

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6242872号
(P6242872)

(45) 発行日 平成29年12月6日(2017.12.6)

(24) 登録日 平成29年11月17日(2017.11.17)

(51) Int. Cl.	F I
C07D 401/04 (2006.01)	C O 7 D 401/04 C S P
A01P 7/04 (2006.01)	A O 1 P 7/04
A01N 43/56 (2006.01)	A O 1 N 43/56 D
A61K 31/4439 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439
A61P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14

請求項の数 18 (全 94 頁)

(21) 出願番号	特願2015-513079 (P2015-513079)
(86) (22) 出願日	平成25年5月7日(2013.5.7)
(65) 公表番号	特表2015-518839 (P2015-518839A)
(43) 公表日	平成27年7月6日(2015.7.6)
(86) 国際出願番号	PCT/EP2013/059430
(87) 国際公開番号	W02013/174645
(87) 国際公開日	平成25年11月28日(2013.11.28)
審査請求日	平成28年5月2日(2016.5.2)
(31) 優先権主張番号	61/651,050
(32) 優先日	平成24年5月24日(2012.5.24)
(33) 優先権主張国	米国 (US)

(73) 特許権者	508020155
	ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ
	ア
	BASF SE
	ドイツ連邦共和国 67056 ルートヴ
	イヒスハーフェン・アム・ライン カール
	-ボッシュ-シュトラッセ 38
	Carl-Bosch-Strasse
	38, 67056 Ludwigsha
	fen am Rhein, Germa
	ny
(74) 代理人	100091096
	弁理士 平木 祐輔
(74) 代理人	100118773
	弁理士 藤田 節

最終頁に続く

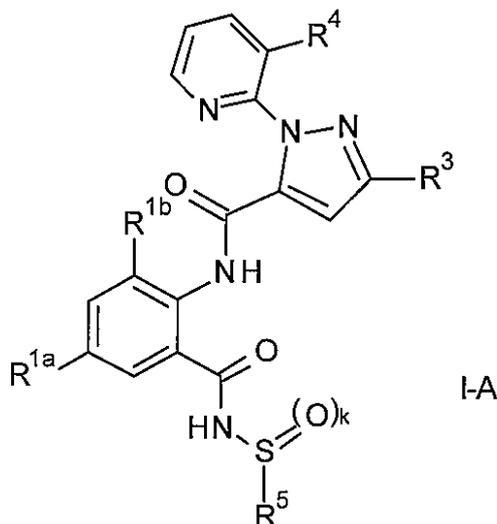
(54) 【発明の名称】 N-チオアントラニルアミド化合物、及び殺有害生物剤としてのそれらの使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I-A)のN-チオアントラニルアミド化合物

【化1】



10

又は、その立体異性体、N-オキシド、互変異性体、若しくは農業的若しくは獣医学的に許

20

容される塩：

(式中、

R^{1a} 及び R^{1b} は、クロロ、プロモ、ヨード、シアノ、及び部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよい $C_1 \sim C_6$ -アルキルから選択され、

R^3 は、クロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 $OCHF_2$ からなる群から選択され、

R^4 は、クロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、メトキシ、及びジフルオロメトキシから選択され、

R^5 は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、2-ブチル(sec-ブチル)、イソブチル、tert-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、及びシクロブチルプロピルからなる群から選択され、

k は、0、1又は2である)。

【請求項2】

R^5 がメチル、エチル、n-プロピル及びイソプロピルから選択される、
請求項1に記載の式(I-A)の化合物。

【請求項3】

R^{1a} がメチル、クロロ、プロモ、ヨード、及びシアノから選択され、
 R^{1b} がクロロ、プロモ、及びメチルから選択される、
請求項1又は2に記載の式(I-A)の化合物。

【請求項4】

R^{1a} がメチル又はクロロである、
請求項3に記載の式(I-A)の化合物。

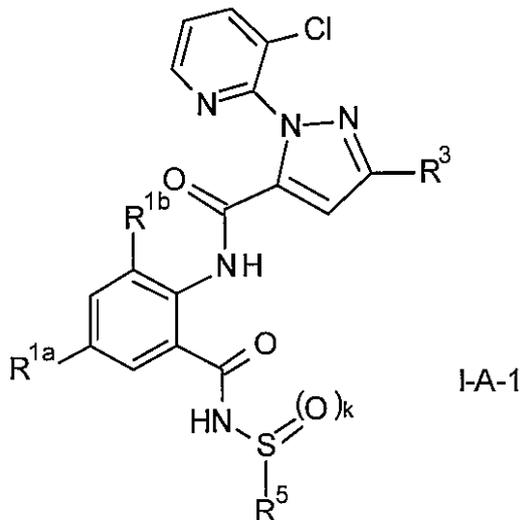
【請求項5】

R^{1a} がメチルである、
請求項4に記載の式(I-A)の化合物。

【請求項6】

化合物が一般式I-A-1

【化2】



(式中、

R^{1a} 及び R^{1b} は請求項1~5のいずれか1項で定義された通りであり、 R^3 、 R^5 及び k は請求項1~5のいずれか1項で定義された通りである。)

を有する、請求項1~5のいずれか1項に記載の式(I-A)の化合物。

【請求項7】

k が0又は1である、請求項1~6のいずれか1項に記載の式(I-A)の化合物。

【請求項8】

以下の化合物1-1~1-53のいずれかから選択される、請求項6に記載の式(I-A)の化合物

【表1】

化合物	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁵	k
1-1	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0
1-2	Cl	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	0
1-3	Cl	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	1
1-4	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH(CH ₃) ₂	0
1-5	Cl	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	0
1-6	Br	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	0
1-7	Br	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	1
1-8	Br	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	2
1-9	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH(CH ₃) ₂	2
1-10	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	0
1-11	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0
1-12	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	0
1-13	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0
1-14	Br	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0
1-15	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	1
1-16	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1
1-17	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	1
1-18	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1
1-19	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1
1-20	Br	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1
1-21	Cl	Cl	CF ₃	CH ₃	0
1-22	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	0
1-23	Br	Br	CF ₃	CH ₃	0
1-24	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	0
1-25	Cl	Br	CF ₃	CH ₃	0
1-26	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₃	0
1-27	Cl	Cl	CF ₃	CH ₃	1
1-28	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	1
1-29	Br	Br	CF ₃	CH ₃	1
1-30	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	1
1-31	Cl	Br	CF ₃	CH ₃	1
1-32	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₃	1
1-33	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0
1-34	CN	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	0
1-35	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₃	0
1-36	CN	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	0
1-37	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0

10

20

30

40

化合物	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁵	k
1-38	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0
1-39	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0
1-40	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0
1-41	Br	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0
1-42	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0
1-43	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0
1-44	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1
1-45	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1
1-46	Br	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1
1-47	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1
1-48	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1
1-49	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1
1-50	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	2
1-51	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1
1-52	CN	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	1
1-53	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1

10

20

【請求項 9】

請求項1~8のいずれか1項に記載の少なくとも一つの化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体又は農業的もしくは獣医学的に許容される塩、並びに少なくとも1種の液体及び/又は固体担体を含む、農業用又は動物用組成物。

【請求項 10】

請求項1~8のいずれか1項に記載の少なくとも一つの化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体又は農業的もしくは獣医学的に許容される塩、並びに少なくとも1種の更なる殺有害生物剤を含む混合物又は組成物。

【請求項 11】

無脊椎有害生物に対処する又はそれを防除する方法であって、前記有害生物又はその食物供給、生息場所、又は繁殖場所に、殺有害生物有効量の請求項1~8のいずれか1項に記載の少なくとも一つの化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体又は農業的もしくは獣医学的に許容される塩、又は請求項9に記載の組成物を接触させることを含む、方法（ヒトを処置する方法を除く）。

30

【請求項 12】

無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から生長植物を保護する方法であって、植物、又は該植物が生長中の土壌もしくは水に、殺有害生物有効量の請求項1~8のいずれか1項に記載の少なくとも一つの化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体又は農業的もしくは獣医学的に許容される塩、又は請求項9に記載の組成物を接触させることを含む、方法。

40

【請求項 13】

土壌昆虫から種子を、及び土壌及び葉昆虫から苗の根及び苗条を保護する方法であって、播種前及び/又は予備発芽後の種子に、請求項1~8のいずれか1項に記載の少なくとも一つの化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体又は農業的もしくは獣医学的に許容される塩、又は請求項9に記載の組成物を接触させることを含む、方法。

【請求項 14】

請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体又は農業的もしくは獣医学的に許容される塩を、植物繁殖材料100kg当たり0.1g~10kgの量で含む種子。

【請求項 15】

50

動物（ヒトを除く）の体内及び体表の無脊椎寄生生物に対処する、又はそれを防除するための、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体もしくは獣医学的に許容される塩、又は請求項9に記載の組成物の使用。

【請求項16】

寄生生物に寄生されたもしくは感染した非ヒト動物を処置するため、又は非ヒト動物が寄生生物に寄生されるもしくは感染するのを予防するため、又は寄生生物による寄生もしくは感染から非ヒト動物を保護するための方法であって、該非ヒト動物に、殺寄生生物有効量の請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、互変異性体又は獣医学的に許容される塩、又は請求項9に記載の組成物を、経口、局所もしくは非経口投与するか、又は施用することを含む、方法。

10

【請求項17】

請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物、又はその立体異性体、N-オキシドもしくは獣医学的に許容される塩を含む医薬。

【請求項18】

寄生生物による寄生又は感染に対して、動物を処置、防除、予防又は保護するための、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物、又はその立体異性体、N-オキシドもしくは獣医学的に許容される塩を含む医薬。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、N-チオ-アントラニルアミド化合物、並びにその立体異性体、N-オキシド、互変異性体、及び塩、並びにそれらを含む組成物に関する。本発明はまた、無脊椎有害生物に対処するための、N-チオ-アントラニルアミド化合物又はこうした化合物を含む組成物の使用にも関する。さらに、本発明はこうした化合物を施用する方法に関する。

20

【背景技術】

【0002】

無脊椎有害生物、特に昆虫、節足動物及び線虫は、生長中及び収穫済みの作物を台無しにし、木造住宅及び商業建築物を襲い、これにより食料供給や所有物に甚大な経済的損失を引き起こす。多くの殺有害生物剤が知られているが、標的有害生物が前記薬剤に対する抵抗性を発現する能力を持つために、特に昆虫、クモ形類及び線虫等の無脊椎有害生物に対処するための新たな薬剤が引き続き必要とされている。

30

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

本発明の目的は、無脊椎有害生物、特に害虫に対する高い殺有害生物活性を有するさらなる化合物を提供することである。本化合物は、多くの様々な無脊椎有害生物に対して、特に防除するのが困難な昆虫、クモ形類及び線虫に対して広い活性スペクトルを示すべきである。

【0004】

上記の目的が、以下に定義する一般式(1)のN-チオ-アントラニルアミド化合物(それらの立体異性体、それらのN-オキシド、それらの互変異性体及びそれらの塩、特にそれらの農業的又は獣医学的に許容される塩を含む)により実現することができることが今や見出された。

40

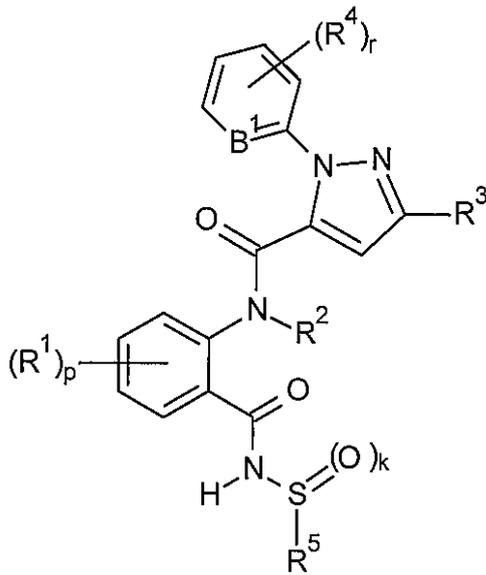
【課題を解決するための手段】

【0005】

したがって、第1の態様では、本発明は、式(1)のN-チオアントラニルアミド化合物

【0006】

【化1】



(I)

10

【0007】

並びに、その立体異性体、N-オキシド、互変異性体、及び農業的又は獣医学的に許容される塩に関する：

20

(式中、

B¹はN又はCHであり、

各R¹は、ハロゲン；シアノ；アジド；ニトロ；-SCN；SF₅；C₁～C₆-アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；C₃～C₈-シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；C₂～C₆-アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；C₂～C₆-アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；-Si(R¹⁴)₂R¹³；-OR⁸；-OS(O)_nR⁸；-SR⁸；-S(O)_mR⁸；-S(O)_nN(R^{9a})R^{9b}；-N(R^{9a})R^{9b}；-N(R^{9a})C(=O)R⁷；C(=O)R⁷；-C(=O)OR⁸；-C(=NR^{9a})H；-C(=NR^{9a})R⁷；-C(=O)N(R^{9a})R^{9b}；C(=S)N(R^{9a})R^{9b})；フェニル(1、2、3、4又は5個の基R¹⁰で置換されていてもよい)；並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

30

R²は、水素；シアノ；C₁～C₁₀-アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；C₃～C₈-シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；C₂～C₁₀-アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；C₂～C₁₀-アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)；-N(R^{9a})R^{9b}；-Si(R¹⁴)₂R¹³；-OR⁸；-SR⁸；-S(O)_mR⁸；-S(O)_nN(R^{9a})R⁹；-C(=O)R⁷；-C(=O)OR⁸；-C(=O)N(R^{9a})R^{9b}；-C(=S)R⁷；-C(=S)OR⁸；-C(=S)N(R^{9a})R^{9b}；-C(=NR^{9a})R⁷；フェニル(1、2、3、4又は5個の基R¹⁰で置換されていてもよい)；並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

40

R³は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₆-アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)、C₃～C₈-シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の

50

基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{13}$ 、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{9a})\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9n}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

10

各 R^4 は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-\text{SCN}$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{13}$ 、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{9a})\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9n}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

20

R^5 は、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

30

各 R^7 は、シアノ、アジド、ニトロ、 $-\text{SCN}$ 、 SF_5 、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{13}$ 、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{OSO}_2\text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})(=\text{NH})-\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})(=\text{N}-\text{CN})-\text{R}^8$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{19}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

40

且つ、 R^7 がシクロアルキル基又はヘテロ環式環に結合している場合、 R_7 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、及びベンジル(1、2、3、4又は5つの基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群からさらに選択されてもよく、

且つ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{QR}^8)\text{R}^7$ 、及び $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ の基において、 R^7 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキ

50

ニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、及びベンジル(1、2、3、4又は5つの基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群からさらに選択されてもよく、

又は、ジェミナル位に結合している2つの基 R^7 が一緒になって、 $=CR^{11}R^{12}$ 、 $=S(R^8)_2$ 、 $=NR^{9a}$ 、 $=NOR^8$ 、及び $=NNR^{9a}R^{9b}$ から選択される基を形成するか、

又は、2つの基 R^7 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6、7又は8員の飽和した、又は部分的に不飽和の炭素環式環又はヘテロ環式環を形成し、

各 R^8 は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $-Si(R^{14})_2R^{13}$ 、 $-SR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 、 $-S(O)_nN(R^{9a})R^{9b}$ 、

$-N(R^{9a})R^{9b}$ 、 $-N=CR^{15}R^{16}$ 、 $-C(=O)R^{17}$ 、 $-C(=O)N(R^{9a})R^{9b}$ 、 $-C(=S)N(R^{9a})R^{9b}$ 、 $-C(=O)OR^{20}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択されるが、

ただし、 R^8 が酸素原子に結合している場合、 R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシではないことを条件とし、

R^{9a} 、 R^{9b} は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ(最後に述べた4つの基の中のアルキル部分は、1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル(このシクロアルキル部分は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $-N(R^{21})R^{22}$ 、 $-N(R^{21})C(=O)R^{19}$ 、 $-Si(R^{14})_2R^{13}$ 、 $-OR^{20}$ 、 $-SR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 、 $-S(O)_nN(R^{21})R^{22}$ 、 $-C(=O)R^{19}$ 、 $-C(=O)OR^{20}$ 、 $-C(=O)N(R^{21})R^{22}$ 、 $-C(=S)R^{17}$ 、 $-C(=S)OR^{20}$ 、 $-C(=S)N(R^{21})R^{22}$ 、 $-C(=NR^{21})R^{17}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 、 $-S(O)_nN(R^{21})R^{22}$ 、

フェニル(1、2、3、4又は5つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択されるか、

又は、 R^{9a} 及び R^{9b} は一緒になって、基 $=CR^{11}R^{12}$ 若しくは $=S(R^8)_2$ を形成するか、

又は、 R^{9a} 及び R^{9b} は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のさらなるヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含んでいてもよい、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)を形成してもよく、

各 R^{10} は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく

10

20

30

40

50

、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $-\text{Si}(R^{14})_2R^{13}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_nR^{20}$ 、 $-\text{SR}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_mR^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(R^{21})R^{22}$ 、 $-\text{N}(R^{21})R^{22}$ 、 $\text{C}(=\text{O})R^{19}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{21})R^{22}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(R^{21})R^{22}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(R^{21})R^{22}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、又は不飽和のヘテロ環式環(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択されるか、

10

又は、隣接する原子上で結合している2つの基 R^{10} が、一緒になって、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{N}-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CH}-\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CHCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHO}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)\text{O}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CHCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHS}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{S}-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^{21}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{NR}^{21}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 及び $-\text{SCH}=\text{N}-$ から選択される基を形成し、したがって、これらが結合している原子と一緒に、5又は6員の環を形成し、上記基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシ、及びハロメトキシから選択される1つ以上の置換基で置き換られていてもよいが、又は上記基の1つ以上の CH_2 基は、 $\text{C}=\text{O}$ 基で置き換られていてもよく、

20

R^{11} 、 R^{12} は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $-\text{C}(=\text{O})R^{19}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{21})R^{22}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(R^{21})R^{22}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(R^{21})R^{22}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択されるが、

30

ただし、 R^{11} 、 R^{12} が、ジェミナル位の2つの R^{19} 基として結合している場合、これらは $-\text{C}(=\text{O})R^{19}$ から選択されないことを条件とし、

R^{13} 、 R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、及びベンジルからなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択され、

40

R^{15} 、 R^{16} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{19} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択され、

各 R^{17} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロ

50

アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フェニル、及びベンジルからなる群から独立して選択され、

各 R^{19} は、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-Si(R^{14})_2R^{13}$ 、 $-OR^{20}$ 、 $-OSO_2R^{20}$ 、 $-SR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 、 $-S(O)_nN(R^{21})R^{22}$ 、 $-N(R^{21})R^{22}$ 、 $-C(=O)N(R^{21})R^{22}$ 、 $-C(=S)N(R^{21})R^{22}$ 、 $-C(=O)OR^{20}$ 、 $-C(=O)R^{20}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される、1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

10

且つ、 R^{19} がシクロアルキル基に結合している場合、 R^{19} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、及び $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニルからなる群からさらに選択されてもよく、

且つ、基 $-C(=O)R^{19}$ において、 R^{19} は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、及び $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニルからさらに選択されてもよく、

20

又は、ジェミナル位に結合している2つの基 R^{19} が一緒になって、 $=CR^{11}R^{12}$ 、 $=S(R^{20})_2$ 、 $=NR^{21}$ 、 $=NOR^{20}$ 、及び $=NNR^{21}$ から選択される基を形成するか、

又は、2つの基 R^{19} は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6、7又は8員の飽和した、又は部分的に不飽和の炭素環式環又はヘテロ環式環を形成し、

各 R^{20} は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、 $-Si(R^{14})_2R^{13}$ 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノスルホニル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ、ジ-($C_1 \sim C_6$ -アルキル)-アミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノカルボニル、ジ-($C_1 \sim C_6$ -アルキル)-アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシカルボニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される、1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択されるが、

30

40

ただし、 R^{20} が酸素原子に結合している場合、 R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシではないことを条件とし、

R^{21} 及び R^{22} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、C

50

$C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルキニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されているもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されているもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される、1つ以上の基で置換されているもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択されるか、

10

又は、R²¹及びR²²は、これらが結合している窒素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1又は2個のさらなるヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含んでもよい、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されているもよい)を形成してもよく、

kは、0、1又は2であり、

20

各mは、独立して1又は2であり、

各nは、独立して0、1又は2であり、

pは、0、1、2、3、又は4であり、

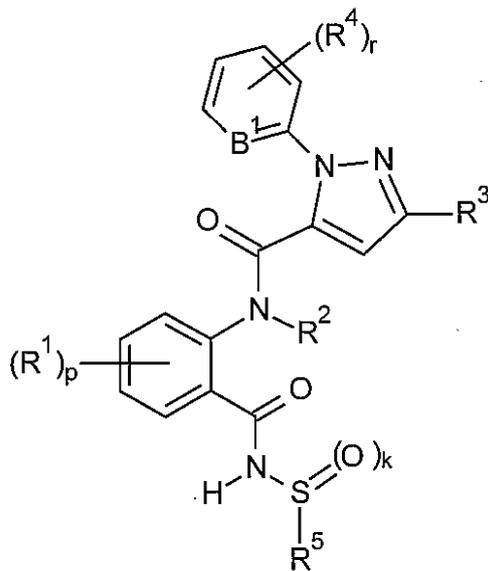
rは、0、1、2、3、又は4である)。

【0008】

さらなる態様では、本発明は式(I)のN-チオアントラニルアミド化合物

【0009】

【化2】



30

(I)

40

【0010】

並びに、その立体異性体、N-オキシド、互変異性体及び農業的又は獣医学的に許容される塩に関する：

(式中、

B¹はN又はCHであり、

各R¹は、ハロゲン；シアノ；アジド；ニトロ；-SCN；SF₅； $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは

50

完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{13}$; $-\text{OR}^8$; $-\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^8$; $-\text{SR}^8$; $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$; $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$; $\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$; $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$; $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{H}$; $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{R}^7$; $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; $\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい); 並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

10

R^2 は、水素;シアノ; $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい); $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{13}$; $-\text{OR}^8$; $-\text{SR}^8$; $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$; $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^9$; $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$; $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$; $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^7$; $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^8$; $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$; $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{R}^7$; フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい); 及び環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

20

R^3 は、水素、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{13}$ 、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{9a})\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9n}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

30

各 R^4 は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-\text{SCN}$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $-\text{Si}(\text{R}^{14})_2\text{R}^{13}$ 、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^8$ 、 $-\text{SR}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ 、 $-\text{S}(\text{O})_n\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{9a})\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{9a})\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9n}$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^{9a})\text{R}^{9b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5個の基 R^{10} で置換されていてもよい); 並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

40

50

R⁵は、水素、C₁~C₁₂-アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)、C₃~C₈-シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)、C₂~C₆-アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)、C₂~C₆-アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基R⁷で置換されていてもよい)、-N(R^{9a})R^{9b}、フェニル(1、2、3、4又は5個の基R¹⁰で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群から選択され、

10

各R⁷は、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、SF₅、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、-Si(R¹⁴)₂R¹³、-OR⁸、-OSO₂R⁸、-SR⁸、-S(O)_mR⁸、-S(O)_nN(R^{9a})R^{9b}、-N(R^{9a})R^{9b}、-C(=O)N(R^{9a})R^{9b}、-C(=S)N(R^{9a})R^{9b}、-C(=O)OR⁸、-C(=O)R¹⁹、フェニル(1、2、3、4又は5個の基R¹⁰で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

且つ、R⁷がシクロアルキル基又はヘテロ環式環に結合している場合、R⁷は、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、及びベンジル(1、2、3、4又は5つの基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群からさらに選択されてもよく、

20

且つ、-C(=O)R⁷、-C(=S)R⁷、-C(=NR^{9a})R⁷、-C(=N-QR⁸)R⁷、及び-N(R^{9a})C(=O)R⁷の基において、R⁷は、水素、ハロゲン、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、及びベンジル(1、2、3、4又は5つの基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群からさらに選択されてもよく、

又は、ジェミナル位に結合している2つの基R⁷が一緒になって、=CR¹¹R¹²、=S(O)_mR⁸、=S(O)_mN(R^{9a})R^{9b}、=NR^{9a}、=NOR⁸、及び=NNR^{9a}R^{9b}から選択される基を形成するか、

30

或いは、2つの基R⁷は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6、7又は8員の飽和した、又は部分的に不飽和の炭素環式環又はヘテロ環式環を形成し、

各R⁸は、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ、C₁~C₆-アルキルスルフィニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆-アルキルスルホニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルホニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、-Si(R¹⁴)₂R¹³、-SR²⁰、-S(O)_mR²⁰、-S(O)_nN(R^{9a})R^{9b}、

40

-N(R^{9a})R^{9b}、-N=CR¹⁵R¹⁶、-C(=O)R¹⁷、-C(=O)N(R^{9a})R^{9b}、-C(=S)N(R^{9a})R^{9b}、-C(=O)OR²⁰、フェニル(1、2、3、4又は5個の基R¹⁰で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択されるが、

ただし、R⁸が酸素原子に結合している場合、R⁸は、C₁~C₆-アルコキシ又はC₁~C₆-ハロアルコキシではないことを条件とし、

R^{9a}、R^{9b}は、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されて

50

いてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ(最後に述べた4つの基の中のアルキル部分は、1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル(このシクロアルキル部分は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} 、 $-N(R^{21})R^{22}$; $-N(R^{21})C(=O)R^{19}$; $-Si(R^{14})_2R^{13}$; $-OR^{20}$; $-SR^{20}$; $-S(O)_mR^{20}$; $-S(O)_nN(R^{21})R^{22}$; $-C(=O)R^{19}$ で置換されていてもよい); $-C(=O)OR^{20}$; $-C(=O)N(R^{21})R^{22}$; $-C(=S)R^{17}$; $-C(=S)OR^{20}$; $-C(=S)N(R^{21})R^{22}$; $-C(=NR^{21})R^{17}$ - $S(O)_mR^{20}$; $-S(O)_nN(R^{21})R^{22}$ 、

10

フェニル(1、2、3、4又は5つの基 R^{10} で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択されるか、

又は、 R^{9a} 及び R^{9b} は一緒になって、基 $=CR^{11}R^{12}$ を形成するか、

又は、 R^{9a} 及び R^{9b} は、これらが結合している窒素原子と一緒に、環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1又は2個のさらなるヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含んでいてもよい、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、1つ以上の基 R^{10} で置換されていてもよい)を形成してもよく、

20

各 R^{10} は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_{10}$ -アルケニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $C_2 \sim C_{10}$ -アルキニル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^{19} で置換されていてもよい)、 $-Si(R^{14})_2R^{13}$ 、 $-OR^{20}$ 、 $-OS(O)_nR^{20}$ 、 $-SR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 、 $-S(O)_nN(R^{21})R^{22}$ 、 $-N(R^{21})R^{22}$ 、 $C(=O)R^{19}$ 、 $-C(=O)OR^{20}$ 、 $-C(=NR^{21})R^{22}$ 、 $-C(=O)N(R^{21})R^{22}$ 、 $-C(=S)N(R^{21})R^{22}$ 、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、又は不飽和のヘテロ環式環(ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシから独立して選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択されるか、

30

又は、隣接する原子上で結合している2つの基 R^{10} が、一緒になって、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、

40

$-CH=N-CH=CH-$ 、 $-N=CH-N=CH-$ 、 $-OCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH=CHO-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2C(=O)O-$ 、 $-C(=O)OCH_2-$ 、 $-O(CH_2)O-$ 、 $-SCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-SCH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2SCH_2CH_2-$ 、 $-SCH_2CH_2S-$ 、 $-SCH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH=CHS-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2C(=S)S-$ 、 $-C(=S)SCH_2-$ 、 $-S(CH_2)S-$ 、 $-CH_2CH_2NR^{21}-$ 、 $-CH_2CH=N-$ 、 $-CH=CH-NR^{21}-$ 、

$-OCH=N-$ 及び $-SCH=N-$ から選択される基を形成し、したがって、これらが結合している原子と一緒に、5又は6員の環を形成し、上記基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロメチル、ヒドロキシル、メトキシ、及びハロメトキシから選択される1つ以上の置換基で

50

置き換られていてもよいが、又は上記基の1つ以上のCH₂基は、C=O基で置き換られていてもよく、

R¹¹、R¹²は、水素、ハロゲン、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、-C(=O)R¹⁹、-C(=O)OR²⁰、-C(=NR²¹)R²²、-C(=O)N(R²¹)R²²、-C(=S)N(R²¹)R²²、フェニル(1、2、3、4又は5個の基R¹⁰で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(1つ以上の基R¹⁰で置換されていてもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択されるが

10

ただし、R¹¹、R¹²が、ジェミナル位の2つのR¹⁹基として結合している場合、これらは-C(=O)R¹⁹から選択されないことを条件とし、

R¹³、R¹⁴は、C₁~C₄-アルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、C₁~C₄-アルコキシ-C₁~C₄-アルキル、フェニル、及びベンジルからなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択され、

R¹⁵、R¹⁶は、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルコキシ-C₁~C₆-アルキル、フェニル(1、2、3、4又は5個の基R¹⁹で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(1つ以上の基R¹⁹で置換されていてもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択され、

20

各R¹⁷は、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルコキシ-C₁~C₆-アルキル、フェニル及びベンジルからなる群から独立して選択され、

各R¹⁹は、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、SF₅、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、-Si(R¹⁴)₂R¹³、-OR²⁰、

30

-OSO₂R²⁰、-SR²⁰、-S(O)_mR²⁰、-S(O)_nN(R²¹)R²²、-N(R²¹)R²²、-C(=O)N(R²¹)R²²、

-C(=S)N(R²¹)R²²、-C(=O)OR²⁰、-C(=O)R²⁰、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される、1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択され、

40

且つ、R¹⁹がシクロアルキル基に結合している場合、R¹⁹は、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、及びC₂~C₆-ハロアルキニルからなる群からさらに選択されてもよく、

且つ、基-C(=O)R¹⁹において、R¹⁹は、水素、ハロゲン、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ-C₁~C₆-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、及びC₂~C₆-ハロアルキニルからさらに選択されてもよく、

又は、ジェミナル位に結合している2つの基R¹⁹が一緒になって、=CR¹¹R¹²、=S(O)_mR²⁰、=S(O)_mN(R²¹)R²²、=NR²¹、=NOR²⁰、及び=NNR²¹から選択される基を形成するか、

又は、2つの基R¹⁹は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、環員として、N

50

、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6、7又は8員の飽和した、又は部分的に不飽和の炭素環式環又はヘテロ環式環を形成し、

各R²⁰は、水素、シアノ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ、C₁~C₆-アルキルスルフィニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆-アルキルスルホニル、C₁~C₆-ハロアルキルスルホニル、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、-Si(R¹⁴)₂R¹³、C₁~C₆-アルキルアミノスルホニル、アミノ、C₁~C₆-アルキルアミノ、ジ-(C₁~C₆-アルキル)-アミノ、C₁~C₆-アルキルカルボニル、C₁~C₆-ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、C₁~C₆-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁~C₆-アルキル)-アミノカルボニル、C₁~C₆-アルコキシカルボニル、C₁~C₆-ハロアルコキシカルボニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される、1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から独立して選択されるが、

ただし、R²⁰が酸素原子に結合している場合、R²⁰は、C₁~C₆-アルコキシ又はC₁~C₆-ハロアルコキシではないことを条件とし、

R²¹及びR²²は、水素、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₁~C₆-ハロアルコキシ、C₁~C₆-アルキルチオ、C₁~C₆-ハロアルキルチオ、C₃~C₈-シクロアルキル、C₃~C₈-ハロシクロアルキル、C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル、C₂~C₆-アルケニル、C₂~C₆-ハロアルケニル、C₂~C₆-アルキニル、C₂~C₆-ハロアルキニル、フェニル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、ベンジル(ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される1、2、3、4又は5つの基で置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから独立して選択される、1つ以上の基で置換されていてもよい)からなる群から、互いに独立して及び出現毎に独立して選択されるが、

又は、R²¹及びR²²は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1又は2個のさらなるヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含んでいてもよい、3、4、5、6又は7員の飽和した、部分的に不飽和又は芳香族性のヘテロ環式環(このヘテロ環式環は、ハロゲン、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-ハロアルキル、C₁~C₆-アルコキシ、及びC₁~C₆-ハロアルコキシから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい)を形成してもよく、

kは、0、1又は2であり、

各mは、独立して1又は2であり、

各nは、独立して0、1又は2であり、

pは、0、1、2、3又は4であり、

rは、0、1、2、3又は4である)。

10

20

30

40

50

【 0 0 1 1 】

アントラニルアミド化合物は、いくつかの特許出願(例えば、WO 01/70671、WO 03/015518、WO 03/024222、WO 2006/000336、WO 2006/068669、WO 2007/043677、WO 2008/130021、WO 03/015519、WO 2004/046129)に記載されている。WO 03/016300には、N-チオ-アントラニルアミド化合物を包含する包括的なアントラニルアミドの式が記載されている。WO 03/016284には、とりわけ、安息香酸アミドの窒素が、2つの置換基で置換されており、これらの置換基の1つが、硫黄原子を介して結合していてもよい、ある種のN-チオ-アントラニルアミド化合物が記載されている。WO 2007/006670には、チオ置換基が-S[O]_m-NR¹²R¹³である、スルフィリミン基又はスルホキシミン基を有するN-チオ-アントラニルアミド化合物、及び殺有害生物剤としてのそれらの使用が記載されている。

10

【 0 0 1 2 】

安息香酸アミドの窒素が、水素及び1つのチオ置換基だけしか有していない、N-チオ-アントラニルアミド化合物が記載されている文献はない。

【 0 0 1 3 】

本発明は、有害無脊椎動物を防除する、特に節足動物及び線虫、とりわけ昆虫を防除するために特に有用な式(1)の化合物、その立体異性体、N-オキシド、互変異性体、及びその塩に関する。さらに、本発明は、本発明による化合物の合成のための方法及び式(1)の化合物の合成のための中間体化合物に関する。

【 0 0 1 4 】

さらに、本発明はまた、以下の実施形態に関するものであり、且つこれらを含む。

20

- 少なくとも1つの式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩、及び少なくとも1種の液体及び/若しくは固体担体とを含む、農業用又は獣医学的組成物。

- 有害無脊椎動物を駆除又は防除するための方法であって、前記有害生物又はその食物供給、生息地又は繁殖地を、少なくとも1つの式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩、又は本明細書で定義される組成物の殺有害生物有効量に接触させることを含む方法。

- 有害無脊椎動物による攻撃又は侵襲から成長している植物を保護するための方法であって、植物又はこの植物が成長している土壌若しくは水を、少なくとも1つの式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩、又は本明細書で定義される組成物の殺有害生物有効量に接触させることを含む方法。

30

- 植物の繁殖材料、特に種子を土壌昆虫から保護するため、及び苗木の根及び苗条を土壌昆虫及び葉昆虫から保護するための方法であって、播種前及び/又は発芽前処理後に、植物繁殖材料、特に種子を、少なくとも1つの式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩、又は本明細書で定義される組成物と接触させることを含む方法。

- 式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩を、植物繁殖材料100kg当たり0.1g~10kgの量で含む、種子。

- 昆虫、クモ又は線虫のグループの有害無脊椎動物を駆除又は防除するための、式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩、又は請求項yyにおいて定義される組成物の使用。

40

- 有害無脊椎動物による攻撃又は侵襲から、成長している植物を保護するための、式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩、又は請求項yyにおいて定義される組成物の使用。

- 動物の体内及び体の上の無脊椎寄生生物を駆除又は防除するための、式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は獣医学的に許容される塩、又は本明細書で定義される組成物の使用。

- 寄生生物に侵襲された若しくはこれらに感染した非ヒト動物を処置するための、又は非ヒト動物が寄生生物に侵襲される若しくはこれらに感染するのを予防するための、又は寄生生物の侵襲若しくは感染から非ヒト動物を保護するための方法であって、式(1)の化

50

合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は獣医学的に許容される塩、又は本明細書で定義される組成物の殺寄生生物有効量を非ヒト動物に経口的に、局所的又は非経口的に投与する又は適用させることを含む方法。

- 医薬として使用するための、式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は獣医学的に許容される塩。

