

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4918042号
(P4918042)

(45) 発行日 平成24年4月18日(2012.4.18)

(24) 登録日 平成24年2月3日(2012.2.3)

(51) Int.Cl.	F I	
CO7D 401/06 (2006.01)	CO7D 401/06	CSP
CO7D 403/06 (2006.01)	CO7D 403/06	
CO7D 409/06 (2006.01)	CO7D 409/06	
AO1N 43/56 (2006.01)	AO1N 43/56	C
AO1N 43/653 (2006.01)	AO1N 43/653	A
請求項の数 12 (全 99 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2007-541739 (P2007-541739)
 (86) (22) 出願日 平成17年11月5日(2005.11.5)
 (65) 公表番号 特表2008-520599 (P2008-520599A)
 (43) 公表日 平成20年6月19日(2008.6.19)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2005/011846
 (87) 国際公開番号 W02006/053643
 (87) 国際公開日 平成18年5月26日(2006.5.26)
 審査請求日 平成20年11月4日(2008.11.4)
 (31) 優先権主張番号 102004055582.6
 (32) 優先日 平成16年11月18日(2004.11.18)
 (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)

(73) 特許権者 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アーゲー
 BAYER CROPSCIENCE A
 G
 ドイツ国、40789・モンハイム、アル
 フレートーノベルーシュトラッセ・50
 (74) 代理人 100062007
 弁理士 川口 義雄
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100140523
 弁理士 渡邊 千尋
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教

最終頁に続く

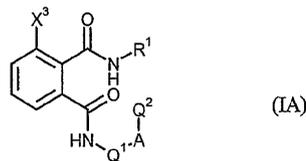
(54) 【発明の名称】 殺虫剤としてのN-ヘテロシクリルフタル酸ジアミド

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造(I A)

【化1】

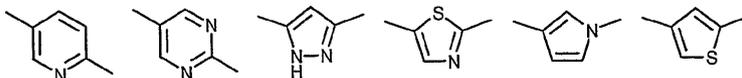


[上記構造中、

Aは、メチレンを表し；

Q¹は、以下のヘテロ環基のうちの1つを表し

【化2】

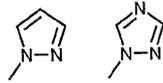


ここで、これらの基は、いずれの場合も、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから

選択される、場合により1つ又は場合により2つの置換基を含んでいてもよく；

Q²は、以下のヘテロ環基のうちの1つを表し

【化3】



ここで、これらの基は、いずれの場合も、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される置換基を場合により含んでいてもよく；

R¹は、基A¹-X¹を表し、ここで、A¹は単結合を表し、X¹は、いずれの場合もメチルチオ、エチルチオ、*n*-プロピルチオ、*i*-プロピルチオ、*n*-ブチルチオ、*i*-ブチルチオ、*s*-ブチルチオ、*t*-ブチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルで場合により置換されていてもよいメチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル又は*t*-ブチルを表し；及び、

X³は、塩素、臭素又はヨウ素を表す。]

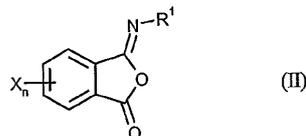
で表される化合物。

【請求項2】

請求項1に記載の構造(IA)で表されるN-ヘテロシクリルフトアルジアミドを調製する方法であって、

構造(II)

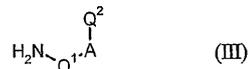
【化4】



[上記構造中、*n*は1を表し、R¹は、請求項1で与えられている意味を有し、Xは、請求項1の式(IA)におけるX³に対応する位置に置換し且つ同じ意味を有する。]

で表される3-イミノ-2-ベンゾフラン-1(3H)-オンを、場合により反応助剤の存在下で、及び、場合により希釈剤の存在下で、構造(III)

【化5】



[上記構造中、A、Q¹及びQ²は、請求項1で与えられている意味を有する。]

で表される置換ヘテロシクリルアミンと反応させる

ことを特徴とする前記方法。

【請求項3】

希釈剤及び/又は界面活性剤と一緒に、請求項1に記載の構造(IA)で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいることを特徴とする、有害生物防除剤。

【請求項4】

10

20

30

40

50

有害生物を防除するための、請求項 1 に記載の構造 (I A) で表される化合物の使用。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の構造 (I A) で表される化合物を有害生物又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする、有害生物を防除する方法。

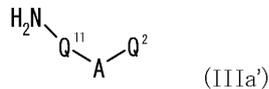
【請求項 6】

請求項 1 に記載の構造 (I A) で表される化合物を希釈剤及び / 又は界面活性剤と混合させることを特徴とする、有害生物防除剤を調製する方法。

【請求項 7】

構造 (I I I a ')

【化 6】



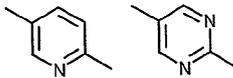
10

[上記構造中、

A は、メチレンを表し；

Q¹ は、以下のヘテロ環基のうちの 1 つを表し

【化 7】

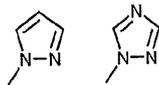


20

ここで、これらの基は、いずれの場合も、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される、場合により 1 つ又は場合により 2 つの置換基を含んでもよく；

Q² は、以下のヘテロ環基のうちの 1 つを表し

【化 8】



30

ここで、これらの基は、いずれの場合も、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される置換基を場合により含んでもよい。]

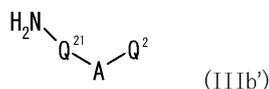
で表されるアゾリルメチルアジンアミン。

40

【請求項 8】

構造 (I I I b ')

【化 9】

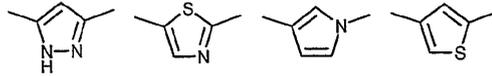


[上記構造中、

A は、メチレンを表し；

Q² は、以下のヘテロ環基のうちの 1 つを表し

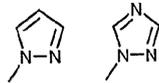
【化 1 0】



ここで、これらの基は、いずれの場合も、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される、場合により1つ又は場合により2つの置換基を含んでいてもよく；

Q^2 は、以下のヘテロ環基のうちの1つを表し

【化 1 1】



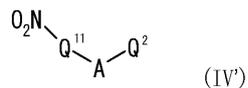
ここで、これらの基は、いずれの場合も、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される置換基を場合により含んでいてもよい。]

で表されるアゾリルメチル化合物。

【請求項 9】

構造 (I V ')

【化 1 2】



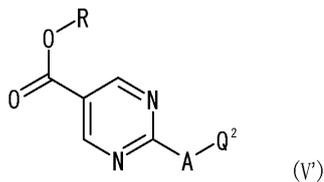
[上記構造中、 A 、 Q^{11} 及び Q^2 は、請求項 7 で規定したとおりである。]

で表されるアゾリルメチルニトロアジン。

【請求項 1 0】

構造 (V ')

【化 1 3】



[上記構造中、

A 及び Q^2 は、請求項 7 で規定したとおりであり；

R は、アルキルを表す。]

で表されるアゾリルメチルピリミジンカルボキシレートエステル。

【請求項 1 1】

構造 (V I ')

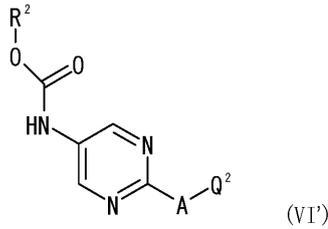
10

20

30

40

【化 1 4】



[上記構造中、

A 及び Q² は、請求項 7 で規定したとおりであり；

R² は、アルキルを表す。]

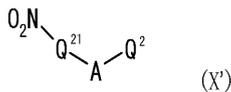
10

で表される N - アゾリルメチルピリミジニルカルバメート。

【請求項 1 2】

構造 (X['])

【化 1 5】



[上記構造中、

A、Q^{2 1} 及び Q² は、請求項 8 で規定したとおりである。]

20

で表されるニトロ化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

発明についての本出願は、新規 N - ヘテロシクリルフタルジアミド、それらの調製方法、並びに、それらの植物処理剤及び有害生物防除剤（特に、殺虫剤）としての使用に関する。

【背景技術】

【0002】

ある種の N - アリールフタルジアミドが殺虫剤特性を示すことは既に知られている。（
c f . US 6 , 3 6 2 , 3 6 9、US 6 , 6 0 3 , 0 4 4、WO 0 1 / 0 2 3 5 4、W
O 0 1 / 2 1 5 7 6、WO 0 1 / 4 6 1 2 4、WO 0 2 / 4 8 1 3 7、WO 0 2 / 9 4 7
6 5、WO 0 4 / 0 1 8 4 1 5）。

30

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

特に、施用量、残留物の形成、選択性、毒性及び有利な製造方法に関して、現代の植物処理剤に対する生態学的な要求及び経済上の要求は絶えず増大しているため、また、例えば、抵抗性の問題も起こり得るとい理由にもより、少なくとも特定の領域では既知植物処理剤よりも有利点を示し得る新規な植物処理剤の開発が続けられている。

40

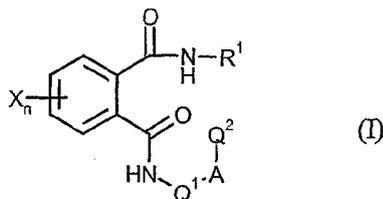
【課題を解決するための手段】

【0004】

構造 (I)

【0005】

【化 15】



[上記構造中、

n は、数 0、1、2、3 又は 4 を表し；

A は、O (酸素)、S (硫黄)、SO、SO₂、NH 若しくは N (アルキル) を表すか、又は、直鎖若しくは分枝鎖のアルカンジイル (アルキレン) (ここで、該アルカンジイルは、場合により置換されていてもよく、また、O (酸素)、S (硫黄)、SO、SO₂、NH 又は N (アルキル) で場合により中断されていてもよい。) を表し；

Q¹ は、場合により置換されていてもよいヘテロ環基を表し；

Q² は、場合により置換されていてもよいヘテロ環基を表し；

R¹ は、水素、シアノ又は基 A¹ - X¹ (ここで、A¹ は、単結合、O (酸素)、S (硫黄)、SO、SO₂、NH、CO、COO 又は直鎖若しくは分枝鎖のアルカンジイル (アルキレン) を表し、X¹ は、いずれの場合も場合により置換されていてもよい、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール又はヘテロシクリルを表す。) を表し；及び、

X は、ニトロ、シアノ、ハロゲン又は基 A² - X² (ここで、A² は、単結合、O (酸素)、S (硫黄)、SO、SO₂、OSO₂、NH SO₂、CO、OCO、NHCO 又はアルカンジイル (アルキレン) を表し、X² は、いずれの場合も場合により置換されていてもよい、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル又はアリールを表す。) を表す。]

で表される新規 N - ヘテロシクリルフタルジアミドが見いだされた。

【0006】

構造 (I) で表される化合物は、酸性物質又は塩基性物質との付加化合物の形態でも存在することが可能であり、また、場合により、N - オキシドの形態で酸素の付加体としても存在することができる。

【0007】

置換基の種類に応じて、構造 (I) で表される化合物は、立体異性体としても存在し得る。即ち、構造 (I) で表される化合物は、幾何異性体及び/若しくは光学異性体としても、又は、種々の組成の異性体混合物としても存在することが可能である。本明細書において、たとえ、議論が概して構造 (I) の化合物に限定されているとしても、純粋な立体異性体及びそれら異性体の全ての任意の混合物の両方とも本発明の対象である。

【0008】

ハロゲンで置換されている残基 (例えば、ハロアルキル) は、1 回ハロゲン化されているか、又は、可能な置換基の最大数まで数回ハロゲン化されている。複数回ハロゲン化されている場合、該ハロゲン原子は、同一であることも、又は、異なっていることも可能である。ここで、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表し、特に、フッ素、塩素又は臭素を表している。

【0009】

さらに、構造 (I) で表される N - ヘテロシクリルフタルジアミドが、構造 (II)

【0010】

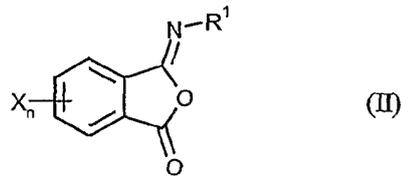
10

20

30

40

【化 1 6】



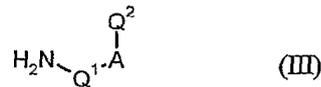
[上記構造中、 n 、 R^1 及び X は、上記意味を有する。]

で表される 3 - イミノ - 2 - ベンゾフラン - 1 (3 H) - オンを、場合により反応助剤の存在下で、及び、場合により希釈剤の存在下で、構造 (I I I)

10

【 0 0 1 1】

【化 1 7】



[上記構造中、 A 、 Q^1 及び Q^2 は、上記意味を有する。]

で表される置換ヘテロシクリルアミンと反応させ、及び、構造 (I) の得られた化合物を、場合により、置換基の定義に相応して標準的な方法で構造 (I) で表される別の化合物に変換することにより得られるということが見いだされた。

20

【 0 0 1 2】

最後に、本発明の構造 (I) で表される化合物が、非常に興味深い生物学的特性を示すことが見いだされ、植物保護、材料物質の保護及び貯蔵物品の保護において、さらに、家庭 / 衛生学の分野及び動物の健康の分野において、害虫 (zoopest)、例えば、節足動物及び線虫、特に昆虫を防除するのに適しているということが分かった。

【発明を実施するための最良の形態】

【 0 0 1 3】

本発明の N - ヘテロシクリルフトルジアミドは、一般構造 (I) で定義される。上記及び下記で与えられている構造の好ましい残基の定義は、以下において定義されている。これらの定義は、構造 (I) で表される最終生成物と全ての中間体の両方に等しく適用される。

30

【 0 0 1 4】

n は、好ましくは、数 1、2 又は 3 を表す。

【 0 0 1 5】

n は、さらに好ましくは、数 1 又は 2 を表す。

【 0 0 1 6】

A は、好ましくは、 O (酸素)、 S (硫黄)、 SO 、 SO_2 、 NH 若しくは $N(C_1 - C_4 - \text{アルキル})$ を表すか、又は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖若しくは分枝鎖のアルカンジイル (アルキレン) (ここで、該アルカンジイルは、シアノ、ハロゲン又は $C_1 - C_6 - \text{アルコキシ}$ で場合により置換されていてもよく、また、 O (酸素)、 S (硫黄)、 SO 、 SO_2 、 NH 又は $N(C_1 - C_4 - \text{アルキル})$ で場合により中断されていてもよい。) を表す。

40

【 0 0 1 7】

A は、さらに好ましくは、1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルカンジイル (アルキレン) (ここで、該アルカンジイルは、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、 n - プロポキシ、 i - プロポキシ、 n - ブトキシ、 i - ブトキシ、 s - ブトキシ又は t - ブトキシで場合により置換されていてもよく、また、 O (酸素)、 S (硫黄)、 SO 、 SO_2 、 NH 又は $N(CH_3)$ で場合により中断されていてもよい。) を表

50

す。

【0018】

Aは、最も好ましくは、メチレン、エタン - 1, 1 - ジイル (エチリデン)、2, 2, 2 - トリフルオロエタン - 1, 1 - ジイル、エタン - 1, 2 - ジイル (ジメチレン)、プロパン - 1, 1 - ジイル (プロピリデン)、プロパン - 1, 2 - ジイル又はプロパン - 1, 3 - ジイル (トリメチレン) を表す。

【0019】

Q¹は、好ましくは、10個以下の炭素原子並びにO (酸素)、S (硫黄)、N (窒素) 及び/又はSO基若しくはSO₂基から選択される少なくとも1個のヘテロ原子を有する場合により置換されていてもよいヘテロ環基 (ここで、可能な好ましい置換基は、以下でXのところ列挙されているものから選択される。) を表す。

10

【0020】

Q¹は、さらに好ましくは、ヘテロ環の一部としての5個以下の炭素原子及び1~4個のN原子及び/又は1個のO原子及び/又は1個のS原子及び/又は1つのSO基若しくはSO₂基からなる場合により置換されていてもよい単環式ヘテロ環基 (ここで、可能な好ましい置換基は、以下でXのところ列挙されているものから選択される。) を表す。

【0021】

Q¹は、最も好ましくは、場合により置換されていてもよいピリジン基、ピリミジン基、ピラジン基、ピリダジン基、トリアゾール基、オキサジアゾール基、チアジアゾール基、ピラゾール基、イミダゾール基、ピロール基、オキサゾール基、イソオキサゾール基、チアゾール基、イソチアゾール基、フラン基又はチオフェン基 (ここで、可能な好ましい置換基は、以下でXのところ列挙されているものから選択される。) を表す。

20

【0022】

Q²は、好ましくは、10個以下の炭素原子並びにO (酸素)、S (硫黄)、N (窒素) 及び/又はSO基若しくはSO₂基から選択される少なくとも1個のヘテロ原子を有する場合により置換されていてもよいヘテロ環基 (ここで、可能な好ましい置換基は、以下でXのところ列挙されているものから選択される。) を表す。

【0023】

Q²は、さらに好ましくは、ヘテロ環の一部としての9個以下の炭素原子及び1~5個のN原子及び/又は1個のO原子及び/又は1個のS原子及び/又は1つのSO基若しくはSO₂基を有する場合により置換されていてもよい単環式又は二環式のヘテロ環基 (ここで、可能な好ましい置換基は、以下でXのところ列挙されているものから選択される。) を表す。

30

【0024】

Q²は、最も好ましくは、場合により置換されていてもよいピロール基、ピラゾール基、イミダゾール基、トリアゾール基、テトラゾール基、オキサゾール基、チアゾール基、フラン基又はチオフェン基 (ここで、可能な好ましい置換基は、以下でXのところ列挙されているものから選択される。) を表す。

【0025】

R¹は、好ましくは、水素又は基A¹ - X¹を表し、ここで、A¹は、単結合、O (酸素)、S (硫黄)、SO、SO₂、NH、CO若しくはCOOを表すか、又は、1~10個の炭素原子を有する直鎖若しくは分枝鎖のアルカンジイル (アルキレン) を表し、X¹は、1~10個の炭素原子を有するアルキル (ここで、該アルキルは、ヒドロキシ、シアノ、カルバモイル、ヒドロキシイミノ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノスルホニル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルアミノ、C₁ - C₆ - アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ (C₁ - C₆ - アルキル) アミノカルボニルオキシ、C₁ - C₆ - アルコキシイミノ、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルアミノカルボニル又はジ (C₁ - C₆ - アルキル) アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。) を表すか、いず

40

50

れの場合も 2 ~ 10 個の炭素原子を有するアルケニル若しくはアルキニル（ここで、該アルケニル又はアルキニルは、いずれの場合も、シアノ、ハロゲン及びノ又は $C_1 - C_6$ - アルコシカルボニルで場合により置換されていてもよい。）を表すか、いずれの場合も 3 ~ 6 個の炭素原子を有するシクロアルキル若しくはシクロアルケニル（ここで、該シクロアルキル又はシクロアルケニルは、いずれの場合も、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコシ及びノ又は $C_1 - C_6$ - アルコシカルボニルで場合により置換されていてもよい。）を表すか、6 個若しくは 10 個の炭素原子を有するアリーール（ここで、該アリーールは、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、ジ（ $C_1 - C_6$ - アルキル）アミノスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコシイミノ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノカルボニル及びノ又はジ（ $C_1 - C_6$ - アルキル）アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。）を表すか、又は、10 個以下の炭素原子、5 個以下の N 原子、及びノ若しくは、1 個の O 原子、S 原子若しくは N 原子、及びノ若しくは、1 つの SO 基若しくは SO_2 基を有するヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、ジ（ $C_1 - C_6$ - アルキル）アミノスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノカルボニル及びノ又はジ（ $C_1 - C_6$ - アルキル）アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。）を表す。

【0026】

R^1 は、さらに好ましくは、水素又は基 $A^1 - X^1$ を表し、ここで、 A^1 は、単結合、O（酸素）、S（硫黄）、SO、 SO_2 、NH、CO 若しくは COO を表すか、又は、1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖若しくは分枝鎖のアルカンジイル（アルキレン）を表し、 X^1 は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキル（ここで、該アルキルは、ヒドロキシ、シアノ、カルバモイル、ヒドロキシイミノ、ハロゲン、 $C_1 - C_5$ - アルコシ、 $C_1 - C_5$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルアミノスルホニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - C_5$ - アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ（ $C_1 - C_5$ - アルキル）アミノカルボニルオキシ、 $C_1 - C_5$ - アルコシイミノ、 $C_1 - C_5$ - アルコシカルボニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルアミノカルボニル又はジ（ $C_1 - C_5$ - アルキル）アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。）を表すか、いずれの場合も 2 ~ 6 個の炭素原子を有するアルケニル若しくはアルキニル（ここで、該アルケニル又はアルキニルは、いずれの場合も、シアノ、ハロゲン及びノ又は $C_1 - C_5$ - アルコシカルボニルで場合により置換されていてもよい）を表すか、3 ~ 6 個の炭素原子を有するシクロアルキル若しくは 5 個若しくは 6 個の炭素原子を有するシクロアルケニル（ここで、該シクロアルキル又はシクロアルケニルは、いずれの場合も、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコシ及びノ又は $C_1 - C_5$ - アルコシカルボニルで場合により置換されていてもよい）を表すか、6 個若しくは 10 個の炭素原子を有するアリーール（ここで、該アリーールは、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコシ、 $C_1 - C_5$ - ハロアルコシ、 $C_1 - C_5$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキルス

10

20

30

40

50

ルホニル、ジ(C₁ - C₅ - アルキル)アミノスルホニル、C₁ - C₅ - アルキルカルボニル、C₁ - C₅ - アルコキシイミノ - C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコシカルボニル、C₁ - C₅ - アルキルアミノカルボニル及び/又はジ(C₁ - C₅ - アルキル)アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表すか、又は、6個以下の炭素原子及び4個以下のN原子、及び/若しくは、1個のO原子、S原子及び/若しくはN原子、及び/若しくは、1つのSO基若しくはSO₂基を有するヘテロシクリル(ここで、該ヘテロシクリルは、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - ハロアルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、C₁ - C₅ - ハロアルコキシ、C₁ - C₅ - アルキルチオ、C₁ - C₅ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₅ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₅ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₅ - アルキルスルホニル、C₁ - C₅ - ハロアルキルスルホニル、ジ(C₁ - C₅ - アルキル)アミノスルホニル、C₁ - C₅ - アルキルカルボニル、C₁ - C₅ - アルコシカルボニル、C₁ - C₅ - アルキルアミノカルボニル及び/又はジ(C₁ - C₅ - アルキル)アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表す。

【0027】

R¹は、最も好ましくは、水素又は基A¹ - X¹を表し、ここで、A¹は、単結合、O(酸素)、S(硫黄)、SO、SO₂、NH、CO若しくはCOOを表すか、又は、メチレン、エタン - 1, 1 - ジイル(エチリデン)、エタン - 1, 2 - ジイル(ジメチレン)、プロパン - 1, 1 - ジイル(プロピリデン)、プロパン - 1, 2 - ジイル若しくはプロパン - 1, 3 - ジイル(トリメチレン)を表し、X¹は、いずれの場合もヒドロキシ、シアノ、カルバモイル、ヒドロキシイミノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、i - プロポキシ、n - ブトキシ、i - ブトキシ、s - ブトキシ、t - ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n - プロピルチオ、i - プロピルチオ、n - ブチルチオ、i - ブチルチオ、s - ブチルチオ、t - ブチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、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、i - プロピルアミノスルホニル、n - ブチルアミノスルホニル、i - ブチルアミノスルホニル、s - ブチルアミノスルホニル、t - ブチルアミノスルホニル、アセチル、プロピオニル、n - ブチロイル、i - ブチロイル、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、n - ブチロイルアミノ、i - ブチロイルアミノ、メチルアミノカルボニルオキシ、エチルアミノカルボニルオキシ、n - プロピルアミノカルボニルオキシ、i - プロピルアミノカルボニルオキシ、ジメチルアミノカルボニルオキシ、ジエチルアミノカルボニルオキシ、メトキシイミノ、エトキシイミノ、プロポキシイミノ、ブトキシイミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n - プロポキシカルボニル、i - プロポキシカルボニル、n - ブトキシカルボニル、i - ブトキシカルボニル、s - ブトキシカルボニル、t - ブトキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n - プロピルアミノカルボニル、i - プロピルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル若しくはジエチルアミノカルボニルで場合により置換されていてもよいメチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、n - ペンチル、i - ペンチル、s - ペンチル、t - ペンチル若しくはネオ - ペンチルを表すか、いずれの場合もシアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n - プロポキシカルボニル、i - プロポキシカルボニル、n - ブトキシカルボニル、i - ブトキシカルボニル、s - ブトキシカルボニル若しくはt - ブトキシカルボニルで場合により置換されていてもよいエチニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、エチニル、プロピニル、ブチニル若しくはペンチニルを表すか、いずれの場合もシアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、i - プロポキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n - プロポキシカルボニル若しくはi - プロポキシカルボニルで場合により置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロペンテニル若しくはシクロヘキセニルを表すか、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、フッ素、塩素、臭素

10

20

30

40

50

、ヨウ素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、フルオロメチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロフルオロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、i - プロポキシ、n - ブトキシ、i - ブトキシ、s - ブトキシ、t - ブトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、テトラフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n - プロピルチオ、i - プロピルチオ、n - ブチルチオ、i - ブチルチオ、s - ブチルチオ、t - ブチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、アセチル、プロピオニル、n - ブチロイル、i - ブチロイル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、n - プロポキシイミノメチル、i - プロポキシイミノメチル、メトキシイミノエチル、エトキシイミノエチル、メトキシイミノプロピル、エトキシイミノプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n - プロポキシカルボニル、i - プロポキシカルボニル、n - ブトキシカルボニル、i - ブトキシカルボニル、s - ブトキシカルボニル、t - ブトキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n - プロピルアミノカルボニル、i - プロピルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル及び/若しくはメチルアミノカルボニルで場合により置換されていてもよいフェニルを表すか、又は、いずれの場合もニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、フルオロメチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロフルオロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、i - プロポキシ、n - ブトキシ、i - ブトキシ、s - ブトキシ、t - ブトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、クロロエトキシ、ジフルオロエトキシ、ジクロロエトキシ、クロロフルオロエトキシ、クロロジフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシ、テトラフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n - プロピルチオ、i - プロピルチオ、n - ブチルチオ、i - ブチルチオ、s - ブチルチオ、t - ブチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、アセチル、プロピオニル、n - ブチロイル、i - ブチロイル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、n - プロポキシイミノメチル、i - プロポキシイミノメチル、メトキシイミノエチル、エトキシイミノエチル、メトキシイミノプロピル、エトキシイミノプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n - プロポキシカルボニル、i - プロポキシカルボニル、n - ブトキシカルボニル、i - ブトキシカルボニル、s - ブトキシカルボニル、t - ブトキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n - プロピルアミノカルボニル、i - プロピルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル及び/又はジエチルアミノカルボニルで場合により置換されていてもよいフリル、テトラヒドロフリル、チエニル、テトラヒドロチエニル若しくはピリジルを表す。

【 0 0 2 8 】

10

20

30

40

50

Xは、好ましくは、ニトロ、シアノ、ハロゲン又は基 $A^2 - X^2$ を表し、ここで、 A^2 は、単結合、O (酸素)、S (硫黄)、SO、 SO_2 、 OSO_2 、 $NHSO_2$ 、CO、OCO若しくはNHCOを表すか、又は、1~10個の炭素原子を有する直鎖若しくは分枝鎖のアルカンジイル(アルキレン)を表し、 X^2 は、1~10個の炭素原子を有するアルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシイミノ又は $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表すか、いずれの場合も2~10個の炭素原子を有するアルケニル若しくはアルキニル(ここで、該アルケニル又はアルキニルは、いずれの場合も、シアノ、ハロゲン及び/又は $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表すか、3~6個の炭素原子を有するシクロアルキル(ここで、該シクロアルキルは、シアノ、ハロゲン及び/又は $C_1 - C_6$ - アルキルで場合により置換されていてもよい。)を表すか、又は、6個若しくは10個の炭素原子を有するアリール(ここで、該アリールは、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、ジ($C_1 - C_6$ - アルキル)アミノスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシイミノ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノカルボニル及び/又はジ($C_1 - C_6$ - アルキル)アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表す。

