミカントガリキジラミ (*Triozza erytreae* )、ニセヤノネカイガラムシ (*Unaspis citri* )、ジギナフラミゲラ (*Zygina flammigera* )、ジギニジアスクテラリス (*Zyginidia scutellaris* ) ;

【0134】

膜翅目 (*Hymenoptera* ) から、例えば、ヒメハキリアリ属 (*Acromyrmex* )、アルゲ属の一種 (*Arge spp.* )、アッタ属の一種 (*Atta spp.* )、セフス属の一種 (*Cephus spp.* )、ジプリオン属の一種 (*Diprion spp.* )、マツハバチ科 (*Diprionidae* )、シマトウヒハバチ (*Gilpinia polytoma* )、ホプロカンパ属の一種 (*Hoplocampa spp.* )、ケアリ属の一種 (*Lasius spp.* )、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis* )、ネオジプリオン属の一種 (*Neodiprion spp.* )、クロナガアリ (*Pogonomyrmex spp.* )、スレノブシスインビクタ (*Slenopsis invicta* )、ソレノブシス属の一種 (*Solenopsis spp.* ) 及びベスパ属の一種 (*Vespa spp.* ) ;

10

20

30

40

50

等翅目 (Isoptera) から、例えば、コプトテルメス属の一種 (Coptotermes spp.)、コルニテルネスクムランス (Cornitermes cumulans)、インシテルメス属の一種 (Incisitermes spp.)、マクロテルメス属の一種 (Macrotermes spp.)、マストテルメス属の一種 (Mastotermes spp.)、ミクロテルメス属の一種 (Microtermes spp.)、ヤマトシロアリ属の一種 (Reticulitermes spp.) ; ソレノプシスゲミナーテ (Solenopsis geminate) ;

【0135】

鱗翅目 (Lepidoptera) から、例えば、アクレリス属の一種 (Acleris spp.)、アドキシフィエス属の一種 (Adoxophyes spp.)、アエゲリア属の一種 (Aegeria spp.)、アグロティス属の一種 (Agrotis spp.)、アラバマアルギラセア (Alabama argillaceae)、アミロイス属の一種 (Amylois spp.)、アンチカルシアゲマタリス (Anticarsia gemmatalis)、アルチップス属の一種 (Archips spp.)、アルギレスチア属の一種 (Argyresthia spp.)、アルギロタエニア属の一種 (Argyrotaenia spp.)、アウトグラフィ属の一種 (Autographa spp.)、ブククラトリクスツルベリエラ (Bucculatrix thurberiella)、アフリカズイム (Busseola fusca)、スジマラダメイガ (Cadra cautella)、モモシンクイガ (Carposina nipponensis)、キロ属の一種 (Chilo spp.)、コリストネウラ属の一種 (Choristoneura spp.)、クリソテウチアトピアリア (Chrysoteuchia topiaria)、クリシアアンビグエラ (Clyisia ambiguella)、クナファロクロシス属の一種 (Cnaphalocrocis spp.)、クネファシア属の一種 (Cnephasia spp.)、コチリス属の一種 (Cochylis spp.)、コレオフォラ属の一種 (Coleophora spp.)、コリアスレスビア (Colias lesbia)、ワタアカキリバ (Cosmophila flava)、クラムバス属の一種 (Crambus spp.)、ケブカノメイガ (Crociodolomia binotalis)、クリプトフレビアロイコトレタ (Cryptophlebia leucotreta)、シダリマペルスベクタリス (Cydalima perspectalis)、シジア属の一種 (Cydia spp.)、ジアファニアペルスベクタリス (Diaphania perspectalis)、ジアトラエア属の一種 (Diatraea spp.)、ジパロプシスカスタネア (Diparopsis castanea)、エアリアス属の一種 (Earias spp.)、エルダナサッカリナ (Eldana saccharina)、エフェスチア属の一種 (Ephestia spp.)、エピノチア属の一種 (Epinotia spp.)、エスチグメネアクレア (Estigmene acrea)、エチエラジンキネラ (Etiella zinckinella)、オイコスマ属の一種 (Eucosma spp.)、ブドウホソハマキ (Eupoecilia ambiguella)、ユープロクチス属の一種 (Euproctis spp.)、エウクソア属の一種 (Euxoa spp.)、フェルチアジャクリフェリア (Feltia jaculiferia)、グラホリタ属の一種 (Grapholita spp.)、ヘディアヌビフェラナ (Hedya nubiferana)、ヘリオティス属の一種 (Heliothis spp.)、ハイマダラノメイガ (Hellula undalis)、ヘルペトグラマ属の一種 (Herpetogramma spp.)、アメリカシロヒトリ (Hyphantria cunea)、ケイフェリアリコペルシセラ (Keiferia lycopersicella)、モロコシマダラメイガ (Lasmopalpus lignosellus)、レウコプテラシテラ (Leucoptera scitella)、リトコレチス属の一種 (Lithocolletis spp.)、ホソバヒメハマキ (Lobesia botrana)、ロキソステゲビフィダリス (Loxostege bifidalis)、リマントリア属の一種 (Lymantria spp.)、リオネチア属の一種 (Lyonetia

spp.)、マラコソマ属の一種 (*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ (*Manduca sexta*)、ミチムナ属の一種 (*Mythimna* spp.)、ノクツア属の一種 (*Noctua* spp.)、オペロフテラ属の一種 (*Operophtera* spp.)、オルニオデスインディカ (*Orniodes indica*)、ヨーロッパアウノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属の一種 (*Pammene* spp.)、パンデミス属の一種 (*Pandemis* spp.)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、パパイマネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラコッフエエラ (*Perileucoptera coffeella*)、シュードレチアウニブクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、ジャガイモキバガ (*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属の一種 (*Pieris* spp.)、コナガ (*Plutella xylostella*)、プレイス属の一種 (*Prays* spp.)、シュードブルシア属の一種 (*Pseudoplusia* spp.)、ラキブルシアヌ (*Rachiplusia nu*)、リチアアルピコスタ (*Richia albicosta*)、シルポファガ属の一種 (*Scirpophaga* spp.)、セサミア属の一種 (*Sesamia* spp.)、スバルガノチス属の一種 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属の一種 (*Spodoptera* spp.)、シレプタデロガテ (*Sylepta derogate*)、シナンテドン属の一種 (*Synanthedon* spp.)、タウメトポエア属の一種 (*Thaumetopoea* spp.)、トルトリックス属の一種 (*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*)、及びスガ属の一種 (*Yponomeuta* spp.) ;

10

20

## 【0136】

食毛目 (*Mallophaga*) から、例えば、  
 ダマリネア属の一種 (*Damalinea* spp.) 及びケモノハジラミ属の一種 (*Trichodectes* spp.) ;  
 直翅目 (*Orthoptera*) から、例えば、ゴキブリ属の一種 (*Blatta* spp.)、チャバネゴキブリ属の一種 (*Blattella* spp.)、グリロタルパ属の一種 (*Gryllotalpa* spp.)、マデイラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、ロクスタ属の一種 (*Locusta* spp.)、ネオクルチラヘキサダクチラ (*Neocurtilla hexadactyla*)、ワモンゴキブリ属の一種 (*Periplaneta* spp.)、スカプテリスクス属の一種 (*Scapteriscus* spp.)、及びコオロギ属の一種 (*Schistocerca* spp.) ;  
 チャタテムシ目 (*Psocoptera*) から、例えば、リボセリス属の一種 (*Liposcelis* spp.) ;  
 ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、ナガノミ属の一種 (*Ceratophyllus* spp.)、イヌノミ属の一種 (*Ctenocephalides* spp.) 及びケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) ;  
 総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えば、カリオトリプスファセオリ (*Caliothrips phaseoli*)、ハナアザミウマ属の一種 (*Frankliniella* spp.)、ヘリオトリプス属の一種 (*Heliothrips* spp.)、ヘルシノトリプス属の一種 (*Hercinothrips* spp.)、パルテノトリプス属の一種 (*Parthenothrips* spp.)、シルトトリプスアウランチ (*Scirtothrips aurantii*)、ダイズアザミウマ (*Sericothrips variabilis*)、タエニオトリプス属の一種 (*Taeniothrips* spp.)、トリプス属の一種 (*Thrips* spp.) ;  
 シミ目 (*Thysanura*) から、例えば、セイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)。

30

40

## 【0137】

50

本発明による活性成分は、特に植物であって、特に、農業、園芸及び営林における有用植物及び観賞用植物に、又は、このような植物の果実、花、群葉、茎、塊茎若しくは根などの器官に、並びに、いくつかの場合において、さらには、これらの有害生物に対する保護が有効である期間より後の時点に形成される植物器官に発生する上記の種類の有害生物を防除、すなわち、抑制若しくは駆逐するために用いられることが可能である。

【0138】

好適な標的作物は、特に、コムギ、オオムギ、ライ麦、カラスムギ、イネ、トウモロコシ又はモロコシ属 (*Sorghum*) などの穀類；サトウダイコン又は飼料ビートなどのビート；リンゴ、セイヨウナシ、セイヨウスモモ、モモ、アーモンド、サクランボ、又は、例えばイチゴ、ラズベリー若しくはブラックベリーといった液果類などの、例えば仁果、石果又は軟果といった果実；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ又は大豆などのマメ科作物；アブラナ、マスタード、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナツ、トウゴマ、カカオ又は落花生などの油作物；カボチャ、キュウリ又はメロンなどのウリ科植物；綿、亜麻、アサ又はジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ又はタンジェリンなどの柑橘果実；ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ又はピーマンなどの野菜；アボカド、シナモン又は樟腦などのクスノキ科；並びに、タバコ、堅果、コーヒー、ナス、サトウキビ、チャ、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科及びラテックス植物である。

【0139】

本発明の組成物及び/又は方法はまた、花、灌木、闊葉樹及び常緑樹を含むいずれかの観賞用及び/又は野菜作物に用いられ得る。

【0140】

例えば、本発明は、以下の観賞用種：アゲラタム属の一種 (*Ageratum* spp.)、アロンソア属の一種 (*Alonsoa* spp.)、アネモネ属の一種 (*Anemone* spp.)、アニソドンテアカプセニシス (*Anisodonteacapsenis*)、アンテミス属の一種 (*Anthemis* spp.)、アンチルリヌム属の一種 (*Antirrhinum* spp.)、アステル属の一種 (*Aster* spp.)、ベゴニア属の一種 (*Begonia* spp.) (例えば *B. elatior*)、*B. semperflorens*、*B. tubereux*)、ブーゲンビレア属の一種 (*Bougainvillea* spp.)、ブラキコメ属の一種 (*Brachycome* spp.)、ブラシカ属の一種 (*Brassica* spp.) (観賞用)、カルセオラリア属の一種 (*Calceolaria* spp.)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ニチニチソウ (*Catharanthus roseus*)、カンナ属の一種 (*Canna* spp.)、セントーレア属の一種 (*Centaurea* spp.)、キク属の一種 (*Chrysanthemum* spp.)、シネリア属の一種 (*Cineraria* spp.) (*C. maritima*)、コレオブシス属の一種 (*Coreopsis* spp.)、クラッスラコッキネア (*Crassula coccinea*)、タバコソウ (*Cuphea ignea*)、ダリア属の一種 (*Dahlia* spp.)、デルフィニウム属の一種 (*Delphinium* spp.)、ケマンソウ (*Dicentra spectabilis*)、ドロテアンツス属の一種 (*Dorotheantus* spp.)、トルコギキョウ (*Eustoma grandiflorum*)、レンギョウ属の一種 (*Forsythia* spp.)、フクシア属の一種 (*Fuchsia* spp.)、ゼラニウムグナファリウム (*Geranium gnaphalium*)、ガーベラ属の一種 (*Gerbera* spp.)、センニチコウ (*Gomphrena globosa*)、ヘリオトロピウム属の一種 (*Heliotropium* spp.)、ヘリアンツス属の一種 (*Helianthus* spp.)、ハイビスカス属の一種 (*Hibiscus* spp.)、ホルテンシア属の一種 (*Hortensia* spp.)、ハイドランジア属の一種 (*Hydrangea* spp.)、ヒポエステスフィロスタシア (*Hypoestes phyllostachya*)、インパチエンス属の一種 (*Imp*

10

20

30

40

50

*atiens* spp.) (アフリカハウセンカ (*I. Walleriana*)), イレシネス属の一種 (*Iresines* spp.), カランコエ属の一種 (*Kalanchoe* spp.), ランタナ (*Lantana camara*), ハナアオイ (*Lavatera trimestris*), カエンキセウタ (*Leonotis leonurus*), ユリ属の一種 (*Lilium* spp.), メセンブリアンテマム属の一種 (*Mesembryanthemum* spp.), ミムルス属の一種 (*Mimulus* spp.), ヤグルマハッカ属の一種 (*Monarda* spp.), ネメシア属の一種 (*Nemesia* spp.), タゲテス属の一種 (*Tagetes* spp.), ダイアンサス属の一種 (*Dianthus* spp.) (カーネーション), カンナ属の一種 (*Canna* spp.), オキザリス属の一種 (*Oxalis* spp.), ベリス属の一種 (*Bellis* spp.), ペラルゴニウム属の一種 (*Pelargonium* spp.) (アイビーゼラニウム (*P. peltatum*), モンテンジクアオイ (*P. Zonale*)), ビオラ属の一種 (*Viola* spp.) (パンジー), ペチュニア属の一種 (*Petunia* spp.), フロックス属の一種 (*Phlox* spp.), プレクトランツス属の一種 (*Plecthranthus* spp.), ポインセチア属の一種 (*Poinsettia* spp.), パルテノキスス属の一種 (*Parthenocissus* spp.) (アメリカヅタ (*P. quinquefolia*), ツタ (*P. tricuspidata*)), プリムラ属の一種 (*Primula* spp.), キンボウゲ属の一種 (*Ranunculus* spp.), ツツジ属の一種 (*Rhododendron* spp.), バラ属の一種 (*Rosa* spp.) (バラ), ルドベキア属の一種 (*Rudbeckia* spp.), アフリカスミレ属の一種 (*Saintpaulia* spp.), サルビア属の一種 (*Salvia* spp.), スカエボラアエモラ (*Scaevola aemola*), シザンサスウィセトネンシス (*Schizanthus wisetonensis*), セダム属の一種 (*Sedum* spp.), ナス属の一種 (*Solanum* spp.), スルフィニア属の一種 (*Surfinia* spp.), タゲテス属の一種 (*Tagetes* spp.), ニコチニア属の一種 (*Nicotinia* spp.), バーベナ属の一種 (*Verbena* spp.), ヒャクニチソウ属の一種 (*Zinnia* spp.) 及び他の花壇用の植物のいずれかに用いられ得る。

10

20

#### 【0141】

例えば、本発明は、以下の野菜種：ネギ属の一種 (*Allium* spp.) (ニンニク (*A. sativum*), タマネギ (*A. cepa*), エシャロット (*A. oschaninii*), リーキ (*A. Porrum*), ワケギ (*A. ascalonicum*), ネギ (*A. fistulosum*)), チャービル (*Anthriscus cerefolium*), セロリ (*Apium graveolus*), アスパラガス (*Asparagus officinalis*), ビート (*Beta vulgaris*), ブラシカ属の一種 (*Brassica* spp.) (ヤセイカンラン (*B. Oleracea*), ハクサイ (*B. Pekinensis*), カブ (*B. rapa*)), トウガラシ (*Capicum annuum*), ヒヨコマメ (*Cicer arietinum*), エンダイブ (*Cichorium endivia*), チコルム属の一種 (*Cichorium* spp.) (チコリー (*C. intybus*), エンダイブ (*C. endivia*)), スイカ (*Citrillus lanatus*), ククミス属の一種 (*Cucumis* spp.) (サフラン (*C. sativus*), メロン (*C. melo*)), ククルビタ属の一種 (*Cucurbita* spp.) (ペボカボチャ (*C. pepo*), 西洋カボチャ (*C. maxima*)), シアナラ属の一種 (*Cyanara* spp.) (アーティチョーク (*C. scolymus*), カルドン (*C. cardunculus*)), ニンジン (*Daucus carota*), フェンネル (*Foeniculum vulgare*), オトギリソウ属の一種 (*Hypericum* spp.), レタス (*Lactuca sativa*), トマト属の一種 (*Lycopersicon* spp.) (トマト (*L. esculentum*), トマト (*L. lycopersicum*)), ハッカ属の一種 (*Mentha* spp.), バジル (*Ocimum basilicum*), パセリ (*P*

30

40

50

*etroselinum crispum*)、ファセオルス属の一種 (*Phaseolus* spp.) (ムシトリスミレ (*P. vulgaris*)、ベニバナインゲン (*P. coccineus*))、エンドウ (*Pisum sativum*)、ダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マンネンロウ属の一種 (*Rosemarinus* spp.)、サルビア属の一種 (*Salvia* spp.)、キバナバラモンジン (*Scorzonera hispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleacea*)、バレリアネラ属の一種 (*Valerianella* spp.) (ノヂシヤ (*V. locusta*)、*V. エリオカルパ* (*V. eriocarpa*)) 及びソラマメ (*Vicia faba*) のいずれかに用いられ得る。

10

## 【0142】

好ましい観賞用種としては、セントポーリア、ペゴニア、ダリア、ガーベラ、アジサイ、バーベナ、バラ、カランコエ、ポインセチア、アスター、ヤグルマギク、キンケイギク、ヒエンソウ、モナルダ、フロックス、ルドベキア、ベンケイソウ、ペチュニア、スミレ、ホウセンカ、ゼラニウム、キク、キンボウゲ、フクシア、サルビア、セイヨウアジサイ、ローズマリー、セージ、セントジョーンズワート、ミント、シシトウガラシ、トマト及びキュウリが挙げられる。

## 【0143】

本発明に係る活性成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る活性成分はさらに、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜において)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおいて)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園において)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおいて) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネにおいて) の防除に特に好適である。

20

## 【0144】

本発明に係る活性成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物におけるマメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る活性成分はさらに、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜において)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおいて)、ヒメヨコバイ (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園において)、ハムシ (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおいて) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネにおいて) の防除に特に好適である。

30

40

## 【0145】

さらなる態様において、本発明はまた、植物寄生性線虫 (内部寄生性 -、半内部寄生性 - 及び外部寄生性線虫)、特に、根こぶ線虫、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) 及び他のメロイドギネ属 (*Meloidogyne*) の種; シスト形成線虫、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及び他のグロボデラ属の一種 (*Globodera*) 種; ムギシストセンチュウ (*Heterodera ave*

50

nae)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*)、及び他のシストセンチュウ属 (*Heterodera*) の種; シードガル (*Seed gall*) 線虫、アングイナ属 (*Anguina*) の種; クキセンチュウ及びハガレセンチュウ、アフエレンコイデス属 (*Aphelenchoides*) の種; 刺毛線虫 (*sting nematode*)、ベロノライムスロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) 及び他のベロノライムス属 (*Belonolaimus*) の種; マツザイ線虫、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 及び他のブルサフェレンクス属 (*Bursaphelenchus*) の種; ワセンチュウ、クリコネマ (*Criconema*) 種、クリコネメラ (*Criconemella*) 種、クリコネモイデス (*Criconemoides*) 種、メソクリコネマ (*Mesocriconema*) 種; 茎及び鱗茎線虫、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、クキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) 及び他のジチレンクス属 (*Ditylenchus*) の種; キリセンチュウ、ドリコドルス (*Dolichodorus*) 種; ラセンセンチュウ、ヘリオコチレンクスムルチシנקツス (*Heliocotylenchus multicinctus*) 及び他のヘリコチレンクス属 (*Helicotylenchus*) の種; サヤセンチュウ及びサヤワセンチュウ (*Sheath and sheathoid nematode*)、ヘミシクリオホラ属 (*Hemicycliophora*) 種及びヘミクリコネモイデス属 (*Hemicriconemoides*) 種; ヒルスマンニエラ属 (*Hirshmanniella*) の種; ヤリセンチュウ、ホプロアイムス属 (*Hoploaimus*) の種; ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (*Nacobbus*) の種; ハリセンチュウ、ロンギドルスエロンガツス (*Longidorus elongatus*) 及び他のロンギドルス属 (*Longidorus*) の種; ピンセンチュウ、ネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus*) の種; ネグサレセンチュウ、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクスクルビタツス (*Pratylenchus curvitatatus*)、プラチレンクスグーデイイ (*Pratylenchus goodeyi*) 及び他のネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus*) の種; ネモグリセンチュウ、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 及び他のネモグリセンチュウ属 (*Radopholus*) の種; ニセフクロセンチュウ、ロチレンクスロブスツス (*Rotylenchus robustus*)、トチレンクスレニホルミス (*Rotylenchus reniformis*) 及び他のロチレンクス (*Rotylenchus*) 種; スクテロネマ属 (*Scutellonema*) の種; コミハリ線虫、トリコドルスピリミチプス (*Trichodorus primitivus*) 及び他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) の種、パラトリトリコドルス属 (*Paratrachodorus*) の種; イシュクセンチュウ、ナマイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコルヒンクスドゥビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) 及び他のチレンコルヒンクス属 (*Tylenchorhynchus*) の種; ミカンネセンチュウ、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) の種; オオハリセンチュウ、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) の種などの植物寄生性線虫; 並びに、スバングイナ属の一種 (*Subanguina spp.*)、ヒブソペリネ属の一種 (*Hypsoperine spp.*)、マクロポストニア属の一種 (*Macroposthonia spp.*)、メリニウス属の一種 (*Melinius spp.*)、プンクトデラ属の一種 (*Punctodera spp.*) 及びキノスルス属の一種 (*Quinisulcius spp.*) などの他の植物寄生性線虫種による植物及びその一部に対する損害を防止する方法に関し得る。

【0146】

本発明の化合物はまた、軟体動物に対しても活性を有し得る。その例としては、例えば

10

20

30

40

50

、スクミリンゴガイ科 (*Ampullariidae*) ; アリオン属 (*Arion*) (コウラクロナメクジ (*A. ater*)、*A. サーカムスクリプツス* (*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス* (*A. hortensis*)、*A. ルーフラス* (*A. rufus*)) ; オナジマイマイ科 (*Bradybaenidae*) (ブラジバエナフルチクム (*Bradybaena fruticum*)) ; オウシュウマイマイ属 (*Cepaea*) (ニワノオウシュウマイマイ (*C. hortensis*)、モリマイマイ (*C. Nemoralis*)) ; オクロジナ (*Ochlodina*) ; デロセラス属 (*Deroceiras*) (*D. アグレスチス* (*D. agrestis*)、*D. エムピリコルム* (*D. empiricorum*)、*D. ラエヴェ* (*D. laeve*)、*D. レチクラツム* (*D. reticulatum*)) ; ディスクス属 (*Discus*) (*D. ロツンダツス* (*D. rotundatus*)) ; ユーオムファリア属 (*Euomphalia*) ; ガルバ属 (*Galba*) (*G. トルククラタ* (*G. trunculata*)) ; ヘリセリア属 (*Helicelia*) (*H. イタラ* (*H. itala*)、*H. オブヴィア* (*H. obvia*)) ; マイマイ科 (*Helicidae*) (ヘリシゴナルブストルム (*Helicigona arbustorum*)) ; ヘリコディスクス属 (*Helicodiscus*) ; ヘリクス属 (*Helix*) (*H. アペルタ* (*H. aperta*)) ; リマックス属 (*Limax*) (*L. シネレオニゲル* (*L. cinereoniger*)、*キイロナメクジ* (*L. flavus*)、*チャコウラナメクジ* (*L. marginatus*)、*マダラコウラナメクジ* (*L. maximus*)、*L. テネルス* (*L. tenellus*)) ; モノアライガイ属 (*Lymnaea*) ; ミラックス属 (*Milax*) (ニワコウラナメクジ (*M. gagates*)、*M. マルギナツス* (*M. marginatus*)、*M. ソウエルバイ* (*M. sowerbyi*)) ; オペアス属 (*Opeas*) ; リンゴガイ属 (*Pomacea*) (スクミリンゴガイ (*P. canaticulata*)) ; ミジンマイマイ属 (*Valtonia*) 及びザニトイデス属 (*Zanitoides*) が挙げられる。

## 【0147】

「作物」という用語は、例えば、特にバチルス属の一種 (*Bacillus*) のトキシン生成性バクテリア由来の公知のものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンを合成することが可能であるようDNA組換え技術を用いて形質転換された作物植物をも含むと理解されるべきである。

## 【0148】

このような形質転換植物によって発現されることが可能であるトキシンとしては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) 又はバチルスポピリアエ (*Bacillus popilliae*) 由来の例えば殺虫性タンパク質といった殺虫性タンパク質 ; 又は、例えば *Cry1Ab*、*Cry1Ac*、*Cry1F*、*Cry1Fa2*、*Cry2Ab*、*Cry3A*、*Cry3Bb1* 若しくは *Cry9C* といった - エンドトキシンなどのバチルスチューリングェンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性タンパク質、又は、例えば *Vip1*、*Vip2*、*Vip3* 若しくは *Vip3A* といった栄養型殺虫性タンパク質 (*Vip*) ; 又は、フォトラブダスルミネセンス (*Photobabdus luminescens*)、ゼノラブダスネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などの、例えばフォトラブダス属の一種 (*Photobabdus spp.*) 若しくはゼノラブダス属の一種 (*Xenorhabdus spp.*) といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質 ; サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ (*wasp*) トキシン及び他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン ; ストレプトミセス (*Streptomyces*) トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチン又はマツユキソウレクチンなどの植物レクチン ; アグルチニン ; トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パパイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤 ; リシン、トウモロコシ - RIP、アプリン、ルフィン、サポリン又はブリオジンなどのリボソーム - 不活性化タンパク質 (RIP) ; 3 - ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド - UDP - グリコシル - トランスフェラーゼ、コレステロ

10

20

30

40

50

ールオキシダーゼ、エクジソン抑制剤、HMG - COA - レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウム又はカルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナナーゼが挙げられる。

【0149】

本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1若しくはCry9Cといった - エンドトキシン、又は、例えばVip1、Vip2、Vip3若しくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質(Vip)とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシン及び修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される(例えば、国際公開第02/15701号を参照のこと)。例えば切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、Cry3A055の場合には、カテプシン - G - 認識配列がCry3Aトキシンに挿入される(国際公開第03/018810号を参照のこと)。

10

【0150】

このようなトキシン、又は、このようなトキシンを合成可能な形質転換植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書及び国際公開第03/052073号に開示されている。

20

【0151】

このような遺伝形質転換植物の調製プロセスは、一般に当業者に公知であり、例えば上記の刊行物に記載されている。CryI - タイプデオキシリボ核酸及びこれらの調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書及び国際公開第90/13651号から公知である。

【0152】

遺伝形質転換植物中に含有されている毒素は、有害な昆虫に対する耐性を植物に対して付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれに属していてもよいが、特に、甲虫(鞘翅目)、羽を2枚有する昆虫(双翅目)、及び、ガ(鱗翅目)に通例見出される。

30

【0153】

殺虫剤耐性をコードすると共に1種以上の毒素を発現する1種以上の遺伝子を含む遺伝形質転換植物が公知であり、そのいく種かが市販されている。このような植物の例としては: YieldGard(登録商標)(Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Rootworm(登録商標)(Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Plus(登録商標)(Cry1Ab及びCry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Starlink(登録商標)(Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種); Herculex I(登録商標)(Cry1Fa2トキシン及び酵素ホスフィノトリシンN - アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現して、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するトウモロコシ品種); NuCOTN 33B(登録商標)(Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard I(登録商標)(Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard II(登録商標)(Cry1Ac及びCry2Abトキシンを発現する綿品種); VIPCOT(登録商標)(Vip3A及びCry1Abトキシンを発現する綿品種); NewLeaf(登録商標)(Cry3Aトキシンを発現するジャガイモ品種); NatureGard(登録商標) Agrisure(登録商標) GT Advantage(GA21グリホサート - 耐性形質)、Agrisure(

40

50

登録商標) CB Advantage (Bt11コーン穿孔性害虫(CB)形質)及びProtecta(登録商標)が挙げられる。

【0154】

このような遺伝子組換え作物のさらなる例は以下のとおりである。

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France製のBt11 Maize, 登録番号C/FR/96/05/10。切断型Cry1Ab毒素の遺伝形質転換発現により、アワノメイガ(ヨーロッパアワノメイガ(Ostrinia nubilalis)及びセサミアノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))による攻撃に対する耐性が付与された遺伝子組み換えトウモロコシ(Zea mays)である。Bt11トウモロコシはまた、遺伝子導入で酵素PATを発現して、グルホシネートアンモニウム除草剤に対する耐性を達成している。

10

【0155】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France製のBt176 Maize, 登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab毒素の遺伝形質転換発現により、アワノメイガ(ヨーロッパアワノメイガ(Ostrinia nubilalis)及びセサミアノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))による攻撃に耐性が付与された遺伝子組み換えトウモロコシ(Zea mays)である。Bt176トウモロコシはまた、遺伝子導入で酵素PATを発現して、グルホシネートアンモニウム除草剤に対する耐性を達成している。

20

【0156】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France製のMIR604 Maize, 登録番号C/FR/96/05/10。修飾Cry3A毒素の遺伝形質転換発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシである。この毒素は、カテプシンG-タンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾されたCry3A055である。このような遺伝形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第03/018810号に記載されている。

【0157】

4. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製のMON 863 Maize, 登録番号C/DE/02/9。MON 863は、Cry3Bb1毒素を発現し、一定の鞘翅目の昆虫に対する耐性を有している。

30

【0158】

5. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製のIPC 531 Cotton, 登録番号C/ES/96/02。

【0159】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium, 登録番号C/NL/00/10製の1507 Maize。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するためにタンパク質Cry1Fを発現すると共に、グルホシネートアンモニウム除草剤に対する耐性を達成するためにPATタンパク質を発現する遺伝子組み換えトウモロコシ。

40

【0160】

7. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium製のNK603xMON 810トウモロコシ, 登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え変種NK603及びMON810のかけ合わせによる、在来型の品種改良されたトウモロコシ交配変種からなる。NK603xMON810トウモロコシは、遺伝子導入で、除草剤Roundup(登録商標)(グリホサート含有)に対する耐性を付与するアグロバクテリ

50

ウム属の一種 (*Agrobacterium* sp.) 菌株 CP4 由来のタンパク質 CP4 EPSPS を発現し、及び、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性をもたらすバチルスチューリングエンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) に由来の Cry1Ab 毒素を発現する。

【0161】

昆虫耐性植物の遺伝子組換え作物はまた、BATS (Zentrum fuer Bio Sicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003 (<http://bats.ch>) に記載されている。