- 寄生生物による侵襲又は感染に対する動物の処置、防除、予防又は保護における使用のための、式(1)の化合物、或いはその立体異性体、N-オキシド又は獣医学的に許容される塩。

【発明を実施するための形態】

【0015】

置換パターンに応じて、式(1)の化合物は1つ以上のキラル中心を有することができ、この場合これらはエナンチオマー又はジアステレオマーの混合物として存在する。本発明は、式(1)の化合物の純粋なエナンチオマー又は純粋なジアステレオマー、及びこれらの混合物の両方、並びに本発明による式(1)の化合物の純粋なエナンチオマー若しくは純粋なジアステレオマー又はその混合物の使用を提供する。式(1)の適切な化合物はまた、すべての可能な幾何学立体異性体(シス/トランス異性体)及びこれらの混合物も含む。シス/トランス異性体は、アルケン、炭素-窒素二重結合、窒素-硫黄二重結合又はアミド基に対して存在し得る。「立体異性体」という用語は、光学異性体、例えば、エナンチオマー又はジアステレオマー(後者は、分子内の複数のキラル中心により存在する)、並びに幾何異性体(シス/トランス異性体)の双方を包含する。

【0016】

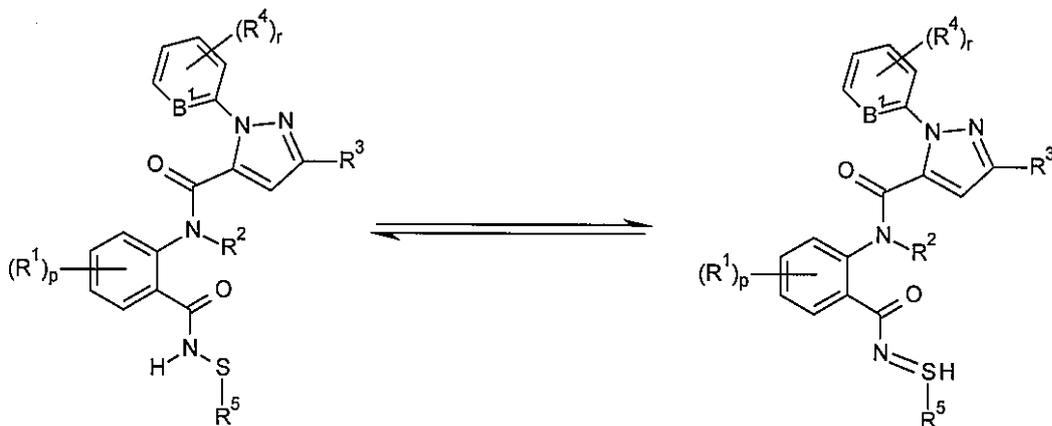
式(1)の化合物は、N-オキシドの形態で存在し得る。「N-オキシド」という用語は、N-オキシド部分に酸化した少なくとも1個の第三級窒素原子を有する任意の本発明の化合物を含む。化合物(1)のN-オキシドは特に、ピリジン環及び/又はピラゾール環の環窒素原子を、ペルオキシカルボン酸又は他の過酸化剤などの適切な酸化剤で酸化することにより、調製することができる。当業者は、本発明の化合物がN-オキシドを形成し得るか、及びそのどの位置にN-オキシドを形成し得るかを認識する。

【0017】

置換パターンに応じて、式(1)の化合物は互変異性体の形態で存在し得る。したがって本発明はまた、式(1)の互変異性体並びに前記互変異性体の立体異性体、塩、及びN-オキシドに関する。例えば、k=0である場合、式(1)の化合物は、以下の互変異性体の形態で存在し得る。

【0018】

【化3】



【0019】

当業者は、本発明の化合物が互変異性体として存在し得るか、及びそのどの位置で互変異性体として存在し得るかを認識する。

【0020】

10

20

30

40

50

本発明の化合物は、非晶質であってもよく、又は1種以上の異なる結晶状態(多形体)で存在していてもよく、この状態は、安定性等の異なる巨視的特性を有することがあるか、又は活性等の異なる生物特性を示すことがある。本発明には、非晶質性と結晶性の式(1)の化合物の両方、それらの鏡像異性体又はジアステレオマー、それぞれの式(1)の化合物の異なる結晶状態の混合物、その鏡像異性体又はジアステレオマー、並びにその非晶質性又は結晶性の塩が含まれる。

【0021】

本発明の化合物の塩は、好ましくは農業的及び獣医学的に許容される塩である。それらの塩は、慣用的な方法で、例えば、本発明の化合物が塩基官能性を有する場合、該化合物と酸とを反応させることにより、又は本発明の化合物が酸官能性を有する場合、該化合物と適切な塩基とを反応させることにより形成することができる。

10

【0022】

適切な農業的に許容される塩は、とりわけ、これらの陽イオンの塩又はこれらの酸の酸付加塩であり、その陽イオン及び陰イオンは、それぞれ、本発明による化合物の殺有害生物作用に対していかなる悪影響も及ぼすものではない。適切な陽イオンは特に、アルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウムのイオン、好ましくはアルカリ土類金属、好ましくはカルシウム、マグネシウム及びバリウムのイオン、並びに遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオンであり、さらにまたアンモニウム(NH₄⁺)及び置換アンモニウム(一つから四つの水素原子がC₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ヒドロキシアルキル、C₁~C₄-アルコキシ、C₁~C₄-アルコキシ-C₁~C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁~C₄-アルコキシ-C₁~C₄-アルキル、フェニル又はベンジルにより置きかえられている)である。置換アンモニウムイオンの例には、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチルアンモニウム、ビス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、及びベンジル-トリエチルアンモニウム、さらにホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C₁~C₄-アルキル)スルホニウム、及びスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C₁~C₄-アルキル)スルホキソニウムが含まれる。

20

【0023】

有用な酸付加塩の陰イオンには、主として塩化物イオン、臭化物イオン、フッ化物イオン、硫酸水素イオン、硫酸イオン、リン酸二水素イオン、リン酸水素イオン、リン酸イオン、硝酸イオン、炭酸水素イオン、炭酸イオン、ヘキサフルオロケイ酸イオン、ヘキサフルオロリン酸イオン、安息香酸イオン、及びC₁~C₄-アルカン酸の陰イオン、好ましくはギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオン及び酪酸イオンがある。これらは、本発明の化合物を、対応する陰イオンの酸、好ましくは塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸又は硝酸と反応させることによって形成することができる。

30

【0024】

本発明の化合物の獣医学的に許容される塩は、獣医学的に使用するための塩の形成について当技術分野で公知であり、且つ許容される陽イオンの塩又は酸付加塩を包含する。例えば、塩基性窒素原子(例えばアミノ基)を含有している本発明の化合物により形成される適切な酸付加塩には、無機酸との塩、例えば塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩、及び硝酸塩、並びに有機酸、例えば酢酸、マレイン酸(例えば、マレイン酸の一酸塩もしくは二酸塩)、二マレイン酸、フマル酸(例えば、フマル酸の一酸塩もしくは二酸塩)、二フマル酸、メタンスルフェン酸、メタンスルホン酸、及びコハク酸の塩が含まれる。

40

【0025】

一実施形態において、本発明の化合物は、その立体異性体、N-オキシド及び農業的又は獣医学的に許容される塩を含む。

【0026】

別の実施形態において、本発明の化合物は、その立体異性体、N-オキシド、互変異性体

50

及び農業的又は獣医学的に許容される塩を含む。

【0027】

ハロゲンという用語のように、上記の可変基の定義において言及されている有機部位は、個々の基メンバーの個別のリストに関する総称である。接頭語 $C_n \sim C_m$ は、各場合において、基中の可能な炭素原子数を示す。

【0028】

ハロゲンという用語は、各場合において、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素、特にフッ素、塩素又は臭素を意味する。

【0029】

用語「部分的、又は完全にハロゲン化されている」とは、所与の基の水素原子の1個以上、例えば1個、2個、3個、4個もしくは5個、又はすべてがハロゲン原子、特にフッ素又は塩素により置きかえられていることを意味するものと理解されよう。部分的、又は完全にハロゲン化されている基は、以下で「ハロ-基」とも呼ばれる。例えば、部分的、又は完全にハロゲン化されているアルキルは、ハロアルキルとも呼ばれる。

【0030】

本明細書(及びアルキル基を含む他の基、例えばアルコキシ、アルキルカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル及びアルコキシアルキルのアルキル部位中)で使用する用語「アルキル」は、各場合において、通常1~12又は1~10個の炭素原子、多くの場合、1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子、特に1~3個の炭素原子を有する、直鎖又は分岐アルキル基を意味する。 $C_1 \sim C_4$ -アルキルの例は、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソ-プロピル、*n*-ブチル、2-ブチル(*sec*-ブチル)、イソブチル及び*tert*-ブチルである。 $C_1 \sim C_6$ -アルキルに関する例は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルについて言及したものの他に、*n*-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、*n*-ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-2-メチルプロピルである。 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルに関する例は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルについて言及したものの他に、*n*-ヘプチル、1-メチルヘキシル、2-メチルヘキシル、3-メチルヘキシル、4-メチルヘキシル、5-メチルヘキシル、1-エチルペンチル、2-エチルペンチル、3-エチルペンチル、*n*-オクチル、1-メチルオクチル、2-メチルヘプチル、1-エチルヘキシル、2-エチルヘキシル、1,2-ジメチルヘキシル、1-プロピルペンチル、2-プロピルペンチル、ノニル、デシル、2-プロピルヘプチル及び3-プロピルヘプチルである。

【0031】

本明細書で使用する用語「アルキレン」(又は、アルカンジイル)は、各場合において、上で定義したアルキル基であって、炭素骨格の任意の位置の水素原子の一つが、一つのさらなる結合部位により置きかえられており、それにより二価の部位を形成する、アルキル基を意味する。

【0032】

本明細書(及びハロアルキル基を含む他の基、例えばハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルカルボニル、ハロアルキルスルホニル及びハロアルキルスルフィニルのハロアルキル部位中)で使用する用語「ハロアルキル」は、各場合において、通常1~10個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_{10}$ -ハロアルキル」)、多くの場合、1~6個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル」)、より多くの場合1~4個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_{10}$ -ハロアルキル」)を有する、直鎖又は分岐アルキル基であって、この基の水素原子は部分的又は完全にハロゲン原子により置きかえられているアルキル基を意味する。好ましいハロアルキル部位は、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルから、より好ましくは $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルから、より好ましくはハロメチルから、特に $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルキルから選択される。ハロメチルとは、1個、2個又は3個の水素原子がハロゲン原子により置きかえられているメチルである。例には、プロモメ

10

20

30

40

50

チル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル等がある。C₁~C₂-フルオロアルキルに関する例には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル等がある。C₁~C₂-ハロアルキルに関する例には、C₁~C₂-フルオロアルキルについて言及したものの他に、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、2,2-ジクロロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、1-ブromoエチル等がある。C₁~C₄-ハロアルキルに関する例には、C₁~C₂-ハロアルキルについて言及したものの他に、1-フルオロプロピル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,1-トリフルオロプロピル-2-イル、3-クロロプロピル、4-クロロブチル等がある。

【 0 0 3 3 】

本明細書(及び、シクロアルキル基を含む他の基、例えばシクロアルコキシ及びシクロアルキルアルキルのシクロアルキル部位中)で使用する用語「シクロアルキル」は、各場合において、通常3~10個の炭素原子(「C₃~C₁₀-シクロアルキル」)、好ましくは3~8個の炭素原子(「C₃~C₈-シクロアルキル」)、特に3~6個の炭素原子(「C₃~C₆-シクロアルキル」)を有する、単環式又は二環式の脂環式基を意味する。3~6個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルを含む。3~8個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル及びシクロオクチルを含む。7個又は8個の炭素原子を有する二環式基の例は、ビスクロ[2.1.1]ヘキシル、ビスクロ[2.2.1]ヘプチル、ビスクロ[3.1.1]ヘプチル、ビスクロ[2.2.1]ヘプチル、ビスクロ[2.2.2]オクチル及びビスクロ[3.2.1]オクチルを含む。

【 0 0 3 4 】

本明細書で使用する用語「シクロアルキレン」(又はシクロアルカンジイル)は、各場合において、炭素骨格の任意の位置における1個の水素原子が1個のさらなる結合部位により置きかえられて2価部分を形成している上記のシクロアルキルラジカルを意味する。

【 0 0 3 5 】

本明細書(及びハロシクロアルキル基を含む他の基、例えばハロシクロアルキルメチルのハロシクロアルキル部位中)で使用する用語「ハロシクロアルキル」は、各場合において、通常3~10個の炭素原子、好ましくは3~8個の炭素原子、特に3~6個の炭素原子を有する単環式又は二環式の脂環式基であって、水素原子の少なくとも1個、例えば1個、2個、3個、4個又は5個が、ハロゲン、特にフッ素又は塩素により置きかえられている基を意味する。例には、1-及び2-フルオロシクロプロピル、1,2-、2,2-及び2,3-ジフルオロシクロプロピル、1,2,2-トリフルオロシクロプロピル、2,2,3,3-テトラフルオロシクロプロピル、1-及び2-クロロシクロプロピル、1,2-、2,2-及び2,3-ジクロロシクロプロピル、1,2,2-トリクロロシクロプロピル、2,2,3,3-テトラクロロシクロプロピル、1-、2-及び3-フルオロシクロペンチル、1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5-ジフルオロシクロペンチル、1-、2-及び3-クロロシクロペンチル、1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5-ジクロロシクロペンチル等がある。

【 0 0 3 6 】

本明細書で使用する用語「シクロアルキル-アルキル」は、アルキレン基を介して分子の他の部分に結合している、上で定義したシクロアルキル基を意味する。用語「C₃~C₈-シクロアルキル-C₁~C₄-アルキル」は、上で定義したC₁~C₄-アルキル基を介して分子の他の部分に結合している、上で定義したC₃~C₈-シクロアルキル基を指す。例には、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロペンチルメチル、シクロペンチ

10

20

30

40

50

ルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル等がある。

【 0 0 3 7 】

本明細書で使用する用語「アルケニル」は、各場合において、通常2~10個(「C₂~C₁₀-アルケニル」)、好ましくは2~6個の炭素原子(「C₂~C₆-アルケニル」)、特に2~4個の炭素原子(「C₂~C₄-アルケニル」)、及び任意の位置に一つの二重結合を有する、直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル又は2-メチル-2-プロペニル等のC₂~C₄-アルケニル;C₂~C₆-アルケニル、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-1-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-1-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル、又はC₂~C₆-アルケニルについて言及した基等のC₂~C₁₀-アルケニル、及びさらには1-ヘプテニル、2-ヘプテニル、3-ヘプテニル、1-オクテニル、2-オクテニル、3-オクテニル、4-オクテニル、1-ノネニル、2-ノネニル、3-ノネニル、4-ノネニル、1-デセニル、2-デセニル、3-デセニル、4-デセニル、5-デセニル、並びにそれらの位置異性体を意味する。

【 0 0 3 8 】

本明細書で使用する用語「アルケニレン」(又は、アルケンジイル)は、各場合において、上で定義したアルケニル基であって、炭素骨格の任意の位置の水素原子の一つが、一つのさらなる結合部位に置きかえられており、それにより二価の部位を形成するアルケニル基を意味する。

【 0 0 3 9 】

本明細書で使用する用語「ハロアルケニル」は、「ハロゲンにより置換されていてもよいアルケニル」、及びハロアルケニルオキシ中、ハロアルケニルカルボニル中等のハロアルケニル部位としても表現することができ、この用語は、2~10個(「C₂~C₁₀-ハロアルケニル」)、もしくは2~6個(「C₂~C₆-ハロアルケニル」)、又は2~4個(「C₂~C₄-ハロアルケニル」)の炭素原子、及び任意の位置に一つの二重結合を有する、直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基を指し、これらの基中の一部又はすべての水素原子が上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素及び臭素により置きかえられている(例えば、クロロビニル、クロロアリル等)。

【 0 0 4 0 】

本明細書で使用する用語「アルキニル」は、通常2~10個(「C₂~C₁₀-アルキニル」)、

多くの場合2~6個(「C₂~C₆-アルキニル」)、好ましくは、2~4個の炭素原子(「C₂~C₄-アルキニル」)、及び任意の位置に一つ又は二つの三重結合を有する、直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル等のC₂~C₄-アルキニル、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、3,3-ジメチル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル等のC₂~C₆-アルキニルを意味する。

【0041】

本明細書で使用する用語「アルキニレン」(又は、アルキンジイル)は、各場合において、上で定義したアルキニル基であって、炭素骨格の任意の位置の水素原子の一つが、一つのさらなる結合部位により置きかえられており、それにより二価の部位を形成するアルキニル基を意味する。

【0042】

本明細書で使用する用語「ハロアルキニル」は、「ハロゲンにより置換されていてもよいアルキニル」としても表現され、通常、3~10個の炭素原子(「C₂~C₁₀-ハロアルキニル」)、多くの場合、2~6個(「C₂~C₆-ハロアルキニル」)、好ましくは2~4個の炭素原子(「C₂~C₄-ハロアルキニル」)、及び任意の位置(上記の通り)に一つ又は二つの三重結合を有する、直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基であって、これらの基中の一部又はすべての水素原子が上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素及び臭素により置きかえられている炭化水素基を指す。

【0043】

本明細書で使用する用語「アルコキシ」は、各場合において、通常、1~10個の炭素原子(「C₁~C₁₀-アルコキシ」)、多くの場合、1~6個の炭素原子(「C₁~C₆-アルコキシ」)、好ましくは1~4個の炭素原子(「C₁~C₄-アルコキシ」)を有しており、酸素原子を介して分子の他の部分に結合している直鎖又は分岐アルキル基である。C₁~C₂-アルコキシは、メトキシ又はエトキシである。C₁~C₄-アルコキシには、さらに、例えばn-プロポキシ、1-メチルエトキシ(イソプロポキシ)、ブトキシ、1-メチルプロポキシ(sec-ブトキシ)、2-メチルプロポキシ(イソブトキシ)又は1,1-ジメチルエトキシ(tert-ブトキシ)。C₁~C₆-アルコキシは、さらに、例えば、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ又は1-エチル-2-メチルプロポキシがある。C₁~C₈-アルコキシにはさらに、例えばヘプチルオキシ、オクチルオキシ、2-エチルヘキシルオキシ及びそれらの位置異性体がある。C₁~C₁₀-アルコキシにはさらに、例えばノニルオキシ、デシルオキシ及びそれらの位置異性体がある。

【0044】

本明細書で使用する用語「ハロアルコキシ」は、各場合において、1~10個の炭素原子(「C₁~C₁₀-ハロアルコキシ」)、多くの場合、1~6個の炭素原子(「C₁~C₆-ハロアルコキシ」)、好ましくは1~4個の炭素原子(「C₁~C₄-ハロアルコキシ」)、より好ましくは1~3個の炭素原子(「C₁~C₃-ハロアルコキシ」)を有する、上で定義した直鎖又は分岐のアル

10

20

30

40

50

コキシ基であって、この基の水素原子が部分的又は完全にハロゲン原子、特にフッ素原子により置きかえられているアルコキシ基を意味する。 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシは、例えば CH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 、 OCH_2Cl 、 $OCHCl_2$ 、 $OCCL_3$ 、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブromoエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ又は OC_2F_5 である。 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシは、さらに、例えば2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、2,3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、2-ブromoプロポキシ、3-ブromoプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、3,3,3-トリクロロプロポキシ、 $OCH_2-C_2F_5$ 、 $OCF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエトキシ、1-(CH_2Cl)-2-クロロエトキシ、1-(CH_2Br)-2-ブromoエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブromoブトキシ又はノナフルオロブトキシである。 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシは、さらに、例えば5-フルオロペントキシ、5-クロロペントキシ、5-ブロンペントキシ、5-ヨードペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロヘキソキシ、6-クロロヘキソキシ、6-ブromoヘキソキシ、6-ヨードヘキソキシ又はドデカフルオロヘキソキシである。

【0045】

本明細書で使用する用語「アルコシアルキル」は、各場合において、1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子を通常含むアルキルであって、1個の炭素原子が、上で定義した1~10個、多くの場合1~6個、特に1~4個の炭素原子を通常含むアルコキシ基を有するアルキルを意味する。「 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル」は、上で定義した通り、1個の水素原子が $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ基により置きかえられている、上で定義した $C_1 \sim C_6$ -アルキル基である。例には、 CH_2OCH_3 、 $CH_2-OC_2H_5$ 、n-プロポキシメチル、 $CH_2-OCH(C_2H_5)_2$ 、n-ブトキシメチル、(1-メチルプロポキシ)-メチル、(2-メチルプロポキシ)メチル、 $CH_2-OC(CH_3)_3$ 、2-(メトキシ)エチル、2-(エトキシ)エチル、2-(n-プロポキシ)-エチル、2-(1-メチルエトキシ)-エチル、2-(n-ブトキシ)エチル、2-(1-メチルプロポキシ)-エチル、2-(2-メチルプロポキシ)-エチル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)-エチル、2-(メトキシ)-プロピル、2-(エトキシ)-プロピル、2-(n-プロポキシ)-プロピル、2-(1-メチルエトキシ)-プロピル、2-(n-ブトキシ)-プロピル、2-(1-メチルプロポキシ)-プロピル、2-(2-メチルプロポキシ)-プロピル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)-プロピル、3-(メトキシ)-プロピル、3-(エトキシ)-プロピル、3-(n-プロポキシ)-プロピル、3-(1-メチルエトキシ)-プロピル、3-(n-ブトキシ)-プロピル、3-(1-メチルプロポキシ)-プロピル、3-(2-メチルプロポキシ)-プロピル、3-(1,1-ジメチルエトキシ)-プロピル、2-(メトキシ)-ブチル、2-(エトキシ)-ブチル、2-(n-プロポキシ)-ブチル、2-(1-メチルエトキシ)-ブチル、2-(n-ブトキシ)-ブチル、2-(1-メチルプロポキシ)-ブチル、2-(2-メチルプロポキシ)-ブチル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)-ブチル、3-(メトキシ)-ブチル、3-(エトキシ)-ブチル、3-(n-プロポキシ)-ブチル、3-(1-メチルエトキシ)-ブチル、3-(n-ブトキシ)-ブチル、3-(1-メチルプロポキシ)-ブチル、3-(2-メチルプロポキシ)-ブチル、3-(1,1-ジメチルエトキシ)-ブチル、4-(メトキシ)-ブチル、4-(エトキシ)-ブチル、4-(n-プロポキシ)-ブチル、4-(1-メチルエトキシ)-ブチル、4-(n-ブトキシ)-ブチル、4-(1-メチルプロポキシ)-ブチル、4-(2-メチルプロポキシ)-ブチル、4-(1,1-ジメチルエトキシ)-ブチル等がある。

【0046】

本明細書で使用する用語「ハロアルコキシ-アルキル」は、各場合において、1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子を通常含む、上で定義したアルキルであって、1個の炭素原子が、上で定義した1~10個、多くの場合1~6個、特に1~4個の炭素原子を通常含む、上で定義したハロアルコキシ基を有するアルキルを意味する。例には、フルオロメトキシメチル、ジフルオロメトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル、1-フルオロエトキシメチル、2-フルオロエトキシメチル、1,1-ジフルオロエトキシメチル、1,2-ジフルオロエトキシメチル、2,2-ジフルオロエトキシメチル、1,1,2-トリフルオロエトキシメ

10

20

30

40

50

チル、1,2,2-トリフルオロエトキシメチル、2,2,2-トリフルオロエトキシメチル、ペンタフルオロエトキシメチル、1-フルオロエトキシ-1-エチル、2-フルオロエトキシ-1-エチル、1,1-ジフルオロエトキシ-1-エチル、1,2-ジフルオロエトキシ-1-エチル、2,2-ジフルオロエトキシ-1-エチル、1,1,2-トリフルオロエトキシ-1-エチル、1,2,2-トリフルオロエトキシ-1-エチル、2,2,2-トリフルオロエトキシ-1-エチル、ペンタフルオロエトキシ-1-エチル、1-フルオロエトキシ-2-エチル、2-フルオロエトキシ-2-エチル、1,1-ジフルオロエトキシ-2-エチル、1,2-ジフルオロエトキシ-2-エチル、2,2-ジフルオロエトキシ-2-エチル、1,1,2-トリフルオロエトキシ-2-エチル、1,2,2-トリフルオロエトキシ-2-エチル、2,2,2-トリフルオロエトキシ-2-エチル、ペンタフルオロエトキシ-2-エチル等がある。

【0047】

本明細書で使用する用語「アルキルチオ」(アルキルスルファニル又はアルキル-S-でもある)は、各場合において、1~10個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルチオ」)を通常含む、多くの場合、1~6個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ」)、好ましくは1~4個の炭素原子(「 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ」)を通常含む、該アルキル基中の任意の位置で硫黄原子を介して結合している、上で定義した、直鎖又は分岐の飽和アルキル基を意味する。 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオは、メチルチオ又はエチルチオである。 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオはさらに、例えば、n-プロピルチオ、1-メチルエチルチオ(イソプロピルチオ)、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ(sec-ブチルチオ)、2-メチルプロピルチオ(イソブチルチオ)又は1,1-ジメチルエチルチオ(tert-ブチルチオ)である。 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオはさらに、例えばペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、1,1-ジメチルプロピルチオ、1,2-ジメチルプロピルチオ、2,2-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、4-メチルペンチルチオ、1,1-ジメチルブチルチオ、1,2-ジメチルブチルチオ、1,3-ジメチルブチルチオ、2,2-ジメチルブチルチオ、2,3-ジメチルブチルチオ、3,3-ジメチルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1,1,2-トリメチルプロピルチオ、1,2,2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオ又は1-エチル-2-メチルプロピルチオである。 $C_1 \sim C_8$ -アルキルチオはさらに、例えばヘプチルチオ、オクチルチオ、2-エチルヘキシルチオ及びそれらの位置異性体である。 $C_1 \sim C_{10}$ -アルキルチオはさらに、例えばノニルチオ、デシルチオ及びそれらの位置異性体である。

【0048】

本明細書で使用する用語「ハロアルキルチオ」は、水素原子が部分的又は完全にフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により置換されている、上で定義したアルキルチオ基を指す。 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルチオには、例えば、 SCH_2F 、 $SCHF_2$ 、 SCF_3 、 SCH_2Cl 、 $SCHCl_2$ 、 $SCCl_3$ 、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2-クロロエチルチオ、2-プロモエチルチオ、2-ヨードエチルチオ、2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、2-クロロ-2-フルオロエチルチオ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチルチオ、2,2,2-トリクロロエチルチオ又は SC_2F_5 がある。 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオにはさらに、例えば2-フルオロプロピルチオ、3-フルオロプロピルチオ、2,2-ジフルオロプロピルチオ、2,3-ジフルオロプロピルチオ、2-クロロプロピルチオ、3-クロロプロピルチオ、2,3-ジクロロプロピルチオ、2-プロモプロピルチオ、3-プロモプロピルチオ、3,3,3-トリフルオロプロピルチオ、3,3,3-トリクロロプロピルチオ、 $SCH_2-C_2F_5$ 、 $SCF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエチルチオ、1-(CH_2Cl)-2-クロロエチルチオ、1-(CH_2Br)-2-プロモエチルチオ、4-フルオロブチルチオ、4-クロロブチルチオ、4-プロモブチルチオ又はノナフルオロブチルチオがある。 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオにはさらに、例えば5-フルオロペンチルチオ、5-クロロペンチルチオ、5-プロンペンチルチオ、5-ヨードペンチルチオ、ウンデカフルオロペンチルチオ、6-フルオロヘキシルチオ、6-クロロヘキシルチオ、6-プロモヘキシルチオ、6-ヨードヘキシルチオ又はドデカフルオロヘキシルチオがある。

【0049】

用語「アルキルスルフィニル」及び「 $S(O)_n$ -アルキル」(式中、nは1である)は等価なも

10

20

30

40

50

のであり、本明細書で使用する場合、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上で定義したアルキル基を意味する。例えば、用語「C₁~C₂-アルキルスルフィニル」とは、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上で定義したC₁~C₂-アルキル基を指す。用語「C₁~C₄-アルキルスルフィニル」とは、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上で定義したC₁~C₄-アルキル基を指す。用語「C₁~C₆-アルキルスルフィニル」とは、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上で定義したC₁~C₆-アルキル基を指す。C₁~C₂-アルキルスルフィニルは、メチルスルフィニル又はエチルスルフィニルである。C₁~C₄-アルキルスルフィニルにはさらに、例えば、n-プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル(イソプロピルスルフィニル)、ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル(sec-ブチルスルフィニル)、2-メチルプロピルスルフィニル(イソブチルスルフィニル)、又は1,1-ジメチルエチルスルフィニル(tert-ブチルスルフィニル)がある。C₁~C₆-アルキルスルフィニルにはさらに、例えば、ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、1,1-ジメチルプロピルスルフィニル、1,2-ジメチルプロピルスルフィニル、2,2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1,1-ジメチルブチルスルフィニル、1,2-ジメチルブチルスルフィニル、1,3-ジメチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルブチルスルフィニル、2,3-ジメチルブチルスルフィニル、3,3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルフィニル又は1-エチル-2-メチルプロピルスルフィニルがある。

【 0 0 5 0 】

用語「アルキルスルホニル」及び「S(O)_n-アルキル」(式中、nは2である)は等価なものであり、本明細書で使用する場合、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上で定義したアルキル基を意味する。用語「C₁~C₂-アルキルスルホニル」とは、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上で定義したC₁~C₂-アルキル基を指す。用語「C₁~C₄-アルキルスルホニル」とは、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上で定義したC₁~C₄-アルキル基を指す。用語「C₁~C₆-アルキルスルホニル」とは、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上で定義したC₁~C₆-アルキル基を指す。C₁~C₂-アルキルスルホニルは、メチルスルホニル又はエチルスルホニルである。C₁~C₄-アルキルスルホニルにはさらに、例えばn-プロピルスルホニル、1-メチルエチルスルホニル(イソプロピルスルホニル)、ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル(sec-ブチルスルホニル)、2-メチルプロピルスルホニル(イソブチルスルホニル)又は1,1-ジメチルエチルスルホニル(tert-ブチルスルホニル)。C₁~C₆-アルキルスルホニルは、さらに、例えば、ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、1,1-ジメチルプロピルスルホニル、1,2-ジメチルプロピルスルホニル、2,2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1,1-ジメチルブチルスルホニル、1,2-ジメチルブチルスルホニル、1,3-ジメチルブチルスルホニル、2,2-ジメチルブチルスルホニル、2,3-ジメチルブチルスルホニル、3,3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルホニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニル又は1-エチル-2-メチルプロピルスルホニルがある。

【 0 0 5 1 】

本明細書で使用する用語「アルキルアミノ」は、各場合において、基-NHRであって、Rが1~6個の炭素原子(「C₁~C₆-アルキルアミノ」)、好ましくは1~4個の炭素原子(「C₁~C₄-アルキルアミノ」)を通常有する、直鎖又は分岐アルキル基である、上記基を意味する。C₁~C₆-アルキルアミノの例は、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イ

ソプロピルアミノ、n-ブチルアミノ、2-ブチルアミノ、イソ-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ等である。

【0052】

本明細書で使用する用語「ジアルキルアミノ」は、各場合において、基-NRR'であって、R及びR'が互いに独立した直鎖又は分岐のアルキル基であり、これらの各々が1~6個の炭素原子(「ジ-(C₁~C₆-アルキル)-アミノ」)、好ましくは1~4個の炭素原子(「ジ-(C₁~C₄-アルキル)-アミノ」)を通常有する上記基を意味する。ジ-(C₁~C₆-アルキル)-アミノ基の例には、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、メチル-エチル-アミノ、メチル-プロピル-アミノ、メチル-イソプロピルアミノ、メチル-ブチル-アミノ、メチル-イソブチル-アミノ、エチル-プロピル-アミノ、エチル-イソプロピルアミノ、エチル-ブチル-アミノ、エチル-イソブチル-アミノ等がある。

10

【0053】

本明細書で使用する用語「アルキルアミノスルホニル」は、各場合において、スルホニル[S(O)₂]基を介して分子の他の部分に結合している、上で定義した、直鎖又は分岐のアルキルアミノ基を意味する。アルキルアミノスルホニル基の例は、メチルアミノスルホニル、エチルアミノスルホニル、n-プロピルアミノスルホニル、イソプロピルアミノスルホニル、n-ブチルアミノスルホニル、2-ブチルアミノスルホニル、イソ-ブチルアミノスルホニル、tert-ブチルアミノスルホニル等である。

【0054】

本明細書で使用する用語「ジアルキルアミノスルホニル」は、各場合において、スルホニル[S(O)₂]基を介して分子の他の部分に結合している、上で定義した直鎖又は分岐のアルキルアミノ基を意味する。ジアルキルアミノスルホニル基の例には、ジメチルアミノスルホニル、ジエチルアミノスルホニル、ジプロピルアミノスルホニル、ジブチルアミノスルホニル、メチル-エチル-アミノスルホニル、メチル-プロピル-アミノスルホニル、メチル-イソプロピルアミノスルホニル、メチル-ブチル-アミノスルホニル、メチル-イソブチル-アミノスルホニル、エチル-プロピル-アミノスルホニル、エチル-イソプロピルアミノスルホニル、エチル-ブチル-アミノスルホニル、エチル-イソブチル-アミノスルホニル等がある。

20

【0055】

基における接尾辞「カルボニル」とは、各場合において、該基がカルボニルC=O基を介して分子の他の部分に結合していることを意味する。これは、例えば、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニルにおける場合である。

30

【0056】

本明細書で使用する用語「アリール」は、フェニル又はナフチル、特にフェニル等の単環式、二環式、又は三環式芳香族炭化水素基を指す。

【0057】

本明細書で使用する用語「ヘト(ヘテロ)アリール」は、単環式、二環式又は三環式複素芳香族炭化水素基、好ましくはピリジル、ピリミジル等の単環式複素芳香族基を指す。

40

【0058】

本明細書中で使用する「環員としてN、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1個、2個もしくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、飽和、部分不飽和又は完全に不飽和の3員、4員、5員、6員もしくは7員複素環式環」という用語(「完全に不飽和」には、「芳香族」も含む)は、飽和、部分不飽和又は完全に不飽和(芳香族を含む)である単環式基を意味する。不飽和の環は、少なくとも一つのC-C及び/又はC-N並びに/あるいはN-Nの二重結合(複数可)を含んでいる。完全に不飽和な環は、環のサイズにより許される数と同数の共役C-C及び/又はC-N並びに/あるいはN-Nの二重結合を含んでいる。完全に不飽和な5員又は6員複素環式環は芳香族である。この複素環式環は、炭素環員又は窒素環員を介して、分子の他の部分に結合していてもよい。当然ながら、複素環式環は、少なくとも1個の炭素