【0029】

Xは、さらに好ましくは、ニトロ、シアノ、ハロゲン又は基 $A^2 - X^2$ を表し、ここで、 A^2 は、単結合、O (酸素)、S (硫黄)、SO、 SO_2 、 OSO_2 、 $NHSO_2$ 、CO、OCO若しくはNHCOを表すか、又は、1~6個の炭素原子を有する直鎖若しくは分枝鎖のアルカンジイル(アルキレン)を表し、 X^2 は、1~6個の炭素原子を有するアルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_5$ - アルコキシ、 $C_1 - C_5$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシイミノ又は $C_1 - C_5$ - アルコキシカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表すか、いずれの場合も2~6個の炭素原子を有するアルケニル若しくはアルキニル(ここで、該アルケニル又はアルキニルは、いずれの場合もシアノ、ハロゲン及び/又は $C_1 - C_5$ - アルコキシカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表すか、3~6個の炭素原子を有するシクロアルキル(ここで、該シクロアルキルは、シアノ、ハロゲン及び/又は $C_1 - C_5$ - アルキルで場合により置換されていてもよい。)を表すか、又は、6個若しくは10個の炭素原子を有するアリール(ここで、該アリールは、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシ、 $C_1 - C_5$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_5$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_5$ - ハロアルキルスルホニル、ジ($C_1 - C_5$ - アルキル)アミノスルホニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシイミノ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_5$ - アルキルアミノカルボニル及び/又はジ($C_1 - C_5$ - アルキル)アミノカルボニルで場合により置換されていてもよい。)を表す。

【0030】

Xは、最も好ましくは、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素又は基 $A^2 - X^2$ を表し、ここで、 A^2 は、単結合、O (酸素)、S (硫黄)、SO、 SO_2 、 OSO_2 、 $NHSO_2$ 、CO、OCO若しくはNHCOを表すか、又は、メチレン、エタン - 1,

1 - ジイル (エチリデン)、エタン - 1, 2 - ジイル (ジメチレン)、プロパン - 1, 1 - ジイル (プロピリデン)、プロパン - 1, 2 - ジイル若しくはプロパン - 1, 3 - ジイル (トリメチレン) を表し、 X^2 は、いずれの場合もヒドロキシ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、*n* - プロポキシ、*i* - プロポキシ、*n* - ブトキシ、*i* - ブトキシ、*s* - ブトキシ、*t* - ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n* - プロピルチオ、*i* - プロピルチオ、*n* - ブチルチオ、*i* - ブチルチオ、*s* - ブチルチオ、*t* - ブチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、アセチル、プロピオニル、*n* - ブチロイル、*i* - ブチロイル、メトキシイミノ、エトキシイミノ、*n* - プロポキシイミノ、*i* - プロポキシイミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n* - プロポキシカルボニル、*i* - プロポキシカルボニル、*n* - ブトキシカルボニル、*i* - ブトキシカルボニル、*s* - ブトキシカルボニル若しくは *t* - ブトキシカルボニルで場合により置換されていてもよいメチル、エチル、*n* - プロピル、*i* - プロピル、*n* - ブチル、*i* - ブチル、*s* - ブチル若しくは *t* - ブチルを表すか、いずれの場合もシアノ、フッ素、塩素、臭素、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n* - プロポキシカルボニル若しくは *i* - プロポキシカルボニルで場合により置換されていてもよいエテニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、エチニル、プロピニル、ブチニル若しくはペンチニルを表すか、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n* - プロピル若しくは *i* - プロピルで場合により置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル若しくはシクロヘキシルを表すか、又は、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、*n* - プロピル、*i* - プロピル、*n* - ブチル、*i* - ブチル、*s* - ブチル、*t* - ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、*n* - プロポキシ、*i* - プロポキシ、*n* - ブトキシ、*i* - ブトキシ、*s* - ブトキシ、*t* - ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n* - プロピルチオ、*i* - プロピルチオ、*n* - ブチルチオ、*i* - ブチルチオ、*s* - ブチルチオ、*t* - ブチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、アセチル、プロピオニル、*n* - ブチロイル、*i* - ブチロイル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル、エトキシイミノエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n* - プロポキシカルボニル、*i* - プロポキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、*n* - プロピルアミノカルボニル、*i* - プロピルアミノカルボニル及び/又はジメチルアミノカルボニルで場合により置換されていてもよいフェニルを表す。

10

20

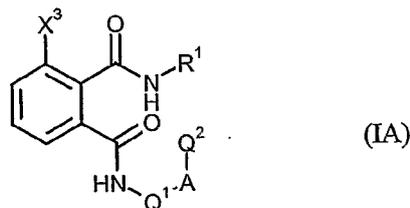
30

【0031】

さらに特に好ましい群は、構造 (IA)

【0032】

【化18】



40

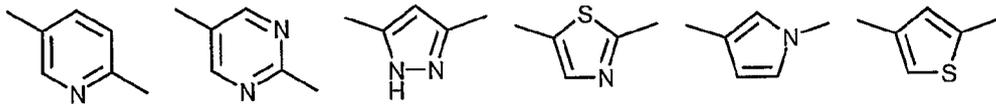
[上記構造中、

A は、メチレンを表し；

Q¹ は、以下のヘテロ環基のうちの1つを表し

【0033】

【化19】



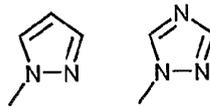
ここで、これらの基は、いずれの場合も、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される、場合により1つ又は場合により2つの置換基を含んでいてもよく；

10

Q^2 は、以下のヘテロ環基のうちの1つを表し

【0034】

【化20】



ここで、これらの基は、いずれの場合も、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される置換基を場合により含んでいてもよく；

20

R^1 は、基 $A^1 - X^1$ を表し、ここで、 A^1 は単結合を表し、 X^1 は、いずれの場合もヒドロキシ、シアノ、カルバモイル、ヒドロキシイミノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*i*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、*i*-ブトキシ、*s*-ブトキシ、*t*-ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-プロピルチオ、*i*-プロピルチオ、*n*-ブチルチオ、*i*-ブチルチオ、*s*-ブチルチオ、*t*-ブチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、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、*i*-プロピルアミノスルホニル、*n*-ブチルアミノスルホニル、*i*-ブチルアミノスルホニル、*s*-ブチルアミノスルホニル、*t*-ブチルアミノスルホニル、アセチル、プロピオニル、*n*-ブチロイル、*i*-ブチロイル、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、*n*-ブチロイルアミノ、*i*-ブチロイルアミノ、メチルアミノカルボニルオキシ、エチルアミノカルボニルオキシ、*n*-プロピルアミノカルボニルオキシ、*i*-プロピルアミノカルボニルオキシ、ジメチルアミノカルボニルオキシ、ジエチルアミノカルボニルオキシ、メトキシイミノ、エトキシイミノ、プロポキシイミノ、ブトキシイミノ、メトシカルボニル、エトシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、*i*-プロポキシカルボニル、*n*-ブトキシカルボニル、*i*-ブトキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニル、*t*-ブトキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、*n*-プロピルアミノカルボニル、*i*-プロピルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル又はジエチルアミノカルボニルで場合により置換されていてもよいメチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル又は *t*-ブチルを表し；及び、

30

40

X^3 は、塩素、臭素、ヨウ素、メチルスルホニルオキシ又はエチルスルホニルオキシを表す。]

で表される化合物である。

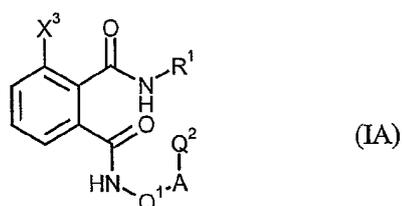
50

【 0 0 3 5 】

最も特に好ましい群は、構造 (I A)

【 0 0 3 6 】

【 化 2 1 】



10

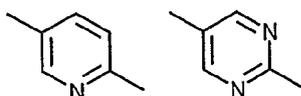
[上記構造中、

A は、メチレンを表し；

Q¹ は、以下のヘテロ環基のうちの 1 つを表し

【 0 0 3 7 】

【 化 2 2 】



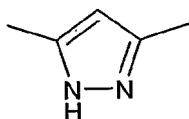
20

ここで、これらの基は、いずれの場合も、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される置換基（最も好ましくは、メチルである。）を場合により含んでいてもよく；

Q¹ は、さらに、以下のヘテロ環基も表し

【 0 0 3 8 】

【 化 2 3 】



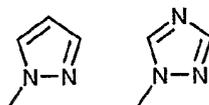
30

ここで、この基も、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される置換基（最も好ましくは、メチルである。）を場合により含んでいてもよく；

Q² は、以下のヘテロ環基のうちの 1 つを表し

【 0 0 3 9 】

【 化 2 4 】



40

ここで、これらの基は、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリ

50

フルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニルから選択される置換基（最も好ましくは、トリフルオロメチルである。）を場合により含んでいてもよく；

さらに、 Q^2 に関して最も好ましい置換基は、フッ素、ヨウ素、ジフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロプロピル及びメチルスルホニルであり；

R^1 は、1 - メチル - 2 - メチルチオエチル、1 - メチル - 2 - エチルチオエチル、1 - メチル - 2 - メチルスルフィニルエチル、1 - メチル - 2 - エチルスルフィニルエチル、1 - メチル - 2 - メチルスルホニルエチル、1 - メチル - 2 - エチルスルホニルエチルを表し、最も好ましくは、(S) - 1 - メチル - 2 - メチルチオエチル、(S) - 1 - メチル - 2 - エチルチオエチル、(S) - 1 - メチル - 2 - メチルスルホニルエチル、(S) - 1 - メチル - 2 - エチルスルホニルエチル、(S) - 1 - メチル - 2 - エチルスルホニルエチルを表し；及び、

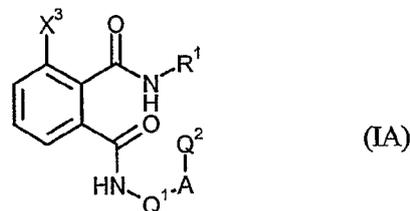
X^3 は、塩素、臭素、ヨウ素又はメチルスルホニルオキシを表す。]
で表される化合物である。

【 0 0 4 0 】

最も特に好ましい群は、構造 (I A)

【 0 0 4 1 】

【 化 2 5 】



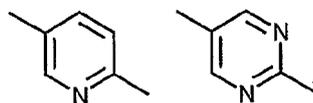
[上記構造中、

A は、メチレンを表し；

Q^1 は、以下のヘテロ環基のうちの1つを表し

【 0 0 4 2 】

【 化 2 6 】

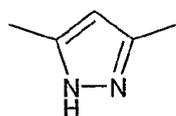


ここで、これらの基は、いずれの場合も、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチルから選択される置換基（最も好ましくは、メチルである。）を場合により含んでいてもよく；

Q^1 は、さらに、以下のヘテロ環基も表し

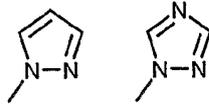
【 0 0 4 3 】

【 化 2 7 】



ここで、この基は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチルから選択される置換基（最も好ましくは、メチルである。）を場合により含んでいてもよく；

Q² は、以下のヘテロ環基のうちの1つを表し
 【0044】
 【化28】



ここで、これらの基は、いずれの場合も、フッ素、ヨウ素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロエチル、クロロエチル、ジフルオロエチル、ジクロロエチル、クロロフルオロエチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、クロロジフルオロエチル、フルオロジクロロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、メチルスルホニルから選択される置換基（最も好ましくは、トリフルオロメチルである。）を場合により含んでいてもよく；

10

さらに、Q² に関して最も好ましい置換基は、フッ素、ヨウ素、ジフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロプロピル及びメチルスルホニルであり；

R¹ は、1 - メチル - 2 - メチルチオエチル、1 - メチル - 2 - メチルスルフィニルエチル、1 - メチル - 2 - メチルスルホニルエチルを表し、最も好ましくは、(S) - 1 - メチル - 2 - メチルチオエチル、(S) - 1 - メチル - 2 - メチルスルフィニルエチル、(S) - 1 - メチル - 2 - メチルスルホニルエチルを表し；及び、

20

X³ は、塩素、臭素、ヨウ素又を表す。]

で表される化合物である。

【0045】

上記で定義された一般的な残基及び好ましい残基の定義は、構造(I)で表される最終生成物と、調製に必用ないずれの場合も対応する出発物質及び中間体の両方に適用される。これらの残基の定義は、互いに任意に組み合わせることが可能であり、これは、好ましい範囲の間で組み合わせることを包含する。

【0046】

本発明によれば、上記で好ましいものとして与えられている意味の組合せが存在している構造(I)の化合物は、好ましい。

30

【0047】

本発明によれば、上記でさらに好ましいものとして与えられている意味の組合せが存在している構造(I)の化合物は、さらに好ましい。

【0048】

本発明によれば、上記で最も好ましいものとして与えられている意味の組合せが存在している構造(I)の化合物は、最も好ましい。

【0049】

本発明によれば、上記で最も特に好ましいものとして与えられている意味の組合せが存在している構造(I)の化合物は、最も特に好ましい。

【0050】

40

上記及び下記で与えられている残基の定義において、アルキルなどの炭化水素残基は、さらに、アルコキシの場合のようにヘテロ原子との組合せにおいても、いずれの場合も、可能である限り、直鎖又は分枝鎖である。

【0051】

上記で定義されている置換基の種類に応じて、構造(I)で表される化合物は、酸性又は塩基性の特性を有することができ、塩を形成することが可能である。構造(I)で表される化合物が、ヒドロキシ、カルボキシ又は酸性特性を誘導する別の基を有する場合、これらの化合物は、塩基を用いて塩に変換することができる。適切な塩基は、例えば、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩、特に、ナトリウム、カリウム、マグネシウム及びカルシウムの酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩であり、さらにまた

50

、(C₁ - C₄) - アルキル残基を有するアンモニア、第1級アミン、第2級アミン及び第3級アミン並びに(C₁ - C₄) - アルカノールのモノアルカノールアミン、ジアルカノールアミン及びトリアルカノールアミンも適している。構造(I)で表される化合物が、アミノ、アルキルアミノ又は塩基性特性を誘導する別の基を有している場合、それらの化合物は、酸を用いて塩に変換することができる。適切な酸は、例えば、鉱酸、例えば、塩酸、硫酸及びリン酸、有機酸、例えば、酢酸又はシュウ酸、並びに、酸性塩、例えば、NaHSO₄及びKHSO₄などである。そのようにして得られた塩も、殺菌特性、殺虫特性、殺ダニ特性(acaricidal and miticidal properties)を示す。

【0052】

塩基性化合物又は酸性化合物を用いて変換することにより構造(I)で表される化合物から形成される塩様誘導体、並びに、通常の酸化方法により調製されたN - オキシドも、本発明の対象である。

10

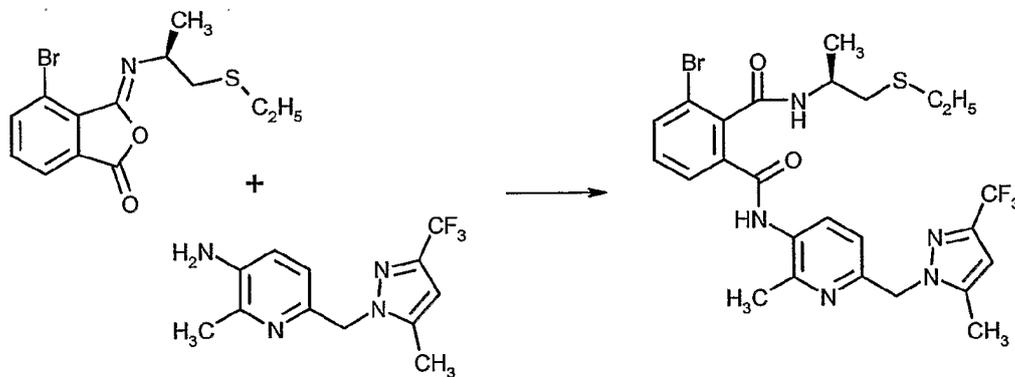
【0053】

例えば、(3Z) - 4 - ブロモ - 3 - { [(1S) - 2 - (エチルチオ) - 1 - メチル - エチル] アミノ } - 2 - ベンゾフラン - 1 (3H) オン及び2 - メチル - 6 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] メチル } ピリジン - 3 - アミンが出発物質として使用される場合、本発明の方法の反応の進行は、以下の反応スキームにより略述することができる

【0054】

【化29】

20



30

【0055】

本発明の構造(I)で表される化合物を調製するための出発物質として使用される3 - イミノ - 2 - ベンゾフラン - 1 (3H) - オンは、一般に、構造(II)で定義される。構造(II)において、n、R¹及びXは、それぞれ、好ましくは、又は、特に、構造(I)で表される本発明の化合物についての記載に関連して、n、R¹及びXについてそれぞれ好ましい又はさらに好ましいものとして既に上記で定義された意味を有する。

【0056】

構造(II)で表される出発物質は、既知であるか、及び/又は、既知方法で調製可能である(c f . EP - A 0 9 1 9 5 4 2、EP - A 1 0 0 6 1 0 2、EP - A 1 0 0 6 1 0 7、US 6, 5 5 9, 3 4 1、WO 0 1 / 2 1 5 7 6、WO 0 2 / 8 8 0 7 5、WO 0 2 / 9 4 7 6 5、WO 0 3 / 0 9 3 2 2 8)。これらは、部分的に、先の出願の主題でもある(c f . 2 0 0 4 年 8 月 3 1 日 の 欧 州 特 許 出 願 No . 0 4 0 2 0 6 1 8 . 7 ; c f . 調製実施例)。

40

【0057】

本発明の構造(I)で表される化合物の本発明による調製のための出発物質としてさらに使用される置換ヘテロシクリルアミンは、一般に、構造(III)で定義される。構造(III)において、A、Q¹及びQ²は、それぞれ、好ましくは、又は、特に、構造(I)で表される本発明の化合物についての記載に関連して、A、Q¹及びQ²についてそ

50

れぞれ好ましい又はさらに好ましいものとして既に上記で定義された意味を有する。

【0058】

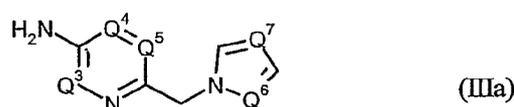
構造(III)で表される出発物質は、既知であるか、及び/又は、既知方法で調製可能である(c f . J . H e t e r o c y c l . C h e m . 20(1983), 807-809; J . M e d . C h e m . 21(1978), 331-337; J . O r g . C h e m . 42(1977), 1523-1527; 上記引用文献中 43(1978), 736-737; WO00/61572; WO02/070494)。

【0059】

構造(IIIa)

【0060】

【化30】



[上記構造中、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 及び Q^7 は、いずれの場合も、CH又はN(窒素)を表し、当該2つのヘテロ環基において、CH位置におけるH原子は、いずれの場合も、上記で定義されている置換基Xのうちの1つで置き換えることもできる。]

で表されるアゾリルメチルアジンアミンは、これまで文献では知られておらず、新規物質として、本発明の対象である。

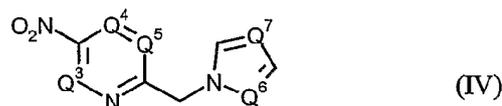
【0061】

構造(IIIa)で表される新規アゾリルメチルアジンアミンは、

(a) 構造(IV)

【0062】

【化31】



[上記構造中、 Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 及び Q^7 は、上記で定義されている意味を有する。]

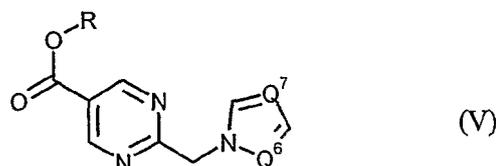
で表されるアゾリルメチルニトロアジンを、場合により希釈剤(例えば、エタノール)の存在下で、0 ~ 100 の温度で、通常還元剤(例えば、塩化スズ(II)/塩酸)と反応させることにより得られ(c f . 調製実施例)、

又は、 Q^3 及び Q^4 がCHを表し、且つ、 Q^5 がNを表す場合、

(b) 構造(V)

【0063】

【化32】



[上記構造中、

Q^3 、 Q^4 、 Q^5 、 Q^6 及び Q^7 は、上記で定義されている意味を有し；

Rは、アルキル、特に、メチル又はエチルを表す。]

10

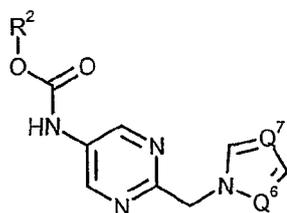
20

30

40

50

で表されるアゾリルメチルピリミジンカルボキシレートエステルを、通常の方法で、例えば、水性エタノール中で、0 ~ 100 の温度で、水酸化カリウムと反応させることにより加水分解し、得られた対応するカルボン酸を、窒素塩基(例えば、トリエチルアミン)の存在下、及び、アルコール(例えば、t-ブタノール)の存在下で、0 ~ 150 の温度でジフェニルホスホリルアジドと反応させ、そのようにして得られた構造(VI)
 【0064】
 【化33】



(VI)

10

[上記構造中、

Q⁶ 及び Q⁷ は、上記で定義されている意味を有し；

R² は、アルキル、好ましくは、C₁ - C₄ - アルキル、特に、t-ブチルを表す。] で表される N-アゾリルメチルピリミジニルカルバメートを、場合により希釈剤(例えば、塩化メチレン)の存在下で、-10 ~ +50 の温度で、強酸(例えば、トリフルオロ酢酸)と反応させることにより切断することにより得られる(c f . 調製実施例)。

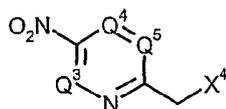
20

【0065】

合成の変形態様(a)に必要な構造(IV)で表されるアゾリルメチルニトロアジンは、これまで文献では知られていない。構造(IV)で表される新規アゾリルメチルニトロアジンは、構造(VII)

【0066】

【化34】



(VII)

30

[上記構造中、

Q³、Q⁴ 及び Q⁵ は、上記で定義されている意味を有し；

X⁴ は、ハロゲン、特に、塩素又は臭素を表す。]

で表されるハロメチルニトロアジンを、場合により塩基性反応助剤(例えば、炭酸カリウム)の存在下、及び、場合により希釈剤(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド)の存在下で、0 ~ 150 の温度で、構造(VIII)

【0067】

【化35】

40



(VIII)

[上記構造中、Q⁶ 及び Q⁷ は、上記で定義されている意味を有する。]

で表されるアゾールと反応させることにより得られる(c f . 調製実施例)。

【0068】

構造(VII)及び構造(VIII)で表される前駆物質は、既知であるか、及び/又

50

は、既知方法で調製可能である (cf. Synlett 3 (1991), 181-182; US 4,053,608; 調製実施例)。

【0069】

合成の変形態様 (b) に必要な構造 (V) で表されるアゾリルメチルピリミジンカルボキシレートエステル及び対応するカルボン酸は、これまで文献では知られておらず、新規物質として、同様に本出願の対象である。

【0070】

構造 (VI) で表される中間体 N - アゾリルメチルピリミジニルカルバメートも、これまで文献では知られていない。構造 (VI) で表される N - アゾリルメチルピリミジニルカルバメートは、新規物質として、同様に本出願の対象である。

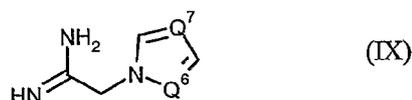
10

【0071】

構造 (V) で表される新規アゾリルメチルピリミジンカルボキシレートエステルは、構造 (IX)

【0072】

【化36】



20

[上記構造中、Q⁶ 及び Q⁷ は、上記で定義されている意味を有する。]
 で表されるアゾリルアセトアミジン又はそれらの酸付加体 (例えば、塩酸塩) を、塩基性反応助剤 (例えば、ナトリウムエチラート) の存在下、及び、希釈剤 (例えば、エタノール) の存在下で、-10 ~ +120 の温度で、適切な 2 - アルコキシメチレン - 3 - オキソ - アルカンカルボキシレートエステルと反応させることにより得られる (cf. 調製実施例)。

【0073】

構造 (IX) で表されるアゾリルアセトアミジンは、既知であるか又は既知方法で調製可能である。例えば、構造 (VII) で表されるアゾールを、例えばプロモ酢酸エチルと反応させて、酢酸アゾリルとすることができ (Abdul - Ghani et al., Journal of Fluorine Chemistry 1990, 48 (1), 149 - 52)、それを、次いで、さらに反応させて、構造 (IX) で表されるアミジンとすることができる (Gielen et al., Tetrahedron Lett. 2002, 43, 419 - 422)。

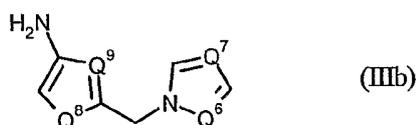
30

【0074】

同様に、構造 (IIIb)

【0075】

【化37】



40

[上記構造中、
 Q⁶ 及び Q⁷ は、上記で定義されている意味を有し；
 Q⁸ は、O (酸素) 又は S (硫黄) を表し；及び
 Q⁹ は、N (窒素) 又は CH を表すが、しかしながら、これらのヘテロ環基の CH 位置における H 原子は、いずれの場合も、上記で定義されている置換基 X のうちの 1 つで置き換えることもできる。]

で表されるアゾリルメチル化合物も、これまで文献では知られておらず、新規物質として

50

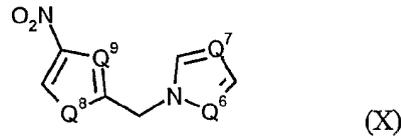
、本出願の対象である。

【0076】

構造 (I I I b) で表される新規アゾリルメチル化合物は、構造 (X)

【0077】

【化38】



10

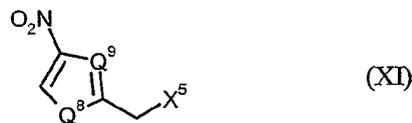
[上記構造中、 Q^6 、 Q^7 、 Q^8 及び Q^9 は、上記で定義されている意味を有する。]
 で表される対応するニトロ化合物を、場合により希釈剤 (例えば、エタノール) の存在下で、 $0 \sim 100$ の温度で、通常の還元剤 (例えば、塩化スズ (I I) / 塩酸) と反応させることにより得られる (c f . 調製実施例) 。

【0078】

構造 (X) で表されるニトロ化合物は、これまで文献では知られていない。それらは、構造 (X I) :

【0079】

【化39】



20

[上記構造中、

Q^8 及び Q^9 は、上記で定義されている意味を有し ;

X^5 は、ハロゲン (特に、塩素又は臭素) を表すか、又は、アルキルスルホニルオキシ (特に、メチルスルホニルオキシ又はエチルスルホニルオキシ) を表す。]

で表される対応する前駆物質及び式 (V I I I)

30

【0080】

【化40】



[上記構造中、 Q^6 及び Q^7 は、上記で定義されている意味を有する。]
 で表されるアゾレンから、場合により塩基性反応助剤 (例えば、炭酸カリウム) の存在下、及び、場合により希釈剤 (例えば、アセトニトリル) の存在下で、 $0 \sim 120$ の温度で、既知方法で調製することができる (c f . 調製実施例) 。

40

【0081】

構造 (X I) で表されるニトロ化合物は、既知であるか又は既知方法で調製可能である。例えば、対応するカルボン酸又はアルデヒドを最初に還元してアルコール ($X^5 =$ ヒドロキシ) とし、次いで、塩化スルホニルと反応させて、対応するスルホネートとする (合成例 X - 1 を参照されたい。) 。さらに、上記アルコールは、既知方法で臭素化することができる。

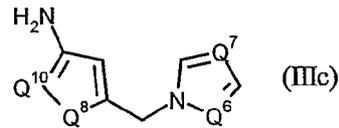
【0082】

さらに、構造 (I I I c)

【0083】

50

【化 4 1】



[上記構造中、

Q⁶、Q⁷ 及び Q⁸ は、上記で定義されている意味を有し；

Q¹⁰ は、N (窒素) 又は CH を表すが、しかしながら、これらのヘテロ環基の CH 位置における H 原子は、いずれの場合も、上記で定義されている置換基 X のうちの 1 つで置き換えることもできる。]

