

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第5771154号  
(P5771154)

(45) 発行日 平成27年8月26日(2015.8.26)

(24) 登録日 平成27年7月3日(2015.7.3)

(51) Int.Cl.			F I		
CO7H	15/04	(2006.01)	CO7H	15/04	CSPA
AO1N	25/00	(2006.01)	AO1N	25/00	IO2
AO1N	43/16	(2006.01)	AO1N	43/16	A
AO1P	7/04	(2006.01)	AO1P	7/04	

請求項の数 9 (全 62 頁)

(21) 出願番号	特願2011-550223 (P2011-550223)	(73) 特許権者	501035309
(86) (22) 出願日	平成22年2月11日(2010.2.11)		ダウ アグロサイエンシズ エルエルシ
(65) 公表番号	特表2012-517476 (P2012-517476A)		ー
(43) 公表日	平成24年8月2日(2012.8.2)		アメリカ合衆国 インディアナ州 462
(86) 国際出願番号	PCT/US2010/023852		68, インディアナポリス, ジオンス
(87) 国際公開番号	W02010/093764		ヴィレ ロード, 9330
(87) 国際公開日	平成22年8月19日(2010.8.19)	(74) 代理人	100092783
審査請求日	平成25年2月5日(2013.2.5)		弁理士 小林 浩
(31) 優先権主張番号	61/151,549	(74) 代理人	100095360
(32) 優先日	平成21年2月11日(2009.2.11)		弁理士 片山 英二
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(74) 代理人	100120134
			弁理士 大森 規雄
		(74) 代理人	100126354
			弁理士 藤田 尚

最終頁に続く

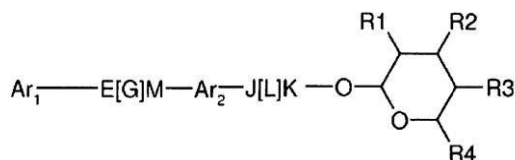
(54) 【発明の名称】 殺虫剤組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の式を有する化合物：

【化37】



式中、

(a) Ar<sub>1</sub> は、置換フェニルであり、  
但し、前記置換フェニルは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)及びC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>(ヒドロキシ)ハロアルキルから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する；

(b) E は、N、C又はCR<sub>5</sub>である；

(c) G は二重結合又は三重結合である；

(d) M は、N、C又はCR<sub>5</sub>である(但し、Eが窒素原子「N」であるとき、Mは窒素原子「N」であり、かつ、Eが炭素原子「C」であるとき、Mは炭素原子「C」であり、かつ、Eが「CR<sub>5</sub>」であるとき、Mは「CR<sub>5</sub>」である)；

(e) Ar<sub>2</sub> は、

(1) フラニル、フェニル、ピリダジニル、ピリジル、ピリミジニル、チエニル、或いは  
(2) 置換フラニル、置換フェニル、置換ピリダジニル、置換ピリジル、置換ピリミジニル又は置換チエニルであり、

但し、前記置換フラニル、置換フェニル、置換ピリダジニル、置換ピリジル、置換ピリミジニル及び置換チエニルは、H、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)H、C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)O(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ)、C(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、C(=O)O(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>(ヒドロキシ)(ハロ)アルキル、フェニル、フェノキシ、置換フェニル及び置換フェノキシから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する(但し、そのような置換フェニル及び置換フェノキシは、H、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)H、C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)O(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ)、C(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、C(=O)O(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、フェニル及びフェノキシから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する)(但し、nは、0、1、または2である。);

(f) Jは、O、N、NR<sub>5</sub>、CR<sub>5</sub>又はC=Oである;

(g) Lは単結合又は二重結合である;

(h) Kは、CR<sub>5</sub>、C=O、N、NR<sub>5</sub>又はC=Sである;

(i) R<sub>1</sub>は、H、OH、F、Cl、Br、I、オキソ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニルオキシ、OC(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OC(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、OC(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OC(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)又はNR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>である;

(j) R<sub>2</sub>は、H、F、Cl、Br、I、オキソ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニルオキシ、OC(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OC(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、OC(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OC(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)又はNR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>である;

(k) R<sub>3</sub>は、H、OH、F、Cl、Br、I、オキソ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニルオキシ、OC(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OC(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、OC(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OC(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)又はNR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>である;

(l) R<sub>4</sub>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニルオキシである;

10

20

30

40

50

(m) R<sub>5</sub>は(それぞれが独立して)、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキルである;かつ

(n) R<sub>x</sub>及びR<sub>y</sub>は独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)H、C(=O)OH、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)O(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、C(=O)O(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、フェニル及びフェノキシから選択される(但し、nは、0、1、または2である。)

10

【請求項2】

4 - [(E) - 2 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - 4 - プロポキシ - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物1)、

4 - [(E) - 2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物2)、

20

4 - {(E) - 2 - [4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロ - 2 - ヘプタフルオロプロピルオキシ - エチル)フェニル]ビニル}ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物3)、

4 - [(E) - 2 - (4 - アセチル - フェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物4)、

4 - [(E) - 2 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物5)、

30

4 - [(E) - 2 - (3 - トリフルオロメチルフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物6)、

4 - [(E) - 2 - (4 - ペンタフルオロエチルオキシフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物7)、

4 - [(E) - 2 - (4 - トリフルオロメチルオキシフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物8)、

40

4 - [(E) - 2 - (3 - トリフルオロメチルフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物9)、

4 - [(E) - 2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル)ビニル]ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - プロポキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物10)、

4 - {(E) - 2 - [4 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - トリフルオロメチル - エチル)フェニル]ビニル}ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル)オキシム(化合物11)、

50

4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 4 , 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 1 2 ) 、

4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニルエチニル ) ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 1 3 ) 、

4 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニルエチニル ) ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 1 4 ) 、

4 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニルエチニル ) ベンズアルデヒド O - ( ( 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 4 , 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 1 5 ) 、

10

{ 4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ビニル ] フェニル } カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 1 6 ) 、

{ 4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - エトキシフェニル ) ビニル ] フェニル } カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 4 , 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 1 7 ) 、

{ 4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - ペンタフルオロエチルオキシフェニル ) ビニル ] フェニル } カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - プロポキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 1 8 ) 、

20

[ 4 - ( 3 - トリフルオロメトキシフェニルアゾ ) フェニル ] カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 5 - ジメトキシ - 4 - エトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 1 9 ) 、 および

[ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシ - フェニルアゾ ) フェニル ] カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 2 0 ) 、

[ 4 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニルアゾ ) フェニル ] カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 2 1 ) 、 及び

30

[ 4 - ( 4 - ペンタフルオロエチルオキシフェニルアゾ ) フェニル ] カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 2 2 )

からなる群から選択される、化合物。

【請求項 3】

請求項 1 または 2 に記載される化合物の、殺虫剤として許容可能な酸付加塩である化合物。

【請求項 4】

請求項 1 または 2 に記載される化合物を害虫駆除のための場所 ( ヒトを除く ) に適用することを含むプロセス。

40

【請求項 5】

請求項 1 または 2 に記載される化合物と、少なくとも 1 つの他の殺虫剤との混合物を含む組成物。

【請求項 6】

請求項 1 または 2 に記載される化合物を種子に適用するプロセス。

【請求項 7】

請求項 1 または 2 に記載される化合物を、1 つ又はそれ以上の特殊化された形質を発現するために遺伝的に形質転換されている種子に適用するプロセス。

【請求項 8】

請求項 1 または 2 に記載される化合物を、1 つ又はそれ以上の特殊化された形質を発現

50

するために遺伝子的に形質転換されている遺伝子的に形質転換された植物に適用するプロセス。

【請求項 9】

請求項 1 または 2 に記載される化合物を動物（ヒトを除く）に経口投与又は適用するプロセス。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本出願は米国仮特許出願第 61 / 151, 549 号（2009 年 2 月 11 日出願）の利益を主張する（その全開示が本明細書により、参照によって組み込まれる）。本書面において開示される発明は、殺虫剤及び害虫駆除におけるその使用の分野に関連する。

10

【背景背景】

【0002】

害虫により、世界中で数百万人の人々が毎年、死亡している。その上、農業において損失を引き起こす害虫が 1 万種を超える。これらの農業損失が毎年、数十億ドルに達する。シロアリにより、様々な構造物（例えば、家屋など）に対する被害が引き起こされている。これらのシロアリ被害損失が毎年、数十億ドルに達する。最後の留意事項として、多くの貯蔵食品害虫により、貯蔵食品が食害され、その品質が低下している。これらの貯蔵食品損失が毎年、数十億ドルに達しており、しかし、より重要なことに、これらの貯蔵食品損失は、必要な食品を人々から奪っている。

20

【0003】

新しい殺虫剤に対する必要性は深刻である。様々な昆虫が、現在使用されている殺虫剤に対する抵抗性を発達させ続けている。数百の昆虫種が 1 つ又はそれ以上の殺虫剤に対して抵抗性である。より以前の殺虫剤のいくつか（例えば、DDT、カルバマート系殺虫剤及び有機リン酸系殺虫剤など）に対する抵抗性の発達が周知である。しかし、抵抗性が今では、より新しい殺虫剤のいくつかに対して発達さえしている。従って、新しい殺虫剤、具体的には、新しい作用様式を有する殺虫剤が求められている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

米国仮特許出願第 61 / 151, 549 号（2009 年 2 月 11 日出願）

30

【発明の概要】

【0005】

[発明が解決しようとする課題]

【課題を解決するための手段】

【0006】

置換基（非網羅的列挙）

置換基について示される例は、（八口を除いて）非網羅的であり、本文書において開示される発明を限定するものとして解釈してはならない。

【0007】

「アルケニル」は、炭素及び水素からなる、非環式の、不飽和（少なくとも 1 つの炭素 - 炭素二重結合）を有する枝分かれ置換基又は非枝分かれ置換基を意味し、例えば、ビニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル及びデセニルを意味する。

40

【0008】

「アルケニルオキシ」は、さらには炭素 - 酸素単結合からなるアルケニルを意味し、例えば、アリルオキシ、ブテニルオキシ、ペンテニルオキシ、ヘキセニルオキシ、ヘプテニルオキシ、オクテニルオキシ、ノネニルオキシ及びデセニルオキシを意味する。

【0009】

「アルコキシ」は、さらには炭素 - 酸素単結合からなるアルキルを意味し、例えば、メ

50

トキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、1-ブトキシ、2-ブトキシ、イソブトキシ、tert-ブトキシ、ペントキシ、2-メチルブトキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、ヘキソキシ、ヘプトキシ、オクトキシ、ノノキシ及びデコキシを意味する。

【0010】

「アルキル」は、炭素及び水素からなる、非環式の、飽和した枝分かれ置換基又は非枝分かれ置換基を意味し、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、1-ブチル、2-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ペンチル、2-メチルブチル、1,1-ジメチルプロピル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル及びデシルを意味する。

【0011】

「アルキニル」は、炭素及び水素からなる、非環式の、不飽和（少なくとも1つの炭素-炭素三重結合及び任意の二重結合）を有する枝分かれ置換基又は非枝分かれ置換基を意味し、例えば、エチニル、プロパルギル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル及びデシニルを意味する。

10

【0012】

「ハロ」は、フルオロ、クロロ、ブロモ及びヨードを意味する。

「ハロアルコキシ」は、さらには炭素-酸素単結合からなるハロアルキルを意味し、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ及びトリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、1,1,2,2,2-ペンタフルオロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロ-2-ブロモエトキシ、並びに、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシを意味する。

20

【0013】

「ハロアルキル」は、さらには1つのハロ~最大可能な数の同一又は異なるハロからなるアルキルを意味し、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2-フルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、クロロメチル、トリクロロメチル及び1,1,2,2-テトラフルオロエチルを意味する。