50

環原子を含んでいる。環が2個以上の0環原子を含んでいる場合、これらは隣接しない。

【 0 0 5 9 】

飽和の3員、4員、5員、6員又は7員複素環式環の例には、オキシラニル、チイラニル、アジリジニル、オキセタニル、チエタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロチエン-2-イル、テトラヒドロチエン-3-イル、ピロリジン-1-イル、ピロリジン-2-イル、ピロリジン-3-イル、ピラゾリジン-1-イル、ピラゾリジン-3-イル、ピラゾリジン-4-イル、ピラゾリジン-5-イル、イミダゾリジン-1-イル、イミダゾリジン-2-イル、イミダゾリジン-4-イル、オキサゾリジン-2-イル、オキサゾリジン-3-イル、オキサゾリジン-4-イル、オキサゾリジン-5-イル、イソオキサゾリジン-2-イル、イソオキサゾリジン-3-イル、イソオキサゾリジン-4-イル、イソオキサゾリジン-5-イル、チアゾリジン-2-イル、チアゾリジン-3-イル、チアゾリジン-4-イル、チアゾリジン-5-イル、イソチアゾリジン-2-イル、イソチアゾリジン-3-イル、イソチアゾリジン-4-イル、イソチアゾリジン-5-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-3-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-5-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-3-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-5-イル、1,3,4-オキサジアゾリジン-2-イル、1,3,4-チアジアゾリジン-2-イル、1,3,4-トリアゾリジン-1-イル、1,3,4-トリアゾリジン-2-イル、2-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、1,3-ジオキサン-5-イル、1,4-ジオキサン-2-イル、ピペリジン-1-イル、ピペリジン-2-イル、ピペリジン-3-イル、ピペリジン-4-イル、ヘキサヒドロピリダジン-3-イル、ヘキサヒドロピリダジン-4-イル、ヘキサヒドロピリミジン-2-イル、ヘキサヒドロピリミジン-4-イル、ヘキサヒドロピリミジン-5-イル、ピペラジン-1-イル、ピペラジン-2-イル、1,3,5-ヘキサヒドロトリアジン-1-イル、1,3,5-ヘキサヒドロトリアジン-2-イル及び1,2,4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イル、モルホリン-2-イル、モルホリン-3-イル、モルホリン-4-イル、チオモルホリン-2-イル、チオモルホリン-3-イル、チオモルホリン-4-イル、1-オキソチオモルホリン-2-イル、1-オキソチオモルホリン-3-イル、1-オキソチオモルホリン-4-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-2-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-3-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル、アゼパン-1-、-2-、-3-又は-4-イル、オキセパン-2-、-3-、-4-又は-5-イル、ヘキサヒドロ-1,3-ジアゼピニル、ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル、ヘキサヒドロ-1,3-オキサゼピニル、ヘキサヒドロ-1,4-オキサゼピニル、ヘキサヒドロ-1,3-ジオキセピニル、ヘキサヒドロ-1,4-ジオキセピニル等が含まれる。

【 0 0 6 0 】

部分不飽和な3員、4員、5員、6員又は7員複素環式環の例には、2,3-ジヒドロフル-2-イル、2,3-ジヒドロフル-3-イル、2,4-ジヒドロフル-2-イル、2,4-ジヒドロフル-3-イル、2,3-ジヒドロチエン-2-イル、2,3-ジヒドロチエン-3-イル、2,4-ジヒドロチエン-2-イル、2,4-ジヒドロチエン-3-イル、2-ピロリン-2-イル、2-ピロリン-3-イル、3-ピロリン-2-イル、3-ピロリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-3-イル、3-イソオキサゾリン-3-イル、4-イソオキサゾリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-4-イル、3-イソオキサゾリン-4-イル、4-イソオキサゾリン-4-イル、2-イソオキサゾリン-5-イル、3-イソオキサゾリン-5-イル、4-イソオキサゾリン-5-イル、2-イソチアゾリン-3-イル、3-イソチアゾリン-3-イル、4-イソチアゾリン-3-イル、2-イソチアゾリン-4-イル、3-イソチアゾリン-4-イル、4-イソチアゾリン-4-イル、2-イソチアゾリン-5-イル、3-イソチアゾリン-5-イル、4-イソチアゾリン-5-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-1-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-2-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-3-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-4-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-5-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-1-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-3-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-4-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-5-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-1-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-3-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-4-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-3-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-2

10

20

30

40

50

-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2-、3-、4-、5-又は6-ジ-又はテトラヒドロピリジニル、3-ジ-又はテトラヒドロピリダジニル、4-ジ-又はテトラヒドロピリダジニル、2-ジ-又はテトラヒドロピリミジニル、4-ジ-又はテトラヒドロピリミジニル、5-ジ-又はテトラヒドロピリミジニル、ジ-又はテトラヒドロピラジニル、1,3,5-ジ-又はテトラヒドロトリアジン-2-イル、1,2,4-ジ-又はテトラヒドロトリアジン-3-イル、2,3,4,5-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-又は-7-イル、3,4,5,6-テトラヒドロ[2H]アゼピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-又は-7-イル、2,3,4,7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-又は-7-イル、2,3,6,7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-又は-7-イル、テトラヒドロオキセピニル、例えば2,3,4,5-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-又は-7-イル、2,3,4,7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-又は-7-イル、2,3,6,7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-又は-7-イル、テトラヒドロ-1,3-ジアゼピニル、テトラヒドロ-1,4-ジアゼピニル、テトラヒドロ-1,3-オキサゼピニル、テトラヒドロ-1,4-オキサゼピニル、テトラヒドロ-1,3-ジオキセピニル及びテトラヒドロ-1,4-ジオキセピニルが含まれる。

【0061】

完全不飽和(芳香族を含む)な3員、4員、5員、6員又は7員複素環式環は、例えば、完全不飽和(芳香族を含む)な5員又は6員複素環式環である。例には、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、1,3,4-トリアゾール-1-イル、1,3,4-トリアゾール-2-イル、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、1-オキソピリジン-2-イル、1-オキソピリジン-3-イル、1-オキソピリジン-4-イル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル及び2-ピラジニルがある。

【0062】

R^{9a} 及び R^{9b} が、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、飽和、部分的に不飽和又は完全に不飽和の3員、4員、5員、6員もしくは7員複素環式環を形成し、この環がさらに、環員としてN、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1個もしくは2個のさらなるヘテロ原子又はヘテロ原子基を含んでもよい場合、これはN-結合している複素環式環であり、上記窒素環原子の他に、環員としてN、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1個、2個、3個又は4個のさらなるヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含んでもよい。例には、アジリジン-1-イル、アゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イル、ピラゾリジン-1-イル、イミダゾリン-1-イル、オキサゾリジン-3-イル、イソオキサゾリジン-3-イル、チアゾリジン-1-イル、イソチアゾリジン-1-イル、トリアゾリジン-1-イル、ピペルドン-1-イル、ピペラジン-1-イル、モルホリン-4-イル、チオモルホリン-1-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル、ピロリン-1-イル、ピロリン-1-イル、イミダゾリン-1-イル、ジヒドロピリジン-1-イル、テトラヒドロピリジン-1-イル、ピロール-1-イル、ピラゾ-1-イル、イミダゾール-1-イル等がある。

好適な形態

式(1)及び(1-1)の化合物の可変基(置換基)の好ましい実施形態に関して以下に言及することは、それら自体、及び好ましくは互いに組み合わせても、並びにそれらの立体異性体、N-オキシド又は塩と組み合わせても、適切な場合、さらに本発明による使用及び方法、並びに本発明による組成物に関するも有効である。

【0063】

本発明による好ましい化合物は、式(1)の化合物、又はその立体異性体、N-オキシドもしくは塩であり、該塩は、農業的又は獣医学的に許容される塩である。

【0064】

好ましいのは、 B^1 がNである、式(1)の化合物である。

【0065】

10

20

30

40

50

更に好ましいのは、 R^2 が水素である、本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0066】

更に好ましいのは、

r が1であり、

R^4 がオルトの位置にあり、クロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、メトキシ、ジフルオロメトキシから、最も好ましくはクロロから選択される、本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0067】

更に好ましいのは、

p が1又は2であり、

R^1 がクロロ、プロモ、ヨード、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は本明細書中で規定される1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)から選択される、

本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0068】

更に好ましいのは、

R^5 が $C_1 \sim C_{12}$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は本明細書中で規定される1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $C_3 \sim C_8$ -シクロアルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)から選択される、

本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0069】

更に好ましいのは、

R^5 がメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、2-ブチル(*sec*-ブチル)、イソブチル、*tert*-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピルから選択される、

本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0070】

更に好ましいのは、

R^5 がメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチルから選択される、

本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0071】

更に好ましいのは、

R^5 がメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピルから選択される、本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0072】

更に好ましいのは、一般式I-Aを有する、本明細書中で規定される式(1)の化合物

【0073】

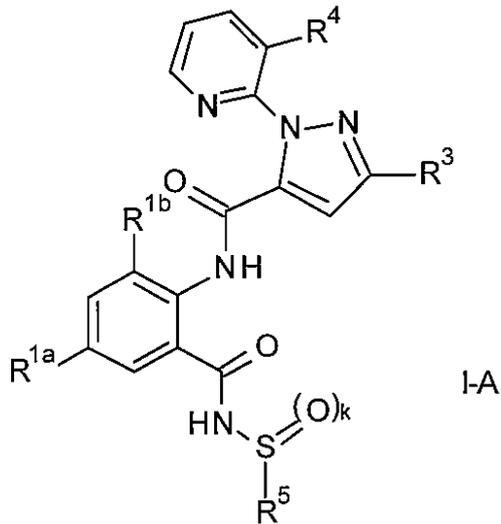
10

20

30

40

【化4】



10

【0074】

(式中、可変基 R^{1a} 及び R^{1b} は本明細書中で R^1 について規定した通りであり、そして可変基 R^3 、 R^4 、 R^5 及び k は本明細書中で規定した通りである)

20

【0075】

一実施形態において、 R^{1a} 及び R^{1b} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよい)からなる群から独立して選択されるか、又はクロロ、プロモ、ヨード、シアノ、メチルから選択される。

【0076】

更なる実施形態において、

R^{1a} はメチル、クロロ、プロモ、ヨード、シアノからなる群から、好ましくはメチル及びクロロから、好ましくはメチルから選択され、そして

R^{1b} はクロロ、プロモ、メチルからなる群から選択される。

【0077】

更に好ましいのは、

R^3 が水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $-OR^8$ からなる群から選択され、ここで R^7 及び R^8 は本明細書中で規定される通りであり、好ましくは R^8 は CF_3 、 CHF_2 から選択される、

本明細書中で規定される式(I-A)の化合物である。

30

【0078】

更に好ましいのは、

R^3 がクロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 $OCHF_2$ からなる群から選択される、本明細書中で規定される式(I-A)の化合物である。

40

【0079】

更に好ましいのは、

R^{1a} がメチル、クロロ、プロモ、ヨード、シアノからなる群から、好ましくはメチル及びクロロから、好ましくはメチルから選択され、

R^{1b} がクロロ、プロモ、メチルからなる群から選択され、

R^3 がクロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 $OCHF_2$ からなる群から選択される、本明細書中で規定される式(I-A)の化合物である。

【0080】

更に好ましいのは、

R^5 がメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピル

50

メチルから選択される、
本明細書中で規定される式(I-A)の化合物である。

【0081】

更に好ましいのは、

R⁵がメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピルから選択される、
本明細書中で規定される式(I-A)の化合物である。

【0082】

更に好ましいのは、

R^{1a}がメチル、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノからなる群から、好ましくはメチル
及びクロロから、好ましくはメチルから選択され、

R^{1b}がクロロ、ブロモ、メチルからなる群から選択され、

R³がクロロ、ブロモ、ヨード、CF₃、CHF₂、OCH₃、OCHF₂からなる群から選択され、

R⁵がメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピルから選択される、

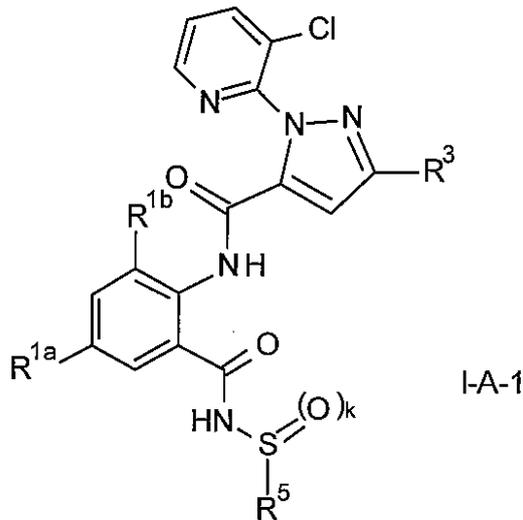
本明細書中で規定される式(I-A)の化合物である。

【0083】

更に好ましいのは、一般式I-A-1

【0084】

【化5】



【0085】

(式中、可変基R^{1a}及びR^{1b}は本明細書中でR¹について規定した通りであり、そして
可変基R³、R⁵及びkは本明細書中で規定した通りである)

を有する、本明細書中で規定される式(I)の化合物である。

【0086】

式(I-A-1)の一実施形態において、

R^{1a}及びR^{1b}は、ハロゲン、シアノ、C₁~C₆-アルキル(部分的若しくは完全にハロゲン
化されていてもよい)からなる群から独立して選択されるか、又はクロロ、ブロモ、ヨード、
シアノ、メチルからなる群から選択される。

【0087】

式(I-A-1)の更なる実施形態において、

R^{1a}は、メチル、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノからなる群から、好ましくはメチル
及びクロロ、好ましくはメチルから選択され、

R^{1b}は、クロロ、ブロモ、メチルからなる群から選択される。

【0088】

更に好ましいのは、

R³が水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₆-アルキル(部分的若しくは完全にハロ

10

20

30

40

50

ゲン化されていてもよく、及び/又は1つ以上の基 R^7 で置換されていてもよい)、 $-OR^8$ からなる群から選択され、ここで R^7 及び R^8 は本明細書中で規定される通りであり、好ましくは R^8 は CF_3 、 CHF_2 から選択される、

本明細書中で規定される式(1-A-1)の化合物である。

【0089】

更に好ましいのは、

R^3 がクロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 $OCHF_2$ からなる群から選択される、本明細書中で規定される式(1-A-1)の化合物である。

【0090】

更に好ましいのは、

R^{1a} がメチル、クロロ、プロモ、ヨード、シアノからなる群から、好ましくはメチル及びクロロ、好ましくはメチルから選択され、

R^{1b} がクロロ、プロモ、メチルからなる群から選択され、

R^3 がクロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 $OCHF_2$ からなる群から選択される、本明細書中で規定される式(1-A-1)の化合物である。

【0091】

更に好ましいのは、

R^5 がメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチルから選択される、

本明細書中で規定される式(1-A-1)の化合物である。

【0092】

更に好ましいのは、

R^5 がメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピルから選択される、本明細書中で規定される式(1-A-1)の化合物である。

【0093】

更に好ましいのは、

R^{1a} がメチル、クロロ、プロモ、ヨード、シアノからなる群から、好ましくはメチル及びクロロ、好ましくはメチルから選択され、

R^{1b} がクロロ、プロモ、メチルからなる群から選択され、

R^3 がクロロ、プロモ、ヨード、 CF_3 、 CHF_2 、 OCH_3 、 $OCHF_2$ からなる群から選択され、

R^5 がメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピルから選択される、

本明細書中で規定される式(1-A-1)の化合物である。

【0094】

更に好ましいのは、kが0又は1である、本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0095】

更に好ましいのは、kが0である、本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0096】

更に好ましいのは、kが1である、本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0097】

更に好ましいのは、kが2である、本明細書中で規定される式(1)の化合物である。

【0098】

好ましい化合物の例は、以下の表にまとめられている個々の化合物である。さらに、表中の個々の可変基に関して言及している意味は、それ自体が、言及されている組合せにかかわらず、対象となる置換基の特に好ましい実施形態である。

【0099】

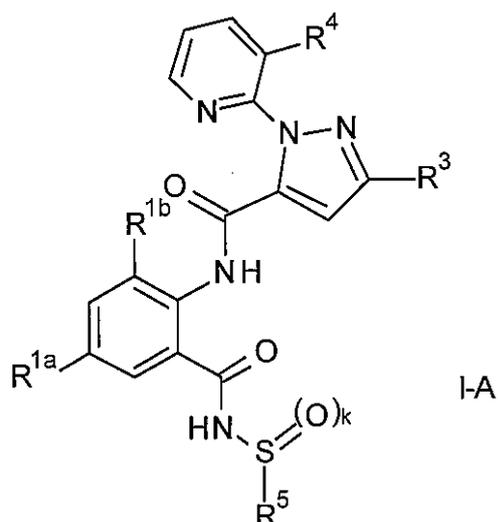
10

20

30

40

【化6】



10

【0100】

表1 kが0であり、R⁵がメチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0101】

20

表2 kが0であり、R⁵がエチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0102】

表3 kが0であり、R⁵がn-プロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0103】

表4 kが0であり、R⁵がイソプロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0104】

表5 kが0であり、R⁵がn-ブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

30

【0105】

表6 kが0であり、R⁵が2-ブチル(sec-ブチル)であり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0106】

表7 kが0であり、R⁵がイソブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0107】

表8 kが0であり、R⁵がtert-ブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

40

【0108】

表9 kが0であり、R⁵がシクロプロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0109】

表10 kが0であり、R⁵がシクロプロピルメチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0110】

表11 kが0であり、R⁵がシクロプロピルエチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0111】

50

表12 kが1であり、R⁵がメチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0112】

表13 kが1であり、R⁵がエチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0113】

表14 kが1であり、R⁵がn-プロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0114】

表15 kが1であり、R⁵がイソプロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

10

【0115】

表16 kが1であり、R⁵がn-ブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0116】

表17 kが1であり、R⁵が2-ブチル(sec-ブチル)であり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0117】

表18 kが1であり、R⁵がイソブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

20

【0118】

表19 kが1であり、R⁵がtert-ブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0119】

表20 kが1であり、R⁵がシクロプロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0120】

表21 kが1であり、R⁵がシクロプロピルメチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0121】

表22 kが1であり、R⁵がシクロプロピルエチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

30

【0122】

表23 kが2であり、R⁵がメチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0123】

表24 kが2であり、R⁵がエチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0124】

表25 kが2であり、R⁵がn-プロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

40

【0125】

表26 kが2であり、R⁵がイソプロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0126】

表27 kが2であり、R⁵がn-ブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【0127】

表28 kが2であり、R⁵が2-ブチル(sec-ブチル)であり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

50

【 0 1 2 8 】

表29 kが2であり、R⁵がイソブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【 0 1 2 9 】

表30 kが2であり、R⁵がtert-ブチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【 0 1 3 0 】

表31 kが2であり、R⁵がシクロプロピルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【 0 1 3 1 】

表32 kが2であり、R⁵がシクロプロピルメチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【 0 1 3 2 】

表33 kが2であり、R⁵がシクロプロピルエチルであり、化合物についてR^{1a}、R^{1b}、R³及びR⁴の組合せが、各場合において、表Aの一つの行に相当する式I-Aの化合物。

【 0 1 3 3 】

【表 1】

表 A

No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁴
A-1	CH ₃	Cl	CF ₃	Cl
A-2	CH ₃	Cl	CHF ₂	Cl
A-3	CH ₃	Cl	OCH ₃	Cl
A-4	CH ₃	Cl	OCHF ₂	Cl
A-5	CH ₃	Cl	Cl	Cl
A-6	CH ₃	Cl	Br	Cl
A-7	CH ₃	Cl	I	Cl
A-8	CH ₃	Br	CF ₃	Cl
A-9	CH ₃	Br	CHF ₂	Cl
A-10	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl
A-11	CH ₃	Br	OCHF ₂	Cl
A-12	CH ₃	Br	Cl	Cl
A-13	CH ₃	Br	Br	Cl
A-14	CH ₃	Br	I	Cl
A-15	CH ₃	CH ₃	CF ₃	Cl
A-16	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	Cl
A-17	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
A-18	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	Cl
A-19	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
A-20	CH ₃	CH ₃	Br	Cl
A-21	CH ₃	CH ₃	I	Cl
A-22	Cl	Cl	CF ₃	Cl
A-23	Cl	Cl	CHF ₂	Cl
A-24	Cl	Cl	OCH ₃	Cl
A-25	Cl	Cl	OCHF ₂	Cl
A-26	Cl	Cl	Cl	Cl
A-27	Cl	Cl	Br	Cl
A-28	Cl	Cl	I	Cl
A-29	Cl	Br	CF ₃	Cl
A-30	Cl	Br	CHF ₂	Cl
A-31	Cl	Br	OCH ₃	Cl
A-32	Cl	Br	OCHF ₂	Cl
A-33	Cl	Br	Cl	Cl
A-34	Cl	Br	Br	Cl
A-35	Cl	Br	I	Cl
A-36	Cl	CH ₃	CF ₃	Cl

10

20

30

40

No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁴
A-37	Cl	CH ₃	CHF ₂	Cl
A-38	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl
A-39	Cl	CH ₃	OCHF ₂	Cl
A-40	Cl	CH ₃	Cl	Cl
A-41	Cl	CH ₃	Br	Cl
A-42	Cl	CH ₃	I	Cl
A-43	Br	Cl	CF ₃	Cl
A-44	Br	Cl	CHF ₂	Cl
A-45	Br	Cl	OCH ₃	Cl
A-46	Br	Cl	OCHF ₂	Cl
A-47	Br	Cl	Cl	Cl
A-48	Br	Cl	Br	Cl
A-49	Br	Cl	I	Cl
A-50	Br	Br	CF ₃	Cl
A-51	Br	Br	CHF ₂	Cl
A-52	Br	Br	OCH ₃	Cl
A-53	Br	Br	OCHF ₂	Cl
A-54	Br	Br	Cl	Cl
A-55	Br	Br	Br	Cl
A-56	Br	Br	I	Cl
A-57	Br	CH ₃	CF ₃	Cl
A-58	Br	CH ₃	CHF ₂	Cl
A-59	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl
A-60	Br	CH ₃	OCHF ₂	Cl
A-61	Br	CH ₃	Cl	Cl
A-62	Br	CH ₃	Br	Cl
A-63	Br	CH ₃	I	Cl
A-64	I	Cl	CF ₃	Cl
A-65	I	Cl	CHF ₂	Cl
A-66	I	Cl	OCH ₃	Cl
A-67	I	Cl	OCHF ₂	Cl
A-68	I	Cl	Cl	Cl
A-69	I	Cl	Br	Cl
A-70	I	Cl	I	Cl
A-71	I	Br	CF ₃	Cl
A-72	I	Br	CHF ₂	Cl
A-73	I	Br	OCH ₃	Cl
A-74	I	Br	OCHF ₂	Cl

10

20

30

40

No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁴
A-75	I	Br	Cl	Cl
A-76	I	Br	Br	Cl
A-77	I	Br	I	Cl
A-78	I	CH ₃	CF ₃	Cl
A-79	I	CH ₃	CHF ₂	Cl
A-80	I	CH ₃	OCH ₃	Cl
A-81	I	CH ₃	OCHF ₂	Cl
A-82	I	CH ₃	Cl	Cl
A-83	I	CH ₃	Br	Cl
A-84	I	CH ₃	I	Cl
A-85	CN	Cl	CF ₃	Cl
A-86	CN	Cl	CHF ₂	Cl
A-87	CN	Cl	OCH ₃	Cl
A-88	CN	Cl	OCHF ₂	Cl
A-89	CN	Cl	Cl	Cl
A-90	CN	Cl	Br	Cl
A-91	CN	Cl	I	Cl
A-92	CN	Br	CF ₃	Cl
A-93	CN	Br	CHF ₂	Cl
A-94	CN	Br	OCH ₃	Cl
A-95	CN	Br	OCHF ₂	Cl
A-96	CN	Br	Cl	Cl
A-97	CN	Br	Br	Cl
A-98	CN	Br	I	Cl
A-99	CN	CH ₃	CF ₃	Cl
A-100	CN	CH ₃	CHF ₂	Cl
A-101	CN	CH ₃	OCH ₃	Cl
A-102	CN	CH ₃	OCHF ₂	Cl
A-103	CN	CH ₃	Cl	Cl
A-104	CN	CH ₃	Br	Cl
A-105	CN	CH ₃	I	Cl

10

20

30

【 0 1 3 4 】

調製方法

本発明による式(1)の化合物は、有機化学の標準方法により、例えば下記の調製方法及び調製スキームにより、また実施例の合成説明において記載する方法により調製することができる。以下のスキーム及び方法中の置換基、可変基、及び添え字は、特に明記しない場合、上記の式(1)における定義に対応する。室温は約20～25 の温度範囲を意味する。

40

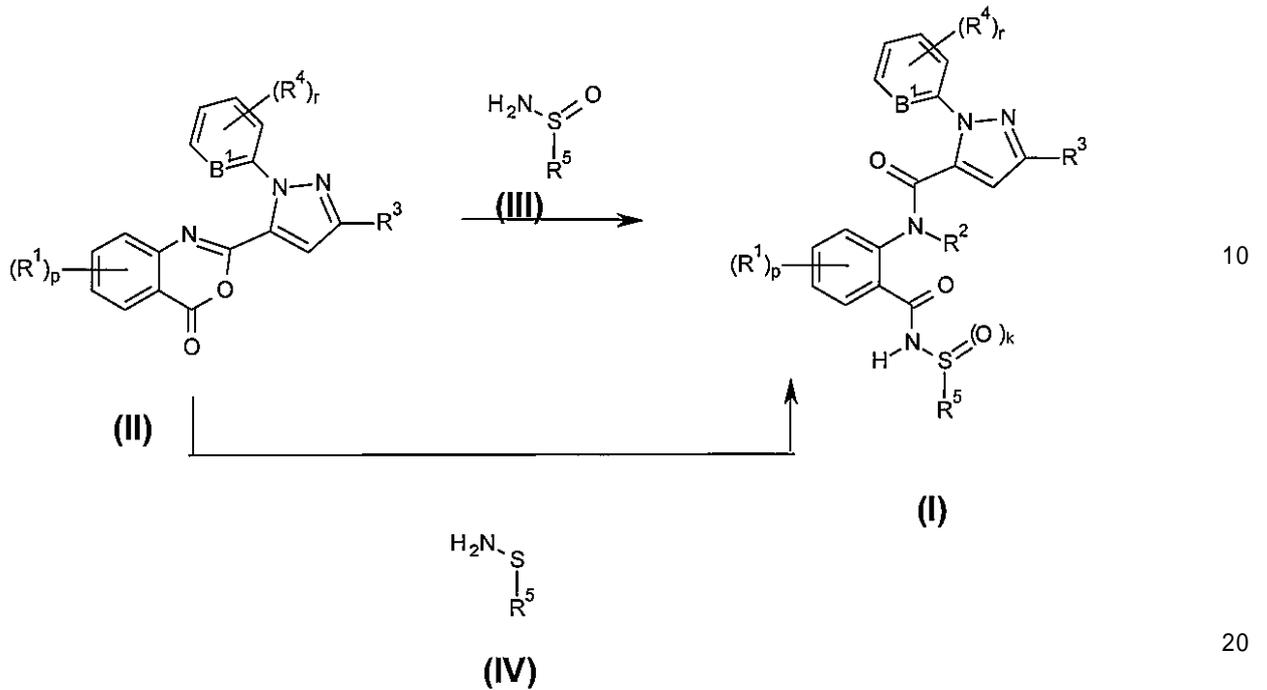
【 0 1 3 5 】

式(1)の化合物は、例えばWO 01/70671に記載されたような、報告されている方法と同様にして調製することができる。スキーム1に示すように、既知化合物(II)を式(III)及び(IV)のチオヒドロキシルアミンで開環すると所望の式(1)の化合物が得られる。これもWO 01/70671に記載されているような慣用的な方法で更に酸化すると、kが1又は2である式(1)の化合物が得られる。

【 0 1 3 6 】

【化7】

スキーム1



【0137】

あるいはまた、W02013/024007、W02013/024008、又はUS 61/561975（未公開のEP出願1189973.8及びPCT/EP2012/073128に対応）に記載された方法を応用することができる。

【0138】

式(III)の化合物は、例えばW02013/024007に記載されたように、式(IV)の化合物から酸化によって調製することができる。

【0139】

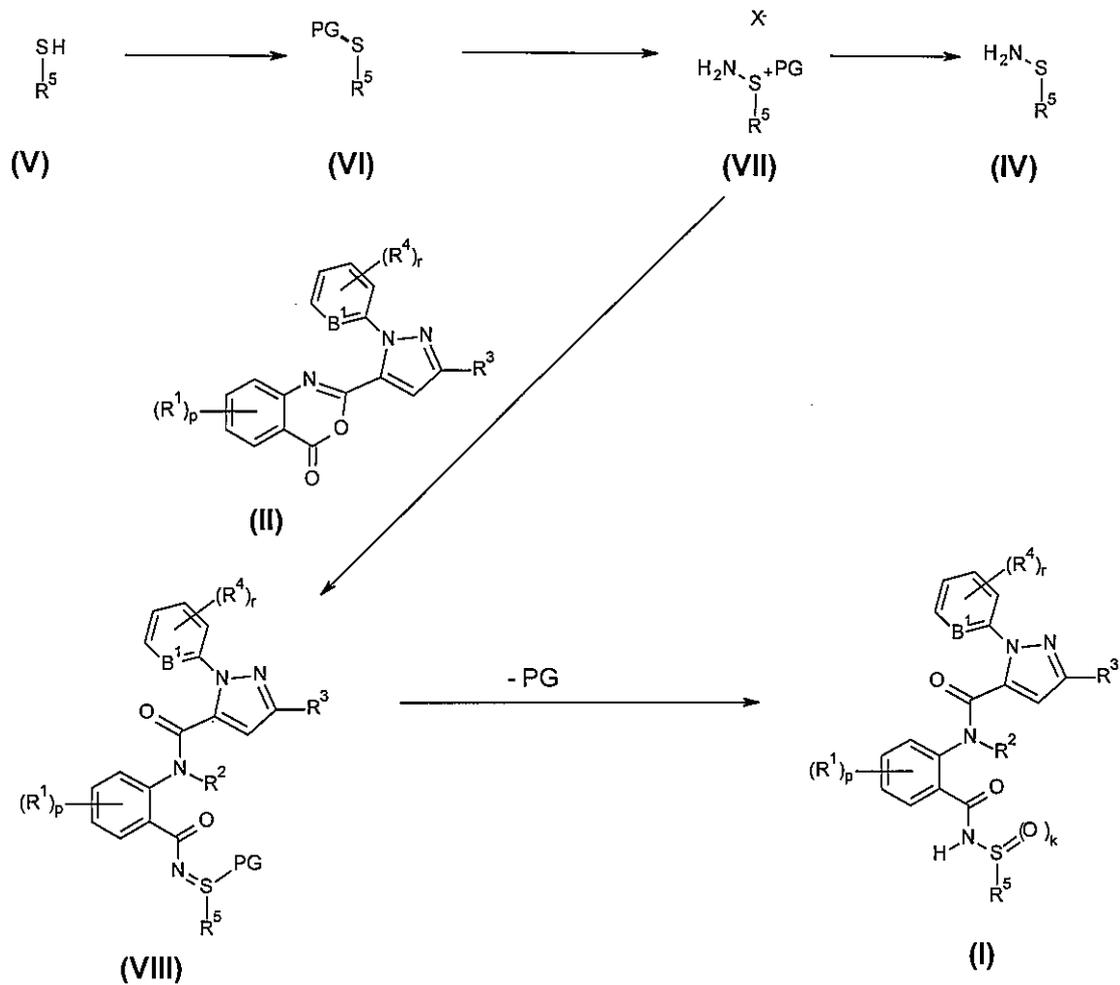
式(IV)の化合物は、スキーム2に示すように、式(V)の硫化物から調製することができる。適切な保護基（PGは保護基を表し、例えばトリアルキルシリル部分、テトラヒドロピラニル、tert-ブチルオキシカルボニル又はアセテート等に相当する）での保護によって式(VI)の化合物が得られる。S-保護のための方法は文献から周知であり、例えばGreene's Protective Groups in Organic Synthesis, 第4版, December 2006, Wiley-VCHに記載されている。式(VI)の化合物は既知のアミノ化試薬、例えばWO 01/70671又は未公開のINV 72056に記載されたものでアミノ化して式(VII)の化合物を得ることができる。式(VII)の化合物中の保護基の開裂によって式(IV)の化合物が得られる。様々な開裂方法が記載されており、上記の文献中に見出すことができる。

【0140】

30

【化8】

スキーム2



10

20

【0141】

あるいはまた、式(I)の化合物は、式(II)の化合物を式(VII)の化合物で開環させて式(VIII)の化合物とし、続いてPG-基の脱保護により調製することができる。

30

【0142】

一般に、式(I)の化合物、とりわけ(I-A)及び(I-A-1)の化合物は、それらの立体異性体、N-オキシド、互変異性体及び塩、並びにそれらの合成方法における前駆体、特に(II)を含め、上記の方法、あるいは記載されている合成経路の慣用的な改変によって調製することができる。個々の化合物を上記の経路を経て調製することができない場合、他の化合物(I)又は個々の前駆体の誘導体化によって調製することができる。例えば、個々の場合、ある種の式(I)の化合物は、誘導体化によって、例えばエステル加水分解、アミド化、エステル化、エーテルの開裂、オレフィン化、還元、酸化等により、又は記載されている合成経路の慣用的な改変によって他の式(I)の化合物から有利に調製することができる。

40

【0143】

反応混合物は、慣用的な方法で、例えば水と混合して相を分離することにより、適切な場合、クロマトグラフィーにより、例えばアルミナ上又はシリカゲル上で粗生成物を精製することにより後処理が行われる。一部の中間体及び最終生成物は、無色又は薄褐色の粘性オイルの形態で得ることができ、これを、減圧下、及び中程度の高温で揮発性成分を不含にするか、又は精製する。中間体及び最終生成物が固体として得られる場合は、それらを再結晶又は適切な溶媒を用いる粉末化により精製することができる。

有害生物

式(I)の化合物、及びその立体異性体、N-オキシド、互変異性体及び塩は、クモ形類、

50

多足動物及び昆虫、並びに線虫等の有害節足動物を効果的に防除するのに特に適している。式(1)の化合物は、以下の有害生物を効果的に防除するのに特に適している。

【 0 1 4 4 】

鱗翅目(Lepidoptera)に由来する昆虫、例えば、アグロティス・イプシロン(*Agrotis ypsilon*)、アグロティス・セゲタム(*Agrotis segetum*)、アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillacea*)、アンチカルシア・ゲマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、アルギレスチア・コンジュゲラ(*Argyresthia conjugella*)、オートグラファ・ガンマ(*Autographa gamma*)、ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、カコエキア・ムリナナ(*Cacoecia murinana*)、カプア・レチキュラナ(*Capua reticulana*)、ケイマトピア・ブルマタ(*Cheimatobia burumata*)、コリストネウラ・フミフェラナ(*Choristoneura fumiferana*)、コリストネウラ・オシデンタリス(*Choristoneura occidentalis*)、キルフイス・ウニパンクタ(*Cirphis unipuncta*)、シディア・ポモネラ(*Cydia pomonella*)、デンドロリマス・ピニ(*Dendrolimus pini*)、ジアファニア・ニチダリス(*Diaphania nitidalis*)、ジアトラエア・グランジオセラ(*Diatraea grandiosella*)、エアリアス・インストラナ(*Earias insulana*)、エラスモバルパス・リグノセラス(*Elasmopalpus lignosellus*)、エウポエキリア・アンビゲラ(*Eupoecilia ambiguella*)、エベトリア・ボーリアナ(*Evetria bouliana*)、フェルチア・サブテラネア(*Feltia subterranea*)、ガレリア・メロネラ(*Galleria mellonella*)、グラホリタ・フネブラナ(*Grapholitha funebrana*)、グラホリタ・モレスタ(*Grapholitha molesta*)、ヘリオチス・アルミゲラ(*Heliothis armigera*)、ヘリオチス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)、ヘリオチス・ゼア(*Heliothis zea*)、ヘルラ・ウンダリス(*Hellula undalis*)、ヒベルニア・デフォリアリア(*Hibernia defoliaria*)、ヒファントリア・クネア(*Hyphantria cunea*)、ヒポノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコペルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、ラムジナ・フィスセラリア(*Lambdina fiscellaria*)、ラフィグマ・エキシグア(*Laphygma exigua*)、ロイコプテラ・コフェーラ(*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、リトコレティス・ブランカルデラ(*Lithocolletis blancardella*)、ロベシア・ボトラナ(*Lobesia botrana*)、ロキソステジ・スティクティカリス(*Loxostege sticticalis*)、リマントリア・ジスパー(*Lymantria dispar*)、リマントリア・モナカ(*Lymantria monacha*)、リオネチア・クレルケラ(*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ニューストリア(*Malacosoma neustria*)、マメストラ・ブラシカエ(*Mamestra brassicae*)、オルギア・シュードツガタ(*Orgyia pseudotsugata*)、オストリニア・ヌビラリス(*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フラメア(*Panolis flammea*)、ペクチノフォラ・ゴシピエラ(*Pectinophora gossypiella*)、ペリドロマ・サウキア(*Peridroma saucia*)、ファレラ・ブセファラ(*Phalera bucephala*)、フトリマエア・オベルクレラ(*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスティス・キトレラ(*Phyllocnistis citrella*)、ピエリス・ブラシカエ(*Pieris brassicae*)、プラチペナ・スカブラ(*Plathypena scabra*)、ブルテラ・キシロステラ(*Plutella xylostella*)、シュードブルシア・インクルデンス(*Pseudoplusia includens*)、リアキオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、スクロビバルブラ・アブソルタ(*Scrobipalpus absoluta*)、シトトラガ・セラレラ(*Sitotroga cerealella*)、スパルガノティス・ピレリアナ(*Sparganothis pilleriana*)、スポドプテラ・フルギベルダ(*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・リトラリス(*Spodoptera littoralis*)、スポドプテラ・リツラ(*Spodoptera litura*)、タウマトポエア・ピチオカンパ(*Thaumtopoea pityocampa*)、トルトリックス・ピリダナ(*Tortrix viridana*)、トリコブルシア・ニ(*Trichoplusia ni*)、トゥタ・アブソルタ(*Tuta absoluta*)及びゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)、