【0162】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「感染特異的タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第 0 392 225 号明細書を参照のこと) などの選択的な作用を有する抗病原性物質を合成することが可能であるよう組換え DNA 技術を用いて形質転換された作物植物をも含むと理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成可能である形質転換植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第 0 392 225 号明細書、国際公開第 95/33818 号及び欧州特許出願公開第 0 353 191 号明細書から公知である。このような形質転換植物を製造する方法は一般に当業者に公知であると共に、例えば、上記の公報に記載されている。

【0163】

作物はまた、真菌 (例えば、フザリウム属 (*Fusarium*)、炭疽病菌又はフィトフトラ属 (*Phytophthora*) )、細菌 (例えばシュードモナス属 (*Pseudomonas*) ) 又はウイルス性 (例えばジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊疽ウイルス、キュウリモザイクウイルス) 病原体に対する耐性を高めるために改良されている。

【0164】

作物はまた、ダイズシスト線虫などの線虫に対する高い抵抗性を有するものを含む。

【0165】

非生物ストレスに耐性である作物は、例えば NF-YB 又は技術分野において公知である他のタンパク質の発現により、干ばつ、高塩分、高温、低温、霜又は光線に対する高い耐性を有するものを含む。

【0166】

このような形質転換植物によって発現可能である抗病原性物質としては、例えば、例えばウイルス性 KP1、KP4 又は KP6 トキシンといったナトリウム及びカルシウムチャネルの遮断剤などのイオンチャネル遮断剤；スチルベンシンターゼ；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる「感染特異的タンパク質」(PRP；例えば欧州特許出願公開第 0 392 225 号明細書を参照のこと)；例えばペプチド抗生物質若しくは複素環式抗生物質といった微生物によって産生される抗病原性物質 (例えば、国際公開第 95/33818 号を参照のこと)、又は、植物病原体防御に關与するタンパク質又はポリペプチド因子 (いわゆる、国際公開第 03/000906 号に記載の「植物病害抵抗性遺伝子」) が挙げられる。

【0167】

本発明の組成物のさらなる使用分野は、貯蔵した物品及び貯蔵室の環境の保護、並びに、木材、生地、床材若しくは建築物などの原料の保護、並びに、特に、上記の種類の有害生物に対するヒト、家畜及び繁殖家畜の保護といった衛生分野である。

【0168】

本発明はまた、有害生物 (蚊及び他の病原媒介者など；また、[http://www.who.int/malaria/vector\\_control/irs/en/](http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/) を参照のこと) を防除する方法を提供する。一実施形態においては、有害生物を防除する方法は、標的有害生物に、その生息地に、又は、表面若しくは基材に、ブラシ、ローラ、吹付け、塗布又は浸漬によって本発明に係る組成物を適用するステップを含む。一例として、

10

20

30

40

50

壁、天井又は床面などの表面のIRS（屋内残留噴霧）適用が本発明の方法により想定されている。他の実施形態においては、このような組成物を、網、衣類、寝具、カーテン及びテントの（又はこれらの製造に用いられることが可能である）形態の不織布又は布材料などの基材に適用することが想定されている。

【0169】

一実施形態において、このような有害生物を防除する方法は、効果的な残存性の有害生物防除活性が表面若しくは基材にもたらされるよう、標的有害生物、その生息地、又は、表面若しくは基材に、殺有害生物的に有効な量の本発明に係る組成物を適用するステップを含む。このような適用は、本発明の有害生物防除組成物をブラシ、ローラ、吹付け、塗布又は浸漬することにより達成され得る。一例として、効果的な残存性の有害生物防除活性が表面上にもたらされるよう、壁、天井又は床面などの表面へのIRS適用が本発明の方法により想定されている。他の実施形態においては、網、衣類、寝具、カーテン及びテントの（又はこれらの製造に用いられることが可能である）形態の布材料などの基材における有害生物の残存性防除のためのこのような組成物の適用が想定されている。

10

【0170】

不織布、布又は網を含む処理されるべき基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布若しくはウールなどの天然繊維、又は、ポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成繊維等よりなるものであり得る。ポリエステルが特に好適である。生地処理方法は、例えば国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005/113886号又は国際公開第2007/090739号において公知である。

20

【0171】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、すべての観賞用樹木、並びに、すべての種類の果実及び堅果の成る木に対する樹幹注入/幹処理の分野である。

【0172】

樹幹注入/幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（Lepidoptera）の木喰虫、及び、鞘翅目（Coleoptera）の木喰虫に対して特に好適であり、特に、以下の表A及びBに列挙されているウッドボラー（woodborer）に対して好適である。

30

【0173】

表A. 経済的に重要な外来ウッドボラーの例。

【表2】

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アオナガタマムシ ( <i>Agrilus planipennis</i> )	セイヨウトネリコ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	アノプルラグラブリペンニス ( <i>Anoplura glabripennis</i> )	広葉樹
キクイムシ科 (Scolytidae)	サクキクイムシ ( <i>Xylosandrus crassiusculus</i> )	広葉樹
	クスノオオキクイムシ ( <i>X. mutilatus</i> )	広葉樹
	マツノキクイムシ ( <i>Tomicus piniperda</i> )	針葉樹

40

50

【 0 1 7 4 】

表B. 経済的に重要な自生ウッドボラーの例。

【表 3 - 1】

科	種	寄生される宿主又は作物
タ マ ム シ 科 (Buprestidae)	アグリルスアンキシウス ( <i>Agrilus anxius</i> )	カバノキ
	アグリルスポリツス ( <i>Agrilus politus</i> )	ヤナギ、カエデ
	アグリルスサイ ( <i>Agrilus sayi</i> )	ヤマモモ、オシダ
	アグリルスビッタチコリス ( <i>Agrilus vittaticollis</i> )	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、ナナカマドの実、サンザシ
	クリソボトリスフェモラタ ( <i>Chrysobothris femorata</i> )	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバカエデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニレ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ローワン、オーク、ペカン、セイヨウナシ、モモ、カキ、セイヨウスモモ、ポプラ、マルメロ、アメリカハナズオウ、ナナカマドの実、スズカケノキ、クルミ、ヤナギ
テキサニアカンペストリス ( <i>Texania campestris</i> )	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、スズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ	
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	ゴエスプルベルレンツス ( <i>Goes pulverulentus</i> )	ブナ、ニレ、ナッターール (Nuttall)、ヤナギ、ブラックオーク (black oak)、アメリカキレハガシワ (Cherrybark oak)、ミズナラ、スズカケノキ

10

20

30

40

50

【表 3 - 2】

	ゴエスチグリヌス ( <i>Goes tigrinus</i> )	オーク	
	ネオクリツスアクミナツス ( <i>Neoclytus acuminatus</i> )	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オーク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、イースタンホップホーンビーン (Eastern hophornbeam)、ハナミズキ、カキ、アメリカハナズオウ、セイヨウヒイラギ、エノキ、黒色イナゴ、アメリカサイカチ、ユリノキ、クリ、オーセージオレンジ、サッサfras、ライラック、マウンテンマホガニー、セイヨウナシ、サクランボ、セイヨウスモモ、モモ、リンゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ	10
	ネオプチコデストリリネツス ( <i>Neoptychodes trilineatus</i> )	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、ネタリーフハックベリー (Netleaf hackberry)	
	オベレアオセラータ ( <i>Oberea ocellata</i> )	ヌルデ、リンゴ、モモ、セイヨウスモモ、セイヨウナシ、スグリ、セイヨウヤブイチゴ	20
	オベレアトリプンクタータ ( <i>Oberea tripunctata</i> )	ハナミズキ、ガマズミ属 ( <i>Viburnum</i> )、ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、ツツジ属 ( <i>Rhododendron</i> )、アザレア、月桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ	
	オンシデレスシングラータ ( <i>Oncideres cingulata</i> )	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワーウッド、シナノキ、アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属、オーク、エノキ、カエデ、果樹	
	サベルダカルカラタ ( <i>Saperda calcarata</i> )	ポプラ	30
	ストロフィオナニテンス ( <i>Strophiona nitens</i> )	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ	
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルスコロンビアヌス ( <i>Corthylus columbianus</i> )	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ	
	デンドロクトヌスフロンタリス ( <i>Dendroctonus frontalis</i> )	マツ	
	ドリオコエテスベツラエ ( <i>Dryocoetes betulae</i> )	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ	40

10

20

30

40

50

【表 3 - 3】

	モナルトルムファスシアツム ( <i>Monarthrum fasciatum</i> )	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、 モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプ ラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、 モモ、マツ	
	フロエオトリブスリミナリス ( <i>Phloeotribus liminaris</i> )	モモ、サクランボ、セイヨウスモ モ、アメリカザクラ、ニレ、クワ、 ローワン	10
	シュードピチオフトルスプル イ ノ ス ス ( <i>Pseudopityophthorus pruinusus</i> )	オーク、アメリカブナ、アメリカ ザクラ、チックソープラム (Chickasaw plum)、クリ、カエデ、 ヒッコリー、クマシデ、アサダ	
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネシムランス ( <i>Paranthrene simulans</i> )	オーク、アメリカグリ	
	サンニナウロセリフォルミス ( <i>Sannina uroceriformis</i> )	カキ	20
	シナンテドンエキシチオサ ( <i>Synanthedon exitiosa</i> )	モモ、セイヨウスモモ、ネクタリ ン、サクランボ、アンズ、アーモ ンド、アメリカザクラ	
	シナンテドンピクチペス ( <i>Synanthedon pictipes</i> )	モモ、セイヨウスモモ、サクラン ボ、ブナ、アメリカザクラ	
	シナンテドンルブロファスシ ア ( <i>Synanthedon rubrofascia</i> )	アメリカヌマミズキ	30
	シナンテドンシツラ ( <i>Synanthedon scitula</i> )	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、 オーク、クリ、ブナ、カバノキ、 アメリカザクラ、ニレ、ローワン、 ガマズミ属 ( <i>Viburnum</i> )、ヤナギ、 リンゴ、ビワ、フィソカルプス、 ヤマモモ	
	ピタセアポリスチフォルミス ( <i>Vitacea polistiformis</i> )	ブドウ	40

## 【0175】

本発明はまた、例えば甲虫、イモ虫、アカカミアリ、グラウンドパール (ground pearl)、ヤスデ、ワラジムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、イボタムシ、マダニ類、アワフキ、サウザンチンチバグ及びホワイトグラブ (white grub) を含む、芝草に存在し得るいずれかの病害虫の防除に用いられ得る。本発明は、卵、幼虫、若虫及び成虫を含む、ライフサイクルにおける種々の段階の病害虫の防除に用いられ得る。

## 【0176】

特に、本発明は、ホワイトグラブ (white grub) (シクロセファラ属の一種 (*Cyclocephala* spp.)) (例えばスジコガネモドキ (masked ch

10

20

30

40

50

afer)、C.ルリダ(C.lurida))、リゾトログス属の一種(Rhizotrogus spp.) (例えばヨーロッパコガネムシ(European chaffer)、R.マヤリス(R.majalis))、コチヌス属の一種(Cotinus spp.) (例えばグリーンジュンビートル、C.ニチダ(C.nitida))、ポピリア属の一種(Popillia spp.) (例えばマメコガネ(マメコガネ(P.japonica))、フィロファーガ属の一種(Phyllophaga spp.) (例えばメイノジュンビートル)、アテニウス属の一種(Ataenius spp.) (例えばブラックターフグラスアテニウス、A.スプレツルス(A.spretulus))、マラデラ属の一種(Maladera spp.) (例えばアジアングーデンビートル、M.カスタネア(M.castanea))及びトマルス属の一種(Tomarus spp.)など)、グラウンドパール(ground pearl)(マルガロデス属の一種(Margarodes spp.))、ケラ(タウニー(tawny)、サザン(southern)及びショートウィング(short-winged);スカプテリスクス属の一種(Scapteriscus spp.))、ケラ(Gryllotalpa africana))及びレザージャケット(leather jacket)(ヨーロッパクレーンフライ(European crane fly)、ガガンボ属の一種(Tipula spp.))を含む芝草の根を摂食する病害虫の防除に用いられ得る。

【0177】

本発明はまた、ヨトウムシ(ツマジロクサヨトウ(スポドプテラフルギベルダ(Spodoptera frugiperda))及び一般的なヨトウムシ(シューダレチアウニプンクタ(Pseudaletia unipuncta))など)、ヨトウムシ、ゾウムシ(S.ベナツスベルスティツス(S.venatus verstitus)及びS.パルブルス(S.parvulus)などのスフェノフォラス属の一種(Sphenophorus spp.))、及び、クロオビクロノメイガ(クラムバス属の一種(Crambus spp.))及び熱帯性のクロオビクロノメイガ(ケナシクロオビクロノメイガ(Herpetogramma phaeopteralis))などを含む、サッチに生息する(thatch dwelling)芝草の病害虫の防除に用いられ得る。

【0178】

本発明はまた、ナガカメムシ(サウザンチンチバグ、ブリススインスラリス(Blissus insularis)など)、ギョウギシバダニ(エリオフィエスシノドニエンシス(Eriophyes cynodoniensis))、ローデスグラスミアリーバグ(rhodesgrass mealybug)(チガヤシロオカイガラムシ(Antonina graminis))、ツーラインドスピットルバグ(two-lined spittlebug)(プロプサピアビシンクタ(Propopsia bicincta))、リーフホッパー、ヨトウムシ(ヤガ科)及びムギミドリアブラムシを含む、地上に生息して芝草の葉を摂食する芝草の病害虫の防除に用いられ得る。

【0179】

本発明はまた、芝生にアリ塚を作るヒアリ(ヒアリ(Solenopsis invicta))などの芝草の他の有害生物の防除に用いられ得る。

【0180】

衛生分野において、本発明の組成物は、カタダニ、ヒメダニ、キュウセンヒダニ、ツツガムシ、ハエ(刺咬性及び非刺咬性)、寄生性ハエ幼虫、シラミ、毛シラミ、ハジラミ、及び、ノミなどの外寄生生物に対して有効である。

【0181】

このような寄生虫の例は以下のとおりである。

シラミ目(Anoplurida)のうち:ブタジラミ属の一種(Haematopinus spp.)、シラミ属の一種(Linognathus spp.)、ペディクルス属の一種(Pediculus spp.)及びフチルス属の一種(Phtirus spp.)、ソレノポテス属の一種(Solenopotes spp.)。

【0182】

10

20

30

40

50

ハジラミ目 (Mallophagida) のうち: トリメノボン属の一種 (Trimenopon spp.)、タンカクハジラミ属の一種 (Menopon spp.)、トリノトン属の一種 (Trinoton spp.)、ボビコーラ属の一種 (Bovicola spp.)、ウェルネキエラ属の一種 (Werneckiella spp.)、レピケントロン属の一種 (Lepikentron spp.)、ダマリナ属の一種 (Damarlina spp.)、ケモノハジラミ属の一種 (Trichodectes spp.) 及びフェリコラ属の一種 (Felicola spp.)。

## 【0183】

双翅目 (Diptera)、並びに、長角亜目 (Nematocera) 及び単角亜目 (Brachycerina) のうち、例えばヤブカ属の一種 (Aedes spp.)、ハマダラカ属の一種 (Anopheles spp.)、イエカ属の一種 (Culex spp.)、ブユ属の一種 (Simulium spp.)、エウシムリウム属の一種 (Eusimulium spp.)、サシチヨウバエ属の一種 (Phlebotomus spp.)、ルツオミヤ属の一種 (Lutzomyia spp.)、キュリコイデス属の一種 (Culicoides spp.)、メクラアブ属の一種 (Chrysops spp.)、キボシアブ属の一種 (Hybomitra spp.)、アチロータス属の一種 (Atylotus spp.)、アブ属の一種 (Tabanus spp.)、ゴマフアブ属の一種 (Haematopota spp.)、フィリポミア属の一種 (Philipomyia spp.)、ブラウラ属の一種 (Braulia spp.)、イエバエ属の一種 (Musca spp.)、トゲアシメマトイ属の一種 (Hydrotaea spp.)、サシバエ属の一種 (Stomoxys spp.)、ハエマトピア属の一種 (Haematobia spp.)、モレリア属の一種 (Morellia spp.)、ヒメイエバエ属の一種 (Fannia spp.)、ツエツエバエ属の一種 (Glossina spp.)、オオクロバエ属の一種 (Calliphora spp.)、キンバエ属の一種 (Lucilia spp.)、オビキンバエ属の一種 (Chrysomyia spp.)、ヴォールファールトニクバエ属の一種 (Wohlfahrtia spp.)、サルコファガ属の一種 (Sarcophaga spp.)、ヒツジバエ属の一種 (Oestrus spp.)、ウシバエ属の一種 (Hypoderma spp.)、ウマバエ属の一種 (Gasterophilus spp.)、シラミバエ属の一種 (Hippoboscidae spp.)、リポプテナ属の一種 (Lipoptena spp.) 及びヒツジシラミバエ属の一種 (Melophagus spp.)。

## 【0184】

ノミ目 (Siphonapterida) のうち、例えばヒトノミ属の一種 (Pulex spp.)、イヌノミ属の一種 (Ctenocephalides spp.)、ネズミノミ属の一種 (Xenopsylla spp.)、ナガノミ属の一種 (Ceratophyllus spp.)。

## 【0185】

異翅目 (Heteroptera) のうち、例えばトコジラミ属の一種 (Cimex spp.)、トリアトマ属の一種 (Triatoma spp.)、ロドニウス属の一種 (Rhodnius spp.)、アカモンサシガメ属の一種 (Panstrongylus spp.)。

## 【0186】

ゴキブリ目 (Blattarida) のうち、例えばトウヨウゴキブリ (Blattella orientalis)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、チャバネゴキブリ (Blattella germanica) 及びスペラ属の一種 (Supella spp.)。

## 【0187】

ダニ亜類 (Acaria) (コナダニ科 (Acarida)) 並びにマダニ亜目 (Metastigmata) 及び中気門亜目 (Mesostigmata) のうち、例えばナガヒメダニ属の一種 (Argas spp.)、カズキダニ属の一種 (Ornithod

10

20

30

40

50

orus spp.）、オトビウス属の一種 (Otobius spp.)、マダニ属の一種 (Ixodes spp.)、アンブリオンマ属の一種 (Amblyomma spp.)、ブーフラス属の一種 (Boophilus spp.)、カクマダニ属の一種 (Dermacentor spp.)、チマダニ属の一種 (Haemophysalis spp.)、イボマダニ属の一種 (Hyalomma spp.)、コイタマダニ属の一種 (Rhipicephalus spp.)、デルマニッスス属の一種 (Dermanyssus spp.)、ライリエチア属の一種 (Raillietia spp.)、ニューモニサス属の一種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属の一種 (Sternostoma spp.) 及びバロア属の一種 (Varroa spp.)。

【0188】

ケダニ亜目 (Actinedida) (前気門類 (Prostigmata)) 及びコナダニ亜目 (Acaridida) (コナダニ亜目 (Astigmata)) のうち、例えばアカラピス属の一種 (Acarapis spp.)、ツメダニ属の一種 (Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア属の一種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオビア属の一種 (Myobia spp.)、ヒツジツメダニ属の一種 (Psorergates spp.)、ニキビダニ属の一種 (Demodex spp.)、ツツガムシ属の一種 (Trombicula spp.)、リストロホルス属の一種 (Listrophorus spp.)、アカルス属の一種 (Acarus spp.)、ケナガコナダニ属の一種 (Tyrophagus spp.)、ゴミコナダニ属の一種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス属の一種 (Hypodectes spp.)、プテロリクス属の一種 (Pterolichus spp.)、キュウセンヒゼンダニ属の一種 (Psoroptes spp.)、ショクヒヒゼンダニ属の一種 (Chorioptes spp.)、ミミヒゼンダニ属の一種 (Otodectes spp.)、サルコプテス属の一種 (Sarcoptes spp.)、ノトエドレス属の一種 (Notoedres spp.)、クネミドコプテス属の一種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス属の一種 (Cytodites spp.) 及びラミノシオプテス属の一種 (Laminosioptes spp.)。

【0189】

本発明の組成物はまた、木材、生地、プラスチック、接着剤、糊、塗料、紙及び厚紙、皮革、床材、並びに、建材などの材料の場合にも、昆虫外寄生に対する保護に好適である。

【0190】

本発明による組成物は、例えば、以下の有害生物に対して用いられることが可能である：ヨーロッパイエカミキリ (Hylotrupes bajulus)、クロロホルスピロシス (Chlorophorus pilosis)、アノビウムプンクタツム (Anobium punctatum)、クセストビウムルホピロスム (Xestobium rufovillosum)、プチリヌスペクチコルニス (Ptilinuspecticornis)、デンドロビウムペルチネクス (Dendrobium pertinex)、マツザイシバンムシ (Ernobius mollis)、オオナガシバンムシ (Priobium carpini)、ヒラタキクイムシ (Lyctus brunneus)、アフリカヒラタキクイムシ (Lyctus africanus)、アメリカヒラタキクイムシ (Lyctus planicollis)、ナラヒラタキクイムシ (Lyctus linearis)、リクツスプベセンス (Lyctus pubescens)、トロゴキシロンアエクアレ (Trogoxylon aequale)、ミンテスルギコリス (Minthesrugicollis)、キシルボルス種 (Xyleborus spec.)、トリプトデンドロン種 (Tryptodendron spec.)、アパテモナクス (Apate monachus)、ボストリクスカプシンス (Bostrychus capucins)、ヘテロボストリクスブルンネウス (Heterobostrychus brunneus)、シノキシロン種 (Sinoxylon spec.) 及びチビタケナガシクイムシ (Dinoderus minutus) などの甲虫；並びに、コルリキバチ (Sirex juvenicus)、モミノオオキバチ (Ur

10

20

30

40

50

ocerus gigas)、ウロセルスギガスタイグヌス(Urocerus gigas taignus)及びウロセルスアウグル(Urocerus augur)などの膜翅類;並びに、カロテルメスフラヴィコリス(Kaloterme flavicollis)、ニシインドカンザイシロアリ(Cryptotermes brevis)、ヘテロテルメスインディコラ(Heterotermes indicola)、キアシシロアリ(Reticulitermes flavipes)、レティクリテルメスサントネンシス(Reticulitermes santonensis)、レティキュリテルメスルシフグス(Reticulitermes lucifugus)、ムカシシロアリ(Mastotermes darwiniensis)、ネバダオオシロアリ(Zootermopsis nevadensis)及びイエシロアリ(Coptotermes formosanus)などのシロアリ;並びに、セイヨウシミ(Lepisma saccharina)などのシミ類。

10

## 【0191】

本発明に係る化合物は未変性の形態で殺有害生物剤として使用可能であるが、これらは一般に、キャリア、溶剤及び表面活性物質などの配合補助剤を用いる種々の方法で組成物に配合される。配合物は、種々の物理的形態、例えば散粉剤、ゲル、水和剤、水分散性顆粒、水分散性錠剤、発泡性ベレット、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、水中油型エマルジョン、油フロアブル、水性分散体、油性分散体、サスポエマルジョン、カプセル懸濁液、乳化性顆粒、可溶性液体、水溶性濃縮物(+キャリアとして水又は水和性の有機溶剤)、含浸ポリマーフィルム of 形態、又は、例えば Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010) から公知である他の形態であることが可能である。このような配合物は、そのまま、又は、事前に希釈して用いることが可能である。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量元素、生物学的生体、油又は溶剤で行うことが可能である。

20

## 【0192】

配合物は、例えば、微小固形分、顆粒、溶液、分散体又はエマルジョンの形態で組成物を得るために活性成分と配合補助剤とを混合することにより調製可能である。活性成分はまた、微小固形分、鉱油、植物性油若しくは動物性油、植物性変性油若しくは動物性変性油、有機溶剤、水、表面活性物質又はこれらの組み合わせなどの他の補助剤と配合することが可能である。

30

## 【0193】

活性成分はまた、きわめて微小なマイクロカプセル中に含まれることが可能である。マイクロカプセルは、多孔性キャリア中に活性成分を含有する。これにより、活性成分を制御された量(例えば緩効性)で環境中に放出させることが可能である。マイクロカプセルは通常、0.1~500ミクロンの直径を有する。これらは、カプセル重量の約25~95重量%の量で活性成分を含有する。活性成分は、一塊の固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微小な粒子の形態、又は、好適な溶液の形態であることが可能である。封入メンブレンは、例えば、天然若しくは合成ゴム、セルロース、スチレン/ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリアエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン若しくは化学変性ポリマー及びデンブンザンデート、又は、当業者に公知である他のポリマーを含んでいることが可能である。或いは、きわめて微小なマイクロカプセルは、基剤の固体マトリックス中に微小粒子の形態で活性成分を含むよう形成されていることが可能であるが、マイクロカプセル自体はカプセルに封入されていない。

40

## 【0194】

本発明に係る組成物の調製に好適である配合補助剤は、それ自体公知である。液体キャリアとしては、以下が用いられ得る:水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、ブチレンカーボネート、クロロベンゼン、シクロ

50

ヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1, 2 - ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p - ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、アビエチン酸ジエチレングリコール、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N, N - ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1, 4 - ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキトール、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2 - エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1, 1, 1 - トリクロロエタン、2 - ヘプタノン、 $\alpha$  - ピネン、d - リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 $\gamma$  - ブチロラクトン、グリセロール、グリセロールアセテート、グリセロールジアセテート、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m - キシレン、n - ヘキサン、n - オクチルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o - キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、プロピル乳酸塩、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p - キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、及び、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N - メチル - 2 - ピロリドン等などの高分子量アルコール。

#### 【0195】

好適な固体キャリアは、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、石灰岩、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿実殻、コムギ粉、ダイズ粉、軽石、木粉、粉碎したクルミ殻、リグニン及び同様の物質である。

#### 【0196】

多数の表面活性物質は、固体及び液体配合物の両方で、特に使用前にキャリアで希釈可能である配合物で有利に用いることが可能である。表面活性物質はアニオン性、カチオン性、ノニオン性又は高分子であり得、これらは、乳化剤、湿潤剤若しくは懸濁剤として、又は、他の目的のために使用可能である。典型的な表面活性物質としては、例えば、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸の塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリールスルホン酸の塩；ノニルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノール/アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなどのアルコール/アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどのセッケン；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルフォネートの塩；ナトリウムジ(2 - エチルヘキシル)スルホコハク酸などのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレアートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなどの第四級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びに、モノ - 及びジ - アルキルリン酸エステルの塩；並びに、例えば McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridge wood New Jersey (1981) に記載されているさらなる物質が挙げられる。

#### 【0197】

殺有害生物配合物において使用可能であるさらなる補助剤としては、結晶化阻害剤、粘

10

20

30

40

50

度変性剤、懸濁剤、染料、抗酸化剤、発泡剤、吸光剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和又はpH-変性物質及び緩衝剤、腐食阻害剤、芳香剤、湿潤剤、吸収促進剤(take-up enhancers)、微量元素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤、並びに、液体及び固体肥料が挙げられる。

【0198】

本発明に係る組成物は、植物性若しくは動物性の油、鉱油、このような油のアルキルエステル、又は、このような油と油誘導体との混合物を含む添加剤を含んでいることが可能である。本発明に係る組成物中における油添加剤の量は一般に、適用される混合物を基準として0.01~10%である。例えば、油添加剤は、噴霧混合物を調製した後に所望される濃度で噴霧タンクに加えることが可能である。好ましい油添加剤は、鉱油、又は、例えばナタネ油、オリーブ油若しくはヒマワリ油といった植物性油、乳化植物油、植物性油のアルキルエステル、例えばメチル誘導体、又は、魚油若しくは牛脂などの動物性油を含む。好ましい油添加剤は、C<sub>8</sub>~C<sub>22</sub>脂肪酸のアルキルエステル、特に、C<sub>12</sub>~C<sub>18</sub>脂肪酸のメチル誘導体、例えばラウリン酸、パルミチン酸及びオレイン酸のメチルエステル(それぞれ、ラウリン酸メチル、パルミチン酸メチル及びオレイン酸メチル)を含む。多くの油誘導体が、Compendium of Herbicide Adjuvants, 10<sup>th</sup> Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

10

【0199】

本発明の組成物は一般に、本発明の化合物を0.1~99重量%、特に0.1~95重量%含み、及び、1~99.9重量%の配合補助剤を含み、これは好ましくは、0~25重量%の表面活性物質を含む。市販の生成物は濃縮物として配合されていることが好ましい一方で、エンドユーザーは通常、希釈配合物を利用することとなる。

20

【0200】

適用量は広い範囲内で様々であり得、土壌の性質、適用方法、作物植物、防除されるべき有害生物、主な気象条件、及び、適用方法によって左右される他の要因、適用時期、並びに、標的作物に応じ得る。一般的なガイドラインとして、化合物は、1~2000l/ha、特に10~1000l/haの量で適用され得る。

【0201】

好ましい配合物は、以下の組成を有していることが可能である(重量%)。

30

【0202】

乳化性濃縮物：

活性成分：1~95%、好ましくは60~90%

表面-活性薬剤：1~30%、好ましくは5~20%

液体キャリア：1~80%、好ましくは1~35%

【0203】

粉剤：

活性成分：0.1~10%、好ましくは0.1~5%

固体キャリア：99.9~90%、好ましくは99.9~99%

【0204】

懸濁液濃縮物：

活性成分：5~75%、好ましくは10~50%

水：94~24%、好ましくは88~30%

表面-活性薬剤：1~40%、好ましくは2~30%

【0205】

水和剤：

活性成分：0.5~90%、好ましくは1~80%

表面-活性薬剤：0.5~20%、好ましくは1~15%

固体キャリア：5~95%、好ましくは15~90%

【0206】

40

50

顆粒：

活性成分：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固体キャリア：99.5～70%、好ましくは97～85%

【実施例】

【0207】

以下の実施例は本発明をさらに例示するものであって、限定するものではない。

【0208】

【表4】

水和剤	a)	b)	c)
活性成分	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	—
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	—	5 %
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	—	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7～8 molのエチレンオキシド)	—	2 %	—
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

10

20

【0209】

組み合わせたものを補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミルで十分に粉砕することで水和剤が得られ、これを、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である。

【0210】

【表5】

乾燥種子処理用粉末	a)	b)	c)
活性成分	25 %	50 %	75 %
軽質鉱油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	—
カオリン	65 %	40 %	—
タルカム	—	—	20 %

30

【0211】

組み合わせたものを補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミルで十分に粉砕することで粉末が得られ、これを、種子処理にそのまま用いることが可能である。

【0212】

40

50

【表 6】

乳化性濃縮物	
活性成分	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4 ～5 molのエチレンオキシド)	3 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %
ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35 molのエチレンオキ シド)	4 %
シクロヘキサノン	30 %
キシレン混合物	50 %

10

## 【0213】

植物の保護に使用可能であるいずれかの要求される希釈率のエマルジョンは、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。