【0014】

「ハロフェニルオキシ」は、1つのハロ、或いは、2つ以上の同一又は異なるハロを有するフェニルオキシを意味する。

【0015】

「ヒドロキシアルキル」は、1つ又はそれ以上のヒドロキシ基を有するアルキルを意味する。

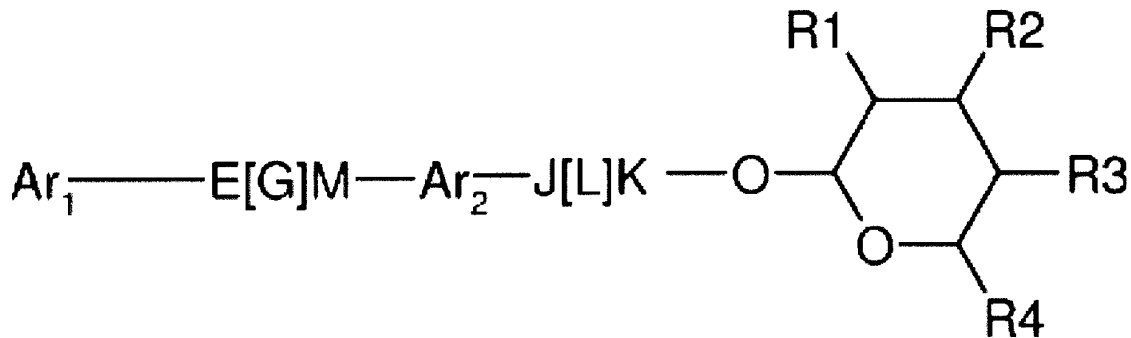
30

【発明を実施するための形態】

【0016】

本発明の化合物は下記の式を有する：

【化1】



40

式中、

(a)  $Ar_1$  は、

(1) フラニル、フェニル、ピリダジニル、ピリジル、ピリミジニル、チエニル、或いは

50

(2) 置換フラニル、置換フェニル、置換ピリダジニル、置換ピリジル、置換ピリミジニル又は置換チエニル  
であり、

但し、前記置換フラニル、置換フェニル、置換ピリダジニル、置換ピリジル、置換ピリミジニル及び置換チエニルは、H、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)H、C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)O(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、C(=O)O(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)S(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)O、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>(ヒドロキシ)ハロアルキル、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、フェニル、フェノキシ、置換フェニル及び置換フェノキシから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する(但し、そのような置換フェニル及び置換フェノキシは、H、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルコキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)H、C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)O(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、C(=O)O(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル)、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)S(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)C(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)フェニル及びフェノキシから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する)；

(b) Eは、N、C又はCR5である；

(c) Gは二重結合又は三重結合である；

(d) Mは、N、C又はCR5である(但し、Eが窒素原子「N」であるとき、Mは窒素原子「N」であり、かつ、Eが炭素原子「C」であるとき、Mは炭素原子「C」であり、かつ、Eが「CR5」であるとき、Mは「CR5」である)；

(c) Ar<sub>2</sub>は、

(1) フラニル、フェニル、ピリダジニル、ピリジル、ピリミジニル、チエニル、或いは  
(2) 置換フラニル、置換フェニル、置換ピリダジニル、置換ピリジル、置換ピリミジニル又は置換チエニル  
であり、

但し、前記置換フラニル、置換フェニル、置換ピリダジニル、置換ピリジル、置換ピリミジニル及び置換チエニルは、H、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルキル、C<sub>3</sub>~C

10

20

30

40

50

$C_6$  シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  ハロシクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  ヒドロキシシクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $S(=O)_n(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $S(=O)_n(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $OSO_2(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $OSO_2(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $C(=O)H$ 、 $C(=O)NR_xR_y$ 、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $NR_xR_y$ 、 $C(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $C(=O)O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $C(=O)(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $C(=O)O(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $C(=O)(C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $C(=O)O(C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $C(=O)(C_2 \sim C_6$  アルケニル)、 $C(=O)O(C_2 \sim C_6$  アルケニル)、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $S(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル) $O(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル) $O$ 、 $C_1 \sim C_6$  (ヒドロキシ) (ハロ) アルキル、 $C(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル) $C(=O)O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、フェニル、フェノキシ、置換フェニル及び置換フェノキシから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する(但し、そのような置換フェニル及び置換フェノキシは、H、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  ヒドロキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$  ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$  ヒドロキシシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  ハロシクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  ヒドロキシシクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $S(=O)_n(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $S(=O)_n(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $OSO_2(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $OSO_2(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $C(=O)H$ 、 $C(=O)NR_xR_y$ 、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $NR_xR_y$ 、 $C(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $C(=O)O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $C(=O)(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $C(=O)O(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $C(=O)(C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $C(=O)O(C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $C(=O)(C_2 \sim C_6$  アルケニル)、 $C(=O)O(C_2 \sim C_6$  アルケニル)、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $S(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $C(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル) $C(=O)O(C_1 \sim C_6$  アルキル)フェニル及びフェノキシから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する);

(d) Jは、O、N、NR<sub>5</sub>、CR<sub>5</sub>又はC=Oである;

(e) Lは単結合又は二重結合である;

(f) Kは、CR<sub>5</sub>、C=O、N、NR<sub>5</sub>又はC=Sである;

(g) R<sub>1</sub>は、H、OH、F、Cl、Br、I、オキソ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルオキシ、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルコキシ)、 $OC(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $OC(=O)(C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $OC(=O)(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $OC(=O)(C_2 \sim C_6$  アルケニル)又はNR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>である;

(h) R<sub>2</sub>は、H、F、Cl、Br、I、オキソ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルオキシ、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルコキシ)、 $OC(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $OC(=O)(C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $OC(=O)(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $OC(=O)(C_2 \sim C_6$  アルケニル)又はNR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>である;

(i) R<sub>3</sub>は、H、OH、F、Cl、Br、I、オキソ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルオキシ、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $(C_1 \sim C_6$  アルキル) $O(C_1 \sim C_6$  アルコキシ)、 $OC(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $OC(=O)(C_3 \sim C_6$  シクロアルキル)、 $OC(=O)(C_1 \sim C_6$  ハロアルキル)、 $OC(=O)(C_2 \sim C_6$  アルケニル)又はNR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>である;

10

20

30

40

50



(j) R<sub>4</sub>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルオキシ、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)である；

(k) R<sub>5</sub>は(それぞれが独立して)、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ハロシクロアルキルである；かつ

(l) R<sub>x</sub>及びR<sub>y</sub>は独立して、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ハロシクロアルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>ヒドロキシシクロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、S(=O)<sub>n</sub>(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、OSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)H、C(=O)OH、C(=O)(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)、C(=O)(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)O(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル)、C(=O)(C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル)、C(=O)O(C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル)、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)S(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、C(=O)(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)C(=O)O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、フェニル及びフェノキシから選択される。

【0017】

本発明の別の実施形態において、

A<sub>r1</sub>は置換フェニルであり、この場合、前記置換フェニルは、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C(=O)(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)O及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>(ヒドロキシ)ハロアルキルから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する。

【0018】

本発明の別の実施形態において、

A<sub>r1</sub>は置換フェニルであり、この場合、前記置換フェニルは、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ及び(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル)Oから独立して選択される1つ又はそれ以上の置換基を有する。

【0019】

本発明の別の実施形態において、A<sub>r2</sub>はフェニルである。

【0020】

本発明の別の実施形態において、Jは、N、NR<sub>5</sub>又はCR<sub>5</sub>である。

【0021】

本発明の別の実施形態において、KはC=O又はNである。

【0022】

本発明の別の実施形態において、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>は(それぞれが独立して)C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシである。

【0023】

本発明の別の実施形態において、R<sub>4</sub>はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである。

【0024】

本発明の別の実施形態において、R<sub>5</sub>はHである。

【0025】

これらの実施形態が表されているが、他の実施形態、及び、これらの表された実施形態と、他の実施形態との組合せが可能である。

【0026】

ピラノース中間体の調製

広範囲の様々なピラノース系化合物(種々の構造形態で、例えば、D体及びL体)を、

10

20

30

40

50

本発明の化合物を作製するために使用することができる。例えば、ピラノース系化合物の下記の非網羅的列挙を使用することができる：リボース、アラビノース、キシロース、リキソース、リブロース、キシルロース、アロース、アルトロース、グルコース、マンノース、グロース、イドース、ガラクトース、タロース、プシコース、フルクトース、ソルボース、タガトース、フコース、ミカロース、キノボース、オレアンドロース、ラムノース及びパラトース。下記の例のほとんどにおいて、L-ラムノースが、ピラノース中間体を作製するために使用された。

【0027】

一般に、ピラノース中間体は、(L-ラムノースを例として使用して)下記のように作製することができる。O-アルキル化されたラムノース誘導体を、ヨウ化アルキル及び粉末化水酸化カリウム(KOH)を5 ~ 15 で乾燥ジメチルスルホキシド(DMSO)において使用することによって市販のL-ラムノース又はL-ラムノース水和物から調製することができる。その後、完全アルキル化生成物が、ヘキサン(hexanes)によるDMSO溶液の抽出、続いて、真空下でのヘキサン層の濃縮によって単離される。その後、この中間体アルキルピラノシドが塩酸(HCl)水溶液又は他の酸水溶液により直接に処理され、これにより、フリーのヒドロキシ糖が、通常の場合には -アノマー及び -アノマーの混合物として形成される。

10

【0028】

代替では、ペル-アルキル化(per-alkylated)されたL-ラムノースを、アベルメクチンB<sub>2</sub>からのメチルオレアンドロシドの単離について記載される条件(Lowe他、J. Org. Chem., 1994, 59, 7870)と類似する条件を使用して、スピノサド又は他のトリ-(O-アルキル)ラムノシル化天然産物の加水分解によって単離することができる。従って、工業用スピノサドを乾燥メチルアルコール(MeOH)において過剰な濃硫酸により処理することにより、ラムノース糖の加水分解及びメチルピラノシドへの変換が生じる。その後、純粋なメチルピラノシドをヘキサン(hexanes)又は他の炭化水素溶媒による徹底した抽出によって反応媒体から取り出すことができる。その後、純粋なラムノピラノシドを真空下での粗液体の蒸留によって約65%~75%の全体的収率で単離することができる。

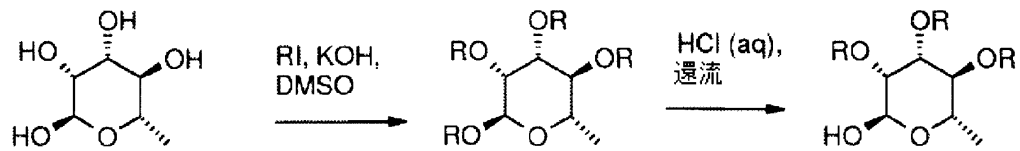
20

【0029】

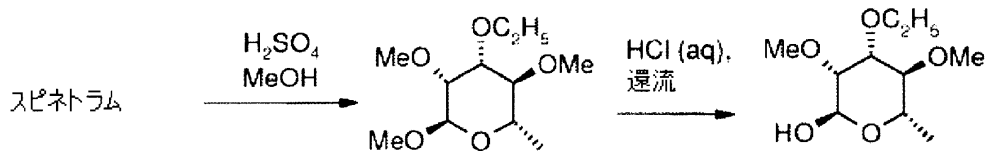
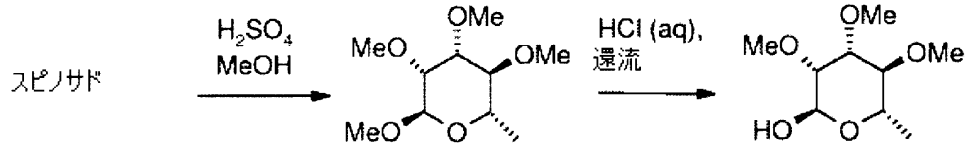
3-O-メチル-2,4-ジ-O-メチルラムノースを、スピネトラムから出発して、同様な様式で調製することができる。他のアルキル化誘導体を、適切に官能基化されたスピノソイド誘導体から開始することによって同様に製造することができる。この場合、そのようなスピノソイド誘導体は、米国特許第6,001,981号(DeAmicis他、1999)に記載される条件を使用して、1つ又はそれ以上のフリーのヒドロキシル基がラムノースに結合しているいずれかのスピノシン因子(例えば、スピノシンJ)から作製される。