10

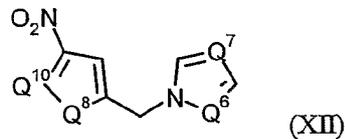
で表されるアゾリルメチル化合物も、これまで文献では知られておらず、新規物質として、本出願の対象である。

【 0 0 8 4】

構造 (I I I b) で表される新規アゾリルメチル化合物は、構造 (X I I)

【 0 0 8 5】

【化 4 2】



20

[上記構造中、Q⁶、Q⁷、Q⁸ 及び Q¹⁰ は、上記で定義されている意味を有する。]
 で表される対応するニトロ化合物を、場合により例えばエタノールの存在下で、0 ~ 100 の温度で、通常還元剤 (例えば、塩化スズ (I I) / 塩酸) と反応させることにより得られる (c f . 調製実施例) 。

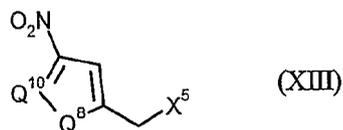
【 0 0 8 6】

構造 (X I I) で表されるニトロ化合物は、これまで文献では知られていない。それらは、構造 (X I I I) :

30

【 0 0 8 7】

【化 4 3】



[上記構造中、

Q⁸ 及び Q¹⁰ は、上記で定義されている意味を有し；

X⁵ は、ハロゲン (特に、塩素又は臭素) を表すか、又は、アルキルスルホニルオキシ (特に、メチルスルホニルオキシ又はエチルスルホニルオキシ) を表す。]

40

で表される対応する前駆物質及び式 (V I I I)

【 0 0 8 8】

【化 4 4】



(VIII)

〔上記構造中、 Q^6 及び Q^7 は、上記で定義されている意味を有する。〕
 で表されるアゾールから、場合により塩基性反応助剤（例えば、炭酸カリウム）の存在下、及び、場合により希釈剤（例えば、アセトニトリル）の存在下で、 $0 \sim 120$ の温度で、既知方法で調製することができる（cf. 調製実施例）。

10

【0089】

構造（XIII）で表されるニトロ化合物は、既知であるか又は既知方法で調製可能である。例えば、構造（XI）で表されるニトロ化合物の調製と同様に、対応するカルボン酸（又は、それらのエステル）又はアルデヒドを最初に還元してアルコール（ $X^5 =$ ヒドロキシ）とし、次いで、塩化スルホニルと反応させて、対応するスルホネートとする。さらに、上記アルコールは、既知方法で臭素化することができる。

【0090】

構造（I）で表される新規化合物を調製するための本発明の方法は、有利には、反応助剤の存在下で実施する。適切な反応助剤は、特に、プロトン酸及びルイス酸であり、特に、プロトン酸である。そのようなものとしては、例えば、塩化水素即ち塩酸、臭化水素、硫酸、リン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸及び *p*-トルエンスルホン酸などを挙げるることができる。

20

【0091】

構造（I）で表される新規化合物を調製するための本発明の方法は、有利には、希釈剤を用いて実施する。全ての不活性溶媒は、本発明の方法を実施するための希釈剤として適している。例として以下のものを挙げるることができる。炭化水素類、特に、クロロ炭化水素類、例えば、テトラクロロエチレン、テトラクロロエタン、ジクロロプロパン、塩化メチレン、ジクロロブタン、クロロホルム、テトラクロロメタン、トリクロロエタン、トリクロロエチレン、ペンタクロロエタン、ジフルオロベンゼン、1, 2-ジクロロエタン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ジクロロベンゼン、クロロトルエン、トリクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール；エーテル類、例えば、エチルプロピルエーテル、メチル *t*-ブチルエーテル、*n*-ブチルエーテル、アニソール、フェネトール、シクロヘキシルメチルエーテル、ジメチルエーテル、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジ-*n*-プロピルエーテル、ジイソブチルエーテル、ジイソアミルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロジエチルエーテル、並びに、エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシドのポリエーテル；アミン類、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、*N*-メチルモルホリン、ピリジン及びテトラメチレンジアミン；ニトロ炭化水素類、例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロプロパン、ニトロベンゼン、クロロニトロベンゼン、*o*-ニトロトルエン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、イソブチロニトリル、ベンゾニトリル、*m*-クロロベンゾニトリル、並びに、テトラヒドロチオフェンオキシド、ジメチルスルホキシド、テトラメチルスルホキシド、ジプロピルスルホキシド、ベンジルメチルスルホキシド、ジイソブチルスルホキシド、ジブチルスルホキシド、ジイソアミルスルホキシドなどの化合物；スルホン類、例えば、ジメチルスルホン、ジエチルスルホン、ジプロピルスルホン、ジブチルスルホン、ジフェニルスルホン、ジヘキシルスルホン、メチルヘキシルスルホン、エチルプロピルスルホン、エチルイソブチルスルホン及びペンタメチルスルホン；脂肪族炭化水素類、脂環式炭化水素類又は芳香族炭化水素類、例えば、沸点が例えば $40 \sim 250$ の範囲にある成分を有するいわゆるホワイトスピリット、シモール（*cymol*）、 $70 \sim 190$ の沸点範囲

30

40

50

にある石油留分、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、オクタン、ベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、プロモベンゼン、ニトロトルエン、キシレン；エステル類、例えば、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル、酢酸イソブチル、炭酸ジメチル、炭酸ジブチル、炭酸エチレン；アミド類、例えば、ヘキサメチレンリン酸トリアミド、ホルムアミド、N - メチルホルムアミド、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジブロピルホルムアミド、N, N - ジブチルホルムアミド、N - メチルピロリジン、N - メチルカプロラクタム、1, 3 - ジメチル 3, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - 2 (1H) ピリミジン、オクチルピロリジン、オクチルカプロラクタム、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリンジオン、N - ホルミルピペリジン、N, N' - 1, 4 - ジホルミルピペラジン；ケトン類、例えば、アセトン、アセトフェノン、メチルエチルケトン、メチル

10

【0092】

もちろん、本発明の方法は、上記で挙げた溶媒又は希釈剤の混合物中で実施することも可能である。

【0093】

本発明の方法を実施する場合、反応温度は広い範囲にわたり変えることができる。一般に、-30 ~ +150 の温度、好ましくは、-10 ~ +100 の温度を使用する。

【0094】

本発明の方法は、一般に、標準圧力下で実施する。しかしながら、本発明の方法は、加圧下又は減圧下（一般に、0.1 パール ~ 15 パール）で実施することも可能である。

20

【0095】

本発明の方法を実施するには、出発物質は、一般に、ほぼ等モル量で使用する。しかしながら、これら成分のうちの1つを比較的大過剰量で使用することも可能である。反応は、一般に、適切な希釈剤の中で、反応助剤の存在下で、場合によりさらに保護雰囲気中（例えば、窒素下、アルゴン下、又は、ヘリウム下）で実施する。一般に、反応混合物を、必要とされる温度で数時間攪拌する。後処理は、標準的な方法で実施する（cf. 調製実施例）。

【0096】

本発明の構造（I）で表される活性化化合物は、植物が良好な耐性を示し、温血動物に対する毒性は望ましい程度であり、また、環境適合性が良好でありながら、同時に、植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、動物育種において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質（materials）の保護において、及び、衛生学の分野において発生する害虫（zoopest）、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、植物保護剤として使用することができる。それらは、通常的感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して活性を示す。上記有害生物としては、以下のものを挙げる事ができる。

30

【0097】

シラミ目（Anoplura）（Phthiraptera）の、例えば、ダマリニア属種（*Damalinea* spp.）、ハエマトピヌス属種（*Haematopinus* spp.）、リノグナツス属種（*Linognathus* spp.）、ベジクルス属種（*Pediculus* spp.）、トリコデクテス属種（*Trichodectes* spp.）。

40

【0098】

クモ綱（Arachnida）の、例えば、アカルス・シロ（*Acarus siro*）、アセリア・シェルドニ（*Aceria sheldoni*）、アクロス属種（*Aculops* spp.）、アクルス属種（*Aculus* spp.）、アンブリオンマ属種（*Amblyomma* spp.）、アルガス属種（*Argas* spp.）、ポオフィルス属種（*Boophilus* spp.）、ブレビパルプス属種（*Brevipalpus* spp.）、ブリオビア・ブラエチオサ（*Bryobia praetiosa*）、コリオプテス属種（*Chorioptes* spp.）、デリマニスス・ガリナエ（*Dermanyssus gallinae*）、エオテトラニクス属種（*Eotetranychus* spp.）

50

、エピトリメルス・ピリ (Epitrimerus pyri)、エウテトラニクス属種 (Eutetranychus spp.)、エリオフィエス属種 (Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属種 (Hemitarsonemus spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、イクソデス属種 (Ixodes spp.)、ラトロデクツス・マクタンズ (Latrodectus mactans)、メタテトラニクス属種 (Metatetranychus spp.)、オリギニクス属種 (Oligonychus spp.)、オルニトドロス属種 (Ornithodoros spp.)、パノニクス属種 (Panonychus spp.)、フィロコプトルタ・オレイボラ (Phyllocoptruta oleivora)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (Polyphagotarsonemus latus)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス属種 (Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、スコルピオ・マルス (Scorpio maurus)、ステノタルソネムス属種 (Stenotarsonemus spp.)、タルソネムス属種 (Tarsonemus spp.)、テトラニクス属種 (tetranychus spp.)、バサテス・リコベルシシ (Vasates lycopersici)。

【 0 0 9 9 】

ニマイガイ綱 (Bivalva) の、例えば、ドレイセナ属種 (Dreissena spp.)。

【 0 1 0 0 】

キロポーダ目 (Chilopoda) の、例えば、ゲオフィルス属種 (Geophilus spp.)、スクチゲラ属種 (Scutigera spp.)。

【 0 1 0 1 】

コウチュウ目 (Coleoptera) の、例えば、アカントセリデス・オブテクツス (Acanthoscelides obtectus)、アドレツス属種 (Adoretus spp.)、アゲラスチカ・アルニ (Agelastica alni)、アグリオテス属種 (Agriotes spp.)、アンフィマロン・ソルスチチアリス (Amphimallon solstitialis)、アノビウム・プンクタツム (Anobium punctatum)、アノプロフォラ属種 (Anoplophora spp.)、アントノムス属種 (Anthonomus spp.)、アントレヌス属種 (Anthrenus spp.)、アポゴニア属種 (Apogonia spp.)、アトマリア属種 (Atomaria spp.)、アタゲヌス属種 (Attagenus spp.)、ブルキジウス・オブテクツス (Bruchidius obtectus)、ブルクス属種 (Bruchus spp.)、セウトリンクス属種 (Ceuthorhynchus spp.)、クレオヌス・メンジクス (Cleonus mendicus)、コノデルス属種 (Conoderus spp.)、コスモポリテス属種 (Cosmopolites spp.)、コステリトラ・ゼアランジカ (Costelytra zealandica)、クルクリオ属種 (Curculio spp.)、クリプトリンクス・ラパチ (Cryptorhynchus lapathi)、デルメステス属種 (Dermestes spp.)、ジアブロチカ属種 (Diabrotica spp.)、エピラクナ属種 (Epilachna spp.)、ファウスチヌス・クバエ (Faustinus cubae)、ジビウム・プシロイデス (Gibbium psyllioides)、ヘテロニクス・アラトル (Heteronychus arator)、ヒラモルファ・エレガンス (Hylamorpha elegans)、ヒロトルペス・バジュルス (Hylotrupes bajulus)、ヒペラ・ポスチカ (Hypera postica)、ヒポテネムス属種 (Hypothenemus spp.)、ラクノステルナ・コンサンゲイネア (Lachnosterna consanguinea)、レプチノタルサ・デセムリネア (Leptinotarsa decemlineata)、リソロプトルス・オリゾフィルス (Lissorhoptrus oryzophilus)、リキス属種 (Lixus spp.)、リクツス属種 (Lyctus spp.)、メリゲテス・アエネウス (Meligethes aeneus)、メロロンタ・メロロンタ (Melolontha melolontha)、ミギドルス属種 (Migdolus spp.)、モノカムス属種 (Monochamus spp.)、ナウパクツス・キサントグラフス (Naupactus xanthographus)、ニプツス・ホロレウクス (Niptus hololeucus)、オリクテス・リノセロス (Oryctes rhinoceros)、オリザエフィルス・スリナメンシス (Oryzaephilus surinamensis)、オチオリンクス・スルカツス (Otiorrhynchus sulcatus)、オキシセトニア・ジュクンダ (Oxycetonia jucunda)、ファエドン・コクレアリアエ (Phaedon cochleariae)、フィロファガ属種 (Phyllophaga spp.)、ポリア・ジャポニカ (Popillia japonica)、プレモトリペス属種 (Premnotrypes spp.)、プシリオデス・クリソセファラ (Psylliodes chrysocephala)、プチヌス属種 (Ptinus spp.)、リゾビウス・ベントラリス (Rhizobius ventralis)、リゾペルタ・ドミニカ (Rhizopertha dominica)、シトフィルス属種 (Sitophilus spp.)、スフェノホルス属種 (Sphenophorus spp.)、ステルネクス属種 (Sternechus spp.)、シンフィレテス属種 (Symphyletes

10

20

30

40

50

spp.)、テネブリオ・モリトル (Tenebrio molitor)、トリボリウム属種 (Tribolium sp. p.)、トロゴデルマ属種 (Trogoderma spp.)、チキウス属種 (Tychius spp.)、キシロトレクス属種 (Xylotrechus spp.)、ザブルス属種 (Zabrus spp.)。

【0102】

トビムシ目 (Collembola) の、例えば、オニキウルス・アルマツス (Onychiurus armatus)。

【0103】

ハサミムシ目 (Dermaptera) の、例えば、フォルフィクラ・アウリクラリア (Forficula auricularia)。

【0104】

ジブローダ目 (Diplopoda) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (Blaniulus guttulatus)。

【0105】

ハエ目 (Diptera) の、例えば、アエデス属種 (Aedes spp.)、アノフェレス属種 (Anopheles spp.)、ビビオ・ホルツラヌス (Bibio hortulanus)、カリホラ・エリトロセファラ (Calliphora erythrocephala)、セラチチス・カピタタ (Ceratitis capitata)、クリソミア属種 (Chrysomya spp.)、コクリオミア属種 (Cochliomyia spp.)、コルジオビア・アントロポファガ (Cordylobia anthropophaga)、クレクス属種 (Culex sp. p.)、クテレブラ属種 (Cuterebra spp.)、ダクス・オレアエ (Dacus oleae)、デルマトビア・ホミニス (Dermatobia hominis)、ドロソフィラ属種 (Drosophila spp.)、ファンニア属種 (Fannia spp.)、ガストロフィルス属種 (Gastrophilus spp.)、ヒレミア属種 (Hylemyia spp.)、ヒポドスカ属種 (Hyppobosca spp.)、ヒポデルマ属種 (Hypoderma spp.)、リリロミザ属種 (Liriomyza spp.)、ルシリア属種 (Lucilia spp.)、ムスカ属種 (Musca spp.)、ネザラ属種 (Nezara spp.)、オエストルス属種 (Oestrus spp.)、オシネラ・フリト (Oscinella frit)、ペゴミア・ヒオシアミ (Pegomyia hyoscyami)、ホルビア属種 (Phorbia spp.)、ストモキス属種 (Stomoxys spp.)、タバヌス属種 (Tabanus spp.)、タエニア属種 (Taenia spp.)、チプラ・パルドサ (Tipula paludosa)、ウォールファルチア属種 (Wohlfahrtia spp.)。

【0106】

マキガイ綱 (Gastropoda) の、例えば、アリオン属種 (Arion spp.)、ビオムファラリア属種 (Biomphalaria spp.)、ブリヌス属種 (Bulinus spp.)、デロセラス属種 (Deroceras spp.)、ガルバ属種 (Galba spp.)、リムナエア属種 (Lymnaea spp.)、オンコメラニア属種 (Oncomelania spp.)、スクシネア属種 (Succinea spp.)。

【0107】

ゼンチュウ綱 (Helminths) の、例えば、アンシロストマ・ズオデナレ (Ancylostoma duodenale)、アンシロストマ・セイラニクム (Ancylostoma ceylanicum)、アンシロストマ・ブラジリエンス (Acylostoma braziliensis)、アンシロストマ属種 (Ancylostoma spp.)、アスカリス・ルブリコイデス (Ascaris lubricoides)、アスカリス属種 (Ascaris spp.)、ブルギア・マライ (Brugia malayi)、ブルギア・チモリ (Brugia timori)、ブノストムム属種 (Bunostomum spp.)、カベルチア属種 (Chabertia spp.)、クロノルキス属種 (Clonorchis spp.)、コオペリア属種 (Cooperia spp.)、ジクロコエリウム属種 (Dicrocoelium spp.)、ジクチオカウルス・フィラリア (Dictyocaulus filaria)、ジフィロボトリウム・ラツム (Diphyllobothrium latum)、ドラクンクルス・メジネンシス (Dracunculus medinensis)、エキノコックス・グラヌロス (Echinococcus granulosus)、エキノコックス・ムルチロクラリス (Echinococcus multilocularis)、エンテロビウス・ベルミクラリス (Enterobius vermicularis)、ファシオラ属種 (Faciola spp.)、ハエモンクス属種 (Haemonchus spp.)、ヘテラキス属種 (Heterakis spp.)、ヒメノレピス・ナナ (Hymenolepis nana)、ヒオストロングルス属種 (Hyostrogylus spp.)、ロア・ロア (Loa Loa)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、オエソファゴストムム属種 (Oesophagostomum spp.)、オピストロキス属種 (Opisthorchis spp.)、オン

10

20

30

40

50

コセルカ・ボルブルス (*Onchocerca volvulus*)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、パラギニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、シストソメン属種 (*Schistosomen* spp.)、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロニロイデス属種 (*Stronyloides* spp.)、タエニア・サギナタ (*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム (*Taenia solium*)、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・プセウドプシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコストロングルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria*)、ウケレリア・バンククロフチ (*Wuchereria bancrofti*)

10

【0108】

さらにまた、エイメリア (*Eimeria*) などの原生動物も防除することができる。

【0109】

ヘテロプテラ目 (*Heteroptera*) の、例えば、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属種 (*Antestiopsis* spp.)、プリスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp.)、シメクス属種 (*Cimex* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウエチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデルクス属種 (*Dysdercus* spp.)、エウシスツス属種 (*Euschistus* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ヘリオペルチス属種 (*Heliopeltis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリア属種 (*Leptocoris* spp.)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、マクロペス・イクスカバツス (*Macropes excavatus*)、ミリダエ (*Miridae*)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クワドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、プサルス・セリアツス (*Psallus seriatus*)、プセウドアシスタ・ベルセア (*Pseudacysta persea*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サフルベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)。

20

30

【0110】

ホモプテラ目 (*Homoptera*) の、例えば、アシルトシポン属種 (*Acyrtosipon* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレウロデス属種 (*Aleurodes* spp.)、アレウロロプス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクスス属種 (*Aleurothrixus* spp.)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフィス属種 (*Aphis* spp.)、アルポリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アスピジエリア属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア属種 (*Bemisia* spp.)、ブラキカウズス・ヘリクリシイ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カリジボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシフォン・フラゲホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*C*

40

50

icadulina mbila)、ココミチルス・ハリイ (Coccomytilus halli)、コクス属種 (Coccus spp.)、クリプトミズス・リビス (Cryptomyzus ribis)、ダルブルス属種 (Dalbulus spp.)、ジアレウロデス属種 (Dialeurodes spp.)、ジアホリナ属種 (Diaphorina spp.)、ジアスピス属種 (Diaspis spp.)、ドラリス属種 (Doralis spp.)、ドロシカ属種 (Drosicha spp.)、ジサフィス属種 (Dysaphis spp.)、ジスミコクス属種 (Dysmicoccus spp.)、エンポアスカ属種 (Empoasca spp.)、エリオソマ属種 (Eriosoma spp.)、エリトロネウラ属種 (Erythroneura spp.)、エウセリス・ピロバツス (Euscelis bilobatus)、ゲオコクス・コフェアエ (Geococcus coffeae)、ホマロジスカ・コアグラタ (Homalodisca coagulata)、ヒアロプテルス・アルンジニス (Hyalopterus arundinis)、イセリア属種 (Icerya spp.)、イジオセルス属種 (Idiocerus spp.)、イジオスコプス属種 (Idioscopus spp.)、ラオデルファクス・ストリアテルス (Laodelphax striatellus)、レカニウム属種 (Lecanium spp.)、レピドサフェス属種 (Lepidosaphes spp.)、リパフィス・エリシミ (Lipaphis erysimi)、マクロシフム属種 (Macrosiphum spp.)、マハナルバ・フィムブリオラタ (Mahanarva fimbriolata)、メラナフィス・サッカリ (Melanaphis sacchari)、メトカルフィエラ属種 (Metcalfiella spp.)、メトポロフィウム・ジロズム (Metopolophium dirhodum)、モネリア・コスタリス (Monellia costalis)、モネリオブシス・ペカニス (Monelliopsis pecanis)、ミズス属種 (Myzus spp.)、ナソノビア・リビスニグリ (Nasonovia ribisnigri)、ネホテチキス属種 (Nephotettix spp.)、ニラバルバタ・ルゲンス (Nilaparvata lugens)、オンコメトピア属種 (Oncometopia spp.)、オルテジア・プラエロンガ (Orthezia praelonga)、パラベムシア・ミリカエ (Parabemisia myricae)、パラトリオザ属種 (Paratrioza spp.)、パルラトリア属種 (Parlatoria spp.)、ペムフィグス属種 (Pemphigus spp.)、ペレグリヌス・マイジス (Peregrinus maidis)、フェナコクス属種 (Phenacoccus spp.)、フロエオミズス・パセリニイ (Phloeomyzus passerinii)、フォロドン・フムリ (Phorodon humuli)、フィロキセラ属種 (Phylloxera spp.)、ピンナスピス・アスピジストラエ (Pinnaspis aspidistrae)、プラノコクス属種 (Planococcus spp.)、プロトブルブナリア・ピリホルミス (Protospulvinaria pyriformis)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (Pseudaulacaspis pentagona)、プセウドコクス属種 (Pseudococcus spp.)、プシラ属種 (Psylla spp.)、プテロマヌス属種 (Pteromalus spp.)、ピリラ属種 (Pyrilla spp.)、クアドラスピジオツス属種 (Quadraspidotus spp.)、クエサダ・ギガス (Quesada gigas)、ラストロコクス属種 (Rastrococcus spp.)、ロパロシフルム属種 (Rhopalosiphum spp.)、サイセチア属種 (Saissetia spp.)、スカフォイデス・チタヌス (Scaphoides titanus)、シザフィス・グラミナム (Schizaphis graminum)、セレナスピズス・アルチクラツス (Selenaspis articulatus)、ソガタ属種 (Sogata spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (Sogatella furcifera)、ソガトデス属種 (Sogatodes spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (Stictocephala festina)、テナラファラ・マラエンシス (Tenalaphara malayensis)、チノカリス・カリアエフォリアエ (Tinocallis caryaefoliae)、トマスピス属種 (Tomaspis spp.)、トキソプテラ属種 (Toxoptera spp.)、トリアレウロデス・バボラリオルム (Trialeurodes vaporariorum)、トリオザ属種 (Trioza spp.)、チフロシバ属種 (Typhlocyba spp.)、ウナスピス属種 (Unaspis spp.)、ビテウス・ビチホリイ (Viteus vitifolii)。

【 0 1 1 1 】

ハチ目 (Hymenoptera) の、例えば、ジプリオン属種 (Diprion spp.)、ホプロカンパ属種 (Hoplocampa spp.)、ラシウス属種 (Lasius spp.)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、ベスパ属種 (Vespa spp.)。

【 0 1 1 2 】

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

【 0 1 1 3 】

10

20

30

40

50

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、レチクリテルメス属種 (Reticulitermes spp.)、オドントテルメス属種 (Odontotermes spp.)。

【 0 1 1 4 】

チョウ目 (Lepidoptera) の、例えば、アクロニクタ・マジヨル (Acronicta major)、アエジア・レウコメラス (Aedia leucomelas)、アグロチス属種 (Agrotis spp.)、アラバマ・アルギアセア (Alabama argillacea)、アンチカルシア属種 (Anticarsia spp.)、バラトラ・ブラシカエ (Barathra brassicae)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (Bucculatrix thurberiella)、ブパルス・ピニアリウス (Bupalus piniarius)、カコエシア・ポダナ (Cacoecia podana)、カプア・レチクラナ (Capua reticulana)、カルポカプサ・ポモネラ (Carpocapsa pomonella)、ケイマトビア・ブルマタ (Cheimatobia brumata)、キロ属種 (Chilo spp.)、コリストネウラ・フミフェラナ (Choristoneura fumiferana)、クリシア・アンビグエラ (Clysia ambiguella)、クナファロセルス属種 (Cnaphalocerus spp.)、エアリアス・インストラナ (Earias insulana)、エフェスチア・クエフニエラ (Ephestia kuehniella)、エウプロクチス・クリソルホエア (Euproctis chryso-rhoea)、エウキソア属種 (Euxoa spp.)、フェルチア属種 (Feltia spp.)、ガレリア・メロネラ (Galleria mellonella)、ヘリコベルパ属種 (Helicoverpa spp.)、ヘリオチス属種 (Heliothis spp.)、ホフマノフィラ・プセウドスプレテラ (Hofmannophila pseudospretella)、ホモナ・マグナニマ (Homona magnanima)、ヒポノメウタ・パデラ (Hypomeuta padella)、ラフィグマ属種 (Laphygma spp.)、リトコレチス・ブランカルデラ (Lithocolletis blancardella)、リトファネ・アンテナタ (Lithophane antennata)、ロキサグロチス・アルビコスタ (Loxagrotis albicosta)、リマントリア属種 (Lymantria spp.)、マラコソマ・ネウストリア (Malacosoma neustria)、マメストラ・ブラシカエ (Mamestra brassicae)、モシス・レパンダ (Mocis repanda)、ミチムナ・セパラタ (Mythimna separata)、オリア属種 (Oria spp.)、オウレマ・オリザエ (Oulema oryzae)、パノリス・フラメア (Panolis flammea)、ペクチノホラ・ゴシピエラ (Pectinophora gossypiella)、フィロクニスチス・シトレラ (Phyllocnistis citrella)、ピエリス属種 (Pieris spp.)、プルテラ・キシロステラ (Plutella xylostella)、プロデニア属種 (Prodenia spp.)、プセウダレチア属種 (Pseudaletia spp.)、プセウドプルシア・インクルデンス (Pseudoplusia includens)、ピラウスタ・ニピラリス (Pyrausta nubilalis)、スポドプテラ属種 (Spodoptera spp.)、テルメシア・ゲマタリス (Thermesia gemmatalis)、チネア・ペリオネラ (Tinea pellionella)、チネオラ・ビセリエラ (Tineola bisselliella)、トルトリクス・ピリダナ (Tortrix viridana)、トリコプルシア属種 (Trichoplusia spp.)。

【 0 1 1 5 】

バッタ目 (Orthoptera) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (Acheta domesticus)、ブラッタ・オリエンタリス (Blatta orientalis)、ブラッテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica)、グリロタルパ属種 (Gryllotalpa spp.)、レウコファエア・マデラエ (Leucophaea maderae)、ロクスタ属種 (Locusta spp.)、メラノプルス属種 (Melanoplus spp.)、ペリプラネタ・アメリカナ (Periplaneta americana)、シストセルカ・グレガリア (Schistocerca gregaria)。

【 0 1 1 6 】

ノミ目 (Siphonaptera) の、例えば、セラトフィルス属種 (Ceratophyllus spp.)、キセノプシラ・ケオピス (Xenopsylla cheopis)。

【 0 1 1 7 】

コムカデ目 (Symphyla) の、例えば、スクチゲレラ・イマクラタ (Scutigereilla immaculata)。

【 0 1 1 8 】

アザミウマ目 (Thysanoptera) の、例えば、バリオトリプス・ビフォルミス (Baliothrips biformis)、エネオトリプス・フラベンス (Enneothrips flavens)、フランクリニエラ属種 (Frankliniella spp.)、ヘリオトリプス属種 (Heliothrips spp.)、ヘルシノ