【 0 1 4 5 】

甲虫(甲虫目(Coleoptera))、例えば、アグリルス・シヌアツス(*Agrilus sinuatus*)、アグリオテス・リネアツス(*Agriotes lineatus*)、アグリオテス・オブスクルス(*Agriotes obscurus*)、アンヒマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスパー(*Anisandrus dispar*)、アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*)、アントノムス・ポモルム(*Anthonomus pomorum*)、アフトナ・エウフォリダエ(*Aphthona euph*

oridae)、アトウス・ハエモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、ブラストファグス・ピニペルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダータ(*Blitophaga undata*)、ブルクス・ルフィマヌス(*Bruchus rufimanus*)、ブルクス・ピソルム(*Bruchus pisorum*)、ブルクス・レンチス(*Bruchus lentis*)、ビクチスクス・ベツラエ(*Byctiscus betulae*)、カシダ・ネブロサ(*Cassida nebulosa*)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、セトニア・アウラータ(*Cetonia aurata*)、ソートリンクス・アシミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ソートリンクス・ナピ(*Ceuthorrhynchus napi*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、コノデルス・ベスペルチヌス(*Conoderus vespertinus*)、クリオセリス・アスパラギ(*Crioceris asparagi*)、クテニセラ属の種(*Ctenicera* spp.)、ジアブロチカ・ロンギコルニス(*Diabrotica longicornis*)、ジアブロチカ・セミプンクタタ(*Diabrotica semipunctata*)、ジアブロチカ・12-プンクタタ(*Diabrotica 12-punctata*)、ジアブロチカ・スペキオサ(*Diabrotica speciosa*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ(*Diabrotica virgifera*)、エピラクナ・バリベスチス(*Epilachna varivestis*)、エピトリックス・ヒルチベニス(*Epitrix hirtipennis*)、エウチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、ヒロビウス・アビエチス(*Hylobius abietis*)、ヒペラ・ブルネイペニス(*Hypera brunneipennis*)、ヒペラ・ポストカ(*Hypera postica*)、イプス・チボグラフィ(*Ips typographus*)、レマ・ビリネアタ(*Lema bilineata*)、レマ・メラノプス(*Lema melanopus*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リモニウス・カリフォルニクス(*Limonius californicus*)、リソロプトルス・オリゾフィルス(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、メラノツス・コムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、メロロンタ・ヒポカスタニ(*Melolontha hippocastani*)、メロロンタ・メロロンタ(*Melolontha melolontha*)、オウレマ・オリザエ(*Oulema oryzae*)、オチオリンクス・スルカツス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オバツス(*Otiorrhynchus ovatus*)、ファエドン・コクレアリアエ(*Phaedon cochleariae*)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロトレタ・クリソセファラ(*Phyllotreta chrysocephala*)、フィロファガ属の種(*Phyllophaga* spp.)、フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、フィロトレタ・ネモルム(*Phyllotreta nemorum*)、フィロトレタ・ストリオラタ(*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ(*Popillia japonica*)、シトナ・リネアツス(*Sitona lineatus*)及びシトフィルス・グラナリア(*Sitophilus granaria*)、

【 0 1 4 6 】

ハエ、蚊(双翅目(Diptera))、例えば、アエデス・アエギプチ(*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス(*Aedes albopictus*)、アエデス・ベキサンズ(*Aedes vexans*)、アナストレファ・ルデンス(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルキアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・ロイコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、アノフェレス・ミニムス(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラツス(*Anopheles quadrimaculatus*)、カリフォラ・ビキナ(*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*)、クリソミア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラックス(*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マセラリア(*Chrysomya macellaria*)、クリソプス・ジスカリス(*Chrysops discalis*)、クリソプス・シラセア(*Chrysops silacea*)、クリソプス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、コクリオミア・ホミニボラックス(*Cochliomyia hominivorax*)、コンタリニア・ソルギコラ(*Contarinia sorghicola*)、コルジロピア・アントロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、クレックス・ピピエンス(*Culex pipiens*)、クレックス・ニグリパルパス(*Culex nigripalpus*)、クレックス・クインクエファシアツス(*Culex quinquefasciatus*)、クレックス・タルサリス(*Culex tarsalis*)、クリセタ・イノルナタ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ダクス・ククルビタエ(*Dacus cucurbitae*)、ダクス・オレアエ(*Dacus oleae*)、ダシネウラ・ブラシカ

10

20

30

40

50

エ(*Dasineura brassicae*)、デリア・アンチクエ(*Delia antique*)、デリア・コアルクタタ(*Delia coarctata*)、デリア・プラツラ(*Delia platura*)、デリア・ラジクム(*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、ファニア・カニクラリス(*Fannia canicularis*)、ゲオミザ・トリプンクタタ(*Geomyza tripunctata*)、ガステロフィルス・インテスチナリス(*Gasterophilus intestinalis*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロシナ・フシペス(*Glossina fuscipes*)、グロシナ・タキノイデス(*Glossina tachinoides*)、ハエマトビア・イリタンス(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、ヒレミア・プラツラ(*Hylemyia platura*)、ヒポデルマ・リネアタ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノプス・トレンス(*Leptoconops torrens*)、リリオミザ・サチバエ(*Liriomyza sativae*)、リリオミザ・トリフォリイ(*Liriomyza trifolii*)、ルキリア・カブリナ(*Lucilia caprina*)、ルキリア・クブリナ(*Lucilia cuprina*)、ルキリア・セリカタ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・チチラヌス(*Mansonia titillanus*)、マイエチオラ・デストルクトル(*Mayetiola destructor*)、ムスカ・アウツムナリス(*Musca autumnalis*)、ムスカ・ドメスチカ(*Musca domestica*)、ムシナ・スタブランズ(*Muscina stabulans*)、オエストルス・オビス(*Oestrus ovis*)、オポミザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒソキアミ(*Pegomya hysocyami*)、フォルビア・アンチクア(*Phorbia antiqua*)、フォルビア・ブラシカエ(*Phorbia brassicae*)、フォルビア・コアルクタタ(*Phorbia coarctata*)、フレボトムス・アルゲンチペス(*Phlebotomus argentipes*)、プソロフォラ・コロンビアエ(*Psorophora columbiae*)、プシラ・ロサエ(*Psila rosae*)、プソロフォラ・ジスコロル(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimulium mixtum*)、ラゴレチス・セラシ(*Rhagoletis cerasi*)、ラゴレチス・ポモネラ(*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ・ハエモロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* spp.)、シムリウム・ビッタツム(*Simulium vittatum*)、ストモキシス・カルキトランス(*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス・ボビヌス(*Tabanus bovinus*)、タバヌス・アトラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)及びタバナス・シミリシ(*Tabanus similis*)、チブラ・オレラセア(*Tipula oleracea*)及びチブラ・パルドサ(*Tipula paludosa*)、

【 0 1 4 7 】

アザミウマ(総翅目(Thysanoptera))、例えば、ジクロモトリプス・コルベッティ(*Dichromothrips corbetti*)、ジクロモトリプス属の種(*Dichromothrips* spp.)、フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・トリチキ(*Frankliniella tritici*)、シルトリプス・キトリ(*Scirtothrips citri*)、トリプス・オリザエ(*Thrips oryzae*)、トリプス・パルミ(*Thrips palmi*)及びトリプス・タバキ(*Thrips tabaci*)、

【 0 1 4 8 】

シロアリ(等翅目(Isoptera))、例えば、カロテルメス・フラビコリス(*Calotermes flavicollis*)、ロイコテルメス・フラビペス(*Leucotermes flavipes*)、ヘテロテルメス・アウレウス(*Heterotermes aureus*)、レチクリテルメス・フラビペス(*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ビルギニクス(*Reticulitermes virginicus*)、レチクリテルメス・ルキフグス(*Reticulitermes lucifugus*)、レチクリテルメス・サントネンシス(*Reticulitermes santonensis*)、レチクリテルメス・グラセイ(*Reticulitermes grassei*)、テルメス・ナタレンシス(*Termes natalensis*)及びコプトテルメス・フォルモサヌス(*Coptotermes formosanus*)、

【 0 1 4 9 】

ゴキブリ(ゴキブリ目(Blattaria-Blattodea))、例えば、ブラテラ・ゲルマニカ(*Blattella germanica*)、ブラテラ・アサヒナエ(*Blattella asahinae*)、ペリプラネタ・アメリカーナ(*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・ジャポニカ(*Periplaneta japonica*)、ペリプラネタ・ブルネア(*Periplaneta brunnea*)、ペリプラネタ・フリギノサ(*Periplaneta fu*

10

20

30

40

50

ligginosa)、ペリプラネタ・アウストララシアエ(*Periplaneta australasiae*)、及びブラッタ・オリエンタリス(*Blatta orientalis*)、

【 0 1 5 0 】

半翅類の昆虫、アブラムシ、ヨコバイ、コナジラミ、カイガラムシ、セミ(半翅目(Hemiptera))、例えば、アクロステルヌム・ヒラレ(*Acrosternum hilare*)、プリサス・ロイコプテルス(*Blissus leucopterus*)、シルトペルチス・ノタツス(*Cyrtopeltis notatus*)、ディスデルクス・キングラツス(*Dysdercus cingulatus*)、ディスデルクス・インテルメジウス(*Dysdercus intermedius*)、エウリガステル・インテグリセプス(*Eurygaster integriceps*)、エウシスツス・インピクチベントリス(*Euschistus impictiventris*)、レプトグロッサス・フィロプス(*Leptoglossus phyllopus*)、リグス・リネオラリス(*Lygus lineolaris*)、
10
リグス・プラテンシス(*Lygus pratensis*)、ネザラ・ビリデュラ(*Nezara viridula*)、ピエスマ・クアドラタ(*Piesma quadrata*)、ソルベア・インスラリス(*Solubea insularis*)、チアンタ・ペルジトル(*Thyanta perditor*)、アクリトシフォン・オノブリキス(*Acrythosiphon onobrychis*)、アデルゲス・ラリキス(*Adelges laricis*)、アフイズラ・ナスツルチ(*Aphidula nasturtii*)、アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*)、アフィス・フォルベシ(*Aphis fabae*)、アフィス・ポミ(*Aphis pomi*)、アフィス・ゴシピ(*Aphis gossypii*)、アフィス・グロスラリアエ(*Aphis grossulariae*)、アフィス・シュネイデリ(*Aphis schneideri*)、アフィス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*)、アフィス・サンブキ(*Aphis sambuci*)、アクリトシフォン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アウラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)、ベミシア・アルゲンチフォリ(*Bemisia argentifolii*)、ブラチカウズス・カルズイ(*Brachycaudus cardui*)、ブラチカウズス・ヘリクリシ(*Brachycaudus helichrysi*)、
20
ブラチカウズス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)、ブラチカウズス・プルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ブレピコリネ・ブラシカエ(*Brevicoryne brassicae*)、カピトフォルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシピ(*Cerosiphia gossypii*)、カエトシフォン・フラガエフォリ(*Chaetosiphon fragaefolii*)、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマニアナエ(*Dreyfusia nordmanniana*)、ドレイフシア・ピセアエ(*Dreyfusia piceae*)、ジサフィス・ラジコラ(*Dysaphis radicola*)、ジサウラコルツム・シュードソラニ(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、ジサフィス・プランタギネア(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、エンポアスカ・ファバエ(*Empoasca fabae*)、ヒアロプテルス・プルニ(*Hyalopterus pruni*)、ヒペロミズス・ラクツカエ(*Hyperomyzus lactucae*)、マクロシフム・アベナエ(*Macrosiphum avenae*)、マクロシフム・エウホルビアエ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフォン・ロサエ(*Macrosiphum rosae*)、メゴウラ・ビキアエ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrarius*)、メトポロフィウム・ジローズム(*Metopolophium dirhodum*)、ミズス・ペルシカエ(*Myzus persicae*)、ミズス・アスカロニクス(*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ(*Myzus cerasi*)、ミズス・バリアンス(*Myzus varians*)、ナソノビア・リビス・ニグリ(*Nasonovia ribis-nigri*)、ニラパルバタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*)、ペムフィグス・ブルサリウス(*Pemphigus bursarius*)、パーキンシエラ・サッカリキダ(*Perkinsiella saccharicida*)、ホロドン・フミリ(*Phorodon humili*)、プシラ・マリ(*Psylla mali*)、プシラ・ピリ(*Psylla piri*)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、ロパロシフム・マイジス(*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・パジ(*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・インセルツム(*Rhopalosiphum insertum*)、サツパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サツパフィス・マリ(*Sappaphis mali*)、シザフィス・グラミンム(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌジノサ(*Schizoneura lanuginosa*)、シトピオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、トリアロイロデス・バボラリオルム(*Trialeurodes vaporariorum*)、トキシプテラ・アウランチアンド(*Toxoptera aurantiiand*)、ビテウス・ビチフォリイ(*Viteus vitifolii*)、キメックス・レクツラリウス(*Cimex lectularius*)、キメックス・ヘミプテルス(*Cimex hemipterus*)、レデュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種(*Triatoma* spp.)及びアリルス・クリタツス(*Arilus critatus*)、

【 0 1 5 1 】

10

20

30

40

50

アリ、ミツバチ、狩蜂、ハバチ(膜翅目(Hymenoptera))、例えば、アタリア・ロサエ(*Athalia rosae*)、アッタ・セファロテス(*Atta cephalotes*)、アッタ・カピグアラ(*Atta capiguara*)、アッタ・ラエビガタ(*Atta laevigata*)、アッタ・ロブスタ(*Atta robusta*)、アッタ・セクスデンス(*Atta sexdens*)、アッタ・テキサナ(*Atta texana*)、クレマトガステル属の種(*Crematogaster* spp.)、ホプロカンパ・ミヌタ(*Hoplocampa minuta*)、ホプロカンパ・テストジネア(*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス・ニガー(*Lasius niger*)、モノモリウム・ファラオニス(*Monomorium pharaonis*)、ソレノプシス・ゲミナタ(*Solenopsis geminata*)、ソレノプシス・インビクタ(*Solenopsis invicta*)、ソレノプシス・リクテリ(*Solenopsis richteri*)、ソレノプシス・キシロニ(*Solenopsis xyloni*)、ポゴノミルメックス・バルバツス(*Pogonomyrmex barbatus*)、ポゴノミルレックス・カリフォルニクス(*Pogonomyrmex californicus*)、フェイドレ・メガセファラ(*Pheidole megacephala*)、ダシムチラ・オシデンタリス(*Dasymutilla occidentalis*)、ボンブス属の種(*Bombus* spp.)、ベスプラ・スクアモサ(*Vespula squamosa*)、パラベスプラ・ブルガリス(*Paravespula vulgaris*)、パラベスプラ・ペンシルバニカ(*Paravespula pennsylvanica*)、パラベスプラ・ゲルマニカ(*Paravespula germanica*)、ドリコベスプラ・マクラタ(*Dolichovespula maculata*)、ベスパ・クラブロ(*Vespa crabro*)、ポリステス・ルビギノサ(*Polistes rubiginosa*)、カンポノツス・フロリダヌス(*Camponotus floridanus*)及びリネピテマ・フミレ(*Linepithema humile*)、

【 0 1 5 2 】

コオロギ、バッタ、イナゴ(直翅目(Orthoptera))、例えば、アケタ・ドメスティカ(*Achetia domestica*)、グリロタルパ・グリロタルパ(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ロクスタ・ミグラトリア(*Locusta migratoria*)、メラノプラス・ビビタツス(*Melanoplus bivittatus*)、メラノプラス・フムルールブラム(*Melanoplus femurrubrum*)、メラノプラス・メキシカヌス(*Melanoplus mexicanus*)、メラノプラス・サンガイニペス(*Melanoplus sanguinipes*)、メラノプラス・スプレツス(*Melanoplus spretus*)、ノマダクリス・セプテムファシアタ(*Nomadacris septemfasciata*)、シストセルカ・アメリカナ(*Schistocerca americana*)、シストセルカ・グレガリア(*Schistocerca gregaria*)、ドキオスタウルス・マロカヌス(*Doclostaurus maroccanus*)、タキキネス・アシナモルス(*Tachycines asynamorus*)、オエダレウス・セネガレンシス(*Oedaleus senegalensis*)、ゾノゼルス・バリエガツス(*Zonozerus variegatus*)、ヒエログリフス・ダガネンシス(*Hieroglyphus daganensis*)、クラウサリア・アングリフェラ(*Kraussaria angulifera*)、カリプタムス・イタリクス(*Calliptamus italicus*)、コルトイセテス・テルミニフェラ(*Chortoicetes terminifera*)、及びロクスタナ・パルダリナ(*Locustana pardalina*)、

【 0 1 5 3 】

クモ形類動物等のクモ類(コナダニ)、例えば、ヒメダニ科(*Argasidae*)、マダニ科(*Ixodidae*)及びヒゼンダニ科(*Sarcoptidae*)、例えば、アンブリオマ・アメリカナム(*Amblyomma americanum*)、アンブリオマ・バリエガツム(*Amblyomma variegatum*)、アンブリオマ・マクラツム(*Amblyomma maculatum*)、アルガス・ベルシクス(*Argas persicus*)、ボーフィルス・アナラツス(*Boophilus annulatus*)、ボーフィルス・デコロラツス(*Boophilus decoloratus*)、ボーフィルス・ミクロブルス(*Boophilus microplus*)、デルマセントル・シルバルム(*Dermacentor silvarum*)、デルマセントル・アンデルソニ(*Dermacentor andersoni*)、デルマセントル・バリアビリス(*Dermacentor variabilis*)、ヒアローマ・トルンカツム(*Hyalomma truncatum*)、イクソデス・リキヌス(*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ルビクンズス(*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカブラリス(*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス(*Ixodes holocyclus*)、イクソデス・パキフィクス(*Ixodes pacificus*)、オルニトドルス・モウバタ(*Ornithodoros moubata*)、オルニトドルス・ヘルムシ(*Ornithodoros hermsi*)、オルニトドルス・ツリカタ(*Ornithodoros turicata*)、オルニトニスス・バコチ(*Ornithonyssus bacoti*)、オトビウス・メグニニ(*Otobius megnini*)、デルマニスス・ガリナエ(*Dermanyssus gallinae*)、プソロプテス・オビス(*Psoroptes ovis*)、リピセファルス・サンガイネウス(*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファルス・アベンジクラ

10

20

30

40

50

ツス(*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファルス・エベルトシ(*Rhipicephalus evertsi*)、サルコプテス・スカビエイ(*Sarcoptes scabiei*)、並びにフシダニ属の種(*Eriophyidae*)、例えば、アクルス・シレクテンダリ(*Aculus schlechtendali*)、フィロコプトラタ・オレイボラ(*Phyllocoptrata oleivora*)、及びエリオフィエス・シェルドニ(*Eriophyes sheldoni*)；タルソネミダエ属の種(*Tarsonemidae* spp.)、例えば、フィトネムス・パリズス(*Phytonemus pallidus*)及びポリファゴタルソネムス・ラツス(*Polyphagotarsonemus latus*)；ヒメハダニ属の種(*Tenuipalpidae* spp.)、例えば、ブレビパルプス・フォエニキス(*Brevipalpus phoenicis*)；ハダニ属の種(*Tetranychidae* spp.)、例えば、テトラニクス・キンナバリヌス(*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・カンザワイ(*Tetranychus kanzawai*)、テトラニクス・パキフィクス(*Tetranychus pacificus*)、テトラニクス・テラリウス(*Tetranychus telarius*)及びテトラニクス・ウルティカエ(*Tetranychus urticae*)、パノニクス・ウルミ(*Panonychus ulmi*)、パノニクス・キトリ(*Panonychus citri*)、及びオリゴニクス・プラテンシス(*Oligonychus pratensis*)；真正クモ目(*Araneida*)、例えば、ラトロデクツス・マクタンズ(*Latrodectus mactans*)、ロクソセレス・レクルサ(*Loxosceles reclusa*)、

【 0 1 5 4 】

ノミ(ノミ目(*Siphonaptera*))、例えば、クテノセファリデス・フェリス(*Ctenocephalides felis*)、クテノセファリデス・カニス(*Ctenocephalides canis*)、キセノプシラ・ケオピス(*Xenopsylla cheopis*)、プレックス・イリタンス(*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス(*Tunga penetrans*)、及びノソプシルス・ファシアツス(*Nosopsyllus fasciatus*)、

【 0 1 5 5 】

セイヨウシミ、マダラシミ(シミ目(*Thysanura*))、例えば、レピスマ・サッカリナ(*Lepisma saccharina*)及びテルモビア・ドメスチカ(*Thermobia domestica*)、

ムカデ(ムカデ綱(*Chilopoda*))、例えば、スクチゲラ・コレオプトラタ(*Scutigera coleoptrata*)、

ヤスデ(ヤスデ綱(*Diplopoda*))、例えば、ナルセウス属の種(*Narceus* spp.)、

ハサミムシ(革翅目(*Dermaptera*))、例えば、フォルフィクラ・アウリクラリア(*forficula auricularia*)、

シラミ(フチラプテラ(*Phthiraptera*))、例えば、ペジクルス・フマヌス・カピチス(*Pediculus humanus capitis*)、ペジクルス・フマヌス・コルポリス(*Pediculus humanus corporis*)、プチルス・プビス(*Pthirus pubis*)、ハエマトピヌス・エウリステルヌス(*Haematopinus eurysternus*)、ハエマトピヌス・スイス(*Haematopinus suis*)、リノグナツス・ビツリ(*Linognathus vituli*)、ボビコラ・ボビス(*Bovicola bovis*)、メノポン・ガリナエ(*Menopon gallinae*)、メナカンツス・ストラミネウス(*Menacanthus stramineus*)及びソレノポテス・カピラツス(*Solenopotes capillatus*)、

粘管目(*Collembola*) (トビムシ)、例えばオニキウルス属の種(*Onychiurus* spp.)、

【 0 1 5 6 】

本発明の化合物は、それらの塩、N-オキシド及び立体異性体を含み、以下の線虫、特に植物寄生線虫を防除するのにも適している。ネコブ線虫である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*)、及び他のメロイドギネ(*Meloidogyne*)種；包嚢形成線虫(*cyst-forming nematodes*)、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(*Globodera*)の種；ムギシストセンチュウ(*Heterodera avenae*)、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*)、及び他のヘテロデラ(*Heterodera*)種；シード・ガール線虫(*Seed gall nematodes*)、アングイナ属(*Anguina*)の種；STEM及びフォリア線虫(*Stem and foliar nematodes*)、アフエレンコイデス属(*Aphelenchoides*)の種；スティング線虫(*Sting nematodes*)、ベロノライムス・ロンギカウダトゥス(*Belonolaimus longicaudatus*)及び他のベロノライムス属(*Belonolaimus*)の種；パイン線虫(*Pine nematodes*)、マツノザイセンチュウ(*Bursaphelenchus xylophilus*)及び他のブルサフェ

10

20

30

40

50

レンクス属(*Bursaphelenchus*)の種;リング線虫(Ring nematodes)、クリコネマ属(*Cricone ma*)の種、クリコネメラ属(*Cricmella*)の種、クリコネモイデス属(*Criconemoides*)の種、メソクリコネマ属(*Mesocriconema*)の種;ステム及びバルブ線虫(Stem and bulb nematodes)、イモグサレセンチュウ(*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ(*Ditylenchus dipsaci*)及び他のジチレンクス属(*Ditylenchus*)の種;突き錐線虫(*Awl nematodes*)、ドリコドルス属(*Dolichodorus*)の種;スパイラル線虫(Spiral nematodes)、ヘリオコチレンクス・ムルチシンクツス(*Helicotylenchus multicinctus*)及び他のヘリオコチレンクス属(*Helicotylenchus*)の種;シース及びシーソイド線虫(Sheath and sheathoid nematodes)、ヘミシクリオフォラ属(*Hemicycliophora*)の種及びヘミクリコネモイデス属(*Hemicriconemoides*)の種;ヒルスマンニエラ属(*Hirshmanniella*)の種;ランス線虫(Lance nematodes)、ヤリセンチュウ属(*Hoploaimus*)の種;フォールス・ルートノット線虫(false rootknot nematodes)、ナコブス属(*Nacobbus*)の種;ニードル線虫(Needle nematodes)、ロンギドルス・エロンガトゥス(*Longidorus elongatus*)、及び他のロンギドルス属(*Longidorus*)の種;リージョン線虫(Lesion nematodes)、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・クルビタトゥス(*Pratylenchus curvatus*)、プラチレンクス・ゴデイ(*Pratylenchus goodeyi*)及び他のプラチレンクス属(*Pratylenchus*)の種;ネモグリセンチュウ(Burrowing nematodes)、バナナネモグリセンチュウ(*Radopholus similis*)、及び他のラドホルス属(*Radopholus*)の種;レニフォーム線虫(Reniform nematodes)、ロチレンクス・ロブスツス(*Rotylenchus robustus*)及び他のロチレンクス属(*Rotylenchus*)の種;スクテロネマ属(*Scutellonema*)の種;スタビイルート線虫(Stubby root nematodes)、トリコドルス・プリミチブス(*Trichodorus primitivus*)、及び他のトリコドルス属(*Trichodorus*)の種、パラトリコドルス(*Paratrichodorus*)種;スタント線虫(Stunt nematodes)、チレンコリンクス・クライトニ(*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・ズビウス(*Tylenchorhynchus dubius*)及び他のチレンコリンクス属(*Tylenchorhynchus*)の種;シトラス線虫(Citrus nematodes)、チレンクルス属(*Tylenchulus*)の種;ダガー線虫(Dagger nematodes)、オオハリセンチュウ属(*Xiphinema*)の種;及び他の植物寄生線虫種等。

【 0 1 5 7 】

その塩、N-オキシド、互変異性体、及び立体異性体を含めた本発明の化合物は、ダニ(コナダニ)などのクモ型類動物(クモ形類)、例えば、ヒメダニ科(*Argasidae*)、マダニ科(*Ixodidae*)及びヒゼンダニ科(*Sarcoptidae*)、例えば、アンブリオマ・アメリカヌム(*Amblyomma americanum*)、アンブリオマ・バリエガツム(*Amblyomma variegatum*)、アルガス・ペルシクス(*Argas persicus*)、ボーフィルス・アヌラツス(*Boophilus annulatus*)、ボーフィルス・デコロラツス(*Boophilus decoloratus*)、ボーフィルス・ミクロプルス(*Boophilus microplus*)、デルマセントル・シルバルム(*Dermacentor silvarum*)、ヒアローマ・トルンカツム(*Hyalomma truncatum*)、イクソデス・リキヌス(*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ルビクンズス(*Ixodes rubicundus*)、オルニトドルス・モウバタ(*Ornithodoros moubata*)、オトビウス・メグニニ(*Otobius megnini*)、デルマニスス・ガリナエ(*Dermanyssus gallinae*)、プソロプテス・オビス(*Psoroptes ovis*)、リピセファルス・アペンジクラツス(*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファルス・エベルトシ(*Rhipicephalus evertsi*)、サルコプテス・スカビエイ(*Sarcoptes scabiei*)、並びにフシダニ属の種(*Eriophyidae* sp.)、例えば、アクルス・シレクテンダリ(*Aculus schlechtendali*)、フィロコプトラタ・オレイボラ(*Phyllocoptrata oleivora*)、及びエリオフィエス・シェルドニ(*Eriophyes sheldoni*);タルソネミダエ属の種(*Tarsonemidae* spp.)、例えば、フィトネムス・パリズス(*Phytonemus pallidus*)及びポリファゴタルソネムス・ラツス(*Polyphagotarsonemus latus*);ヒメハダニ属の種(*Tenuipalpidae* spp.)、例えば、ブレビパルプス・フォエニキス(*Brevipalpus phoenicis*);ハダニ属の種(*Tetranychidae* spp.)、例えば、テトラニクス・キンナバリヌス(*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・カンザワイ(*Tetranychus kanzawai*)、テトラニクス・パキフィクス(*Tetranychus pacificus*)、テトラニクス・テラリウス(*Tetranychus telarius*)及びテトラニクス・ウルティカエ(*Tetranychus urticae*)、バ

10

20

30

40

50

ノニクス・ウルミ(*Panonychus ulmi*)、パノニクス・キトリ(*Panonychus citri*)、及びオリゴニクス・プラテンシス(*oligonychus pratensis*)を防除するのにも有用である。

【 0 1 5 8 】

式Iの化合物は、昆虫、好ましくは総翅目、双翅目、及び半翅目の属からの昆虫などの吸汁性及び刺性昆虫、並びに鱗翅目の属からの昆虫などの咀嚼性及び刺咬性有害生物、特に、以下の種を防除するのに特に有用である：

総翅目(Thysanoptera): フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・トリチキ(*Frankliniella tritici*)、シルトリプス・キトリ(*Scirtothrips citri*)、トリプス・オリザエ(*Thrips oryzae*)、トリプス・パルミ(*Thrips palmi*)及びトリプス・タバキ(*Trips tabaci*)、

10

双翅目(Diptera)、例えば、アエデス・アエギプチ(*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス(*Aedes albopictus*)、アエデス・ベキサンス(*Aedes vexans*)、アナストレファ・ルデンス(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルキアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、アノフェレス・ガンビアエ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・ロイコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、アノフェレス・ミニムス(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラツス(*Anopheles quadrimaculatus*)、カリフォラ・ビキナ(*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ(*Ceratitis capitata*)、クリソミア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラックス(*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マセラリア(*Chrysomya macellaria*)、クリソプス・ジスカリス(*Chrysops discalis*)、クリソプス・シラセア(*Chrysops silacea*)、クリソプス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、コクリオミア・ホミニボラックス(*Cochliomyia hominivorax*)、コンタリニア・ソルギコラ(*Contarinia sorghicola*)、コルジロピア・アントロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、クレックス・ピピエンス(*Culex pipiens*)、クレックス・ニグリパルパス(*Culex nigripalpus*)、クレックス・クインクエファシアツス(*Culex quinquefasciatus*)、クレックス・タルサリス(*Culex tarsalis*)、クリセタ・イノルナタ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ダクス・ククルビタエ(*Dacus cucurbitae*)、ダクス・オレアエ(*Dacus oleae*)、ダシネウラ・ブラシカエ(*Dasineura brassicae*)、デリア・アンチクエ(*Delia antique*)、デリア・コアルクタタ(*Delia coarctata*)、デリア・プラツラ(*Delia platura*)、デリア・ラジクム(*Delia radicum*)、デルマトピア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、ファニア・カニクラリス(*Fannia canicularis*)、ゲオミザ・トリプンクタタ(*Geomyza tripunctata*)、ガステロフィルス・インテスチナリス(*Gasterophilus intestinalis*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロシナ・フシベス(*Glossina fuscipes*)、グロシナ・タキノイデス(*Glossina tachinoides*)、ハエマトピア・イリタンス(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、ヒレミア・プラツラ(*Hylemyia platura*)、ヒポデルマ・リネアタ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノプス・トレンス(*Leptoconops torrens*)、リリオミザ・サチバエ(*Liriomyza sativae*)、リリオミザ・トリフォリイ(*Liriomyza trifolii*)、ルキリア・カプリナ(*Lucilia caprina*)、ルキリア・クプリナ(*Lucilia cuprina*)、ルキリア・セリカタ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・チチラヌス(*Mansonia titillanus*)、マイエチオラ・デストルクトル(*Mayetiola destructor*)、ムスカ・アウツムナリス(*Musca autumnalis*)、ムスカ・ドメスチカ(*Musca domestica*)、ムシナ・スタブランズ(*Muscina stabulans*)、オエストルス・オビス(*Oestrus ovis*)、オポミザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ・フリット(*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒソキアミ(*Pegomya hysocyami*)、フォルビア・アンチクア(*Phorbia antiqua*)、フォルビア・ブラシカエ(*Phorbia brassicae*)、フォルビア・コアルクタタ(*Phorbia coarctata*)、フレボトムス・アルゲンチベス(*Phlebotomus argentipes*)、プソロフォ

20

30

40

50

ラ・コロンビアエ(*Psorophora columbiae*)、プシラ・ロサエ(*Psila rosae*)、プソロフォ
 ラ・ジスコロル(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimulium mixt*
um)、ラゴレチス・セラシ(*Rhagoletis cerasi*)、ラゴレチス・ポモネラ(*Rhagoletis pomo*
nella)、サルコファガ・ハエモロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ
 属の種(*Sarcophaga spp.*)、シムリウム・ビッタツム(*Simulium vittatum*)、ストモキシス
 ・カルキトランス(*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス・ボビヌス(*Tabanus bovinus*)、タバ
 ナス・アトラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)及びタバ
 ナス・シミリス(*Tabanus similis*)、チプラ・オレラセア(*Tipula oleracea*)及びチプラ・パ
 ルドサ(*Tipula paludosa*)、

半翅目(Hemiptera)、特にアブラムシ：アクリトシフォン・オノブリキス(*Acrythosiphon*
onobrychis)、アデルゲス・ラリキス(*Adelges laricis*)、アフィズラ・ナスツルチ(*Aph*
idula nasturtii)、アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*)、アフィス・フォルベシ(*Aphis fo*
rbesi)、アフィス・ポミ(*Aphis pomi*)、アフィス・ゴシピ(*Aphis gossypii*)、アフィス・
 グロスラリアエ(*Aphis grossulariae*)、アフィス・シュネイデリ(*Aphis schneideri*)、ア
 フィス・スピラエコラ(*Aphis spiraecola*)、アフィス・サンブキ(*Aphis sambuci*)、アク
 リトシフォン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アウラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum so*
lani)、ブラチカウズス・カルズイ(*Brachycaudus cardui*)、ブラチカウズス・ヘリクリシ
 (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラチカウズス・ペルシカエ(*Brachycaudus persicae*)、ブ
 ラチカウズス・ブルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ブレビコリネ・ブラシカエ(*Brevi*
coryne brassicae)、カピトフォルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシ
 ピ(*Cerosipha gossypii*)、カエトシフォン・フラガエフォリ(*Chaetosiphon fragaefolii*)
 、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマニアナエ(*Drey*
fusia nordmanniana)、ドレイフシア・ピセアエ(*Dreyfusia piceae*)、ジサフィス・ラジ
 コラ(*Dysaphis radicola*)、ジサウラコルツム・シュードソラニ(*Dysaulacorthum pseudos*
olani)、ジサフィス・プランタギネア(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ピリ(*Dysap*
his pyri)、エンポアスカ・ファバエ(*Empoasca fabae*)、ヒアロプテルス・ブルニ(*Hyalop*
terus pruni)、ヒペロミズス・ラクツカエ(*Hyperomyzus lactucae*)、マクロシフム・アベ
 ナエ(*Macrosiphum avenae*)、マクロシフム・エウホルビアエ(*Macrosiphum euphorbiae*)、
 マクロシフォン・ロサエ(*Macrosiphon rosae*)、メゴウラ・ビキアエ(*Megoura viciae*)、
 メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrarius*)、メトポロフィウム・ジローズム(*Meto*
polophium dirhodum)、ミゾデス・ペルシカエ(*Myzodes persicae*)、ミズス・アスカロニ
 クス(*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ(*Myzus cerasi*)、ミズス・バリアンス(*Myzus*
varians)、ナソノビア・リビス-ニグリ(*Nasonovia ribis-nigri*)、ニラバルバタ・ルゲン
 ス(*Nilaparvata lugens*)、ペムフィグス・ブルサリウス(*Pemphigus bursarius*)、パーキ
 ンシエラ・サッカリキダ(*Perkinsiella saccharicida*)、ホロドン・フミリ(*Phorodon hum*
ili)、プシラ・マリ(*Psylla mali*)、プシラ・ピリ(*Psylla piri*)、ロパロミズス・アスカ
 ロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、ロパロシフム・マイジス(*Rhopalosiphum maidis*)
 、ロパロシフム・パジ(*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・インセルツム(*Rhopalosiph*
um insertum)、サツパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サツパフィス・マリ(*Sappaphis m*
ali)、シザフィス・グラミヌム(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌジノサ(*Schizo*
neura lanuginosa)、シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、トリアロイロデス・バポ
 ラリオルム(*Trialeurodes vaporariorum*)、トキソプテラ・アウランチアンド(*Toxoptera*
aurantiand)及びビテウス・ビチフォリイ(*Viteus vitifolii*)、