30

## 【化2】



L-ラムノース  
又はL-ラムノース水合物



10

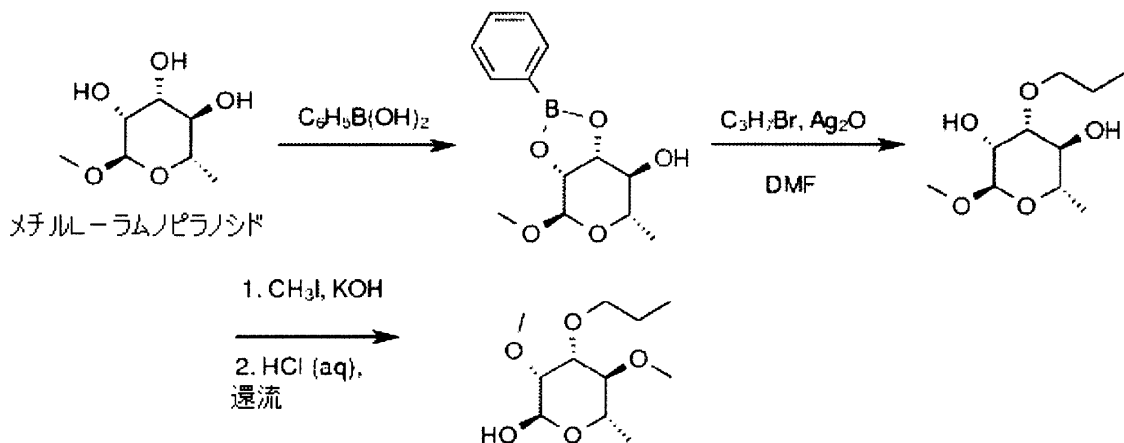
## 【0030】

より大きな置換基によりC3が選択的にアルキル化されるラムノース前駆体が記載されている（例えば、Pozsgay他、Can. J. Chem.、1987、65、2764を参照のこと）。1つの代替経路が下記に記載され、この経路では、スズ試薬の使用が回避される。L-ラムノースのメチルピラノシドを、水の除去を考慮する条件のもとで1当量のフェニルボロン酸と反応することにより、ホウ素アセタールが形成される。このアセタールを0 ~ 110 で極性の非プロトン溶媒（例えば、N, N - ジメチルホルムアミド（DMF）など）においてヨウ化アルキル及び酸化銀により処理することにより、C3 - OHにおける選択的アルキル化が生じ、これにより、3 - O - アルキルメチルピラノシドが得られる。その後、この物質はさらに、以前に記載された条件を使用して、2 - OH及び4 - OHの位置をヨウ化メチルによりメチル化することができる。その後、この完全アルキル化ラムノースは、2, 4 - ジ - O - メチル - 3 - O - アルキルL - ラムノースを得るために上記のように加水分解することができる。

20

30

## 【化3】



40

## 【0031】

そのようなピラノース中間体を作製することの例示が実施例において示される。

## 【0032】

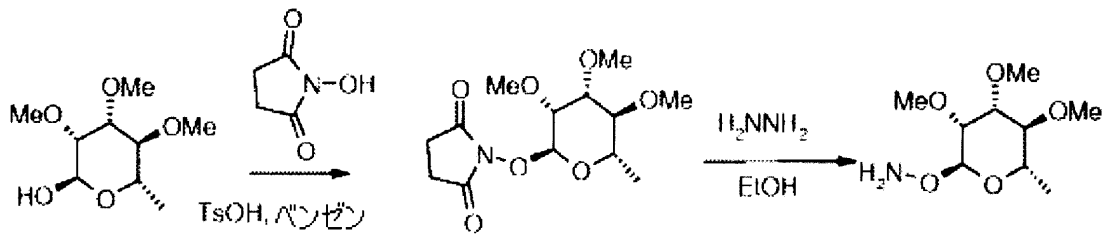
ヒドロキシルアミノピラノース中間体もまた作製することができる。例えば、ヒドロキシルアミノピラノース中間体を、形成される水が共沸除去されて、N - スクシンイミドイ

50

ルヒドロキシルアミン付加物を形成する条件のもとで、対応するラムノース誘導体及びN-ヒドロキシスクシンイミド(NHS)から調製することができる。1つの実施形態において、このような条件は、ラムノース及びNHSをトルエン又はベンゼンにおいて一緒にし、触媒量の酸(例えば、p-トルエンスルホン酸(TsOH))を加え、ディーン・スターク型トラップを備える装置で加熱還流することを伴う。フリーヒドロキシルアミン中間体への変換が、アルコール性溶媒(例えば、MeOH又はエチルアルコール(EtOH))における過剰なヒドラジン水和物又は無水ヒドラジンによるスクシンイミドイル付加物の処理によって達成される。その後、O-ラムノシルヒドロキシルアミンを、周囲温度から還流までにおいて、EtOH又は他の低級アルコール溶媒を使用してアルデヒド又はケトンにより処理することにより、O-ラムノシルオキシムが生じる。

10

【化4】



【0033】

20

ジアリアル中間体の調製

本発明の化合物は、上記で記載されたピラノース系化合物を共有結合リンカーJ[L]KQによってジアリアル中間体のAr1-E[G]M-Ar2に連結することによって調製される(これらは上記で定義される)。ジアリアル前駆体が、共有結合リンカーを形成するためにピラノース中間体が結合し得るAr2上の好適な官能基を含有する場合、広範囲の様々なジアリアル前駆体を、本発明の化合物を調製するために使用することができる。好適な官能基には、アミノ基、オキソアルキル基、ホルミル基又はカルボン酸基が含まれる。これらの中間体は、化学文献に以前に記載された方法によって調製することができる。これらの方法のいくつかが下記に示される。

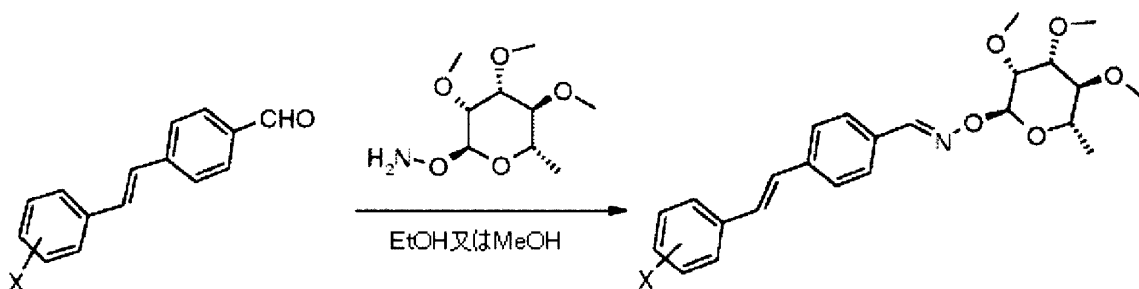
【0034】

30

オキシム連結化合物の調製

オキシム連結化合物を、0 ~ 100 の間の温度で、有機溶媒(例えば、MeOH又はEtOHなど)において、対応する2-ヒドロキシルアミノ糖との反応によって、対応するアリアルアルデヒド又はアリアルケトンから調製することができる。

【化5】



40

【0035】

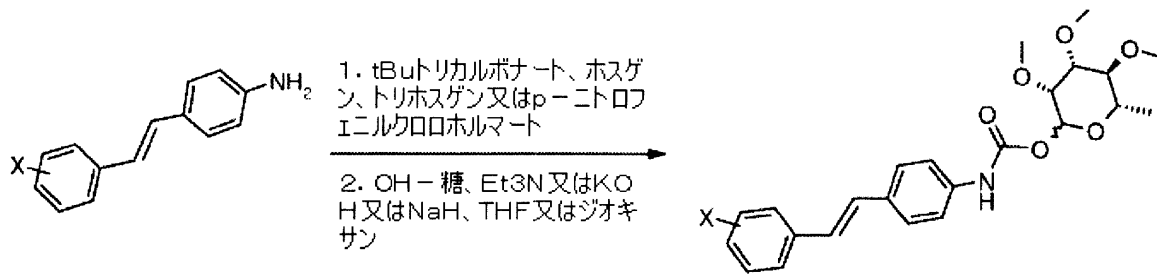
カルバマート連結化合物の調製

カルバマート連結化合物又はチオカルバマート連結化合物を、イソシアナート、イソチオシアナート又はp-ニトロフェニルカルバマートへの変換、それに続く、0 ~ 100 の間の温度での好適な溶媒(例えば、テトラヒドロフラン(THF))における適切な-ROH及び有機塩基又は無機塩基による処理によって、対応するアリアルアミンが

50

ら調製することができる。

【化6】



10

【0036】

これらの反応において、ラムノース部分のC1における - 立体配置が通常の場合には主生成物であるものの、少量の - アノマーもまた形成される。これら2つの異性体はクロマトグラフィーによって分離することができ、又は、それらは混合物として使用することができる。

【0037】

本発明の範囲に含まれる化合物の調製を、ピラノース中間体への結合のための、酸官能基、アルデヒド官能基、ケトン官能基又はアミノ官能基を含有する適切な中間体の合成によって行うことができる。

20

【実施例】

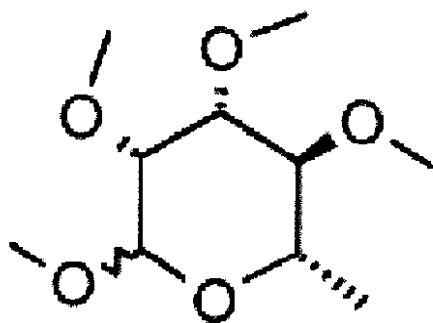
【0038】

これらの実施例は例示目的のためであり、本文書において開示される発明を開示された実施形態のみに限定するものとして解釈してはならない。

【0039】

実施例1：(3R, 4R, 5S, 6S) - 2, 3, 4, 5 - テトラメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン (化合物E - 1) の調製

【化7】



30

40

L - ラムノース水和物 (40グラム (g)、0.22モル (mol)) を乾燥ジメチルスルホキシド (DMSO; 450ミリリットル (mL)) に溶解した溶液を2リットル (L) の三口丸底フラスコに入れ、機械的に攪拌し、その間に、粉末化された水酸化カリウム (KOH; 75g, 1.34mol) を一度に加えた。ヨードメタン (187g, 1.32mol) を、溶液の温度が30 未満で維持されるような速度でこの溶液に加えた。ドライアイス - アセトン浴を間欠的に使用して、この温度を維持した。添加が完了した後 (約2時間 (h) 後)、溶液をさらに3h攪拌し、その後、溶液を周囲温度で一晩放置した。その後、この透明な溶液をヘキサン (hexanes) により抽出し (500mL, 4回)、一緒にしたヘキサン溶液をブラインにより洗浄し、その後、乾燥し、溶媒をエバポレーションして、明るいオレンジ色の溶液を得た (44g, 92%)。蒸留により、40gの

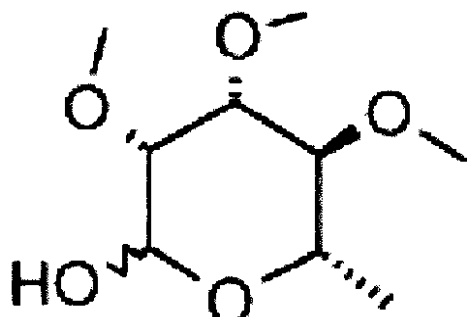
50

無色のオイルを得た ( b p、150 ( 0.5 mmHg ) )。

【0040】

実施例2：(3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - オール (化合物E - 2) の調製

【化8】



10

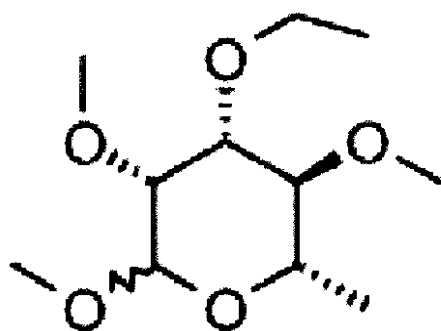
E - 1 ( 35.7 g、0.162 mol ) を 2 N 塩酸 ( HCl ; 300 mL ) に溶解した溶液を 98 で 5 時間にわたって加熱し、その後、室温に冷却し、ジクロロメタン ( C H<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> ) により抽出した ( 170 mL、4 回 )。一緒にした抽出液を硫酸マグネシウム ( MgSO<sub>4</sub> ) で乾燥し、活性炭で脱色した。濃縮により、表題化合物 ( 24.7 g、74% ) を粘性のオイルとして得た。粗生成物の一部 ( 960 ミリグラム ( mg ) ) を、クーゲルロール装置を使用して真空蒸留し、これにより、890 mg を 145 ~ 155 ( 1 ~ 2 mm ) で回収した。