10

20

30

40

50

トリプス・フェモラリス (Hercinothrips femoralis)、カコトリプス属種 (Kakothrips spp.)、リピフォロトリプス・クルエンタツス (Rhipiphorothrips cruentatus)、シロトトリプス属種 (Scirtothrips spp.)、テアニオトリプス・カルダモニ (Taeniothrips cardamoni)、トリプス属種 (Thrips spp.)。

【 0 1 1 9 】

シミ目 (Thysanura) の、例えば、レピスマ・サカリナ (Lepisma saccharina)。

【 0 1 2 0 】

植物寄生性線虫としては、例えば、以下のものを挙げる事ができる：アングイナ属種 (Anguina spp.)、アフェレンコイデス属種 (Aphelenchoides spp.)、ペロノアイムス属種 (Belonoaimus spp.)、ブルサフェレンクス属種 (Bursaphelenchus spp.)、ジチレンクス・ジプサシ (Ditylenchus dipsaci)、グロボデラ属種 (Globodera spp.)、ヘリオコチレンクス属種 (Heliocotylenchus spp.)、ヘテロデラ属種 (Heterodera spp.)、ロンギドルス属種 (Longidorus spp.)、メロイドギネ属種 (Meloidogyne spp.)、プラチレンクス属種 (Pratylenchus spp.)、ラドホルス・シミリス (Radopholus similis)、ロチレンクス属種 (Rotylenchus spp.)、トリコドルス属種 (Trichodorus spp.)、チレンコリンクス属種 (Tylenchorhynchus spp.)、チレンクルス属種 (Tylenchulus spp.)、チレンクルス・セミペネトランス (Tylenchulus semipenetrans)、キシフィネマ属種 (Xiphinema spp.)。

【 0 1 2 1 】

本発明の構造 (I) で表される化合物は、特に、アブラムシ類 (例えば、ワタアブラムシ (Aphis gossypii) 及びモモアカアブラムシ (Myzus persicae))、コウチュウの幼虫 (beetle larvae) (例えば、ファエドン・コクレアリアエ (Phaedon cochleariae))、チョウの幼虫 (butterfly caterpillar) (例えば、コナガ (Plutella xylostella))、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua) 及びスポドプテラ・フルギベルダ (Spodoptera frugiperda)) に対して強い作用を示すこと特徴とする。

【 0 1 2 2 】

本発明の化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (microbicide) として、例えば、殺菌剤 (fungicide)、抗真菌剤 (antimycotic)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤 (これは、ウイロイドに対する作用薬も包含する) としても使用し得るか、又は、MLO (マイコプラズマ様生物) 及び RLO (リケッチア様生物) に対する作用薬としても使用し得る。本発明の化合物は、場合により、別の活性化化合物を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【 0 1 2 3 】

本発明により、全ての植物及び植物の全ての部分を処理することができる。本明細書において、植物は、望ましい野生植物及び望ましくない野生植物又は作物植物 (天然に発生している作物植物を包含する) のような全ての植物及び植物個体群を意味するものと理解される。栽培変種は、慣習的な植物育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物品種保護権によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、接ぎ穂 (scion)、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解され、その例としては、葉、針状葉、葉柄、茎、花、子実体、果実、種子、根、球根及び根茎などを挙げる事ができる。収穫された作物、並びに、栄養生殖器官 (vegetative reproduction material) 及び生殖増殖器官 (generative reproduction material)、例えば、挿穂、球根、根茎、枝条及び種子なども、植物の部分に属する。

【 0 1 2 4 】

上記活性化化合物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、標準的な処理方法

によって、例えば、浸漬、散布、気化、霧化、ばらまき、塗布又は注入などによって、直接的に行うか、又は、植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵場所に作用させることにより行い、また、増殖器官、特に種子の場合は、さらに、種子に1以上のコーティングを施すことによって行う。

【0125】

植物の上記活性物質は、溶液剤、エマルジョン剤、散布用粉末剤 (spray powders)、水性懸濁液剤、油性懸濁液剤、粉末剤 (powders)、粉剤 (dusting agent)、ペースト剤、可溶性粉末剤、可溶性顆粒剤、ばらまき用顆粒剤、懸濁エマルジョン濃厚液、活性化化合物を含浸させた天然物質、活性化化合物を含浸させた合成物質、肥料、及び、高分子物質中にマイクロカプセル化したもののような標準的な製剤に変換することができる。

10

【0126】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、場合により界面活性剤 (即ち、乳化剤及び/又は分散剤及び/又は泡形成剤) を使用して、上記活性化化合物を希釈剤 (即ち、溶媒及び/又は固体担体) と混合させることにより調製することができる。そのような製剤の調製は、適切な設備で実施するか、又は、使用前若しくは使用中に実施することも可能である。

【0127】

助剤として使用可能な物質は、該物質自体及び/又はそれから誘導された調製物 (例えば、噴霧用エマルジョン、種子粉衣など) に、特定の技術的特性及び/又は特別な生物学的特性などの特別な性質を付与するのに適した物質である。適切な助剤は、希釈剤、溶媒又は担体である。

20

【0128】

適切な希釈剤は、例えば、水、極性及び非極性の有機液体、例えば、芳香族炭化水素及び非芳香族炭化水素 (例えば、パラフィン、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類)、アルコール類及びポリオール類 (これらは、場合により、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び/又は、エステル化されていてもよい)、ケトン類 (例えば、アセトン、シクロヘキサノン)、エステル類 (さらに、脂肪及び油) 及び (ポリ) エーテル類、単純な及び置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類 (例えば、N-アルキルピロリドン類) 及びラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類 (例えば、ジメチルスルホキシド) の種類から選ばれたものである。

【0129】

希釈剤として水が使用される場合、例えば、有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。本質的に、そのような適している液体溶媒は、以下のものである: 芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素類、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素類、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、天然油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル類及びエステル類、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン及びシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシドなどであり、さらに、水も適している。

30

【0130】

固体担体として適しているのは、例えば、アンモニウム塩、及び、天然鉱物粉、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び合成鉱物粉、例えば、高分散シリカ、酸化アルミニウム及びシリケートなどであり; 顆粒剤用の担体として適しているの、例えば、粉碎して分別した天然鉱物、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及びドロマイトなどであり、さらに、無機及び有機の粗挽き粉からなる合成顆粒や、有機材料、例えば、紙、おがくず、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄などから得た顆粒なども適しており; 乳化剤及び泡形成剤として適しているのは、例えば、非イオン性及びアニオン性乳化剤、例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルス

40

50

ルフェート類、アリアルスルホネート類、及び、タンパク質加水分解物などであり；分散剤として適しているのは、非イオン性及び／又はイオン性物質、例えば、アルコール - P O E 及び／又は P O P エーテル類、酸 - 及び／又は P O P 若しくは P O E エステル類、アルキル - アリアル - 及び／又は P O P 若しくは P O E エーテル類、脂肪 - 及び／又は P O P 若しくは P O E 付加体、P O E - 及び／又は P O P - ポリオール誘導体、P O E - 及び／又は P O P - ソルピタン若しくは糖付加体、アルキル若しくはアリアルのスルフェート類、スルホネート類及びホスフェート類又はそれぞれの P O エーテル付加体の種類から選ばれたものである。さらに、適切なオリゴマー又はポリマー、例えば、ビニルモノマーから出発した適切なオリゴマー又はポリマー、アクリル酸の適切なオリゴマー又はポリマー、E O 及び／又は P O の単独又は組み合わせたものから得られた適切なオリゴマー又はポリマー、例えば（ポリ）アルコール類又は（ポリ）アミン類。さらに、リグニン及びそのスルホン酸誘導体、単純なセルロース及び変性セルロース、芳香族及び／又は脂肪族スルホン酸並びにそれらのホルムアルデヒドとの付加体なども使用することができる。

10

【 0 1 3 1 】

上記製剤において、粘着付与剤 (deposit builder)、例えば、カルボキシメチルセルロース、天然及び合成の粉末状ポリマー又は顆粒状ポリマー又はラテックス様ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、並びに、天然のリン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質などを使用することができる。

【 0 1 3 2 】

着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びフェロシアンブルー (ferrocyanblue)、並びに、有機着色剤、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などを使用することができる。

20

【 0 1 3 3 】

さらなる添加剤は、芳香族成分、場合により改質されていてもよい鉱油及び植物油、蠟、並びに、栄養素（さらにまた、微量栄養素）、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などである。

【 0 1 3 4 】

安定剤（例えば、低温安定剤）、保存剤、酸化防止剤、光保護剤、又は、安定性を向上させるための別の化学的及び／若しくは物理的作用剤も含ませることができる。

30

【 0 1 3 5 】

上記製剤は、一般に、0.01 ~ 98 重量%の活性化化合物、好ましくは、0.5 ~ 90 重量%の活性化化合物を含有する。

【 0 1 3 6 】

本発明の活性化化合物は、殺虫剤、誘引剤、不妊剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節物質、除草剤、葉害軽減剤、肥料又はセミオケミカルなどの他の活性化化合物と混合された状態で、標準的な市販されている製剤中に存在させることが可能であるか、又は、そのような製剤から調製した使用形態中に存在させることが可能である。

【 0 1 3 7 】

特に好ましい混合相手剤は、例えば、以下のものである。

40

【 0 1 3 8 】

殺菌剤核酸合成阻害薬

ベナラキシル、ベナラキシル - M、ブピリメート、キララキシル (chiralaxyl)、クロジラコン、ジメチリモール、エチリモール、フララキシル、ヒメキサゾール、メタラキシル、メタラキシル - M、オフラセ、オキサジキシル、オキシリン酸；

有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬

ベノミル、カルベンダジム、ジエトフェンカルブ、フベリダゾール、ペンシクロン、チアベンダゾール、チオファネート - メチル、ゾキサミド (zoxamis)；

50

呼吸複合体 I の阻害薬

ジフルメトリム；

呼吸複合体 I I の阻害薬

ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フルトラニル、フラメトピル、メプロニル、オキシカルボキシシン、ベンチオピラド、チフルザミド；

呼吸複合体 I I I の阻害薬

アゾキシストロピン、シアゾファミド、ジモキシストロピン、エネストロピン (enestrabin)、ファモキサドン、フェンアミドン、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、ピラクロストロピン、ピコキシストロピン；

デカップラー

ジノカップ、フルアジナム；

A T P 産生阻害薬

酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ、シルチオファミン；

アミノ酸及びタンパク質生合成阻害薬

アンドプリム、プラストサイジン - S、シプロジニル、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、メパニピリム、ピリメタニル；

シグナル伝達阻害薬

フェンビクロニル、フルジオキソニル、キノキシフェン；

脂質及び膜合成阻害薬

クロゾリネート、イプロジオン、プロシミドン、ピンクロゾリン、アンプロピルホス (ampropylfos)、アンプロピルホスカリウム (potassium ampropylfos)、エジフェンホス、イプロベンホス (I B P)、イソプロチオラン、ピラゾホス、トルクロホス - メチル、ピフェニル、

ヨードカルブ (iodocarb)、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩；

エルゴステロール生合成阻害薬

フェンヘキサミド、

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、ジクロブトラゾール、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、エタコナゾール、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、フルコナゾール、フルコナゾール - シス、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、ミクロブタニル、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、ポリコナゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、オキシポコナゾール、フェナリモール、フルルプリミドール、ヌアリモール、ピリフェノックス、トリホリン、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール、ピニコナゾール、

アルジモルフ、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、スピロキサミン、

ナフチフィン、ピリブチカルブ、テルピナフィン；

細胞壁合成阻害薬

ベンチアバリカルブ、ピアラホス、ジメトモルフ、フルモルフ (flumorph)、イプロバリカルブ、ポリオキシシン、ポリオキシソリム、バリダマイシン A；

メラニン生合成阻害薬

カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル、フタリド (phthalide)、ピロキロン、トリシクラゾール；

抵抗性誘導薬

アシベンゾラル - S - メチル、プロベナゾール、チアジニル；

多部位

キャプタホール、キャプタン、クロロタロニル、銅塩：水酸化銅、ナフテン酸銅、塩基

10

20

30

40

50

性塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシ銅、ボルドー液、ジクロフルアニド、ジチアノン、ドジン、ドジン遊離塩基、ファーバム、フルオロホルペット、グアザチン、酢酸グアザチン、イミノクタジン、イミノクタジンアルベシル酸塩、イミノクタジン三酢酸塩、マンカッパー、マンゼブ、マンネブ、メチラム、メチラム亜鉛 (metiram zinc)、プロピネブ、硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、チウラム、トリルフルアニド、ジネブ、ジラム；

作用機序不明

アミブロムドール (amibromdol)、ベンチアゾール、ベトキサジン (bethoxazin)、カプシマイシン (capsimycin)、カルボン、キノリンメチオネート、クロロピクリン、クフラネブ、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ (debacarb)、ジクロメジン、ジクロロフェン、ジクロラン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフェニルアミン、エタボキサム、フェリムゾン、フルメトベル、フルスルファミド、フルオピコリド、フルオルイミド、ヘキサクロロベンゼン、8 - ヒドロキシキノリン硫酸、イルマイシン、メタスルホカルブ、メトラフェノン、メチルイソチオシアネート、ミルディオマイシン、ナタマイシン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロタル - イソプロピル、オクチリノン、オキサモカルブ (oxamocarb)、オキシフェンチイン (oxyfenthin)、ペンタクロロフェノール及び塩、2 - フェニルフェノール及び塩、ピペラリン (piperalin)、プロパノシン - ナトリウム (propanosin-sodium)、プロキナジド、ピロールニトリン、キントゼン、テクロフタラム、テクナゼン、トリアゾキシド、トリクラミド、ザリラミド、並びに、2, 3, 5, 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル)ピリジン、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、2 - アミノ - 4 - メチル - N - フェニル - 5 - チアゾールカルボキサミド、2 - クロロ - N - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1H - インデン - 4 - イル) - 3 - ピリジンカルボキサミド、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、シス - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)シクロヘプタノール、2, 4 - ジヒドロ - 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [[[[1 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]アミノ]オキシ]メチル]フェニル] - 3H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 3 - オン (185336 - 79 - 2)、メチル 1 - (2, 3 - ジヒドロ - 2, 2 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - イミダゾール - 5 - カルボキサレート、3, 4, 5 - トリクロロ - 2, 6 - ピリジンジカルボニトリル、メチル 2 - [[[[シクロプロピル[(4 - メトキシフェニル)イミノ]メチル]チオ]メチル] - (メトキシメチレン) - ベンズアセテート、4 - クロロ - プロピニルオキシ - N - [2 - [3 - メトキシ - 4 - (2 - プロピニルオキシ)フェニル]エチル] - ベンズアセトアミド、(2S) - N - [2 - [4 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピニル]オキシ] - 3 - メトキシフェニル]エチル] - 3 - メチル - 2 - [(メチルスルホニル)アミノ] - ブタンアミド、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、5 - クロロ - 6 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - N - [(1R) - 1, 2, 2 - トリメチルプロピル][1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリミジン - 7 - アミン、5 - クロロ - N - [(1R) - 1, 2 - ジメチルプロピル] - 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 - 7 - アミン、N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル)エチル] - 2, 4 - ジクロロニコチンアミド、N - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル)メチル - 2, 4 - ジクロロニコチンアミド、2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピルベンゾピラノン - 4 - オン、N - {(Z) - [(シクロプロピルエトキシ)イミノ][6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル]メチル} - 2 - ベンズアセトアミド、N - (3 - エチル - 3, 5, 5 - トリメチルシクロヘキシル) - ホルミルアミノ - 2 - ヒドロキシベンズアミド、2 - [[[[1 - [3(1 - フルオロ - 2 - フェニルエチル)オキシ]フェニルエチリデン]アミノ]オキシ]メチル] - (メトキシイミノ) -

10

20

30

40

50

N - メチル - E - ベンズアセトアミド、N - { 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] エチル } - 2 (トリフルオロメチル)ベンズアミド、N - (3' , 4' - ジクロロ - 5 - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - (6 - メトキシ - 3 - ピリジニル) - シクロプロパンカルボキサミド、1 - [(4 - メトキシフェノキシ) メチル] - 2 , 2 - ジメチルプロピル - 1 H - イミダゾール - 1 - カルボン酸、O - [1 - [(4 - メトキシフェノキシ) メチル] - 2 , 2 - ジメチルプロピル] - 1 H - イミダゾール - 1 - カルボチオン酸、2 - (2 - { [6 - (3 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ) - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル] オキシ } フェニル) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド。

10

【 0 1 3 9 】

殺細菌剤：

プロノポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び別の銅剤。

【 0 1 4 0 】

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤：アセチルコリンエステラーゼ (A C h E) 阻害薬

カーバメート系

例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アリキシカルブ、アミノカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブフェンカルブ、ブタカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、ジメチラン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、フェノチオカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メタム - ナトリウム、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロメカルブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリメタカルブ、X M C、キシリルカルブ、トリアザメート；

20

有機リン系

例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス (- メチル , - エチル)、プロモホス - エチル、プロムフェンピンホス (- メチル)、ブタチオホス、カズサホス、カルボフェノチオン、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス (- メチル / - エチル)、クマホス、シアノフェンホス、シアノホス、クロルフェンピンホス、ジメトン - S - メチル、ジメトン - S - メチルスルホン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス / D D V P、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ジオキサベンゾホス、ダイスルホトン、E P N、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、ホノホス、ホルモチオン、ホスメチラン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、ヨードフェンホス、イプロベンホス、イサゾホス、イソフェンホス、O - サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン - メチル、パラチオン (- メチル / - エチル)、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホスホカルブ (phosphocarb)、ホキシム、ピリミホス (- メチル / - エチル)、プロフェノホス、プロバホス、プロベタムホス、プロチオホス、プロトエート、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、ピリダチオン (pyridathion)、キナルホス、セブホス (sebufos)、スルホテップ、スルプロホス、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロロピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン；

30

40

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

ピレスロイド系

例えば、アクリナトリン、アレスリン (d - シス - トランス , d - トランス)、ベータ - シフルトリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン - S - シクロペンチ

50

ル異性体、ピオエタノメトリン (bioethanomethrin)、ピオペルメトリン、ピオレスメトリン、クロバポルトリン (chlovaporthrin)、シス - シペルメトリン、シス - レスメトリン、シス - ペルメトリン、クロシトリン (clocythrין)、シクロプロトリン、シフルトリン、シハロトリン、シペルメトリン (アルファ - , ベータ - , シータ - , ゼータ -)、シフェノトリン、デルタメトリン、エムペントリン (1 R 異性体)、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンフルトリン (fenfluthrin)、フェンプロパトリン、フェンピリトリン、フェンバレレート、フルプロシトリネート (flubrocycythrinate)、フルシトリネート、フルフェンプロックス、フルメトリン、フルバリネート、フブフェンプロックス (fubfenprox)、ガンマ - シハロトリン、イミプロトリン、カデトリン、ラムダ - シハロトリン、メトフルトリン、ペルメトリン (シス - , トランス -)、フェノトリン (1 R トランス異性体)、プラレトリン、プロフルトリン、プロトリフェンブト (protriflubenbutol)、ピレスメトリン、レスメトリン、R U 15525、シラフルオフエン、タウ - フルバリネート、テフルトリン、テラレトリン、テトラメトリン (1 R 異性体)、トラロメトリン、トランスフルトリン、Z X I 8901、ピレトリン類 (pyrethrum) ;

DDT ;

オキサジアジン系

例えば、インドキサカルブ ;

アセチルコリン受容体作動薬 / 拮抗薬

クロロニコチニル系

例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ニチアジン、チアクロプリド、チアメトキサム ;

ニコチン、ベンスルタップ、カルタップ ;

アセチルコリン受容体モジュレーター

スピノシン系

例えば、スピノサド ;

G A B A 制御塩化物チャンネル拮抗薬

有機塩素系

例えば、カンフェクロル、クロルダン、エンドスルファン、ガンマ - H C H、H C H、ヘプタクロル、リンダン、メトキシクロル ;

フィプロール系

例えば、アセトプロール、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピリプロール (pyriprole)、バニリプロール (vaniliprole) ;

塩化物チャンネル活性化剤

メクチン系

例えば、アベルメクチン、エマメクチン、エマメクチン安息香酸塩、イベルメクチン、ミルベマイシン ;

幼若ホルモンミメティクス

例えば、ジオフェノラン、エポフェノナン (epofenonane)、フェノキシカルブ、ハイドロプレン、キノプレン、メトプレン、ピリプロキシフェン、トリプレン (triprene) ;

エクジソン作動薬 / ディスラプター

ジアシルヒドラジン系

例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド ;

キチン生合成阻害薬

ベンゾイル尿素系

例えば、ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルアズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、ペンフルロン (penfluron)、テフルベンズロン、トリフルムロン ;

;

ブプロフェジン ;

シロマジン ;

10

20

30

40

50

酸化的リン酸化阻害薬、ATPディスラプター

ジアフェンチウロン

有機スズ化合物

例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、酸化フェンブタスズ；

H - プロトン勾配を遮断することにより作用する酸化的リン酸化デカップラー；

ピロール系

例えば、クロルフェナピル；

ジニトロフェノール系

例えば、ピナパクリル、ジノプトン、ジノカップ、DNOC；

Site - I 電子伝達阻害薬

METI系

例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフエンピラド、トルフェンピラド；

ヒドラメチルノン；

ジコホル；

Site - II 電子伝達阻害薬

ロテノン；

Site - III 電子伝達阻害薬

アセキノシル、フルアクリピリム；

昆虫消化管膜の微生物ディスラプターバシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 株脂肪合成阻害薬

テトロン酸系

例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン (spiromesifen)；

テトラミン酸系

例えば、スピロテトラマト (spirotetramat) (CAS Reg. No. : 203313-25-1)、及び、3-(2,5-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-2-オキシ-1-アザスピロ[4.5]デク-3-エン-4-イルエチルカルボナート (別名：カルボン酸3-(2,5-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-2-オキシ-1-アザスピロ[4.5]デク-3-エン-4-イルエチルエステル、CAS-Reg. No. : 382608-10-8)；

カルボキサミド系

例えば、フロニカミド；

オクトパミン作用薬

例えば、アミトラズ；

マグネシウム刺激ATPアーゼの阻害薬

プロパルギット；

安息香酸ジカルボキサミド系

例えば、フルベンジアミド

ネライストキシン類似体

例えば、チオシクラムシュウ酸水素塩 (thiocyclam hydrogen oxalate)、チオスルタップ-ナトリウム (thiosultap-sodium)；

生物学的薬剤、ホルモン又はフェロモン例えば、アザジラクチン、バシルス属 (*Bacillus spec.*)、ベアウベリア属 (*Beauveria spec.*)、コドレモン (codlemone)、メタリジウム属 (*Metarrhizium spec.*)、パエシロマイセス属 (*Paecilomyces spec.*)、チューリングエンシン (thuringiensin)、ベルチシリウム属 (*Verticillium spec.*)；作用機序が知られていないか又は特定されていない活性化化合物

燻蒸剤

例えば、リン化アルミニウム、臭化メチル、フッ化スルフルル；

10

20

30

40

50

摂食阻害薬

例えば、氷晶石 (cryolite)、フロニカミド、ピメトロジン；

ダニ成長阻害薬

例えば、クロフェンテジン、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス；

アミドフルメト、ベンクロチアズ (benclotiaz)、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロモプロピレート、プロロフェジン、キノメチオネート、クロルジメホルム、クロロベンジレート、クロロピクリン、クロチアゾベン (clothiazoben)、シクロプレネ (cycloprene)、シフルメトフェン、ジシクラニル、フェノキサクリム、フェントリファニル (fentrifanil)、フルベンジミン、フルフェネリム、フルテンジン (flutenzin)、ゴシプルレ (gossyplure)、ヒドラメチルノン、ジャポニルレ (japonilure)、メトキサジアゾン、石油、ピペロニルブトキシド、オレイン酸カリウム、ピリダリル、スルフラミド、テトラジホン、テトラスル、トリアラセン、ベルブチン (verbutin)。

10

【0141】

別の既知活性化合物 (例えば、除草剤、肥料、成長調節剤、薬害軽減剤、セミオケミカル) との混合物も可能であり、又は、植物の特性を改善する作用薬との混合物も可能である。

【0142】

殺虫剤として使用する場合、本発明の活性化合物は、さらにまた、それらの市販されている標準的な製剤中においても、及び、それらの製剤から調製した使用形態中においても、協力剤との混合物として存在させることができる。協力剤は、本発明の活性化合物の効果を増大させることが可能な化合物であり、その際、加える協力剤自体は必ずしも活性を有する必要はない。

20

【0143】

殺虫剤として使用する場合、本発明の活性化合物は、さらにまた、それらの市販されている標準的な製剤中においても、及び、それらの製剤から調製した使用形態中においても、抑制剤 (inhibitor) との混合物として存在させることも可能であり、ここで、該抑制剤は、使用後に植物の周辺又は植物の部分の表面又は植物の組織内において該活性化合物の分解を低減する。

【0144】

市販されている標準的な製剤から調製した使用形態の上記活性化合物の含有量は、広い範囲で変えることができる。使用形態における上記活性化合物の含有量は、0.00000001重量% ~ 95重量%の範囲内、好ましくは、0.000001重量% ~ 1重量%であることができる。

30

【0145】

施用は、その使用形態に適合した慣習的な方法で実施する。

【0146】

上記で既に述べたように、本発明により、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生植物種、及び、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法を用いて得られた植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、場合により慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種 (遺伝子組換え生物 (genetic modified organisms)) 及びそれらの部分を処理する。用語「部分 (parts)」及び「植物の部分 (parts of plants)」又は「植物の部分 (plant parts)」については、既に上記で説明した。

40

【0147】

本発明により、特に好ましくは、それぞれ慣習的に又は一般的に使用されている植物品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種方法又は突然変異誘発又は組換えDNA技術により品種改良された、新しい特性 (「形質」) を有する植物を意味するものと理解される。これらは、品種、系統、生物型及び遺伝子型であることができる。

【0148】

50

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件（土壌、気候、生育期、養分）に応じて、本発明の処理により、相加効果を超える効果（「相乗効果」）が生じる場合もある。従って、例えば、施用量の低減、及び/又は、活性スペクトルの拡大、及び/又は、本発明により使用し得る物質及び作用剤の活性の増強、植物の生育の向上、高温及び低温に対する耐性の向上、干ばつ又は水若しくは土壌中に含まれる塩分に対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向上、より早い成熟、収穫量の増加、収穫された生産物の品質の向上及び/又は栄養価の増加、収穫された生産物の貯蔵寿命の向上及び/又は加工性の向上などが可能であり、これらは、予期された効果を実際に超えるものである。