## 【0214】

【表 7】

粉剤	a)	b)	c)
活性成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	—	—
カオリン	—	94 %	—
無機充填材	—	—	96 %

20

## 【0215】

すぐに使用可能な粉剤は、組み合わせたものをキャリアと混合し、混合物を好適なミルで粉砕することにより得られる。このような粉末はまた、種子の乾燥粉衣に使用可能である。

30

## 【0216】

【表 8】

押出し顆粒	
活性成分	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

40

## 【0217】

組み合わせたものを補助剤と混合及び粉砕し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

## 【0218】

50

【表 9】

コーティングされた顆粒	
活性成分	8 %
ポリエチレングリコール(mol. wt. 200)	3 %
カオリン	89 %

## 【0219】

細かく粉砕した組み合わせたものを、ミキサ中でポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。非粉衣顆粒はこのようにして得られる。

10

## 【0220】

懸濁液濃縮物

【表 10】

活性成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15 molのエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコン油(75 %水中エマルジョンの形態)	1 %
水	32 %

20

## 【0221】

細かく粉砕した組み合わせたものを補助剤と密に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することにより、これからいずれかの所望される希釈率の懸濁液を得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬によって、生きている植物並びに植物繁殖材料(plant propagation material)を処置し、及び、微生物による外寄生から保護することが可能である。

30

## 【0222】

種子処理用流動性濃縮物

【表 11】

活性成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノールPO/EO	2 %
10~20モルのEOを伴うトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(20%水溶液の形態)	0.5 %
モノアゾ顔料カルシウム塩	5 %
シリコン油(75 %水中エマルジョンの形態)	0.2 %
水	45.3 %

40

## 【0223】

細かく粉砕した組み合わせたものを補助剤と密に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することにより、これからいずれかの所望される希釈率の懸濁液を得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬によって、生きている植物並びに植物繁殖材料を処置し、及び、微生物による外寄生から保護することが可能で

50

ある。

【0224】

緩効性カプセル懸濁液

28部の組み合わせたものを、2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート混合物(8:1)と混合する。この混合物を、所望の粒径が達成されるまで、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中において乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られたカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の活性成分を含有している。媒体カプセルの直径は8~15ミクロンである。得られる配合物を、目的に好適な装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

10

【0225】

配合物タイプとしては、エマルジョン濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁液(CS)、水分散性顆粒(WG)、乳化性顆粒(EG)、エマルジョン、油中水型(EO)、エマルジョン、水中油型(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油分散体(OD)、油混和性のフロアブル(OF)、油混和性の液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、可溶性顆粒(SG)、又は、農学的に許容可能な補助剤との組み合わせでいずれかの技術的に好ましい配合物が挙げられる。

20

【0226】

調製例：

「Mp」は、融点( )を意味する。フリーラジカルは、メチル基を表す。<sup>1</sup>H NMR測定をBruker 400MHz分光計で記録し、化学シフトをTMS標準を基準としてppmで示す。示されるように、スペクトルを重水素化溶媒中で測定した。以下のLCMS法のいずれか一方を用いて化合物を特徴付けた。各化合物について得られた特徴付けのためのLCMS値は、保持時間(「Rt」、分単位で記録)及び分子イオン測定値(M+H)<sup>+</sup>又は(M-H)<sup>-</sup>であった。

30

【0227】

LCMS方法：

方法1：標準1

スペクトルを、エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン及び陰イオン、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30V、抽出器：2.00V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：50l/h、脱溶剤ガス流：650l/h、質量範囲：100~900Da)及びWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計(SQD、SQDIIシングル四重極型質量分析計)及びELSD検出器で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8µm、30×2.1mm、温度：60、DAD波長範囲(nm)：210~500、溶剤勾配：A=水+5%MeOH+0.05%HCOOH、B=アセトニトリル+0.05%HCOOH、勾配：1.2分間で10~100%B；流量(ml/min)0.85。

40

【0228】

方法2：標準(長期)

エレクトロスプレーソース(極性：正イオン又は負イオン)、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30V、抽出器：2.00V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：50l/h、脱溶剤ガス流：650l/h、質量範囲：100~900Da)を備えるWaters製の質量分光計(SQD、SQDIIシングル四重極型質量分析計)、並びに、Waters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器及びELSD検出器でスペ

50

クトルを記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、 $1.8\ \mu\text{m}$ 、 $30 \times 2.1\ \text{mm}$ 、温度： $60^\circ\text{C}$ 、DAD波長範囲 (nm)： $210 \sim 500$ 、溶剤勾配：A = 水 +  $5\%$  MeOH +  $0.05\%$  HCOOH、B = アセトニトリル +  $0.05\%$  HCOOH、勾配：2.7分間で $10 \sim 100\%$  B；流量 ( $\text{ml}/\text{min}$ )  $0.85$ 。

## 【0229】

方法3：標準2 (長期)

エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン又は陰イオン、MS2 Scan、キャピラリ： $4.00\ \text{kV}$ 、フラグメンタ： $100\ \text{V}$ 、脱溶媒和温度： $350^\circ\text{C}$ 、ガス流量： $1\ \text{L}/\text{min}$ 、ネプライザガス： $45\ \text{psi}$ 、質量範囲： $110 \sim 1000\ \text{Da}$ ) を備える Agilent Technologies 製の質量分光計 ( $6410\ \text{Triple Quadrupole mass spectrometer}$  (三連四重極型質量分析計))、及び、Agilent 製  $1200\ \text{Series HPLC}$ ：ポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器でスペクトルを記録した。カラム：KINETEX EVO C18、 $2.6\ \mu\text{m}$ 、 $50 \times 4.6\ \text{mm}$ 、温度： $40^\circ\text{C}$ 、DAD波長範囲 (nm)： $210 \sim 400$ 、溶剤勾配：A = 水 +  $5\%$  アセトニトリル +  $0.1\%$  HCOOH、B = アセトニトリル +  $0.1\%$  HCOOH：勾配：0分間 $0\%$  B、 $100\%$  A； $0.9 \sim 1.8$ 分間 $100\%$  B；流量 ( $\text{ml}/\text{min}$ )  $1.8$ 。

## 【0230】

方法4：標準2

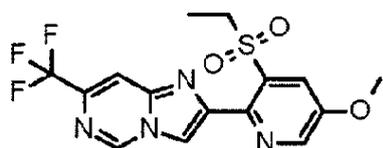
エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン又は陰イオン、完全走査、キャピラリ： $3.00\ \text{kV}$ 、コーン範囲： $41\ \text{V}$ 、ソース温度： $150^\circ\text{C}$ 、脱溶剤温度： $500^\circ\text{C}$ 、コーンガス流： $50\ \text{L}/\text{Hr}$ 、脱溶剤ガス流： $1000\ \text{L}/\text{Hr}$ 、質量範囲： $110 \sim 800\ \text{Da}$ ) を備える Waters 製の質量分光計、及び、Waters 製の H-Class UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器でスペクトルを記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3 C18、 $1.8\ \mu\text{m}$ 、 $30 \times 2.1\ \text{mm}$ 、温度： $40^\circ\text{C}$ 、DAD波長範囲 (nm)： $210 \sim 400$ 、溶剤勾配：A = 水 +  $5\%$  アセトニトリル +  $0.1\%$  HCOOH、B = アセトニトリル +  $0.1\%$  HCOOH：勾配：0分間 $10\%$  B； $0. \sim 0.2$ 分間 $10 \sim 50\%$  B； $0.2 \sim 0.7$ 分間 $50 \sim 100\%$  B；流量 ( $\text{ml}/\text{min}$ )  $0.8$ 。

## 【0231】

調製例：

実施例 H1：2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - メトキシ - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン (化合物 P9、表 P) の合成

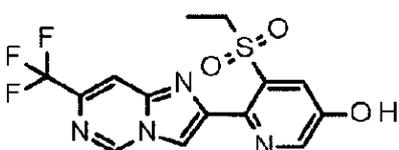
## 【化30】



(化合物P9、表P)

ステップ A：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 - 3 - オール (化合物 P10、表 P) の調製

## 【化31】



(化合物P10、表P)

10

20

30

40

50

## 方法 A

国際公開第 2016071214 号に記載のとおり調製した 2 - (5 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン (2 g、5.118 mmol) のジオキサン (15.35 mL) 中の溶液に、ビス (ピナコラート) ジボロン (1.724 g、6.653 mmol) 及び酢酸カリウム (1.256 g、12.79 mmol) を添加した。得られる懸濁液をアルゴンで 10 分間脱気し、及び [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) (ジクロロメタンとの錯体) (0.168 g、0.2048 mmol) を添加した。得られる混合物を 105 で 48 時間攪拌し、室温において水で失活させ、次いで、酢酸エチルで抽出した。有機相を水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られた粗生成物をテトラヒドロフラン (7 mL) 中に溶解し、水中の過酸化水素 35% (0.240 g、0.212 mL、2.48 mmol) をシリンジで滴下した。得られるオレンジ色の溶液を室温で 20 時間攪拌した。混合物をチオ硫酸ナトリウム及び水で失活させた。水性層を酢酸エチルで逆抽出し、組み合わせた有機相を水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、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 - 3 - オールをベージュ色の固体として得た。

融点：229 ~ 232

LCMS：(方法 標準) rt 0.55 min (MH<sup>+</sup> = 373)

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO - d<sub>6</sub>) ppm 1.24 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 4.07 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 7.84 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.33 (s, 1H) 8.52 (d, J = 2.57 Hz, 1H) 8.53 (s, 1H) 9.66 (s, 1H) 10.97 - 11.25 (m, 1H)

【0232】

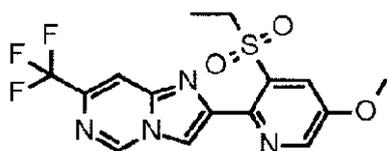
## 方法 B

Supelco バイアル中において、アルゴン雰囲気下に、DMF (2 mL) 中に溶解した 2 - (5 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン (0.25 g、0.6397 mmol) を、炭酸セシウム (0.4586 g、1.407 mmol) 及び (E) - ベンズアルデヒドオキシム (0.1007 g、0.8316 mmol) で処理した。これに、RockPhos Pd G3 (0.01609 g、0.01919 mmol) を添加し、バイアルに蓋をした。得られる混合物を 80 に 34 時間加熱した。この後の LCMS 分析は、反応の完了を示した。反応混合物を室温に冷却し、1 N HCl で pH 1 に失活させた。次いで、水性層をジクロロメタンで 3 回抽出した。数滴のメタノールを有機層に添加して、存在する沈殿物を溶解させた。次いで、組み合わせた有機層を Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、表題の化合物 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 - 3 - オールをベージュ色の固体として得た。

【0233】

ステップ B：：2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - メトキシ - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン (化合物 P9、表 P) の合成

【化 3 2】



(化合物 P9、表 P)

10

20

30

40

50

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 - 3 - オール (0.2 g, 0.4298 mmol) 及び炭酸セシウム (0.4201 g, 1.289 mmol, 0.1032 mL) のサンプルを DMF (4 mL) 中に懸濁させ、ヨードメタン (0.9455 mmol, 0.0592 mL) をシリンジで添加した。得られる茶色の懸濁液を室温で4時間攪拌した。次いで、反応混合物を NaHCO<sub>3</sub> 及び酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - メトキシ - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジンを白色の固体として得た。

10

融点 194 ~ 196

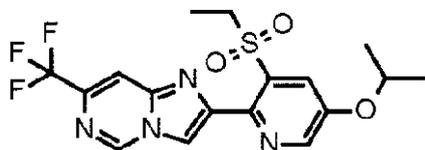
LCMS : (方法 標準) rt 0.85 min (MH<sup>+</sup> = 387)

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.39 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 3.89 (q, J = 7.58 Hz, 2H) 4.05 (s, 3H) 7.97 - 7.99 (m, 1H) 8.04 (d, J = 2.57 Hz, 1H) 8.62 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 9.18 (s, 1H)

【0234】

実施例 H2 : 2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - イソプロポキシ - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン (化合物 P7、表 P) の合成  
【化33】

20



(化合物P7, 表P)

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 - 3 - オール (0.2 g, 0.4298 mmol) 及び炭酸セシウム (0.4201 g, 1.289 mmol, 0.1032 mL) のサンプルを DMF (4 mL) 中に懸濁させ、2 - プロモプロパン (0.1163 g, 0.9455 mmol, 0.088 mL) で処理した。得られる茶色の懸濁液を 50 で 20 時間攪拌した。反応混合物を NaHCO<sub>3</sub> で失活させ、水性層を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、表題の化合物 2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - イソプロポキシ - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジンを白色の固体として得た。

30

融点 : 167 ~ 169

LCMS : (方法 標準) rt ... 0.96 min (MH<sup>+</sup> = 415) .

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.38 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.47 (d, J = 6.24 Hz, 6H) 3.87 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 4.80 (dt, J = 12.10, 6.05 Hz, 1H) 7.98 (s, 1H) 8.00 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.31 (s, 1H) 8.57 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 9.16 - 9.19 (m, 1H)

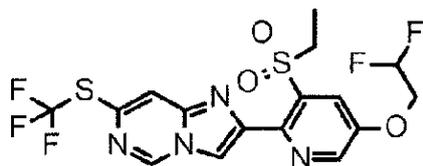
40

【0235】

実施例 H3 : 2 - [ 5 - (2,2-ジフルオロエトキシ) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル] - 7 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン (化合物 P4、表 P) の合成

50

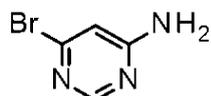
## 【化34】



(化合物P4, 表P)

ステップA：6-ブロモピリミジン-4-アミンの調製

## 【化35】



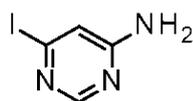
4,6-ジブロモピリミジン(9.5g、40.0mmol)の200mLのアセトニトリル中の溶液に、NH<sub>3</sub>・H<sub>2</sub>O(250mL)を添加した。混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで4回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を石油エーテル/EtOAcから再結晶化して表題の化合物を得た。

<sup>1</sup>H NMR(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) 6.58(s, 1H), 7.17(s, 2H), 8.10(s, 1H).

## 【0236】

ステップB：6-ヨードピリミジン-4-アミンの調製

## 【化36】



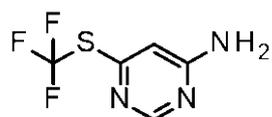
6-ブロモピリミジン-4-アミン(8.0g、46mmol)の100mLのHI中の溶液に、NaI(15.0g、100mmol)を添加した。混合物を一晩還流した。次いで、混合物をNaOH溶液でpH=10に調節し、固体を分離し、ろ過して、6-ヨードピリミジン-4-アミンを得た。

<sup>1</sup>H NMR(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) 6.85(s, 1H), 6.99(s, 2H), 7.99(s, 1H).

## 【0237】

ステップC：6-(トリフルオロメチルスルファニル)ピリミジン-4-アミンの調製

## 【化37】



6-ヨードピリミジン-4-アミン(0.22g、1mmol)の5mLのNMP中の溶液に、(bpy)CuCF<sub>3</sub>(0.64g、3mmol)を添加した。混合物を90で2時間攪拌した。次いで、混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるカラムクロマトグラフィによって精製して、表題の化合物を白色の固体として得た。

融点147~148

LCMS：(方法 標準) rt 0.63min (MH<sup>+</sup> = 196).

10

20

30

40

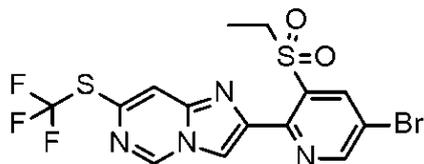
50

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ ) 6.61 (s, 1H), 7.28 (s, 2H), 8.29 (s, 1H).  $^{19}\text{F}$ -NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ ) : -37.39 (s, 3F).

【0238】

ステップD: 2-(5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジンの調製

【化38】



10

2-ブロモ-1-(5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)エタノン(国際公開第2016071214号に記載の調製)(0.194g、0.52284mmol)及び6-(トリフルオロメチルスルファニル)ピリミジン-4-アミン(0.102g、0.52284mmol)のサンプルをアセトニトリル(2mL)中に溶解し、得られる黄色がかった溶液を90℃で7.5時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、溶剤を減圧中で蒸発させた。得られる濃色の固体をジクロロメタン中にとり、有機相を、NaHCO<sub>3</sub>及びNH<sub>4</sub>OH、及び、塩水で順次に洗浄した。有機相をNa<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られる粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2-(5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジンをオフホワイトの固体として得た。

20

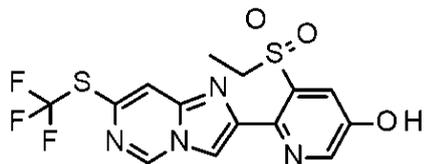
LCMS:(方法 標準)rt 1.00min(MH<sup>+</sup>=467/469)。

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ ) ppm 1.27 (t, J = 7.52 Hz, 3H) 4.16 (q, J = 7.58 Hz, 2H) 8.28 (s, 1H) 8.57 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.62 (s, 1H) 9.15 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 9.57 - 9.60 (m, 1H)

【0239】

ステップE: 5-エチルスルホニル-6-[7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-2-イル]ピリジン-3-オールの調製

【化39】



30

Supelcoバイアルに、2-(5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン(4.0708g、8.711mmol)、ビス(ピナコラート)ジボロン(2.905g、11.32mmol)、酢酸カリウム(2.159g、21.78mmol)及び1,4-ジオキサン(759.1mmol、65.33mL)を仕込んだ。得られる懸濁液をアルゴンで10分間脱気した。次いで、1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン-パラジウム(II)ジクロリドジクロロメタン錯体(0.1467g、0.1742mmol)を添加し、これを、マイクロ波システム中において130℃で1時間照射に供した。次いで、混合物を水で失活させ、酢酸エチルで5回抽出した。有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られた粗生成物(3.7g、7.2mmol)をテトラヒドロフラン(72mL)中に溶解し、過酸化水素(0.70g、

40

50

0.62 mL、7.2 mmol) をシリンジにより滴下した。得られる茶色の溶液を室温で攪拌した。15 時間後、反応混合物をチオ硫酸ナトリウム及び NH<sub>4</sub>Cl 飽和溶液で失活させた。テトラヒドロフランを蒸発により除去し、残った水性層をジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わせた有機層を Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、5 - エチルスルホニル - 6 - [ 7 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン - 2 - イル ] ピリジン - 3 - オールをオフホワイトの固体として得た。

LCMS : (方法 標準) rt 0.83 min (MH<sup>+</sup> = 405)

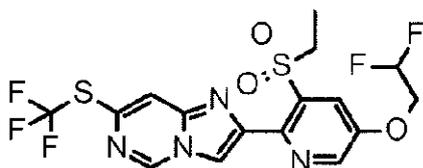
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, 溶剤) ppm 1.22 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 4.05 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 7.85 - 7.85 (m, 1H) 8.22 (d, J = 1.10 Hz, 1H) 8.44 (s, 1H) 8.50 (d, J = 2.57 Hz, 1H) 9.56 (d, J = 1.10 Hz, 1H) 11.07 (s, 1H)

10

【0240】

ステップ F : 2 - [ 5 - ( 2 , 2 - ジフルオロエトキシ ) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ] - 7 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン (化合物 P 4、表 P) の合成

【化 4 0】



(化合物P4, 表P)

20

5 - エチルスルホニル - 6 - [ 7 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン - 2 - イル ] ピリジン - 3 - オール (0.387 g、0.9570 mmol) 及び炭酸セシウム (0.780 g、2.392 mmol) のサンプルをアセトニトリル (5.27 g、128 mmol、6.699 mL) 中に懸濁させ、2, 2 - ジフルオロエチルトリフルオロメタンスルホネート (1.053 mmol、0.1430 mL) を滴下して処理した。得られる混合物を室温で 15 時間攪拌したところ、LCMS により、この時間までに反応が完了したことが示された。反応混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2 - [ 5 - ( 2 , 2 - ジフルオロエトキシ ) - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ] - 7 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジンを白色の固体として得た。

30

LCMS : (方法 標準) rt 0.95 min (MH<sup>+</sup> = 469)

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.34 - 1.40 (m, 3H) 3.89 (q, J = 7.46 Hz, 2H) 4.37 - 4.46 (m, 2H) 6.03 - 6.36 (m, 1H) 7.93 (s, 1H) 8.06 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.27 (d, J = 0.73 Hz, 1H) 8.66 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 9.09 (d, J = 1.47 Hz, 1H)

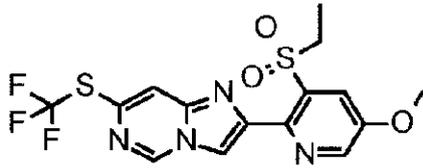
40

【0241】

実施例 H 4 : 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 5 - メトキシ - 2 - ピリジル ) - 7 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン (化合物 P 5、表 P) の合成

50

## 【化41】



(化合物P5, 表P)

5 - エチルスルホニル - 6 - [ 7 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン - 2 - イル ] ピリジン - 3 - オール ( 0 . 3 8 7 g 、 0 . 9 5 7 0 mmol ) 及び炭酸セシウム ( 0 . 9 3 5 5 g 、 2 . 8 7 1 mmol ) のサンプルを、N , N - ジメチルホルムアミド ( 9 2 . 5 mmol 、 7 . 1 7 7 mL ) 中に懸濁させた。次いで、ヨードメタン ( 2 . 1 0 5 mmol 、 0 . 1 3 2 mL ) をシリンジで添加した。得られる混合物を室温で 1 5 時間攪拌した。反応混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2 - ( 3 - エチルスルホニル - 5 - メトキシ - 2 - ピリジル ) - 7 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジンを白色の固体として得た。

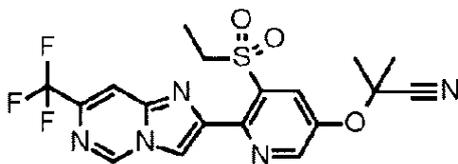
LCMS : ( 方法 標準 ) rt 0 . 9 min ( MH<sup>+</sup> = 4 2 0 )

<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 MHz , クロロホルム - d ) ppm 1 . 3 4 ( t , J = 7 . 5 2 Hz , 3 H ) 3 . 8 4 ( q , J = 7 . 3 4 Hz , 2 H ) 4 . 0 2 ( s , 3 H ) 7 . 9 1 ( s , 1 H ) 8 . 0 1 ( d , J = 2 . 9 3 Hz , 1 H ) 8 . 2 4 ( s , 1 H ) 8 . 5 9 ( d , J = 2 . 9 3 Hz , 1 H ) 9 . 0 8 ( d , J = 1 . 4 7 Hz , 1 H )

## 【0242】

実施例 H 5 : 2 - [ [ 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 ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリル ( 化合物 P 1 3 、 表 P ) の合成

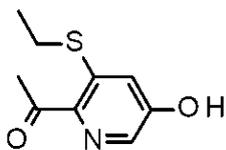
## 【化42】



(化合物P13, 表P)

ステップ A : 1 - ( 3 - エチルスルファニル - 5 - ヒドロキシ - 2 - ピリジル ) エタノンの調製

## 【化43】



1 - ( 5 - プロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) エタノン ( 2 . 5 g 、 9 . 6 mmol ) を N , N - ジメチルホルムアミド ( 1 9 mL ) 中に溶解し、炭酸セシウム ( 6 . 9 g 、 2 1 mmol ) を添加した。次いで、( E ) - ベンズアルデヒドオキシム ( 1 . 4 mL 、 1 2 mmol ) を室温で滴下した。得られる懸濁液を室温で一晩攪拌し、次いで、水及び酢酸エチルで希釈し、1 N HCl で失活させた。pH を 1 ~ 2 に調節し、水性層を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過

し、減圧中で濃縮した。粗生成物をクロマトグラフィにより精製して、1 - (3 - エチルスルファニル - 5 - ヒドロキシ - 2 - ピリジル) エタノンを得た。

LC - MS : 198 (M+H), rt : 0.70 min

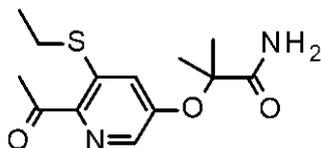
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.42 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 2.69 (s, 3H) 2.89 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 6.06 - 6.20 (m, 1H) 7.15 (d, J = 2.57 Hz, 1H) 8.05 (d, J = 2.57 Hz, 1H)

【0243】

ステップB : 2 - [(6 - アセチル - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル) オキシ] - 2 - メチル - プロパンアミドの調製

10

【化44】



1 - (3 - エチルスルファニル - 5 - ヒドロキシ - 2 - ピリジル) エタノン (4 g、20.279 mmol) をアセトニトリル (100 mL) 中に溶解した。次いで、炭酸セシウム (9.9116 g、30.418 mmol) を添加し、得られる懸濁液を5分間攪拌し、その後、2 - プロモ - 2 - メチル - プロパンアミド (5.3867 g、32.446 mmol) を添加した。室温で一晩の後、得られる混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで希釈した。水性層を酢酸エチルで3回抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して2 - [(6 - アセチル - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル) オキシ] - 2 - メチル - プロパンアミドを得、これを、次のステップにさらに精製せずに用いた。

20

LC - MS : 283 (M+H), rt : 0.77 min

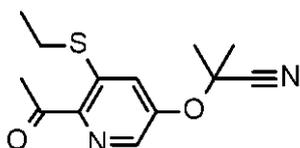
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO) ppm 1.28 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.56 (s, 6H) 2.55 (s, 3H) 2.82 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 7.15 (d, J = 2.57 Hz, 1H) 7.45 (s, 1H) 7.73 (s, 1H) 8.04 (d, J = 2.20 Hz, 1H)

30

【0244】

ステップC : 2 - [(6 - アセチル - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル) オキシ] - 2 - メチル - プロパンニトリルの調製

【化45】



40

2 - [(6 - アセチル - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル) オキシ] - 2 - メチル - プロパンアミド (0.517 g、1.098 mmol) をジクロロメタン (10.98 mL) 中に懸濁させ、トリエチルアミン (0.4491 g、0.619 mL、4.394 mmol) を添加した。混合物を0℃に冷却し、トリフルオロ酢酸無水物 (0.463 mL、3.295 mmol) を滴下した。得られる懸濁液を2時間室温で攪拌した。反応混合物をメタノール (2 mL) で注意深く失活させ、次いで、重炭酸塩溶液で注意深く失活させた (ガスが生成された)。水性層をジクロロメタンで2回抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2 - [(6 - アセチル - 5 - エチルスル

50

アニル - 3 - ピリジル) オキシ] - 2 - メチル - プロパンニトリルを得た。

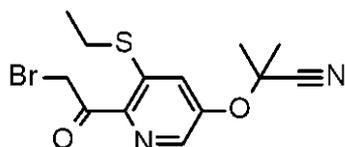
LC - MS : 265 (M+H), rt : 0.99 min

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.44 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.83 (s, 6H) 2.71 (s, 3H) 2.93 (q, J = 7.58 Hz, 2H) 7.57 (d, J = 2.57 Hz, 1H) 8.22 (d, J = 2.20 Hz, 1H)

【0245】

ステップD : 2 - [[6 - (2 - ブロモアセチル) - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル] オキシ] - 2 - メチル - プロパンニトリルの調製

【化46】



アルゴン雰囲気下において、2 - [(6 - アセチル - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル) オキシ] - 2 - メチル - プロパンニトリル (1 g, 3.784 mmol) を乾燥テトラヒドロフラン (14 mL) 中に室温で溶解した。次いで、溶液を 0 °C に冷却し、フェニルトリメチルアンモニウムペルブロミド (1.426 g, 3.784 mmol) を添加した。オレンジ色の懸濁液を 2 日間室温で攪拌した。水及び酢酸エチルを反応混合物に添加した。水性層を分離し、酢酸エチルで 3 回逆抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物 (黄色の油) を、15 mL の冷シクロヘキサン及び 1 mL のジクロロメタン中に倍散した。数分間の後、沈殿物が形成された。沈殿物をろ過し、シクロヘキサンで洗浄し、減圧下で乾燥させて、2 - [[6 - (2 - ブロモアセチル) - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル] オキシ] - 2 - メチル - プロパンニトリルを得た。

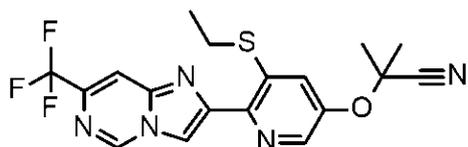
LC - MS : 345 (M+H), rt : 1.07 min

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, 溶剤) ppm 1.46 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.85 (s, 6H) 2.96 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 4.82 (s, 2H) 7.57 - 7.60 (m, 1H) 8.20 - 8.22 (m, 1H)

【0246】

ステップE : 2 - [[5 - エチルスルファニル - 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] - 3 - ピリジル] オキシ] - 2 - メチル - プロパンニトリルの調製

【化47】



2 - [[6 - (2 - ブロモアセチル) - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル] オキシ] - 2 - メチル - プロパンニトリル (0.229 g, 0.6672 mmol) 及び 6 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 4 - アミン (国際公開第 2015000715 号に記載のとおり調製した) (0.1143 g, 0.7006 mmol) を、アセトニトリル (5 mL) 中に懸濁させた。得られる混合物を一晚 70 °C で加熱した。オキソマグネシウム (Oxomagnesium) (0.02689 g, 0.6672 mmol) を添加し、反応混合物をさらに 4 時間攪拌した。反応混合物を水及び酢酸エチルで希釈した。水性層を酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を塩水で前脱水し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、

10

20

30

40

50

ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2 - [ [ 5 - エチルスルファニル - 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 ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリルを得た。

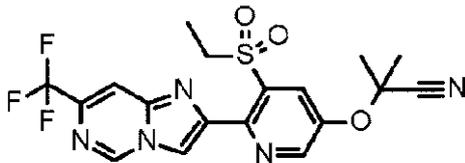
LC - MS : 408 (M + H) , r t : 1 . 00 min

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz , クロロホルム) ppm 1 . 45 ( t , J = 7 . 34 Hz , 3 H ) 1 . 82 ( s , 6 H ) 3 . 05 ( q , J = 7 . 34 Hz , 2 H ) 7 . 67 ( d , J = 2 . 57 Hz , 1 H ) 8 . 05 ( s , 1 H ) 8 . 34 ( d , J = 2 . 57 Hz , 1 H ) 8 . 46 ( s , 1 H ) 9 . 15 - 9 . 21 ( m , 1 H )

【 0247】

ステップ F : 2 - [ [ 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 ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリル ( (化合物 P 13、表 P ) の調製

【化 48】



(化合物P13, 表P)