20

【0041】

実施例3：(3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 2, 3, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン (化合物E - 3) の調製

【化9】



30

硫酸 ( H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>、98% ; 300 mL、5.6 mol ) を 4 L の三角フラスコにおけるメチルアルコール ( 2.5 リットル ( L ) ) の攪拌溶液にゆっくり加えた。溶液が周囲温度に冷えたとき、3' - OEt スピノシン J / L ( 350 g、0.47 mol ) (これは米国特許第 6,001,981 号 ( De Amicis 他、1999 ) の場合のように調製された) を加え、得られた溶液を 6 時間にわたって加熱還流した。冷却された溶液を 4 L の分液ロートに移し、ヘキサン ( hexanes ) により抽出した ( 1 L、3 回 )。一緒にした有機溶液を乾燥し、真空下で濃縮し、その後、クーゲルロール装置を使用して蒸留して、無色のオイルを得た ( 65 g、60% ) ( b p、165 ( 10 m Torr ) )。

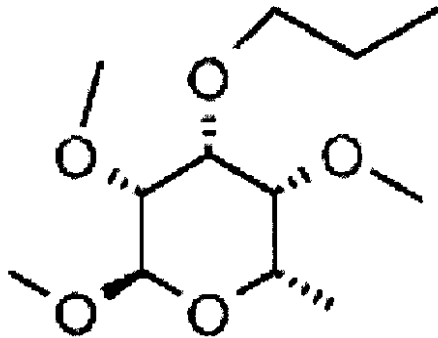
40

【0042】

実施例4：(2R, 3R, 4R, 5R, 6S) - 2, 3, 5 - トリメトキシ - 6 - メチ

50

ル - 4 - プロポキシ - テトラヒドロピラン ( 化合物 E - 5 ) の調製  
【化 1 0】



10

工程 1 . ( 2 R , 3 R , 4 R , 5 R , 6 S ) - 2 - メトキシ - 6 - メチル - 4 - プロポキシ - テトラヒドロピラン - 3 , 5 - ジオール。

メチル - L - フコピラノシドの 3 , 4 - ボロナートエステル調製のための O s h i m a 他 ( Tetrahedron Lett.、1997、38、5001 ) によって記載される手順に従って、メチル - L - ラムノピラノシドを 2 , 3 - ボロナートエステルに変換した。粗エステル ( 10 . 0 g、37 . 7 ミリモル ( m m o l ) ) をトルエン ( 150 m L ) に溶解し、ヨードプロパン ( 8 . 0 g、47 m m o l )、酸化銀 ( 21 . 8 g、94 . 3 m m o l ) 及びトリエチルアミン ( 4 . 77 g、47 . 1 m m o l ) により処理した。溶液を 100 に加熱し、一晚 ( 16 時間 ) 攪拌した。冷却及びろ過の後、溶液をガム状オイルにまで濃縮し、酢酸エチル ( E t O A c ) - ヘキサンのグラジエントにより溶出するシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、5 . 9 g の純粋な生成物を得た。

20

【 0 0 4 3 】

工程 2 . 工程 1 から物質を、実施例 1 に記載される条件のもと、MeI 及び KOH を使用してメチル化して、化合物 E - 5 を得た。

表 1 に列挙されるピラノース中間体を、より以前に記載され、また、実施例 1 ~ 実施例 4 において例示される経路によって調製した。

30

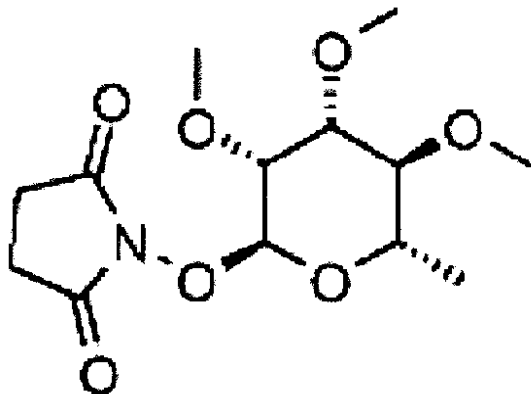
【 0 0 4 4 】

2 - O - スクシンイミドイルピラノース中間体を調製する一例が下記に記載される。

【 0 0 4 5 】

実施例 5 : 1 - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 4 , 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルオキシ ) ピロリジン - 2 , 5 - ジオン ( 化合物 E - 23 ) の調製

【化 1 1】



40

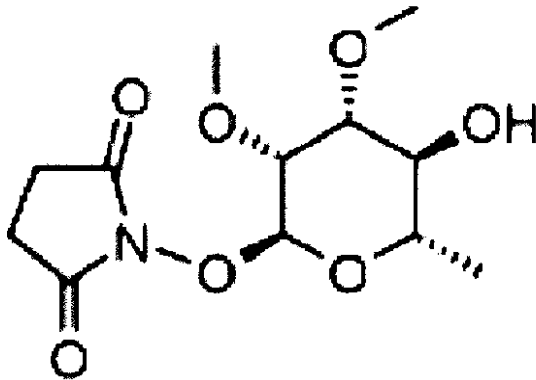
50

ベンゼン ( 50 mL ) における 2, 3, 4 - トリ - O - メチル - L - ラムノース ( 6.5 g, 31.5 mmol ) 及び N - ヒドロキシスクシンイミド ( 5.4 g, 47 mmol ) の攪拌溶液に、p - トルエンスルホン酸 ( 50 mg, 触媒 ) を加えた。溶液を加熱還流し、水 ( H<sub>2</sub>O ) を、ディーン・スターク型トラップを使用して集めた。4 時間後、溶液を冷却し、上澄みのトルエン層を少量の不溶性ガムから分離した。有機層を重炭酸ナトリウム ( NaHCO<sub>3</sub> ) の飽和溶液 ( 20 mL ) により洗浄し、MgSO<sub>4</sub> で乾燥し、固体にまで濃縮した。エーテル ( Et<sub>2</sub>O ) - ヘキサン ( hexanes ) からの再結晶により、表題化合物 ( 4.95 g, 52% ) を灰白色の固体として得た。

【 0046 】

実施例 6 : 1 - ( ( 2S, 3R, 4R, 5S, 6S ) - 5 - ヒドロキシ - 3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルオキシ ) ピロリジン - 2, 5 - ジオン ( 化合物 E - 24 ) の調製

【 化 12 】



( 2R, 3R, 4R, 5S, 6S ) - 5 - ベンジルオキシ - 3, 4 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - オール ( これは、Wu 他、Carbohydr. Res., 1998, 306, 493 に従って調製された ; 10.5 g, 26.6 mmol )、N - ヒドロキシスクシンイミド ( 5.0 g, 50 mmol ) 及び TsOH ( 250 mg, 触媒 ) をベンゼン ( 100 mL ) に溶解した溶液を、ディーン・スターク型トラップを使用して H<sub>2</sub>O を除きながら、24 時間にわたって加熱還流した。褐色の溶液を冷却し、ろ過し、飽和 NaHCO<sub>3</sub> 溶液により洗浄し、濃縮した。ガム状オイルを、70 : 30 のヘキサン ( hexanes ) - アセトンにより溶出するシリカゲルクロマトグラフィーによって精製した。その後、純粋な O - スクシンイミド ( 7.5 g, 14.5 mmol ) を 500 mL の Parr 水素化装置に移し、Pd(OH)<sub>2</sub>/C ( 0.95 g ) を EtOH ( 75 mL ) において使用して脱ベンジル化した。その後、溶液 ( この溶液は 19 ポンド / 平方インチ ( psi ) の水素を 24 時間にわたって取り込んだ ) をろ過し、濃縮し、これにより、固体残渣が残り、この固体残渣を EtOH から再結晶して、白色の固体を得た ( 3.25 g )。

【 0047 】

表 2 に列挙される O - スクシンイミジルピラノース中間体を、より以前に記載され、また、実施例 5 及び実施例 6 において例示される経路によって調製した。

【 0048 】

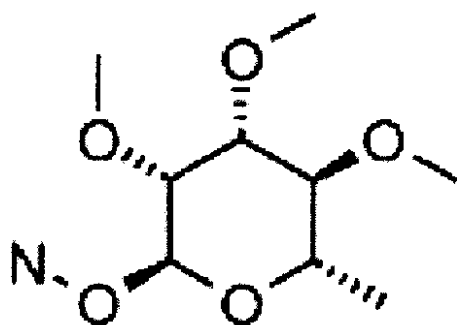
2 - ヒドロキシルアミノピラノース中間体を対応する O - スクシンイミドイルピラノース中間体から調製する一例が次に記載される。

【 0049 】

実施例 7 : O - ( ( 2S, 3R, 4R, 5S, 6S ) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) ヒドロキシルアミン ( 化合物 E - 30 ) の調製



## 【化13】



10

2,3,4-トリ-O-メチル-N-スクシンイミジルラムノース誘導体 E-23 (0.50 g、1.65 mmol) (これは実施例5に従って調製された) を無水 EtOH (5 mL) に溶解し、過剰なヒドラジン水和物 (0.4 g、8 mmol) により処理した。溶液を周囲温度で60分間 (min) 撹拌した。そのとき、多量の白色の沈殿物が形成された。さらなる EtOH (5 mL) を加え、溶液を周囲温度で一晩撹拌した。溶液をろ過し、濃縮し、その後、クロマトグラフィー (100% EtOH) によって精製して、265 mg (74% の収率) の標記ヒドロキシルアミンを結晶性固体として得た。

20

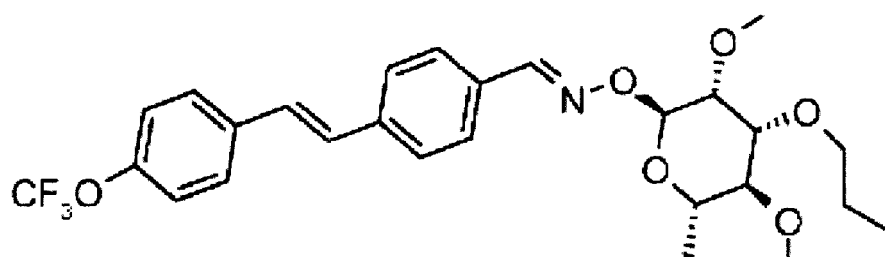
## 【0050】

表3におけるピラノース中間体を、より以前に記載され、また、実施例7において例示されるような経路によって調製した。

## 【0051】

実施例8：4-[(E)-2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ビニル]ベンズアルデヒド O-((2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-ジメトキシ-6-メチル-4-プロポキシ-テトラヒドロピラン-2-イル)オキシム (化合物1) の調製