【 0 1 4 9 】

特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾により与えられた全ての植物は、本発明により処理するのが好ましいトランスジェニック（遺伝子工学により得られた）植物又は植物品種に属する。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、干ばつ又は水若しくは土壌中に含まれる塩分に対する向上した耐性、向上した開花能力、向上した収穫の容易性、向上した成熟速度、増加した収穫量、作物の向上した品質及び/又は向上した栄養価、作物の向上した貯蔵寿命及び/又は向上した加工性などである。そのような特性のさらに別の特に強調しなければならない例は、害虫及び有害微生物に対する植物の向上した抵抗性、例えば、昆虫、ダニ、植物病原性菌類、細菌及び/又はウイルスに対する植物の向上した抵抗性、並びに、特定の除草剤に対する植物の向上した耐性である。そのようなトランスジェニック植物の例は、重要な栽培変種、例えば、禾穀類（コムギ、イネ）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、トマト、エンドウ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、果実植物（果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びグレープを有する果実植物）などであり、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）は、植物内で形成された毒素による昆虫類、クモ形類動物、線虫類及び腹足類動物に対する植物の向上した耐性であり、特に、バシルス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）の遺伝物質（例えば、遺伝子 *Cry I A (a)*、*Cry I A (b)*、*Cry I A (c)*、*Cry I I A*、*Cry I I I A*、*Cry I I I B 2*、*Cry 9 c*、*Cry 2 A b*、*Cry 3 B b* 及び *Cry I F* 並びにそれらの組合せ）により植物内で形成された毒素による昆虫類、クモ形類動物、線虫類及び腹足類動物に対する植物の向上した耐性である（以下、「Bt植物」と称する）。特性（「形質」）として同様に特に重要であるものは、全身獲得抵抗性（SAR）、システミン（systemin）、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子及びそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、菌類、細菌類及びウイルスに対する植物の向上した抵抗性である。特に重要であるさらに別の特性（「形質」）は、特定の除草剤活性化化合物、例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシンなどに対する植物の向上した耐性である（例えば、「PAT」遺伝子）。望ましい該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物内で、相互に組み合わせて存在させることも可能である。そのような「Bt植物」の例は、YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Knock Out（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Star Link（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、Nucotn（登録商標）（ワタ）、及び、New Leaf（登録商標）（ジャガイモ）の商品名で市販されているトウモロコシ品種、ワタ品種、ダイズ品種及びジャガイモ品種などである。除草剤耐性植物の例は、Roundup Ready（登録商標）（グリホセートに対する耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノン系に対する耐性）、及び、STS（登録商標）（スルホニル尿素系に対する耐性、例えば、トウモロコシ）の商品名で市販されているトウモロコシ品種、ワタ品種及びダイズ品種などである。同様に、除草剤抵抗性植物（除草剤耐性に関して慣習的な方法で品種改良された植物）として、Clearfield（登録商標）（例えば、トウモロコシ）の商品名で市販されている品種が挙げられる。ここで述べたことは、も

10

20

30

40

50

ちろん、これらの遺伝特性（「形質」）を有しているか又は今後開発される遺伝特性（「形質」）を有し、将来開発又は販売されるであろう植物品種にも適用される。

【0150】

上記で挙げた植物は、一般構造（I）で表される化合物又は本発明の活性化合物混合物を用いて、本発明により、特に有利に処理することができる。該活性化合物又は混合物について上記で述べた好ましい範囲は、これらの植物の処理にも同様に維持される。特に言及すべきなのは、本明細書内で具体的に記載されている化合物又は混合物による植物の処理である。

【0151】

本発明の化合物は、植物、衛生及び貯蔵生産物の有害生物に対してのみではなく、マダニ類（hard ticks）、ヒメダニ類（soft ticks）、疥癬ダニ類（mange thicks）、ツツガムシ類（harvest mites）、ハエ類（刺咬性（stinging）及び舐性（licking））、寄生性のハエ幼虫、シラミ類、刺咬性ダニ類（biting mites）、咀嚼性ダニ類（chewing mites）及びノミ類などの獣医学の分野における害虫（外部寄生虫及び内部寄生虫）に対しても有効である。これらの寄生虫としては、以下のものを挙げるができる。

【0152】

アノプルーリダ目（Anoplurida）、例えば、ハエマトピヌス属種（Haematopinus spp.）、リノグナツス属種（Linognathus spp.）、ペジクルス属種（Pediculus spp.）、フチルス属種（Phtirus spp.）、ソレノポテス属種（Solenopotes spp.）。

【0153】

マロファギダ目（Mallophagida）並びにアンブリセリナ亜目（Amblycerina）及びイスクノセリナ亜目（Ischnocerina）、例えば、トリメノポン属種（Trimenopon spp.）、メノポン属種（Menopon spp.）、トリノトン属種（Trinoton spp.）、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ属種（Werneckiella spp.）、レピケントロン属種（Lepikentron spp.）、ダマリナ属種（Damalina spp.）、トリコデクテス属種（Trichodectes spp.）、フェリコラ属種（Felicola spp.）。

【0154】

双翅目（Diptera）並びにネマトセリナ亜目（Nematocera）及びブラキセリナ亜目（Brachycera）、例えば、アエデス属種（Aedes spp.）、アノフェレス属種（Anopheles spp.）、クレキス属種（Culex spp.）、シムリウム属種（Simulium spp.）、エウシムリウム属種（Eusimulium spp.）、フレボトムス属種（Phlebotomus spp.）、ルトゾミヤ属種（Lutzomyia spp.）、クリコイデス属種（Culicoides spp.）、クリソプス属種（Chrysops spp.）、ヒボミトラ属種（Hybomitra spp.）、アチロツス属種（Atylotus spp.）、タバヌス属種（Tabanus spp.）、ハエマトポタ属種（Haematopota spp.）、フィリポミア属種（Philipomyia spp.）、ブラウラ属種（Braula spp.）、ムスカ属種（Musca spp.）、ヒドロタエア属種（Hydrotaea spp.）、ストモキシス属種（Stomoxys spp.）、ハエマトビア属種（Haematobia spp.）、モレリア属種（Morellia spp.）、ファンニア属種（Fannia spp.）、グロシナ属種（Glossina spp.）、カリフォラ属種（Calliphora spp.）、ルシリア属種（Lucilia spp.）、クリソミア属種（Chrysomyia spp.）、ウォルフアルチア属種（Wohlfahrtia spp.）、サルコファガ属種（Sarcophaga spp.）、オエストルス属種（Oestrus spp.）、ヒポデルマ属種（Hypoderma spp.）、ガステロフィルス属種（Gasterophilus spp.）、ヒポボスカ属種（Hippobosca spp.）、リポプテナ属種（Lipoptena spp.）、メロファグス属種（Melophagus spp.）。

【0155】

シフォナプテリダ目（Siphonaptera）、例えば、プレクス属種（Pulex spp.）、クテノセファリデス属種（Ctenocephalides spp.）、キセノプシラ属種（Xenopsylla spp.）、セラトフィルス属種（Ceratophyllus spp.）。

【0156】

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

10

20

30

40

50

種 (Panstrongylus spp.)。

【0157】

ブラッタリダ目 (Blattarida)、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (Blatta orientalis)、ペリプラネタ・アメリカナ (Periplaneta americana)、ブラッテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica)、スベラ属種 (Supella spp.)。

【0158】

アカリ亜綱 (Acari (Acarina)) 並びにメタスチグマ目 (Metastigmata) 及びメソスチグマ目 (Mesostigmata)、例えば、アルガス属種 (Argas spp.)、オルニトドロス属種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属種 (Otobius spp.)、イクソデス属種 (Ixodes spp.)、アンブリオマ属種 (Amblyomma spp.)、ボオフィルス属種 (Boophilus spp.)、デルマセントル属種 (Dermacentor spp.)、ハエモフィサリス属種 (Haemophysalis spp.)、ヒアロマ属種 (Hyalomma spp.)、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp.)、デルマニسس属種 (Dermanyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、プネウモニسس属種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属種 (Sternostoma spp.)、バロア属種 (Varroa spp.)。

【0159】

アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) 及びアカリジダ目 (Acaridida (Astigmata))、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、デモデクス属種 (Demodex spp.)、トロムビクラ属種 (Trombicula spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.)、アカルス属種 (Acarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、クネミドコプテス属種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス属種 (Cytodites spp.)、ラミノシオプテス属種 (Laminosioptes spp.)。

【0160】

本発明の構造 (I) で表される化合物は、さらにまた、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、ニワトリ、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ及びミツバチなどの農業用動物 (agricultural animal) を襲う節足動物、イヌ、ネコ、籠のトリ及び水槽のサカナなどの他のペット類 (domestic animal) を襲う節足動物、並びに、ハムスター、モルモット、ラット及びマウスなどのいわゆる実験動物を襲う節足動物を防除するのにも適している。これらの節足動物を防除することにより、上記動物の死亡率が低減し、また、生産性 (肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜など) の損失が軽減される。従って、本発明の化合物を使用することにより、より経済的で且つより容易な畜産業が可能となる。

【0161】

獣医学の分野において、また、畜産業において、本発明の活性化合物の使用は、既知方法で、例えば、錠剤、カプセル剤、ドリンク剤 (drink)、水薬 (drench)、顆粒剤、ペースト剤、大型丸薬、フィードスルー法及び坐剤などの形態で腸内投与することにより、並びに、例えば、注射 (筋肉内注射、皮下注射、静脈内注射、腹腔内注射など) 及びインプラントなどにより非経口投与することにより、並びに、鼻内投与することにより、並びに、例えば、薬浴 (dipping)、スプレー、ポアオン及びスポットオン、洗浄及び散粉 (powdering) の形態で経皮投与することにより、並びに、活性化合物を含有する補助具、例えば、首輪、耳標、尾標、肢バンド (limb bands)、端綱、マーキング装置などを用いて使用する。

【0162】

家畜、家禽及びペット (domestic animal) などに使用する際、構造 (I) で表される活性化合物は、1 ~ 80 重量%の量の該活性化合物を含有する製剤 (例えば、粉末剤、工

10

20

30

40

50

マルシオン剤、フロアブル剤)として、直接的に使用することができるか、又は、100倍～10000倍に希釈した後に使用することができるか、又は、それらは、薬浴として使用することができる。

【0163】

さらに、本発明の化合物は、工業原料を破壊する昆虫に対しても強い殺虫作用を示すことが見いだされた。

【0164】

以下に示す昆虫を、例として、及び、好ましいものとして挙げることができるが、何ら限定するものではない。

【0165】

甲虫類 (beetles)、例えば、ヒロトルペス・バジュルス (Hylotrupes bajulus)、クロコホルス・ピロシス (Chlorophorus pilosis)、アノビウム・ブクタクタム (Anobium punctatum)、キセストビウム・ルフォビロスム (Xestobium rufovillosum)、プチリヌス・ベクチコルニス (Ptilinus pecticornis)、デンドロビウム・ベルチネキス (Dendrobium pertinex)、エルノビウス・モリス (Ernobius mollis)、プリオビウム・カロピニ (Priobium carpini)、リクツス・ブルネウス (Lyctus brunneus)、リクツス・アフリカヌス (Lyctus africanus)、リクツス・プラニコリス (Lyctus planicollis)、リクツス・リネアリス (Lyctus linearis)、リクツス・プベセンス (Lyctus pubescens)、トロゴキシロン・アエクアレ (Trogoxylon aequale)、ミンテス・ルギコリス (Minthes rugicollis)、キシレボルス属種 (Xyleborus spec.)、トリポトデンドロン属種 (Tryptodendron spec.)、アパテ・モナクス (Apate monachus)、ボストリクス・カプシンス (Bostrychus capucinus)、ヘテロボストリクス・ブルネウス (Heterobostrychus brunneus)、シノキシロン属種 (Sinoxylon spec.)、ジノデルス・ミヌツス (Dinoderus minutus)。

【0166】

膜翅目 (Hymenoptera)、例えば、シレクス・ジュベックス (Sirex juvencus)、ウロセルス・ギガス (Urocerus gigas)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (Urocerus gigas taignus)、ウロセルス・アウグル (Urocerus augur)。

【0167】

シロアリ類 (termite)、例えば、カロテルメス・フラビコリス (Kaloterme flavicollis)、クリプトテルメス・ブレビス (Cryptoterme brevis)、ヘテロテルメス・インジコラ (Heteroterme indicola)、レチクリテルメス・フラビペス (Reticuliterme flavipes)、レチクリテルメス・サントネンシス (Reticuliterme santonensis)、レチクリテルメス・ルシフグス (Reticuliterme lucifugus)、マストテルメス・ダルウィニエンシス (Mastoterme darwiniensis)、ズーテルモプシス・ネバデンシス (Zootermopsis nevadensis)、コプトテルメス・フォルモサヌス (Coptoterme formosanus)。

【0168】

シミ類 (silverfishs)、例えば、レピスマ・サッカリナ (Lepisma saccharina)。

【0169】

本発明に関連して、工業材料は、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、膠、紙及び厚紙、皮革、木材、木材加工製品、並びに、塗料などの、非生物材料を意味するものと理解される。

【0170】

即時使用可能な薬剤 (ready-to-use agent) には、場合により、別の殺虫剤も含ませることができ、また、場合により、1種類以上の殺菌剤も含ませることができる。

【0171】

可能な混合相手に関連しては、上記で挙げた殺虫剤及び殺菌剤を参照する。

【0172】

加えて、本発明の化合物は、海水又は淡水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、波止場及び信号設備を、付着物から保護するために使用することもできる

10

20

30

40

50

。

【0173】

さらに、本発明の化合物は、別の活性化合物と組み合わせて、汚れ止め剤として用いることができる。

【0174】

本発明の活性化合物は、家庭、衛生及び貯蔵生産物の保護において害虫を防除するのに適しており、特に、部屋、工場の通路、オフィス及び車両の客室などの密閉空間で見られる昆虫類、クモ形類動物及びダニ類を防除するのに適している。それらは、単独で使用することもできるし、又は、上記有害生物を防除するための家庭用殺虫剤製品中において、別の活性化合物及び助剤と組み合わせて使用することもできる。それらは、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。これらの有害生物としては、以下のものを挙げるることができる。

10

【0175】

スコルピオニデア目 (Scorpionidea)、例えば、ブツス・オッシタヌス (Buthus occitanus)。

【0176】

ダニ目 (Acarina)、例えば、アルガス・ペルシクス (Argas persicus)、アルガス・レフレクス (Argas reflexus)、ブリオピア属種 (Bryobia spp.)、デルマニスス・ガリナエ (Dermanyssus gallinae)、グリシファグス・ドメスチクス (Glyciphagus domesticus)、オルニトドルス・モウバト (Ornithodoros moubat)、リピセファルス・サングイネウス (Rhipicephalus sanguineus)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (Trombicula alfreddugesi)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (Neutrombicula autumnalis)、デルマトファゴイデス・プテロニシムス (Dermatophagoides pteronissimus)、デルマトファゴイデス・フォリナエ (Dermatophagoides forinae)。

20

【0177】

クモ目 (Araneae)、例えば、アビクラリイダエ (Aviculariidae)、アラネイダエ (Araneidae)。

【0178】

ザトウムシ目 (Opiliones)、例えば、プセウドスコルピオネス・ケリフェル (Pseudoscorpiones chelifer)、プセウドスコルピオネス・ケイリジウム (Pseudoscorpiones cheiridium)、オピリオネス・ファランギウム (Opiliones phalangium)。

30

【0179】

等脚目 (Isopoda)、例えば、オニクス・アセルス (Oniscus asellus)、ポルセリオ・スカベル (Porcellio scaber)。

【0180】

倍脚目 (Diplopoda)、例えば、ブラニウルス・グツラツス (Blaniulus guttulatus)、ポリデスムス属種 (Polydesmus spp.)。

【0181】

唇脚目 (Chilopoda)、例えば、ゲオフィルス属種 (Geophilus spp.)。

【0182】

シミ目 (Zygentoma)、例えば、クテノレピスマ属種 (Ctenolepisma spp.)、レピスマ・サカリナ (Lepisma saccharina)、レピスマデス・インクイリヌス (Lepismodes inquilinus)。

40

【0183】

ゴキブリ目 (Blattaria)、例えば、ブラッタ・オリエンタリエス (Blatta orientalis)、ブラッテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica)、ブラッテラ・アサヒナイ (Blattella asahinai)、レウコファエア・マデラエ (Leucophaea maderae)、パンクロラ属種 (Panchlora spp.)、パルコブラタ属種 (Parcoblatta spp.)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (Periplaneta australasiae)、ペリプラネタ・アメリカナ (Periplaneta americana)、ペリプラネタ・ブルネア (Periplaneta brunnea)、ペリプラネタ・フリギノ

50

サ (Periplaneta fuliginosa)、スペラ・ロンギパルパ (Supella longipalpa)。

【0184】

サルタトリア目 (Saltatoria)、例えば、アケタ・ドメスチクス (Acheta domesticus)。

【0185】

ハサミムシ目 (Dermaptera)、例えば、フォルフィクラ・アウリクラリア (Forficula auricularia)。

【0186】

シロアリ目 (Isoptera)、例えば、カロテルメス属種 (Kaloterme spp.)、レチクリテルメス属種 (Reticuliterme spp.)。

10

【0187】

チャタテムシ目 (Psocoptera)、例えば、レピナツス属種 (Lepinatus spp.)、リボセリス属種 (Liposcelis spp.)。

【0188】

コレプテラ目 (Coleoptera)、例えば、アントレヌス属種 (Anthrenus spp.)、アタゲヌス属種 (Attagenus spp.)、デルメステス属種 (Derme spp.)、ラテチクス・オリザエ (Latheticus oryzae)、ネクロビア属種 (Necrobia spp.)、プチヌス属種 (Ptinus spp.)、リゾペルタ・ドミニカ (Rhizopertha dominica)、シトフィルス・グラナリウス (Sitophilus granarius)、シトフィルス・オリザエ (Sitophilus oryzae)、シトフィルス・ゼアマイス (Sitophilus zeamais)、ステゴビウム・パニセウム (Stegobium pa niceum)。

20

【0189】

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・タエニオリンクス (Aedes taeniorhynchus)、アノフェレス属種 (Anopheles spp.)、カリフォラ・エリトロセファラ (Calliphora erythrocephala)、クリソゾナ・プルビアリス (Chrysozona pluvialis)、クレクス・クインクエファシアツス (Culex quinquefasciatus)、クレクス・ピピエンス (Culex pipiens)、クレクス・タルサリス (Culex tarsalis)、ドロソフィラ属種 (Drosophila spp.)、ファニア・カニクラリス (Fannia canicularis)、ムスカ・ドメスチカ (Musca domestica)、フレボトムス属種 (Phlebotomus spp.)、サルコファガ・カルナリア (Sarcophaga carnaria)、シムリウム属種 (Simulium spp.)、ストモキス・カルシトランス (Stomoxys calcitrans)、チブラ・パルドサ (Tipula paludosa)。

30

【0190】

鱗翅目 (Lepidoptera)、例えば、アクロイア・グリセラ (Achroia grisella)、ガレリア・メロネラ (Galleria mellonella)、プロジア・インテルプンクテラ (Plodia interpunctella)、チネア・クロアセラ (Tinea cloacella)、チネア・ペリオネラ (Tinea pellionella)、チネオラ・ビセリエラ (Tineola bisselliella)。

【0191】

ノミ目 (Siphonaptera)、例えば、クテノセファリデス・カニス (Ctenocephalides canis)、クテノセファリデス・フェリス (Ctenocephalides felis)、プレクス・イリタンス (Pulex irritans)、ツンガ・ペネトランス (Tunga penetrans)、キセノプシラ・ケオピス (Xenopsylla cheopis)。

40

【0192】

膜翅目 (Hymenoptera)、例えば、カムポノツス・ヘルクレアヌス (Camponotus herculeanus)、ラシウス・フリギノス (Lasius fuliginosus)、ラシウス・ニゲル (Lasius niger)、ラシウス・ウムブラツス (Lasius umbratus)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、パラベスブラ属種 (Paravespula spp.)、テトラモリウム・カエスピウム (Tetramorium caespitum)。

【0193】

シラミ目 (Anoplura)、例えば、ペジクルス・フマヌス・カピチス (Pediculus humanu

50

s capitis)、ペジクルス・フマヌス・コルポリス (*Pediculus humanus corporis*)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、フィロエラ・バスタトリクス (*Phylloera vastatrix*)、フチルス・プビス (*Phthirus pubis*)。

【0194】

異翅目 (Heteroptera)、例えば、シメクス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメクス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、ロジヌス・プロリクス (*Rhodinus prolixus*)、トリアトマ・インフェスタンス (*Triatoma infestans*)。

【0195】

それらは、家庭用殺虫剤分野においては、単独で使用されるか、又は、別の適切な活性化化合物、例えば、リン酸エステル類、カーバメート類、ピレスロイド類、ネオニコチノイド類、成長調節剤又は別の既知のクラスの殺虫剤から選択される活性化化合物などと組み合わせて使用される。

10

【0196】

それらは、エアゾル、非加圧スプレー剤、例えば、ポンプスプレー及び散粉スプレー (dusting spray)、噴霧器 (nebuliser)、噴霧器 (mister)、泡形成器 (foamer)、ゲル、セルロース又はプラスチック製の蒸発プレートを有するエバポレーション製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙 (fly papers)、防虫トラップ (fly traps) 及び防虫ゲル (fly gels) と一緒に、粒剤若しくは粉剤として使用されるか、又は、ばらまき用ベイト (scatter bait) 若しくはベイトステーションで使用される。

20

【実施例】

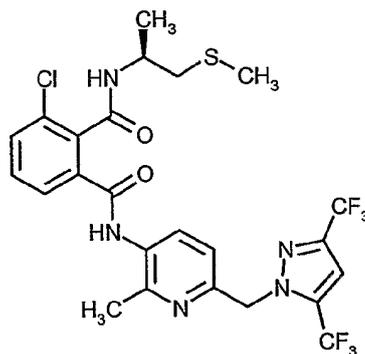
【0197】

調製実施例

実施例 1

【0198】

【化45】



30

【0199】

0.80 g (2.47 mmol) の 6 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] メチル } - 2 - メチルピリジン - 3 - アミンを 8 mL の 1 , 2 - ジクロロエタンに溶解させ、4 滴の濃塩酸で処理し、55 に加熱する。6 mL の 1 , 2 - ジクロロエタン中の 0.93 g (3.45 mmol) の (3Z) - 4 - クロロ - 3 - { [(1S) - 1 - メチル - 2 (メチルチオ) エチル] イミノ } - 2 - ベンゾフラン - 1 (3H) - オンの溶液を添加し、得られた混合物を 65 で 30 分間攪拌する。次いで、減圧下に溶媒を留去し、残渣を、溶離液として (1) ジクロロメタン及び (2) シクロヘキサン / 酢酸エチル (2 : 1) を使用するシリカでのクロマトグラフィーで精製する。

40

【0200】

0.56 g (理論値の 37%) の N¹ - (6 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] メチル } - 2 - メチルピリジン - 3 - イル) - 3 - クロロ - N² - [(1S) - 1 - メチル - 2 - (メチルチオ) エチル] フタルアミドが黄色

50

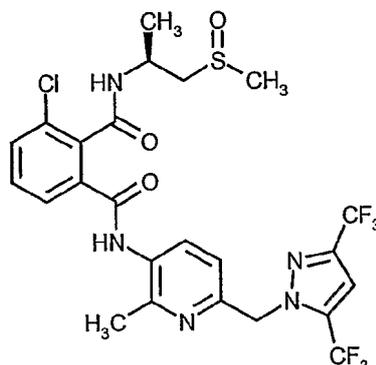
の固体（融点 92 ）として得られる。

【 0 2 0 1 】

実施例 2

【 0 2 0 2 】

【 化 4 6 】



10

（ 続いて実施される変換 ）

0.21 g (0.35 mmol) の N¹ - (6 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] メチル } - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - 3 - クロロ - N² - [(1 S) - 1 - メチル - 2 - (メチルチオ) エチル] フタルアミドを 5 mL の 1 , 2 - ジクロロエタンに溶解させ、60 で、3.3 mg (0.07 mmol) のギ酸及び 44.1 mg (0.39 mmol) の過酸化水素を順次添加し、その混合物を 60 で 30 分間攪拌する。その反応混合物を、攪拌しながら、50 で、5 mL の 10 % 亜硫酸水素ナトリウム溶液 (重亜硫酸塩) で処理し、10 分間攪拌し、10 mL の 10 % 炭酸水素ナトリウム溶液でクエンチする。有機相を分離し、水相をジクロロメタンで 2 回抽出する。有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に溶媒を留去した後、生成物を白色の固体として得る。

20

【 0 2 0 3 】

0.20 g (理論値の 86 %) の N¹ - (6 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] メチル } - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - 3 - クロロ - N² - [(1 S) - 1 - メチル - 2 - (メチルスルフィニル) エチル] フタルアミド (融点 183) が得られる。

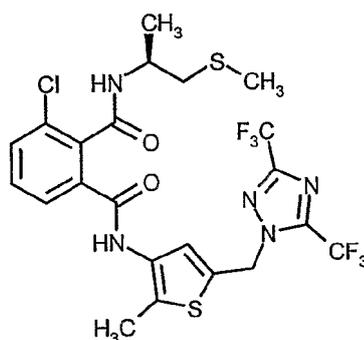
30

【 0 2 0 4 】

実施例 3

【 0 2 0 5 】

【 化 4 7 】



40

【 0 2 0 6 】

0.39 g (1.18 mmol) の 5 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル] メチル } - 2 - メチルチオフエン - 3 - アミ

50

ンを 8 mL の 1, 2 - ジクロロエタンに溶解させ、3 滴の濃塩酸を添加する。その混合物を 55 に加熱し、6 mL の 1, 2 - ジクロロエタン中の 382 mg (1.42 mmol) の (3Z) - 4 - クロロ - 3 - { [(1S) - 1 - メチル - 2 - (メチルチオ)エチル - イミノ] - 2 - ベンゾフラン - 1 (3H) - オン} の溶液を添加し、その混合物を 65 で 30 分間攪拌する。次いで、減圧下に溶媒を留去し、残渣を分取 HPLC でさらに精製する。

【0207】

44 mg (理論値の 6%) の N¹ - (5 - { [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル - メチル] - 2 - メチル - 3 - チエニル} - 3 - クロロ - N² - [(1S) - 1 - メチル - 2 - (メチルチオ)エチル] フタルアミド

10

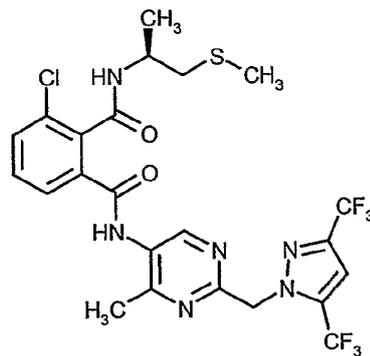
が得られる。
HPLC : log P (pH 2.3) = 3.8。

【0208】

実施例 4

【0209】

【化 48】



20

【0210】

5 mL の 1, 2 - ジクロロエタン中の 435 mg (1.61 mmol) の 4 - クロロ - 3 - (S - 1 - メチル - 2 - メチルスルファニルエチルイミノ) - 3H - イソベンゾフラン - 1 - オンの溶液に、500 mg (1.53 mmol) 2 - (3, 5 - ビストリフルオロメチルピラゾール - 1 - イルメチル) - 4 - メチルピリミジン - 5 - イルアミン及び 7.3 mg (38 μmol) の p - トルエンスルホン酸一水和物を順次添加し、次いで、その混合物を 50 で 2 時間加熱する。室温まで冷却した後、残渣を、溶離液としてをシクロヘキサン / 酢酸エチル (3 : 1 2 : 1) を使用してシリカで精製する。

30

【0211】

0.90 g (理論値の 96%) の N¹ - [2 - (3, 5 - ビス - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルメチル) - 4 - メチルピリミジン - 5 - イル] - 3 - クロロ - N² - (S - 1 - メチル - 2 - メチルスルファニルエチル) フタルアミドが無色の固体として得られる。

40

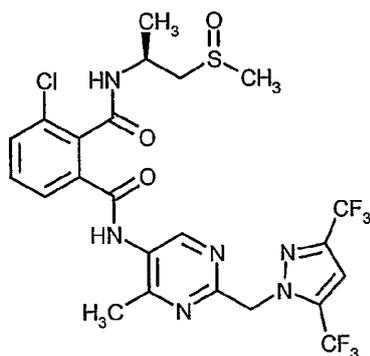
HPLC : log P (pH 2.3) = 3.39。

【0212】

実施例 5

【0213】

【化49】



10

【0214】

3 mLのクロロホルム中の300 mg (0.50 mmol)のN¹-[2-(3,5-ピストリフルオロメチルピラゾール-1-イルメチル)-4-メチルピリミジン-5-イル]-3-クロロ-N²-(S-1-メチル-2-メチルスルファニルエチル)フタルアミドの溶液に、0 で、3 mLのクロロホルム中の127 mg (0.55 mmol)のメタ-クロロ過安息香酸(水中75%)の溶液をゆっくりと添加する。その反応混合物を1.5時間かけて室温まで昇温させ、次いで、40 で30分間加熱する。室温まで冷却した後、その反応混合物をジクロロメタンで希釈し、10%水酸化ナトリウム及び飽和NaCl溶液で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水する。溶媒を除去した後、残渣を、溶離液としてジクロロメタン/メタノール(10:1)を使用するシリカでのクロマトグラフィーにより精製する。