2 - [ [ 5 - エチルスルファニル - 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 ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリル ( 0 . 151 g , 0 . 2965 mmol ) をジクロロメタン ( 4 . 5 mL ) 中に溶解し、0 に冷却した。次いで、3 - クロロ過安息香酸 ( 0 . 1535 g , 0 . 6227 mmol ) を添加し、得られる懸濁液を 0 で 30 分間攪拌し、室温に温め、一晚攪拌した。反応混合物を、NaOH 1 M ( 25 mL ) 及びチオ硫酸ナトリウム飽和水溶液 ( 25 mL ) で失活させた。得られる混合物を 10 分間攪拌し、次いで、水性層をジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わせた有機層を NaOH 1 M ( × 3 )、HCl 1 M ( × 2 )、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、2 - [ [ 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 ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリルを得た。

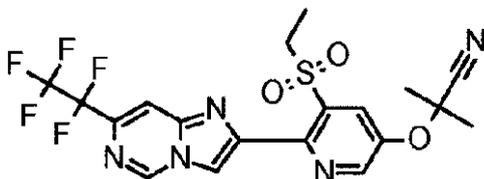
LC - MS : 440 (M + H) , r t : 0 . 94 min

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz , クロロホルム) ppm 1 . 37 - 1 . 43 ( m , 3 H ) 1 . 89 ( s , 6 H ) 3 . 98 ( q , J = 7 . 34 Hz , 2 H ) 7 . 98 ( s , 1 H ) 8 . 34 ( s , 1 H ) 8 . 35 ( d , J = 2 . 57 Hz , 1 H ) 8 . 81 ( d , J = 2 . 57 Hz , 1 H ) 9 . 19 ( s , 1 H )

【 0248】

実施例 H 6 : 2 - [ [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 7 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル)イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリル ( 化合物 P 18、表 P ) の調製

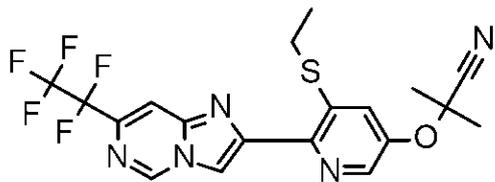
【化 49】



(化合物P18, 表P)

ステップA：2 - [ [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 7 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリルの調製

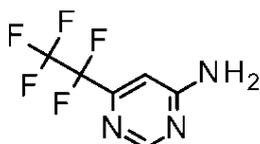
【化50】



10

この化合物は、実施例H5と同様であるが、ステップEにおいて、以下に記載のとおり調製した6 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) ピリミジン - 4 - アミンを用いて調製した。

【化51】



20

アルゴン雰囲気下に、乾燥させたバイアル中において、6 - ヨードピリミジン - 4 - アミン ( 国際公開第 2 0 1 6 0 7 1 2 1 4 号に記載のとおり調製した、5 . 8 3 g、2 6 . 4 m m o l ) 及び ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) ( 1 , 1 0 - フェナントロリン - N 1 , N 1 0 ) 銅 ( 1 5 . 1 g、3 9 . 6 m m o l ) をジメチルホルムアミド ( 9 5 . 0 m L ) 中に懸濁させた。得られる混合物を90 に一晩加熱した。反応混合物を室温に冷却し、セライトでろ過した。フィルタケーキを酢酸エチルですすぎ、得られる緑色の懸濁液を、飽和重炭酸ナトリウム及び水酸化アンモニウム水溶液、次いで、塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して粗生成物を得、これを、シリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、6 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) ピリミジン - 4 - アミンを得た。

30

LC - MS : 2 1 4 ( M + H ) , R t : 0 . 6 7 m i n

<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , クロロホルム ) p p m 5 . 4 1 ( b r s , 2 H ) 6 . 8 2 ( d , J = 1 . 1 0 H z , 1 H ) 8 . 7 1 ( s , 1 H )

【0249】

実施例H4中のステップEに記載されている2 - [ [ 6 - ( 2 - プロモアセチル ) - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリルとこの化合物の反応で、2 - [ [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 7 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリルを得た。

LC - MS : 4 5 8 ( M + H ) , R t : 1 . 1 0 m i n

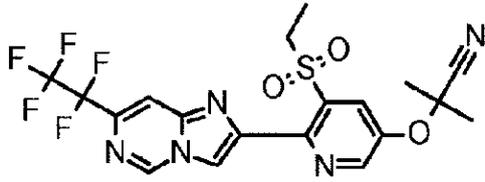
<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , 溶剤 ) p p m 1 . 4 5 ( t , J = 7 . 5 2 H z , 3 H ) 1 . 8 3 ( s , 6 H ) 3 . 0 5 ( q , J = 7 . 3 4 H z , 2 H ) 7 . 6 7 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 8 . 1 0 ( s , 1 H ) 8 . 3 4 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 8 . 4 6 ( s , 1 H ) 9 . 1 8 ( s , 1 H )

【0250】

ステップB：2 - [ [ 5 - エチルスルホニル - 6 - [ 7 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - メチル - プロパンニトリル ( 化合物 1 8 、 表 P ) の調製。

50

## 【化52】



(化合物18, 表P)

この化合物は、実施例H4のステップEに記載されているものと同様に、MCPBAによる酸化により調製した。表題の化合物は以下の分析データを有していた。

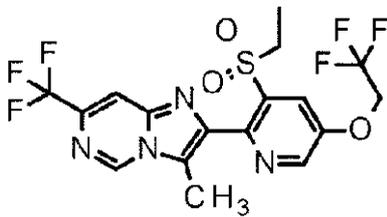
LC-MS: 490 (M+H), Rt: 1.03 min

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.41 (t, J = 7.52 Hz, 3H) 1.89 (s, 6H) 4.00 (q, J = 7.46 Hz, 2H) 8.02 (s, 1H) 8.35 - 8.36 (m, 1H) 8.36 (s, 1H) 8.81 (d, J = 2.57 Hz, 1H) 9.19 (d, J = 1.10 Hz, 1H)

## 【0251】

実施例H7: 2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-3-メチル-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン(化合物P28、表P)の合成。

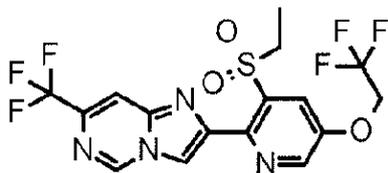
## 【化53】



(化合物P28, 表P)

ステップA: 2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン(化合物P6、表P)の調製。

## 【化54】



(化合物P6, 表P)

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-3-オール(0.4g、1.074mmol)及び炭酸セシウム(0.4551g、1.397mmol)を、N,N-ジメチルホルムアミド(8mL)中に懸濁させた。2,2,2-トリフルオロエチルトリフルオロメタンスルホネート(0.2992g、1.289mmol、0.186mL)をシリンジで添加した。得られる茶色の懸濁液を室温で2時間攪拌した。反応混合物を水及び酢酸エチルで希釈した。水性層を酢酸エチルで抽出した。有機層を水で4回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィ(シクロヘキサン/酢酸エチル)によって精製して、2-[3-エチルスルホニル-5-(2,

10

20

30

40

50

2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジンを得た。

LCMS (方法 標準) : 455 (M+H) Rt. : 0.98 min

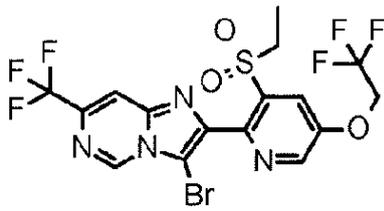
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.39 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 3.95 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 4.59 (q, J = 7.70 Hz, 2H) 7.98 (s, 1H) 8.09 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.33 (s, 1H) 8.69 (d, J = 2.94 Hz, 1H) 9.18 (d, J = 0.73 Hz, 1H)

【0252】

ステップB : 3-プロモ-2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン (化合物P25、表P) の調製。

10

【化55】



(化合物P25, 表P)

20

2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン (0.19 g、0.4181 mmol) をアセトニトリル (4 mL、79 mmol) 中に溶解し、N-ブロモスクシンイミド (0.082 g、0.4599 mmol) を添加し、得られた混合物を室温で攪拌した。一晩の後、溶液を減圧下で濃縮し、クロマトグラフィにより精製して、3-プロモ-2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジンを得た。

LCMS (方法 標準) : 535 (M+H) Rt. : 1.03 min

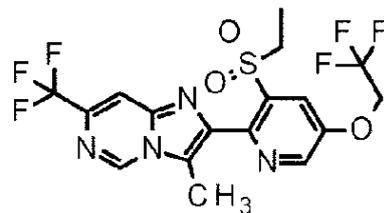
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.41 (t, J = 7.52 Hz, 3H) 3.91 (q, J = 7.46 Hz, 2H) 4.61 (q, J = 7.70 Hz, 2H) 7.93 (d, J = 0.73 Hz, 1H) 8.05 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.74 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 9.15 - 9.20 (m, 1H)

【0253】

ステップC : 2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-3-メチル-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン (化合物P28、表P) の調製。

30

【化56】



(化合物P28, 表P)

40

3-プロモ-2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン (0.1 g、0.1875 mmol) を1,4-ジオキサン (2 mL) 中に溶解し、炭酸カリウム (0.07854 g、0.5626 mmol) を添加し、混合物をアルゴンで10

50

分間パーズした。次いで、2, 4, 6 - トリメチル - 1, 3, 5, 2, 4, 6 - トリオキサトリボリン(0.0391 mL, 0.2813 mmol) 及びパラジウム; トリフェニルホスファン(0.04335 g, 0.03751 mmol) を添加した。混合物を95 で一晩加熱した。反応混合物を室温に冷却した。水及び酢酸エチルを添加し、水性層を酢酸エチルで2回逆抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、40 に減圧下で蒸発させた。粗生成物を、ジクロロメタン/酢酸エチル勾配を用いるシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ[1, 2 - c]ピリミジンを得た。

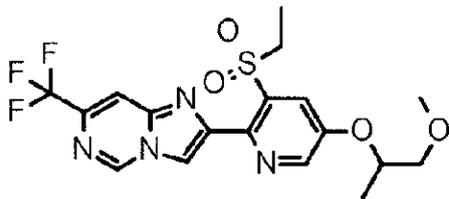
LCMS (方法 標準) : 469 (M+H), Rt : 1.00 min

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.40 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 2.70 (s, 3H) 3.96 (q, J = 7.58 Hz, 2H) 4.60 (q, J = 7.83 Hz, 2H) 7.91 (s, 1H) 8.06 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.70 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.98 (s, 1H)

【0254】

実施例 H8 : 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (2 - メトキシ - 1 - メチル - エトキシ) - 2 - ピリジル] - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ[1, 2 - c]ピリミジン (化合物 P29、表 P) の合成

【化57】



(化合物P29, 表P)

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 - 3 - オール(0.400 g, 1.07 mmol) 及びトリフェニルホスフィン(0.342 g, 1.29 mmol) を乾燥テトラヒドロフラン(4.80 mL) 中に懸濁させた。得られる混合物に、1 - メトキシプロパン - 2 - オール(0.116 mL, 1.18 mmol) を添加し、続いて、ジイソプロピルアゾカルボキシレート(0.270 mL, 1.29 mmol) を添加した。反応混合物を3時間30分、室温で撹拌した。次いで、反応を、0 で、水で注意深く失活させ、酢酸エチルで希釈した。水性層を酢酸エチルで2回逆抽出した。有機層を組み合わせ、塩水で洗浄し、硫酸塩で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (2 - メトキシ - 1 - メチル - エトキシ) - 2 - ピリジル] - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ[1, 2 - c]ピリミジンを得た。

LCMS (方法 標準) : 445 (M+H), Rt : 0.92 min

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.37 (t, J = 7.52 Hz, 3H) 1.42 (d, J = 6.24 Hz, 3H) 3.44 (s, 3H) 3.58 - 3.70 (m, 2H) 3.81 - 3.93 (m, 2H) 4.80 (td, J = 6.42, 3.67 Hz, 1H) 7.96 (s, 1H) 8.09 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 8.29 (s, 1H) 8.62 (d, J = 2.93 Hz, 1H) 9.16 (s, 1H)

【0255】

実施例 H9 : 5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 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 - 3 - オール (化合物 P30、表 P) の合成

10

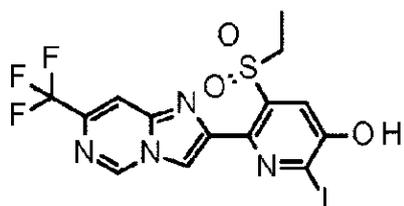
20

30

40

50

## 【化58】



(化合物P30, 表P)

アルゴン雰囲気下で、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-3-オール(0.25g、0.6715mmol)及び炭酸ナトリウム(0.1495g、1.410mmol)をアセトニトリル(2.7mL)及び水(2.686mL)中に懸濁させた。得られる混合物に、分子ヨウ素(0.205g、0.8058mmol)を添加した。得られるオレンジ/赤色の溶液を室温で一晩撹拌した。反応を70℃で5時間撹拌した。分子ヨウ素(0.205g、0.8058mmol)を再度添加し、反応を室温で一晩撹拌した。反応混合物をチオ硫酸ナトリウムで失活させ、15分間撹拌した。得られる混合物を酢酸エチルで2回抽出した。有機層を分離し、塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物を、ジクロロメタン及び酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、5-エチルスルホニル-2-ヨード-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-3-オールを得た。

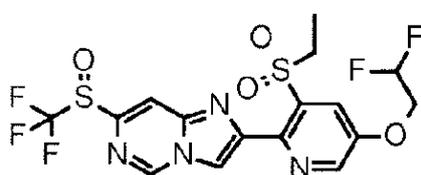
LC-MS: 499 (MH), Rt: 0.89min

<sup>1</sup>H NMR (400MHz, クロロホルム) ppm 1.22 (t, J = 7.52 Hz, 3H) 4.01 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 8.33 (s, 1H) 8.55 (s, 1H) 9.63 (d, J = 0.73 Hz, 1H) 11.95 - 12.09 (m, 1H)

【0256】

実施例H10: 2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチルスルフィニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン(化合物P3、表P)の合成。

## 【化59】



(化合物P3, 表P)

アルゴン雰囲気下で、2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン(0.1087g、0.2321mmol、実施例H3において調製)をジクロロメタン(2.3mL)中に溶解した。黄色の溶液を0℃に冷却した。混合物に、3-クロロ過安息香酸(0.1201g、0.4873mmol)を数回に分けて添加した。得られる白色の懸濁液を0℃で30分間撹拌し、次いで、混合物を室温に温め、1時間撹拌した。反応を5mLのチオ硫酸ナトリウムで失活させ、室温で1時間撹拌した。得られる混合物をDCM及びNaHCO<sub>3</sub>(飽和)で抽出した。水性層をDCMで2回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗生成物を、逆相クロマトグラフィにより精製して、2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチルスルフィニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジンを得た。

LC - MS : 485 (M+H) , Rt : 0.84 min  
 【0257】

表P:好ましい式Iの化合物の物理化学的及び分光学的特性:

【表12-1】

化合物	IUPAC名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	Mp °C
P1	2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		1.00	487	1	160 - 162
P2	2-(3-エチルスルホニル-5-イソプロポキシ-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		1.01	447	1	180 - 182
P3	2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチルスルフィニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.84	485	1	-
P4	2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.95	469	1	-
P5	2-(3-エチルスルホニル-5-メトキシ-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.90	420	1	-
P6	2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.96	455	1	181 - 183

10

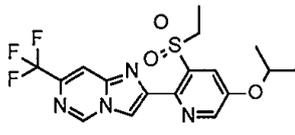
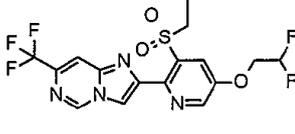
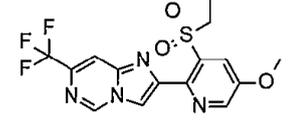
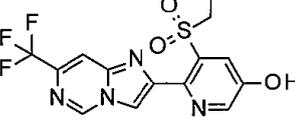
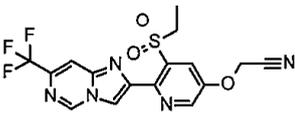
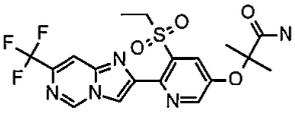
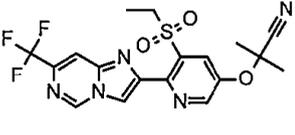
20

30

40

50

【表 1 2 - 2】

P7	2-(3-エチルスルホニル-5-イソプロポキシ-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.96	415	1	167 - 169
P8	2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.90	437	1	154 - 156
P9	2-(3-エチルスルホニル-5-メトキシ-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.85	387	1	194 - 196
P10	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-3-オール		0.75	373	1	229 - 232
P11	2-[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]-3-ピリジル]オキシ]アセトニトリル		0.84	413	1	195-196
P12	2-[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]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンアミド		0.78	458	1	171-173
P13	2-[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]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		0.94	440	1	137-139

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 3】

P14	2-(3-エチルスルホニル-5-イソプトキシ-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		1.04	429	1	165-166
P15	2-[3-エチルスルホニル-5-(2-メチルスルファニルエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.97	447	1	
P16	2-[3-エチルスルホニル-5-(メチルスルファニルメトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.94	433	1	
P17	2-[5-エチルスルホニル-6-[7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-2-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		1.00	472	1	
P18	2-[5-エチルスルホニル-6-[7-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-2-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		1.01	490	1	151-153
P19	2-[5-(エチルスルホニルイミドイル)-6-[7-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-2-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		0.93	489	1	75-80

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 4】

P20	2-[5-(エチルスルホンイミドイル)-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]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		0.84	439	1	75-78
P21	2-[5-(ジフルオロメトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.85	423	2	154-156
P22	2-[3-エチルスルホニル-5-(メチルスルフィニルメトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.73	449	1	222-223
P23	2-[3-エチルスルホニル-5-(メチルスルホニルメトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.80	465	1	237-238
P24	2-[3-エチルスルホニル-5-(2-メチルスルホニルエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.76	479	1	209-210
P25	3-ブromo-2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		1.03	535	1	86-88
P26	2-[3-エチルスルホニル-5-(メチルスルホニルメトキシ)-2-ピリル]-7-(1,1,2,2,2-ペentaフルオロエチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.89	515	1	248-250

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 5】

P27	6-[3-ブromo-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]-5-エチルスルホニル-ピリジン-3-オール		0.82	453	1	230-234
P28	2-[3-エチルスルホニル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-3-メチル-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		1.00	469	1	
P29	2-[3-エチルスルホニル-5-(2-メトキシ-1-メチル-エトキシ)-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.92	445	1	
P30	5-エチルスルホニル-2-ヨード-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-3-オール		0.89	499	1	
P31	5-エチルスルホニル-6-[7-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-2-イル]ピリジン-3-オール		0.81	405	1	-
P32	5-エチルスルホニル-6-[7-(トリフルオロメチルスルホニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-2-イル]ピリジン-3-オール		0.81	437	1	-
P33	2-(3-エチルスルホニル-5-イソプロポキシ-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチルスルホニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		1.01	479	1	-

10

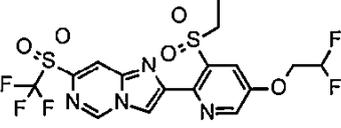
20

30

40

50

【表 1 2 - 6】

P34	2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-エチルスルホニル-2-ピリジル]-7-(トリフルオロメチルスルホニル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン		0.96	501	1	-
-----	--	---	------	-----	---	---

10

## 【0258】

本発明による組成物の活性は、他の殺虫的、殺ダニ的及び/又は殺菌・殺力比的に活性な処方成分を加えることにより、相当な広範化、及び、流行している状況に対する適応が可能である。式 I の化合物と他の殺虫的、殺ダニ的及び/又は殺菌・殺力比的に活性な処方成分との混合物はまた、より広い意味で、相乗的活性とも説明可能であるさらに意外な利点を有し得る。例えば、植物によるより優れた耐性、低い殺草性、異なる成長段階昆虫を防除可能であること、又は、例えば粉碎若しくは混合の最中、保管若しくは使用の最中といった製造中の挙動が良好であることである。

## 【0259】

ここで、活性成分に対する好適な添加物は、例えば、以下の分類の活性成分が代表的である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼虫ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイド及びバチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

20

## 【0260】

以下に示す式 I の化合物と活性成分との混合物が好ましい（略記「TX」は、「本発明の表 1、2、3 及び Y に記載の化合物からなる群から選択される 1 種の化合物」を意味する）：

石油（代替名）（628）+ TX からなる物質群から選択される補助剤、

30

1, 1 - ビス（4 - クロロフェニル） - 2 - エトキシエタノール（IUPAC 名）（910）+ TX、2, 4 - ジクロロフェニルベンゼンスルホネート（IUPAC / Chemical Abstracts 名）（1059）+ TX、2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - シンナムアルデヒド（IUPAC 名）（1295）+ TX、4 - クロロフェニルフェニルスルホン（IUPAC 名）（981）+ TX、アバメクチン（1）+ TX、アセキノシル（3）+ TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン（9）+ TX、アルジカルブ（16）+ TX、アルドキシカルブ（863）+ TX、シベルメトリン（202）+ TX、アミジチオン（870）+ TX、アミドフルメト [CCN] + TX、アミドチオエート（872）+ TX、アミトン（875）+ TX、シュウ酸水素アミトン（875）+ TX、アミトラズ（24）+ TX、アラマイト（881）+ TX、三酸化ヒ素（882）+ TX、AVI 382（化合物コード）+ TX、AZ60541（化合物コード）+ TX、アジンホス - エチル（44）+ TX、アジンホス - メチル（45）+ TX、アゾベンゼン（IUPAC 名）（888）+ TX、アゾシクロチン（46）+ TX、アゾトエート（889）+ TX、ベノミル（62）+ TX、ベノキサホス（代替名）[CCN] + TX、ベンゾキメート（71）+ TX、ベンジル安息香酸塩（IUPAC 名）[CCN] + TX、ピフェナゼート（74）+ TX、ピフェントリン（76）+ TX、ピナバクリル（907）+ TX、プロフェンバレレート（代替名）+ TX、プロモシクレン（918）+ TX、プロモホス（920）+ TX、プロモホス - エチル（921）+ TX、プロモプロピレート（94）+ TX、ブプロフェジン（99）+ TX、プトカルボキシム（103）+ TX、プトキシカルボキシム（104）+ TX、ブチルピリダベン（代替名）

40

50

+ TX、多硫酸カルシウム (IUPAC名) (111) + TX、カンフェクロール (941) + TX、カルバノレート (943) + TX、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、カルボフェノチオン (947) + TX、CGA50'439 (開発コード) (125) + TX、チノメチオナート (126) + TX、クロルベンシド (959) + TX、クロルジメホルム (964) + TX、クロルジメホルムヒドロクロリド (964) + TX、クロルフェナビル (130) + TX、クロルフェネトール (968) + TX、クロルフェンソン (970) + TX、クロルフェンスルフィド (971) + TX、クロルフェンピンホス (131) + TX、クロロベンジレート (975) + TX、クロロメプホルム (977) + TX、クロロメチウロン (978) + TX、クロロプロピレート (983) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロルピリホス - メチル (146) + TX、クロルチオホス (994) + TX、シネリン I (696) + TX、シネリン II (696) + TX、シネリンス (696) + TX、クロフェンテジン (158) + TX、クロサンテル (代替名) [CCN] + TX、クマホス (174) + TX、クロタミトン (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1010) + TX、クフラエブ (1013) + TX、シアントエート (1020) + TX、シフルメトフェン (CAS Reg. No. : 400882-07-7) + TX、シハロトリン (196) + TX、シヘキサチン (199) + TX、シベルメトリン (201) + TX、DCPM (1032) + TX、DDT (219) + TX、デメフィオン (1037) + TX、デメフィオン - O (1037) + TX、デメフィオン - S (1037) + TX、デメトン (1038) + TX、デメトン - メチル (224) + TX、デメトン - O (1038) + TX、デメトン - O - メチル (224) + TX、デメトン - S (1038) + TX、デメトン - S - メチル (224) + TX、デメトン - S - メチルスルフォン (1039) + TX、ジアフェンチウロン (226) + TX、ジアリホス (1042) + TX、ダイアジノン (227) + TX、ジクロフルアニド (230) + TX、ジクロルボス (236) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジコホル (242) + TX、ジクロトホス (243) + TX、ジエノクロル (1071) + TX、ジメホクス (1081) + TX、ジメトエート (262) + TX、ジナクチン (代替名) (653) + TX、ジネクス (1089) + TX、ジネクスジクレキシ (1089) + TX、ジノプトン (269) + TX、ジノカップ (270) + TX、ジノカップ - 4 [CCN] + TX、ジノカップ - 6 [CCN] + TX、ジノクトン (1090) + TX、ジノペントン (1092) + TX、ジノスルホン (1097) + TX、ジノテルボン (1098) + TX、ジオキサチオン (1102) + TX、ジフェニルスルホン (IUPAC名) (1103) + TX、ジスルフィラム (代替名) [CCN] + TX、ジスルホトン (278) + TX、DNOC (282) + TX、ドフェナピン (1113) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、

エンドスルファン (294) + TX、エンドチオン (1121) + TX、EPN (297) + TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エチオン (309) + TX、エトエートメチル (1134) + TX、エトキサゾール (320) + TX、エトリムホス (1142) + TX、フェナザフロル (1147) + TX、フェナザキン (328) + TX、酸化フェンブタズ (330) + TX、フェノチオカルブ (337) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンピロキシメート (345) + TX、フェンソン (1157) + TX、フェントリファニル (1161) + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィプロニル (354) + TX、フルアクリピリム (360) + TX、フルアズロン (1166) + TX、フルベンジミン (1167) + TX、フルシクロクスロン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネチル (1169) + TX、フルフェノクスロン (370) + TX、フルメトリン (372) + TX、フルオルベンシド (1174) + TX、フルバリネート (1184) + TX、FMC 1137 (開発コード) (1185) + TX、ホルメタネート (405) + TX、ホルメタネートヒドロクロリド (405) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート (1193) + TX、 - HCH (430) + TX、グリオジン (1205) + TX、ハルフェンプロクス (424) + TX、ヘプテノホス (432)

10

20

30

40

50

+ TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート ( I U P A C / C h e m i c a l  
A b s t r a c t s 名 ) ( 1 2 1 6 ) + T X、ヘキシチアゾクス ( 4 4 1 ) + T X、ヨード  
メタン ( I U P A C 名 ) ( 5 4 2 ) + T X、イソカルボホス ( 代替名 ) ( 4 7 3 ) + T  
X、イソプロピル O - ( メトキシアミノチオホスホリル ) サリチレート ( I U P A C 名 )  
( 4 7 3 ) + T X、イベルメクチン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、ジャスモリン I ( 6 9  
6 ) + T X、ジャスモリン I I ( 6 9 6 ) + T X、ジヨドフェンホス ( 1 2 4 8 ) + T X  
、リンダン ( 4 3 0 ) + T X、ルフェヌロン ( 4 9 0 ) + T X、マラチオン ( 4 9 2 ) +  
T X、マロノベン ( 1 2 5 4 ) + T X、メカルバム ( 5 0 2 ) + T X、メホスフォラン ( 1  
2 6 1 ) + T X、メスルフェン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、メタクリホス ( 1 2 6 6  
) + T X、メタミドホス ( 5 2 7 ) + T X、メチダチオン ( 5 2 9 ) + T X、メチオカル  
ブ ( 5 3 0 ) + T X、メソミル ( 5 3 1 ) + T X、臭化メチル ( 5 3 7 ) + T X、メトル  
カルブ ( 5 5 0 ) + T X、メピンホス ( 5 5 6 ) + T X、メキサカルベート ( 1 2 9 0 )  
+ T X、ミルベメクチン ( 5 5 7 ) + T X、ミルベマイシンオキシム ( 代替名 ) [ C C N  
] + T X、ミパホクス ( 1 2 9 3 ) + T X、モノクロトホス ( 5 6 1 ) + T X、モルホチ  
オン ( 1 3 0 0 ) + T X、モキシデクチン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、ナレド ( 5 6 7  
) + T X、NC - 1 8 4 ( 化合物コード ) + T X、NC - 5 1 2 ( 化合物コード ) + T X  
、ニフルリジド ( 1 3 0 9 ) + T X、ニッコマイシン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、ニト  
リラカルブ ( 1 3 1 3 ) + T X、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 ( 1 3 1 3 ) + T X  
、NNI - 0 1 0 1 ( 化合物コード ) + T X、NNI - 0 2 5 0 ( 化合物コード ) + T X  
、オメトエート ( 5 9 4 ) + T X、オキサミル ( 6 0 2 ) + T X、オキシデプロホス ( 1  
3 2 4 ) + T X、オキシジスルホトン ( 1 3 2 5 ) + T X、pp ' - D D T ( 2 1 9 ) + T  
X、パラチオン ( 6 1 5 ) + T X、ペルメトリン ( 6 2 6 ) + T X、石油 ( 代替名 ) ( 6  
2 8 ) + T X、フェンカプトン ( 1 3 3 0 ) + T X、フェントエート ( 6 3 1 ) + T X、  
ホレート ( 6 3 6 ) + T X、ホサロン ( 6 3 7 ) + T X、ホスホラン ( 1 3 3 8 ) + T X  
、ホスメット ( 6 3 8 ) + T X、ホスファミドン ( 6 3 9 ) + T X、ホキシム ( 6 4 2 )  
+ T X、ピリミホス - メチル ( 6 5 2 ) + T X、ポリクロロテルペン ( 従来の名称 ) ( 1  
3 4 7 ) + T X、ポリナクチン ( 代替名 ) ( 6 5 3 ) + T X、プロクロノール ( 1 3 5 0  
) + T X、プロフェノホス ( 6 6 2 ) + T X、プロマシル ( 1 3 5 4 ) + T X、プロパル  
ギット ( 6 7 1 ) + T X、プロベタムホス ( 6 7 3 ) + T X、プロボキスル ( 6 7 8 ) +  
T X、プロチダチオン ( 1 3 6 0 ) + T X、プロトエート ( 1 3 6 2 ) + T X、プレトリ  
ン I ( 6 9 6 ) + T X、プレトリン I I ( 6 9 6 ) + T X、プレトリン ( 6 9 6 ) + T X  
、ピリダベン ( 6 9 9 ) + T X、ピリダフェンチオン ( 7 0 1 ) + T X、ピリミジフェン  
( 7 0 6 ) + T X、ピリミテート ( 1 3 7 0 ) + T X、キナルホス ( 7 1 1 ) + T X、キ  
ンチオホス ( 1 3 8 1 ) + T X、R - 1 4 9 2 ( 開発コード ) ( 1 3 8 2 ) + T X、RA  
- 1 7 ( 開発コード ) ( 1 3 8 3 ) + T X、ロテノン ( 7 2 2 ) + T X、シュラダン ( 1  
3 8 9 ) + T X、セブホス ( 代替名 ) + T X、セラメクチン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X  
、SI - 0 0 0 9 ( 化合物コード ) + T X、ソファミド ( 1 4 0 2 ) + T X、スピロジク  
ロフェン ( 7 3 8 ) + T X、スピロメシフェン ( 7 3 9 ) + T X、SSI - 1 2 1 ( 開発  
コード ) ( 1 4 0 4 ) + T X、スルフィラム ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、スルフラミド  
( 7 5 0 ) + T X、スルホテブ ( 7 5 3 ) + T X、硫黄 ( 7 5 4 ) + T X、SZI - 1 2  
1 ( 開発コード ) ( 7 5 7 ) + T X、 - フルバリネート ( 3 9 8 ) + T X、テブフェン  
ピラド ( 7 6 3 ) + T X、TEPP ( 1 4 1 7 ) + T X、テルバム ( 代替名 ) + T X、テ  
トラクロルピンホス ( 7 7 7 ) + T X、テトラジホン ( 7 8 6 ) + T X、テトラナクチン  
( 代替名 ) ( 6 5 3 ) + T X、テトラスル ( 1 4 2 5 ) + T X、チアフェノクス ( 代替名  
) + T X、チオカルボキシム ( 1 4 3 1 ) + T X、チオファノックス ( 8 0 0 ) + T X、  
チオメトン ( 8 0 1 ) + T X、チオキノックス ( 1 4 3 6 ) + T X、ツリンギエンシン ( 代  
替名 ) [ C C N ] + T X、トリアミホス ( 1 4 4 1 ) + T X、トリアラテン ( 1 4 4 3  
) + T X、トリアゾホス ( 8 2 0 ) + T X、トリアズロン ( 代替名 ) + T X、トリクロル  
ホン ( 8 2 4 ) + T X、トリフェノホス ( 1 4 5 5 ) + T X、トリナクチン ( 代替名 ) ( 6  
5 3 ) + T X、バミドチオン ( 8 4 7 ) + T X、バニリプロール [ C C N ] 及び Y I -