## 【化14】



30

工程1：4-[(E)-2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ビニル]ベンゾニトリル。窒素フラッシュされた丸底フラスコに、三塩基性リン酸カリウム (617 mg、2.9 mmol) を、ジメチルアセトアミド (DMA; 2 mL)、4-トリフルオロメトキシプロモベンゼン (500 mg、2.1 mmol) 及び4-シアノビニルベンゼン (322 mg、2.5 mmol) において加え、続いて、酢酸パラジウム (23 mg、5 mol%) を加えた。溶液を12時間にわたって撹拌とともに140 に加熱した。その後、溶液を室温に冷却し、H<sub>2</sub>Oに注ぎ、EtOAcにより抽出し、ブラインにより洗浄した。一緒にした有機層をMgSO<sub>4</sub>で乾燥し、ろ過し、濃縮した。粗物質をカラムクロマトグラフィー (ヘキサン (hexanes) における EtOAc、0~75%) によって精製して、黄色の固体を得た (543 mg、90%)。この固体はガスクロマトグラフィー/質量スペクトル (GC-MS) 分析によって純粋であった。この物質を、さらに精製することなく、次の反応においてそのまま使用した。

40

50

## 【 0 0 5 2 】

工程 2 . 4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド。シアノジフェニルスチレン ( 5 4 3 m g , 1 . 8 8 m m o l ) を乾燥  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  ( 1 0 m L ) に溶解し、ドライアイス / アセトン浴で - 7 8 に冷却した。この溶液に、ヘキサン ( hexanes ) におけるジイソブチルアルミニウムヒドリド ( 3 . 7 m L , 3 . 7 m m o l ) を滴下により加えた。反応液を、室温に加温しながら 4 時間にわたって攪拌した。所望されるアルデヒドが、GC - MS によって、もっぱら形成された。水及びメタノールを反応混合物に加えた。これにより、発泡し、ゲルが形成された。この不均一な混合物を  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  により希釈し、B i o t a g e 相分離器フリットでろ過した。有機層を集め、濃縮して、黄色の固体を得た ( 4 5 0 m g , 8 1 % ) 。これは GC - MS によ

10

## 【 0 0 5 3 】

工程 3 . 4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - 4 - プロポキシ - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム。工程 1 で調製されたアルデヒド ( 0 . 1 g , 0 . 3 m m o l ) 及び化合物 E - 3 2 ( 0 . 3 m m o l ) を無水 E t O H ( 1 0 m L ) に溶解し、溶液を、一晚、攪拌とともに 4 0 に加熱した。その後、水 ( 5 m L ) を、冷却された溶液に加えた。これにより、白色の沈殿物が形成された。溶液を、 $\text{H}_2\text{O}$  ( 5 m L ) と、E t O A c ( 5 m L , 3 回 ) との間で分配し、一緒にした有機層を  $\text{MgSO}_4$  で乾燥し、ろ過し、濃縮して、暗黄色の固体を得た。順相カラムクロマトグラフィー ( E t O A c - ヘキサン ( hexanes ) のグラジエント ) による精製により、所望の生成物 ( 7 2 m g , 4 0 % ) を明黄色の固体として得た : m p 、 1 2 4 ~ 1 3 2 ;  $^1\text{H NMR}$  ( 300 MHz,  $\text{CDCl}_3$  ) d 8.13 ( s , 1H ) , 7.63 ( d , J = 9.0 Hz , 2H ) , 7.54 ( m , 4H ) , 7.21 ( d , J = 9.0 Hz , 2H ) , 7.11 ( d , J = 9.0 Hz , 2H ) , 5.63 ( s , 1H ) , 3.71 ( m 1H ) , 3 . 70 - 3 . 50 ( m , 4H ) , 3.59 ( s , 3H ) , 3.55 ( s , 3H ) , 3.20 ( t , J = 9.0 Hz , 1H ) , 1.68 ( m , 2H ) , 1.31 ( d , J = 6.0 Hz , 3H ) , 0.98 ( t , J = 7.6 Hz , 3H ) ; ESIMS m/z 524 ( [M+H]<sup>+</sup> )

20

## 【 0 0 5 4 】

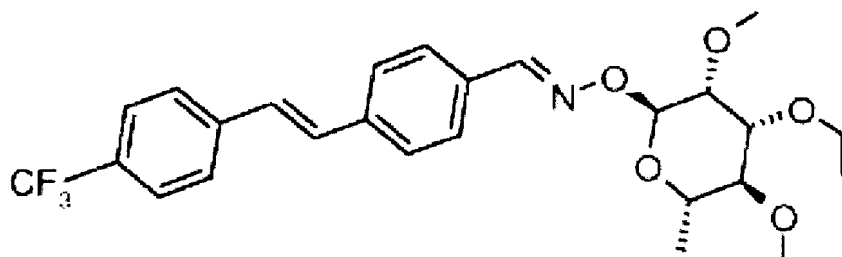
下記の化合物を、実施例 8 において概略が示される条件を使用して調製した。

30

## 【 0 0 5 5 】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 2 )

## 【 化 1 5 】



40

オキシム形成により、60%の収率で、黄褐色の固体を得た : m p 、 1 5 0 ~ 1 5 3

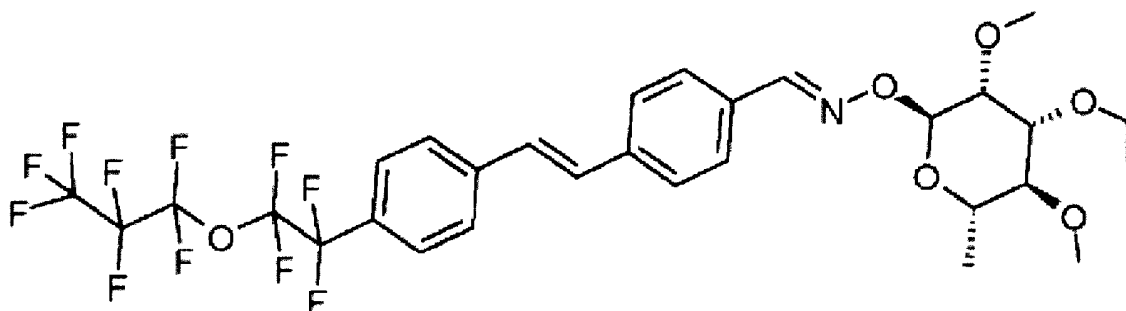
;  $^1\text{H NMR}$  ( 400 MHz,  $\text{DMSO-d}_6$  ) d 8.41 ( s , 1H ) , 7.84 ( d , J = 8.1 Hz , 2H ) , 7.75 - 7.67 ( m , 6H ) , 7.46 ( s , 2H ) , 5.49 ( d , J = 2.0 Hz , 1H ) , 3.73 - 3.66 ( br s , 2H ) , 3.56 - 3.47 ( m , 3H ) , 3.45 ( s , 3H ) , 3.43 ( s , 3H ) , 3.04 ( t , J = 10.0 Hz , 1H ) , 1.17 ( m , 6H ) ; ESIMS m/z 494 ( [M+H]<sup>+</sup> ) .

50

## 【 0 0 5 6 】

4 - { ( E ) - 2 - [ 4 - ( 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロ - 2 - ヘプタフルオロプロピルオキシ - エチル ) フェニル ] ビニル } ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 3 )

## 【 化 1 6 】



10

オキシム形成により、84%の収率で、明黄色のオイルを得た：

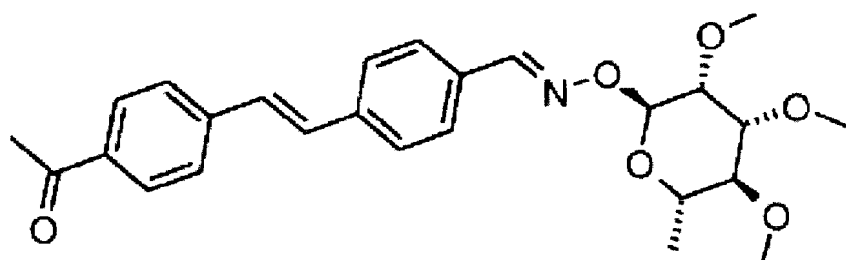
$^1\text{H NMR}$  (400 MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  8.40 (s, 1H), 7.68 (m, 4H), 7.50 (m, 3H), 7.40 (d,  $J = 4.0$  Hz, 1H), 7.15 (d,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 5.48 (s, 1H), 3.74 (m, 1H), 3.67 (m, 1H), 3.55-3.46 (m, 4H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t,  $J = 9.2$  Hz, 1H), 1.17 (m, 6H); ESIMS  $m/z$  707 ( $[\text{M-H}]^-$ ).

20

## 【 0 0 5 7 】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - アセチル - フェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 4 )

## 【 化 1 7 】



30

オキシム形成により、56%の収率で、黄褐色の固体を得た： $m p$ 、164 ~ 167

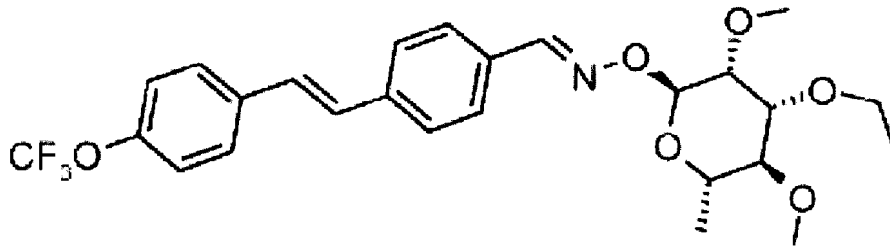
;  
 $^1\text{H NMR}$  (400 MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  8.41 (s, 1H), 7.97 (d,  $J = 8.0$  Hz, 2H), 7.77 (d,  $J = 8.0$  Hz, 2H), 7.72 (d,  $J = 8.0$  Hz, 2H), 7.68 (d,  $J = 8.3$  Hz, 2H), 7.45 (s, 2H), 5.48 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.74 (br s, 1H), 3.73-3.66 (m, 1H), 3.54-3.46 (m, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 1.17 (m, 6H); ESIMS  $m/z$  485 ( $[\text{M}+\text{H}_2\text{O}]^+$ ).

40

## 【 0 0 5 8 】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 5 )

## 【化18】

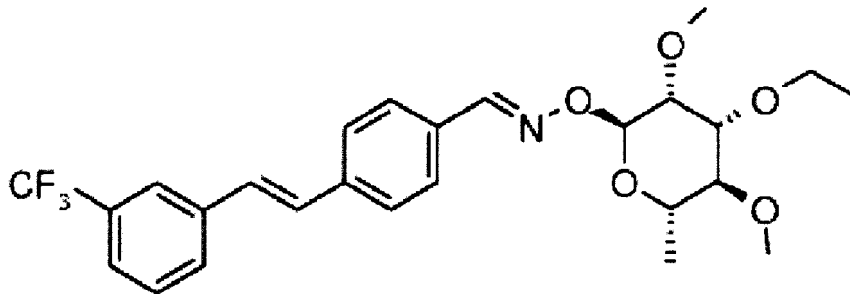


オキシム形成により、24%の収率で、明黄色の固体を得た：mp、91～101；  
<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): d 8.13 (s, 1H), 7.63 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.55-7.51 (m, 3H), 7.23-7.17 (m, 3H), 7.11 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 5.64 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 3.79-3.60 (m, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.20 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 1.32-1.24 (m, 6H); ESIMS m/z 532 ([M+Na]<sup>+</sup>).

## 【0059】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 3 - トリフルオロメチルフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 6 )

## 【化19】

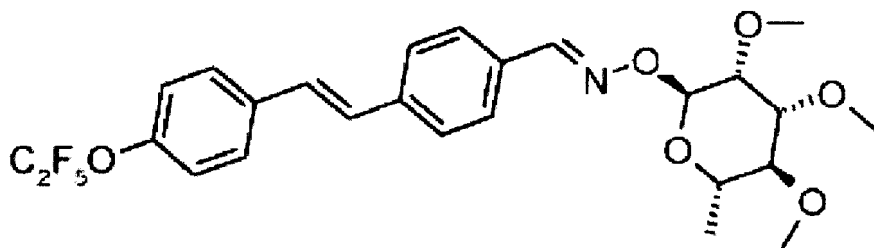


オキシム形成により、62%の収率で、褐色のオイルを得た：  
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) d 8.40 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.94 (br s, 1H), 7.72-7.63 (m, 6H), 7.47 (s, 2H), 5.48 (s, 1H), 3.74 (m, 1H), 3.73-3.68 (m, 1H), 3.54-3.47 (m, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.17 (m, 6H); ESIMS m/z 494 ([M+H]<sup>+</sup>).