鱗翅目(Lepidoptera)、特に：アグロティス・イプシロン(*Agrotis ypsilon*)、アグロテ
 イス・セゲタム(*Agrotis segetum*)、アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillacea*)、アン
 チカルシア・ゲマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、アルギレスチア・コンジュゲラ(*Ar*
gyresthia conjugella)、オートグラフィア・ガンマ(*Autographa gamma*)、プパルス・ピニ
 アリウス(*Bupalus piniarius*)、カコエキア・ムリナナ(*Cacoecia murinana*)、カプア・レ
 チキュラナ(*Capua reticulana*)、ケイマトビア・ブルマタ(*Cheimatobia brumata*)、コリ
 ストネウラ・フミフェラナ(*Choristoneura fumiferana*)、コリストネウラ・オシデンタリ

10

20

30

40

50

ス(*Choristoneura occidentalis*)、キルフィス・ウニパンクタ(*Cirphis unipuncta*)、シディア・ポモネラ(*Cydia pomonella*)、デンドロリマス・ピニ(*Dendrolimus pini*)、ジアファニア・ニチダリス(*Diaphania nitidalis*)、ジাত্রアエア・グランジオセラ(*Diatraea grandiosella*)、エアリアス・インストラナ(*Earias insulana*)、エラスモパルパス・リゲノセラ(*Elasmopalpus lignosellus*)、エウポエキリア・アンビゲラ(*Eupoecilia ambiguella*)、エベトリア・ボーリアナ(*Evetria bouliana*)、フェルチア・サブテラネア(*Feltia subterranea*)、ガレリア・メロネラ(*Galleria mellonella*)、グラホリタ・フネブラナ(*Grapholitha funebrana*)、グラホリタ・モレスタ(*Grapholitha molesta*)、ヘリオチス・アルミゲラ(*Heliothis armigera*)、ヘリオチス・ビレセンス(*Heliothis virescens*)、ヘリオチス・ゼア(*Heliothis zea*)、ヘルラ・ウンダリス(*Hellula undalis*)、ヒベルニア・デフォリアリア(*Hibernia defoliaria*)、ヒファントリア・クネア(*Hyphantria cunea*)、ヒポノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコペルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、ラムジナ・フィスセラリア(*Lambdina fiscellaria*)、ラフィグマ・エキシグア(*Laphygma exigua*)、ロイコプテラ・コフェーラ(*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、リトコレティス・ブランカルデラ(*Lithocolletis blancardella*)、ロベシア・ボトラナ(*Lobesia botrana*)、ロキソステジ・ステイクティカリス(*Loxostege sticticalis*)、リマントリア・ジスパー(*Lymantria dispar*)、リマントリア・モナカ(*Lymantria monacha*)、リオネチア・クレルケラ(*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ニューストリア(*Malacosoma neustria*)、マメストラ・ブラシカエ(*Amestrea brassicae*)、オルギア・シュードツガタ(*Orgyia pseudotsugata*)、オストロニア・ヌビラリス(*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フラメア(*Panolis flammea*)、ペクチノフォラ・ゴシピエラ(*Pectinophora gossypiella*)、ペリドロマ・サウキア(*Peridroma saucia*)、ファレラ・ブセファラ(*Phalera bucephala*)、フトリマエア・オペルクレラ(*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスティス・キトレラ(*Phyllocnistis citrella*)、ピエリス・ブラシカエ(*Pieris brassicae*)、プラチペナ・スカブラ(*Plathypena scabra*)、プルテラ・キシロステラ(*Plutella xylostella*)、シュードブルシア・インクルデンス(*Pseudoplusia includens*)、リアキオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、スクロビパルブラ・アブソルタ(*Scrobipalpus absoluta*)、シトトラガ・セラアレラ(*Sitotroga cerealella*)、スパルガノティス・ピレリアナ(*Sparganothis pilleriana*)、スポドプテラ・フルギベルダ(*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・リトラリス(*Spodoptera littoralis*)、スポドプテラ・リツラ(*Spodoptera litura*)、タウマトポエア・ピチオカンパ(*Thaummatopoea pityocampa*)、トルトリックス・ピリダナ(*Tortrix viridana*)、トリコプルシア・ニ(*Trichoplusia ni*)及びゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)。

【0159】

一実施形態では、式Iの化合物は、鱗翅目、鞘翅目、双翅目、半翅目、及び総翅目の昆虫の防除に特に有用である。

【0160】

別の実施形態では、式Iの化合物は、半翅目及び総翅目の昆虫の防除に特に有用である。

製剤

本発明はまた、助剤、及び本発明による少なくとも1つの化合物Iを含む農薬組成物にも関する。

【0161】

農薬組成物は、殺有害生物有効量の化合物Iを含む。用語「有効量」とは、栽培植物に対する、又は材料の保護において有害無脊椎動物を防除するのに十分で、且つ処理された植物若しくは材料に実質的な損害をもたらさない、組成物又は化合物Iの量を意味する。こうした量は、広い範囲内で変えることができ、防除すべき無脊椎(例えば、昆虫)種、処理される栽培植物又は材料、気候条件及び使用される特定の化合物Iなどの様々な要因に依存する。

【0162】

10

20

30

40

50

化合物I、その立体異性体、N-オキシド、互変異性体、及び塩は、慣用的なタイプの農薬組成物、例えば、液剤、エマルジョン製剤、懸濁剤、粉剤、散剤、ペースト剤、粒剤、圧縮剤、カプセル剤、及びそれらの混合物に変換することができる。組成物のタイプの例は、懸濁剤(例えば、SC、OD、FS)、乳剤(例えば、EC)、エマルジョン製剤(例えば、EW、EO、ES、ME)、カプセル剤(例えば、CS、ZC)、ペースト剤、パステル剤、水和剤若しくは粉剤(例えば、WP、SP、WS、DP、DS)、圧縮剤(例えば、BR、TB、DT)、粒剤(例えば、WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫性品(例えば、LN)、及び種子などの植物繁殖材料を処理するためのゲル製剤(例えば、GF)である。これら、及びさらなる組成物のタイプは「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」(Technical Monograph No.2、第6版、2008年5月、CropLife International社)において定義されている。

10

【0163】

組成物は、Mollet及びGrubemann(Formulation technology、Wiley VCH、Weinheim、2001年)、又はKnowles(New developments in crop protection product formulation、Agrow Reports DS243、T&F Informa、London、2005年)により記載されているものなどの公知の方法で調製される。

【0164】

適切な助剤の例は、溶媒、液体担体、固体担体又は充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、アジュバント、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、粘着剤、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激物質、相溶剤、殺細菌剤、凍結防止剤、消泡剤、着色剤、粘着付与剤及び結合剤である。

20

【0165】

適切な溶媒及び液体担体は、水、並びに中～高沸点の鉱物油留分(例えば灯油、ディーゼル油)、植物又は動物由来の油、脂肪族炭化水素、環式炭化水素及び芳香族炭化水素(例えば、トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン)、アルコール(例えば、エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノール)、グリコール、DMSO、ケトン(例えば、シクロヘキサノン)、エステル(例えば、乳酸エステル、炭酸エステル、脂肪酸エステル、ガンマ-ブチロラクトン)、脂肪酸、ホスホネート、アミン、アミド(例えば、N-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミド)、及びそれらの混合物などの有機溶媒である。

30

【0166】

適切な固体担体又は充填剤は、鉱物土類(例えば、シリケート、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰石、石灰、チョーク、クレイ、ドロマイト、珪藻土、ペントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム)、多糖類粉末(例えば、セルロース、デンプン)、肥料(例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素)、植物由来の生成物(例えば、穀物の粗粉、樹皮の粗粉、木材の粗粉、堅果殻の粗粉)、及びそれらの混合物である。

【0167】

適切な界面活性剤は、陰イオン性、陽イオン性、非イオン性及び両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、及びそれらの混合物などの界面活性化合物である。こうした界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、又はアジュバントとして使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheonの第1巻: Emulsifiers & Detergents、McCutcheon's Directories、Glen Rock、米国、2008年(International Ed.又はNorth American Ed.)に列挙されている。

40

【0168】

適切な陰イオン性界面活性剤は、スルホン酸イオン、硫酸イオン、リン酸イオン、カルボン酸イオンのアルカリ塩、アルカリ土類塩又はアンモニウム塩、及びそれらの混合物である。スルホン酸イオンの例は、アルキルアリアルスルホン酸イオン、ジフェニルスルホン酸イオン、アルファ-オレフィンスルホン酸イオン、リグニンスルホン酸イオン、脂肪酸及び油のスルホン酸イオン、エトキシ化アルキルフェノールのスルホン酸イオン、アル

50

コキシ化アリアルフェノールのスルホン酸イオン、縮合ナフタレンのスルホン酸イオン、ドデシルベンゼン及びトリデシルベンゼンのスルホン酸イオン、ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホン酸イオン、スルホスクシネート又はスルホスクシナメートである。硫酸イオンの例は、脂肪酸及び油、エトキシ化アルキルフェノール、アルコール、エトキシ化アルコール、又は脂肪酸エステルの硫酸イオンである。リン酸イオンの例は、リン酸イオンのエステルである。カルボン酸イオンの例は、アルキルカルボン酸イオン及びカルボキシ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレートである。

【 0 1 6 9 】

適切な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミノオキシド、エステル、糖をベースとする界面活性剤、ポリマー界面活性剤、及びそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1~50当量でアルコキシ化された、アルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリアルフェノール、脂肪酸又は脂肪酸エステルなどの化合物である。エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシド、好ましくはエチレンオキシドをアルコキシ化のために使用することができる。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミド又は脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステル又はモノグリセリドである。糖をベースとする界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロース及びグルコースエステル又はアルキルポリグルコシドである。ポリマー界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール、又は酢酸ビニルのホモポリマー又はコポリマーである。

【 0 1 7 0 】

適切な陽イオン性界面活性剤は、四級界面活性剤、例えば、1つ若しくは2つの疎水性基を有する四級アンモニウム化合物、又は長鎖一級アミンの塩である。適切な両性界面活性剤は、アルキルベタイン及びイミダゾリンである。適切なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B若しくはA-B-A型ブロックポリマー、又はアルカノール、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドを含むA-B-C型ブロックポリマーである。適切な高分子電解質は、ポリ酸又はポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸又はポリ酸のくし状ポリマーのアルカリ塩である。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

【 0 1 7 1 】

適切なアジュバントは、それ自体、殺有害生物活性が無視できるか又は全くなく、且つ標的に対する化合物Iの生物的性能を改善する化合物である。例は、界面活性剤、鉱物油又は植物油、及び他の助剤である。さらなる例は、Knowles、Adjuvants and additives、Agrow Reports DS256、T&F Informa UK、2006年、第5章に列挙されている。

【 0 1 7 2 】

適切な増粘剤は、多糖類(例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース)、有機クレイ(有機的改変又は未改変型)、ポリカルボキシレート、及びシリケートである。

【 0 1 7 3 】

適切な殺細菌剤は、プロノポール及びアルキルイソチアゾリノン及びベンゾイソチアゾリノンなどのイソチアゾリノン誘導体である。

【 0 1 7 4 】

適切な凍結防止剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素及びグリセリンである。

【 0 1 7 5 】

適切な消泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール、及び脂肪酸の塩である。

【 0 1 7 6 】

適切な着色剤(例えば、赤色、青色、又は緑色)は、水溶性の低い顔料、及び水溶性の染料である。例は、無機の着色剤(例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸塩)、及び有機着色剤(例えば、アリザリン着色剤、アゾ着色剤、及びフタロシアニン着色剤)である。

【 0 1 7 7 】

10

20

30

40

50

適切な粘着付与剤又は結合剤は、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物系又は合成ワックス、及びセルロースエーテルである。

【 0 1 7 8 】

組成物のタイプ及びそれらの調製に関する例は、以下の通りである。

i) 液剤 (SL、LS)

10～60重量%の本発明による化合物I、及び5～15重量%の湿潤剤(例えば、アルコールアルコキシレート)を水、及び/又は水溶性溶媒(例えば、アルコール)に100重量%まで溶解する。活性物質は、水で希釈すると溶解する。

ii) 分散剤 (DC)

5～25重量%の本発明による化合物I、及び1～10重量%の分散剤(例えば、ポリビニルピロリドン)を100重量%まで有機溶媒(例えば、シクロヘキサノン)に溶解する。水で希釈すると、分散液が得られる。

iii) 乳剤 (EC)

15～70重量%の本発明による化合物I、及び5～10重量%の乳化剤(例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート)を100重量%まで水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)に溶解する。水で希釈するとエマルションが得られる。

iv) エマルション製剤 (EW、EO、ES)

5～40重量%の本発明による化合物I、及び1～10重量%の乳化剤(例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート)を20-40重量%の水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)に溶解する。この混合物を、乳化装置により100重量%まで水に導入し、均一なエマルション製剤にする。水で希釈するとエマルションが得られる。

v) 懸濁剤 (SC、OD、FS)

掻き混ぜたボールミル内で、20～60重量%の本発明による化合物Iを、2～10重量%の分散剤及び湿潤剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート)、0.1～2重量%の増粘剤(例えば、キサンタンガム)、及び100重量%までの水を加えて粉碎すると、活性物質の微細懸濁剤が得られる。水で希釈すると活性物質の安定な懸濁液が得られる。FSタイプの組成物の場合、最大40重量%の結合剤(例えば、ポリビニルアルコール)を添加する。

vi) 水和性顆粒剤及び水溶性顆粒剤 (WG、SG)

50～80重量%の本発明による化合物Iを、100重量%までの分散剤及び湿潤剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート)を添加して微粉碎し、専用の装置(例えば、押出器、噴霧塔、流動床)により水和性顆粒剤又は水溶性顆粒剤として調製する。水で希釈すると活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

vii) 水和剤及び水溶剤 (WP、SP、WS)

ローターステーターミル(rotor-stator mill)中で、50～80重量%の本発明による化合物Iに1～5重量%の分散剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム)、1～3重量%の湿潤剤(例えば、アルコールエトキシレート)、及び100重量%までの固体担体(例えば、シリカゲル)を添加して粉碎する。水で希釈すると活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

viii) ゲル製剤 (GW、GF)

掻き混ぜたボールミル中で、5～25重量%の本発明による化合物Iを、3～10重量%の分散剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム)、1～5重量%の増粘剤(例えば、カルボキシメチルセルロース)、及び100重量%までの水を添加して細砕すると、活性物質の微細懸濁液が得られる。水で希釈すると活性物質の安定な懸濁液が得られる。

iv) マイクロエマルション製剤 (ME)

5～20重量%の本発明による化合物Iを5～30重量%の有機溶媒ブレンド(例えば、脂肪酸ジメチルアミド及びシクロヘキサノン)、10～25重量%の界面活性剤ブレンド(例えば、アルコール(alcohol)エトキシレート及びアリアルフェノールエトキシレート)、及び100重量%までの水に加える。この混合物を1時間攪拌すると、熱力学的に安定したマイクロエマルションが自発的に生じる。

10

20

30

40

50

iv) マイクロカプセル剤 (CS)

5~50重量%の本発明による化合物I、0~40重量%の水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)、2~15重量%のアクリルモノマー(例えば、メチルメタクリレート、メタクリル酸、及びジ又はトリアクリレート)を含む油相を保護コロイド(例えばポリビニルアルコール)の水溶液に分散する。ラジカル開始剤により開始されるラジカル重合により、ポリ(メタ)アクリレートのマイクロカプセルが形成する。或いは、5~50重量%の本発明による化合物I、0~40重量%の水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)、及びイソシアネートモノマー(例えば、ジフェニルメタン-4,4'-ジイソシアネート(diisocyanatae)を含む油相を保護コロイド(例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液に分散する。ポリアミン(例えば、ヘキサメチレンジアミン)の付加により、ポリ尿素のマイクロカプセルが形成する。このモノマーは総計1~10重量%になる。重量%は、総CS組成物に関する。

10

ix) 粉剤 (DP、DS)

1~10重量%の本発明による化合物Iを微粉碎し、100重量%までの固体担体(例えば、微細分割カオリン)と密に混合する。

x) 顆粒剤 (GR、FG)

0.5~30重量%の本発明による化合物Iを微粉碎し、100重量%までの固体担体(例えば、シリケート)と混合する。顆粒は押出成形、スプレードライ、又は流動床により達成される。

xi) 超微量溶液剤 (UL)

1~50重量%の本発明による化合物Iを100重量%までの有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)に溶解する。

20

【0179】

タイプi)~xi)の組成物は、場合により、0.1~1重量%の殺細菌剤、5~15重量%の凍結防止剤、0.1~1重量%の消泡剤、及び0.1~1重量%の着色剤などのさらなる助剤を含んでもよい。

【0180】

本農薬組成物は、一般に、0.01~95重量%の間、好ましくは0.1~90重量%の間、最も好ましくは0.5~75重量%の間の活性物質を含む。これらの活性物質は、90%~100%、好ましくは、95%~100%の純度(NMRスペクトルによる)で使用される。

【0181】

植物繁殖材料、特に種子を処理するために、液剤(LS)、サスポエマルジョン製剤(SE)、フロアブル製剤(FS)、乾式処理用粉剤(DS)、スラリー処理用水和剤(WS)、水溶剤(SS)、エマルジョン製剤(ES)、乳剤(EC)及びゲル製剤(GF)を一般に使用する。当該組成物は、2~1000倍の希釈後、即時使用可能な調製物中に0.01~60重量%、好ましくは0.1~40重量%の活性物質濃度をもたらす。施用は、播種の前又はその最中に実施することができる。化合物I及びその組成物をそれぞれ、植物繁殖材料とりわけ種子に施用するか又は処理する方法には、該繁殖材料への粉衣法、コーティング法、ペレット化法、散粉法、浸漬法、及び畝間施用する方法が含まれる。好ましくは、化合物I又はその組成物はそれぞれ、発芽が誘発されない方法によって、例えば種子粉衣法、種子ペレット化法、種子コーティング法及び種子散粉法によって、植物繁殖材料上に施用される。

30

40

【0182】

作物保護において使用される場合、施用される活性物質の量は、所望の効果の種類に応じて、1ha当たり0.001~2kg、好ましくは1ha当たり0.005~2kg、より好ましくは1ha当たり0.05~0.9kg、特に1ha当たり0.1~0.75kgである。

【0183】

例えば種子に散粉する、種子にコーティングする、又は種子をドレンチすることによる種子などの植物繁殖材料の処理において、植物繁殖材料(好ましくは、種子)100キログラム当たり0.1~1000g、好ましくは1~1000g、より好ましくは1~100g、最も好ましくは5~100gの量の活性物質が、一般的に必要なものである。

【0184】

50

材料又は貯蔵生産物の保護において使用される場合、施用される活性物質の量は、施用領域の種類及び所望の効果に依存する。材料の保護において慣用的に施用される量は、処理される材料1立方メートル当たり、0.001g~2kg、好ましくは0.005g~1kgの活性物質である。

【0185】

様々なタイプの油、湿潤剤、アジユバント、肥料、又は微量栄養素、及び他の殺有害生物剤(例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、生長調節剤、毒性緩和剤)を活性物質、又はプレミックスとしてそれを含む組成物に添加してもよく、又は適切な場合、使用直前に添加することもできる(タンクミックス)。これらの作用剤は、本発明による組成物と、1:100~100:1、好ましくは1:10~10:1の重量比で混合することができる。

10

【0186】

使用者は、本発明による組成物を、通常は、事前に投与量を設定できる(predosage)装置、背負い式噴霧器、噴霧用タンク、噴霧用飛行機、又は灌漑システムから施用する。通常、本農薬組成物は、水、緩衝剤、及び/又はさらなる助剤により所望の施用濃度に作製され、こうして、本発明による即時使用可能な噴霧用液体又は農薬組成物が得られる。農業上有用な領域1ヘクタールあたり、通常20~2000リットル、好ましくは50~400リットルの即時使用可能な噴霧用液体を施用する。

【0187】

一実施形態によれば、キットの一部又は二元系若しくは三元系混合物の一部などの、本発明による組成物の個々の成分が、使用者自身により噴霧用タンク中で混合されてもよく、またさらなる助剤が適宜、添加されてもよい。

20

【0188】

さらなる実施形態では、本発明による組成物の個々の成分又は一部が事前混合されている成分(例えば、化合物I及び/又はグループA~O)からの活性物質を含む成分)のいずれかが、使用者により噴霧用タンク中で混合されてもよく、またさらなる助剤及び添加物が適宜、添加されてもよい。

【0189】

さらなる実施形態では、本発明による組成物の個々の成分又は一部が事前混合されている成分(例えば、化合物I及び/又はグループA~O)からの活性物質を含む成分)のいずれかを一緒に施用することができ(例えば、タンクミックスした後)、又は連続して施用することができる。

30

【0190】

本発明の方法では、化合物(I)は、他の活性成分、例えば、他の殺有害生物剤、殺虫剤、除草剤、肥料(硝酸アンモニウム、尿素、カリ、及び過リン酸塩等)、植物に有毒な物質及び植物生長調整剤、毒性緩和剤、並びに殺線虫剤と一緒に施用されてもよい。これらの追加成分は、逐次に又は上記組成物と組み合わせて使用することが可能であり、適当な場合には、使用の直前にのみ加えることもできる(タンクミックス)。例えば、他の活性成分により処理する前又はその後のいずれかに、本発明の組成物を植物(複数可)に噴霧することができる。

【0191】

従って、本発明はまた、少なくとも1種の式(I)の化合物、又はその立体異性体、N-オキシド、農業的もしくは獣医学的に許容される塩、及び少なくとも1種の更なる殺有害生物剤を含む混合物又は組成物に関する。

40

【0192】

以下で分類した殺有害生物剤のリストMは、殺虫剤混合物のパートナーを表し、これは、可能な場合は常に、殺虫剤抵抗性対策委員会(Insecticide Resistance Action Committee (IRAC))に従って分類され、本発明による化合物はこれらと共に使用することができる。本発明の化合物の以下の殺有害生物剤との併用によって、相乗効果を生じる可能性がある。殺虫用混合パートナーの以下の例は、可能な組合せを例示することを意図したものであり、得られる混合物について何らの限定を設けるものではない。

50

【 0 1 9 3 】

M.1. 以下のクラスのアセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤 :

M.1A. カーバメート類、例えばアルジカルブ(aldicarb)、アラニカルブ(alanycarb)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、プトカルボキシム(butocarb oxim)、プトキシカルボキシム(butoxycarboxim)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、ホルメタネート(formetanate)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メチオカルブ(methiocarb)、メソミル(methomyl)、メトルカルブ(metolcarb)、オキサミル(oxamyl)、ピリミカルブ(pirimicarb)、プロポクスル(propoxur)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオファノックス(thiofanox)、トリメタカルブ(trimethacarb)、XMC、キシリルカルブ(xylylcarb)及びトリアザメート(triazamate);

10

M.1B. 有機ホスフェート類、例えばアセフェート(acephate)、アザメチホス(azamethiphos)、アジンホス-エチル(azinphos-ethyl)、アジンホスメチル(azinphosmethyl)、カドゥサホス(cadusafos)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルメホス(chlormephos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クマホス(coumaphos)、シアノホス(cyanophos)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、ジアジノン(diazinon)、ジクロルボス(dichlorvos)/DDVP、ジクロトホス(dicrotophos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジスルホトン(disulfoton)、EPN、エチオン(ethion)、エトプロホス(ethoprophos)、ファミフル(famphur)、フェナミホス(fenamiphos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、フェンチオン(fenthion)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ヘプテノホス(heptenophos)、イミシアホス(imicyafos)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロピル-0-(メトキシアミノチオ-ホスホリル)サリシレート、イソキサチオン(isoxathion)、馬拉チオン(malathion)、メカルバム(mecarbam)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレド(naled)、オメトエート(omethoate)、オキシデメトン-メチル(oxdemeton-methyl)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、フェントエート(phenthoate)、ホレート(phorate)、ホサロン(phosalone)、ホスメット(phosmet)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホキシム(phoxim)、ピリミホス-メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノフォス(profenofos)、プロベタムホス(propetamphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、キナルホス(quinalphos)、スルホテップ(sulfotep)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テムホス(temephos)、テルブホス(terbufos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、チオメトン(thiometon)、トリアゾホス(triazophos)、トリクロルホン(trichlorfon)及びバミドチオン(vamidathion);

20

30

【 0 1 9 4 】

M.2. 以下のようなGABA-作動性塩素チャンネルアンタゴニスト :

M.2A. シクロジエン有機塩素化合物、例えばエンドスルファン(endosulfan)若しくはクロルダン(chlordane); 又は

40

M.2B. フィプロール(fiproles)(フェニルピラゾール)、例えばエチプロール(ethiprole)、フィプロニル(fipronil)、フルフィプロール(flufiprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)及びピリプロール(pyriprole);

【 0 1 9 5 】

M.3. 以下のクラスのリチウムチャンネルモジュレーター :

M.3A. ピレスロイド類、例えばアクリナトリン(acrinathrin)、アレトリン(allethrin)、d-cis-transアレトリン、d-transアレトリン、ピフェントリン(bifenthrin)、ピオアレトリン(bioallethrin)、ピオアレトリンS-シクロペンテニル(bioallethrin S-cyclopentenyl)、ピオレスメトリン(bioresmethrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)

50

in)、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ガンマ-シハロトリン(gamma-cyhalothrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、アルファ-シペルメトリン(alpha-cypermethrin)、ベータ-シペルメトリン(beta-cypermethrin)、シータ-シペルメトリン(theta-cypermethrin)、ゼータ-シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エンペントリン(empenthrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(etofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルメトリン(flumethrin)、タウ-フルバリネート(tau-fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、イミプロトリン(imiprothrin)、メペルフルトリン(meperfluthrin)、メトフルトリン(metofluthrin)、ペルメトリン(permethrin)、フェノトリン(phenothrin)、プラレトリン(prallethrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ピレトリン(pyrethrin)ピレトラム(pyrethrum)、レスメトリン(resmethrin)、シラフルオフェン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、テトラメチルフルトリン(tetramethylfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、トラロメトリン(tralomethrin)及びトランスフルトリン(transfluthrin); 又は

M.3B.DDT又はメトキシクロル(methoxychlor)等のナトリウムチャンネルモジュレーター;
【0196】

M.4.以下のクラスのコチニン性アセチルコリン受容体アゴニスト(nAChR)

M.4A.ネオニコチノイド類、例えばアクテアミプリド(acteamiprid)、クロチアニジン(clothianidin)、ジノテフラン(dinotefuran)、イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、チアクロプリド(thiacloprid)及びチアメトキサム(thiamethoxam);
又は

M.4B.ニコチン

M.5.スピノシンクラスのニコチン性アセチルコリン受容体アロステリックアクチベーター、例えばスピノサド(spinosad)又はスピネトラム(spinetoram)

M.6.アベルメクチン(ivermectins)及びミルベマイシン(milbemycins)クラスの塩素チャンネルアクチベーター、例えばアバメクチン(abamectin)、エマメクチン安息香酸塩(emamectin benzoate)、イベルメクチン(ivermectin)、レピメクチン(lepimectin)又はミルベメクチン(milbemectin);

M.7.幼若ホルモン模倣物質、例えば

M.7A.幼若ホルモン類似体、例えばヒドロプレン(hydroprene)、キノプレン(kinoprene)及びメトプレン(methoprene); 又は

M.7B.フェノキシカルブ(fenoxycarb); 又は

M.7C.ピリプロキシフェン(pyriproxyfen);

【0197】

M.8.混合型非特異的(多部位)阻害剤、例えば

M.8A.臭化メチル等のハロゲン化アルキル及び他のハロゲン化アルキル、又は

M.8B.クロロピクリン(chloropicrin)、又は

M.8C.フッ化スルフリル、又は

M.8D.ボラックス(borax)、又は

M.8E.吐酒石;

M.9.同翅類選択的摂食プロッカー、例えば

M.9B.ピメトロジン(pymetrozine)、又は

M.9C.フロニカミド(flonicamid);

M.10.ダニ成長阻害剤、例えば

M.10A.クロフェンテジン(clofentazine)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)及びジフロピダジン(diflovidazin)、又は

M.10B.エトキサゾール(etoxazole);

【0198】

M.11.昆虫の中腸膜の微生物攪乱物質、例えばバチルス・チューリンゲンシス(bacillus

10

20

30

40

50

thuringiensis)又はバチルス・スファエリクス(bacillus sphaericus)及びこれらが産生する殺虫性タンパク質、例えばバチルス・チューリングエンシス亜種イスラエレンシス(bacillus thuringiensis subsp. israelensis)、バチルス・スファエリクス、バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ(bacillus thuringiensis subsp. aizawai)、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキ(bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)及びバチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス(bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis)、又はBt cropタンパク質: Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb及びCry34/35Ab1;

【 0 1 9 9 】

- M.12. ミトコンドリアATP合成酵素阻害剤、例えば 10
 M.12A. ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、又は
 M.12B. 有機スズ殺ダニ剤、例えばアゾシクロチン(azocyclostin)、シヘキサチン(cyhexatin)又はフェンブタチン酸化物(fenbutatin oxide)、又は
 M.12C. プロパルギット(propargite)、又は
 M.12D. テトラジホン(tetradifon);
 M.13. プロトン勾配の破壊を介した酸化的リン酸化の脱共役剤、例えばクロルフェナピル(chlorfenapyr)、DNOC又はスルフルラミド(sulfluramid);
 M.14. ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)チャネルブロッカー、例えばベンスルタップ(bensultap)、カルタップ塩酸塩(cartap hydrochloride)、チオシクラム(thiocyclam)又はチオスルタップナトリウム(thiosultap-sodium)等のネレイストキシン(nereistoxin)類似体; 20
 M.15. タイプ0のキチン生合成阻害剤、例えばビストリフルロン(bistrifluron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルシクロクスロン(flucycloxon)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフエヌロン(lufenuron)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)又はトリフルムロン(triflumuron)等のベンゾイルウレア類;
 M.16. タイプ1のキチン生合成阻害剤、例えばブプロフェジン(buprofezin);

【 0 2 0 0 】

- M.17. 双翅類の脱皮攪乱物質、例えばシロマジン(cyromazine); 30
 M.18. ジアシルヒドラジン等のエクジソン受容体アゴニスト、例えばメトキシフェノジド(methoxyfenozide)、テブフェノジド(tebufenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、フフェノジド(fufenozide)又はクロマフェノジド(chromafenozide);
 M.19. オクトパミン受容体アゴニスト、例えばアミトラズ(amitraz);
 M.20. ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害剤、例えば
 M.20A. ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、又は
 M.20B. アセキノシル(acequinocyl)、又は
 M.20C. フルアクリピリム(flucrypyrim);
 M.21. ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害剤、例えば
 M.21A. METIダニ駆除剤及び殺虫剤、例えばフェナザキン(fenazaquin)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリダベン(pyridaben)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)又はトルフェンピラド(tolfenpyrad)、又は
 M.21B. ロテノン(rotenone); 40

【 0 2 0 1 】

- M.22. 電圧依存型ナトリウムチャネルブロッカー、例えば
 M.22A. インドキサカルブ(indoxacarb)、又は
 M.22B. メタフルミゾン(metaflumizone);
 M.23. アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤、例えばテトロン酸(Tetronic)及びテトラミン酸(Tetramic acid)誘導体、例えばスピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロメシフェン(spiromesifen)又はスピロテトラマト(spirotetramat); 50

M.24.ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害剤、例えば
 M.24A.ホスフィン、例えばリン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン又はリン化亜鉛、又は
 M.24B.シアン化物。

【0202】

M.25.ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害剤、例えば -ケトニトリル誘導体、例えばシエノピラフェン(cyenopyrafen)又はシフルメトフェン(cyflumetofen);

【0203】

M.26.ジアミドクラスのリアノジン受容体モジュレーター、例えばフルベンジアミド(flubendiamide)、クロルアントラニリプロール(chloranthraniliprole(rynaxypyr(登録商標)))、シアントラニリプロール(cyanthraniliprole(cyazypyr(登録商標)))、又はフタルアミド化合物

M.26.1:(R)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド、及び

M.26.2:(S)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド、又は化合物

M.26.3:3-ブromo-N-{2-ブromo-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(提案されているISO名:シクラニリプロール)、又は化合物

M.26.4:メチル-2-[3,5-ジブromo-2-([3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル)アミノ]ベンゾイル]-1,2-ジメチルヒドラジンカルボキシレート;又はM.26.5a)~M.26.5h)から選択される化合物

M.26.5a):N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド;

M.26.5b):N-[4-クロロ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド;

M.26.5c):N-[4-クロロ-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド;

M.26.5d):N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド;

M.26.5e):N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(ジフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド;

M.26.5f):N-[4,6-ジブromo-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド;

M.26.5g):N-[4-クロロ-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-シアノ-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド;

M.26.5h):N-[4,6-ジブromo-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド。

【0204】

M.X.作用モードが未知であるか不確定である殺虫活性化合物、例えばアザジラクチン(azadirachtin)、アミドフルメト(amidoflumet)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ピフェ

10

20

30

40

50

ナゼート(bifenazate)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、キノメチオネート(chino methionat)、クリオライト(cryolite)、ジコホール(dicofol)、フルフェネリム(flufenim)、フロメトキン(flometoquin)、フルエンスルホン(fluensulfone)、フルピラジフロン(flupyradifurone)、ピペロニルブトキシド(piperonyl butoxide)、ピリダリル(pyridaly l)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、スルホキサフロール(sulfoxafloor)、又は化合物

M.X.1:4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-ベンズアミド、又は化合物

M.X.2:シクロプロパン酢酸、1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[2-シクロプロピルアセチル]オキシ]メチル]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-デカヒドロ-12-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-3,6-ジイル]エステル、又は化合物

M.X.3:11-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-12-ヒドロキシ-1,4-ジオキサ-9-アザジスピロ[4.2.4.2]-テトラデカ-11-エン-10-オン、又は化合物

M.X.4:3-(4'-フルオロ-2,4-ジメチルピフェニル-3-イル)-4-ヒドロキシ-8-オキサ-1-アザスピロ[4.5]デカ-3-エン-2-オン、又は化合物

M.X.5:1-[2-フルオロ-4-メチル-5-[(2,2,2-トリフルオロエチル)スルフィニル]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-アミン、又はバチラス・フィルムス(bacillus firmus)に基づく活性物質(Votivo, I-1582)、又は

M.X.6:以下の群から選択される化合物

(E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド;

(E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-5-フルオロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド;

(E/Z)-2,2,2-トリフルオロ-N-[1-[(6-フルオロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]アセトアミド;

(E/Z)-N-[1-[(6-ブromo-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド;

(E/Z)-N-[1-[1-(6-クロロ-3-ピリジル)エチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド;

(E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2-ジフルオロ-アセトアミド;

(E/Z)-2-クロロ-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2-ジフルオロ-アセトアミド;

(E/Z)-N-[1-[(2-クロロピリミジン-5-イル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド; 及び