10

20

30

40

50

5302 (化合物コード) + TX からなる物質群から選択されるダニ駆除薬、  
 ベトキサジン [CCN] + TX、ニオクタノン酸銅 (IUPAC 名) (170) + TX、  
 硫酸銅 (172) + TX、シブトリン [CCN] + TX、ジクロン (1052) + TX、  
 ジクロロフェン (232) + TX、エンドタール (295) + TX、フェンチン (347)  
 ) + TX、消石灰 [CCN] + TX、ナーバム (566) + TX、キノクラミン (714)  
 ) + TX、キノンアミド (1379) + TX、シマジン (730) + TX、酢酸トリフェ  
 ニルスズ (IUPAC 名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC 名) (3  
 47) + TX からなる物質群から選択される殺藻剤、

アバメクチン (1) + TX、クルホメート (1011) + TX、ドラメクチン (代替名)  
 [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291)  
 + TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、イベルメクチン (代替名) [C  
 CN] + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代  
 替名) [CCN] + TX、ピペラジン [CCN] + TX、セラメクチン (代替名) [C  
 CN] + TX、スピノサド (737) 及びチオファネート (1435) + TX からなる物  
 質群から選択される駆虫薬、

クロラロース (127) + TX、エンドリン (1122) + TX、フェンチオン (346  
 ) + TX、ピリジン - 4 - アミン (IUPAC 名) (23) 及びストリキニン (745)  
 + TX からなる物質群から選択される殺鳥剤、

1 - ヒドロキシ - 1H - ピリジン - 2 - チオン (IUPAC 名) (1222) + TX、4  
 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC 名) (748  
 ) + TX、8 - 硫酸ヒドロキシキノリン (446) + TX、プロノポール (97) + TX  
 、ニオクタノン酸銅 (IUPAC 名) (170) + TX、水酸化銅 (IUPAC 名) (1  
 69) + TX、クレゾール [CCN] + TX、ジクロロフェン (232) + TX、ジピリ  
 チオン (1105) + TX、ドジチン (1112) + TX、フェナミノスルフ (1144  
 ) + TX、ホルムアルデヒド (404) + TX、ヒドラルガフェン (代替名) [CCN]  
 + TX、カスガマイシン (483) + TX、カスガマイシンヒドロクロリド水和物 (48  
 3) + TX、ニッケルビス (ジメチルジチオカルバメート) (IUPAC 名) (1308  
 ) + TX、ニトラピリン (580) + TX、オクチリノン (590) + TX、オキシリン  
 酸 (606) + TX、オキシテトラサイクリン (611) + TX、硫酸ヒドロキシキノリ  
 ンカリウム (446) + TX、プロベナゾール (658) + TX、ストレプトマイシン (7  
 44) + TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート (744) + TX、テクロフタ  
 ラム (766) + TX、及びチオメルサル (代替名) [CCN] + TX からなる物質群  
 から選択される殺バクテリア剤、

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana* GV) (代替名) (12)  
 + TX、アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radio  
 bacter*) (代替名) (13) + TX、アムプリセイウス属の一種 (*Amblyse  
 ius* spp.) (代替名) (19) + TX、アナグラファファルシフェラ (*Anag  
 rapha falcifera* NPV) (代替名) (28) + TX、アングルスアトム  
 ス (*Anagrus atomus*) (代替名) (29) + TX、アブラコバチ (*Aph  
 elinus abdominalis*) (代替名) (33) + TX、コレマンアブラバ  
 チ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) + TX、シヨクガタマバ  
 エ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代替名) (35) + TX、オー  
 トグラファカリホルニカ (*Autographa californica* NPV) (代  
 替名) (38) + TX、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) (代替  
 名) (48) + TX、バチルススファエリクス (*Bacillus sphaericus*  
*Neide*) (学名) (49) + TX、バチルスチューリンゲンシスベルリネル (*Bac  
 illus thuringiensis* (Berliner) (学名) (51) + TX  
 、バチルスチューリンゲンシスアイザワイ (*Bacillus thuringiens  
 is* subsp. *aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリンゲン  
 シスイスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *i*

10

20

30

40

50

*sraelensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングエンシスジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングエンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングエンシステネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ベアウベリアバッシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ベアウベリアブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオヒメtentウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリガ (*Cydia pomonella* GV) (代替名) (191) + TX、ハモグリコマコバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea* NPV) (代替名) (431) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) 及び H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、ヒポダミアコンベルゲンス (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae* NPV) (代替名) (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエアクリズム (*Metarhizium anisopliae var. acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae var. anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer* NPV) 及び N. レコンテイ (*N. lecontei* NPV) (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属の一種 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカプシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイナーネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマカルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマリオブラエb (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマリオブラビス (*Steinernema riobravense*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマスカプテリスキ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマ属の一種 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属の一種 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及びベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX からなる物質群から選択される生物剤、  
 ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及び臭化メチル (537) + TX からなる物質

10

20

30

40

50

の群から選択される土壌不毛剤、

アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘムパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] 及びウレデパ (代替名) [CCN] + TX からなる物質群から選択される不妊化剤、

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテート + (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) - トテラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (283) + TX、(9Z, 11E) - トテラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (780) + TX、(9Z, 12E) - トテラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC 名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オール + 4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC 名) (544) + TX、  
- ムルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、ブレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルレ (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、クエルレ (代替名) (179) + TX、ジスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート (IUPAC 名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシップルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャポニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (589) + TX、オルフルアルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタールア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドルア B<sub>1</sub> (代

10

20

30

40

50

替名) (839) + TX、トリメドルア B<sub>2</sub> (代替名) (839) + TX、トリメドルア C (代替名) (839) 及びトランクコール (代替名) [CCN] + TX からなる物質群から選択される昆虫フェロモン、

2 - (オクチルチオ)エタノール (IUPAC 名) (591) + TX、ブトピロノキシル (933) + TX、ブトキシ (ポリプロピレングリコール) (936) + TX、ジブチルアジペート (IUPAC 名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル (1047) + TX、ジブチルコハク酸塩 (IUPAC 名) (1048) + TX、ジエチルトルアミド [CCN] + TX、ジメチルカルベート [CCN] + TX、ジメチルフタレート [CCN] + TX、エチルヘキサジオール (1137) + TX、ヘキサミド [CCN] + TX、メトキン - ブチル (1276) + TX、メチルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート [CCN] 及びピカリジン [CCN] + TX からなる物質群から選択される昆虫忌避剤、

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1058) + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) エタン (IUPAC 名) (1056) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1062) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン + 1, 3 - ジクロロプロペン (IUPAC 名) (1063) + TX、1 - プロモ - 2 - クロロエタン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (916) + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) 酢酸エチル (IUPAC 名) (1451) + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルリン酸塩 (IUPAC 名) (1066) + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニルジメチルカルバメート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1109) + TX、2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (935) + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチルカルバメート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1084) + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ) エタノール (IUPAC 名) (986) + TX、2 - クロロビニルジエチルリン酸塩 (IUPAC 名) (984) + TX、2 - イミダゾリドン (IUPAC 名) (1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC 名) (1246) + TX、2 - メチル (プロブ - 2 - イニル) アミノフェニルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1284) + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート (IUPAC 名) (1433) + TX、3 - プロモ - 1 - クロロプロブ - 1 - エン (IUPAC 名) (917) + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート (IUPAC 名) (1283) + TX、4 - メチル (プロブ - 2 - イニル) アミノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1285) + TX、5, 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート (IUPAC 名) (1085) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセフェート (2) + TX、アセタミブリド (4) + TX、アセチオン (代替名) [CCN] + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アクリロニトリル (IUPAC 名) (861) + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、アルドリン (864) + TX、アレトリン (17) + TX、アロサミジン (代替名) [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、 - シベルメトリン (202) + TX、 - エクジソン (代替名) [CCN] + TX、リン化マグネシウム (640) + TX、アミジチオン (870) + TX、アミドチオエート (872) + TX、アミノカルブ (873) + TX、アミトン (875) + TX、シュウ酸水素アミトン (875) + TX、アミトラズ (24) + TX、アナバシン (877) + TX、アチダチオン (883) + TX、AVI 382 (化合物コード) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、アザジラクチン (代替名) (41) + TX、アザメチホス (42) + TX、アジンホス - エチル (44) + TX、アジンホス - メチル (45) + TX、アゾトエート (889) + TX、バチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) エンドトキシン (代替名) (52) + TX、バリウムヘキサフルオロ

10

20

30

40

50

シリケート（代替名）[CCN]+TX、バリウムポリスルフィド（IUPAC/Chemical Abstracts名）（892）+TX、バルトリン[CCN]+TX、バイエル22/190（開発コード）（893）+TX、バイエル22408（開発コード）（894）+TX、ベンジオカルブ（58）+TX、ペンフラカルブ（60）+TX、ベンサルタップ（66）+TX、  
-シフルトリン（194）+TX、  
-シベルメトリン（203）+TX、ピフェントリン（76）+TX、ピオアレトリン（78）+TX、ピオアレトリンS-シクロペンテニル異性体（代替名）（79）+TX、バイオエタノメトリン[CCN]+TX、ピオパーメトリン（908）+TX、ピオレスメトリン（80）+TX、ピス（2-クロロエチル）エーテル（IUPAC名）（909）+TX、ピストリフルロン（83）+TX、ホウ酸ナトリウム（86）+TX、プロフェンバレレート（代替名）+TX、プロムフェンピンホス（914）+TX、プロモシクレン（918）+TX、プロモ-DDT（代替名）[CCN]+TX、プロモホス（920）+TX、プロモホス-エチル（921）+TX、プフェンカルブ（924）+TX、ププロフェジン（99）+TX、プタカルブ（926）+TX、プタチオホス（927）+TX、プトカルボキシム（103）+TX、プトネート（932）+TX、プトキシカルボキシム（104）+TX、プチルピリダベン（代替名）+TX、カズサホス（109）+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、シアン化カルシウム（444）+TX、多硫酸カルシウム（IUPAC名）（111）+TX、カンフェクロール（941）+TX、カルバノレート（943）+TX、カルバリル（115）+TX、カルボフラン（118）+TX、  
二硫化炭素（IUPAC/Chemical Abstracts名）（945）+TX  
、四塩化炭素（IUPAC名）（946）+TX、カルボフェノチオン（947）+TX、カルボスルファン（119）+TX、カルタップ（123）+TX、カルタップヒドロクロリド（123）+TX、セバジン（代替名）（725）+TX、クロルビシクレン（960）+TX、クロルダン（128）+TX、クロルデコン（963）+TX、クロルジメホルム（964）+TX、クロルジメホルムヒドロクロリド（964）+TX、クロルエトキシホス（129）+TX、クロルフェナピル（130）+TX、クロルフェンピンホス（131）+TX、クロルフルアズロン（132）+TX、クロルメホス（136）+TX、クロルホルム[CCN]+TX、クロルピクリン（141）+TX、クロルホキシム（989）+TX、クロルブラゾホス（990）+TX、クロルピリホス（145）+TX、クロルピリホス-メチル（146）+TX、クロルチオホス（994）+TX  
、クロマフェノジド（150）+TX、シネリンI（696）+TX、シネリンII（696）+TX、シネリンス（696）+TX、cis-レスメスリン（代替名）+TX、シスメトリン（80）+TX、クロシトリン（代替名）+TX、クロエトカルブ（999）+TX、クロサンテル（代替名）[CCN]+TX、クロチアニジン（165）+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、ヒ酸銅[CCN]+TX、オレイン酸銅[CCN]+TX、クマホス（174）+TX、クミトエート（1006）+TX、クロタミトン（代替名）[CCN]+TX、クロトキシホス（1010）+TX、クルホメート（1011）+TX、氷晶石（代替名）（177）+TX、CS 708（開発コード）（1012）+TX、シアノフェンホス（1019）+TX、シアノホス（184）+TX、シアントエート（1020）+TX、シクレトリン[CCN]+TX、シクロプロトリン（188）+TX、シフルトリン（193）+TX、シハロトリン（196）+TX、シベルメトリン（201）+TX、シフェノトリン（206）+TX、シロマジン（209）+TX、シチオエート（代替名）[CCN]+TX、  
d-リモネン（代替名）[CCN]+TX、d-テトラメトリン（代替名）（788）+TX、DAEP（1031）+TX、ダゾメット（216）+TX、DDT（219）+TX、デカルボフラン（1034）+TX、デルタメトリン（223）+TX、デメフィオン（1037）+TX、デメフィオン-O（1037）+TX、デメフィオン-S（1037）+TX、デメトン（1038）+TX、デメトン-メチル（224）+TX、デメトン-O（1038）+TX、デメトン-O-メチル（224）+TX、デメトン-S（1038）+TX、デメトン-S-メチル（224）+TX、デメトン-S-メチルス

10

20

30

40

50

ルホン(1039)+TX、ジアフェンチウロン(226)+TX、ジアリホス(1042)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ダイアジノン(227)+TX、ジカプトン(1050)+TX、ジクロロフェンチオン(1051)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジクレシル(代替名)[CCN]+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジシクラニル(244)+TX、ディルドリン(1070)+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルリン酸塩(IUPAC名)(1076)+TX、ジフルベンズロン(250)+TX、ジロール(代替名)[CCN]+TX、ジメフルトリン[CCN]+TX、ジメホクス(1081)+TX、ジメタン(1085)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジメトリン(1083)+TX、ジメチルピンホス(265)+TX、ジメチラン(1086)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクスジクレキシ(1089)+TX、ジノプロブ(1093)+TX、ジノサム(1094)+TX、ジノセブ(1095)+TX、ジノテフラン(271)+TX、ジオフェノラン(1099)+TX、ジオキサベンゾホス(1100)+TX、ジオキサカルブ(1101)+TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジスルホトン(278)+TX、ジチクロホス(1108)+TX、DNOC(282)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、エクジステロン(代替名)[CCN]+TX、EI 1642(開発コード)(1118)+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、EMP(1120)+TX、エムベントリン(292)+TX、エンドスルフアン(294)+TX、エンドチオン(1121)+TX、エンドリン(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)+TX、エポフェノナン(1124)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エスフェンバレレート(302)+TX、エタホス(代替名)[CCN]+TX、エチオフェンカルブ(308)+TX、エチオン(309)+TX、エチプロール(310)+TX、エトエートメチル(1134)+TX、エトプロホス(312)+TX、エチル(IUPAC名)[CCN]+TX、エチル-DDD(代替名)(1056)+TX、エチレンジブロミド(316)+TX、ジクロロエタン(化学名)(1136)+TX、エチレンオキシド[CCN]+TX、エトフェンブロックス(319)+TX、エトリムホス(1142)+TX、EXD(1143)+TX、ファンファー(323)+TX、フェナミホス(326)+TX、フェナザフロル(1147)+TX、フェンクローホス(1148)+TX、フェネタカルブ(1149)+TX、フェンフルトリン(1150)+TX、フェニトロチオン(335)+TX、フェノブカルブ(336)+TX、フェノキサクリム(1153)+TX、フェノキシカルブ(340)+TX、フェンピリトリン(1155)+TX、フェンプロパトリン(342)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、フェンチオン(346)+TX、フェンチオン-エチル[CCN]+TX、フェンバレレート(349)+TX、フィプロニル(354)+TX、フロニカミド(358)+TX、フルベンジアミド(CAS.Reg.No.:272451-65-7)+TX、フルコフロン(1168)+TX、フルシクロクスロン(366)+TX、フルシトリネート(367)+TX、フルエネチル(1169)+TX、フルフェネリム[CCN]+TX、フルフェノクスロン(370)+TX、フルフェンブロックス(1171)+TX、フルメトリン(372)+TX、フルバリネート(1184)+TX、FMC 1137(開発コード)(1185)+TX、フォノホス(1191)+TX、ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネートヒドロクロリド(405)+TX、ホルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、ホスメチラン(1194)+TX、ホスピレート(1195)+TX、ホスチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、フラチオカルブ(412)+TX、フレトリン(1200)+TX、-シハロトリン(197)+TX、-HCH(430)+TX、グアザチン(422)+TX、グアザチン酢酸塩(422)+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ハルフェンブロックス(424)+TX、ハロフェノジド(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、ヘプタクロール(1211)+TX、ヘプテノホス(

10

20

30

40

50

432) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヘキサフルムロン (439) + TX、H  
 HDN (864) + TX、ヒドラメチルノン (443) + TX、シアン化水素 (444)  
 + TX、ヒドロブレン (445) + TX、ヒキンカルブ (1223) + TX、イミダクロ  
 プリド (458) + TX、イミプロトリン (460) + TX、インドキサカルブ (465)  
 ) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、IPSP (1229) + T  
 X、イサゾホス (1231) + TX、イソベンザン (1232) + TX、イソカルボホス  
 (代替名) (473) + TX、イソドリン (1235) + TX、イソフェンホス (123  
 6) + TX、イソラン (1237) + TX、イソプロカルブ (472) + TX、イソプロ  
 ピルO - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチレート (IUPAC名) (473) +  
 TX、イソプロチオラン (474) + TX、イソチオエート (1244) + TX、イソキ  
 サチオン (480) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、  
 ジャスモリンI (696) + TX、ジャスモリンII (696) + TX、ジヨドフェンホ  
 ス (1248) + TX、幼虫ホルモンI (代替名) [CCN] + TX、幼虫ホルモンII  
 (代替名) [CCN] + TX、幼虫ホルモンIII (代替名) [CCN] + TX、ケレバ  
 ン (1249) + TX、キノブレン (484) + TX、ラムダ - シハロトリン (198)  
 + TX、硫酸鉛 [CCN] + TX、レピメクチン (CCN) + TX、レプトホス (125  
 0) + TX、リンダン (430) + TX、リリムホス (1251) + TX、ルフェヌロン  
 (490) + TX、リチダチオン (1253) + TX、m - クメニルメチルカルバメート  
 (IUPAC名) (1014) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640)  
 + TX、マラチオン (492) + TX、マロノベン (1254) + TX、マジドクス (1  
 255) + TX、メカルバム (502) + TX、メカルホン (1258) + TX、メナゾ  
 ン (1260) + TX、メホスフォラン (1261) + TX、塩化第一水銀 (513) +  
 TX、メスルフェンホス (1263) + TX、メタフルミゾン (CCN) + TX、メタム  
 (519) + TX、メタム - カリウム (代替名) (519) + TX、メタム - ナトリウム  
 (519) + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、  
 フッ化メタンスルホニル (IUPAC / Chemical Abstracts名) (1  
 268) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メト  
 クロトホス (1273) + TX、メソミル (531) + TX、メトブレン (532) + T  
 X、メトキン - ブチル (1276) + TX、メトトリン (代替名) (533) + TX、メ  
 トキシクロル (534) + TX、メトキシフェノジド (535) + TX、臭化メチル (5  
 37) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、メチルクロロホルム (代替  
 名) [CCN] + TX、塩化メチレン [CCN] + TX、メトフルトリン [CCN] + T  
 X、メトルカルブ (550) + TX、メトキサジアゾン (1288) + TX、メピンホス  
 (556) + TX、メキサカルベート (1290) + TX、ミルベメクチン (557) +  
 TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、ミパホクス (1293) +  
 TX、ミレックス (1294) + TX、モノクロトホス (561) + TX、モルホチオン  
 (1300) + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ナフトロホス (代替  
 名) [CCN] + TX、ナレド (567) + TX、ナフトレン (IUPAC / Chemi  
 cal Abstracts名) (1303) + TX、NC - 170 (開発コード) (1  
 306) + TX、NC - 184 (化合物コード) + TX、ニコチン (578) + TX、ニ  
 コチンスルフェート (578) + TX、ニフルリジド (1309) + TX、ニテンピラム  
 (579) + TX、ニチアジン (1311) + TX、ニトリラカルブ (1313) + TX  
 、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 (1313) + TX、NNI - 0101 (化合物コ  
 ード) + TX、NNI - 0250 (化合物コード) + TX、ノルニコチン (従来の名称)  
 (1319) + TX、ノバルロン (585) + TX、ノビフルムロン (586) + TX、  
 O - 5 - ジクロロ - 4 - ヨードフェニルO - エチルエチルホスホノチオエート (IUPA  
 C名) (1057) + TX、O, O - ジエチルO - 4 - メチル - 2 - オキソ - 2H - クロ  
 メン - 7 - イルホスホロチオネート (IUPAC名) (1074) + TX、O, O - ジエ  
 チルO - 6 - メチル - 2 - プロピルピリミジン - 4 - イルホスホロチオネート (IUPA  
 C名) (1075) + TX、O, O, O', O' - テトラプロピルジチオピロホスフェート

10

20

30

40

50

( I U P A C 名 ) ( 1 4 2 4 ) + T X、オレイン酸 ( I U P A C 名 ) ( 5 9 3 ) + T X、オメトエート ( 5 9 4 ) + T X、オキサミル ( 6 0 2 ) + T X、オキシデメトン - メチル ( 6 0 9 ) + T X、オキシデプロホス ( 1 3 2 4 ) + T X、オキシジスルホトン ( 1 3 2 5 ) + T X、p p ' - D D T ( 2 1 9 ) + T X、パラ - ジクロロベンゼン [ C C N ] + T X、パラチオン ( 6 1 5 ) + T X、パラチオン - メチル ( 6 1 6 ) + T X、ベンフルロン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、ペンタクロロフェノール ( 6 2 3 ) + T X、ラウリン酸ペンタクロロフェニル ( I U P A C 名 ) ( 6 2 3 ) + T X、ペルメトリン ( 6 2 6 ) + T X、石油 ( 代替名 ) ( 6 2 8 ) + T X、P H 6 0 - 3 8 ( 開発コード ) ( 1 3 2 8 ) + T X、フェンカプトン ( 1 3 3 0 ) + T X、フェノトリン ( 6 3 0 ) + T X、フェントエート ( 6 3 1 ) + T X、ホレート ( 6 3 6 ) + T X、ホサロン ( 6 3 7 ) + T X、ホスホラン ( 1 3 3 8 ) + T X、ホスメット ( 6 3 8 ) + T X、ホスニクロル ( 1 3 3 9 ) + T X、ホスファミドン ( 6 3 9 ) + T X、ホスフィン ( I U P A C 名 ) ( 6 4 0 ) + T X、ホキシム ( 6 4 2 ) + T X、ホキシム - メチル ( 1 3 4 0 ) + T X、ピリメタホス ( 1 3 4 4 ) + T X、ピリミカーブ ( 6 5 1 ) + T X、ピリミホス - エチル ( 1 3 4 5 ) + T X、ピリミホス - メチル ( 6 5 2 ) + T X、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体 ( I U P A C 名 ) ( 1 3 4 6 ) + T X、ポリクロロテルペン ( 従来の名称 ) ( 1 3 4 7 ) + T X、亜ヒ酸カリウム [ C C N ] + T X、カリウムチオシアネート [ C C N ] + T X、プラレトリン ( 6 5 5 ) + T X、プレコセン I ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、プレコセン I I ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、プレコセン I I I ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、プリミドホス ( 1 3 4 9 ) + T X、プロフェノホス ( 6 6 2 ) + T X、プロフルトリン [ C C N ] + T X、プロマシル ( 1 3 5 4 ) + T X、プロメカルブ ( 1 3 5 5 ) + T X、プロパホス ( 1 3 5 6 ) + T X、プロペタムホス ( 6 7 3 ) + T X、プロボキスル ( 6 7 8 ) + T X、プロチダチオン ( 1 3 6 0 ) + T X、プロチオホス ( 6 8 6 ) + T X、プロトエート ( 1 3 6 2 ) + T X、プロトリフェンブト [ C C N ] + T X、ピメトロジン ( 6 8 8 ) + T X、ピラクロホス ( 6 8 9 ) + T X、ピラゾホス ( 6 9 3 ) + T X、ピレスメトリン ( 1 3 6 7 ) + T X、ピレトリン I ( 6 9 6 ) + T X、ピレトリン I I ( 6 9 6 ) + T X、ピレトリン ( 6 9 6 ) + T X、ピリダベン ( 6 9 9 ) + T X、ピリダリル ( 7 0 0 ) + T X、ピリダフェンチオン ( 7 0 1 ) + T X、ピリミジフェン ( 7 0 6 ) + T X、ピリミテート ( 1 3 7 0 ) + T X、ピリプロキシフェン ( 7 0 8 ) + T X、カシヤ ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、キナルホス ( 7 1 1 ) + T X、キナルホス - メチル ( 1 3 7 6 ) + T X、キノチオン ( 1 3 8 0 ) + T X、キンチオホス ( 1 3 8 1 ) + T X、R - 1 4 9 2 ( 開発コード ) ( 1 3 8 2 ) + T X、ラホキサニド ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、レスメスリン ( 7 1 9 ) + T X、ロテノン ( 7 2 2 ) + T X、R U 1 5 5 2 5 ( 開発コード ) ( 7 2 3 ) + T X、R U 2 5 4 7 5 ( 開発コード ) ( 1 3 8 6 ) + T X、リアニア ( 代替名 ) ( 1 3 8 7 ) + T X、リアノジン ( 従来の名称 ) ( 1 3 8 7 ) + T X、サバジラ ( 代替名 ) ( 7 2 5 ) + T X、シュラダン ( 1 3 8 9 ) + T X、セブホス ( 代替名 ) + T X、セラメクチン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、S I - 0 0 0 9 ( 化合物コード ) + T X、S I - 0 2 0 5 ( 化合物コード ) + T X、S I - 0 4 0 4 ( 化合物コード ) + T X、S I - 0 4 0 5 ( 化合物コード ) + T X、シラフルオフエン ( 7 2 8 ) + T X、S N 7 2 1 2 9 ( 開発コード ) ( 1 3 9 7 ) + T X、亜ヒ酸ナトリウム [ C C N ] + T X、シアン化ナトリウム ( 4 4 4 ) + T X、ナトリウムフッ化物 ( I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名 ) ( 1 3 9 9 ) + T X、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム ( 1 4 0 0 ) + T X、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩 ( 6 2 3 ) + T X、セレン酸ナトリウム ( I U P A C 名 ) ( 1 4 0 1 ) + T X、チオシアン酸ナトリウム [ C C N ] + T X、ソファミド ( 1 4 0 2 ) + T X、スピノサド ( 7 3 7 ) + T X、スピロメシフェン ( 7 3 9 ) + T X、スピロテトラマト ( C C N ) + T X、スルコフロン ( 7 4 6 ) + T X、スルコフロン - ナトリウム ( 7 4 6 ) + T X、スルフラミド ( 7 5 0 ) + T X、スルホテブ ( 7 5 3 ) + T X、スルフルルフッ化物 ( 7 5 6 ) + T X、スルプロホス ( 1 4 0 8 ) + T X、タール油 ( 代替名 ) ( 7 5 8 ) + T X、フルバリネート ( 3 9 8 ) + T X、チオナジン ( 1 4 1 2 ) + T X、T D E ( 1 4 1 4 ) + T X、テブフェノジド ( 7