## 【0060】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - ペンタフルオロエチルオキシフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 7 )

## 【化20】



オキシム形成により、7 mg (6%)の明黄色のガラスを得た：

10

20

30

40

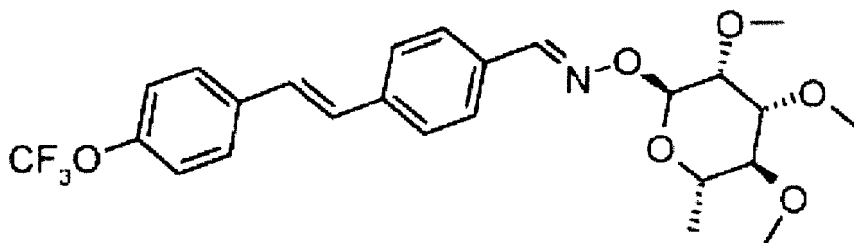
50

$^1\text{H}$  NMR (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.13 (s, 1H), 7.63 (d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.56-7.51 (m, 5H), 7.24 (d,  $J = 4.5$  Hz, 2H), 7.11 (d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 5.63 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 3.79-3.60 (m, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 1.32-1.25 (m, 6H); ESIMS  $m/z$  582 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

【0061】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチルオキシフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 4 , 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 8 )

【化21】



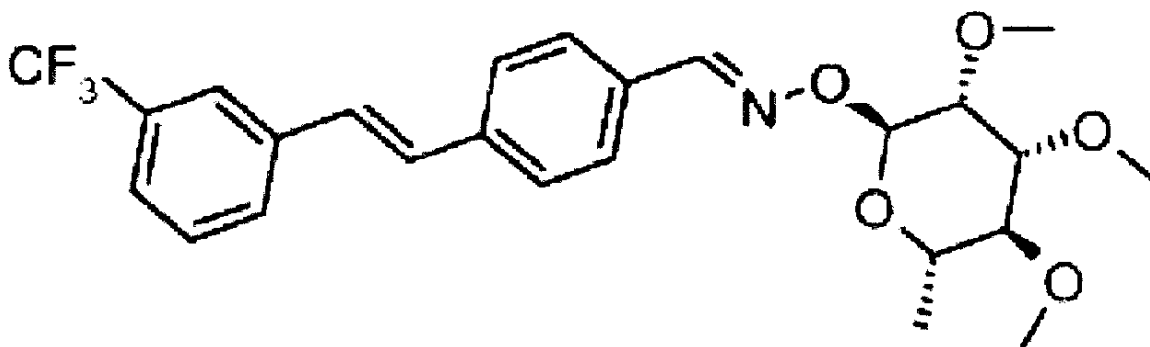
オキシム形成により、37 mg (30%) の白色の固体を得た：mp、120 ~ 128 ;

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.40 (s, 1H), 7.75 (d,  $J=8.0$  Hz, 2H), 7.68-7.65 (m, 4H), 7.42-7.30 (m, 4H), 5.50 (s, 1H), 3.80-3.79 (m, 1H), 3.56-3.52 (m, 1H), 3.43 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.40-3.37 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.05 (t,  $J=8.0$  Hz, 1H), 1.17 (d, 3H,  $J = 4.0$  Hz). ESIMS  $m/z$  496 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ )

【0062】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 3 - トリフルオロメチルフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 4 , 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 9 )

【化22】



この物質 ( 65 mg 、 50 % ) を透明なガラスとして単離した :

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.40 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.72 (br s, 1H), 7.70 (dd,  $J = 12.0, 8.0$  Hz, 4H), 7.64 (br s, 2H), 7.48 (s, 2H), 5.51 (br s, 1H), 3.56-3.43 (m, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.05 (t,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 1.17 (d,  $J = 4.0$  Hz, 3H); ESIMS  $m/z$  480 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

【0063】

4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - プロポキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 10 )

10

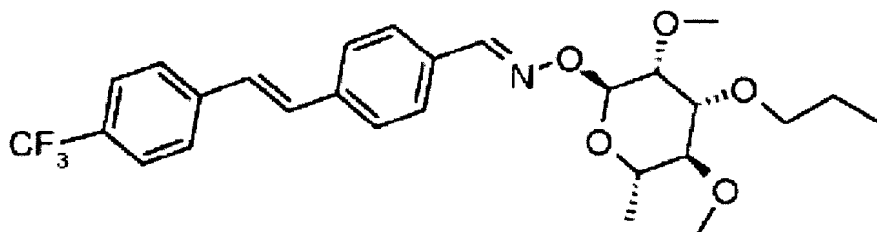
20

30

40

50

## 【化23】



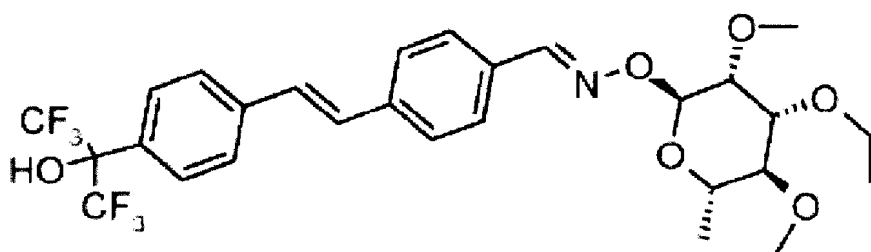
この物質 (210 mg、77%) を無色の固体として単離した：mp、163 ~ 166 ;

$^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) d 8.16 (s, 1H), 7.66 (d,  $J = 8$  Hz, 2H), 7.63 (s, 4H), 7.56 (d,  $J = 8$  Hz, 2H), 7.2 (s, 2H), 5.66 (s, 1H), 3.73 - 3.57 (m, 10H), 3.23 (t,  $J = 9$  Hz, 1H), 1.71 (m, 2H), 1.33 (d,  $J = 6$  Hz, 2H), 1.0 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H)

## 【0064】

4 - { (E) - 2 - [ 4 - ( 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - トリフルオロメチル - エチル ) フェニル ] ビニル } ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S, 3 R, 4 R, 5 S, 6 S ) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム (化合物 11)

## 【化24】



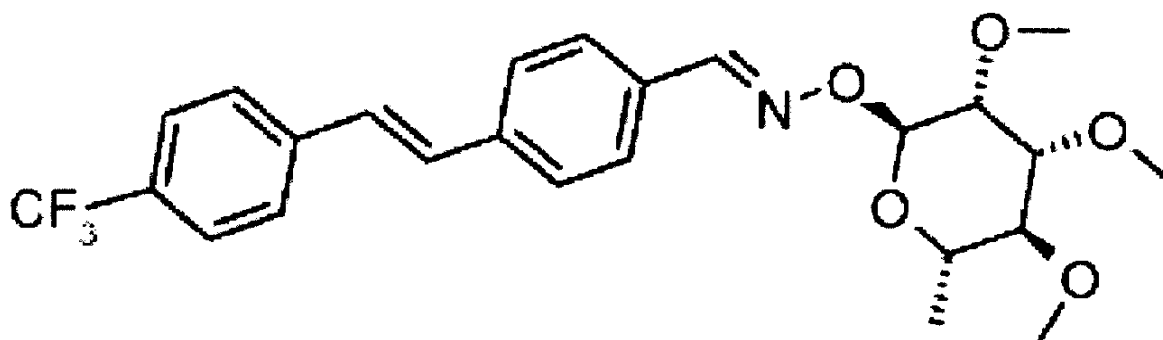
この物質 (250 mg、86%) を黄色のガムとして単離した：

$^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) d 8.16 (s, 1H), 7.74 (d,  $J = 8$  Hz, 2H), 7.65-7.45 (m, 6H), 7.15 (s, 2H), 5.62 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 4.67 (s, 1H), 4.8-4.5 (m, 11H), 3.22 (t,  $J = 8$  Hz, 1H), 1.35-1.2 (m, 6H); ESIMS  $m/z$  614 ( $[\text{M}+\text{Na}]^+$ ).

## 【0065】

4 - [ (E) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ビニル ] ベンズアルデヒド O - ( ( 2 S, 3 R, 4 R, 5 S, 6 S ) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム (化合物 12)

## 【化25】



10

20

30

40

50

この物質 ( 95 mg、56% ) を白色の固体として単離した : mp、147 ~ 151

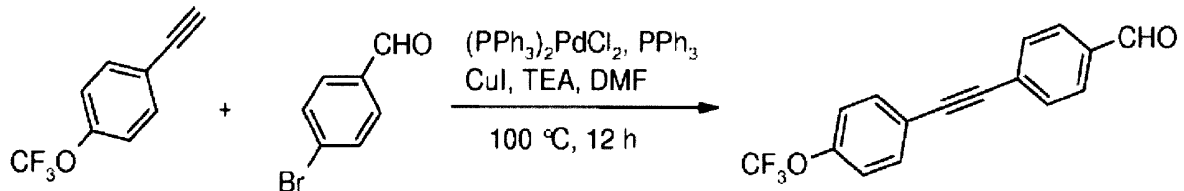
;

$^1\text{H NMR}$  (400 MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  8.42 (s, 1H), 7.85 (d,  $J = 8.0$  Hz, 2H), 7.76-7.67 (m, 6H), 7.47 (s, 2H), 5.52 (d,  $J = 4.0$  Hz, 1H), 3.80 (t,  $J = 4.0$  Hz, 1H), 3.56-3.51 (m, 1H), 3.43 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.41-3.39 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.04 (t,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 1.17 (d,  $J = 4.0$  Hz, 3H).

【0066】

実施例9 : プロモベンゼンへのアルキンカップリングのための一般的手順

【化26】



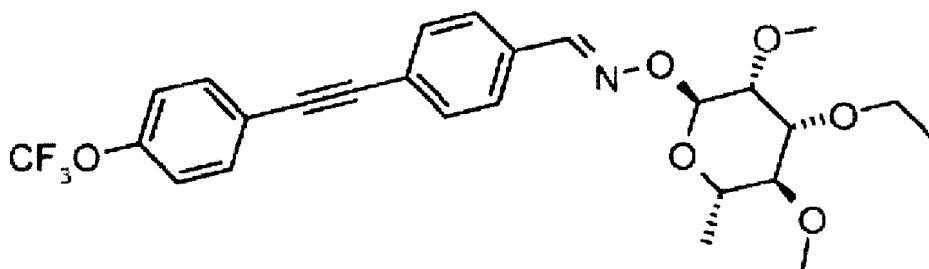
アルキン ( 0.5 g、2.7 mmol )、プロモベンズアルデヒド ( 0.45 g、2.4 mmol )、Pd 触媒 ( 0.04 g、0.06 mmol )、CuI ( 0.02 g、0.12 mmol )、トリフェニルホスフィン ( 0.03 g、0.12 mmol ) 及びトリエチルアミン ( 3.5 mL ) を 1.5 mL の無水 DMF において一緒にした。溶液を、合計 20

で 12 時間にわたって窒素雰囲気下での攪拌とともに 100 °C に加熱した。その後、溶液を室温に冷却し、セライトでろ過し、褐色の固体にまで濃縮した。この固体を順相カラムクロマトグラフィー (ヘキサン (hexanes) における EtOAc) によって精製して、ジアリール化アセチレンを得た ( 512 mg、65% )。これを、さらに特徴づけることなく、そのまま使用した。

【0067】

実施例10 : 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニルエチニル ) ベンズアルデヒド O - ( ( 2S, 3R, 4R, 5S, 6S ) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル ) オキシム ( 化合物 13 ) の調製

【化27】



EtOH ( 10 mL ) におけるアルデヒド ( 0.12 g、0.42 mmol ) をヒドロキシルアミン中間体 E - 31 ( 0.10 g、0.42 mmol ) により処理し、溶液を攪拌とともに 50 °C に加熱した。反応が ( LC - MS 分析によって ) 完了したとき、溶液を室温に冷却し、 $\text{H}_2\text{O}$  により希釈し、EtOAc により抽出した ( 10 mL、3 回 )。一緒にした有機層を  $\text{MgSO}_4$  で乾燥し、ろ過し、濃縮して、黄色の固体を得た。この固体を順相カラムクロマトグラフィー (ヘキサン (hexanes) における EtOAc) によって精製した。所望の生成物 ( 120 mg、56% ) を粘性性の黄色の固体として単離した : mp、82 ~ 87 ;

$^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.13 (s, 1H), 7.63 (d,  $J = 9.0$  Hz, 2H), 7.55 (m, 4H), 7.21 (d,  $J = 9.0$  Hz, 2H), 5.63 (s, 1H), 3.75-3.60 (m, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s

40

50

, 3H), 3.19 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 1.32-1.27 (m, 6H); ESIMS m/z 509 ([M+H]<sup>+</sup>).