20

【0215】

30 mg (9理論値の%)のN¹-[2-(3,5-ピストリフルオロメチルピラゾール-1-イルメチル)-4-メチルピリミジン-5-イル]-3-クロロ-N²-(S-2-メタンスルフィニル-1-メチルエチル)フタルアミドが無色の固体として得られる。

HPLC: log P (pH 2.3) = 2.17。

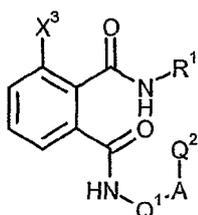
【0216】

本発明の調製方法についての一般的な記載に従い、実施例1~実施例5と同様にして、例えば、表1に挙げられている構造(I)の化合物及び構造(IA)の化合物を調製することができる。

30

【0217】

【化50】



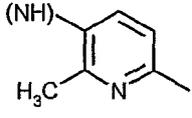
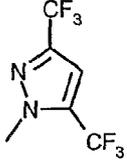
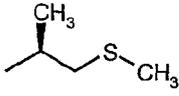
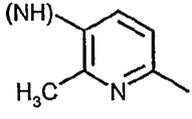
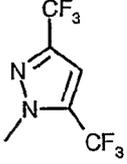
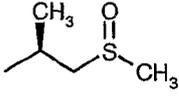
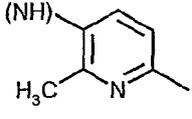
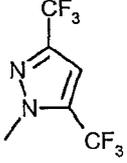
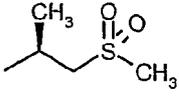
(IA)

40

【0218】

【表 1】

表1: 構造 (IA) で表される化合物の例

実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理的性質
6	CH ₂				I	logP(pH2.3): 3.68
7	CH ₂				I	logP(pH2.3): 2.42
8	CH ₂				I	logP(pH2.3): 2.80

10

20

実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理特性
9	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.69
10	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 3.59
11	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.32
12	CH ₂				I	logP(pH2.3): 3.52
13	CH ₂				I	logP(pH2.3): 2.28
14	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.39
15	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.17
16	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.56

10

20

30

40

実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理的性質
17	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 3.44
18	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 3.44
19	CH ₂				I	logP(pH2.3): 3.55
20	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.24
21	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 3.29
22	CH ₂				I	logP(pH2.3): 3.35
23	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.20
24	CH ₂				I	logP(pH2.3): 2.27

10

20

30

40

実施例番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理的性質
25	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.29
26	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.91
27	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 4.11
28	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.42
29	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.41
30	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.62
31	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 3.67
32	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 1.67

10

20

30

40

実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理定数
33	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 1.89
34	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.56
35	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.65
36	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.07
37	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.49
38	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.42
39	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.11

10

20

30

40

実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理特性
40	CH ₂				I	logP(pH2.3): 2.13
41	CH ₂				I	logP(pH2.3): 2.54
42	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.95
43	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.80
44	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 4.37
45	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.76
46	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 4.15

10

20

30

40

実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理的性質
47	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 4.23
49	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 4.37
50	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.88
51	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.70
52	CH ₂				I	logP(pH2.3): 2.74
53	CH ₂				Br	logP(pH2.3): 2.29
54	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.98
55	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.04

10

20

30

40

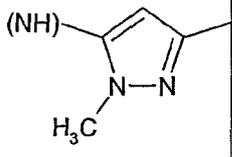
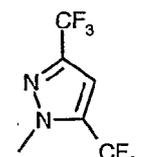
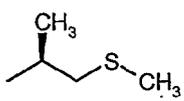
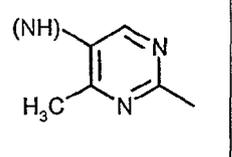
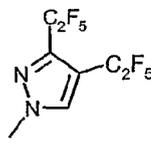
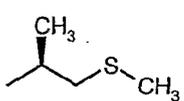
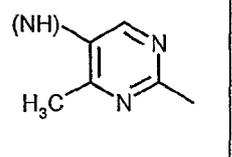
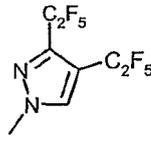
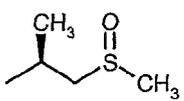
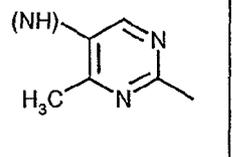
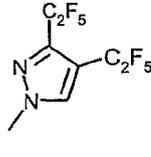
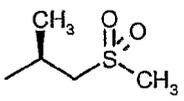
実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理特性
56	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 1.89
57	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.88
58	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.51
59	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.60
60	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.02
61	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.33
62	CH ₂				I	logP(pH2.3): 4.47

10

20

30

40

実施例 番号	A	Q ¹	Q ²	R ¹	X ³	物理特性
63	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.22
64	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 4.11
65	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 2.91
66	CH ₂				Cl	logP(pH2.3): 3.29

10

20

【0219】

上記表及び調製実施例に記載されているlogP値は、EEC Directive 79/831 Annex V. A8に従い、逆相カラム(C18)でのHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)により測定する。温度: 43。

30

【0220】

上記測定は、pH2.3の酸性条件下、溶離液として0.1%水性リン酸及びアセトニトリル(10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配)を用いて実施する。

【0221】

酸性条件下でのLC-MSを用いた測定は、pH2.7で、溶離液として0.1%水性ギ酸及びアセトニトリル(これは、0.1%のギ酸を含有している)(10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配)を用いて実施する。

【0222】

中性条件下でのLC-MSを用いた測定は、pH7.8で、溶離液として0.001モルの水性炭酸水素アンモニウム溶液及びアセトニトリル(10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配)を用いて実施する。

40

【0223】

校正は、logP値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン(炭素原子数3~16)を用いて行った(logP値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間を用いて、保持時間により決定)。

【0224】

ラムダマックス値は、200nm~400nmの紫外線スペクトルを用いて、クロマトグラフシグナルの最大値で決定した。

50

【 0 2 2 5 】

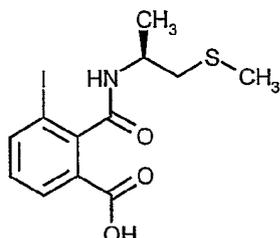
構造 (I I) で表される出発物質の調製

実施例 (I I - 1)

段階 1 :

【 0 2 2 6 】

【 化 5 1 】



10

【 0 2 2 7 】

34.7 g (1 2 7 m m o l) の 3 - ヨードフタル酸無水物を N , N - ジメチルアセトアミドに溶解させ、10 で、N , N - ジメチルアセトアミド中の 1 6 . 0 g (1 5 2 m m o l) の (S) - 1 - メチル - 2 - メチルスルファニルエチルアミンの溶液を 6 0 分間かけて添加する。その混合物をさらに 6 0 分間攪拌する。次いで、水中の 1 6 . 5 g (1 6 5 m m o l) の水酸化ナトリウムの溶液を 7 0 分間かけて添加し、その混合物をさらに 1 2 時間攪拌する。減圧下に溶媒を留去し、残渣を水及び t - ブチルメチルエーテルと混合し、塩酸を用いて p H = 1 ~ 2 に調節する。有機相を分離し、水で洗浄し、次いで、飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過する。減圧下に、濾液から溶媒を注意深く留去する。当初は油状であった生成物は、通常、数時間以内に結晶化する。

20

【 0 2 2 8 】

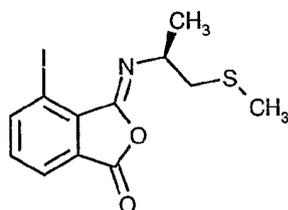
2 2 . 3 g (理論値の 4 6 %) の 3 - ヨード - N - [(S) - (1 - メチル - 2 - メチルスルファニルエチル) フタルアミド酸 (融点 1 3 2 ~ 1 3 4) が得られる。

【 0 2 2 9 】

段階 2 :

【 0 2 3 0 】

【 化 5 2 】



40

【 0 2 3 1 】

1 5 . 1 g (3 8 . 8 m m o l) の 3 - ヨード - N - [(S) - 1 - メチル - 2 - メチルスルファニルエチル] フタルアミド酸をジクロロメタンに溶解させる。40 で、水中の 6 . 0 2 g (7 1 . 7 m m o l) の炭酸水素ナトリウムを添加し、次いで、その温度で、5 . 6 4 g (5 9 . 7 m m o l) のクロロギ酸メチルを 1 5 分間かけて滴下して加える。次いで、その混合物を 5 0 で 1 時間攪拌した後、水を用いて、容積が約 2 倍になるまで希釈する。有機相を分離し、水相をジクロロメタンで 2 回抽出する。有機相を合して水で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過する。減圧下に濾液から溶媒を注意深く留去する。得られた油状の生成物は、通常、数時間以内に結晶化する。

【 0 2 3 2 】

50

10.5 g (理論値の69%)の4-ヨード-3-[(1S)-1-メチル-2-メチルスルファニルエチルイミノ]-3H-イソベンゾフラン-1-オンが得られる。

HPLC: $\log P(\text{pH} 2.3) = 3.87$ 。

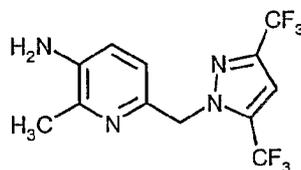
【0233】

構造(III)で表される出発物質の調製

実施例(IIIa-1)

【0234】

【化53】



10

【0235】

12 gのエタノールと12 gの濃塩酸と塩化スズ(II)二水和物の混合物に、10で、3.1 g (8.75 mmol)の6-{[3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}-2-メチル-3-ニトロピリジンを追加し、その混合物を70で45分間攪拌する。冷却したその混合物を50 mLの水の中に注ぎ入れ、1 N 水酸化ナトリウムでアルカリ性とし(pH 10~11)、それぞれメチル-t-ブチルケトン及び酢酸エチルで3回抽出する。有機相を合して水及び飽和塩化ナトリウム溶液でそれぞれ1回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過する。減圧下に濾液から溶媒を注意深く留去する。

20

【0236】

2.63 g (84%)の6-{[3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]メチル}-2-メチルピリジン-3-アミンが残渣として得られる。

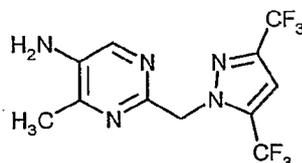
HPLC: $\log P(\text{pH} 2.7) = 1.90$ 。

【0237】

実施例(IIIa-2)

【0238】

【化54】



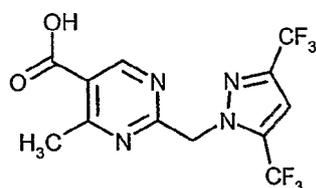
30

【0239】

段階1:

【0240】

【化55】



40

【0241】

50

15 mLのエタノール中の6.40 g (16.7 mmol)の2-(3,5-ビストリフルオロメチルピラゾール-1-イルメチル)-4-メチルピリミジン-5-カルボン酸エチル (cf. 実施例V-1)の溶液を、20 mLのエタノール中の2.82 g (50.2 mmol)の水酸化カリウムを滴下することにより処理する。次いで、その反応混合物を5時間加熱還流する。室温まで冷却した後、溶媒を除去し、残渣を水で処理し、濃塩酸を用いてpH = 1に調節する。分離した結晶を濾過し、減圧下に乾燥させる。

【0242】

6.0 g (理論値の92%)の2-(3,5-ビストリフルオロメチルピラゾール-1-イル-メチル)-4-メチルピリミジン-5-カルボン酸が得られる。

HPLC: log P (pH 2.3) = 2.68。

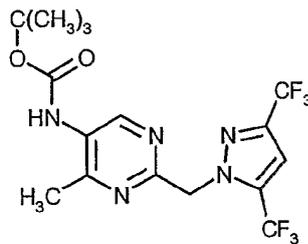
10

【0243】

段階2:

【0244】

【化56】



20

【0245】

30 mLのt-ブタノール中の5.00 g (14.1 mmol)の2-(3,5-ビストリフルオロメチルピラゾール-1-イル-メチル)-4-メチルピリミジン-5-カルボン酸の溶液に、3.89 g (14.1 mmol)のジフェニルホスホリルアジド及び1.43 g (14.1 mmol)のトリエチルアミンを順次滴下して加える。その混合物を9時間加熱還流し、室温まで冷却し、溶媒を除去して、残留物の容積を約15 mLとする。その残渣を100 mLのジクロロメタンで希釈し、0.5 N 水酸化ナトリウム、水及び飽和塩化ナトリウム溶液で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水する。残渣を、溶離液としてシクロヘキサン(2%トリエチルアミン)/酢酸エチル(6:1 3:1)を使用するシリカでのクロマトグラフィーで精製する。

30

【0246】

2.60 g (理論値の38%)の[2-(3,5-ビストリフルオロメチルピラゾール-1-イルメチル)-4-メチルピリミジン-5-イル]カルバミン酸t-ブチル(VI-1)が淡黄色の固体として得られる。

HPLC: log P (pH 2.3) = 3.84。

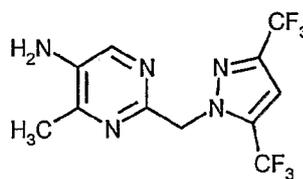
【0247】

段階3:

【0248】

【化57】

40



【0249】

50

15 mL のジクロロメタン中の 2.50 g (5.88 mmol) の [2 - (3, 5 - ビストリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イルメチル) - 4 - メチルピリミジン - 5 - イル] カルバミン酸 t - ブチルの溶液に、0 で、8.14 g (71.4 mmol) トリフルオロ酢酸を滴下して加える。その反応溶液をその温度で 30 分間攪拌し、次いで、室温で 3 時間攪拌する。次いで、その反応溶液を、氷冷した飽和炭酸ナトリウム溶液に滴下して加え、ジクロロメタンで完全に抽出する。有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を除去した後、生成物を黄色の油状物として得る。

【0250】

1.80 g (90%) の 2 - (3, 5 - ビス - トリフルオロメチルピラゾール - 1 - イル - メチル) - 4 - メチルピリミジン - 5 - イル - アミン (III a - 2) が得られる。
HPLC: log P (pH 2.3) = 2.43。

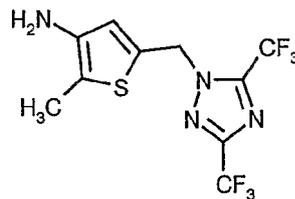
10

【0251】

実施例 (III b - 1)

【0252】

【化58】



20

【0253】

1.0 g (1.5 mmol) の 1 - [(5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - チエニル)メチル] - 3, 5 - ビス(トリフルオロメチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾールを、10 で、8.0 g のエタノールと 8.0 g の濃塩酸と 2.71 g (12.0 mmol) の塩化スズ(II)二水和物の混合物に添加し、70 で 45 分間攪拌する。冷却したその反応混合物を 25 mL の水に注ぎ入れ、1 N 水酸化ナトリウムでアルカリ性とし (pH 10 ~ 11)、メチル - t - ブチルケトン及び酢酸エチルで数回抽出する。有機相を水及び飽和塩化ナトリウム溶液でそれぞれ 1 回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、減圧下に溶媒を注意深く留去する。

30

【0254】

0.41 g (理論値の 66%) の 5 - {[3, 5 - ビス(トリフルオロメチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル]メチル} - 2メチルチオフェン - 3 - アミンが得られる。

HPLC: log P (pH 2.7) = 2.2。

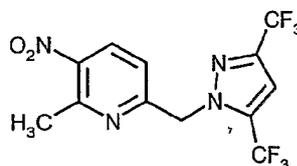
【0255】

構造 (IV) で表される出発物質の調製

実施例 (IV - 1)

【0256】

【化59】



40

【0257】

アルゴン下、80 mL の N, N - ジメチルホルムアミド中の 2.9 g (12.55 mmol)

50

o 1) の 6 - (ブロモメチル) - 2 - メチル - 3 - ニトロピリジン、 2 . 6 5 g (1 2 . 5 5 m m o l) の 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ピラゾール及び 4 . 3 4 g (3 1 . 3 8 m m o l) の炭酸カリウムを 6 0 で 3 0 分間攪拌する。冷却しその反応混合物を濾過し、残渣を N , N - ジメチルホルムアミドで洗浄し、母液を留去する。得られた暗緑色の残渣を、溶離液としてシクロヘキサン / 酢酸エチル (3 : 1) を使用するシリカでのクロマトグラフィーで精製する。

【 0 2 5 8 】

3 . 2 5 g (理論値の 7 2 %) の 6 - { [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] メチル } - 2 - メチル - 3 - ニトロピリジンが橙色の油状物として得られる。

H P L C : l o g P (p H 2 . 7) = 3 . 8 。

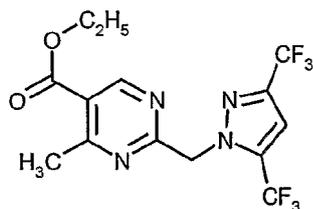
【 0 2 5 9 】

構造 (V) で表される出発物質の調製

実施例 (V - 1)

【 0 2 6 0 】

【 化 6 0 】



【 0 2 6 1 】

アルゴン下、 8 . 6 9 m L (2 3 . 6 m m o l) のナトリウムエチラート (エタノール中の 2 1 % 溶液) を 1 7 . 5 m L のエタノールで希釈し、 7 . 0 0 g (2 3 . 6 m m o l) の 2 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル) アセトアミド塩酸塩で少量ずつ処理する。次いで、その反応混合物を 0 まで冷却し、 4 . 4 0 g (2 3 . 6 m m o l) の 2 - エトキシメチレン - 3 - オキソ - ブタン酸エチルを滴下することにより処理し、その混合物を一晩加熱還流する。室温まで冷却した後、沈澱物を濾過し、濾液を蒸発させ、残渣を、溶離液としてシクロヘキサン / 酢酸エチル (4 : 1) を使用してシリカで精製する。

【 0 2 6 2 】

3 . 5 0 g (理論値の 3 8 %) の 2 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル - メチル) - 4 - メチルピリミジン - 5 - カルボン酸エチルが、黄色の油状物として得られる。

H P L C : l o g P (p H 2 . 3) = 3 . 9 6 。

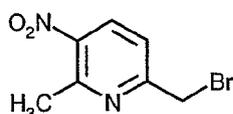
【 0 2 6 3 】

構造 (V I I) で表される出発物質の調製

実施例 (V I I - 1)

【 0 2 6 4 】

【 化 6 1 】



【 0 2 6 5 】

アルゴン下、 1 1 . 6 g (7 6 . 2 m m o l) の 2 , 6 - ジメチル - 3 - ニトロピリジ

10

20

30

40

50

ン及び1.25 g (7.62 mmol)のアゾジイソブチロニトリルを250 mLのテトラクロロメタンに溶解させ、50 に加熱する。次いで、14.9 g (83.9 mmol)のN-ブロモスクシンイミドを添加し、その混合物を照射(Hgランプ、250 W)下、5時間加熱還流する。次いで、減圧下に溶媒を留去し、残渣を、溶離液としてシクロヘキサン/酢酸エチル(4:1)を使用するシリカでのクロマトグラフィーで精製する。

【0266】

5.9 g (理論値の26%)の6-(プロモメチル)-2-メチル-3-ニトロピリジンが橙色の油状物として得られる。

HPLC: log P (pH 2.7) = 2.2。

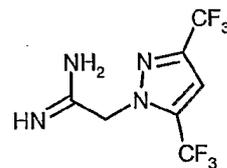
【0267】

構造(IX)で表される出発物質の調製

実施例(IX-1)

【0268】

【化62】



10

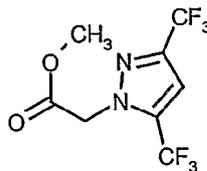
20

【0269】

段階1:

【0270】

【化63】



30

【0271】

400 mLのアセトニトリル中の100 g (490 mmol)の3,5-ビス(トリフルオロメチル)ピラゾールの溶液を、80.3 g (588 mmol)の炭酸カリウム及び53.2 g (490 mmol)のクロロ酢酸メチルで順次処理する。その反応混合物を6時間加熱還流し、室温まで冷却し、溶媒を除去する。残渣を水で処理し、酢酸エチルで完全に抽出する。有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、蒸発させる。

【0272】

88 g (理論値の59%)の(3,5-ビス(トリフルオロメチル)-ピラゾール-1-イル)酢酸メチルが黄色の油状物として得られる。

HPLC: log P (pH 2.3) = 2.93。

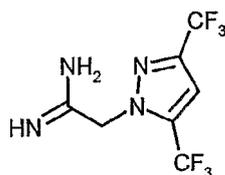
【0273】

段階2:

【0274】

40

【化64】



【0275】

アルゴン下、19.4 g (362 mmol) の塩化アンモニウムを260 mLのトルエンに懸濁させ、0℃に冷却し、181 mL (362 mmol) の塩化アルミニウム(トルエン中の2 M溶液)を滴下して処理する。その反応混合物を室温で1時間攪拌し、短時間60℃に加熱し、再度室温まで冷却する。20.0 g (72.4 mmol) の(3,5-ピストリフルオロメチルピラゾール-1-イル)酢酸メチルを滴下して加えた後、その混合物80℃で一晩攪拌する。その反応混合物を0℃まで冷却し、150 mLのメタノールで注意深く処理し、室温で1時間攪拌する。形成された塩を濾過し、メタノールで洗浄する。濾液を蒸発させた後、標的化合物を無色の固体として得る。

10

【0276】

13.5 g (理論値の60%)の2-(3,5-ピストリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)アセトアミド塩酸塩が得られる。

20

HPLC: $\log P(\text{pH } 2.3) = 0.74$ 。

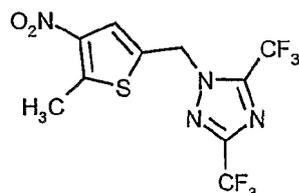
【0277】

構造(X)で表される出発物質の調製

実施例(X-1)

【0278】

【化65】



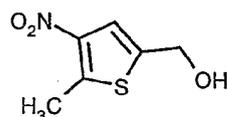
30

【0279】

段階1:

【0280】

【化66】



40

【0281】

2.9 g (16.94 mmol) の5-メチル-4-ニトロチオフェン-2-カルバルデヒドを60 mLのエタノールに溶解させ、0.32 g (8.47 mmol) の水素化ホウ素ナトリウムを室温で添加し、その反応混合物を30℃で20分間攪拌する。次いで、溶媒の半分を蒸発させ、100 mLの水を添加し、メチル t - ブチルケトンで抽出する。有機相を水及び飽和塩化ナトリウム溶液でそれぞれ1回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、蒸発させる。

【0282】

50

2.2 g (64%) の (5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - チエニル) メタノールが橙 - 褐色の油状物として得られる。

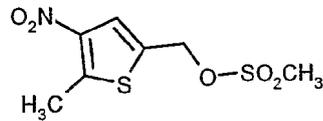
HPLC : $\log P (\text{pH } 2.7) = 1.4$ 。

【0283】

段階 2 :

【0284】

【化67】



10

【0285】

1.0 g (5.77 mmol) の (5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - チエニル) メタノール及び 0.76 g (7.51 mmol) のトリエチルアミンを 10 mL のテトラヒドロフランに溶解させ、3 mL のテトラヒドロフラン中の 0.66 g (5.77 mmol) のメタンシルホニルクロリドの溶液を 5 未満でゆっくりと滴下して加える。その溶液を室温で 1 時間攪拌する。その反応混合物を注意深く蒸発させ、残渣を取って少量の酢酸エチルの中に入れ、1 N 塩酸及び炭酸水素ナトリウム溶液でそれぞれ 1 回洗浄する。有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を留去した。残渣 (5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - チエニルメチルメタンシルホネート) は、それ以上精製することなく次に段階で使用する。

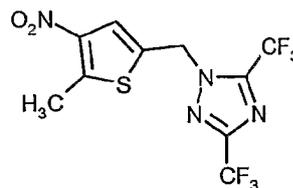
20

【0286】

段階 3 :

【0287】

【化68】



30

【0288】

1.0 g (3.98 mmol) の (5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - チエニル) メチルメタンシルホネート、0.82 g (3.98 mmol) の 3,5 - ビス(トリフルオロメチル) - 1H - 1,2,4 - トリアゾール、0.93 g (5.97 mmol) の炭酸カリウム及び 0.11 g (0.398 mmol) の 18 - クラウン - 6 をアセトニトリル中で 2 時間加熱還流する。冷却したその反応混合物を蒸発させる。残渣を取って 20 mL の水の中に入れ、酢酸エチルで 3 回抽出する。有機相を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に溶媒を留去する。生成物である (1 - [(5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - チエニル) メチル] - 3,5 - ビス(トリフルオロメチル) - 1H - 1,2,4 - トリアゾール) は、それ以上精製することなく次の段階で使用する。

40

【0289】

適用実施例

実施例 A

ミズス (Myzus) 試験 (噴霧処理)

溶媒 : 78 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : 0.5 重量部のアルキルアールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な製剤を調製するために、1 重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び

50

乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釈して所望の濃度とする。

【0290】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) に侵襲されているハクサイ (*Brassica pekinensis*) のスライスに所望の濃度の活性化化合物調製物を噴霧する。

【0291】

所望の期間が経過した後、効果 (%) を求める。100% は、全てのアブラムシが死んだことを意味し、0% は、死んだアブラムシがいなかったことを意味する。

【0292】

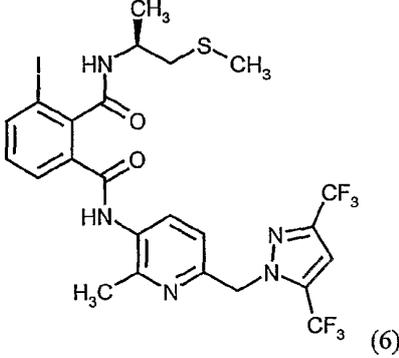
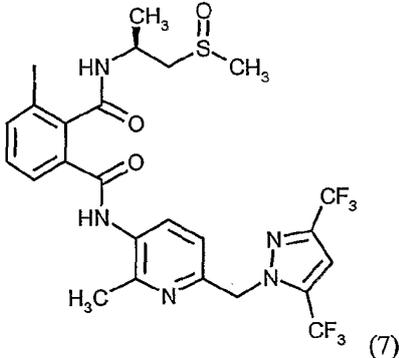
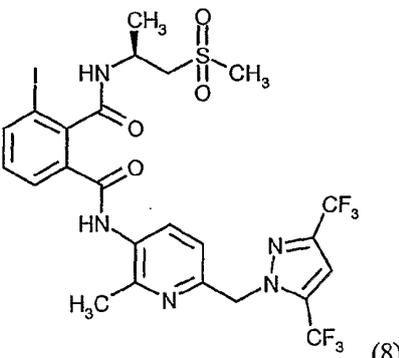
この試験において、例えば、調製実施例 1、2、5、6、7、8、9、13、14、15、16、18、19、20、21、22、23、24、28、29、30、31、34、36、37、38、39、40、41、64、65 及び 66 の化合物は、良好な活性を示した。

【0293】

【表 2】

表A

植物に害を及ぼす昆虫
ミス試験(噴霧処理)

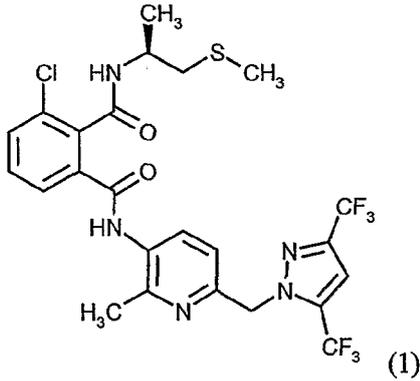
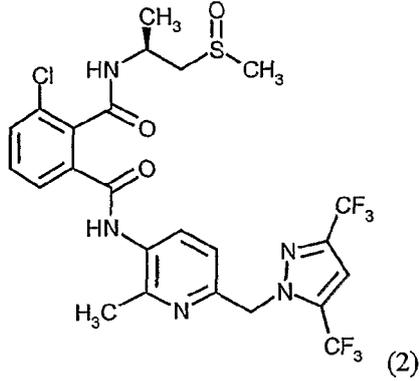
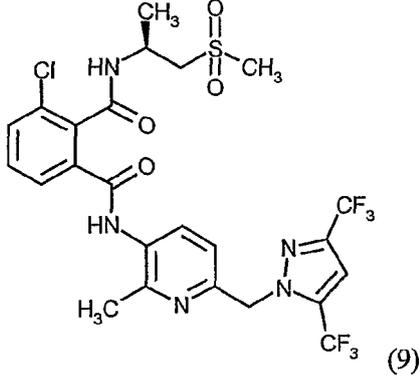
活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(6)</p>	100	100
 <p>(7)</p>	100	90
 <p>(8)</p>	100	100