(E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,3,3,3-ペンタフルオロ-プロパンアミド。

【 0 2 0 5 】

上記のグループMの市販の化合物は、刊行物の中で、The Pesticide Manual, 第15版、C. D.S. Tomlin, British Crop Protection Council(2011年)に見出すことができる。

【 0 2 0 6 】

フタルアミドM.26.1及びM.26.2は、いずれもWO 2007/101540から公知である。アントラニルアミドM.26.3は、WO 2005/077934に記載されている。ヒドラジド化合物M.26.4はWO 2007/043677に記載されている。アントラニルアミドM.26.5a)~M.26.5h)は、WO 2007/006670、WO 2013/024009、及びWO 2013/024010に記載されたように調製することができる。M.X.6に挙げられた化合物は、WO 2012/029672に記載されている。

【 0 2 0 7 】

キノリン誘導体フロメトキン(flometoquin)はWO 2006/013896に示されている。アミノ

10

20

30

40

50

フラノン化合物フルピラジフロン(flupyradi furone)はWO 2007/115644から公知である。スルホキシミン化合物スルホキサフロールはWO 2007/149134から公知である。イソキサゾリン化合物M.X.1はWO 2005/085216に記載されている。ピリピロペン誘導体M.X.2はWO 2006/129714に記載されている。スピロケタール-置換環状ケトエノール誘導体M.X.3はWO 2006/089633から公知であり、ピフェニル-置換スピロ環状ケトエノール誘導体M.X.4はWO 2008/067911から公知である。最後に、トリアゾイルフェニルスルフィド様のM.X.5はWO 2006/043635に記載されており、バチラス・フィルムスに基づく生物学的対照物質はWO 2009/124707に記載されている。

【0208】

本発明による化合物と一緒に使用することができる、以下の活性物質のリストFは、可能な組合せを例示するように意図されているが、それらを限定するものではない。

10

【0209】

F.1)呼吸阻害剤

F.1-1)複合体IIIのQ₀部位阻害剤

ストロビルリン系:アゾキシストロピン、コウメトキシストロピン、コウモキシストロピン、ジモキシストロピン、エネストロブリン、フルオキサストロピン、クレソキシム-メチル、メトミノストロピン、オリサストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、ピラメトストロピン、ピラオキシストロピン、ピリベンカルブ、トリクロピリカルブ/クロロジンカルブ、トリフロキシストロピン、2-[2-(2,5-ジメチル-フェノキシメチル)-フェニル]-3-メトキシ-アクリル酸メチルエステル及び2(2-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-アリリデンアミノオキシメチル)-フェニル)-2-メトキシイミノ-Nメチル-アセトアミド;

20

オキサゾリジンジオン系及びイミダゾリノン系:ファモキサドン、フェンアミドン;

F.1-2)複合体IIの阻害剤(例えば、カルボキサミド系):

カルボキシアニリド系:ペノドアニル、ベンゾピンジフルピル(benzovindiflupyr)、ピルピキサフェン、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フェンヘキサアミド、フルオピラム、フルトールアニル、フラメトピル、イソピラザム、イソチアニル、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルズアミド、チアジニル、2-アミノ-4メチル-チアゾール-5-カルボキサニリド、N-(3',4',5'-トリフルオロピフェニル-2イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4カルボキサミド(フルキサピロキサド)、N-(4'-トリフルオロメチルチオピフェニル-2-イル)-3ジフルオロメチル-1-メチル-1Hピラゾール-4-カルボキサミド、N-(2-(1,3,3-トリメチル-ブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5フルオロ-1H-ピラゾール-4カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(トリフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、1,3-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(トリフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、1,3,5-トリメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、1,3,5-トリメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド;

30

40

F.1-3)複合体IIIのQ_i部位阻害剤:シアゾファミド(cyazofamid)、アミスルプロム(amisu lbrom)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-アセトキシ-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル]2-メチルプロパノエー

50

ト、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[[3-(アセトキシメトキシ)-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル]2-メチルプロパノエート、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-イソブトキシカルボニルオキシ-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル]2-メチルプロパノエート、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[[3-(1,3-ベンゾジオキソル-5-イルメトキシ)-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル]2-メチルプロパノエート、(3S,6S,7R,8R)-3-[[3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2-ピリジニル)カルボミル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-8-(フェニルメチル)-1,5-ジオキソナン-7-イル 2-メチルプロパノエート;

F. I-4)他の呼吸阻害剤(複合体I、脱共役剤):ジフルメトリム(diflumetorim);(5,8-ジフルオロオキサゾリン-4-イル)-{2-[2-フルオロ-4-(4-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)-フェニル]-エチル}-アミン;テクナゼン(tecnazen);アメトクトラジン(ametoctradin);シルチオフアム(silthiofam);ニトロフェニル誘導体:ピナパクリル(binapacryl)、ジノブトン(dinobuton)、ジノカップ(dinocap)、フルアジナム(fluzazinam)、フェリムゾン(ferimzone)、ニトルタル-イソプロピル(nitrthal-isopropyl)、及び有機金属化合物:酢酸-フェンチン(fentin-acetate)、塩化フェンチン(fentin chloride)又は水酸化フェンチン(fentin hydroxide)等のフェンチン塩;

【 0 2 1 0 】

F. II)ステロール生合成阻害剤(SBI殺菌剤)

F. II-1)C14デメチラーゼ阻害剤(DMI殺菌剤、例えばトリアゾール系、イミダゾール系) トリアゾール系:アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブトアニル、パクロブトラゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、1-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-5-チオシアナト-1H-[1,2,4]トリアゾール、2-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-2H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール;

イミダゾール系:イマザリル、ペフラゾアート、オキスポコナゾール、プロクロラズ、トリフルミゾール;

ピリミジン系、ピリジン系及びピペラジン系:フェナリモール、ヌアリモール、ピリフェノキス、トリホリン、1-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-5-チオシアナト-1H-[1,2,4]トリアゾール、2-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-2H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール;

F. II-2)デルタ14-レダクターゼ阻害剤(アミン系、例えばモルホリン系、ピペリジン系) モルホリン系:アルジモルフ(aldimorph)、ドデモルフ(dodemorph)、酢酸ドデモルフ(dodemorph-acetate)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、トリデモルフ(tridemorph);

ピペリジン系:フェンプロピジン(fenpropidin)、ピペラリン(piperalin);

スピロケタールアミン系:スピロキシアミン(spiroxamine);

F. II-3)3-ケトレダクターゼ阻害剤:ヒドロキシアニリド系:フェンヘキサミド(fenhexamid);

【 0 2 1 1 】

F. III)核酸合成阻害剤

F. III-1 RNA、DNA合成

フェニルアミド系又はアシルアミノ酸殺菌剤:ベナラキシル(benalaxyl)、ベナラキシル-M、キララキシル(kiralaxyl)、メタラキシル(metalaxyl)、メタラキシル-M(メフェノキサム(mefenoxam))、オフラース(ofurace)、オキサジキシル(oxadixyl);

イソキサゾール系及びイソチアゾロン系:ヒメキサゾール(hymexazole)、オクチリノン(octhilinone);

F. III-2) DNAトポイソメラーゼ阻害剤:オキソリン酸(oxolinic acid);

F. III-3)ヌクレオチド代謝(例えば、アデノシン-デアミナーゼ)

ヒドロキシ(2-アミノ)-ピリミジン系:ブピリメート(bupirimate);

【 0 2 1 2 】

F. IV)細胞分裂及び又は細胞骨格阻害剤

F. IV-1)チューブリン阻害剤:ベンズイミダゾール系及びチオファネート系:ベノミル(benomyl)、カルベンダジム(carbendazim)、フベリダゾール(fuberidazole)、チアベンダゾール(thiabendazole)、チオファネート-メチル(thiophanate-methyl);

トリアゾロピリミジン系:5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン

F. IV-2)他の細胞分裂阻害剤

ベンズアミド系及びフェニルアセトアミド系:ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、エタボキサム(ethaboxam)、ペンシクロン(pencycuron)、フルオピコリド(fluopicolide)、ゾキサミド(zoxamide);

F. IV-3)アクチン阻害剤:ベンゾフェノン系:メトラフェノン(metrafenopne)、ピリオフェノン(pyriofenone);

【 0 2 1 3 】

F. V)アミノ酸及びタンパク質合成の阻害剤

F. V-1)メチオニン合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン系)

アニリノ-ピリミジン系:シプロジニル(cyprodinil)、メパニピリム(mepaniprim)、ニトラピリン(nitrapyrin)、ピリメタニル(pyrimethanil);

F. V-2)タンパク質合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン系)

抗生物質:プラスチジジン-S(blasticidin-S)、カスガマイシン(kasugamycin)、カスガマイシン塩酸塩水和物、ミルジオマイシン(mildiomycin)、ストレプトマイシン(streptomycin)、オキシテトラサイクリン(oxytetracyclin)、ポリオキシシン(polyoxine)、バリダマイシンA(validamycin A);

【 0 2 1 4 】

F. VI)シグナル伝達阻害剤

F. VI-1)MAP/ヒスチジinkinase阻害剤(例えば、アニリノ-ピリミジン系)

ジカルボキシイミド系:フルオロイミド(fluoroimid)、イプロジオン(iprodione)、プロシミドン(procymidone)、ビクロゾリン(vinclozolin);

フェニルピロール系:フェンピクロニル(fenpiclonil)、フルジオキサニル(fludioxonil);

F. VI-2)Gタンパク質阻害剤:キノリン系:キノキシフェン(quinoxifen);

【 0 2 1 5 】

F. VII)脂質及び膜合成阻害剤

F. VII-1)リン脂質生合成阻害剤

有機リン化合物:エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス;

ジチオラン系:イソプロチオラン(isoprothiolane);

F. VII-2)脂質過酸化

芳香族炭化水素系:ジクロラン(dicloran)、キントゼン(quintozene)、テクナゼン(tecnezene)、トルクロホスメチル(tolclofos-methyl)、ピフェニル、クロロネブ(chloroneb)、エトリジアゾール(etridiazole);

F. VII-3)カルボキシル酸アミド系(CAA殺菌剤)

ケイ皮酸又はマンデル酸アミド系:ジメトモルフ(dimethomorph)、フルモルフ(flumorph)、マンジプロパミド(mandiproamid)、ピリモルフ(pyrimorph);

バリニアミドカーバメート系:ベンチアバリカルブ(benthiavalicarb)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、ピリベンカルブ(pyribencarb)、バリフェナレート(valifenalate)、及びN-(1-(1-(4-シアノ-フェニル)エタンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン酸-(4-フル

10

20

30

40

50

オロフェニル)エステル;

F.VII-4)細胞膜透過性に作用する化合物及び脂肪酸:

1-[4-[4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル]-2-チアゾリル]-1-ピペリジニル]-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、カーバメート系:プロパモカルブ(propamocarb)、プロパモカルブ塩酸塩

F.VII-5)脂肪酸アミドヒドロラーゼ阻害剤:1-[4-[4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル]-2-チアゾリル]-1-ピペリジニル]-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン;

【0216】

F.VIII)多部位に作用する阻害剤

F.VIII-1)無機活性物質:ボルドー(Bordeaux)混合液、酢酸銅、水酸化銅、オキシ塩化銅、塩基性硫酸銅、硫黄;

F.VIII-2)チオカーバメート系及びジチオカーバメート系:フェルバム(ferbam)、マンゼブ(mancozeb)、マンネブ(maneb)、メタム(metam)、メタスルホカルブ(methasulphocarb)、メチラム(metiram)、プロピネブ(propineb)、チラム(thiram)、ジネブ(zineb)、ジラム(ziram);

F.VIII-3)有機塩素化合物(例えば、フタルイミド系、スルファミド系、クロロニトリル系):

アニラジン(anilazine)、クロロタロニル(chlorothalonil)、カプタホール(captafol)、カプタン(captan)、フォルペット(folpet)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、ジクロロフェン(dichlorophen)、フルスルファミド(flusulfamid)、ヘキサクロロベンゼン、ペンタクロロフェノール(pentachlorophenole)及びその塩、フタリド、トリルフルアニド(tolylfluanid)、N-(4-クロロ-2-ニトロ-フェニル)-N-エチル-4-メチル-ベンゼンスルホンアミド;

F.VIII-4)グアニジン系他:グアニジン、ドジン(dodine)、ドジン遊離塩基、グアザチン(guazatine)、グアザチン酢酸塩、イミノクタジン(iminoctadine)、イミノクタジン三酢酸塩、イミノクタジン-トリス(アルベシレート)(iminoctadine-tris(albesilate))、2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトラオン;

F.VIII-5)アントラキノン系:ジチアノン(dithianon);

【0217】

F.IX)細胞壁合成阻害剤

F.IX-1)グルカン合成阻害剤:バリダマイシン、ポリオキシシンB(polyoxin B);

F.IX-2)メラニン合成阻害剤:ピロキロン(pyroquilon)、トリシクラゾール(tricyclazole)、カルプロパミド(carpropamid)、ジシクロメット(dicyclomet)、フェノキサニル(fenoxanil);

【0218】

F.X)植物防御誘導物質

F.X-1)サリチル酸経路:アシベンゾラル-S-メチル(acibenzolar-S-methyl);

F.X-2)その他:プロベナゾール(probenazole)、イソチアニル(isotianil)、チアジニル(tiadinil)、プロヘキサジオン-カルシウム(prohexadione-calcium);

ホスホン酸塩系:ホセチル(fosetyl)、ホセチルアルミニウム(fosetyl-aluminum)、亜リン酸及びその塩;

【0219】

F.XI)未知の作用機序:

プロノポール、キノメチオナト、シフルフェンアミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾクワット、ジフェンゾクワット-メチルスルフェート、ジフェニルアミン、フェンピラザミン、フルメトベル、フルスルファミド、フルチアニル、メタスルホカルブ、ニトラピリン、ニトロサル-イソプロピル、オキサチアピプロリン、オキシシン-銅、プロキンアジド、テブフロキン、テクロフタラム、トリアゾキシド、2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン、N-(シクロプロピルメトキシイミノ

10

20

30

40

50

- (6-ジフルオロ-メトキシ-2,3-ジフルオロ-フェニル)-メチル)-2-フェニルアセトアミド、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(5-ジフルオロメチル-2メチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル-アミド、メトキシ-酢酸6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチル-キノリン-4-イルエステル及びN-メチル-2-{1-[5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]-4-チアゾールカルボキサミド、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3イル]-ピリジン、ピリソオキサゾール、5-アミノ-2-イソプロピル-3-オキソ-4-オルト-トリル-2,3-ジヒドロ-ピラゾール-1カルボチオ酸S-アリルエステル、N-(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)シクロプロパンカルボン酸アミド、5-クロロ-1(4,6-ジメトキシ-ピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール、2-(4-クロロ-フェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-イソオキサゾール-5-イル]-2-プロブ-2-イニルオキシ-アセトアミド;

10

20

【0220】

F.XII) 成長調節剤:

アブシジン酸、アミドクロル(amidochlor)、アンシミドール(ancymidol)、6-ベンジルアミノプリン、ブラシノリド(brassinolide)、ブトラリン(butralin)、クロルメコート(chlormequat)(塩化クロルメコート(chlormequat chloride))、塩化コリン、シクラニリド(cyclanilid)、ダミノジド(daminozide)、ジケグラック(dikegulac)、ジメチピン(dimethipin)、2,6-ジメチルプリジン、エテホン(ethephon)、フルメトラリン(flumetralin)、フルルプリミドール(flurprimidol)、フルチアセット(fluthiacet)、フォルクロルフェヌロン(forchlorfenuron)、ジベレリン酸、イナベンフィド(inabenfide)、インドール-3-酢酸、マレイン酸ヒドラジド、メフルイジド(mefluidide)、メピコート(mepiquat)(塩化メピコート(mepiquat chloride))、ナフタレン酢酸、N6-ベンジルアデニン(N6-benzyladenine)、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、プロヘキサジオン(prohexadione)(プロヘキサジオンカルシウム(prohexadione-calcium))、プロヒドロジャスモン(prohydrojasmon)、チジアズロン(thidiazuron)、トリアペンテノール(triapenthenol)、トリブチルホスホトリチオエート(tributyl phosphorotrthioate)、2,3,5 トリヨード安息香酸、トリネキサパック-エチル(trinexapac-ethyl)、及びウニコナゾール(uniconazole);

30

【0221】

F.XIII) 生物防除剤

アンペロミセス・キスカリス(Ampelomyces quisqualis)(例えば、Intrachem Bio GmbH & Co KG(ドイツ)からのAQ10(登録商標))、アスペルギルス・フラブス(例えば、Syngenta, CHからのAFLAGUARD(登録商標))、アウレオバシジウム・プルランス(Aureobasidium pullulans)(例えば、bio-ferm GmbH(ドイツ)からのBOTECTOR(登録商標))、パチルス・プミルス(例えば、AgraQuest, Inc.(米国)からのSONATA(登録商標)及びBALLAD(登録商標)Plus、NRRL番号B-30087)、パチルス・サブチリス(例えば、AgraQuest, Inc.(米国)からのRHAPSODY(登録商標)、SERENADE(登録商標)MAX及びSERENADE(登録商標)ASO、単離株NRRL番号B-21661)、パチルス・サブチリス変種 アミロリケファシエンス FZB24(例えば、Novozyme Biologicals, Inc.(米国)からのTAEGR0(登録商標))、カンジダ・オレオフィラ I-82(例えば、Ecogen Inc.(米国)からのASPIRE(登録商標))、カンジダ・サイトアナ(例えば、Micro Flo Company(米国)(BASF SE)及びArystaからのBIOCURE(登録商標)(リゾチームとの混合物)及びBIOCOAT(登録商標))、キトサン(例えば、BotriZen Ltd.(ニュージーランド)からのARMO

40

50

UR-ZEN)、クロノスタキス・ロセア f. カテヌラタ(*Clonostachys rosea* f. *catenulata*)、別名グリオクラジウム・カテヌラツム(*Gliocladium catenulatum*) (例えば、単離株J1446:Verdera(フィンランド)からのPRESTOP(登録商標))、コニオチリウム・ミニタンス(*Coniothyrium minitans*) (例えば、Prophyta(ドイツ)からのCONTANS(登録商標))、クリフォネクトリア・パラシティカ(例えば、CNICM(フランス)からのエンドチア・パラシティカ(*Endothia parasitica*))、クリプトコッカス・アルビダス(例えば、Anchor Bio-Technologies(南アフリカ)からのYIELD PLUS(登録商標))、フサリウム・オキシスポルム(*Fusarium oxysporum*) (例えば、S.I.A.P.A.(イタリア)からのBIOFOX(登録商標)、Natural Plant Protection(フランス)からのFUSACLEAN(登録商標))、メツクニコウィア・フクルチコラ(*Metschnikowia fructicola*) (例えば、Agrogreen(イスラエル)からのSHEMER(登録商標))、ミクロドキウム・ジメルム(*Microdochium dimerum*) (例えば、Agrauxine(フランス)からのANTIBOT(登録商標))、フレビオプシス・ギガンテア(*Phlebiopsis gigantea*) (例えば、Verdera(フィンランド)からのROTSOP(登録商標))、シュードザイマ・フロックロサ(*Pseudozyma flocculosa*) (例えば、Plant Products Co.Ltd.(カナダ)からのSPORODEX(登録商標))、ピチウム・オリガンドルム(*Pythium oligandrum*) DV74(例えば、Remeslo SSR0, Biopreparaty(チェコ)からのPOLYVERSUM(登録商標))、レイノウトリア・サクリネンシス(*Reynoutria sachalinensis*) (例えば、Marrone BioInnovations(米国)からのREGALIA(登録商標))、タラロミセス・フラプス(*Talaromyces flavus*) V117b(例えば、Prophyta(ドイツ)からのPROTUS(登録商標))、トリコデルマ・アスペレルム(*Trichoderma asperellum*) SKT-1(例えば、Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.(日本)からのECO-HOPE(登録商標))、T. アトロビリデ(*T. atroviride*) LC52(例えば、Agrimm Technologies Ltd(ニュージーランド)からのSENTINEL(登録商標))、T. ハルジアヌム(*T. harzianum*) T-22(例えば、Firma BioWorks Inc.(米国)からのPLANTSHIELD(登録商標))、T. ハルジアヌム TH35(例えば、Mycontrol Ltd.(イスラエル)からのROOT PRO(登録商標))、T. ハルジアヌム T-39(例えば、Mycontrol Ltd.(イスラエル)及びMakhteshim Ltd.(イスラエル)からのTRICHODEX(登録商標)及びTRICHODERMA 2000(登録商標))、T. ハルジアヌム及びT. ビリデ(*T. viride*) (例えば、Agrimm Technologies Ltd(ニュージーランド)からのTRICHOPEL)、T. ハルジアヌム ICC012及びT. ビリデ ICC080(例えば、Isagro Ricerca(イタリア)からのREMEDIER(登録商標) WP)、T. ポリスポルム(*T. polysporum*) 及びT. ハルジアヌム(例えば、BINAB Bio-Innovation AB(スウェーデン)からのBINAB(登録商標))、T. ストロマティクム(*T. stromaticum*) (例えば、C.E.P.L.A.C.(ブラジル)からのTRICOVAB(登録商標))、T. ビレンス(*T. virens*) GL-21(例えば、Certis LLC(米国)からのSOILGARD(登録商標))、T. ビリデ(例えば、Ecosense Labs.(インド)、Pvt. Ltd.(インド)からのTRIECO(登録商標))、T. Stanes & Co. Ltd.(インド)からのBIO-CURE(登録商標) F)、T. ビリデ TV1(例えば、Agribiotec srl(イタリア)からのT. viride TV1)、ウロクラジウム・オウデマンシー(*Ulocladium oudemansii*) HRU3(例えば、Botry-Zen Ltd.(ニュージーランド)からのBOTRY-ZEN(登録商標))。

【 0 2 2 2 】

上記のグループF中の市販の化合物IIは、公開されている文献中で特にThe Pesticide Manual, 第15版, C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011)中に見出すことができる。これらの調製及び有害な真菌に対する活性は公知である(<http://www.alanwood.net/pesticides/>を参照されたい); これらの物質は市販されている。IUPAC命名法で記載された化合物、それらの調製及び殺真菌活性も公知である(Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP A 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP A 243 970; EP A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP A 1 201 648; EP A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87

10

20

30

40

50

325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657を参照されたい)。

適用

本発明の化合物は、その優れた活性によって、無脊椎有害生物を防除するために使用することができる。

【0223】

動物有害生物(「無脊椎有害生物」とも称される)、すなわち、昆虫、クモ形類及び線虫、植物、植物が生長中の土壌又は水は、本発明の式(1)の化合物又はそれを含んでいる組成物(複数可)と、当技術分野で公知の任意の施用方法により接触させることができる。「接触」という用語自体には、直接接触(本化合物/組成物を動物有害生物又は植物に、通常、植物の葉、茎又は根に直接施用すること)と間接触(本化合物/組成物を動物有害生物又は植物の発生場所に施用すること)の両方が含まれる。

10

【0224】

式(1)の化合物又はそれを含む殺有害生物組成物は、生長植物/作物を殺有害生物有効量の式(1)の化合物と接触させることにより、動物有害生物、とりわけ昆虫、ダニ又はクモ形類による攻撃又は寄生から該植物及び作物を保護するために使用することができる。「作物」という用語は、生長中の作物及び収穫済み作物の両方を指す。

【0225】

本発明の化合物及びそれを含む組成物は、穀類、根菜類、油料作物、野菜、香辛料、観賞植物、例えば、デュラム及び他の小麦の種、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ(飼料トウモロコシ(maize)及び糖トウモロコシ/スイートコーン及び飼料用トウモロコシ(corn))、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、綿花、ひまわり、バナナ、イネ、ナタネ、アブラナ、テンサイ、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、イネ科植物、芝生、ターフ(turf)、飼料用のイネ科植物、トマト、ニラネギ、パンプキン/スクアッシュ、キャベツ、アイスパークレタス、胡椒、キュウリ、メロン、アブラナ属の種、メロン、豆、エンドウ、ニンニク、玉ねぎ、ニンジン、塊茎植物(ジャガイモ等)、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/テンジクアオイ、パンジー及びハウセンカ等の様々な栽培植物に対する多くの昆虫の防除に特に重要である。

20

【0226】

本発明の化合物は、昆虫又は害虫の攻撃から保護すべき植物、植物繁殖材料(種子等)、土壌、表面、資材、もしくは部屋を、殺虫上有効な量の活性化化合物で処理することにより、そのまま使用されるか又は組成物の形態で使用される。施用は、昆虫による、植物、植物繁殖材料(種子等)、土壌、表面、資材もしくは室内の感染前と感染後の両方に行うことができる。

30

【0227】

本発明はまた、動物有害生物、その生息場所、繁殖場所、食物供給、栽培植物、種子、土壌、区域、資材、又は動物有害生物が成長中もしくは成長する可能性がある環境、あるいは動物の攻撃もしくは侵入から保護すべき資材、植物、種子、土壌、表面又は空間を、殺有害生物有効量の少なくとも1種の活性化化合物(1)の混合物に接触させることを含む、動物有害生物を防除する方法も含む。

【0228】

さらに、動物有害生物は、標的とする有害生物、その食物供給、生息場所、繁殖場所、又はその発生場所を、殺有害生物有効量の式(1)の化合物に接触させることによって防除することができる。こうして、施用は、発生場所、生長中の作物、又は収穫済み作物の、有害生物による感染前又は感染後に行うことができる。

40

【0229】

本発明の化合物はまた、有害生物の発生が予期される場所に予防的に施用することもできる。

【0230】

式(1)の化合物はまた、生長中の植物を殺有害生物有効量の式(1)の化合物と接触させることにより、有害生物による攻撃又は寄生から該植物を保護するために使用することもで

50

きる。「接触」という用語自体には、直接接触(本化合物/組成物を有害生物及び/又は植物、通常、植物の葉、茎又は根に直接施用すること)と間接接触(本化合物/組成物を有害生物及び/又は植物の発生場所に施用すること)の両方が含まれる。

【0231】

「発生場所」とは、生息場所、繁殖場所、植物、種子、土壌、区域、資材、あるいは有害生物もしくは寄生生物が成長中又は成長する可能性がある環境を意味する。

【0232】

「植物繁殖材料」という用語は、植物の繁殖に使用することができる、種子等の植物、並びに挿し木及び塊茎(例えば、ジャガイモ)等の植物性の植物材料等の繁殖力のある部分すべてを意味するものと理解されたい。この用語には、種子、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎、苗条、芽及び他の植物部分が含まれる。発芽後もしくは土壌から出芽した後に移植されることになる苗及び若木も包含され得る。これらの植物繁殖材料は、植栽又は移植と同時に又はその前のいずれかに、植物保護用化合物により予防的に処理することができる。

【0233】

「栽培植物」という用語は、品種改良、突然変異誘発又は遺伝子工学により改変されている植物を含むものと理解されたい。遺伝子組換え植物とは、その遺伝子物質が、組換えDNA技法の使用により、自然環境下において交雑育種、突然変異又は自然組換えによって容易に得ることができないように改変した植物のことである。通常、植物のある種の特性を改善するため、1種以上の遺伝子が、遺伝子組換え植物の遺伝子物質に組み込まれている。こうした遺伝的組換えには、以下に限定されないが、例えばグリコシル化による、又はプレニル化、アセチル化もしくはファルネシル化部位又はPEG部位等のポリマー付加による、タンパク質(複数可)(オリゴペプチド又はポリペプチド)の標的翻訳後修飾も含まれる(例えば、Biotechnol Prog. 2001年、7月~8月、17巻(4号)、720~8頁、Protein Eng Des Sel. 2004年、1月17巻(1号)、57~66頁、Nat Protoc. 2007年、2巻(5号)、1225~35頁、Curr Opin Chem Biol. 2006年、10月、10巻(5号)、487~91頁、Epub 2006年、8月28日、Biomaterials.2001年、3月、22巻(5号)、405~17頁、Bioconjug.Chem. 2005年、1月~2月、16巻(1号)、113~21頁に記載されている)。

【0234】

「栽培植物」という用語は、従来の品種改良法又は遺伝子工学法の結果として、特定のクラスの除草剤(ヒドロキシ-フェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤、スルホニル尿素(例えば、US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照されたい)もしくはイミダゾリノン(例えば、US 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照されたい)等のアセト乳酸合成酵素(ALS)阻害剤、グリホセート(例えばWO 92/00377を参照されたい)等のエノールピルピルシキミ酸-3-リン酸合成酵素(EPSPS)阻害剤、グルホシネート(例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246を参照されたい)等のグルタミン合成酵素(GS)阻害剤、又はオキシニル除草剤(例えばUS 5,559,024を参照されたい)等)の施用に対して耐性になっている植物もさらに包含すると理解されたい。いくつかの栽培植物は、従来の品種改良法(突然変異誘発)によって除草剤耐性となっており、例えば、Clearfield(登録商標)夏アブラナ(Canola)は、イミダゾリノン、例えばイマザモックスに耐性である。遺伝子工学法を用いて、ダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビート及びアブラナ等の栽培植物に、グリホセート及びグルホシネート等の除草剤に対する耐性が付与されており、これらの一部はRoundupReady(登録商標)(グリホセート)及びLibertyLink(登録商標)(グルホシネート)という商品名で市販されている。

【0235】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法を使用することにより、1種以上の殺虫性タンパク質、とりわけ細菌属のバチルス属(*Bacillus*)、特にバチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)から公知のもの(エンドトキシ、例えばCryIA(b)、CryIA(c)

10

20

30

40

50

、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)又はCry9c等)、植物殺虫性タンパク質(VIP)、例えばVIP1、VIP2、VIP3又はVIP3A、線虫にコロニーを形成する細菌の殺虫性タンパク質、例えばフォトラブドゥス属の種(*Photorhabdus* spp.)又はゼノラブドゥス属の種(*Xenorhabdus* spp.)、動物により産生される毒素(サソリ毒、クモ毒、ハチ毒又は他の昆虫特異的の神経毒等)、菌類により産生される毒素(ストレプトマイセス(*Streptomyces*)毒等)、植物レクチン(エンドウレクチン又はオオムギレクチン等)、アグルチニン、プロテイナーゼ阻害剤(トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン又はパイン阻害剤等)、リボソーム不活化タンパク質(RIP)(リシン、トウモロコシ-RIP、アプリン、ルフイン、サポリン又はプリオジン等)、ステロイド代謝酵素(3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-IDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤又はHMG-CoA-レダクターゼ等)、イオンチャンネル遮断物(ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネル遮断物等)、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体(ヘリコキニン受容体)、スチルベン合成酵素、ビベンジル合成酵素、キチナーゼ又はグルカナーゼを合成することができる植物もさらに含むものと理解されたい。本発明の文脈において、これらの殺虫性タンパク質又は毒素は、プレトキシン、ハイブリッドタンパク質、切断されているか又はそうでなければ改変されたタンパク質としても明確に理解されたい。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新しい組合せによって特徴付けられる(例えば、W002/015701を参照されたい)。こうした毒素、又はこうした毒素を合成することができる遺伝子組換え植物のさらなる例は、例えば、EP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/018810及びWO 03/052073に開示されている。こうした遺伝子組換え植物を生成する方法は一般に当業者に公知であり、例えば前述の刊行物に記載されている。遺伝子組換え植物に含有されるこれらの殺虫性タンパク質は、これらのタンパク質を産生する植物に、節足動物の特定の分類学的グループ由来の有害生物、特に甲虫類(鞘翅目(*Coleoptera*))、ハエ類(双翅目(*Diptera*))、並びに蝶類及び蛾類(鱗翅目(*Lepidoptera*))、並びに植物寄生性線虫類(線形動物門(*Nematoda*))からの防御力(Protection)を付与する。

【0236】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用により、細菌病原体、ウイルス病原体又は菌病原体に対するそのような植物の抵抗性又は耐性を高める1種以上のタンパク質を合成することができる植物も含むものと理解されたい。こうしたタンパク質の例は、いわゆる「感染特異的タンパク質(pathogenesis-related protein)」(PRタンパク質、例えばEP-A 392 225を参照されたい)、植物病害抵抗性遺伝子(例えば、メキシコの野生ジャガイモであるソラム・ブルボカスタナム(*Solanum bulbocastanum*)由来のジャガイモ疫病菌(*Phytophthora infestans*)に対して作用する抵抗性遺伝子を発現するジャガイモ栽培品種)、又はT4-リゾチーム(例えば、火傷病菌(*Erwinia amylovora*)等の細菌に対して高い抵抗性を有するこれらのタンパク質を合成することができるジャガイモ栽培品種)である。こうした遺伝子組換え植物を生成する方法は一般に当業者に公知であり、例えば前述の刊行物に記載されている。

【0237】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法を使用することにより、生産性(例えば、バイオマス産生、穀物収量、デンプン含量、油含量又はタンパク質含量)、干ばつ、塩分もしくは他の生長制限環境因子に対する耐性、又はそれらの植物の有害生物、及び菌類、細菌もしくはウイルス病原体に対する耐性を高める1種以上のタンパク質を合成することができる植物も含むものと理解されたい。

【0238】

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用により、具体的にはヒト又は動物の栄養を改善するために、改変量の含有物質又は新規含有物質を含有している植物、例えば、健康を促進する長鎖オメガ-3脂肪酸又は不飽和オメガ-9脂肪酸を産生する油料作物(例えば、Nexera(登録商標)アブラナ)も含むものと理解されたい。

【0239】

10

20

30

40

50

「栽培植物」という用語は、組換えDNA技法の使用により、具体的には原料生産の生産量を改善するために、改変量の含有物質又は新規含有物質を含有している植物、例えば多量のアミロペクチンを産生するジャガイモ(例えば、Amflora(登録商標)ジャガイモ)も含むものと理解されたい。

【0240】

一般に、「殺有害生物有効量」とは、標的生物の壊死、死滅、成長遅延、予防、除去、破壊、その他には標的生物の発生及び活動の低減を含めた、標的生物の成長に対する観察可能な効果を実現するために必要な活性成分の量を意味する。殺有害生物有効量は、本発明において使用される様々な化合物/組成物について変えることができる。本組成物の殺有害生物有効量は、所望の殺有害生物効果及び持続時間、天候、標的生物種、発生場所、施用形式等の一般的な条件によっても変動することになる。

10

【0241】

土壌処理の場合、又は有害生物が生息している場所又は巣への施用の場合、本活性成分の量は、100m²当たり0.0001~500g、好ましくは100m²当たり0.001~20gの範囲である。

【0242】

資材を保護する際の慣用的な施用量は、例えば、処理される資材1m²当たり活性化合物0.01g~1000g、望ましくは1m²当たり0.1g~50gである。

【0243】

資材の含浸に使用するための殺虫剤組成物は、一般に、0.001~95重量%、好ましくは0.1~45重量%、より好ましくは1~25重量%の少なくとも一つの忌避剤及び/又は殺虫剤を含有する。

20

【0244】

作物植物の処理に用いる場合、本発明の活性成分の施用量は、1ヘクタール当たり0.1g~4000g、望ましくは1ヘクタール当たり1g~600g又は25g~600g、さらに望ましくは1ヘクタール当たり5g~500g又は50g~500gの範囲内とすることができる。

【0245】

式(1)の化合物は接触(土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物の一部又は動物の一部を介する接触)と食物摂取(餌又は植物部分)のいずれによっても効果がある。

【0246】

本発明の化合物はまた、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、カ、コオロギ又はゴキブリ等の非作物害虫に対して施用することもできる。前記非作物有害生物に対する使用に關すると、式(1)の化合物は、餌組成物中で好ましくは使用される。

30

【0247】

この餌は液状、固形又は半固形の調製物(例えば、ゲル剤)とすることができる。固形の餌は、個々の施用に適した、様々な形状及び形態、例えば粒状、塊状、棒状、円板状に成形することができる。液状の餌は、適切な施用を確実にするために様々なデバイス、例えば、開放容器、スプレー器具、液滴供給源、又は蒸気供給源に充填することができる。ゲル剤は、水性又は油性のマトリクスをベースとすることができ、粘性、水分保持又はエージング特性の点で特定の必需品に配合することができる。