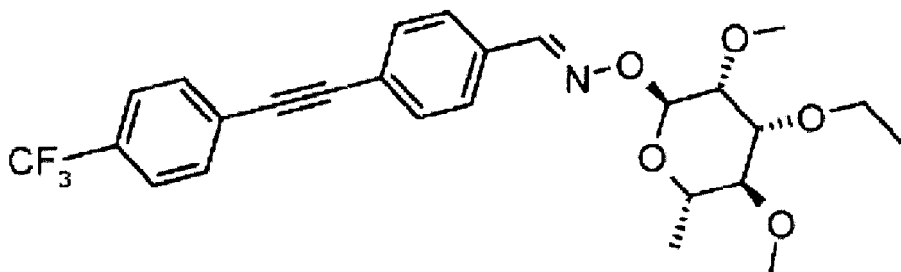
【0068】

下記の化合物を、実施例9及び実施例10において概略が示される条件を使用して調製した。

【0069】

4 - (4 - トリフルオロメチルフェニルエチニル) ベンズアルデヒドO - ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル) オキシム (化合物14)

【化28】



10

生成物を灰白色の固体として単離した (137 mg, 76%) : mp、130 ~ 132

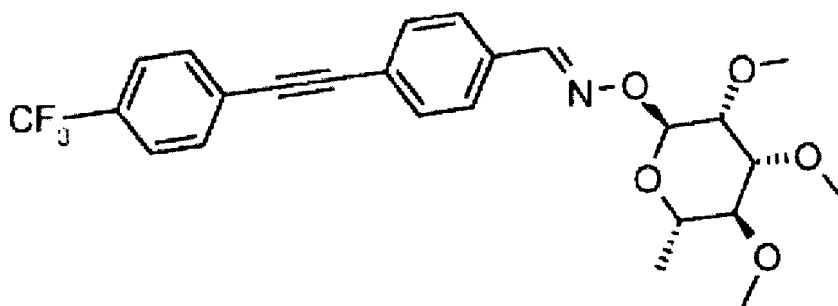
20

; <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.46 (s, 1H), 7.81 (s, 4H), 7.73 (d, J = 8 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 8 Hz, 2H), 5.49 (s, 1H), 3.75 (br s, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.51-3.46 (m, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.19-1.15 (m, 6H); ESIMS m/z 492 ([M+H]<sup>+</sup>).

【0070】

4 - (4 - トリフルオロメチルフェニルエチニル) ベンズアルデヒドO - ((3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル) オキシム (化合物15)

【化29】



30

生成物 (78 mg, 84%) を白色の固体として単離した : mp、128 ~ 136 ; <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8.14 (s, 1H), 7.65-7.63 (m, 6H), 7.56 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 5.65 (s, 1H), 3.76-3.75 (m, 1H), 3.68-3.64 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.51-3.49 (m, 1H), 3.20 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.32 (d, J = 4.0 Hz, 3H); ESIMS m/z 500 ([M+Na]<sup>+</sup>).

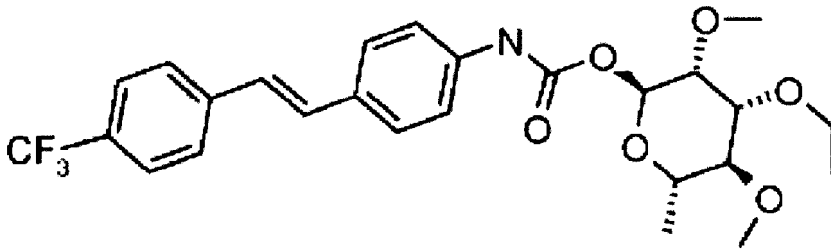
40

【0071】

実施例11 : { 4 - [(E) - 2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ビニル ] フェニル } カルバミン酸 ((2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル) エステル (化合物16) の調製



## 【化30】



10

4 - (4 - トリフルオロメチルフェニルビニル)フェニルアミン (25 mg、0.095 mmol) を乾燥 THF (4 mL) に溶解した溶液に、4 - ニトロフェニルクロロホルマート (19 mg、0.095 mmol) を加えた。溶液を窒素下で1時間にわたって攪拌し、その後、ラムノピラノース (化合物 E - 8 ; 20 mg、0.95 mmol) を加え、続いて、粉末化 KOH (25 mg、0.4 mmol) を加えた。溶液を周囲温度で4時間にわたって攪拌し、その後、Et<sub>2</sub>O (25 mL) により希釈し、H<sub>2</sub>O により洗浄し、MgSO<sub>4</sub> で乾燥し、濃縮した。赤色の粗オイルをシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、化合物 16 を得た :

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): d 7.61 (s, 4H), 7.52 (d, J = 8 Hz, 2H), 7.47 (d, J = 8 Hz, 2H), 7.2 (d, J = 15 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 15 Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.2 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.8-3.5 (m, 11H), 3.23 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.33-1.25 (m, 6H); ESIMS m/z 531 ([M+Na]<sup>+</sup>).

20

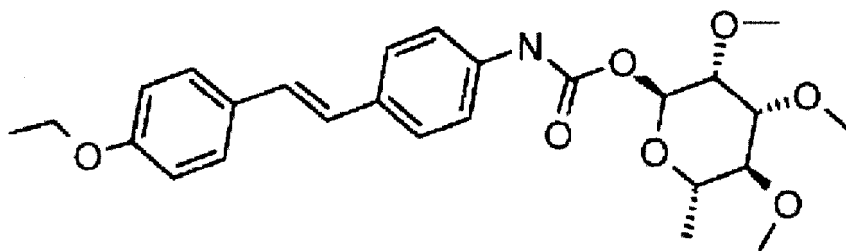
## 【0072】

下記の化合物を、実施例 11 に記載される条件を使用して調製した。

## 【0073】

{ 4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - エトキシフェニル ) ビニル ] フェニル } カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 3 , 4 , 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 17 )

## 【化31】



30

この物質 ( 68 mg、40% ) を黄色の泡状物として単離した :

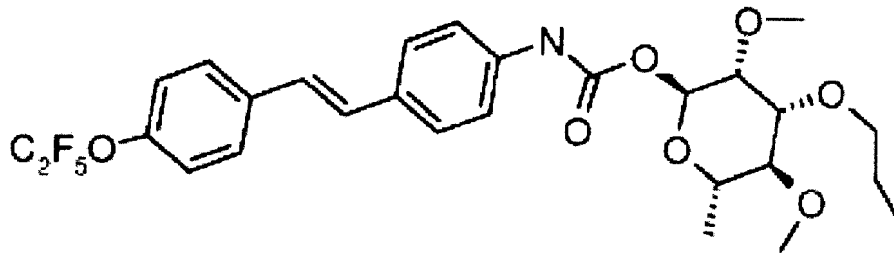
<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) d 7.38-7.22 (m, 8H), 6.84 (d, J = 8.24 Hz, 2H), 6.64 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 4.06 (q, J = 7.24 Hz, 2H), 3.76-3.75 (m, 1H), 3.68-3.64 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.51-3.49 (m, 1H), 3.20 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.38-1.28 (m, 6H); ESI m/z 485 ([M]<sup>+</sup>).

40

## 【0074】

{ 4 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - ペンタフルオロエチルオキシフェニル ) ビニル ] フェニル } カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - プロポキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 18 )

## 【化32】



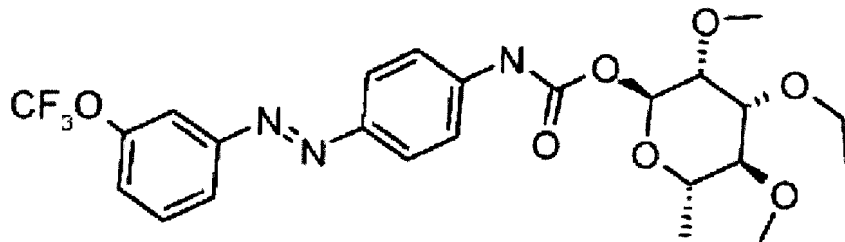
この物質 (18 mg、12%) をガム状の固体として単離した：

$^1\text{H NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): d 7.5-7.45 (m, 6H), 7.21 (d,  $J = 8.4$  Hz, 2H), 7.05 (s, 2H), 6.91 (s, 1H), 5.27 (br s, 1H), 3.8 (m, 1H), 3.69-3.50 (m, 10H), 3.23 (t,  $J = 8$  Hz, 1H), 1.69 (m, 2H), 1.3 (d,  $J = 6$  Hz, 3H), 0.98 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H); ESIMS  $m/z$  591 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

## 【0075】

実施例12：[4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアゾ)フェニル]カルバミン酸(2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3, 5-ジメトキシ-4-エトキシ-6-メチル-テトラヒドロピラン-2-イルエステル(化合物19)の調製

## 【化33】



工程1. 4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアゾ)アニリン。3-トリフルオロメトキシアニリン(2.0 g、11 mmol)を $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ (20 mL)に溶解し、 $\text{H}_2\text{O}$ (20 mL)においてOxone(商標)の混合物(11 g、18 mmol)により処理し、溶液を25で20時間にわたって攪拌した。有機相を分離し、水相を $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ により抽出し(20 mL、2回)、一緒にした有機相を乾燥し( $\text{Na}_2\text{SO}_4$ )、エバポレーションした。粗ニトロソ化合物を酢酸(40 mL)に溶解し、p-フェニレンジアミン(2.0 g、19 mmol)により処理し、60時間にわたって攪拌した。揮発物を真空下で除き、残渣を0%~20%のEtOAc/ヘキサンによるシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、標記アゾアニリン(900 mg、27%)をオレンジ色のオイルとして得た：

$^1\text{H NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): d 7.77-7.84 (m, 3H), 7.71 (s, 1H), 7.46-7.52 (m, 1H), 7.22-7.26 (m, 1H), 6.71-6.75 (m, 2H), 4.12 (br s, 2H); ESIMS  $m/z$  282 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

## 【0076】

工程2. 化合物19。4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアゾ)アニリン(200 mg、0.71 mmol)を無水THF(5 mL)に溶解し、4-ニトロフェニルクロロホルマー(170 mg、0.82 mmol)により処理し、25で1時間にわたって攪拌した。(3R, 4R, 5S, 6S)-4-エトキシ-3, 5-ジメトキシ-6-メチル-テトラヒドロピラン-2-オール(175 mg、0.78 mmol)及び95%水素化ナトリウム( $\text{NaH}$ ; 35 mg、2.1 mmol)を加え、混合物を2時間にわたって攪拌した。 $\text{H}_2\text{O}$ (20  $\mu\text{L}$ 、1 mmol)を加え、攪拌を1時間にわたって続けた。混合物を $\text{H}_2\text{O}$ (10 mL)及びEtOAc(15 mL)により希釈した。分離された有

10

20

30

40

50

機相を H<sub>2</sub>O (5 mL) 及びブライン (5 mL) により洗浄し、乾燥し (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>)、濃縮した。残渣を 0% ~ 30% の EtOAc / ヘキサンによるシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物 (220 mg, 59%) をオイルとして得た：  
<sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>): d 7.87-7.97 (m, 3H), 7.77 (s, 1H), 7.54-7.57 (m, 4H), 6.94 (s, 1H), 6.22(s, 1H), 3.56-3.78 (m, 11H), 3.24 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 1.28-1.36 (m, 6H); ESIMS m/z 528 ([M+H]<sup>+</sup>).