10

20

30

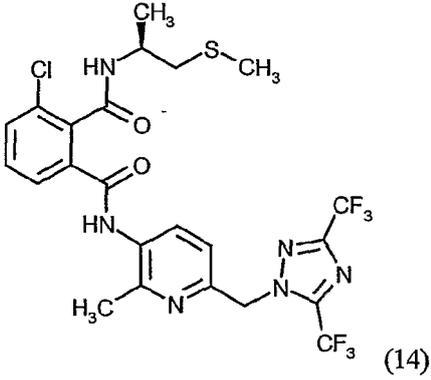
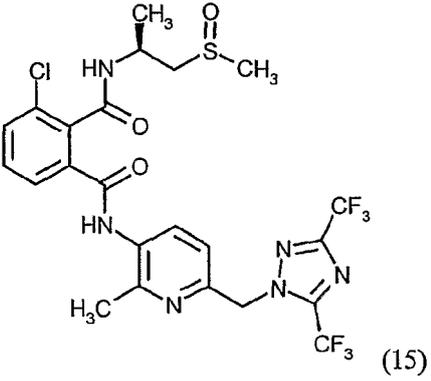
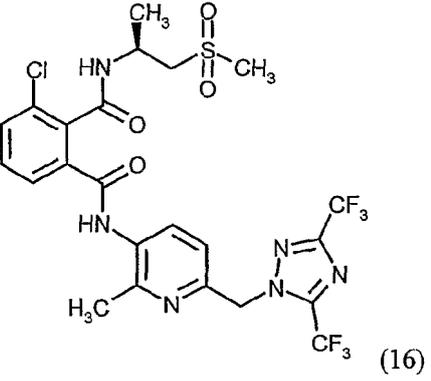
40

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(1)</p>	100	100
 <p>(2)</p>	100	100
 <p>(9)</p>	100	100

10

20

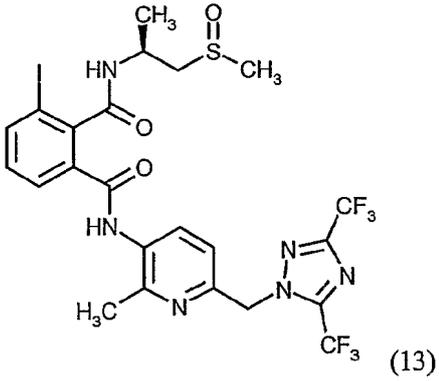
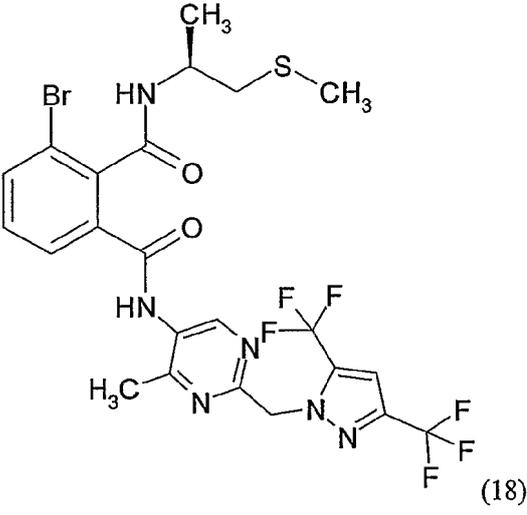
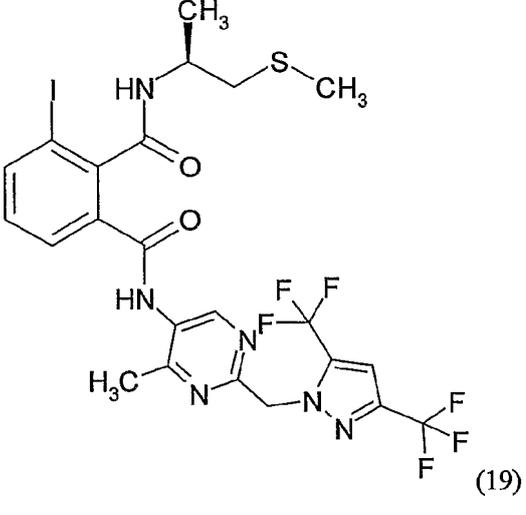
30

活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(14)</p>	100	90
 <p>(15)</p>	100	100
 <p>(16)</p>	100	100

10

20

30

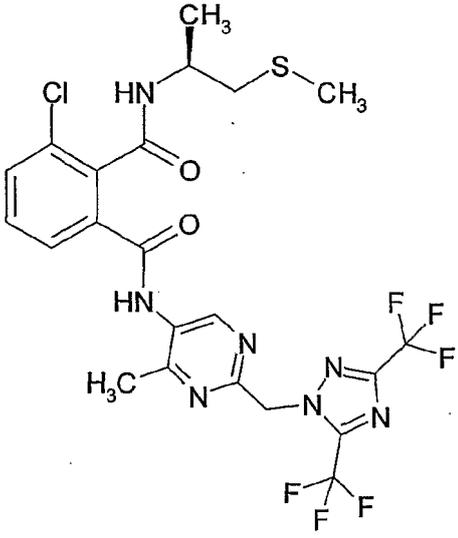
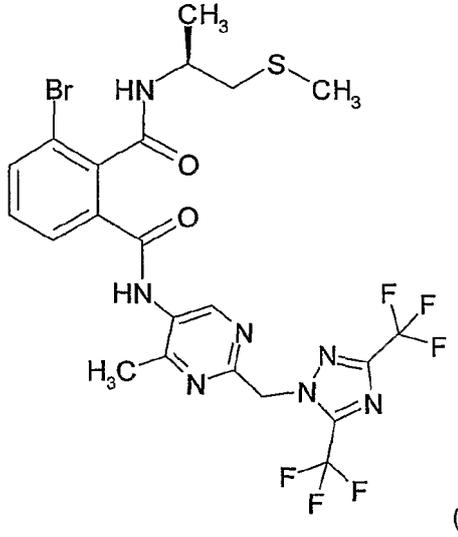
活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(13)</p>	100	100
 <p>(18)</p>	100	100
 <p>(19)</p>	100	100

10

20

30

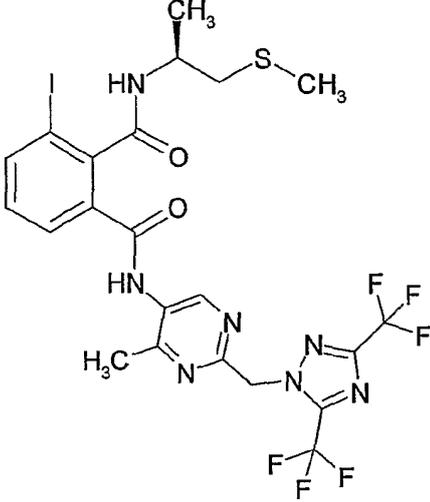
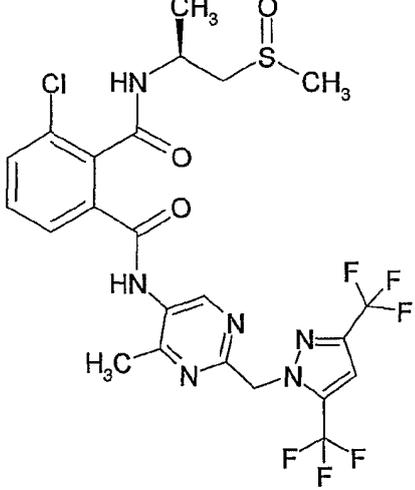
40

活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(20)</p>	100	100
 <p>(21)</p>	100	100

10

20

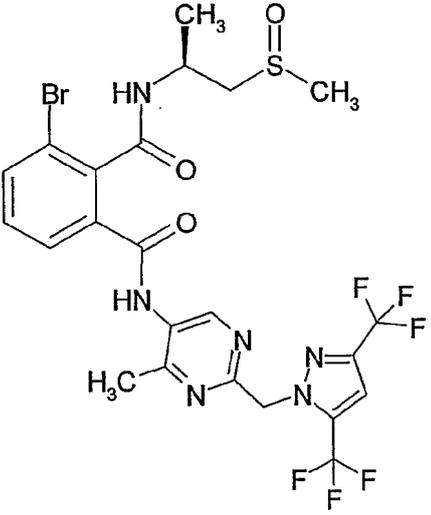
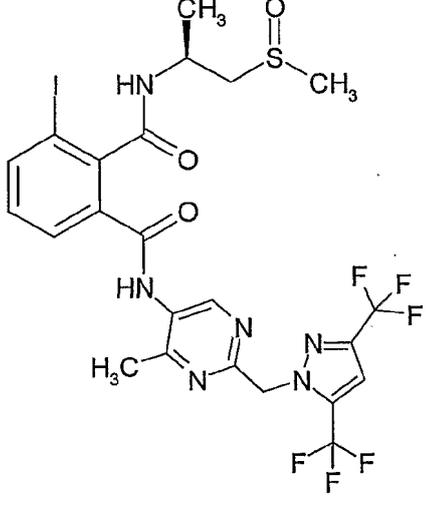
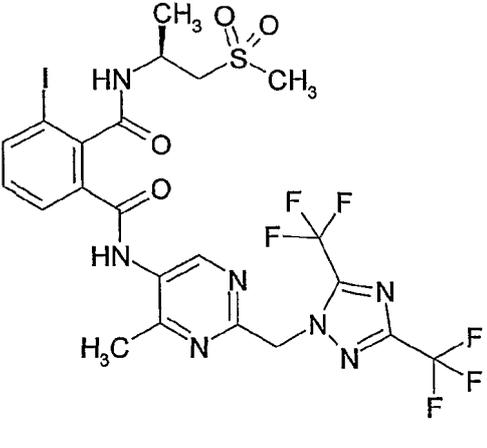
30

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(22)</p>	100	90
 <p>(5)</p>	100	80

10

20

30

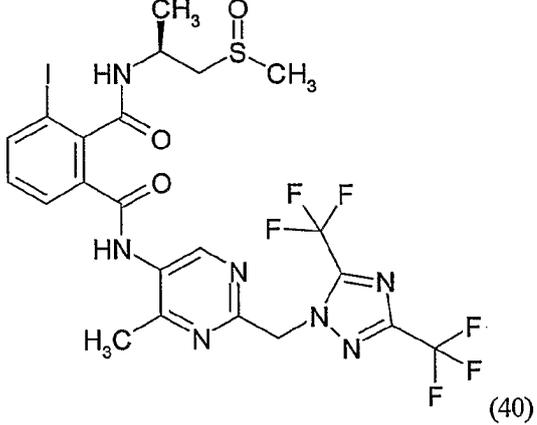
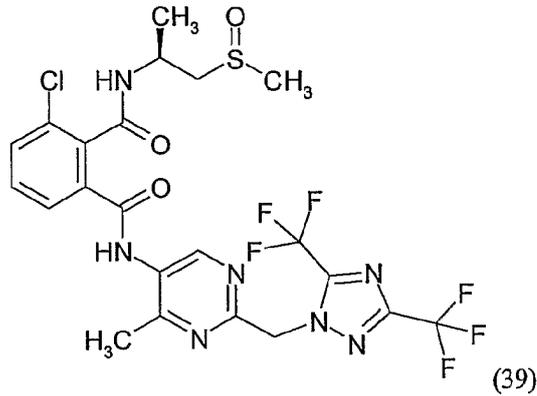
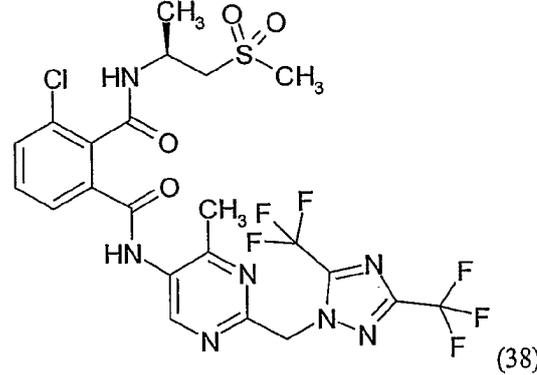
活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(23)</p>	100	80
 <p>(24)</p>	100	100
 <p>(41)</p>	100	90

10

20

30

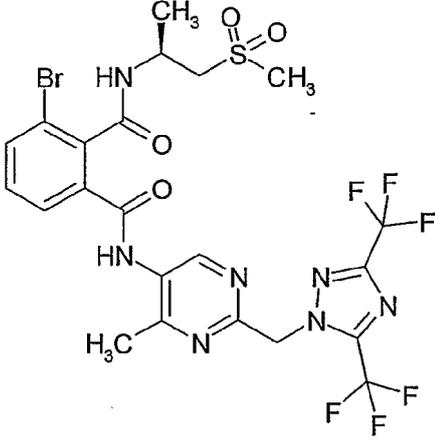
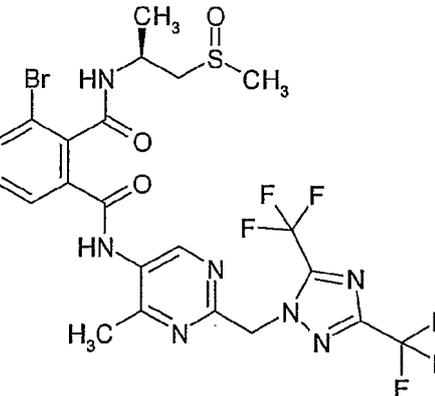
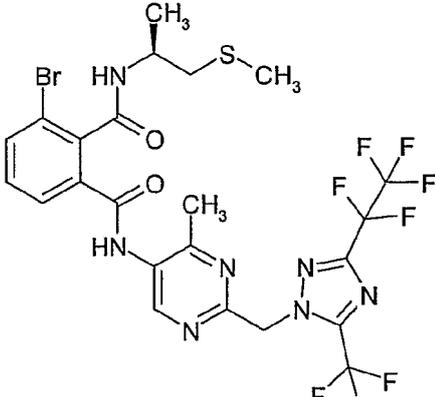
40

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(40)</p>	100	100
 <p>(39)</p>	100	100
 <p>(38)</p>	100	100

10

20

30

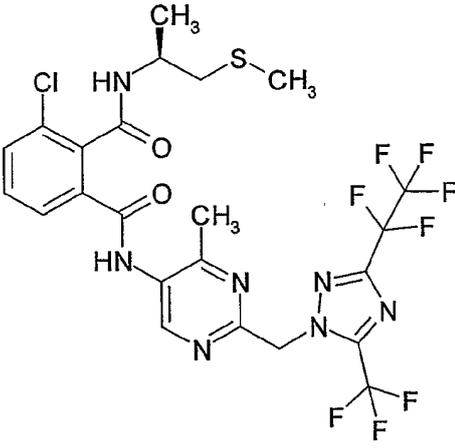
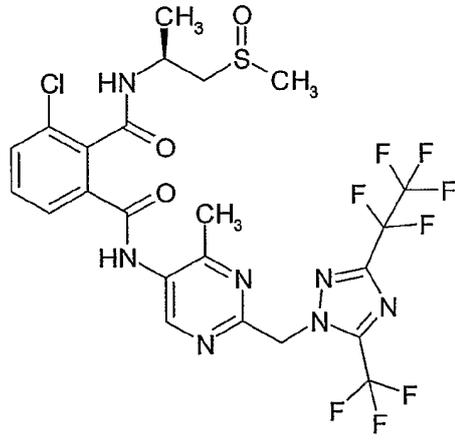
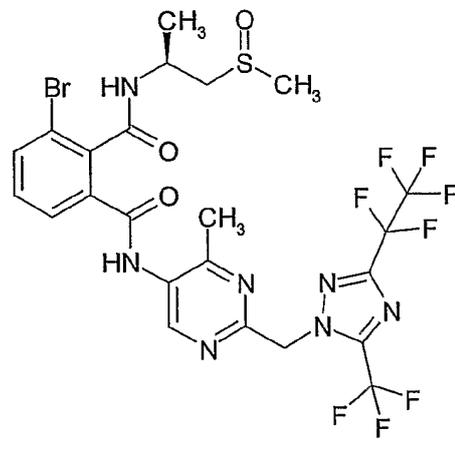
活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(37)</p>	100	100
 <p>(36)</p>	100	100
 <p>(31)</p>	100	100

10

20

30

40

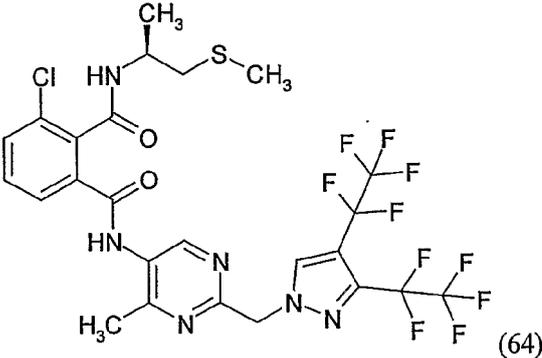
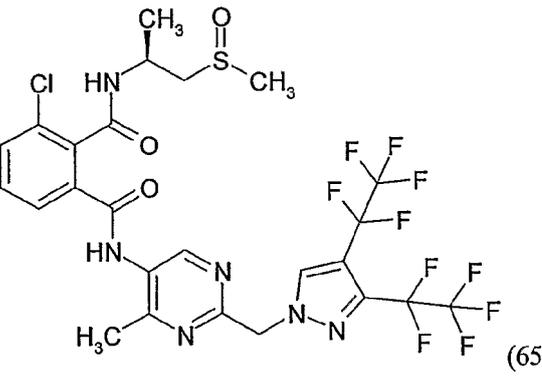
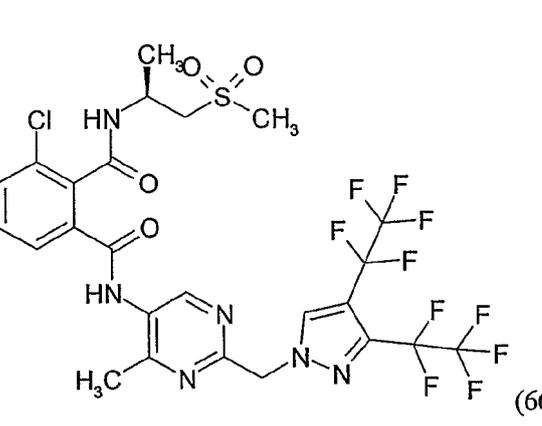
活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p>(30)</p>	100	90
 <p>(29)</p>	100	100
 <p>(28)</p>	100	100

10

20

30

40

活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
 <p style="text-align: right;">(64)</p>	100	100
 <p style="text-align: right;">(65)</p>	100	100
 <p style="text-align: right;">(66)</p>	100	100

10

20

30

【0294】

実施例 B

ファエドン (Phaedon) 試験 (噴霧処理)

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 0.5重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。

【0295】

ハクサイ (*Brassica pekinensis*) のスライスに所望の組成を有する活性化化合物調製物

40

50

を噴霧し、乾燥後、マスタードリーフビートル (mustard leaf beetle) (Phaedon cochleariae) の幼虫を寄生させる。

【 0 2 9 6 】

所望の期間が経過した後、効果 (%) を求める。100% は、全てのビートル幼虫が死んだことを意味し、0% は、死んだビートル幼虫がいなかったことを意味する。

【 0 2 9 7 】

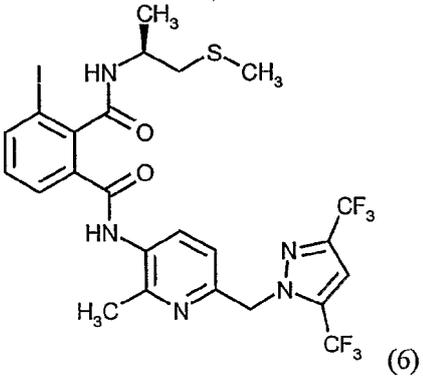
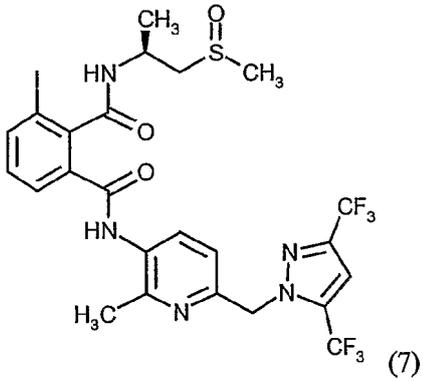
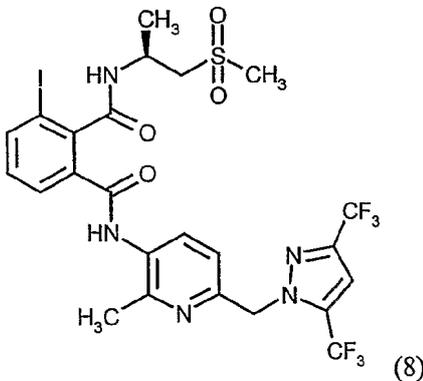
この試験において、例えば、調製実施例 1、2、6、7、8、9、13、14、15、16、64、65 及び 66 の化合物は、良好な活性を示した。

【 0 2 9 8 】

【表3】

表B

植物に害を及ぼす昆虫
ファイトン試験(噴霧処理)

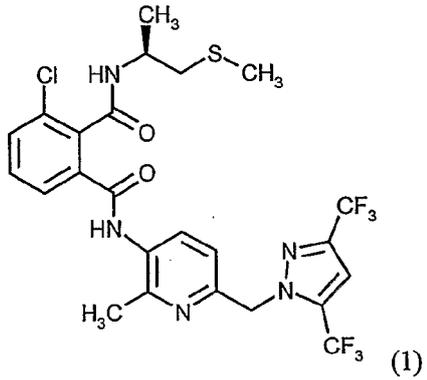
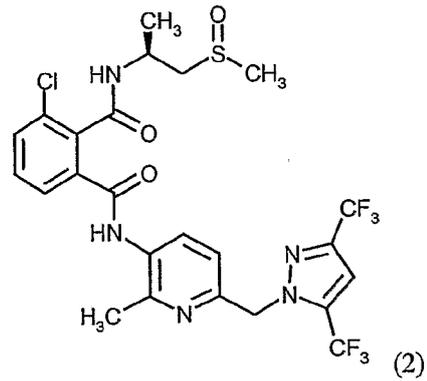
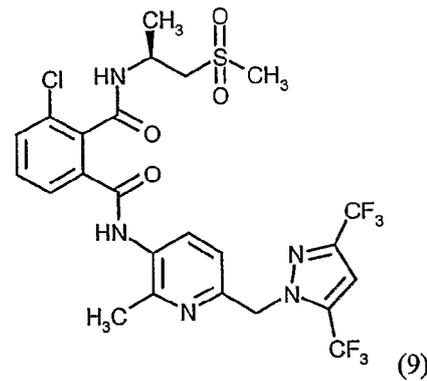
活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(6)</p>	100	100
 <p>(7)</p>	100	90
 <p>(8)</p>	100	100

10

20

30

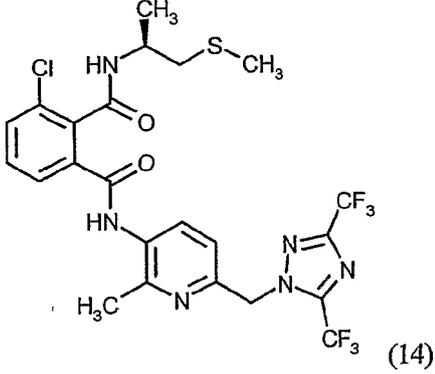
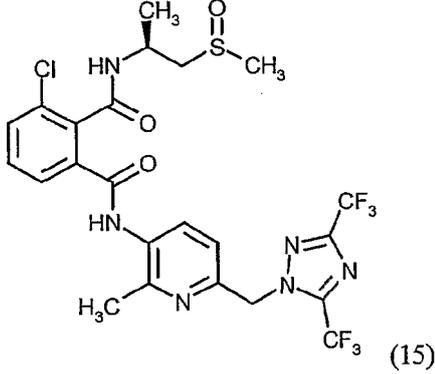
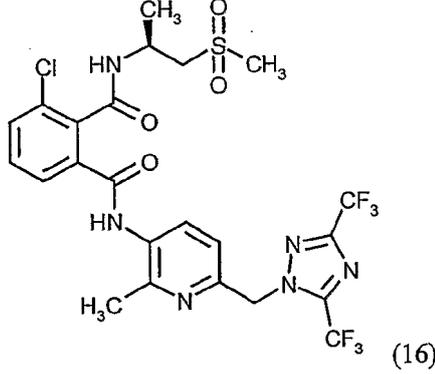
40

活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(1)</p>	100	100
 <p>(2)</p>	100	100
 <p>(9)</p>	100	100

10

20

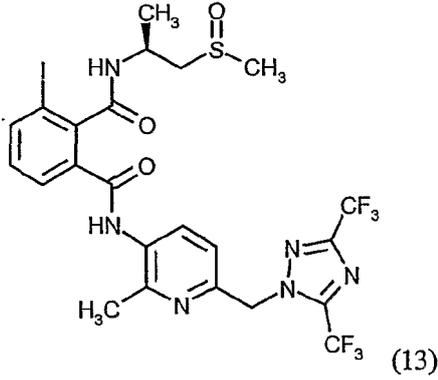
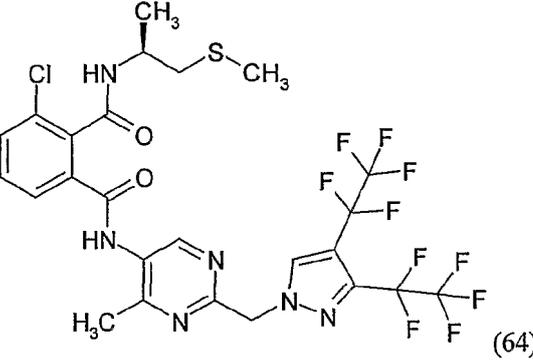
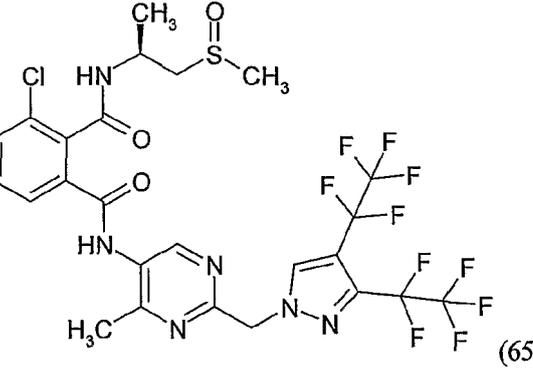
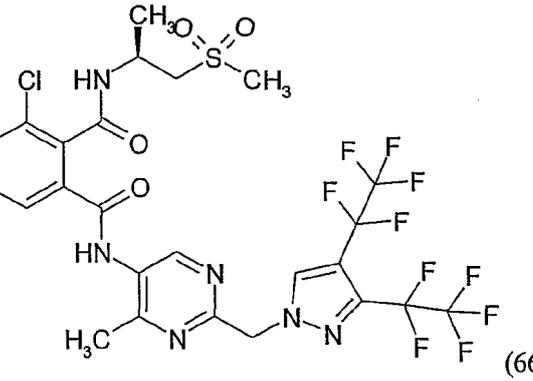
30

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(14)</p>	100	90
 <p>(15)</p>	100	100
 <p>(16)</p>	100	100

10

20

30

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(13)</p>	100	100
 <p>(64)</p>	4	100
 <p>(65)</p>	4	100
 <p>(66)</p>	4	100

【 0 2 9 9 】

実施例 C

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) 試験 (噴霧処理)

10

20

30

40

50

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 0.5重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釈して所望の濃度とする。

【0300】

トウモロコシ (*Zea mays*) の葉の切片に所望の濃度を有する活性化化合物調製物を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) の幼虫を寄生させる。