10

20

30

40

50

62) + TX、テブフェンピラド(763) + TX、テブピリムホス(764) + TX、  
 テフルベンズロン(768) + TX、テフルトリン(769) + TX、テムホス(770)  
 ) + TX、TEPP(1417) + TX、テラレスリン(1418) + TX、テルバム(代  
 替名) + TX、テルブホス(773) + TX、テトラクロロエタン[CCN] + TX、  
 テトラクロルピンホス(777) + TX、テトラメトリン(787) + TX、 - シペル  
 メトリン(204) + TX、チアクロプリド(791) + TX、チアフェノクス(代替名  
 ) + TX、チアメトキサム(792) + TX、チクロホス(1428) + TX、チオカル  
 ボキシム(1431) + TX、チオシクラム(798) + TX、チオシクラム水素オキサ  
 レート(798) + TX、チオジカルブ(799) + TX、チオフアノックス(800)  
 + TX、チオメトン(801) + TX、チオナジン(1434) + TX、チオスルタツブ  
 (803) + TX、チオスルタツブ - ナトリウム(803) + TX、ツリングエンシン(代  
 替名)[CCN] + TX、トルフェンピラド(809) + TX、トラロメトリン(81  
 2) + TX、トランスフルトリン(813) + TX、トランスパーメトリン(1440)  
 + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアザメート(818) + TX、トリアゾ  
 ホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + T  
 X、トリクロルメタホス - 3(代替名)[CCN] + TX、トリクロロナト(1452)  
 + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリフルムロン(835) + TX、トリメ  
 タカルブ(840) + TX、トリプレン(1459) + TX、バミドチオン(847) +  
 TX、バニリプロール[CCN] + TX、ベラトリジン(代替名)(725) + TX、ベ  
 ラトリン(代替名)(725) + TX、XMC(853) + TX、キシリルカルブ(85  
 4) + TX、YI - 5302(化合物コード) + TX、 - シペルメトリン(205) +  
 TX、 - メトリン(代替名) + TX、亜鉛ホスフィド(640) + TX、ゾラプロホス(1  
 469)及びZXI 8901(開発コード)(858) + TX、シアントラニリプロ  
 ール[736994 - 63 - 19 + TX、クロラントラニリプロール[500008 - 4  
 5 - 7] + TX、シエノピラフェン[560121 - 52 - 0] + TX、シフルメトフェ  
 ン[400882 - 07 - 7] + TX、ピリフルキナゾン[337458 - 27 - 2] +  
 TX、スピネトラム[187166 - 40 - 1 + 187166 - 15 - 0] + TX、スピ  
 ロテトラマト[203313 - 25 - 1] + TX、スルホキサフロル[946578 - 0  
 0 - 3] + TX、フルフィプロール[704886 - 18 - 0] + TX、メベルフルトリ  
 ン[915288 - 13 - 0] + TX、テトラメチルフルトリン[84937 - 88 - 2  
 ] + TX、トリフルメゾピリン(国際公開第2012/092115号に開示) + TX、  
 フルキサメタミド(国際公開第2007/026965号) + TX、 - メトフルトリン  
 [240494 - 71 - 7] + TX、 - モンフルオロトリン[1065124 - 65 -  
 3] + TX、フルアザインドリジン[1254304 - 22 - 7] + TX、クロロブラレ  
 トリン[399572 - 87 - 3] + TX、フルキサメタミド[928783 - 29 - 3  
 ] + TX、シハロジアミド[1262605 - 53 - 7] + TX、チオキサザフェン[3  
 30459 - 31 - 9] + TX、プロフラニリド[1207727 - 04 - 5] + TX、  
 フルフィプロール[704886 - 18 - 0] + TX、シクラニリプロール[10317  
 56 - 98 - 5] + TX、テトラニリプロール[1229654 - 66 - 3] + TX、グ  
 アジピル(国際公開第2010/060231号に記載) + TX、シクロキサブリド(国  
 際公開第2005/077934号に記載) + TX、スピロビジオン + TX、アフィドピ  
 ロペン + TX、フルピリミン + TX、モンフルオロトリン + TX、 - ビフェントリン +  
 TX、 - テフルトリン + TX、ジクロロメゾチアズ + TX、テトラクロラニリプロール  
 + TX、ベンズピリモキサム + TX からなる物質群から選択される殺虫剤、  
 ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913) + TX、プロモアセタミド  
 [CCN] + TX、ヒ酸カルシウム[CCN] + TX、クロエトカルブ(999) + TX  
 、アセト亜ヒ酸銅[CCN] + TX、硫酸銅(172) + TX、フェンチン(347) +  
 TX、第二鉄リン酸塩(IUPAC名)(352) + TX、メタアルデヒド(518) +  
 TX、メチオカルブ(530) + TX、ニコロアミド(576) + TX、ニコロアミ  
 ド - オラミン(576) + TX、ペンタクロロフェノール(623) + TX、ペンタクロ

10

20

30

40

50

ロフェノキシドナトリウム塩 (623) + TX、チオナジン (1412) + TX、チオジカルブ (799) + TX、酸化トリブチルスズ (913) + TX、トリフェンモルフ (1454) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX、ピリプロール [394730-71-3] + TX からなる物質群から選択される殺軟体動物剤、AKD-3088 (化合物コード) + TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン (IUPAC/Chemical Abstracts名) (1045) + TX、1,2-ジクロロプロパン (IUPAC/Chemical Abstracts名) (1062) + TX、1,2-ジクロロプロパン + 1,3-ジクロロプロペン (IUPAC名) (1063) + TX、1,3-ジクロロプロペン (233) + TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド (IUPAC/Chemical Abstracts名) (1065) + TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルロダニン (IUPAC名) (980) + TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸 (IUPAC名) (1286) + TX、6-イソペンテニルアミノプリン (代替名) (210) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、ベンクロチアズ [CCN] + TX、ベノミル (62) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (945) + TX、カルボスルファン (119) + TX、クロルピクリン (141) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロエトカルブ (999) + TX、サイトカイニン (代替名) (210) + TX、ダゾメット (216) + TX、DBCP (1045) + TX、DCIP (218) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ジクロロフェンチオン (1051) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジメトエート (262) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エトプロホス (312) + TX、エチレンジブromid (316) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、ルフラール (代替名) [CCN] + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、カイネチン (代替名) (210) + TX、メカルホン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタム-カリウム (代替名) (519) + TX、メタム-ナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC-184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロチオフェン (IUPAC/Chemical Abstracts名) (1422) + TX、チアフエノクス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノルス [CCN] + TX、YI-5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [318290-98-1] + TX からなる物質群から選択される殺線虫剤、エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX からなる物質群から選択される硝化阻害剤、アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル (6) + TX、プロベナゾール (658) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*)

10

20

30

40

50

抽出物(代替名)(720)+TXからなる物質群から選択される植物活性化剤、  
 2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、  
 -クロロヒドリル[CCN]+TX、リン化マグネシウム(640)+TX、アンツ(880)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、炭酸バリウム(891)+TX、  
 ビスチオセミ(912)+TX、プロジファクム(89)+TX、プロマジオロン(91)+TX、  
 プロメタリン(92)+TX、シアン化カルシウム(444)+TX、クロラロース(127)+TX、  
 クロロファシノン(140)+TX、コレカルシフェロール(代替名)(850)+TX、  
 クマクロル(1004)+TX、クマフリル(1005)+TX、クマテトラリル(175)+TX、  
 クリミジン(1009)+TX、ジフェナクム(246)+TX、ジフェチアロン(249)+TX、  
 ジファシノン(273)+TX、エルゴカルシフェロール(301)+TX、  
 フロクマフェン(357)+TX、フルオロアセタミド(379)+TX、  
 フルプロパジン(1183)+TX、フルプロパジンヒドロクロリド(1183)+TX、  
 -HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、シアン化水素(444)+TX、  
 ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、リンダン(430)+TX、  
 リン化マグネシウム(IUPAC名)(640)+TX、臭化メチル(537)+TX、  
 ノルボルミド(1318)+TX、ホスアセチム(1336)+TX、  
 ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、リン[CCN]+TX、  
 ピンドン(1341)+TX、  
 亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、  
 プリヌロン(1371)+TX、  
 シリロシド(1390)+TX、  
 亜ヒ酸ナトリウム[CCN]+TX、  
 シアン化ナトリウム(444)+TX、  
 フルオロ酢酸ナトリウム(735)+TX、  
 ストリキニン(745)+TX、  
 硫酸タリウム[CCN]+TX、  
 ワルファリン(851)及び亜鉛ホスフィド(640)+TXからなる物質群から選択される殺鼠剤、  
 2-(2-ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート(IUPAC名)(934)+TX、  
 5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903)+TX、  
 ファルネソール+ネロリドール(代替名)(324)+TX、  
 MB-599(開発コード)(498)+TX、  
 MGK 264(開発コード)(296)+TX、  
 ピペロニルブトキシド(649)+TX、  
 ピプロタル(1343)+TX、  
 プロピル異性体(1358)+TX、  
 S421(開発コード)(724)+TX、  
 セサメックス(1393)+TX、  
 セサスモリン(1394)及びスルホキシド(1406)+TXからなる物質群から選択される共力剤、  
 アントラキノン(32)+TX、  
 クロラロース(127)+TX、  
 ナフテン酸銅[CCN]+TX、  
 オキシ塩化銅(171)+TX、  
 ダイアジノン(227)+TX、  
 ジシクロペンタジエン(化学名)(1069)+TX、  
 グアザチン(422)+TX、  
 グアザチン酢酸塩(422)+TX、  
 メチオカルブ(530)+TX、  
 ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)+TX、  
 チラム(804)+TX、  
 トリメタカルブ(840)+TX、  
 ナフテン酸亜鉛[CCN]及びジラム(856)+TXからなる物質群から選択される動物忌避剤、  
 イマニン(代替名)[CCN]及びリバピリン(代替名)[CCN]+TX  
 からなる物質群から選択される抗ウイルス剤、  
 酸化水銀(II)(512)+TX、  
 オクチリノン(590)及びチオファネート-メチル(802)+TXからなる物質群から選択される創傷保護剤、  
 並びに、  
 アザコナゾール(60207-31-0)+TX、  
 ビテルタノール[70585-36-3]+TX、  
 プロムコナゾール[116255-48-2]+TX、  
 シプロコナゾール[94361-06-5]+TX、  
 ジフェノコナゾール[119446-68-3]+TX、  
 ジニコナゾール[83657-24-3]+TX、  
 エポキシコナゾール[106325-08-0]+TX、  
 フェンブコナゾール[114369-43-6]+TX、  
 フルキンコナゾール[136426-54-5]+TX、  
 フルシラゾール[85509-19-9]+TX、  
 フルトリアホール[76674-21-0]+TX、  
 ヘキサコナゾール[79983-71-4]+TX、  
 イマザリル[35554-44-0]+TX、  
 イミ

10

20

30

40

50

ベンコナゾール [ 8 6 5 9 8 - 9 2 - 7 ] + T X、イブコナゾール [ 1 2 5 2 2 5 - 2 8  
 - 7 ] + T X、メトコナゾール [ 1 2 5 1 1 6 - 2 3 - 6 ] + T X、ミクロブタニル [ 8  
 8 6 7 1 - 8 9 - 0 ] + T X、ペフラゾエート [ 1 0 1 9 0 3 - 3 0 - 4 ] + T X、ペン  
 コナゾール [ 6 6 2 4 6 - 8 8 - 6 ] + T X、プロチオコナゾール [ 1 7 8 9 2 8 - 7 0  
 - 6 ] + T X、ピリフェノックス [ 8 8 2 8 3 - 4 1 - 4 ] + T X、プロクロラズ [ 6 7  
 7 4 7 - 0 9 - 5 ] + T X、プロピコナゾール [ 6 0 2 0 7 - 9 0 - 1 ] + T X、シメコ  
 ナゾール [ 1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7 ] + T X、テブコナゾール [ 1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3  
 ] + T X、テトラコナゾール [ 1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3 ] + T X、トリアジメホン [ 4 3  
 1 2 1 - 4 3 - 3 ] + T X、トリアジメノール [ 5 5 2 1 9 - 6 5 - 3 ] + T X、トリフ  
 ルミゾール [ 9 9 3 8 7 - 8 9 - 0 ] + T X、トリチコナゾール [ 1 3 1 9 8 3 - 7 2 -  
 7 ] + T X、アンシミドール [ 1 2 7 7 1 - 6 8 - 5 ] + T X、フェナリモル [ 6 0 1 6  
 8 - 8 8 - 9 ] + T X、ヌアリモル [ 6 3 2 8 4 - 7 1 - 9 ] + T X、ブピリメート [ 4  
 1 4 8 3 - 4 3 - 6 ] + T X、ジメチリモール [ 5 2 2 1 - 5 3 - 4 ] + T X、エチリモ  
 ール [ 2 3 9 4 7 - 6 0 - 6 ] + T X、ドデモルフ [ 1 5 9 3 - 7 7 - 7 ] + T X、フェ  
 ンプロピジン [ 6 7 3 0 6 - 0 0 - 7 ] + T X、フェンプロピモルフ [ 6 7 5 6 4 - 9 1  
 - 4 ] + T X、スピロキサミン [ 1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8 ] + T X、トリデモルフ [ 8 1  
 4 1 2 - 4 3 - 3 ] + T X、シブロジニル [ 1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2 ] + T X、メパニピ  
 リム [ 1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7 ] + T X、ピリメタニル [ 5 3 1 1 2 - 2 8 - 0 ] + T X  
 、フェンピクロニル [ 7 4 7 3 8 - 1 7 - 3 ] + T X、フルジオキサニル [ 1 3 1 3 4 1  
 - 8 6 - 1 ] + T X、ベナラキシル [ 7 1 6 2 6 - 1 1 - 4 ] + T X、フララキシル [ 5  
 7 6 4 6 - 3 0 - 7 ] + T X、メタラキシル [ 5 7 8 3 7 - 1 9 - 1 ] + T X、R - メタ  
 ラキシル [ 7 0 6 3 0 - 1 7 - 0 ] + T X、オフレース [ 5 8 8 1 0 - 4 8 - 3 ] + T X  
 、オキサジキシル [ 7 7 7 3 2 - 0 9 - 3 ] + T X、ベノミル [ 1 7 8 0 4 - 3 5 - 2 ]  
 + T X、カルベンダジム [ 1 0 6 0 5 - 2 1 - 7 ] + T X、デバカルブ [ 6 2 7 3 2 - 9  
 1 - 6 ] + T X、フベリダゾール [ 3 8 7 8 - 1 9 - 1 ] + T X、チアベンダゾール [ 1  
 4 8 - 7 9 - 8 ] + T X、クロゾリネート [ 8 4 3 3 2 - 8 6 - 5 ] + T X、ジクロゾリ  
 ン [ 2 4 2 0 1 - 5 8 - 9 ] + T X、イブロジオン [ 3 6 7 3 4 - 1 9 - 7 ] + T X、ミ  
 クロゾリン [ 5 4 8 6 4 - 6 1 - 8 ] + T X、プロシミドン [ 3 2 8 0 9 - 1 6 - 8 ] +  
 T X、ピンクロゾリン [ 5 0 4 7 1 - 4 4 - 8 ] + T X、ボスカリド [ 1 8 8 4 2 5 - 8  
 5 - 6 ] + T X、カルボキシシン [ 5 2 3 4 - 6 8 - 4 ] + T X、フェンフラム [ 2 4 6 9  
 1 - 8 0 - 3 ] + T X、フルトラニル [ 6 6 3 3 2 - 9 6 - 5 ] + T X、メプロニル [ 5  
 5 8 1 4 - 4 1 - 0 ] + T X、オキシカルボキシシン [ 5 2 5 9 - 8 8 - 1 ] + T X、ペン  
 チオピラド [ 1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3 ] + T X、チフルザミド [ 1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7  
 ] + T X、グアザチン [ 1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6 ] + T X、ドジン [ 2 4 3 9 - 1 0 - 3  
 ] [ 1 1 2 - 6 5 - 2 ] ( 遊離塩基 ) + T X、イミノクタジン [ 1 3 5 1 6 - 2 7 - 3 ]  
 + T X、アゾキシストロピン [ 1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8 ] + T X、ジモキシストロピン [  
 1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4 ] + T X、エネストロプリン { P r o c . B C P C , I n t . C  
 o n g r . , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + T X、フルオキサストロピン [ 3  
 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9 ] + T X、クレソキシム - メチル [ 1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0 ] + T  
 X、メトミノストロピン [ 1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1 ] + T X、トリフロキシストロピン [  
 1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7 ] + T X、オリザストロピン [ 2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0 ] + T X  
 、ピコキシストロピン [ 1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5 ] + T X、ピラクロストロピン [ 1 7 5  
 0 1 3 - 1 8 - 0 ] + T X、フェルバム [ 1 4 4 8 4 - 6 4 - 1 ] + T X、マンコゼブ [  
 8 0 1 8 - 0 1 - 7 ] + T X、マンネブ [ 1 2 4 2 7 - 3 8 - 2 ] + T X、メチラム [ 9  
 0 0 6 - 4 2 - 2 ] + T X、プロピネブ [ 1 2 0 7 1 - 8 3 - 9 ] + T X、チラム [ 1 3  
 7 - 2 6 - 8 ] + T X、ジネブ [ 1 2 1 2 2 - 6 7 - 7 ] + T X、ジラム [ 1 3 7 - 3 0  
 - 4 ] + T X、カプタホール [ 2 4 2 5 - 0 6 - 1 ] + T X、キャプタン [ 1 3 3 - 0 6  
 - 2 ] + T X、ジクロフルアニド [ 1 0 8 5 - 9 8 - 9 ] + T X、フルオロイミド [ 4 1  
 2 0 5 - 2 1 - 4 ] + T X、ホルベット [ 1 3 3 - 0 7 - 3 ] + T X、トリルフルアニド  
 [ 7 3 1 - 2 7 - 1 ] + T X、ボルドー液 [ 8 0 1 1 - 6 3 - 0 ] + T X、水酸化銅 ( c

10

20

30

40

50

opperhydroxid) [20427-59-2]+TX、オキシ塩化銅(copperoxychlorid) [1332-40-7]+TX、硫酸銅(coppersulfat) [7758-98-7]+TX、酸化銅(copperoxid) [1317-39-1]+TX、マンカップー[53988-93-5]+TX、オキシ銅[10380-28-6]+TX、ジノカップ[131-72-6]+TX、ニトロタール-イソプロピル[10552-74-6]+TX、エディフェンホス[17109-49-8]+TX、イプロベンホス[26087-47-8]+TX、イソプロチオラン[50512-35-1]+TX、ホスジフェン[36519-00-3]+TX、ピラゾホス[13457-18-6]+TX、トルコホス-メチル[57018-04-9]+TX、アシベンゾラル-S-メチル[135158-54-2]+TX、アニラジン[101-05-3]+TX、ベンチアバリカルブ[413615-35-7]+TX、プラストサイジン-S[2079-00-7]+TX、チノメチオナート[2439-01-2]+TX、クロロネブ[2675-77-6]+TX、クロロタロニル[1897-45-6]+TX、シフルフェナミド[180409-60-3]+TX、シモキサニル[57966-95-7]+TX、ジクロン[117-80-6]+TX、ジクロシメット[139920-32-4]+TX、ジクロメジン[62865-36-5]+TX、ジクロラン[99-30-9]+TX、ジエトフェンカルブ[87130-20-9]+TX、ジメトモルフ[110488-70-5]+TX、SYP-LI90(フルモルフ)[211867-47-9]+TX、ジチアノン[3347-22-6]+TX、エタボキサム[162650-77-3]+TX、エトリジアゾール[2593-15-9]+TX、ファモキサドン[131807-57-3]+TX、フェンアミドン[161326-34-7]+TX、フェノキサニル[115852-48-7]+TX、フェンチン[668-34-8]+TX、フェリムゾン[89269-64-7]+TX、フルアジナム[79622-59-6]+TX、フルオピコリド[239110-15-7]+TX、フルスルファミド[106917-52-6]+TX、フェンヘキサミド[126833-17-8]+TX、ホセチル-アルミニウム[39148-24-8]+TX、ヒメキサゾール[10004-44-1]+TX、イプロバリカルブ[140923-17-7]+TX、IKF-916(シアゾファミド)[120116-88-3]+TX、カスガマイシン[6980-18-3]+TX、メタスルホカルブ[66952-49-6]+TX、メトラフェノン[220899-03-6]+TX、ペンシクロン[66063-05-6]+TX、フタリド[27355-22-2]+TX、ポリオキシシン[11113-80-7]+TX、プロベナゾール[27605-76-1]+TX、プロパモカルブ[25606-41-1]+TX、プロキナジド[189278-12-4]+TX、ピロキロン[57369-32-1]+TX、キノキシフェン[124495-18-7]+TX、キントゼン[82-68-8]+TX、硫黄[7704-34-9]+TX、チアジニル[223580-51-6]+TX、トリアゾキシド[72459-58-6]+TX、トリシクラゾール[41814-78-2]+TX、トリホリン[26644-46-2]+TX、バリダマイシン[37248-47-8]+TX、ゾキサミド(RH7281)[156052-68-5]+TX、マンジプロパミド[374726-62-2]+TX、イソピラザム[881685-58-1]+TX、セダキサン[874967-67-6]+TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(9-ジクロロメチレン-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノ-ナフタレン-5-イル)-アミド(国際公開第2007/048556号に開示)+TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(3',4',5'-トリフルオロ-ピフェニル-2-イル)-アミド(国際公開第2006/087343号に開示)+TX、[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-デカヒドロ-6,12-ジヒドロキシ-4,6a,12b-トリメチル-11-オキソ-9-(3-ピリジニル)-2H,11Hナフト[2,1-b]ピラノ[3,4-e]ピラン-4-イル]メチル-シクロプロパンカルボキシレー

10

20

30

40

50

ト [ 9 1 5 9 7 2 - 1 7 - 7 ] + T X、及び 1, 3, 5 - トリメチル - N - ( 2 - メチル - 1 - オキソプロピル ) - N - [ 3 - ( 2 - メチルプロピル ) - 4 - [ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ] フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [ 9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8 ] + T X ; ランコトリオン [ 1 4 8 6 6 1 7 - 2 1 - 3 ] + T X、フロルピラウキシフェン [ 9 4 3 8 3 2 - 8 1 - 3 ] ] + T X、イブフェントリフルコナゾール [ 1 4 1 7 7 8 2 - 0 8 - 1 ] + T X、メフェントリフルコナゾール [ 1 4 1 7 7 8 2 - 0 3 - 6 ] + T X、キノフメリン [ 8 6 1 6 4 7 - 8 4 - 9 ] + T X、クロロブラレトリン [ 3 9 9 5 7 2 - 8 7 - 3 ] + T X、シハロジアミド [ 1 2 6 2 6 0 5 - 5 3 - 7 ] ] + T X、フルアザインドリジン [ 1 2 5 4 3 0 4 - 2 2 - 7 ] + T X、フルキサメタミド [ 9 2 8 7 8 3 - 2 9 - 3 ] + T X、 - メトフルトリン [ 2 4 0 4 9 4 - 7 1 - 7 ] + T X、 - モンフルオロトリン [ 1 0 6 5 1 2 4 - 6 5 - 3 ] + T X、ピジフルメトフェン [ 1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7 ] + T X、 - ビフェントリン [ 4 3 9 6 8 0 - 7 6 - 9 ] + T X、プロフラニリド [ 1 2 0 7 7 2 7 - 0 4 - 5 ] + T X、ジクロロメゾチアズ [ 1 2 6 3 6 2 9 - 3 9 - 5 ] + T X、ジピメチトロン [ 1 6 1 1 4 - 3 5 - 5 ] + T X、ピラジフルミド [ 9 4 2 5 1 5 - 6 3 - 1 ] + T X、及び - テフルトリン [ 3 9 1 6 3 4 - 7 1 - 2 ] + T X からなる群から選択される生物学的に有効な化合物 ; 並びに

以下を含む微生物 : アシネトバクテールオフィイ ( *Acinetobacter lwoffii* ) + T X、アクレモニウムアルテルナタム ( *Acremonium alternatum* ) + T X + T X、アクレモニウムセファロスポリウム ( *Acremonium cephalosporium* ) + T X + T X、アクレモニウムジオスピリ ( *Acremonium diospyri* ) + T X、アクレモニウムオブカラバタム ( *Acremonium obclavatum* ) + T X、アドキソフィイスオラナグラヌロヴィルス ( *Adoxophyes orana granulovirus* ) ( Adox GV ) ( Capex ( 登録商標 ) ) + T X、アグロバクテリウムラジオバクター ( *Agrobacterium radiobacter* ) 菌株 K 8 4 ( Galltrol - A ( 登録商標 ) ) + T X、アルテルナリアアルテルナータ ( *Alternaria alternata* ) + T X、アルテルナリアカッシア ( *Alternaria cassia* ) + T X、アルテルナリアデストルエンシス ( *Alternaria destruens* ) ( Smolder ( 登録商標 ) ) + T X、アムペロマイセスキスクアリス ( *Ampelomyces quisqualis* ) ( AQ 1 0 ( 登録商標 ) ) + T X、アスペルギルスフラブス AF 3 6 ( *Aspergillus flavus* AF 3 6 ) ( AF 3 6 ( 登録商標 ) ) + T X、アスペルギルスフラブス ( *Aspergillus flavus* ) NRRL 2 1 8 8 2 ( Aflaguard ( 登録商標 ) ) + T X、アスペルギルス属の一種 ( *Aspergillus* spp. ) + T X、アウレオバシジウムプルランス ( *Aureobasidium pullulans* ) + T X、アゾスピリルム属 ( *Azospirillum* ) + T X、 ( MicroAZ ( 登録商標 ) + T X、TAZO B ( 登録商標 ) ) + T X、アゾトバクター ( *Azotobacter* ) + T X、アゾトバクタークロオクカム ( *Azotobacter chroococcum* ) ( Azotomeal ( 登録商標 ) ) + T X、アゾトバクターシスツ ( *Azotobacter cysts* ) ( Bionatural Blooming Blossoms ( 登録商標 ) ) + T X、バチルスアミロリケファシエンシス ( *Bacillus amyloliquefaciens* ) + T X、バチルスセレウス ( *Bacillus cereus* ) + T X、バチルスキチノスポルス ( *Bacillus chitinosporus* ) 菌株 CM - 1 + T X、バチルスチノスポルス ( *Bacillus chitinosporus* ) 菌株 AQ 7 4 6 + T X、バチルスリケニホルミス ( *Bacillus licheniformis* ) 菌株 HB - 2 ( Biostart<sup>TM</sup> Rhizoboost ( 登録商標 ) ) + T X、バチルスリケニホルミス ( *Bacillus licheniformis* ) 菌株 3 0 8 6 ( EcoGuard ( 登録商標 ) ) + T X、Green Releaf ( 登録商標 ) ) + T X、バチルスシルクランシス ( *Bacillus circulans* ) + T X、バチルスフィルムス ( *Baci*

10

20

30

40

50

*illus firmus*) (BioSafe (登録商標) + TX、BioNem-WP (登録商標) + TX、VOTiVO (登録商標) + TX、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) 菌株 I-1582 + TX、バチルスマセランス (*Bacillus macerans*) + TX、バチルスマリスマルツイ (*Bacillus marismortui*) + TX、バチルスメガテリウム (*Bacillus megaterium*) + TX、バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) 菌株 AQ726 + TX、バチルスパピラエ (*Bacillus papillae*) (Milky Spore Powder (登録商標)) + TX、バチルスプミルス属の一種 (*Bacillus pumilus* spp.) + TX、バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株 GB34 (Yield Shield (登録商標)) + TX、バチルス  
 10  
 プミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株 AQ717 + TX、バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株 QST 2808 (Sonata (登録商標)) + TX、Ballad Plus (登録商標) + TX、バチルススパヘリクス (*Bacillus spahericus*) (VectoLex (登録商標)) + TX、バチルス属の一種 (*Bacillus* spp.) + TX、バチルス属の一種 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ175 + TX、バチルス属の一種 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ177 + TX、バチルス属の一種 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ178 + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST713 (CEASE (登録商標) + TX、Serenade (登録商標) + TX、Rhapsody (登録商標) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST 714 (JAZZ (登録商標)) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 AQ153 + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 AQ743 + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST3002 + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST3004 + TX、バチルスサブチリス var. アミロリクエファシエンス (*Bacillus subtilis* var. amyloliquefaciens) 菌株 FZB24 (Taegro (登録商標) + TX、Rhizopro (登録商標) + TX、バチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry 2Ae + TX、バチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry 1Ab + TX、バチルスチューリン  
 20  
 ゲンシスアイザワイ (*Bacillus thuringiensis aizawai*) GC 91 (Agree (登録商標)) + TX、バチルスチューリンゲンシスイスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israelensis*) (BMP123 (登録商標) + TX、Aquabac (登録商標) + TX、VectoBac (登録商標)) + TX、バチルスチューリンゲンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (Javelin (登録商標) + TX、Deliver (登録商標) + TX、CryMax (登録商標) + TX、Bonide (登録商標) + TX、Scutella WP (登録商標) + TX、Turilav WP (登録商標) + TX、Astuto (登録商標) + TX、Dipel WP (登録商標) + TX、Biobit (登録商標) + TX、Foray (登録商標)) + TX、バチルス  
 30  
 チューリンゲンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) BMP 123 (Baritone (登録商標)) + TX、バチルスチューリンゲンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) HD-1 (Bioprotect-CAF/3P (登録商標)) + TX、バチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株 BD#32 + TX、バチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株 AQ52 + TX、バチルスチューリンゲンシス var. アイザワイ (*Bacillus thuringiensis* var. aizawai) (XenTari (登録商標) + TX、Dipel (登録商標)) + TX、バクテリア属の一種 (*bacteria* spp.) (GROWMEND (登録商標) + TX、GROWSWEET (登録商標  
 40  
 50

)+TX、Shootup(登録商標)+TX、クラビパクターミシガンシス(*Clavipacter michiganensis*)のバクテリオファージ(*AgriPhage*(登録商標))+TX、Bakflor(登録商標)+TX、ベアウベリアバッシアナ(*Beauveria bassiana*)(*Beaugenic*(登録商標))+TX、Brocaril WP(登録商標)+TX、ベアウベリアバッシアナGHA(*Beauveria bassiana* GHA)(*Mycotrol ES*(登録商標))+TX、*Mycotrol O*(登録商標)+TX、*BotaniGuard*(登録商標))+TX、ベアウベリアブロングニアルチイ(*Beauveria brongniartii*)(*Engerlingspilz*(登録商標))+TX、*Schweizer Beauveria*(登録商標)+TX、*Melocont*(登録商標))+TX、ポーベリア属の一種(*Beauveria* spp.)+TX、ボトリチスシネリア(*Botrytis cineria*)+TX、ダイズ根粒菌(*Bradyrhizobium japonicum*)(*TerraMax*(登録商標))+TX、*Brevibacillus brevis*(登録商標))+TX、バチルスチューリンゲンシステネブリオニス(*Bacillus thuringiensis tenebrionis*)(*Novodor*(登録商標))+TX、*BtBooster*+TX、バークホルデリアセパシア(*Burkholderia cepacia*)(*Deny*(登録商標))+TX、*Intercept*(登録商標))+TX、*Blue Circle*(登録商標))+TX、バークホルデリアグラジイ(*Burkholderia gladii*)+TX、バークホルデリアグラジオリ(*Burkholderia gladioli*)+TX、バークホルデリア属の一種(*Burkholderia* spp.)+TX、カナディアンチスルファンガス(*Canadian thistle fungus*)(*CBH Canadian Bioherbicide*(登録商標))+TX、カンジダブチリ(*Candida butyri*)+TX、カンジダファミタ(*Candida famata*)+TX、カンジダフルクツス(*Candida fructus*)+TX、カンジダグラブラタ(*Candida glabrata*)+TX、カンジダグイリエルモンチイ(*Candida guilliermondii*)+TX、カンジダメリビオシカ(*Candida melibiosica*)+TX、カンジダオレフィラ(*Candida oleophila*)菌株O+TX、カンジダパラブシロシス(*Candida parapsilosis*)+TX、カンジダペリクロサ(*Candida pelliculosa*)+TX、カンジダプルケリマ(*Candida pulcherrima*)+TX、カンジダレウカウフィイ(*Candida reukaufii*)+TX、カンジダサイトアナ(*Candida saitoana*)(*Bio-Coat*(登録商標))+TX、*Biocure*(登録商標))+TX、カンジダサケ(*Candida sake*)+TX、カンジダ属の一種(*Candida* spp.)+TX、カンジダテニウス(*Candida tenuis*)+TX、セデセアドラビサエ(*Cedecea dravisae*)+TX、セルモナスフラビゲナ(*Cellulomonas flavigena*)+TX、カエトミウムコクリオデス(*Chaetomium cochliodes*)(*Nova-Cide*(登録商標))+TX、カエトミウムグロボスム(*Chaetomium globosum*)(*Nova-Cide*(登録商標))+TX、クロモバクテリウムサブツガエ(*Chromobacterium subtsugae*)菌株PRAA4-1T(*Grandevo*(登録商標))+TX、クラドスポリウムクラドスポリオイデス(*Cladosporium cladosporioides*)+TX、クラドスポリウムオキシスポルム(*Cladosporium oxysporum*)+TX、クラドスポリウムクロロセファルム(*Cladosporium chlorocepalum*)+TX、クラドスポリウム属の一種(*Cladosporium* spp.)+TX、クラドスポリウムテヌイシマム(*Cladosporium tenuissimum*)+TX、クロノスタキスロゼア(*Clonostachys rosea*)(*EndoFine*(登録商標))+TX、コレトトリカムアクタタム(*Colletotrichum acutatum*)+TX、コニオチリウムミニタンス(*Conio*