【0248】

組成物中に用いられる餌は、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、カ、コオロギ等の昆虫、又はゴキブリがその餌を食べるように駆り立てるのに十分誘引性のある製品である。この誘引性は、食餌促進剤又は性フェロモンを用いることにより操作することができる。食餌促進剤は、例えば、限定するものではないが、動物及び/又は植物タンパク質(肉粉、魚粉又は血粉、昆虫の一部、卵黄)、動物及び/又は植物由来の脂肪及び油、あるいは有機単糖、有機オリゴ糖もしくは有機多糖(polyorganosaccharide)から、とりわけスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、デンプン、ペクチン、又はさらには糖蜜もしくは蜂蜜からも選択される。果物、作物、植物、動物、昆虫もしくはそれらの特定部分の新鮮な、又は腐りかけの部分も、食餌促進剤としての役割を果たすことができる。性フェロモンはより昆虫特異的であることが知られている。特異的フェロモ

40

50

ンは、文献に記載されており、当業者に公知である。

【0249】

餌組成物における使用に關すると、活性成分の一般的な含量は、活性成分が0.001重量%~15重量%、望ましくは0.001重量%~5重量%である。

【0250】

エアゾール(例えばスプレー缶中)剤、油性スプレー剤又はポンプ用スプレー剤としての式(1)の化合物の製剤は、非専門家の使用者がハエ、ノミ、ダニ、カ又はゴキブリ等の有害生物を防除するのに非常に適している。エアゾール剤の処方物は、本発明の活性化合物、溶媒(低級アルコール(例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン)、沸点範囲が約50~250を有するパラフィン系炭化水素(例えば、灯油)、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素(トルエン、キシレン等)、水)、さらに補助剤(乳化剤(一オレイン酸ソルビトール、3~7molのエチレンオキシドを有するオレイルエトキシレート、脂肪アルコールエトキシレート)、香油(エーテル油、中鎖脂肪酸の低級アルコールによるエステル、芳香族カルボニル化合物等)、適切な場合、安定化剤(安息香酸ナトリウム、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチル等)、及び必要に応じて、噴射剤(プロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素、又はこれらのガスの混合物等)からなるのが好ましい。

10

【0251】

油性スプレー製剤は、噴射剤を使用しない点で、エアゾール処方物とは異なる。スプレー用組成物における使用に關すると、活性成分の含量は、0.001~80重量%、好ましくは0.01~50重量%、最も好ましくは0.01~15重量%である。

20

【0252】

式(1)の化合物及びその各組成物はまた、蚊取線香及び燻し型線香、発煙カートリッジ、気化器プレート又は長期型気化器、さらにまた虫取り紙、虫用パッド又は他の加熱非依存型気化器システムで使用することもできる。

【0253】

式(1)の化合物及びその個々の組成物を用いて、昆虫により媒介される感染症(例えば、マラリア、デング熱及び黄熱病、リンパ性糸状虫症、及びリーシュマニア症)を防除する方法は、小屋及び家屋の表面処理、カーテン、テント、衣料品、蚊帳、ツェツェバ工用捕獲具等の空気噴霧及び浸漬も含む。繊維、織物、ニット製品、不織布、ネット状材料又はホイル及び防水布に施用するための殺虫剤組成物は、本殺虫剤、場合により忌避剤及び少なくとも1種の結合剤を含む混合物を含むのが好ましい。適切な忌避剤には、例えば、N,N-ジエチル-メタ-トルアミド(DEET)、N,N-ジエチルフェニルアセトアミド(DEPA)、1-(3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル)-2-メチルピペリン、(2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)酢酸ラクトン、2-エチル-1,3-ヘキサジオール、インダロン、メチルネオデカンアミド(MNDA)、{(+/-)-3-アリル-2-メチル-4-オキソシクロペンタ-2-(+)-エニル-(+)-trans-クリサンテメート(エスピオトリン)等の昆虫防除用ではないピレスロイド、リモネン、オイゲノール、(+)-ユーカマロール(1)、(-)-1-エピユーカマロールのような植物抽出物から誘導されるか又は植物抽出物と同じものである忌避剤、又はスポッテドガム(*Eucalyptus maculata*)、ハマゴウ(*Vitex rotundifolia*)、パルマローザ(*Cymbopogon martinii*)、シムボポガン・シトラツス(*Cymbopogon citratus*)(レモングラス)、シモボガン・ナルトドゥス(*Cymbopogon nardus*)(シトロネラ)のような植物からの粗製植物抽出物がある。好適な結合剤は、例えば、脂肪酸のビニルエステル(酢酸ビニル及びビニルベルサテート等)、アクリル酸及びメタクリル酸のアルコールエステル(アクリル酸ブチル、2-エチルヘキシルアクリレート、及びアクリル酸メチル等)、モノエチレン性及びジエチレン性不飽和炭化水素(スチレン等)、並びに脂肪族ジエン(ブタジエン等)のポリマー及びコポリマーから選択される。

30

40

【0254】

カーテン及び蚊帳の含浸は、一般に、その繊維材料を殺虫剤のエマルジョン又は分散液

50

に浸漬するか、又は蚊帳上にそれらを噴霧することにより行われる。

【0255】

式(1)の化合物及びその組成物は、木製材料(木、板塀、枕木等)、及び建物(家屋、納屋、工場等)だけではなく、建築材料、家具、皮革、繊維、ビニル用品、電線、及びケーブル等もアリ及び/又はシロアリから保護するため、並びに作物又はヒトに害を加えること(例えば、有害生物が家屋及び公共施設に侵入する場合)からアリ及びシロアリを防除するために使用することができる。式(1)の化合物は、木製材料を保護するために、周囲の土壌表面又は床下の土壌中に施用されるだけではなく、床下コンクリート、床柱、梁、合板、家具等の表面等の製材物品、パーティクルボード、ハーフボード等の木製物品、及び被覆電線、ビニルシート等のビニル物品、スチレン発泡体等の熱絶縁材料にも施用することができ

10

種子処理

式(1)の化合物はまた、種子を害虫から、特に土壌生息害虫から保護するために種子を処理するのに、また土壌有害生物及び葉昆虫に対して、得られた植物の根及び苗条を処理するのにも適している。

【0256】

式(1)の化合物は、土壌有害生物からの種子の保護、並びに土壌有害生物及び葉昆虫に対して、得られた植物の根及び苗条を保護するのに特に有用である。得られた植物の根及び苗条の保護が好ましい。より好ましいのは、刺性昆虫及び吸汁性昆虫から、得られた植物の苗条を保護することであり、この場合、アブラムシからの保護が最も好ましい。

20

【0257】

したがって、本発明は、昆虫、特に土壌昆虫から種子の保護、及び昆虫、特に土壌昆虫及び葉昆虫から苗の根及び苗条を保護する方法であって、播種前及び/又は予備発芽後の種子に一般式(1)の化合物又はその塩を接触させることを含む、方法を含む。特に好ましいのは、植物の根及び苗条が保護される方法であって、より好ましくは、植物の苗条が刺性昆虫及び吸汁性昆虫から保護される方法であり、最も好ましくは、植物の苗条がアブラムシから保護される方法である。

【0258】

種子という用語は、種子、及び以下に限定されないが、まさに種子そのもの、種子片、吸枝、球茎、鱗茎、果実、塊茎、穎果、挿し木、切り苗条等を含むすべての種類の植物繁殖体を包含し、且つ好ましい実施形態では、まさに種子そのものを意味する。

30

【0259】

種子処理という用語は、種子の粉衣、種子コーティング、種子散粉、種子含浸及び種子ペレット化等、当技術分野で公知の適切な種子処理技法すべてを包含する。本発明はまた、活性化合物により被覆されているか、又はそれを含有している種子も含む。

【0260】

「被覆されている及び/又は含有している」という用語は、活性成分の大部分が、施用時に繁殖製品の表面上に存在しているが、多量又は少量の該成分が、施用方法に応じて繁殖製品の内部に浸透し得ることを一般に意味する。前記繁殖製品が(再び)植えられる際に、活性成分を吸収することがある。

40

【0261】

適切な種子は、穀類、根菜類、油料作物、野菜、香辛料、観賞植物の種子、例えば、デュラム及び他の小麦、大麦、オート麦、ライ麦、トウモロコシ(飼料トウモロコシ及び糖トウモロコシ/スイートコーン及び飼料用トウモロコシ)、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、綿花、ひまわり、バナナ、イネ、ナタネ、アブラナ、テンサイ、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、イネ科植物、芝生、ターフ、飼料用のイネ科植物、トマト、ニラネギ、パンプキン/スクアッシュ、キャベツ、アイスバーグレタス、胡椒、キュウリ、メロン、アブラナ属の種、メロン、豆、エンドウ、ニンニク、玉ねぎ、ニンジン、塊茎植物(ジャガイモ等)、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/テンジクアオイ、パン

50

ジー及びハウセンカの種子である。

【0262】

さらに、活性化合物はまた、遺伝子工学法を含む、品種改良による除草剤もしくは殺菌剤又は殺虫剤の作用に耐容する植物由来の種子の処理のためにも使用することができる。

【0263】

例えば、該活性化合物は、スルホニル尿素系、イミダゾリノン系、グルホシネート-アンモニウム又はグリホセート-イソプロピルアンモニウム、及び類似の活性物質(例えば、EP-A 242 236、EP-A 242 246を参照されたい)(WO 92/00377)(EP-A 257 993及びU.S. 5,013,659)からなる群からの除草剤に耐性である植物由来の種子の処理、又は、植物にある種の有害生物に対して耐性をもたらすバチルス・チューリンゲンシス毒素(Bt毒素)を産生する能力を有するトランスジェニック作物植物(例えば、綿花)において使用することができる(EP-A 142 924、EP-A 193 259)。

10

【0264】

さらに、該活性化合物は、既存の植物構成(consist)と比較して、改変特性を有する植物由来の種子を処理するのにも使用することができ、その特性は、例えば、従来 of 育種方法及び/もしくは突然変異体の発生、又は組換え手順によって生じ得る。例えば、植物中で合成されるデンプンを改変するための作物植物の組換え改変(例えばWO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)、又は改変した脂肪酸組成物を有するトランスジェニック作物植物(WO 91/13972)の多くの例が記載されている。

【0265】

活性化合物の種子処理施用は、植物の播種前及び植物の出芽前の種子に噴霧又は散粉することによって行われる。

20

【0266】

種子処理にとりわけ有用な組成物は、例えば、

- A 液剤(SL、LS)
- D エマルション製剤(EW、EO、ES)
- E 懸濁製剤(SC、OD、FS)
- F 水和性顆粒剤及び水溶性顆粒剤(WG、SG)
- G 水和剤及び水溶剤(WP、SP、WS)
- H ゲル製剤(GF)
- I 粉剤(DP、DS)

30

である。

【0267】

従来の種子処理用製剤には、例えば、フロアブル剤SC、液剤LS、乾式処理用粉剤DS、スラリー処理用粉末水和剤WG、粉末水溶剤SP、及びエマルションES及びEC、並びにゲル製剤GFが含まれる。これらの製剤は希釈して又は希釈しないで種子に施用することができる。種子への施用は、播種前に種子に直接行うか、又は種子を予備発芽させた後に行う。

【0268】

好ましい実施形態では、FS剤が種子処理に使用される。通常、FS剤は1~800g/lの活性成分、1~200g/lの界面活性剤、0~200g/lの凍結防止剤、0~400g/lの結合剤、0~200g/lの顔料及び総量が1リットルになる量の溶媒、好ましくは水を含むことができる。

40

【0269】

とりわけ、種子処理のための式(1)の化合物の好ましいFS剤は、活性成分0.1重量%~80重量%(1~800g/l)、少なくとも1種の界面活性剤0.1~20重量%(1~200g/l)、例えば、湿潤剤0.05重量%~5重量%、分散剤0.5重量%~15重量%、凍結防止剤最大20重量%(例えば、5重量%~20重量%)、顔料及び/又は染料0~15重量%(例えば、1重量%~15重量%)、結合剤(粘着剤/付着剤)0~40重量%(例えば、1~40重量%)、場合により増粘剤を最大5重量%(例えば0.1重量%~5重量%)、場合により消泡剤0.1重量%~2重量%、及び場合により殺生物剤、酸化防止剤等の保存剤を例えば0.01重量%~1重量%の量、並びに充填剤/ピヒクルを総量で100重量%になる量を通常含む。

50

【0270】

種子処理用製剤はまた、結合剤、及び場合により着色剤をさらに含んでもよい。

【0271】

結合剤は、処理後の種子への活性物質の付着を改善するために添加することができる。適切な結合剤には、エチレンオキシド又はプロピレンオキシドのようなアルキレンオキシド由来のホモポリマー及びコポリマー、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、及びそれらのコポリマー、エチレン-酢酸ビニルコポリマー、アクリルホモポリマー及びコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミド及びポリエチレンイミン、セルロース、チロース及びデンプンのような多糖、並びにオレフィン/無水マレイン酸コポリマーのようなポリオレフィンホモポリマー及びコポリマー、ポリウレタン、ポリアステル、ポリスチレンホモポリマー及びコポリマーがある。

10

【0272】

場合により、製剤には着色剤も含めることができる。種子処理用製剤に適した着色剤又は染料はローダミンB、C.I.、ピグメントレッド112、C.I.、ソルベントレッド1、ピグメントブルー15:4、ピグメントブルー15:3、ピグメントブルー15:2、ピグメントブルー15:1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド12、ピグメントレッド48:2、ピグメントレッド48:1、ピグメントレッド57:1、ピグメントレッド53:1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッド

20

【0273】

ゲル化剤の例は、カラギーナン(Satiigel(登録商標))である。

【0274】

種子の処理において、式(1)の化合物の施用量は、一般に、種子100kg当たり0.1g~10kg、好ましくは種子100kg当たり1g~5kg、より好ましくは種子100kg当たり1g~1000g、特に種子100kg当たり1g~200gである。

【0275】

したがって、本発明はまた、本明細書で定義した通り、式(1)の化合物、又は農業上有用な(1)の塩を含む種子にも関する。式(1)の化合物又は農業上有用なその塩の量は、一般に、種子100kg当たり0.1g~10kg、好ましくは種子100kg当たり1g~5kg、特に種子100kg当たり1g~1000gで変動することになる。レタス等の特定の作物に関すると、施用量はより多くすることができる。

30

動物の健康

式(1)の化合物、又はそれらの立体異性体、N-オキシド、もしくは獣医学的に許容される塩は、特に、動物の体内及び体表の寄生生物に対処するための使用にも適している。

【0276】

したがって、本発明の目的は、動物の体内及び体表の寄生生物を防除する新たな方法を提供することでもある。本発明の別の目的は、より安全な動物用の殺有害生物剤を提供することである。本発明の別の目的は、さらに、既存の殺有害生物剤より低用量で使用することができる動物用の殺有害生物剤を提供することである。また、本発明の別の目的は、寄生生物の防除が長く残る動物用の殺有害生物剤を提供することである。

40

【0277】

本発明はまた、動物の体内及び体表の寄生生物に対処するための、殺寄生生物有効量の式(1)の化合物、又はそれらの立体異性体、N-オキシド、もしくは獣医学的に許容される塩、及び許容される担体を含む組成物にも関する。

【0278】

本発明はまた、寄生生物による寄生及び感染に対して動物を処置、防除、予防、且つ保護する方法であって、殺寄生生物有効量の式(1)の化合物、又はそれらの立体異性体、N-

50

オキシド、もしくは獣医学的に許容される塩又はそれを含む組成物を、動物に経口、局所もしくは非経口投与するか、あるいは施用することを含む、方法も提供する。

【0279】

本発明はまた、寄生生物による寄生又は感染に対して動物を処置、防除、予防又は保護する組成物を調製する方法であって、殺寄生生物有効量の式(1)の化合物、又はそれらの立体異性体、N-オキシド、もしくは獣医学的に許容される塩又はそれを含む組成物を含めることを含む、上記方法も提供する。

【0280】

農業上の有害生物に対する化合物の活性は、例えば、経口施用の場合に低い非催吐用量、動物との代謝適合性、低毒性及び取扱いの安全性を必要とする、動物の体内及び体表の内部寄生生物及び外部寄生生物の防除に対するそれらの適合性を示唆するものではない。

10

【0281】

驚くべきことに、式(1)の化合物は、動物の体内及び体表の内部寄生生物及び外部寄生生物の対処に適していることが、今や見出された。

【0282】

式(1)の化合物、又はそれらの立体異性体、N-オキシド、もしくは獣医学的に許容される塩、並びにそれらを含む組成物は、温血動物(ヒトを含む)及び魚類を含む動物への侵入及び感染の防除及び予防に使用するのが好ましい。それらは、例えば、ウシ、ヒツジ、イノシシ、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ、トリ、ウサギ、ヤギ、イヌ及びネコ、水牛、ロバ、ダマジカ、トナカイ等の哺乳類において、さらにまた、ミンク、チンチラ及びアライグマ等の毛皮用の動物、メンドリ、ガチョウ、シチメンチョウ及びアヒル等の鳥類、並びにマス、コイ、ウナギ等の淡水魚及び海水魚等の魚類において、寄生及び感染を防除し、且つ予防するのに適している。

20

【0283】

式(1)の化合物、又はそれらの立体異性体、N-オキシド、もしくは獣医学的に許容される塩及びそれらを含む組成物は、イヌ又はネコ等の家庭用動物における寄生及び感染を防除し、且つ予防するために使用するのが好ましい。

【0284】

温血動物及び魚類における寄生には、以下に限定されないが、シラミ、ハジラミ、マダニ、ハナウマバエ、ヒツジシラミバエ、刺咬性ハエ、キンバエ、ハエ、ハエウジ、ツツガムシ、ブヨ、カ及びノミが含まれる。

30

【0285】

式(1)の化合物、又はそれらの立体異性体、N-オキシド、もしくは獣医学的に許容される塩及びそれらを含む組成物は、外部寄生生物及び/又は内部寄生生物の浸透性並びに/あるいは非浸透性防除に適している。それらは、発育段階のすべて又は一部に対して活性である。

【0286】

式(1)の化合物は、外部寄生生物に対処するのにとりわけ有用である。

【0287】

式(1)の化合物は、それぞれ以下の目及び種の寄生生物に対処するのにとりわけ有用である。

40

【0288】

ノミ(ノミ目(Siphonaptera))、例えば、ネコノミ(*Ctenocephalides felis*)、イヌノミ(*Ctenocephalides canis*)、ケオピスネズミノミ(*Xenopsylla cheopis*)、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、スナノミ(*Tunga penetrans*)、及びヨーロッパネズミノミ(*Nosopsyllus fasciatus*)、

【0289】

ゴキブリ(ゴキブリ目(Blattaria-Blattodea))、例えば、チャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、プラテラ・アサヒナエ(*Blattella asahinae*)、ワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、トビイロゴキブリ(*Periplaneta*

50

brunnea)、クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、コウモンゴキブリ(*Periplaneta australasiae*)、及びトウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*)、

【0290】

ハエ、カ(双翅目:Diptera)、例えば、ネツタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、キンイロヤブカ(*Aedes vexans*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペンニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルキアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、ガンビアハマダラカ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレエボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・ロイコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、コガタハマダラカ(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラトウス(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(*Calliphora vicina*)、旧世界ラセンウジバエ(*Chrysomya bezziana*)、新世界ラセンウジバエ(*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マケルラリア(*Chrysomya macellaria*)、サシバエ(*Chrysops discalis*)、クリソプス・シラケア(*Chrysops silacea*)、クリソプス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、ラセンウジバエ(*Cochliomyia hominivorax*)、ヒトクイバエ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、クレックス・ニグリパルプス(*Culex nigripalpus*)、ネツタイイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、イエカ(*Culex tarsalis*)、ハボシカ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ヒフバエ(*Dermatobia hominis*)、ヒメイエバエ(*Fannia canicularis*)、ウマバエ(*Gasterophilus intestinalis*)、ゴロツシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロツシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロツシナ・フスキペス(*Glossina fuscipes*)、グロツシナ・タキノイデス(*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、ウシバエ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノプス・トルレンス(*Leptoconops torrens*)、ルキリア・カプリナ(*Lucilia caprina*)、ヒツジキンバエ(*Lucilia cuprina*)、ヒロズキンバエ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア属の種(*Mansonina* spp.)、イエバエ(*Musca domestica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、サシチョウバエ(*Phlebotomus argentipes*)、ヤブカ(*Psorophora columbiae*)、プソロフォラ・ディスコロール(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimulium mixtum*)、サルコファガ・ハエモルロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* sp.)、シムリウム・ウイッタツム(*Simulium vittatum*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、ウシアブ(*Tabanus bovinus*)、タバヌス・トラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)、及びタバヌス・シミリス(*Tabanus similis*);

【0291】

シラミ(フチラプテラ(Phthiraptera))、例えば、アタマジラミ(*Pediculus humanus capitis*)、コロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ(*Pthirus pubis*)、ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ(*Linnognathus vituli*)、ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)、ニワトリハジラミ(*Menopon gallinae*)、ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)及びケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*)、

ダニ及び寄生性ダニ(ダニ目:Parasitiformes):ダニ(マダニ科:Ixodida)、例えば、クロアシマダニ(*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス(*Ixodes holocyclus*)、西部クロアシマダニ(*Ixodes pacificus*)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)、デルマケントル・アンデルソニ(*Dermacentor andersoni*)、アメリカイヌカクマダニ(*Dermacentor variabilis*)、アメリカキララマダニ(*Amblyomma americanum*)、メキシコ湾岸マダニ(*Amblyomma maculatum*)、オルニトドルス・ヘルムシ(*Ornithodoros hermsi*)、オルニトドルス・ツリカタ(*Ornithodoros turicata*)、並びに寄生性ダニ(トゲダニ亜目:Mesostigmata)、例えば、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)及びワクモ(*Dermanyssus gallinae*) ;

10

20

30

40

50

【 0 2 9 2 】

ケダニ亜目(Actinedida)(Prostigmata)及びコナダニ下目(Acaridida)(コナダニ亜目(As tigmata))、例えば、アカラピス属の種(Acarapis spp.)、ツメダニ属の種(Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア属の種(Ornithocheyletia spp.)、ミオピア属の種(Myobia sp p.)、プソレルガテス属の種(Psorergates spp.)、ニキビダニ属の種(Demodex spp.)、ツ ツガムシ属の種(Trombicula spp.)、リストロホラス属の種(Listrophorus spp.)、アカル ス属の種(Acarus spp.)、ケナガコナダニ属の種(Tyrophagus spp.)、ゴミコナダニ属の種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテ属の種(Hypodectes spp.)、プテロリクス属の種(Pterol ichus spp.)、キュウセンダニ属の種(Psoroptes spp.)、シヨクヒヒゼンダニ属の種(Chor ioptes spp.)、ミミヒゼンダニ属の種(Otodectes spp.)、ヒゼンダニ属の種(Sarcoptes s 10 pp.)、ノトエドレス属の種(Notoedres spp.)、クネミドコプテス属の種(Knemidocoptes s pp.)、シトジテス属の種(Cytodites spp.)、及びラミノシオプテス属の種(Laminosioptes spp.);

【 0 2 9 3 】

バグ(異翅目:Heteropterida):トコジラミ(Cimex lectularius)、ネッタイトコジラミ(C imex hemipterus)、サシガメ(Reduvius senilis)、トリアトマ属の種(Triatoma spp.)、 ロドニウス属の種(Rhodnius spp.)、パンストロギルス属の種(Panstrongylus spp.)、及 びアリラス・クリタツス(Arilus critatus);

シラミ目(Anoplurida)、例えば、ハエマトピヌス属の種(Haematopinus spp.)、ケモノ ホソジラミ属の種(Linognathus spp.)、ペディクルス属の種(Pediculus spp.)、プチルス 属の種(Phthirus spp.)、及びソレノポテス属の種(Solenopotes spp.); 20

【 0 2 9 4 】

ハジラミ目(Mallophagida)(マルツノハジラミ(Arnbllycerina)亜目及びホソツノハジラ ミ亜目(Ischnocerina))、例えば、トリメノポン属の種(Trimenopon spp.)、メノポン属の 種(Menopon spp.)、トリノトン属の種(Trinoton spp.)、ボビコラ属の種(Bovicola spp.)、 ウェルネキエラ属の種(Werneckiella spp.)、レピケントロン属の種(Lepikentron spp.)、 トリコデクテス属の種(Trichodectes spp.)、及びフェリコラ属の種(Felicola spp.);

【 0 2 9 5 】

回虫線形動物:

ワイプワーム(Wipeworm)及び旋毛虫(毛管目(Trichosyringida))、例えば、毛形虫科(Tr ichinellidae)(旋毛虫属の種(Trichinella spp.))、(鞭虫科(Trichuridae))(トリクリス 属の種(Trichuris spp.)、カピラリア属の種(Capillaria spp.)); 30

桿線虫目(Rhabditida)、例えば、ラブディチス属の種(Rhabditis spp.)、糞線虫属の種 (Strongyloides spp.)、ヘリセファロブス属の種(Helicephalobus spp.);

円虫目(Strongylida)、例えば、ストロンギルス属の種(Strongylus spp.)、アンシロス トマ属の種(Ancylostoma spp.)、アメリカ鉤虫(Necator americanus)、ブノストマム属の 種(Bunostomum spp.)(十二指腸虫)、トリコストロンギルス属の種(Trichostrongylus spp .)、捻転胃虫(Haemonchus contortus)、オステルタジア属の種(Ostertagia spp.)、コー ペリア属の種(Cooperia spp.)、ネマトディルス属の種(Nematodirus spp.)、ジクチオカ ウルス属の種(Dictyocaulus spp.)、シアトストマ属の種(Cyathostoma spp.)、エソファ 40 ゴストーム属の種(Oesophagostomum spp.)、ブタ腎虫(Stephanurus dentatus)、オルラ ヌス属の種(Ollulanus spp.)、チャベルチア属の種(Chabertia spp.)、ブタ腎虫(Stephan urus dentatus)、開嘴虫(Syngamus trachea)、アンキロストマ属の種(Ancylostoma spp.)、 ウンキナリア属の種(Uncinaria spp.)、グロボセファルス属の種(Globocephalus spp.)、 ネカトル属の種(Necator spp.)、メタストロンギルス属の種(Metastrongylus spp.)、 毛細肺虫(Muellerius capillaris)、プロトストロンギルス属の種(Protostrongylus spp.)、 アンギオストロンギルス属の種(Angiostrongylus spp.)、パレラフォストロンギルス 属の種(Parelaphostrongylus spp.)、ネコ肺虫(Aleurostrongylus abstrusus)、及び腎虫 (Dioctophyma renale);

腸管寄生回虫(回虫目:Ascaridida)、例えば、ヒト回虫(Ascaris lumbricoides)、ブタ 50

回虫(*Ascaris suum*)、ニワトリ回虫(*Ascaridiagalli*)、ウマ回虫(*Parascaris equorum*)、蟯虫(*Enterobius vermicularis*) (線虫)、イヌ回虫(*Toxocara canis*)、回虫(*Toxascaris leonine*)、スクルジャピネマ属の種(*Skrjabinema* spp.)、及びウマ蟯虫(*Oxyuris equi*);

カマラス目(*Camallanida*)、例えば、メジナ虫(*Dracunculus medinensis*) (メジナチュウ);

旋尾線虫目(*Spirurida*)、例えば、テラジア属の種(*Thelazia* spp.)、ウケレリア属の種(*Wuchereria* spp.)、ブルギア属の種(*Brugia* spp.)、オンコセルカ属の種(*Onchocerca* spp.)、ディロフィラリア属の種(*Dirofilaria* spp.)、ディペタロネーマ属の種(*Dipetalone ma* spp.)、セタリア属の種(*Setaria* spp.)、エレオフォラ属の種(*Elaeophora* spp.)、血色食道虫(*Spirocerca lupi*)、及びハプロネーマ属の種(*Habronema* spp.);

鉤頭虫(*Acanthocephala*)、例えば、アカントケファルス属の種(*Acanthocephalus* spp.)、大鉤頭虫(*Macracanthorhynchus hirudinaceus*)、及びオンシコーラ属の種(*Oncicola* spp.);

【0296】

プラナリア(扁形動物:Plathelminthes):

吸虫(Trematoda)、例えば、肝蛭属の種(*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス・マグナ(*Fascioloides magna*)、肺吸虫属の種(*Paragonimus* spp.)、ジクロコエリウム属の種(*Dicrocoelium* spp.)、肥大吸虫(*Fasciolopsis buski*)、肝吸虫(*Clonorchis sinensis*)、シストソーマ属の種(*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルツ属の種(*Trichobilharzia* spp.)、吸虫(*Alaria alata*)、肺吸虫属の種(*Paragonimus* spp.)、及びナノサイエテス属の種(*Nanocyetes* spp.);

条虫(Cercomeromorpha)、特に条虫綱(Cestoda)(条虫)、例えば、広節裂頭条虫属の種(*Diphyllobothrium* spp.)、テニア属の種(*Tenia* spp.)、エキノコックス属の種(*Echinococcus* spp.)、イヌ条虫(*Dipylidium caninum*)、ムルチセプス属の種(*Multiceps* spp.)、膜様条虫属の種(*Hymenolepis* spp.)、有線条虫属の種(*Mesocestoides* spp.)、ヴァンピロレピス属の種(*Vampirolepis* spp.)、モニエジア属の種(*Moniezia* spp.)、アノプロケファラ属の種(*Anoplocephala* spp.)、スピロメトラ属の種(*Spirometra* spp.)、アノプロケファラ属の種(*Anoplocephala* spp.)、及び膜様条虫属の種(*Hymenolepis* spp.)。

【0297】

式Iの化合物、及びそれを含む組成物は、双翅目、隠翅目、及びマダニ亜目の有害生物の防除に特に有用である。

【0298】

さらに、蚊を駆除するための式Iの化合物及びそれを含む組成物の使用が、とりわけ好ましい。

【0299】

ハエを駆除するための式Iの化合物及びそれを含む組成物の使用が、本発明のさらに好ましい実施形態である。

【0300】

さらには、ノミを駆除するための式Iの化合物及びそれを含む組成物の使用が、とりわけ好ましい。

【0301】

ダニを駆除するための式Iの化合物及びそれを含む組成物の使用が、本発明のさらに好ましい実施形態である。

【0302】

式Iの化合物はまた、内部寄生生物(線形動物門線虫、鉤頭虫及びプラナリア)を駆除するのにとりわけ有用である。

【0303】

投与は、予防と治療の両方で実施することができる。

【0304】

本活性化化合物の投与は、直接、又は適切な調製物の形態で、経口的に、局所的に/経皮

10

20

30

40

50

的に若しくは非経口的に行われる。

【0305】

温血動物に経口投与するために、式Iの化合物は、飼料、プレミックス飼料、濃厚飼料、丸剤、液剤、ペースト剤、懸濁剤、ドレンチ剤、ゲル製剤、錠剤、ポーラス剤、及びカプセル剤として製剤化することができる。さらに、式Iの化合物を飲料水に入れて動物に投与することができる。経口投与の場合、選択される剤形は、1日あたり動物の体重の0.01mg/kg ~ 100mg/kg、好ましくは1日あたり動物の体重の0.5mg/kg ~ 100mg/kgの式Iの化合物を動物に与えるべきである。

【0306】

或いは、式Iの化合物は、非経口的に、例えば、第一胃内、筋肉内、静脈内、又は皮下注射により動物に投与してもよい。皮下注射の場合、式Iの化合物を生理的に許容される担体中に分散又は溶解してもよい。或いは、式Iの化合物は、皮下投与用のインプラントに製剤化されてもよい。さらに、式Iの化合物を動物に経皮的に投与してもよい。非経口投与の場合、選択される剤形は1日あたり動物の体重の0.01mg/kg ~ 100mg/kgの式Iの化合物を動物に与えるべきである。

10

【0307】

式Iの化合物はまた、ディップ剤、粉末、散剤、首輪、メダル、スプレー剤、シャンプー、スポットオン式及びポアオン式製剤、及び軟膏、又は水中油型若しくは油中水型乳剤の形態で、動物に局所的に施用してもよい。局所施用の場合、ディップ剤及びスプレー剤は、通常0.5ppm ~ 5,000ppm、好ましくは1ppm ~ 3,000ppmの式Iの化合物を含有する。さら

20

【0308】

適切な調製物は以下のものである：

- 液剤(経口液剤、希釈後に経口投与するための濃縮剤、皮膚上又は体腔内に使用するための液剤、ポアオン式製剤、ゲル製剤など)；
 - 経口又は経皮投与用の乳剤及び懸濁剤；半固形調製物；
 - 活性化化合物が軟膏基剤、又は水中油型若しくは油中水型乳剤基剤中で処理されている製剤；
 - 固形調製物(散剤、プレミックス剤又は濃縮剤、粒剤、ペレット剤、錠剤、ポーラス剤、カプセル剤；エアゾール剤及び吸入剤、並びに活性化化合物含有成形品など)
- である。

30

【0309】

注射に適した組成物は、活性成分を適当な溶媒に溶解し、場合により酸、塩基、緩衝塩、保存剤、及び可溶化剤などのさらなる成分を添加することにより調製される。この液剤を濾過して、滅菌充填する。

【0310】

適切な溶媒は、水、エタノール、ブタノール、ベンジルアルコール、グリセロール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコールなどのアルカノール、N-メチル-ピロリドン、2-ピロリドン、及びそれらの混合物などの生理的に許容される溶媒である。

40

【0311】

活性化化合物は、場合により、注射用に適した、生理的に許容される植物油又は合成油に溶解することができる。

【0312】

適切な可溶化剤は、主溶媒中に活性化化合物が溶解するのを促進する溶媒、又は活性化化合物の沈殿を防止する溶媒である。例は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチル化ヒマシ油、及びポリオキシエチル化ソルピタンエステルである。

【0313】

適切な保存剤は、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステル、及びn-ブタノールである。

50

【0314】

経口液剤は直接投与される。濃縮剤は使用濃度に事前に希釈した後、経口投与される。経口液剤及び濃縮剤は、当分野の現在の技術に従って、及び注射用液剤について上述した通り調製されるが、滅菌手順は必要でない。皮膚上で用いる液剤は皮膚に垂らすか、塗り広げるか、こすり付けるか、振りかけるか、又はスプレーする。皮膚上で用いる液剤は、当分野の現在の技術に従って、また注射用液剤について上述した方法に従って調製されるが、滅菌手順は必要でない。

【0315】

さらなる適切な溶媒は、ポリプロピレングリコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、酢酸エチル又は酢酸ブチル、安息香酸ベンジルなどのエステル、アルキレングリコールアルキルエーテル(例えば、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル)などのエーテル、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン、芳香族炭化水素、植物油及び合成油、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、トランスクトール(transcutol)、ソルケタル(solketal)、プロピレンカーボネート、及びそれらの混合物である。

10

【0316】

調製中に、増粘剤を加えると有利なことがある。適切な増粘剤は、ベントナイト、コロイドケイ酸、及びモノステアリン酸アルミニウムなどの無機増粘剤、セルロース誘導体、ポリビニルアルコール、及びそれらのコポリマー、アクリレート並びにメタクリレートなどの有機増粘剤である。

20

【0317】

ゲル製剤は皮膚に塗布するか又は塗り広げるか、或いは体腔内に注入する。ゲル製剤は、注射用液剤の場合に記載した通りに調製した液剤を、軟膏の様な粘稠度を有する透明な材料になるのに十分な増粘剤で処理することにより調製される。用いる増粘剤は、上に挙げた増粘剤である。

【0318】

ポアオン製剤は、限られた皮膚領域に注ぐか又はスプレーし、活性化合物が皮膚を浸透して全身的に作用する。

【0319】

ポアオン製剤は、活性化合物を、適当な皮膚適合性溶媒又は混合溶媒中に溶解、懸濁、又は乳化することにより調製される。適当な場合、着色剤、生体吸収促進物質、抗酸化剤、光安定剤、粘着剤などの他の助剤が添加される。