【0301】

所望の期間が経過した後、効果(%)を求める。100%は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ幼虫がいなかったことを意味する。

【0302】

この試験において、例えば、調製実施例1、2、6、7、8、9、13、14、15、16、18、19、24、29、30、31、34、64、65及び66の化合物は、良好な活性を示した。

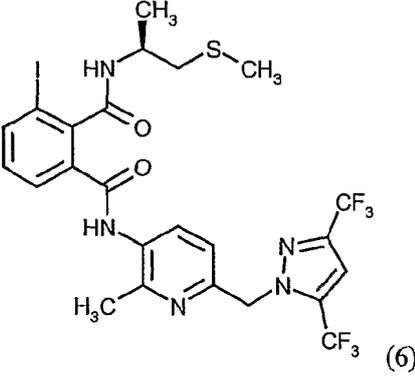
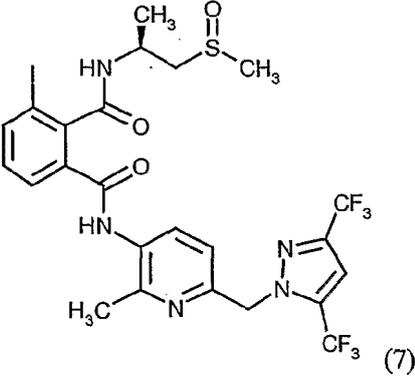
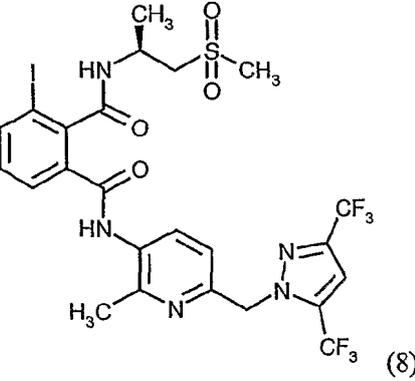
【0303】

【表4】

表C

植物に害を及ぼす昆虫

ツマジロクサヨトウ試験(噴霧処理)

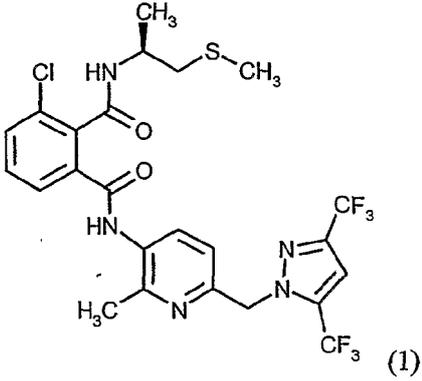
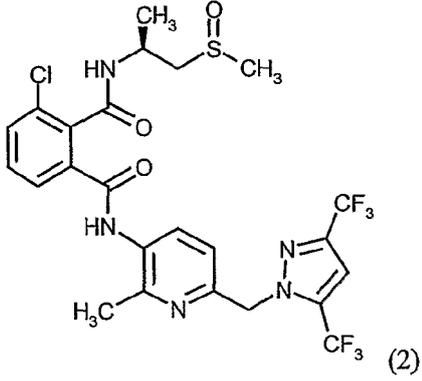
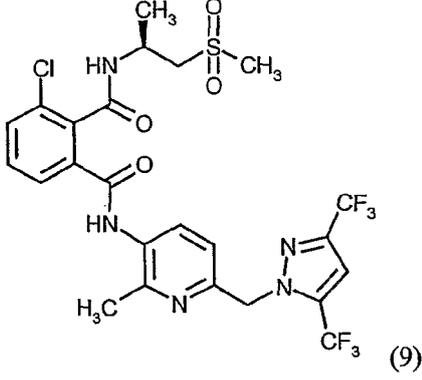
活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(6)</p>	4	100
 <p>(7)</p>	4	100
 <p>(8)</p>	4	100

10

20

30

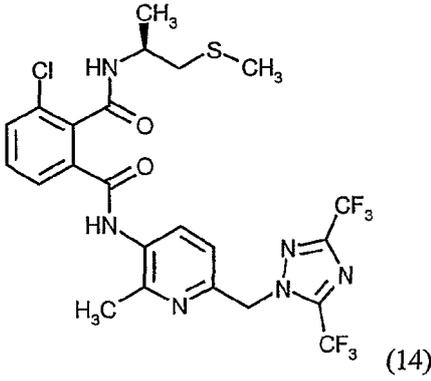
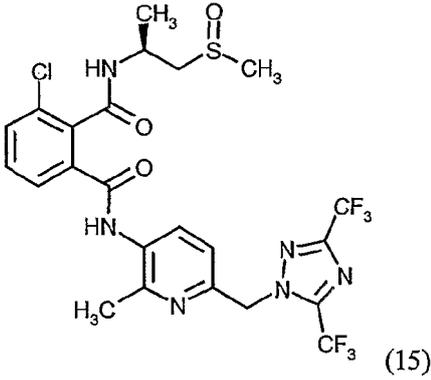
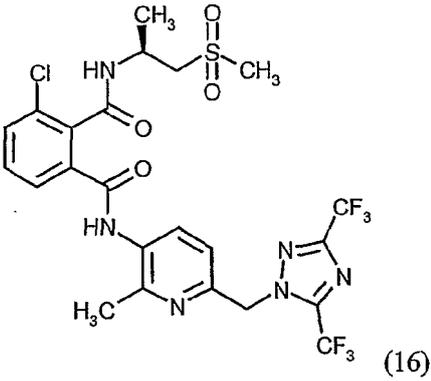
40

活性化化合物	活性化化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(1)</p>	4	100
 <p>(2)</p>	4	100
 <p>(9)</p>	4	100

10

20

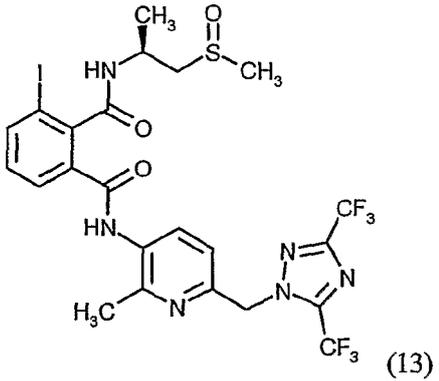
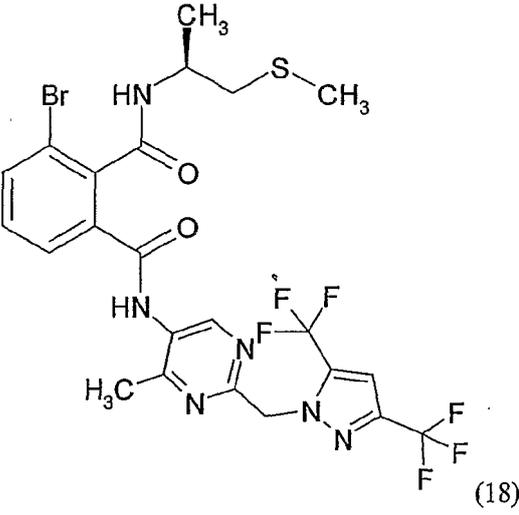
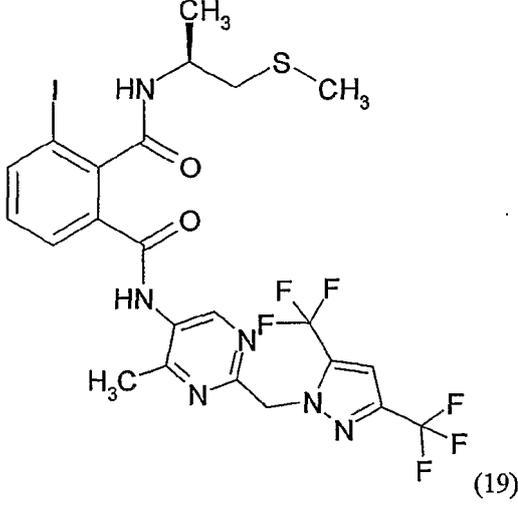
30

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(14)</p>	4	100
 <p>(15)</p>	4	100
 <p>(16)</p>	4	100

10

20

30

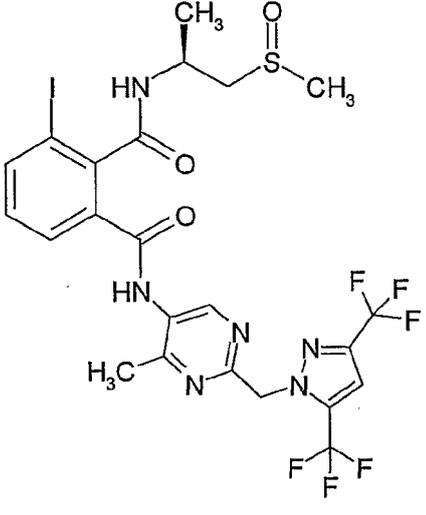
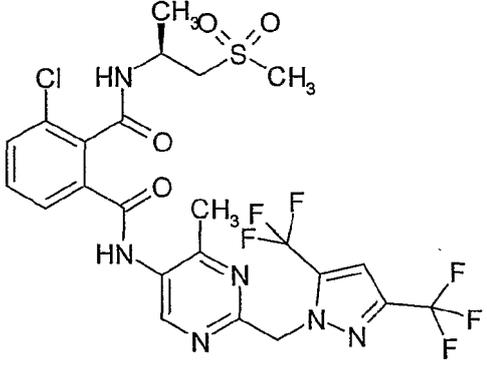
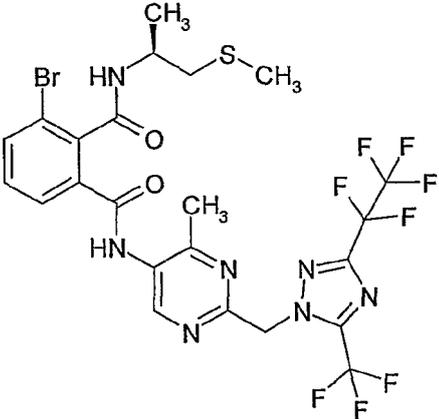
活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(13)</p>	4	100
 <p>(18)</p>	4	100
 <p>(19)</p>	4	83

10

20

30

40

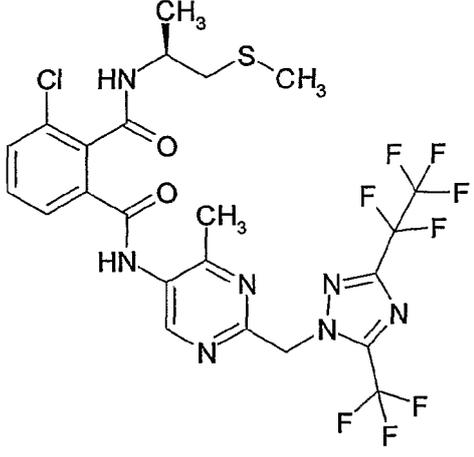
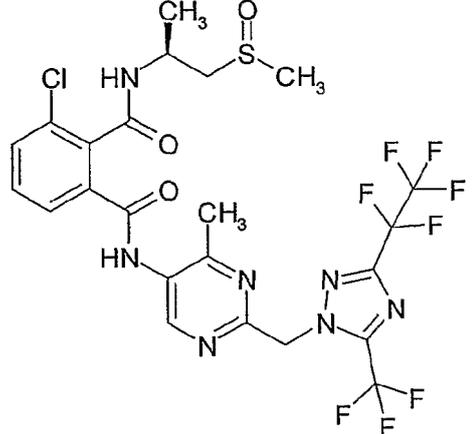
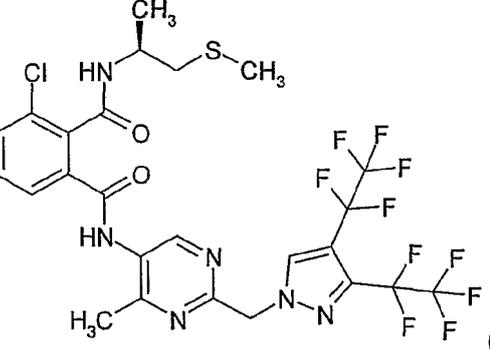
活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(24)</p>	4	83
 <p>(34)</p>	4	100
 <p>(31)</p>	4	100

10

20

30

40

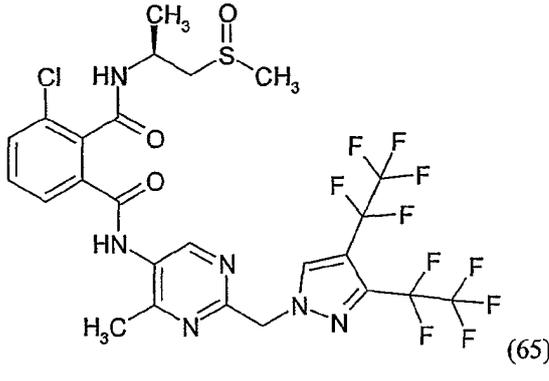
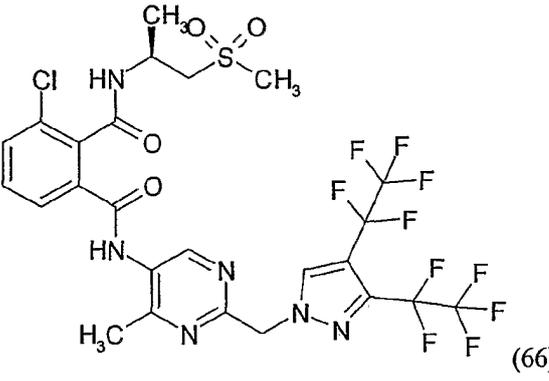
活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(30)</p>	4	100
 <p>(29)</p>	4	100
 <p>(64)</p>	4	100

10

20

30

40

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(65)</p>	4	100
 <p>(66)</p>	4	100

10

20

【0304】

実施例 D

プルテラ (Plutella) 試験

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 2重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。

30

【0305】

所望の濃度を有する活性化合物調製物中に浸漬することによりキャベツ (*Brassica oleracea*) の葉を処理し、キャベツの葉が湿った状態のまま、コナガ (*Plutella xylostella*) の幼虫を寄生させる。

【0306】

所望の期間が経過した後、死亡率 (%) を求める。100% は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0% は、死んだ幼虫がいなかったことを意味する。

40

【0307】

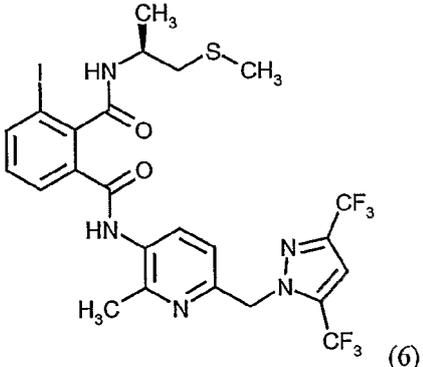
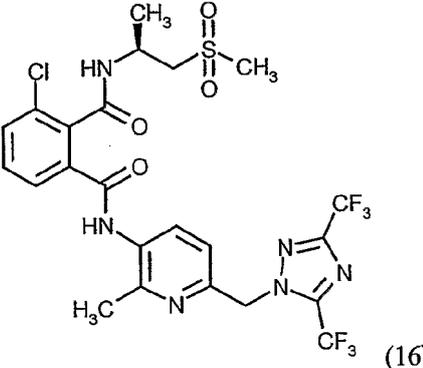
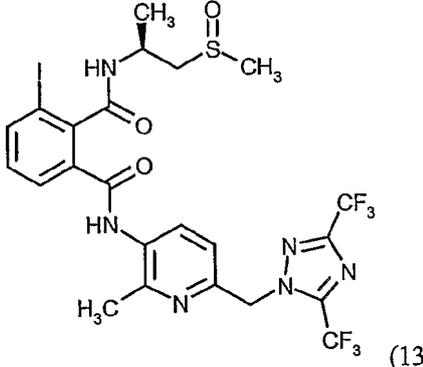
この試験において、例えば、調製実施例 6、13、16 及び 66 の化合物は、良好な活性を示した。

【0308】

【表5】

表D

植物に害を及ぼす昆虫
7日試験

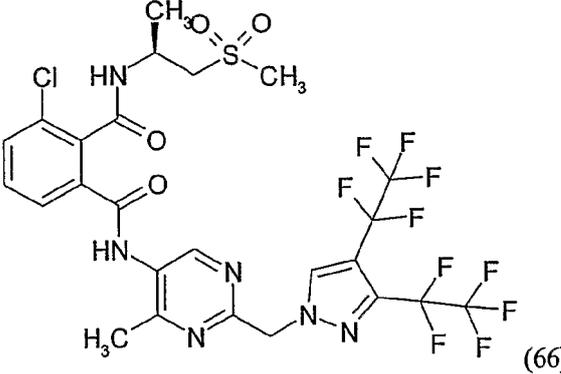
活性化化合物	活性化化合物濃度 (ppm)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(6)</p>	0,8	100
 <p>(16)</p>	0,16	100
 <p>(13)</p>	0,16	95

10

20

30

40

活性化化合物	活性化化合物濃度 (ppm)	7日後の死亡率 (%)
 <p style="text-align: right;">(66)</p>	0,8	100

10

【0309】

実施例 E

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) 試験

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

20

乳化剤： 2重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。

【0310】

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) に重度に侵襲されているワタ (*Gossypium hirsutum*) の葉を、所望の濃度の活性化化合物調製物に浸漬することにより、処理する。

【0311】

所望の期間が経過した後、死亡率 (%) を求める。100% は、全てのアブラムシが死んだことを意味し、0% は、死んだアブラムシがいなかったことを意味する。

30

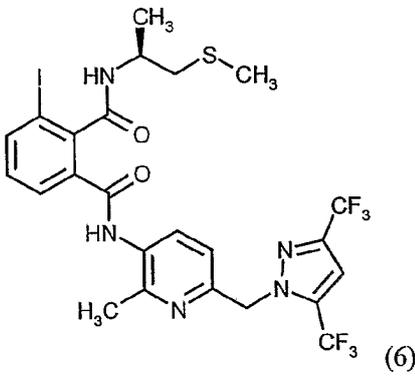
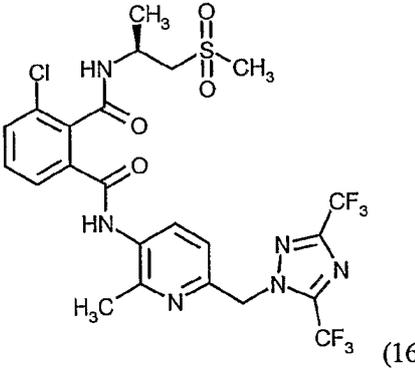
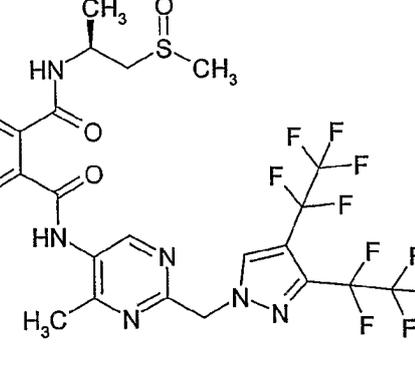
【0312】

この試験において、例えば、調製実施例 6、16 及び 65 の化合物は、良好な活性を示した。

【0313】

【表6】

表E
植物に害を及ぼす昆虫
ワアアラムシ試験

活性化化合物	活性化化合物濃度 (ppm)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(6)</p>	20	95
 <p>(16)</p>	100	80
 <p>(65)</p>	100	80

10

20

30

40

【0314】

実施例 F

シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 試験 (抵抗性系統)

溶媒: 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: 2重量部のアルキルアールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び

50

乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。

【0315】

所望の濃度の活性化合物調製物中に浸漬することによりキャベツ (*Brassica oleracea*) の葉を処理し、キャベツの葉が湿った状態のまま、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) の幼虫を寄生させる。

【0316】

所望の期間が経過した後、死亡率 (%) を求める。100% は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0% は、死んだ幼虫がいなかったことを意味する。

【0317】

この試験において、例えば、調製実施例 9 及び 66 の化合物は、良好な活性を示した。

【0318】

【表 7】

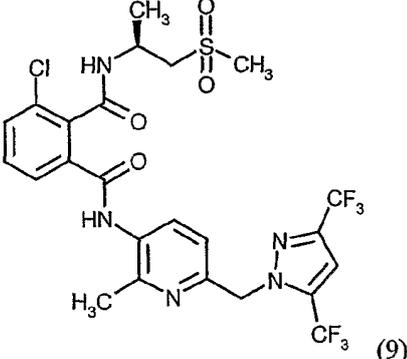
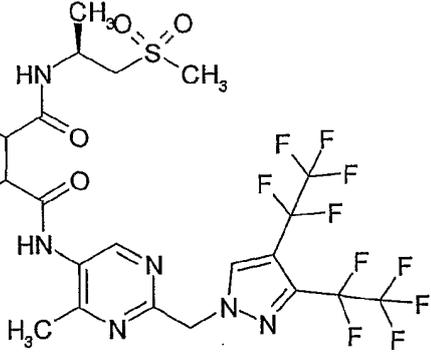
10

表F

植物に害を及ぼす昆虫

シロイチモジヨトウ試験(抵抗性系統)

20

活性化合物	活性化合物濃度 (ppm)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(9)</p>	0,8	80
 <p>(66)</p>	4	100

30

40

【0319】

実施例 G

テトラニクス (Tetranychus) 試験 O P 抵抗性

溶媒： 78重量部のアセトン

50

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 0.5重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。

【0320】

全ての成育段階のナミハダニ (*Tetranychus urticae*) に侵襲されているインゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*) の葉のスライスに、所望の濃度の活性化合物調製物を噴霧する。

【0321】

所望の期間が経過した後、効果(%)を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し、0%は、死んだナミハダニがないことを意味する。

10

【0322】

この試験において、例えば、調製実施例64の化合物は、良好な活性を示した。

【0323】

【表8】

表G

植物に害を及ぼす昆虫

テラックス試験OP抵抗性

20

活性化合物	活性化合物濃度 (g/ha)	5日後の死亡率 (%)
<p>Chemical structure (64) is a complex molecule featuring a benzimidazole core. It has a chlorine atom and a methyl group on the benzimidazole ring, and a dimethylsulfanyl group on the imidazole ring. The benzimidazole ring is connected via a methylene bridge to another benzimidazole ring, which is substituted with a methyl group and a pentafluorophenyl group.</p>	100	100

30

【0324】

実施例 H

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) 試験：水耕処理

40

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 2重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0325】

活性化合物調製物を水と混合する。得られた濃度は、水の単位容積当たりの活性化合物の量 (mg/L = ppm) で表す。処理した水をエンドウ (*Pisum sativum*) 植物を含んでいる容器の中に入れ、次いで、そのエンドウにモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) を寄生させる。

【0326】

50

所望の期間が経過した後、死亡率(%)を求める。100%は、全てのアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだアブラムシがいなかったことを意味する。

【0327】

この試験において、例えば、調製実施例24及び41の化合物は、良好な活性を示した。

【0328】

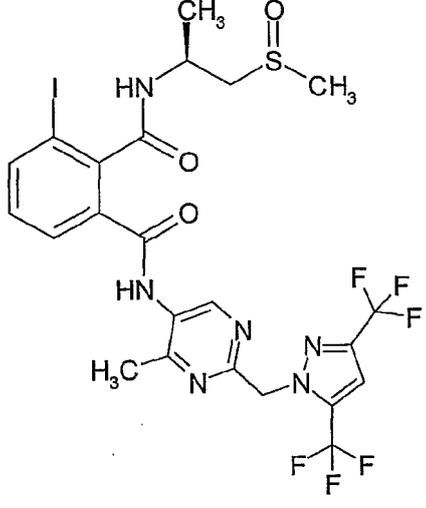
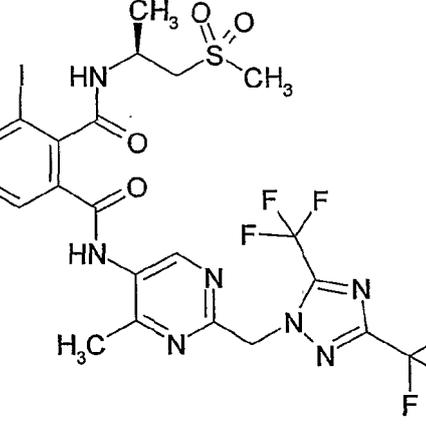
【表9】

表H

植物に害を及ぼす昆虫

モモアブラムシ試験：水耕処理

10

活性化合物	活性化合物濃度 (ppm)	6日後の死亡率 (%)
 <p>(24)</p>	20	95
 <p>(41)</p>	20	95

20

30

40

【0329】

実施例I

オオタバコガ (*Heliothis armigera*) 試験

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 2重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

50

活性化化合物の適切な製剤を調製するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。

【0330】

所望の濃度をの活性化化合物調製物中に浸漬することによりダイズ (*Glycine max*) の葉を処理し、ダイズの葉が湿った状態のままで、オオタバコガ (*Heliothis armigera*) の幼虫を寄生させる。

【0331】

所望の期間が経過した後、死亡率 (%) を求める。100% は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0% は、死んだ幼虫がいなかったことを意味する。

10

【0332】

この試験において、例えば、調製実施例66の化合物は、良好な活性を示した。

【0333】

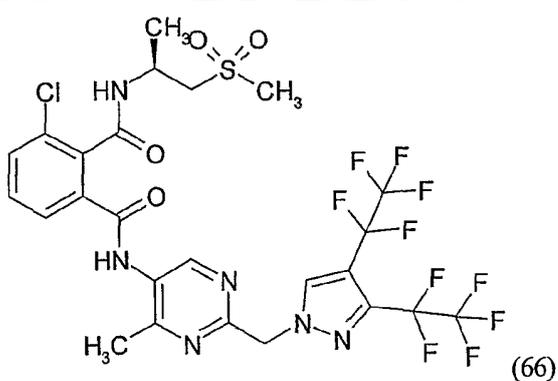
【表10】

表1

植物に害を及ぼす昆虫

オオタバコガ-試験

20

活性化化合物	活性化化合物濃度 (ppm)	7日後の死亡率 (%)
 <p>(66)</p>	0,8	80

30

フロントページの続き

- (51)Int.Cl. F I
A 0 1 P 7/04 (2006.01) A 0 1 P 7/04
- (74)代理人 100103920
 弁理士 大崎 勝真
- (74)代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
- (72)発明者 フイツシャー, リュデイガー
 ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツー・デン・フスフェレン・2 3
- (72)発明者 フンケ, クリステイアン
 ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、ローテンベルク・7 5・アー
- (72)発明者 マルサム, オルガ
 ドイツ国、5 1 5 0 3・レースラート、フォ・デム・クロスターホフ・1 9
- (72)発明者 村田 哲也
 栃木県小山市城東7 - 1 6 - 2 4 - 2 0 2
- (72)発明者 和田 勝昭
 栃木県小山市中久喜5 - 1 2 - 1 5
- (72)発明者 米田 靖
 埼玉県加須市土手1 - 1 0 - 3
- (72)発明者 渋谷 克彦
 栃木県下野市緑6 - 1 4 - 4
- (72)発明者 下城 英一
 栃木県小山市西城南4 - 1 6 - 1 エフ - 2 0 2
- (72)発明者 アルノルト, クリステイアン
 ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、パストア - レー - シュトラーセ・4 2

審査官 鳥居 福代

- (56)参考文献 蘭国特許出願公開第0 8 1 0 2 8 7 4 (N L , A)
 特開2 0 0 1 - 3 3 5 5 6 3 (J P , A)
 特開2 0 0 1 - 1 5 8 7 6 4 (J P , A)
 特開2 0 0 1 - 2 4 0 5 8 0 (J P , A)
 特開2 0 0 3 - 0 4 0 8 6 0 (J P , A)
 国際公開第2 0 0 4 / 0 8 0 9 8 4 (W O , A 1)
 特開2 0 0 4 - 2 7 7 3 3 3 (J P , A)
 特表2 0 0 4 - 5 1 5 5 4 7 (J P , A)

- (58)調査した分野(Int.Cl. , D B名)
 C07D 401/06
 C07D 403/06
 C07D 409/06
 A01N 43/56
 A01N 43/653
 CAPlus/REGISTRY(STN)