*thyrium minitans*) (Cotans WG (登録商標)) + TX、コニオチリウム属の一種 (*Coniothyrium spp.*) + TX、クリプトコッカスアルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS (登録商標)) + TX、クリプトコッカスフミコラ (*Cryptococcus Humicola*) + TX、クリプトコッカスインフィルミニアツス (*Cryptococcus infirmo-miniatum*) + TX、クリプトコッカスラウレンチイ (*Cryptococcus laurentii*) + TX、クリプトフレビアロイコトレタグラニューロウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (Cryptex (登録商標)) + TX、クプリアビダスカムピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) + TX、シジアポモネラグラニューロウイルス (10  
*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X (登録商標)) + TX、シジアポモネラグラニューロウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (Madex (登録商標)) + TX、Madex Plus (登録商標) + TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標) + TX、エビコウヤクタケ (*Cylindrobasidium laeve*) (Stump out (登録商標)) + TX、シリンドロクラジウム属 (*Cylindrocladium*) + TX、デバリオマイセスハンセニイ (*Debaryomyces hansenii*) + TX、ドレックスレラハワイイネンシス (*Drechslera hawaiiensis*) + TX、エンテロバクタークロアカ (*Enterobacter cloacae*) + TX、エンテロバクターイアカ (20  
*Enterobacteriaceae*) + TX、エントモフトラヴィルレンタ (*Entomophthora virulenta*) (Vektor (登録商標)) + TX、エピコッカムニグラム (*Epicoccum nigrum*) + TX、エピコッカムプルプラセンス (*Epicoccum purpurascens*) + TX、エピコッカム属の一種 (*Epicoccum spp.*) + TX、フィロバシジウムフロリホルメ (*Filobasidium floriforme*) + TX、フザリウムアクミナタム (*Fusarium acuminatum*) + TX、フザリウムクラミドスポルム (*Fusarium chlamydosporum*) + TX、フザリウムオキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) (Fusaclean (登録商標) / Biofox C (登録商標)) + TX、フザリウムブラリフェラタム (*Fusarium proliferatum*) + TX、フザリウム属の一種 (30  
*Fusarium spp.*) + TX、グララクトマイセスゲオトリクム (*Galactomyces geotrichum*) + TX、グリオクラジウムカテナラタム (*Gliocladium catenulatum*) (Primastop (登録商標)) + TX、Prestop (登録商標) + TX、グリオクラジウムロセウム (*Gliocladium roseum*) + TX、グリオクラジウム属の一種 (*Gliocladium spp.*) (SoilGard (登録商標)) + TX、グリオクラジウムピレンス (*Gliocladium virens*) (Soilgard (登録商標)) + TX、グラニューロウイルス (*Granulovirus*) (Granupom (登録商標)) + TX、ハロバシルスハロフィルス (*Halobacillus halophilus*) + TX、ハロバシルスリトラリス (*Halobacillus litoralis*) + TX、ハロバシルストルエペリ (*Halobacillus trueperi*) + TX、ハロモナス属の一種 (*Halomonas spp.*) + TX、ハロモナススブグラシエスコラ (*Halomonas subglaciescola*) + TX、ハロビブリオバリアビイス (*Halovibrio variabilis*) + TX、ハンセニアスポラウバルム (*Hanseniaspora uvarum*) + TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多核体ウイルス (*Helicovex* (登録商標)) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多角体病ウイルス (*Gemstar* (登録商標)) + TX、イソフラボン - ホルモノネチン (*Myconate* (登録商標)) + TX、クロエケラアピクラタ (*Kloeckera apiculata*) + TX、クロエケラ属の一種 (*Kloeckera spp.*) + TX、ラゲニジウ 50

ムギガンテウム (*Lagenidium giganteum*) (*Laginex* (登録商標)) + TX、オンシツコナジラミ (*Lecanicillium longisporum*) (*Vertiblast* (登録商標)) + TX、レカニシリウムムスカリウム (*Lecanicillium muscarium*) (*Vertikil* (登録商標)) + TX、マイマイガ (*Lymantria dispar*) 核多角体病ウイルス (*Disparvirus* (登録商標)) + TX、マリノコッカスハロフィルス (*Marinococcus halophilus*) + TX、メイラゲウラコニギイ (*Meirageulakonigii*) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*) (*Met52* (登録商標)) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*) (*Destruxin WP* (登録商標)) + TX、メチニコピアフルチコラ (*Metschnikowia fruticola*) (*Shemer* (登録商標)) + TX、メチニコピアブルケリマ (*Metschnikowia pulcherrima*) + TX、ミクロドキウムジメルム (*Micrdochium dimerum*) (*Antibot* (登録商標)) + TX、ミクロモノスポラコエルレア (*Micromonospora coerulea*) + TX、ミクロスファエロプシスオクラセア (*Microsphaeropsis ochracea*) + TX、ムスコドルアルブス (*Muscodor albus*) 620 (*Muscudor* (登録商標)) + TX、ムスコドルロセウス (*Muscodor roseus*) 菌株 A3-5 + TX、ミコルヒザエ属の一種 (*Mycorrhizae spp.*) (*AMykor* (登録商標)) + TX、根 *Maximizer* (登録商標)) + TX、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 菌株 AARC-0255 (*DiTera* (登録商標)) + TX、BROS PLUS (登録商標) + TX、オフィオストマピリフェルム (*Ophiostoma piliiferum*) 菌株 D97 (*Sylvanex* (登録商標)) + TX、

パエシロマイセスファリノス (*Paecilomyces farinosus*) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosorosus*) (*PFR-97* (登録商標)) + TX、PreFeRal (登録商標) + TX、パエシロマイセスリナシヌス (*Paecilomyces linacinus*) (*Biostat WP* (登録商標)) + TX、パエシロマイセスリラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株 251 (*MeloCon WG* (登録商標)) + TX、

パエニバチルスポリミクサ (*Paenibacillus polymyxa*) + TX、パントエアアグロメラン (*Pantoea agglomerans*) (*BlightBan C9-1* (登録商標)) + TX、パントエア属の一種 (*Pantoea spp.*) + TX、パストゥリア属の一種 (*Pasteuria spp.*) (*Econem* (登録商標)) + TX、パストゥリアニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウムオーランチオグリセウム (*Penicillium antiogriseum*) + TX、ペニシリウムビライ (*Penicillium billai*) (*Jumpstart* (登録商標)) + TX、TagTeam (登録商標) + TX、ペニシリウムブレビコンパクト (*Penicillium brevicompactum*) + TX、ペニシリウムフレクエンタンス (*Penicillium frequentans*) + TX、ペニシリウムグリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) + TX、ペニシリウムプルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) + TX、ペニシリウム属の一種 (*Penicillium spp.*) + TX、ペニシリウムビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオプシスゲガンテアン (*Phlebiopsis gigantean*) (*Rotstop* (登録商標)) + TX、リン溶解菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) + TX、フィトフトラクリプトギア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フィトフトラパルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (*Devine* (登録商標)) + TX、ピチアアノマラ (*Pichia anomala*) + TX、ピチアゲイレルモンディイ (*Pichia guiler*

mondi i) + TX、ピチアメンブランファイエンス (*Pichia membran*  
*aefaciens*) + TX、ピチアオニキス (*Pichia onychis*) + TX  
 、ピチアスチピテス (*Pichia stipites*) + TX、緑膿菌 (*Pseudo*  
*monas aeruginosa*) + TX、シュードモナスアウレオファシエンス (*P*  
*seudomonas aureofasciens*) (Spot-Less Biofu  
 ngicide (登録商標)) + TX、シュードモナスセパシア (*Pseudomona*  
*s cepacia*) + TX、シュードモナスクロロラフィス (*Pseudomonas*  
*chlororaphis*) (AtEze (登録商標)) + TX、シュードモナスコルゲ  
 ート (*Pseudomonas corrugate*) + TX、シュードモナスフルオレ  
 ッセンス (*Pseudomonas fluorescens*) 菌株 A506 (Blig  
 htBan A506 (登録商標)) + TX、シュードモナスプチダ (*Pseudomo*  
*nas putida*) + TX、シュードモナスリアクタンズ (*Pseudomonas*  
*reactans*) + TX、シュードモナス属の一種 (*Pseudomonas spp*  
 .) + TX、シュードモナス シリンガエ (*Pseudomonas syringae*)  
 (Bio-Save (登録商標)) + TX、シュードモナスビリジフラバ (*Pseudo*  
*monas viridiflava*) + TX、シュードモナスフルオレックス (*Ps*  
*eu-domons fluorescens*) (Zequanox (登録商標)) + TX  
 、シュードジマフロクロッサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 PF  
 - A22UL (Sporodex L (登録商標)) + TX、プッシニアカナリクラタ (  
*Puccinia canaliculata*) + TX、プッシニアトラスペオス (*Pu*  
*ccinia thlaspeos*) (Wood Warrior (登録商標)) + TX、  
 ピシウムパロエカンドルム (*Pythium paroecandrum*) + TX、ピシ  
 ウムオリガンドラム (*Pythium oligandrum*) (Polygandro  
 n (登録商標)) + TX、Polyversum (登録商標)) + TX、ピシウムペリプロ  
 クム (*Pythium periplocum*) + TX、ラネラアクアチリス (*Rhan*  
*ella aquatilis*) + TX、ラネラ属の一種 (*Rhanella spp.*)  
 + TX、根粒菌 (Dormal (登録商標)) + TX、Vault (登録商標)) + TX、  
 リゾクトニア属の一種 (*Rhizoctonia*) + TX、ロドコッカスグロベルルス (  
*Rhodococcus globerulus*) 菌株 AQ719 + TX、ロドスポリジ  
 ウムディオボバタム (*Rhodosporeidium diobovatum*) + TX、  
 ロドスポリジウムトルロイデス (*Rhodosporeidium toruloides*  
 ) + TX、ロドトルラ属の一種 (*Rhodotorula spp.*) + TX、ドトル  
 ラグルチニス (*Rhodotorula glutinis*) + TX、ロドトルラグラミ  
 ニス (*Rhodotorula graminis*) + TX、ロドトルラムシラグノサ (  
*Rhodotorula mucilagnosa*) + TX、ロドトルラルブラ (*Rho*  
*dotorula rubra*) + TX、サッカロマイセスセレピシエ (*Sacchar*  
*omyces cerevisiae*) + TX、サリノコッカスロセウス (*Salino*  
*coccus roseus*) + TX、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia*  
*minor*) + TX、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*) (  
 SARRITOR (登録商標)) + TX、シタリジウム属の一種 (*Scytalidiu*  
*m spp.*) + TX、シタリジウムウレジニコラ (*Scytalidium uredi*  
*nicola*) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 核  
 多角体病ウイルス (Spod-X (登録商標)) + TX、Spexit (登録商標)) + T  
 X、セラチアマルセセンス (*Serratia marcescens*) + TX、セラチ  
 アプリムシカ (*Serratia plymuthica*) + TX、セラチア属の一種 (  
*Serratia spp.*) + TX、ソルダリアフィミコラ (*Sordaria fim*  
*icola*) + TX、  
 エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) 核多核体ウイルス (*L*  
*ittovir* (登録商標)) + TX、スポロボロミセスロセウス (*Sporobolo*  
*myces roseus*) + TX、ステノトロホモナスマルトフィリア (*Stenot*

10

20

30

40

50

ropomonas maltophilia)+TX、ストレプトマイセスアヒグロ  
 スコピクス(Streptomyces ahygroscopicus)+TX、スト  
 レプトマイセスアルバドンカス(Streptomyces albaduncus)+  
 TX、ストレプトマイセスエクサホリアテス(Streptomyces exfoli  
 ates)+TX、ストレプトマイセスガルブス(Streptomyces galb  
 us)+TX、ストレプトマイセスグリセオブラヌス(Streptomyces gr  
 iseoplanus)+TX、ストレプトマイセスグリセオビリディス(Strept  
 omyces griseoviridis)(Mycostop(登録商標))+TX  
 、ストレプトマイセスリディクス(Streptomyces lydicus)(Ac  
 tinovate(登録商標))+TX、ストレプトマイセスリディクス(Strept  
 omyces lydicus)WYEC-108(ActinoGrow(登録商標)  
 )+TX、ストレプトマイセスビオラセウス(Streptomyces violac  
 eus)+TX、チレチオブシスミノル(Tilletiopsis minor)+T  
 X、チレチオブシス属の一種(Tilletiopsis spp.)+TX、トリコデ  
 ルマアスペレルム(Trichoderma asperellum)(T34 Bioc  
 ontrol(登録商標))+TX、トリコデルマガムシイ(Trichoderma  
 gamsii)(Tenet(登録商標))+TX、トリコデルマアトロビリデ(Tri  
 choderma atroviride)(Plantmate(登録商標))+TX  
 、トリコデルマハマツム(Trichoderma hamatum)TH382+TX  
 、トリコデルマハルジアヌムリファイ(Trichoderma harzianum r  
 ifai)(Mycostar(登録商標))+TX、トリコデルマハルジアヌム(Tri  
 choderma harzianum)T-22(Trianum-P(登録商標)  
 )+TX、PlantShield HC(登録商標)+TX、RootShield(登  
 録商標)+TX、Trianum-G(登録商標))+TX、トリコデルマハルジアヌム  
 (Trichoderma harzianum)T-39(Trichodex(登録  
 商標))+TX、トリコデルマインハマツム(Trichoderma inhamat  
 um)+TX、トリコデルマコニンギイ(Trichoderma koningii)  
 +TX、トリコデルマ属の一種(Trichoderma spp.)LC 52(Sen  
 tinel(登録商標))+TX、トリコデルマリグノルム(Trichoderma  
 lignorum)+TX、トリコデルマロンギブラキアタム(Trichoderma  
 longibrachiatum)+TX、トリコデルマポリスポルム(Trichod  
 erma polysporum)(Binab T(登録商標))+TX、トリコデルマ  
 タクシ(Trichoderma taxi)+TX、トリコデルマビレンス(Tric  
 hoderma virens)+TX、トリコデルマビレンス(Trichoderma  
 virens)(旧名グリオクラジウムビレンス(Gliocladium viren  
 s)GL-21)(SoilGuard(登録商標))+TX、トリコデルマビリデ(Tri  
 choderma viride)+TX、トリコデルマビリデ(Trichode  
 rma viride)菌株ICC 080(Remedier(登録商標))+TX、ト  
 リコスポロンプルランス(Trichosporon pullulans)+TX、ト  
 リコスポロン属の一種(Trichosporon spp.)+TX、トリコテシウム  
 属の一種(Trichothecium spp.)+TX、トリコテシウムロセウム(Typh  
 ula phacorrhiza)菌株94670+TX、アカエガマノホタケ(Typh  
 ula phacorrhiza)菌株94671+TX、ウロクラディウムアトラム(Ulo  
 cladium atrum)+TX、ウロクラディウムオウデマンシイ(Ulo  
 cladium oudemansii)(Botry-Zen(登録商標))+TX、  
 ウスチラゴマイディス(Ustilago maydis)+TX、種々のバクテリア及  
 び補助的な微量元素(Natural II(登録商標))+TX、種々の真菌(Mil  
 lennium Microbes(登録商標))+TX、ベルチシリウムクラミドスポ  
 リウム(Verticillium chlamydosporium)+TX、ベルチ

10

20

30

40

50

シリウムレカニイ (Verticillium lecanii) (Mycotal (登録商標) + TX、Vertalec (登録商標) + TX、Vip3Aa20 (VIPtera (登録商標) + TX、ビルギバクリルスマリスマルツイ (Virgibacillus marismortui) + TX、キサントモナス カムペストリス pv. ポアエ (Xanthomonas campestris pv. Poae) (Camperico (登録商標) + TX、ゼノラブダスポビエニイ (Xenorhabdus bovienii) + TX、ゼノラブダスネマトフィルス (Xenorhabdus nematophilus) ; 及び

以下を含む植物抽出物：パイン油 (Retenol (登録商標) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標) + TX、AzaGuard (登録商標) + TX、MeemAzal (登録商標) + TX、Molt-X (登録商標) + TX、Botanical IGR (Neemazad (登録商標) + TX、Neemix (登録商標) + TX、カノーラ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標) + TX、アメリカアリタソウ (Chenopodium ambrosioides near ambrosioides) (Requiem (登録商標) + TX、キク属 (chrysanthemum) 抽出物 (Crisant (登録商標) + TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標) + TX、シソ科 (Labiatae) のエッシェンシャルオイル (Botania (登録商標) + TX、クローブ、ローズマリー、ペパーミント及びタイム油の抽出物 (Garden insect killer (登録商標) + TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標) + TX、ニンニク + TX、レモンガラス油 (GreenMatch (登録商標) + TX、ニーム油 + TX、イヌハッカ (イヌハッカ油) + TX、イヌハッカ (Nepeta catarina) + TX、ニコチン + TX、オレガノ油 (MossBuster (登録商標) + TX、ゴマ科 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標) + TX、除虫菊 + TX、キラヤサボナリア (Quillaja saponaria) (NemaQ (登録商標) + TX、オオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) (Regalia (登録商標) + TX、Sakalia (登録商標) + TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標) + TX、ミカン科 (Rutaceae) 植物抽出物 (Soleo (登録商標) + TX、大豆油 (オルトecosense (登録商標) + TX、ティーツリーオイル (Timorex Gold (登録商標) + TX、胸腺油 (thymus oil) + TX、AGNIQUE (登録商標) MMF + TX、BugOil (登録商標) + TX、ローズマリー、ゴマ、ペパーミント、タイム及びシナモン抽出物の混合物 (EF300 (登録商標) + TX、クローブ、ローズマリー及びペパーミント抽出物の混合物 (EF400 (登録商標) + TX、クローブ、ペパーミント、ニンニク油及びミントの混合物 (土壌Shot (登録商標) + TX、カオリン (Screen (登録商標) + TX、褐藻の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標) ; 及び

以下を含むフェロモン：ブラックヘデッドファイヤーワーム (blackheaded fireworm) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標) + TX、コドリングフェロモン (Paramount dispenser - (CM) / Isomate C-Plus (登録商標) + TX、グレープベリーモスフェロモン (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone (登録商標) + TX、ハマキムシフェロモン (3M MEC-LR Sprayable Pheromone (登録商標) + TX、ムスカモン (Muscamone) (Snip7 Fly Bait (登録商標) + TX、Starbar Premium Fly Bait (登録商標) + TX、ナシヒメシクイフェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標) + TX、ピーチツリーボラー (Peachtree Borer) フェロモン (Isomate - P (登録商標) + TX、トマトピンワーム (tomato pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標) + TX、エントスタット (Entostat) 粉末 (ヤシからの抽出物) (Exos

10

20

30

40

50

ex CM (登録商標) + TX、(E + TX, Z + TX, Z) - 3 + TX, 8 + TX、  
 11テトラデカトリエニルアセテート + TX、(Z + TX, Z + TX, E) - 7 + TX、  
 11 + TX, 13 - ヘキサデカトリエノール + TX、(E + TX, Z) - 7 + TX、9 -  
 ドデカジエン - 1 - イルアセテート + TX、2 - メチル - 1 - ブタノール + TX、酢酸カル  
 ルシウム + TX、Scenturion (登録商標) + TX、Biolure (登録商標  
 ) + TX、Check - Mate (登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオエート；及び  
 以下を含む微生物：アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) + T  
 X、エルビアブラバチ (*Aphidius ervi*) (*Aphelinus - Syst  
 em* (登録商標)) + TX、アセロファグスパパイヤ (*Acerophagus pap  
 aya*) + TX、フタモンテントウ (*Adalia bipunctata*) (*Adal  
 ia - System* (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (*Adalia bipu  
 nctata*) (*Adaline* (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (*Adali  
 a bipunctata*) (*Aphidalia* (登録商標)) + TX、アゲニアスピ  
 スシトリアスピス (*Ageniaspis citricola*) + TX、アゲニアスピ  
 スフシコリス (*Ageniaspis fuscicollis*) + TX、アムブリセイ  
 ウスアンデルソニ (*Amblyseius andersoni*) (*Anderline  
 (登録商標)*) + TX、Andersoni - System (登録商標) + TX、アムブ  
 リセイウスカリホルニクス (*Amblyseius californicus*) (*Am  
 blyline* (登録商標)) + TX、Spical (登録商標) + TX、クメリスカ  
 ブリダニ (*Amblyseius cucumeris*) (*Thripex* (登録商標)  
 ) + TX、Bugline cucumeris (登録商標) + TX、アムブリセイウス  
 ファラシス (*Amblyseius fallacis*) (*Fallacis* (登録商標  
 )) + TX、スワルスキーカブリダニ (*Amblyseius swirskii*) (*B  
 ugliine swirskii* (登録商標)) + TX、Swirskii - Mite (登  
 録商標) + TX、ケナガカブリダニ (*Amblyseius womersleyi*)  
 (*WomerMite* (登録商標)) + TX、アミツスヘスペリズム (*Amitus h  
 esperidum*) + TX、アングルスアトムス (*Anagrus atomus*) +  
 TX、アナギルスフスシベントリス (*Anagrus fusciventris*) +  
 TX、アナギルスカマリ (*Anagrus kamali*) + TX、アナギルス口エツ  
 キ (*Anagrus loeckii*) + TX、アナギルスシュードコッキ (*Anagy  
 rus pseudococci*) (*Citripar* (登録商標)) + TX、アニセツ  
 スベネフィセス (*Anicetus benefices*) + TX、ゾウムシコガネコバ  
 チ (*Anisopteromalus calandrae*) + TX、アントコリスネモ  
 ラリス (*Anthocoris nemoralis*) (*Anthocoris - Sys  
 tem* (登録商標)) + TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominal  
 is*) (*Apheline* (登録商標)) + TX、Aphiline (登録商標) + TX  
 、チャバラアブラコバチ (*Aphelinus asychis*) + TX、コレマンアブ  
 ラバチ (*Aphidius colemani*) (*Ahipar* (登録商標)) + TX  
 、エルビアブラバチ (*Aphidius ervi*) (*Ervipar* (登録商標)) +  
 TX、ギフアブラバチ (*Aphidius gifuensis*) + TX、アフィディウ  
 スマトリカリエ (*Aphidius matricariae*) (*Ahipar - M*  
 (登録商標)) + TX、シヨクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*)  
 (*Aphidend* (登録商標)) + TX、シヨクガタマバエ (*Aphidolet  
 es aphidimyza*) (*Aphidoline* (登録商標)) + TX、アフィテ  
 イスリングナネンシス (*Aphytis lingnanensis*) + TX、アフィテ  
 イスメリヌス (*Aphytis melinus*) + TX、アプロストセツスハゲノウィ  
 イ (*Aprostocetus hagenowii*) + TX、メナシヒメハネカクシ (*Ath  
 eta coriaria*) (*Staphyline* (登録商標)) + TX、マル  
 ハナバチ属の一種 (*Bombus spp.*) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bo  
 mbus terrestris*) (*Natupol Beehive* (登録商標)) + T

10

20

30

40

50

X、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (Beeline (登録商標) + TX、Tripol (登録商標) + TX、セファロノミアステファノ  
 デリス (*Cephalonomia stephanoderis*) + TX、キロコルス  
 ニグリツス (*Chilocorus nigritus*) + TX、ヤマトクサカゲロウ (  
*Chrysoperla carnea*) (Chrysoline (登録商標) + TX  
 、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (Chrysopa (登録商標) + TX、クリソベルラルフィラブリス (*Chrysoperla rufi  
 labris*) + TX、シロスピルスインゲヌウス (*Cirrospilus inge  
 nuus*) + TX、シロスピルスクアドリストラアツス (*Cirrospilus qu  
 adristriatus*) + TX、シトロスチクスフィロニストイデス (*Citros  
 tichus phyllocnistoides*) + TX、クロステロセルスチャマエ  
 レオン (*Closterocerus chamaeleon*) + TX、クロステロセル  
 ス属の一種 (*Closterocerus spp.*) + TX、コシドキセノイデスペル  
 ミヌタス (*Coccidoxenoides perminutus*) (Planopa  
 r (登録商標) + TX、ココファグスコウベリ (*Coccophagus cowpe  
 ri*) + TX、ココファグスリシムニア (*Coccophagus lycimnia*)  
 + TX、コテシアフラビペス (*Cotesia flavipes*) + TX、コテシアブ  
 ルテラエ (*Cotesia plutellae*) + TX、ツマアカオオヒメテントウ (  
*Cryptolaemus montrouzieri*) (Cryptobug (登録商  
 標) + TX、Cryptoline (登録商標) + TX、キムネタマキスイ (*Cybo  
 cephalus nipponicus*) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa a  
 sibirica*) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*)  
 (Minusa (登録商標) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isa  
 eae*) (Diminex (登録商標) + TX、デルファスツスカタリナエ (*Delph  
 hastus catalinae*) (Delphastus (登録商標) + TX、デル  
 ファスツスプシルス (*Delphastus pusillus*) + TX、ディアカス  
 ミモルフアクラウシイ (*Diachasmimorpha krausii*) + TX、デ  
 ィアカスミモルフアロンギカウダタ (*Diachasmimorpha longica  
 udata*) + TX、ディアバルシスジュクンダ (*Diaparsis jucunda*)  
 + TX、ディアホレンシルタスアリガルヘンシス (*Diaphorencyrtus  
 aligarhensis*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isa  
 eae*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaeae*) (Miglyp  
 hus (登録商標) + TX、Digline (登録商標) + TX、ハモグリコマユバチ  
 (*Dacnusa sibirica*) (DacDigline (登録商標) + TX、M  
 inex (登録商標) + TX、ディベルシネルプス属の一種 (*Diversinerv  
 us spp.*) + TX、エンカルシアシトリナ (*Encarsia citrina*) +  
 TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (Encarsia m  
 ax (登録商標) + TX、Encarline (登録商標) + TX、En-Strip (登  
 録商標) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*)  
 (Enermix (登録商標) + TX、エンカルシアグアデロウペ (*Encarsia  
 guadeloupae*) + TX、エンカルシアハイチエンシス (*Encarsia h  
 aitiensis*) + TX、ホソヒラタアブ (*Episyrphus balteat  
 us*) (Syrphidend (登録商標) + TX、エルトモセルスシホニニ (*Ere  
 tmoceris siphonini*) + TX、エルトモセルスカリフォルニクス (*Ere  
 tmocerus californicus*) + TX、サバクツヤコバチ (*Ere  
 tmocerus eremicus*) (Ercal (登録商標) + TX、Eretli  
 ne e (登録商標) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremi  
 cus*) (Bemimix (登録商標) + TX、エルトモセルスハヤチ (*Eretmo  
 cerus hayati*) + TX、ムンダスツヤコバチ (*Eretmocerus mu  
 ndus*) (Bemipar (登録商標) + TX、Eretline m (登録商標) )

10

20

30

40

50

+ TX、エルトモセルスシホニニ (*Eretmocerus siphonini*) + TX、エクソコムスクアドリプスツラタス (*Exochomus quadripustulatus*) + TX、ハダニタマバエ (*Feltiella acarisuga*) (*Spidend* (登録商標)) + TX、ハダニタマバエ (*Feltiella acarisuga*) (*Feltiline* (登録商標)) + TX、フォピウスアリサヌス (*Fopius arisanus*) + TX、フォピウスセラチチボルス (*Fopius ceratitivorius*) + TX、ホルモノネチン (*Wirless Beehome* (登録商標)) + TX、フランクリノトリプスベスピホルミス (*Franklinothrips vespiformis*) (*Vespop* (登録商標)) + TX、ガレンドロムスオッキデンタリス (*Galendromus occidentalis*) + TX、ゴニオズスレグネリ (*Goniozus legneri*) + TX、ハプロブラコンヘベトル (*Habrobracon hebetor*) + TX、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*) (*HarmoBeetle* (登録商標)) + TX、ヘテロハブディティス属の一種 (*Heterorhabditis spp.*) (*Lawn Patrol* (登録商標)) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) (*NemaShield HB* (登録商標)) + TX、*Nemaseek* (登録商標) + TX、*Terranem-Nam* (登録商標) + TX、*Terranem* (登録商標) + TX、*Larvanem* (登録商標) + TX、*B-Green* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nematop* (登録商標) + TX、ヘテロラブディティスメギディス (*Heterorhabditis megidis*) (*Nemasys H* (登録商標)) + TX、*BioNem H* (登録商標) + TX、*Exhibitline hm* (登録商標) + TX、*Larvanem-M* (登録商標) + TX、