30

【0320】

適切な溶媒は、水、アルカノール、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセロール、芳香族アルコール(ベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノールなど)、エステル(酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジルなど)、エーテル(ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテルなどのアルキレングリコールアルキルエーテルなど)、ケトン(アセトン、メチルエチルケトンなど)、環状カーボネート(プロピレンカーボネート、エチレンカーボネートなど)、芳香族及び/又は脂肪族炭化水素、植物油又は合成油、DMF、ジメチルアセトアミド、n-アルキルピロリドン(メチルピロリドン、n-ブチルピロリドン又はn-オクチルピロリドン、N-メチルピロリドン、2-ピロリドンなど)、2,2-ジメチル-4-オキシ-メチレン-1,3-ジオキサラン及びグリセロールホルムールである。

40

【0321】

適切な着色剤は、動物に使用が認可されており、溶解可能又は懸濁可能な、すべての着色剤である。

【0322】

適切な吸収促進物質は、例えば、DMSO、拡散用オイル(spreading oil)(ミリスチン酸イソプロピル、ジプロピレングリコールペラルゴネートなど)、シリコンオイル、及びそのポリエーテルとのコポリマー、脂肪酸エステル、トリグリセリド、脂肪族アルコールである。

50

【0323】

適切な抗酸化剤は、亜硫酸塩又はメタ重亜硫酸塩(メタ重亜硫酸カリウムなど)、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、トコフェロールである。

【0324】

適切な光安定剤は、例えばノバンチソール酸である。

【0325】

適切な粘着剤は、例えば、セルロース誘導体、デンプン誘導体、ポリアクリレート、アルギネート、ゼラチンなどの天然ポリマーである。

【0326】

乳剤は、経口的に、経皮的に、又は注射剤として投与することができる。

【0327】

乳剤は、油中水型又は水中油型のいずれかである。

【0328】

乳剤は、活性化化合物を疎水性相又は親水性相のいずれかに溶解し、これを適当な乳化剤、及び適切な場合、着色剤、吸収促進物質、保存剤、抗酸化剤、光安定剤、粘度向上物質などの他の助剤の助けにより、他方の相の溶媒と共に均質にすることにより調製される。

【0329】

適切な疎水性相(油)は以下のものである：

流動パラフィン、シリコーンオイル、ゴマ油、扁桃油、ヒマシ油などの天然植物油、カプリル酸/カプリン酸ピグリセリドなどの合成トリグリセリド、鎖長 $C_8 \sim C_{12}$ の植物脂肪酸又は他の特別に選択された天然脂肪酸とのトリグリセリド混合物、やはりヒドロキシル基も含むことができる飽和又は不飽和脂肪酸の部分グリセリド混合物、 $C_8 \sim C_{10}$ 脂肪酸のモノ及びジグリセリド、

ステアリン酸エチル、アジピン酸ジ-n-ブチル、ラウリン酸ヘキシル、ジプロピレングリコールペルラルゴネート(perlargonate)などの脂肪酸エステル、中鎖分枝脂肪酸と鎖長 $C_{16} \sim C_{18}$ の飽和脂肪アルコールとのエステル、ミスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、鎖長 $C_{12} \sim C_{18}$ の飽和脂肪アルコールのカプリル酸/カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、合成アヒル尾腺脂などのワックス様脂肪酸エステル、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、及び後者のアジピン酸ジイソプロピルに関連するエステル混合物、イソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコールなどの脂肪アルコール、並びにオレイン酸及びその混合物などの脂肪酸である。

【0330】

適切な親水性相は、水、プロピレングリコール、グリセロール、ソルビトールなどのアルコール、及びそれらの混合物である。

【0331】

適切な乳化剤は、

非イオン性界面活性剤、例えば、ポリエトキシ化ヒマシ油、ポリエトキシ化ソルビタンモノオレエート、ソルビタンモノステアレート、一ステアリン酸グリセロール、ステアリン酸ポリオキシエチル、アルキルフェノールポリグリコールエーテル；

両性界面活性剤(N-ラウリル-p-イミノジプロピオン酸二ナトリウム又はレシチンなど)；

陰イオン性界面活性剤(ラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコールエーテル硫酸塩、モノ/ジアルキルポリグリコールエーテルオルトリン酸エステルのモノエタノールアミン塩など)；

陽イオン性界面活性剤(cation-active surfactant)(塩化セチルトリメチルアンモニウムなど)

である。

【0332】

10

20

30

40

50

さらなる適切な助剤は、粘度を向上させて乳剤を安定化する物質(カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース及び他のセルロース、並びにデンプン誘導体、ポリアクリレート、アルギネート、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテルと無水マレイン酸とのコポリマー、ポリエチレングリコール、ワックス、コロイドケイ酸、又は上記物質の混合物など)である。

【0333】

懸濁剤は、経口的に又は局所的/経皮的に投与することができる。懸濁剤は、活性化合物を懸濁化剤中に、適宜、湿潤剤、着色剤、生体吸収促進物質、保存剤、抗酸化剤、光安定剤などの他の助剤を添加して、懸濁することにより調製される。

【0334】

液状懸濁化剤は、すべての均質溶媒及び混合溶媒である。

【0335】

適切な湿潤剤(分散剤)は、上記した乳化剤である。

【0336】

言及することができる他の助剤は、上記したものである。

【0337】

半固形調製物は、経口的又は局所的/経皮的に投与することができる。それらは、粘度がより高いことでのみ、上記の懸濁剤及び乳剤と異なる。

【0338】

固形調製物の製造に関すると、活性化合物を適当な賦形剤と混合し、適宜、助剤を添加して、所望の形態にする。

【0339】

適切な賦形剤は、生理的に許容される、あらゆる固体の不活性物質である。使用されるものは、無機及び有機物質である。無機物質は、例えば、塩化ナトリウム、炭酸カルシウムなどの炭酸塩、炭酸水素塩、酸化アルミニウム、酸化チタン、ケイ酸、粘質土、沈降又はコロイドシリカ、又はリン酸塩がある。有機物質は、例えば、糖、セルロース、食物及び飼料(粉乳、動物の粗粉、穀物の粗粉及び破砕物、デンプンなど)がある。

【0340】

適切な助剤は、上で言及している保存剤、抗酸化剤、及び/又は着色剤である。

【0341】

他の適切な助剤は、滑沢剤、及び滑剤(ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、タルク、ベントナイトなど)、崩壊促進剤(デンプン又は架橋ポリビニルピロリドンなど)、結合剤(デンプン、ゼラチン、又は線状ポリビニルピロリドンなど)、及び乾燥結合剤(微結晶性セルロースなど)である。

【0342】

一般的に、「殺寄生生物有効量」は、ネクローシス、死滅、遅延、予防、及び除去、破壊、又はさもなければ標的生物の出現及び活性を減少させるという効果を含む、成長に対する観察可能な効果を達成するのに必要とされる活性成分の量を意味する。殺寄生生物有効量は、本発明で使用される化合物/組成物に対して変動し得る。組成物の殺寄生生物有効量もまた、一般的な条件、例えば所望の殺寄生生物効果及び継続時間、標的種、適用モードなどに従い変動することになる。

【0343】

本発明において使用することができる組成物は、一般に約0.001~95%の式Iの化合物を含むことができる。

【0344】

一般に、式Iの化合物を1日あたり0.5mg/kg~100mg/kg、好ましくは1日あたり1mg/kg~50mg/kgの総量で施用するのが有益である。

【0345】

即時使用可能な調製物は、寄生生物、好ましくは外部寄生生物に対して作用する本化合物を、10ppm~80重量%、好ましくは0.1~65重量%、より好ましくは1~50重量%、最も好ま

10

20

30

40

50

しくは5~40重量%の濃度で含有する。

【0346】

使用前に希釈される調製物は、外部寄生生物に対して作用する本化合物を、0.5~90重量%、好ましくは1~50重量%の濃度で含有する。さらに、本調製物は、内部寄生生物に対して作用する式Iの化合物を、10ppm~2重量%、好ましくは0.05~0.9重量%、非常に特に好ましくは0.005~0.25重量%の濃度で含む。

【0347】

本発明の好ましい実施形態では、式Iの化合物を含む組成物は、経皮的/局所的に施用される。

【0348】

さらなる好ましい実施形態では、局所施用は、化合物を含有する成形品(首輪、メダル、耳タグ、身体の一部に固定するためのバンド、及び接着性ストリップ及びフィルムなど)の形態で実施される。

【0349】

一般には、処置される動物の体重に対して10mg/kg~300mg/kg、好ましくは20mg/kg~200mg/kg、最も好ましくは25mg/kg~160mg/kgの総量で、式Iの化合物を3週間にわたり放出する固形製剤を施用するのが有益である。

【0350】

成形品を製造する場合、熱可塑性プラスチック及び軟質プラスチック、並びにエラストマー及び熱可塑性エラストマーが使用される。適切なプラスチック及びエラストマーは、式Iの化合物と十分な適合性を示すポリビニル樹脂、ポリウレタン、ポリアクリレート、エポキシ樹脂、セルロース、セルロース誘導体、ポリアミド及びポリエステルである。プラスチック及びエラストマーの詳細なリスト並びに成形品の調製手順は、例えばWO 03/086075に記載されている。

【実施例】

【0351】

これから、以下の実施例により、本発明になんら限定を設けることなく、本発明をより詳細に例示する。

【0352】

化合物は、例えば、連結した高速液体クロマトグラフィー/質量分析法(HPLC/MS)により、¹H-NMR及び/又はそれらの融点により特徴付けることができる。

【0353】

以下の分析手順を使用した。

方法A: HPLC分析用カラム1:RP-18カラムChromolith Speed ROD(Merck KgaA社から、ドイツ)。

溶出:40 において、5分間で、アセトニトリル+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)/水+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)を5:95から95:5の比にする。

方法B: UPLC分析用カラム:Phenomenex Kinetex 1.7 μm XB-C18 100A; 50×2.1mm; 移動相:A:水+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA); B:アセトニトリル+0.1% TFA; 勾配:1.50分間で5-100% B; 100% Bを0.20分間; 流速:60 において、0.8-1.0mL/分を1.50分間。

MS方法:ESIポジティブ

¹H-NMR、シグナルは、テトラメチルシランに対する化学シフト(ppm)、それらの多重度、及びそれらの積分値(所与の水素原子の相対数)により特徴付ける。シグナルの多重度を特徴付けるために、以下の略語を使用する。m=多重線、q=四重線、t=三重線、d=二重線及びs=一重線。

【0354】

使用した略語は次の通りである:hは時間、minは分、及び室温は20~25 である。

【0355】

調製例は、スキーム2の一般的合成方法に開示したようにBOC-保護を用いるか、又はスキーム2の一般的合成方法に開示したようにスルフィミンラジカルの1つとしてトリメチル

10

20

30

40

50

シリルエチルを用い、続いてフッ化テトラブチルアンモニウムで脱保護する、W001/70671に記載された方法と同様にして合成した。

【0356】

例として、化合物1~22及び1~28の合成を以下に示す：

ステップ1：トリメチル(2-メチルスルファニルエチル)シランの合成

ビニルトリメチルシラン (25.0 g, 36.2 mL, 250 mmol, 1.2 当量) にAIBN (0.34 g, 2.1 mmol, 1 mol-%) を室温で添加した。この混合液を加熱還流し、メタンチオール (10 g, 12 mL, 210 mmol) を3時間かけてバブリングさせた。最終温度が73℃に達した後、混合液を冷却し、真空蒸留で精製し (30 mbar, 64-66℃)、標題の化合物を得た (24.1 g, 77%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = -0.01 (m, 9H), 0.85 (m, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.51 (m, 2H)。

【0357】

ステップ2：[メチル(2-トリメチルシリルエチル)-4-スルファニリデン]アンモニウム硫酸塩の合成

ナトリウムメチラート (4.77 g, 26.5 mmol, 1.1 当量) のメタノール (20 mL) 溶液に、トリメチル(2-メチルスルファニルエチル)シラン (3.93 g, 26.5 mmol, 1.1 当量) を0-5℃で添加し、その温度で30分間維持した。5℃に冷却した後、ヒドロキシルアミン 0-スルホン酸 (2.72 g, 24.1 mmol, 1.0 当量) を一度に添加し、混合液を0-5℃で5時間攪拌し、一晩で室温に戻した。沈殿物をろ過により除去し、ろ液を真空下で濃縮して標題の化合物 (3.7 g) を得、これをそのまま次のステップで使用した。

【0358】

ステップ3：2-アミノ-5-クロロ-3-メチル-N-[メチル(2-トリメチルシリルエチル)-4-スルファニリデン]ベンズアミドの合成

6-クロロ-8-メチル-1H-3,1-ベンゾオキサジン-2,4-ジオン (2.64 g, 12.5 mmol, 1 当量) および [メチル(2-トリメチルシリルエチル)-4-スルファニリデン]アンモニウム硫酸塩 (ステップ2で得られた3.7 g) のDMSO (8 mL) 中の混合物に、トリエチルアミン (1.9 mL, 1.4 g, 14 mmol, 1.10 当量) を室温で添加し、一晩攪拌した。得られた反応混合液を氷水中に攪拌して入れ、ジクロロメタンで抽出した。有機相を合わせて硫酸ナトリウム上で乾燥し、ろ過し、真空で濃縮した。残渣をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーで精製して標題の化合物を得た (3.4 g, 82%)。

HPLC-MS (方法 B): 1.066 分, M = 331.3

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 0.10 (s, 9H), 0.80 (dt, 1H), 1.01 (dt, 1H), 2.13 (s, 3H), 2.71 (s, 1H), 2.98 (dt, 1H), 3.14 (dt, 1H), 6.00 (br. s, 2H), 7.07 (s, 1H), 7.94 (s, 1H)。

【0359】

ステップ4：N-[4-クロロ-2-メチル-6-[[メチル(2-トリメチルシリルエチル)-4-スルファニリデン]カルバモイル]フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミドの合成

2-アミノ-5-クロロ-3-メチル-N-[メチル(2-トリメチルシリルエチル)-4-スルファニリデン]ベンズアミド (1.7 g, 5.1 mmol, 1 当量) のジクロロメタン (25 mL) 溶液にK₂CO₃ を添加し、混合液を0-5℃に冷却した。2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボニルクロリド (2.07 g, 6.68 mmol, 1.3 当量) のジクロロメタン (25 mL) 溶液を添加し、氷浴を取り除いた。室温で1時間放置した後、氷水を添加し、相分離させた。水相からジクロロメタンで抽出し、有機相を合わせて乾燥させ (Na₂SO₄)、濃縮した。残渣をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにかけて標題の化合物 (2.3 g, 75%) を得た。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 0.10 (s, 9H), 0.87 (dt, 1H), 0.96 (dt, 1H), 2.18 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.00 (dt, 1H), 3.15 (dt, 1H), 7.20-7.30 (m, 2H), 7.40 (m, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.49 (m, 1H), 11.66 (br. s, 1H)。

【0360】

ステップ5 : N-[4-クロロ-2-メチル-6-(メチルスルファニルカルバモイル)フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド (表S.1の化合物 1-22)の合成

N-[4-クロロ-2-メチル-6-[[メチル(2-トリメチルシリルエチル)-⁴-スルファニリデン]カルバモイル]フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド(1.10 g, 1.82 mmol)のTHF(15 mL)溶液に、フッ化テトラブチルアンモニウム(1 MのTHF溶液2.18 mL, 2.18 mmol, 1.2当量)の溶液を0-5 で添加した。この温度で1.5時間放置した後、混合液を真空下で濃縮し、酢酸エチルおよび水の中にとった。相分離させた後、有機相を乾燥させ(Na₂SO₄)、濃縮した。残渣をシリカゲル上で精製して標題の化合物(700 mg, 76%)を得た。

¹H-NMR(360 MHz, CDCl₃): = 2.21 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 6.88 (m, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.43 (m, 1H), 7.89 (m, 1H), 8.49 (m, 1H), 9.77 (m, 1H)。

【0361】

ステップ6 : N-[4-クロロ-2-メチル-6-(メチルスルフィニルカルバモイル)フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド (表S.1の化合物 1-28)の合成

アセトニトリル(8 mL)中のN-[4-クロロ-2-メチル-6-(メチルスルファニルカルバモイル)フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド(820 mg, 1.63 mmol, 1.25当量)の懸濁液に、mCPBA(321 mg, 純度70% 1.30 mmol)のアセトニトリル(3 mL)溶液を0-5 でゆっくり添加した。この温度で1時間放置した後、沈殿物をろ過によって除去し、石油エーテル(petrol ether)で洗浄し、乾燥した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーで精製して標題の化合物(570 mg, 使用した酸化剤に基づいて84%)を得た。

¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆): = 2.21 (s, 3H), 2.68 (s, 3H), 7.44 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.22 (d, 1H), 8.52 (d, 1H), 10.50 (br. s, 1H), 11.28 (br. s, 1H)。

【0362】

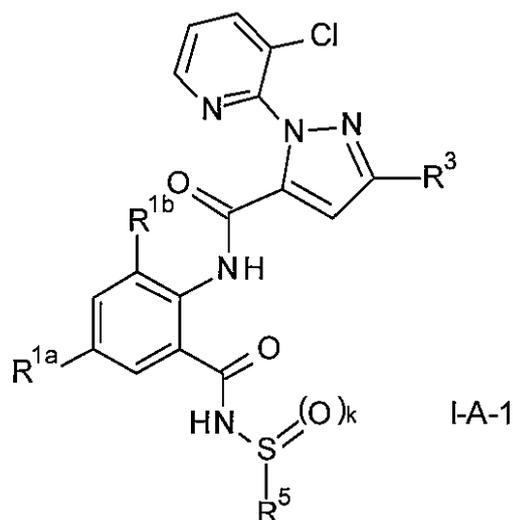
ステップ6に記載した方法によって、2当量のmCPBA等の酸化剤を用い、化合物1-8、1-9、および1-50中に存在する個々のスルホニル様物質を得ることができた。

A. 合成実施例

上記の方法によって、以下の表に記載した(式I-A-1の)化合物1-1~1-6を同様にして調製した。

【0363】

【化9】



【0364】

10

20

30

40

50

【表 2】

表 S.1

化合物例	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁵	k	HPLC 保持時間 [分]	MS [m/z]	HPLC 法
1-1	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0	1.201	518.1	B
1-2	Cl	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	0	1.256	532.3	B
1-3	Cl	CH ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	1	1.138	548.1	B
1-4	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH(CH ₃) ₂	0	1.160	514.2	B
1-5	Cl	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	0	1.250	598.1	B
1-6	Br	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	0	1.263	642.0	B
1-7	Br	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	1	1.143	658.1	B
1-8	Br	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	2	1.194	674	B
1-9	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH(CH ₃) ₂	2	1.072	547.9	B
1-10	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	0	1.12	500.2	B
1-11	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0	1.18	538.2	B
1-12	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	0	1.123	522.1	B
1-13	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0	1.182	584	B
1-14	Br	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0	1.206	629.8	B
1-15	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	1	2.892	516	A
1-16	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1	3.171	534	A
1-17	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	1	2.927	538	A
1-18	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1	3.208	554	A
1-19	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1	3.229	599.9	A
1-20	Br	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1	3.276	643.9	A
1-21	Cl	Cl	CF ₃	CH ₃	0	3.441	525.9	A
1-22	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	0	3.419	504	A
1-23	Br	Br	CF ₃	CH ₃	0	3.527	613.9	A
1-24	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	0	3.138	486	A
1-25	Cl	Br	CF ₃	CH ₃	0	3.442	569.9	A
1-26	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₃	0	3.135	508	A
1-27	Cl	Cl	CF ₃	CH ₃	1	3.075	540	A
1-28	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	1	3.006	520	A
1-29	Br	Br	CF ₃	CH ₃	1	3.125	629.9	A
1-30	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	1	2.74	502	A
1-31	Cl	Br	CF ₃	CH ₃	1	3.092	585.9	A
1-32	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₃	1	2.783	522	A
1-33	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	0	3.293	509.1	A
1-34	CN	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	0	2.99	491.1	A
1-35	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₃	0	3.151	495.1	A

10

20

30

40

化合物例	R ^{1a}	R ^{1b}	R ³	R ⁵	k	HPLC 保持時間 [分]	MS [m/z]	HPLC 法
1-36	CN	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	0	2.829	477.1	A
1-37	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	3.484	523.1	A
1-38	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	3.425	514.1	A
1-39	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	3.679	532	A
1-40	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	3.686	597.9	A
1-41	Br	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	3.736	641.9	A
1-42	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	3.678	554	A
1-43	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	3.424	536	A
1-44	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1	3.035	552	A
1-45	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1	3.306	570	A
1-46	Br	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1	3.369	657.9	A
1-47	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1	3.327	613.9	A
1-48	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1	3.271	548	A
1-49	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1	3.011	530.1	A
1-50	Cl	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	2	3.192	546.1	A
1-51	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1	3.102	539.1	A
1-52	CN	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	1	2.639	507.1	A
1-53	CN	CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	1	2.945	525.1	A

10

20

【0365】

B. 生物学の実施例

本発明の式(1)の化合物の活性は、以下に記載した生物試験において実証且つ評価することができる。

【0366】

特に指定しない場合、試験溶液は以下の通り調製する。

30

【0367】

活性化化合物を、1:1(体積:体積)の蒸留水:アセトン混合物中で所望の濃度に溶解する。この試験溶液は、使用当日に、一般にppm(重量/体積)の濃度で調製する。

【0368】

B.1 マメアブラムシ(アフィス・クラッチボラ(*aphis craccivora*))

様々な段階にある約50~100匹のアブラムシによりコロニーを形成させた鉢植えのカウピー植物に、有害生物の集団を記録した後、噴霧を施す。24、72、及び120時間後に集団の減少を評価する。

この試験において、500ppmの化合物1-5、1-6、1-7、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-51、1-52及び1-53は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

40

【0369】

B.2 コナガ(プルテラ・キシロステラ(*plutella xylostella*))

活性化化合物を、1:1(体積:体積)の蒸留水:アセトン(acetone)混合物中で所望の濃度に溶解する。界面活性剤(Alkamuls(登録商標)EL 620)を、0.1%(体積/体積)の量で加える。この試験溶液は、使用当日に調製する。

キャベツの葉を試験溶液に浸して空気乾燥する。湿潤ろ紙を敷いたペトリ皿に処理した葉を置き、10匹の第3齢幼虫を接種する。処理72時間後の死亡率を記録する。摂食ダメー

50

ジモ0~100%の尺度を使用して記録する。

【0370】

この試験において、500ppmの化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52及び1-53は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0371】

B.3 チチュウカイミバエ(セラチチス・カピタタ(Ceratitis capitata))

チチュウカイミバエ(Ceratitis capitata)の防除の評価に関しては、試験ユニットは、昆虫餌及び50~80個のチチュウカイミバエの卵を含むマイクロタイタープレートから構成する。

本化合物は、75%(体積/体積)水、及び25%(体積/体積) DMSOを含んでいる溶液を使用して配合する。様々な濃度に配合した化合物を、2連で、注文品のマイクロ噴霧器を使用して昆虫餌上に5µl噴霧する。

【0372】

施用後、マイクロタイタープレートを、約28±1 及び相対湿度約80±5%で5日間インキュベートする。その後、卵及び幼虫の死亡率を目視で評価する。

この試験において、2500ppmの化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52及び1-53は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0373】

B.4 ランアザミウマ(ジクロモトリプス・コルベッティ(dichromothrips corbeti))

生物アッセイに使用したランアザミウマの成体は、実験室条件下で連続的に維持したコロニーから得る。試験のために、試験化合物を、界面活性剤Kinetic(登録商標) 0.01%(体積/体積)を含むアセトン:水(体積/体積)1:1混合物の中に300ppm(化合物重量:希釈剤体積)の濃度まで希釈する。

【0374】

各化合物のアザミウマの効力は、花の浸漬技法を使用することにより評価する。プラスチック製のペトリ皿を試験領域として使用する。個々の花弁すべて、すなわち無傷のラン花を処理溶液に漬けて、乾燥する。処理した花を10-15匹の成体のアザミウマと共に個々のペトリ皿に入れる。その後、ペトリ皿を蓋で覆う。アッセイの間、すべての試験領域を光の連続照射下で約28 °Cの温度に維持する。4日後に、生存しているアザミウマ数を各花及び各ペトリ皿の内壁に沿って数える。アザミウマの死亡率のレベルを前処理したアザミウマの数から外挿する。

この試験において、500ppmの化合物1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52及び1-53は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0375】

B.5 シルバーリーフコナジラミ(ベミシア・アルゲンチフォリ(Bemisia argentifolii))

活性化化合物を、チューブに供給した10,000ppm溶液としてシクロヘキサノン中で配合する。噴霧用ノズルを装備した自動静電噴霧器にチューブを挿入し、それらは、50%アセトン:50%水(体積/体積)中で低濃度に希釈するストック溶液としての役割を果たす。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))が0.01体積%(体積/体積)で溶液に含まれる。

【0376】

子葉段階(一つの鉢当たり一つの植物)にある綿花植物に、噴霧用スプレーノズルを装備

10

20

30

40

50

した自動植物用静電噴霧器により噴霧する。該植物を噴霧器付き換気フード内で乾燥し、次に、噴霧器から取り出す。各鉢をプラスチック製カップに置き、約10~12匹のコナジラミ成体(約3~5日齢)を導入する。障壁ピペットチップに連結したアスピレーター及び無毒のTygon(登録商標)チューブを使用して昆虫を集める。次に、集めた昆虫を含んでいるチップを、処理植物を含む土壌にゆっくりと挿入し、昆虫がチップの外に這い出て、摂食するために葉に近づけるようにする。カップは、再使用可能な網目のある蓋で覆う。約25及び相対湿度約20~40%の育成室中で、試験植物を3日間維持し、カップ内部の熱のこもりを予防するため、蛍光(24時間の光周期)への直接曝露は避ける。処理3日後の死亡率を、未処理対照植物と比較評価する。

この試験において、100ppmの化合物1-7が、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0377】

B.6 南方ヨトウムシ(スポドプテラ・エリダニア(Spodoptera eridania))

活性化化合物を、チューブに供給した10,000ppm溶液としてシクロヘキサノン中で配合する。噴霧用ノズルを装備した自動静電噴霧器にチューブを挿入し、それらは、50%アセトン:50%水(体積/体積)中で低濃度に希釈するストック溶液としての役割を果たす。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))が0.01体積%(体積/体積)で溶液に含まれる。

【0378】

ライマメ植物(Sieva品種)2苗を鉢に生育させ、最初の本葉の段階で処理するために選択する。噴霧用スプレーノズルを装備した自動植物用静電噴霧器で試験溶液を葉に噴霧する。該植物を噴霧器付き換気フード内で乾燥し、次に、噴霧器から取り出す。各々の鉢をジッパーで閉じられる穴あきのプラスチック製の袋に入れる。約10~11匹のヨトウムシの幼虫を袋に入れ、ジッパーを閉める。試験植物を約25及び相対湿度約20~40%の育成室中で4日間維持し、袋の内部の熱のこもりを予防するため、蛍光(24時間の光周期)への直接曝露は避ける。処理4日後の死亡率及び餌の減少を、未処理対照植物と比較評価する。

この試験において、1ppmの化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-9、1-14、1-17、1-18、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-30、1-31、1-32、1-44、1-48及び1-49は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0379】

B.7 ソラマメヒゲナガアブラムシ(メゴウラ・ビキアエ(Megoura viciae))

接触または浸透手段によるソラマメヒゲナガアブラムシ(Megoura viciae)の防除の評価に関しては、試験ユニットは、ソラマメの葉のディスクを入れた24-ウェル-マイクロタイタープレートから構成する。

【0380】

本化合物は、75%(体積/体積)水、及び25%(体積/体積) DMSOを含んでいる溶液を使用して配合する。様々な濃度に配合した化合物を、2連で、注文品のマイクロ噴霧器を使用して葉のディスク上に2.5µl噴霧する。

【0381】

施用後、葉のディスクを空気乾燥し、5~8匹のアブラムシ成虫をマイクロタイタープレートウェル内の葉のディスク上に置く。次いでアブラムシに処理した葉のディスクを吸わせ、約23±1及び相対湿度約50±5%で5日間インキュベートする。その後、アブラムシの死亡率及び繁殖率(fecundity)を目視で評価する。

この試験において、2500ppmの化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52及び1-53は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0382】

B.8 ニセアメリカタバコガ(ヘリオチス・ビレセンス(Heliothis virescens))

試験ユニットは、昆虫餌及び15~25個のH. virescensの卵を含む96-ウェル-マイクロタ

10

20

30

40

50

イタープレートから構成する。本化合物は、75%(体積/体積)水、及び25%(体積/体積) DMSOを含んでいる溶液を使用して配合した。様々な濃度に配合した化合物を、2連で、注文品のマイクロ噴霧器を使用して昆虫餌上に10 μ l噴霧した。

【0383】

施用後、マイクロタイタープレートを約28 \pm 1 及び相対湿度約80 \pm 5%で5日間インキュベートした。その後、卵及び幼虫の死亡率を目視で評価した。

この試験において、2500ppmの化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52及び1-53は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

10

【0384】

B.9 ワタミハナゾウムシ(アントノムス・グランジス(Anthonomus grandis))

ワタミハナゾウムシ(Anthonomus grandis)の防除の評価に関しては、試験ユニットは、昆虫餌及び20~30個のA. grandisの卵を含む24-ウェル-マイクロタイタープレートから構成する。

【0385】

本化合物は、75%(体積/体積)水、及び25%(体積/体積) DMSOを含んでいる溶液を使用して配合する。様々な濃度に配合した化合物を、2連で、注文品のマイクロ噴霧器を使用して昆虫餌上に20 μ l噴霧する。

20

【0386】

施用後、マイクロタイタープレートを約23 \pm 1 及び相対湿度約50 \pm 5%で5日間インキュベートする。その後、卵及び幼虫の死亡率を目視で評価する。

この試験において、2500ppmの化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52及び1-53は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0387】

B.10 モモアカアブラムシ(ミズス・ペルシカエ(Myzus persicae))

30

活性化化合物を、チューブに供給した10,000ppm溶液としてシクロヘキサノン中で配合する。噴霧用ノズルを装備した自動静電噴霧器にチューブを挿入し、それらは、50%アセトン:50%水(体積/体積)中で低濃度に希釈するストック溶液としての役割を果たす。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))が0.01%(体積/体積)で溶液に含まれる。

【0388】

最初の本葉の段階のパブリカ植物に、処理に先立って、主たるコロニーから被害のひどい葉を処理植物の頂部に置くことによって、寄生させる。アブラムシは一晩で移動して植物あたり30~50匹のアブラムシが寄生し、元の葉は取り除く。次いで、寄生された植物に、噴霧用スプレーノズルを装備した自動植物用静電噴霧器で噴霧する。植物を噴霧器付き換気フード内で乾燥し、取り出し、次いで24時間の光周期の蛍光下、約25 及び相対湿度約20~40%の育成室中で維持する。未処理対照植物での死亡率と比較した処理植物上のアブラムシの死亡率を、5日後に判定する。

40

この試験において、100ppmの化合物1-1、1-3、1-4、1-5、1-6及び1-7は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0389】

B.11 タイワンツマグロヨコバイ(ネフォテティックス・ビレセンス(Nephotettix virescens))

噴霧24時間前にイネの苗を清浄化・洗浄する。活性化化合物を50:50のアセトン:水(体積:体積)中に配合し、0.1%(体積/体積)の界面活性剤(EL 620)を添加する。

【0390】

50

鉢植えのイネの苗に5mlの試験溶液を噴霧し、空気乾燥し、ケージに入れて10匹の成虫を接種する。処理されたイネ植物を約28～29 及び相対湿度約50～60%に維持する。72時間後に死亡率を記録する。

この試験において、500ppmの化合物1-5、1-6、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-17、1-18、1-21、1-22、1-25、1-26、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-49及び1-52は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0391】

B.12 トビイロウンカ(ニラパルバタ・ルーゲンス(*Nilaparvata lugens*))

噴霧24時間前にイネの苗を清浄化・洗浄する。活性化化合物を50:50のアセトン:水(体積:体積)中に配合し、0.1%(体積/体積)の界面活性剤(EL 620)を添加する。

10

【0392】

鉢植えのイネの苗に5mlの試験溶液を噴霧し、空気乾燥し、ケージに入れて10匹の成虫を接種する。処理されたイネ植物を約28～29 及び相対湿度約50～60%に維持する。72時間後に死亡率を記録する。

この試験において、500ppmの化合物1-11、1-17、1-33、1-34、1-36、1-37及び1-52は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

【0393】

B.13 コロラドハムシ(レプチノタルサ・デセムリネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*))

活性化化合物を、チューブに供給した10,000ppm溶液としてシクロヘキサノン中で配合する。噴霧用ノズルを装備した自動静電噴霧器にチューブを挿入し、それらは、50%アセトン:50%水(体積/体積)中で低濃度に希釈するストック溶液としての役割を果たす。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))が0.01%(体積/体積)で溶液に含まれる。

20

【0394】

ナス2苗を鉢に生育させ、最初の本葉の段階で処理するために選択する。噴霧用スプレーノズルを装備した自動植物用静電噴霧器で試験溶液を葉に噴霧する。該植物を噴霧器付き換気フード内で乾燥し、次に、噴霧器から取り出す。次いで処理した葉を切り取って鉢から取り除き、湿らせた紙を敷いたペトリ皿に入れる。5匹のハムシ幼虫を各ペトリ皿に入れ、ペトリ皿の蓋で皿を覆う。ペトリ皿を約25 及び相対湿度約20～40%の育成室中で4日間維持し、皿内部の熱のこもりを予防するため、蛍光(24時間の光周期)への直接曝露は避ける。処理4日後の死亡率及び餌の減少を、未処理対照植物と比較評価する。

30

【0395】

この試験において、1ppmの化合物1-1、1-2、1-3、1-5、1-7、1-17、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-31及び1-32は、未処理対照と比較すると75%を超える死亡率を示した。

フロントページの続き

- (74)代理人 100122389
弁理士 新井 栄一
- (74)代理人 100111741
弁理士 田中 夏夫
- (74)代理人 100169971
弁理士 菊田 尚子
- (74)代理人 100171505
弁理士 内藤 由美
- (72)発明者 ケルバー, カルステン
ドイツ連邦共和国 6 9 2 1 4 エッベルハイム, ヒンテレ リスゲヴァン 2 6
- (72)発明者 ヴァハ, ジャン - イヴ
ドイツ連邦共和国 6 8 1 5 9 マンハイム, キルヒェンシュトラッセ 5
- (72)発明者 カイザー, フローリアン
ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, シュペルツェンシュトラッセ 9
- (72)発明者 フォン ダイン, ヴォルフガング
ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 5 ノイシュタット, アン デア ブライヒェ 2 4
- (72)発明者 バンドゥール, ニナ ゲルトルド
ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 3 ルートヴィヒスハーフェン, ヴイスリツェヌスシュトラッセ 4
- (72)発明者 ディックハウト, ヨアヒム
ドイツ連邦共和国 6 9 1 2 1 ハイデルベルク, クライン レーピングスガッセ 4 / 3
- (72)発明者 ナリーン, アラン
ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 1 マンハイム, 1 2 - 1 3, キュー 3
- (72)発明者 カルバートソン, デボラ エル.
アメリカ合衆国 2 7 5 2 6 ノースカロライナ州, フクエイ バリナ, ピンテージ リッジ レーン 6 4 0 0
- (72)発明者 ニース, ポール
アメリカ合衆国 2 7 5 3 9 ノースカロライナ州, アベックス, グレイモス レーン 5 2 2 5
- (72)発明者 郡嶋 浩志
日本国 4 4 1 - 8 0 2 1 愛知県豊橋市白河町97 ハイツ宝 - 3 2 0 5
- (72)発明者 デビッド, マイケル
アメリカ合衆国 0 2 7 6 1 3 ノースカロライナ州, ローリー, グリーンバース ドライブ 5 9 1 3
- (72)発明者 ブラウン, フランツ ヨセフ
アメリカ合衆国 2 7 7 0 3 ノースカロライナ州, ダーラム, ロング リッジ ロード 3 6 0 2

審査官 村守 宏文

- (56)参考文献 特表2009 - 500373 (JP, A)
特表2005 - 503384 (JP, A)
特表2009 - 523715 (JP, A)
国際公開第2011 / 157663 (WO, A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D
A 0 1 N
A 0 1 P
A 6 1 K

A 6 1 P
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)