ヒポダミアコンベルゲンス (*Hippodamia convergens*) + TX、ハイポアスピスクレイフェル (*Hypoaspis aculeifer*) (*Aculeifer-System* (登録商標)) + TX、*Entomite-A* (登録商標) + TX、ハイポアスピスマレス (*Hypoaspis miles*) (*Hypoline m* (登録商標)) + TX、*Entomite-M* (登録商標) + TX、ルバリアレウコスポイデス (*Lbalia leucospoides*) + TX、レカノイデウスフロッキシムス (*Lecanoideus floccissimus*) + TX、レモファグスエラブ  
 ンダス (*Lemophagus errabundus*) + TX、レプトマスチダエアブ  
 ノルミス (*Leptomastidea abnormis*) + TX、フジコナヒゲナガ  
 トビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (*Leptopar* (登録商標)) + TX、レプトマスチクスエポナ (*Leptomastix epona*) + TX、リンドルスロファンタエ (*Lindorus lophanthae*) + TX、リポレクシスオレグマエ (*Lipolexis oregmae*) + TX、キンバエ (*Lucilia caesar*) (*Natufly* (登録商標)) + TX、リシフレブステスタセイペス (*Lysiphlebus testaceipes*) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (*Mirical-N* (登録商標)) + TX、*Macroline c* (登録商標) + TX、*Mirical* (登録商標) + TX、メソセイウルスロンギペス (*Mesoseiulus longipes*) + TX、メタフィクスフラプス (*Metaphycus flavus*) + TX、メタフィクスロウンズブライ (*Metaphycus lounsburyi*) + TX、ミクロムスアングラタス (*Micromus angulatus*) (*Milacewing* (登録商標)) + TX、ミクロテリスフラプス (*Microterys flavus*) + TX、ムシディフラクスラプトレルス (*Muscidifurax raptorellus*) 及びスパランギアカメロニ (*Spalangia cameroni*) (*Biopar* (登録商標)) + TX、ネオドリヌスチファロシバエ (*Neodryinus typhlocybae*) + TX、ネオセイウルスカリホルニクス (*Neoseiulus californicus*) + TX、ネオセイウルスククメリス (*Neose*

10

20

30

40

50

*iulus cucumeris*) (THRYPEX (登録商標)) + TX、ネオセイウルスファラシス (*Neoseiulus fallacis*) + TX、ネシデオコリステヌイス (*Nesideocoris tenuis*) (NesidioBug (登録商標)) + TX、Nesibug (登録商標)) + TX、オフィラアエネセンス (*Ophyra aenescens*) (Biofly (登録商標)) + TX、オリウスインシジオス (*Orius insidiosus*) (Thripor - I (登録商標)) + TX、Oriline i (登録商標)) + TX、オリウスラエビガツ (*Orius laevigatus*) (Thripor - L (登録商標)) + TX、Oriline l (登録商標)) + TX、オリウスマジスクルス (*Orius majusculus*) (Oriline m (登録商標)) + TX、タイリクヒメハナカメムシ (*Orius strigicollis*) (Thripor - S (登録商標)) + TX、パウエシアジュニペロルム (*Pauesia juniperorum*) + TX、ペディビウスフォベオラツ (*Pediobius foveolatus*) + TX、ファスマラブジチスヘルマフロディタ (*Phasmarhabditis hermaphrodita*) (Nemaslug (登録商標)) + TX、フィマスチクスコフェア (*Phymastichus coffea*) + TX、フィトセイウルスマクロピルス (*Phytoseiulus macropilus*) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (Spidex (登録商標)) + TX、Phytoline p (登録商標)) + TX、ポディススマクリベントリス (*Podisus maculiventris*) (Podisus (登録商標)) + TX、シュードクテオンクルバタ (*Pseudacteon curvatus*) + TX、シュードクテオンオブツ (*Pseudacteon obtusus*) + TX、シュードクテオントリクス (*Pseudacteon tricuspis*) + TX、シュードフィクスマクリペニス (*Pseudaphycus maculipennis*) + TX、シュードレプトマスチクスメキシカナ (*Pseudoleptomastix mexicana*) + TX、プシラエファグスピロス (*Psyllaephagus pilosus*) + TX、プシタリアコンコロール (*Psytalia concolor*) (複合体) + TX、クアドラステイクス属の一種 (*Quadrastichus spp.*) + TX、リゾビウスロファンタ (*Rhizophobius lophanthae*) + TX、ベダリアテントウ (*Rodolia cardinalis*) + TX、ルミナデコラテ (*Rumina decollate*) + TX、セミエラケルベチオラ (*Semielacher petiolatus*) + TX、シトビオンアヴェナ (*Sitobion avenae*) (Ervibank (登録商標)) + TX、ステイネルネマカルポカプサ (*Steinernema carpocapsae*) (Nematac C (登録商標)) + TX、Millenium (登録商標) + TX、BioNem C (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nemastar (登録商標) + TX、Capsanem (登録商標) + TX、ステイネルネマフェルチア (*Steinernema feltiae*) (NemaShield (登録商標)) + TX、Nemasy F (登録商標) + TX、BioNem F (登録商標) + TX、Steinernema - System (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nemaplus (登録商標) + TX、Exhibitline sf (登録商標) + TX、Scia - rid (登録商標) + TX、Entonem (登録商標) + TX、ステイネルネマクラウセイ (*Steinernema kraussei*) (Nemasy L (登録商標)) + TX、BioNem L (登録商標) + TX、Exhibitline srb (登録商標) + TX、ステイネルネマリオブ (*Steinernema riobrave*) (BioVector (登録商標)) + TX、BioVektor (登録商標) + TX、ステイネルネマスカプテリス (*Steinernema scapterisci*) (Nematac S (登録商標)) + TX、ステイネルネマ属の一種 (*Steinernema spp.*) + TX、ステイネルネマチド属の一種 (*Steinernematid spp.*) (Guardian Nematodes (登録商標)) + TX、ステトルスプンクチルム (*Stethoru*

10

20

30

40

50

s punctillum) (Stethorus (登録商標)) + TX、タマリキシアラディアテ (Tamarixia radiate) + TX、テトラスティクスセティフェル (Tetrastichus setifer) + TX、トリポビウスセミルテウス (Thripobius semiluteus) + TX、チュウゴクオナガコバチ (Torymus sinensis) + TX、トリコグランマブラッシカエ (Trichogramma brassicae) (Tricholine b (登録商標)) + TX、トリコグランマブラッシカエ (Trichogramma brassicae) (Tricho-Strip (登録商標)) + TX、トリコグラマエヴァネセンス (Trichogramma evanescens) + TX、トリコグラマミニタム (Trichogramma minutum) + TX、アワノメイガタマゴバチ (Trichogramma ostriniae) + TX、トリコグラマプラトネリ (Trichogramma platneri) + TX、トリコグラマプレチオスム (Trichogramma pretiosum) + TX、キサントピムラステマトル (Xanthopimpla stemmator) ; 及び

以下を含む他の生物学的製剤：アブシジン酸 + TX、bioSea (登録商標) + TX、ムラサキウロコタケ (Chondrostereum purpureum) (Control Paste (登録商標)) + TX、コレトリカムグロエオスポリオイデス (Colletotrichum gloeosporioides) (Collego (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (Cueva (登録商標)) + TX、デルタトラプス (Delta traps) (Trapline d (登録商標)) + TX、エルウィニアアミロボラ (Erwinia amylovora) (ハルピン) (ProAct (登録商標)) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標) + TX、リン酸第二鉄 (Ferramol (登録商標)) + TX、漏斗トラップ (Trapline y (登録商標)) + TX、Gallex (登録商標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラソノリド (Homo-brassonolide) + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標)) + TX、MCPヘイルトラップ (MCP hail trap) (Trapline f (登録商標)) + TX、ミクロトヌスヒペロダエ (Microctonus hyperodae) + TX、ミコレプトディスクステレストリス (Mycoleptodiscus terrestris) (Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Aminomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (Thripline ams (登録商標)) + TX、重炭酸カリウム (MilStop (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマロクスタエ (Nosema locustae) (Semaspore Organic Grasshopper Control (登録商標)) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標)) + TX、Rebell Amarillo (登録商標) + TX 及びトラップ (Takitrapline y + b (登録商標)) + TX。

又は：プロフルトリネート + TX、ジフロヴィダジン + TX、フロメトキン + TX、フルヘキサホン + TX、コナガ (Plutella xylostella) グラニューロシスウイルス + TX、コドリリング (Cydia pomonella) グラニューロシスウイルス + TX、イミシアホス + TX、ニセアメリカタバコガ (Heliothis virescens) 核多核体ウイルス + TX、ヘリオチスプンクチゲラ (Heliothis punctigera) 核多核体ウイルス + TX、アメリカタバコガ (Helicoverpa zea) 核多核体ウイルス + TX、スポドプテラフルギペルダ (Spodoptera frugiperda) 核多核体ウイルス + TX、コナガ (Plutella xylostella) 核多核体ウイルス + TX、p-シメン + TX、ピフルブミド + TX、ピラフルプロール + TX、QRD420 + TX、QRD452 + TX、QRD460

10

20

30

40

50

+ TX、テルペノイドブレンド+ TX、テルペノイド+ TX、テトラニリプロール+ TX、及び - テルピネン+ TXから選択される生物学的に有効な化合物若しくは薬剤；  
 又は、コードAE1887196 (BSC - BX60309) + TX、コードNNI - 0745GR + TX、コードIKI - 3106 + TX、コードJT - L001 + TX、コードZ NQ - 08056 + TX、コードIPPA152201 + TX、コードHNPC - A9908 (CAS: [660411 - 21 - 2]) + TX、コードHNPC - A2005 (CAS: [860028 - 12 - 2]) + TX、コードJS118 + TX、コードZJ0967 + TX、コードZJ2242 + TX、コードJS7119 (CAS: [929545 - 74 - 4]) + TX、コードSN - 1172 + TX、コードHNPC - A9835 + TX、コードHNPC - A9955 + TX、コードHNPC - A3061 + TX、コードChuanhua89 - 1 + TX、コードIPP - 10 + TX、コードZJ3265 + TX、コードJS9117 + TX、コードZJ3757 + TX、コードZJ4042 + TX、コードZJ4014 + TX、コードITM - 121 + TX、コードDPX - RAB55 (DKI - 2301) + TX、コードNA - 89 + TX、コードMIE - 1209 + TX、コードMCI - 8007 + TX、コードBCS - CL73507 + TX、コードS - 1871 + TX、コードDPX - RDS63 + TX、キノフメリン+ TX、メフェントリフルコナゾール+ TX、フェンピコキサミド+ TX、フルインダビル+ TX、インピルフルキサム+ TX又はジンジフルメトピル+ TX、イソフルシプラム+ TX、ピラプロポイン+ TX、フロリルピコキサミド+ TX、メチルテトラプロール+ TX、イプフルフェノキン+ TX、ピリダクロメチル+ TX又はクロピリジフル+ TX、テトラクロラントラニリプロール+ TX、テトラクロラニリプロール+ TX、チクロピラゾフロル+ TX、フルピリミン+ TX又はピリフルラミド+ TX、ベンズピリモキサン+ TX、ベンゾスフィル+ TX又はオキサゾスフィル+ TX、エトピラフェン+ TX、アシノナピル+ TX又はピリノナフェン+ TX、オキソトリオン+ TX、ピクスロゾン+ TX又はクロフェンジゾン+ TX又はジクロロキシゾン+ TX、シクロピラニル+ TX又はピラゾシクロニル+ TX又はシクロピラゾニル+ TX、 - プロマジオロン+ TX、及びコードAKD - 1193 + TXなどのコード+ TXによって参照される活性物質。

#### 【0261】

例えば [3878 - 19 - 1] といった活性成分に続く括弧中の参照は、Chemical Abstracts Registry numberを指している。上記の混合相手は公知である。活性成分が「The Pesticide Manual」[The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council] 中に含まれている場合、これらは、特定の化合物について本明細書中上記の丸括弧中に示されている項目番号下でその中に記載されており；例えば、化合物「アバメクチン」は、項目番号(1)下に記載されている。上記に記載の特定の化合物について「[CCN]」が付記されている場合、対象の化合物は[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright (著作権) 1995 - 2004]にてインターネットを介してアクセス可能である「Compendium of Pesticide Common Names」に含まれており；例えば、化合物「アセトプロール」は、インターネットアドレス<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>において記載されている。

#### 【0262】

上記明細書において、上記の活性成分の大部分は、いわゆる「慣用名」、関連する「ISO慣用名」又は他の「慣用名」を個々の事例において用いることにより言及されている。「慣用名」による呼称ではない場合、代わりに用いられる呼称の性質は特定の化合物について丸括弧中に記載されており；この場合、IUPAC名、IUPAC/Chemical Abstracts名、「化学名」、「慣習名」、「化合物名」若しくは「開発コード」が用いられており、又は、これらの呼称若しくは「慣用名」のいずれも用いられて

いない場合には、「代替名」が採用されている。「CAS Reg. No」はChemical Abstracts Registry Numberを意味する。

【0263】

表1、2、3及びYから選択される式Iの化合物と上記の活性成分との活性成分混合物は、表1、2、3及びYから選択される化合物と上記の活性成分とを、好ましくは100：1～1：6000、特に50：1～1：50の混合比、とりわけ20：1～1：20、とりわけ10：1～1：10、とりわけ5：1～1：5の比で含み、2：1～1：2の比が特に好ましく、及び、4：1～2：1の比が同様に好ましく、特に、1：1、又は、5：1、又は、5：2、又は、5：3、又は、5：4、又は、4：1、又は、4：2、又は、4：3、又は、3：1、又は、3：2、又は、2：1、又は、1：5、又は、2：5、又は、3：5、又は、4：5、又は、1：4、又は、2：4、又は、3：4、又は、1：3、又は、2：3、又は、1：2、又は、1：600、又は、1：300、又は、1：150、又は、1：35、又は、2：35、又は、4：35、又は、1：75、又は、2：75、又は、4：75、又は、1：6000、又は、1：3000、又は、1：1500、又は、1：350、又は、2：350、又は、4：350、又は、1：750、又は、2：750、又は、4：750の比が好ましい。これらの混合比は重量基準である。

10

【0264】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物若しくはその環境に適用するステップを含む有害生物を防除する方法において用いられることが可能であるが、手術又は治療によるヒト又は動物の身体の処置法、及び、ヒト又は動物の身体において実施される診断法は除かれる。

20

【0265】

表1、2、3及びYから選択される式Iの化合物と、上記の1種又は複数種の活性成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の活性成分コンポーネントの個々の配合物から組成される「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、及び、逐次的（すなわち、数時間又は数日間などの適度に短時間のうちに次々と）に適用される場合には単一の活性成分を併用して適用されることが可能である。表1、2、3及びYから選択される式Iの化合物と上記の活性成分とを適用する順番は本発明の作用について重要ではない。

【0266】

本発明に係る組成物はまた、例えば未エポキシ化又はエポキシ化植物性油（例えばエポキシ化ココナツ油、ナタネ油又はダイズ油）といった安定化剤、例えばシリコーン油といった消泡剤、防腐剤、粘度調節剤、バインダ及び/若しくは粘着剤、肥料、又は、特定の効果を達成するための他の活性成分、例えば殺菌剤、殺菌・殺カビ剤、抗線虫薬、植物活性化剤、殺軟体動物剤若しくは除草剤などのさらなる固体助剤若しくは液体助剤を含んでいることが可能である。

30

【0267】

本発明に係る組成物は、それ自体は公知である様式において、助剤の不在下で、例えば、固体活性成分を粉末化し、スクリーニングし、及び/又は、固体に圧縮することにより調製され、また、少なくとも1種の助剤の存在下に、例えば、活性成分を助剤と共に均質混合し、及び/又は、粉末化することにより調製される。組成物のこれらの調製プロセス、及び、これらの組成物を調製するための化合物Iの使用もまた本発明の主題である。

40

【0268】

流行している状況における意図される目的、及び、上述の種類有害生物を防除するための組成物の使用に適合するよう選択されるべきである、吹付け、噴霧、散粉、はけ塗り、粉衣、拡散又は流しかけなどの上述の種類有害生物の防除方法である組成物の適用方法が本発明の他の主題である。典型的な濃度割合は、0.1～1000 ppm、好ましくは0.1～500 ppmの活性成分である。1ヘクタール当たりの適用量は、一般に1～2000 gの活性成分/ヘクタール、特に10～1000 g/ha、好ましくは10～600 g/haである。

50

## 【0269】

作物保護分野における好ましい適用方法は植物の群葉への適用（葉面処理）であり、対象となる有害生物による外寄生の脅威に合致する適用頻度及び量を選択することが可能である。代わりに、植物の生育地に液体組成物を灌注することにより、又は、固体形態の活性成分を植物の生育地に（例えば土壌に例えば顆粒形態で）導入する（土壌適用）ことにより、根系を介して植物に活性成分を到達させることが可能である（浸透移行作用）。水稻作物の場合、このような顆粒は計量されて満たされた水田に適用が可能である。

## 【0270】

本発明の化合物及びその組成物はまた、果実、塊茎若しくは穀粒などの例えば種子といった植物繁殖材料、又は、苗床植物の上記の種類有害生物に対する保護に好適である。繁殖材料を植える前に化合物で処理することが可能であり、例えば、種子を播種の前に処理することが可能である。若しくは、穀粒を液体組成物中に液浸させることにより、又は、固体組成物層を塗布することにより、化合物を種子穀粒に適用する（コーティング）ことが可能である。繁殖材料を適用場所に植える際、例えばドリルまきの最中に蒔き溝に組成物を適用することも可能である。植物繁殖材料に対するこれらの処理方法、及び、このようにして処理された植物繁殖材料が本発明のさらなる主題である。典型的な処理量は、防除される植物及び有害生物/真菌に応じることとなり、一般に、1～200グラム/100kgの種子、好ましくは5～150グラム/100kgの種子、10～100グラム/100kgの種子などである。

## 【0271】

種子という用語は、すべての種類の種子及び植物栄養繁殖材料を包含し、特にこれらに限定されないが、真正種子、種子片、吸根、トウモロコシ、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽等を含み、好ましい実施形態においては、真正種子を意味する。

## 【0272】

本発明はまた、式Iの化合物でコーティングされ、又は、処理され、又は、式Iの化合物を含有する種子を含む。「コーティングされ、又は、処理され、及び/又は、含有する」という用語は、一般に、適用時活性成分が種子の表面の大部分にあることを意味するが、適用方法に応じて、処方成分のより多く若しくは少ない部分が種子材料中に浸透していてもよい。前記種子生成物が（再度）植えられる場合、活性成分が吸収されていてもよい。実施形態においては、本発明により、式（I）の化合物が植物繁殖材料に付着したものが利用可能となる。さらに、式（I）の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能となる。

## 【0273】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散粉、種子液浸及び種子ペレット化などの技術分野において公知であるすべての好適な種子処理技術を含む。式（I）の化合物の種子処理適用は、種子の播種前、播種/植え付けの最中における種子に対する吹付け又は散粉などのいずれかの公知の方法によって行われることが可能である。

## 【0274】

生物学的実施例：

実施例B1：タバココナジラミ（*Bemisia tabaci*）（綿コナジラミ）：摂食/接触活性

綿葉片を24-ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000ppmのDMISOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片にコナジラミの成虫を外寄生させた。インキュベーションの6日後に、サンプルを死亡率について確認した。

## 【0275】

表P中の以下の化合物が200ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P1、P4、P6、P8、P13、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、及びP22。

10

20

30

40

50

## 【0276】

実施例 B 2 : ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*) (コーンルートワーム)

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの新芽を吹付けにより、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2 幼虫 (ウェル毎に 6 ~ 10 匹) を外寄生させた。サンプルを、未処理のサンプルと比較して、外寄生の 4 日後に死亡率及び成長阻害について評価した。

## 【0277】

表 P 中の以下の化合物は、200 ppm の施用量で、2 種のカテゴリ (死亡率又は成長阻害) の少なくとも一方において少なくとも 80 % の効果をもたらした：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 13、P 14、P 16、P 17、P 18、P 19、P 20、及び P 21。

## 【0278】

実施例 B 3 :

ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*) (コーンルートワーム) :

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより 10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2 幼虫を寄生させた (ウェル当たり 6 ~ 10 匹)。寄生の 4 日後に、サンプルを、未処理のサンプルと比して、成長阻害について評価した。テストサンプルによるジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*) の防除は、成長阻害が未処理のサンプルよりも高い場合にもたらされているとする。

## 【0279】

表 P 中の以下の化合物が、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の成長阻害をもたらした：

P 8 及び P 20。

## 【0280】

実施例 B 4 :

ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*) (コーンルートワーム) :

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより 10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2 幼虫を寄生させた (ウェル当たり 6 ~ 10 匹)。寄生の 4 日後に、サンプルを死亡率について評価した。

## 【0281】

表 P 中の以下の化合物が、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の死亡率をもたらした：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 13、P 14、P 16、P 17、P 18、P 19、P 20 及び P 21。

## 【0282】

実施例 B 5 : ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルブラウンスティンクバグ (*Neotropical Brown Stink Bug*))

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉に N2 若虫を外寄生させた。サンプルを、未処理のサンプルと比較して、外寄生の 5 日後に死亡率及び成長阻害について評価した。

## 【0283】

表 P 中の以下の化合物が、2 つの区分の少なくとも一方 (死亡率又は成長阻害) におい

10

20

30

40

50

て、200 ppmの施用量で少なくとも80%の効果をもたらした：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 1 2、P 1 3、P 1 4、P 1 5、  
P 1 6、P 1 7、P 1 8、P 1 9、P 2 1、P 2 2、及びP 2 3。

【0284】

実施例 B 6：

ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルブラウン  
スティンクバグ (*Neotropical Brown Stink Bug*))：成長阻害

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上のダイズの葉に、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、これらの葉にN2若虫を寄生させた。寄生の5日後に、サンプルを、未処理のサンプルと比して、成長阻害について評価した。テストサンプルによるユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) の防除は、成長阻害が未処理のサンプルよりも高い場合にもたらされているとする。

10

【0285】

以下の化合物が、200 ppmの施用量で少なくとも80%の成長阻害をもたらした：  
P 1 4及びP 2 2。

【0286】

実施例 B 7：

ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルブラウン  
スティンクバグ (*Neotropical Brown Stink Bug*))：摂食/  
接触活性

20

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上のダイズの葉に、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、これらの葉にN2若虫を寄生させた。寄生の5日後に、サンプルを死亡率について評価した。

【0287】

表P中の以下の化合物が、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 1 2、P 1 3、P 1 4、P 1 5、  
P 1 6、P 1 7、P 1 8、P 1 9、P 2 1、P 2 2及びP 2 3。

【0288】

実施例 B 8：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (ミカンキイロアザミウマ)：摂食/接触活性

30

ヒマワリの葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000のDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のハナアザミウマ属 (*Frankliniella*) の個体群を外寄生させた。サンプルを、外寄生から7日後の死亡率について評価した。

【0289】

表P中の以下の化合物が200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P 8、P 1 3、P 1 6、P 1 7、P 1 8、P 1 9、及びP 2 2。

40

【0290】

実施例 B 9：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)：摂食/接触活性

ヒマワリの葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシの個体群を外寄生させた。サンプルを、外寄生の6日後に死亡率について評価した。

【0291】

以下の化合物が200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P 1、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 1 2、P 1 3、P 1 4、P 1 5、

50

P 1 6、P 1 7、P 1 8、P 1 9、P 2 0、P 2 1、P 2 2、及びP 2 3。

【0292】

実施例B10：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)。浸透移行活性

様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させたエンドウの実生の根を、10'000 DMSOストック溶液から調製したテスト水溶液中に直接入れた。実生をテスト溶液中に入れてから6日後に、サンプルを、死亡率について評価した。

【0293】

表P中の以下の化合物が、24 ppmのテスト量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P 6、P 8、P 9、P 1 5、P 1 6、P 1 9、P 2 0、P 2 2、及びP 2 3。

【0294】

実施例B11：

コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ)：成長阻害活性  
人工餌料を入れた24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2幼虫を寄生させた(ウェル当たり10~15匹)。寄生の5日後に、サンプルを、未処理のサンプルと比して、成長阻害について評価した。テストサンプルによるコナガ (*Plutella xylostella*) の防除は、成長阻害が未処理のサンプルよりも高い場合にもたらされているとする。

【0295】

表P中の以下の化合物が、200 ppmの施用量で少なくとも80%の成長阻害をもたらした：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 6、P 7、P 8、P 9、P 1 3、P 1 6、P 1 8、P 1 9、P 2 0及びP 2 1。

【0296】

実施例B12：

コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ)：摂食/接触活性  
人工餌料を入れた24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2幼虫を寄生させた(ウェル当たり10~15匹)。寄生の5日後に、サンプルを死亡率について評価した。

【0297】

表P中の以下の化合物が、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P 1、P 2、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 1 3、P 1 4、P 1 7、P 1 8、P 1 9、P 2 0及びP 2 1。

【0298】

実施例B13：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ)

人工餌料を入れた24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製した水性テスト溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫(ウェル毎に10~15)を外寄生させた。外寄生から5日後に、未処理のサンプルとの比較において、サンプルを死亡率及び成長阻害について評価した。

【0299】

表P中の以下の化合物が、200 ppmの施用量で、2つのカテゴリ(死亡率又は成長阻害)の少なくとも一方において少なくとも80%の効果を示した：

P 1、P 2、P 3、P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 9、P 1 3、P 1 4、P 1 6、P 1 7、P 1 8、P 1 9、P 2 0、及びP 2 1。

【0300】

実施例B14：

10

20

30

40

50

エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) :  
摂食阻害効果

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に綿の葉片を置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹のL1幼虫を寄生させた。寄生の3日後に、サンプルを、未処理のサンプルと比して、摂食阻害効果について評価した。テストサンプルによるエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除は、摂食阻害効果が未処理のサンプルよりも高い場合にもたらされているとする。

【0301】

表P中の以下の化合物が、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：

P1、P2、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P13、P14、P16、P17、P18、P19、P20及びP21。

【0302】

実施例B15：

エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) :  
成長阻害活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に綿の葉片を置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹のL1幼虫を寄生させた。寄生の3日後に、サンプルを、未処理のサンプルと比して、成長阻害について評価した。テストサンプルによるエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除は、成長阻害が未処理のサンプルよりも高い場合にもたらされているとする。

【0303】

表P中の以下の化合物が、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：

P4、P5、P9、P12、P17及びP19。

【0304】

実施例B16：

エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) :  
摂食/接触活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に綿の葉片を置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹のL1幼虫を寄生させた。寄生の3日後に、サンプルを死亡率について評価した。

【0305】

表P中の以下の化合物が、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P1、P2、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P13、P14、P16、P17、P18、P19、P20及びP21。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕式(I)の化合物

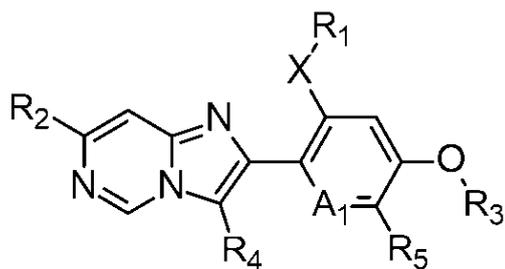
10

20

30

40

【化60】



(I)

10

(式中、

A<sub>1</sub>はCH又はNであり；Xは、S、SO又はSO<sub>2</sub>であり；R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；R<sub>2</sub>は、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシであり；

20

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシイミノC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>シアノアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)アミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>シアノハロアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニイミドイル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルであり；

30

又は、R<sub>3</sub>は、部分飽和又は完全飽和であり得る4~6員複素環系であり、前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1~2個のヘテロ原子を含有し、並びに、前記環系は、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル及びオキソからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換され得て；ここで、前記硫黄は、0、1若しくは2の酸化状態で存在し得；R<sub>4</sub>は、水素、ハロゲン又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；並びにR<sub>5</sub>は、水素、ハロゲン又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである)

40

又は、式(I)の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。〔2〕R<sub>3</sub>が、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシイミノC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>シアノアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)アミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシ

50

カルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>シアノハロアルキル、アミノカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボンイミドイル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルであり；又は

R<sub>3</sub>が、部分飽和又は完全飽和であり得る4~6員複素環系であり、前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1~2個のヘテロ原子を含有し、並びに、前記環系は、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル及びオキソからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換され得て、ここで、前記硫黄は、0、1若しくは2の酸化状態で存在し得；又は

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルによって単置換され得るオキセタニルである、前記〔1〕に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔3〕R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである、前記〔1〕又は前記〔2〕に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔4〕R<sub>2</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキル、ハロメチルスルファニル、ハロメチルスルフィニル又はハロメチルスルホニルである、前記〔1〕、〔2〕又は〔3〕のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔5〕R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル若しくはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；又は、R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルによって単置換され得るオキセタニルである、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕又は〔4〕のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔6〕XがSO<sub>2</sub>である、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕又は5のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔7〕R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>が共に水素である、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5又は6のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔8〕R<sub>1</sub>がエチルであり、及び、R<sub>2</sub>が、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル又はトリフルオロメチルスルファニルである、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、6又は7のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔9〕R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルスルファニルC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルである、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、6、7又は8のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔10〕R<sub>3</sub>が、-CH(CH<sub>3</sub>)CN、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CN、メチルスルファニルメチル、メチルスルファニルエチル、メチルスルフィニルメチル、メチルスルフィニルエチル、メチルスルホニルメチル又はメチルスルホニルエチルである、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、6、7、8又は9のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔11〕XがSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>1</sub>がエチルであり；

R<sub>2</sub>が、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル又はトリフルオロメチルスルファニルであり；並びに

10

20

30

40

50

R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>が共に水素である、

前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、6、7、8、9又は10のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシド。

〔12〕A<sub>1</sub>がNである、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、6、7、8、9、10又は11のいずれか一項に記載の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシド。

〔13〕殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、又は、殺軟体動物的に有効な量の、前記〔1〕～〔12〕のいずれか一項に記載されている式(I)の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを含み、及び、助剤又は希釈剤を含んでもよい組成物。

10

〔14〕昆虫、ダニ、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地、又は、有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的に、又は、殺軟体動物的に有効な量の、前記〔1〕～〔12〕のいずれか一項に記載されている式(I)の化合物、又は、その農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシド、又は、前記〔13〕に記載されている組成物を適用することを含む方法。

〔15〕昆虫、ダニ、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられている場所を、前記〔13〕に記載の組成物で処理することを含む方法。

20

30

40

50

## フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I  
A 0 1 P 7/04

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100162422

弁理士 志村 将

(72)発明者 エドマンズ アンドリュウ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロテク  
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 レンドラー セバスチャン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロテク  
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ミューレバッハ ミシェル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロテク  
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 エメリー ダニエル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロテク  
ション アクチェンゲゼルシャフト内

審査官 神野 将志

(56)参考文献 特表 2 0 1 6 - 5 2 8 1 8 9 ( J P , A )

国際公開第 2 0 1 6 / 0 7 1 2 1 4 ( W O , A 1 )

国際公開第 2 0 1 6 / 0 4 1 8 1 9 ( W O , A 1 )

国際公開第 2 0 1 6 / 0 3 9 4 4 1 ( W O , A 1 )

国際公開第 2 0 1 5 / 0 8 7 4 5 8 ( W O , A 1 )

特開 2 0 1 3 - 1 3 6 5 1 9 ( J P , A )

国際公開第 2 0 1 7 / 0 6 5 2 2 8 ( W O , A 1 )

(58)調査した分野 (Int.Cl., D B 名)

C 0 7 D

A 0 1 N

A 0 1 P

C A p l u s / R E G I S T R Y / M A R P A T ( S T N )