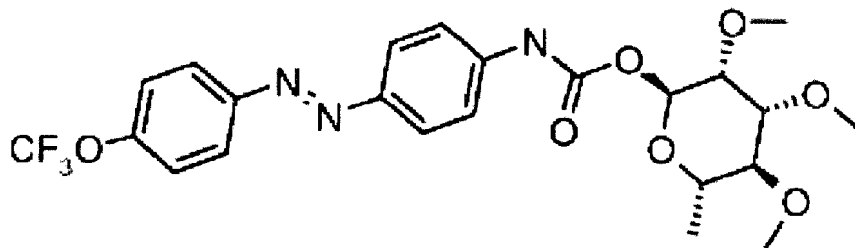
【0077】

下記の化合物を、実施例 12 に記載される条件を使用して調製した。

【0078】

[4 - (4 - トリフルオロメトキシ - フェニルアゾ) フェニル] カルバミン酸 (2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル (化合物 20)

【化34】



10

20

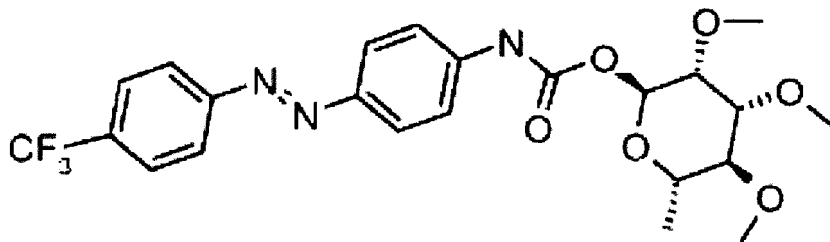
工程 1 . 4 - (4 - トリフルオロメチオキシ (methoxy) フェニルアゾ) アニリン。  
<sup>1</sup>H NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>): d 7.79-7.83 (m, 4H), 7.25-7.33 (m, 2H), 6.72-6.75 (m, 2H), 4.09 (br s, 2H); ESIMS m/z 282 (M+H).

工程 2 . 化合物 20。mp、158 ~ 159 ;  
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) d 7.95-7.92 (m, 4H), 7.59-7.57 (d, J = 8.6Hz, 2H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.21 (s, 1H), 3.8-3.5 (m, 11H), 3.22 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.35-1.25 (m, 6H); ESIMS m/z 528 ([M+H]<sup>+</sup>).

【0079】

[4 - (4 - トリフルオロメチルフェニルアゾ) フェニル] カルバミン酸 (2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 4 - エトキシ - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル (化合物 21)

【化35】



30

40

工程 1 . 4 - (4 - トリフルオロメチルフェニルアゾ) アニリン。  
<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300MHz): d 7.81-7.91 (m, 4H), 7.72 (d, J= 8.2 Hz, 2H), 6.71-6.75 (m, 2H), 4.12 (br s, 2H); ESIMS m/z 266 ([M+H]<sup>+</sup>).

【0080】

工程 2 . 化合物 21。mp、186 ~ 188 ;  
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) d 7.89-8.2 (m, 4H), 7.77 (d, J= 8.3 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.91 (s, 1H), 6.21(s, 1H), 3.77-3.57 (m, 11H), 3.22 (t, J = 9.4 Hz

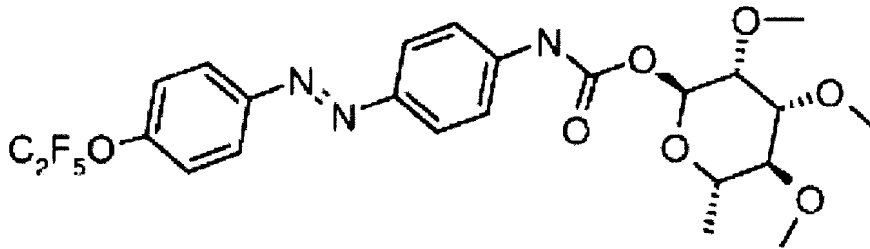
50

z, 1H), 1.34-1.28 (m, 6H); ESIMS m/z 512 ([M+H]<sup>+</sup>).

【 0 0 8 1 】

[ 4 - ( 4 - ペンタフルオロエチルオキシフェニルアゾ ) フェニル ] カルバミン酸 ( 2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 S ) - 4 - エトキシ - 3 , 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イルエステル ( 化合物 2 2 )

【 化 3 6 】



10

工程 1 . 4 - ( 4 - ペンタフルオロエトキシフェニルアゾ ) アニリン。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300MHz) d 7.79-7.89 (m, 4H), 7.32 (d, J= 8.5 Hz, 2H), 6.73-6.76 (m, 2H), 4.09 (br s, 2H); ESIMS m/z 332 ([M+H]<sup>+</sup>).

【 0 0 8 2 】

工程 2 . 化合物 2 2 。

<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) d 7.96-7.92 (m, 4H), 7.60-7.57 (m, 2H), 7.38-7.35 (m, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.26 (s, 1H), 3.75-3.45 (m, 11H), 3.22 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 1.33-1.26 (m, 6H); ESIMS m/z 578 ([M+H]<sup>+</sup>).

【 0 0 8 3 】

化合物の試験

シロイチモンジヨトウ ( B A W ; Spodoptera exigua : 鱗翅目 ) に対するバイオアッセイを、96 ウェル・マイクロタイター・プレートに基づくハイスループット ( H T S ) バイオアッセイ、又は、128 ウェルの餌トレアッセイのどちらかを使用して行った。H T S アッセイは、L e w e r 他、J. Nat. Prod.、2006、69、1506 の改変に基づく。B A W の卵を96 ウェル・マイクロタイター・プレートの各ウェルにおいて人工餌 ( 100 μ L ) の上部に置いた。餌は、液体取り扱いシステムを使用して餌の上部に重層され、その後、数時間乾燥させられた試験化合物 ( 30 μ L の D M S O - アセトン - H<sub>2</sub>O 混合物に溶解された 12 μ g ) により前処理された。その後、寄生させたプレートを無菌の精製綿の層及びプレートのかぶりで覆い、その後、29 で暗所において保った。死亡数を処理後6日で記録した。それぞれのプレートが6つの反復実験を有した。死亡率を6つの反復実験の平均から計算した。128 ウェル餌アッセイの場合には、3匹~5匹の第2齢の B A W 幼虫が、50 u g / c m<sup>2</sup> の試験化合物 ( 90 : 10 のアセトン - 水の混合物の 50 μ L に溶解された ) が ( 8 個のウェルのそれぞれに ) 加えられ、その後、乾燥させられた 1 m L の人工餌で事前に満たされた餌トレの各ウェル ( 3 m L ) に置かれた。トレを透明な粘着性カバーで覆い、6日間にわたって 14 : 10 の明暗で、25 で保った。死亡率をそれぞれのウェルにおける幼虫について記録した：その後、8個のウェルにおける活性を平均化した。結果が表4に示される。表4において、B A W H T S の項目欄及び B A W 50 の項目欄の両方において、「A」は、化合物が試験され、少なくとも50パーセントの死亡が観測されたことを意味し、これに対して、「B」は、( 1 ) 化合物が試験され、50パーセント未満の死亡が観測されたか、又は、( 2 ) 化合物が試験されなかったかのどちらかを意味する。

20

30

40

【表 1】

表 - 1  
R1 R2 R3 R4  
A  
一般式

#	A	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	bp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラクトース		150 °C (0.5 mm Hg)	5.28 (m, 1H), 3.85 (m, 1H), 3.66 (m, 1H), 3.60-3.50 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.53 (s, 6H), 3.37 (s, 3H), 3.16 (t, 1H), 1.31 (d, J = 6.2 Hz, 3H)
E-2	OH	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラクトース		145-155 °C (1 mm Hg)	5.28 (s, 1H), 3.83 (m, 1H), 3.7-3.45 (m, 11H), 3.16 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.0 (s, 1H), 1.31 (d, J = 6 Hz, 3H)
E-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラクトース	202.9 (M-MeOH)	165 °C (10 mTorr)	4.71 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.50 (m, 11H), 3.37 (s, 3H), 3.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.32 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.27 (t, J = 7.0 Hz, 3H)
E-4	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラクトース	299.1 (M+Na)	180 °C (10 mTorr)	4.72 (d, J = 1.8 Hz) and 4.30 (s, total 1H), 4.0-3.35 (series of m, 10H), 3.2 (m, 2H), 1.3-1.1 (m, 15H)
E-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラクトース		175 °C (10 mTorr)	4.70 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.50 (m, 11H), 3.37 (s, 3H), 3.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.62 (m, 2H), 1.32 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

10

20

30

40

50

表 - 1

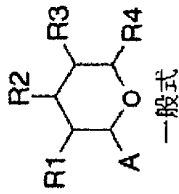
一般式

#	A	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	bp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O-allyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラムノース		175 °C (10 mTorr)	5.98 (m, 1H), 5.32 (d, 1H), 5.20 (d, 1H), 4.50 (s, 1H), 4.18 (d, 2H), 3.62-3.50 (m, 9H), 3.28 (s, 3H), 3.17 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 1.33 (d, J = 6.3 Hz, 3H)
E-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラムノース		165 °C (5 mTorr)	4.71 (s, 1H), 3.62-3.50 (m, 11H), 3.35 (s, 3H), 3.17 (t, 1H), 1.6 (m, 2H), 1.4 (m, 2H), 1.33 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-8	OH	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラムノース	202.9 (M-H <sub>2</sub> O)	165 °C (9 mTorr)	5.35 (m, J = 3.2, 2.0 Hz, 1H), 3.84-3.62 (m, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.16 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.73 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 1.33-1.26 (m, 6H)
E-9	OH	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラムノース	248.2 (M+)	203 °C (5 mTorr)	5.2 (s) and 4.65 (dd, J = 1.2, 9 Hz, α/β マーケット シグナル, 合計で 1H, 比率 64:36 α:β); 4.10-3.45 (m, 8H), 3.36-3.20 (m, 2H), 1.37- 1.13 (m, 12H)
E-10	OH	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラムノース	220.2 (M+)	185 °C (5 mTorr)	5.25 (dd, J = 3.2, 2.0 Hz) および 4.61 (m, 合計で 1H), 3.80 (m, 1H), 3.70-3.50 (m, 9H), 3.36- 3.05 (m, 1H), 1.60 (m, 2H), 1.30 (m, 5H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

表 - 1  
R2  
R3  
R1  
A  
一般式

#	A	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	bp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-11	OH	OCH <sub>3</sub>	O-allyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラムノース	254.9 (M+Na)	175 °C (10 mTorr)	5.95 (m, 1H), 5.3 (m, 1H), 5.19 (m, 1H), 5.21 及び 4.61 (両方* m, α 及び β アノマー、合計 1H), 4.20 (m, 2H), 3.80 (m, 1H), 3.70-3.50 (m, 7H), 3.40-3.10 (m, 3H), 1.3 (m, 3H)
E-12	OH	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ラムノース	248.2 (M+)	189 °C (5 mTorr)	5.35 (dd, J = 3.2, 2.0 Hz) and 4.45 (m, 合計で 1H), 3.80 (m, 1H), 3.70-3.50 (m, 10H), 3.36- 3.05 (m, 1H), 2.73 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 1.60 (m, 2H), 1.40 (m, 2H), 1.33 (d, J = 6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-13	-OH	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> O- CH <sub>3</sub>	L-ラムノース			5.32 (s, 1H), 3.9 (m, 1H), 3.66-3.53 (一連の m, 4H), 3.52 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.35 (m, 1H), 3.18 (d, J = 3 Hz, 1H)
E-14	-OH	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> O- CH <sub>3</sub>	D-グルコース			5.33 (d, J = 3.6 Hz)及び 4.60 (d, J = 4 Hz, α 及び β アノマー、合計で 1H), 3.9 (m, 1H), 3.6-3.3 (一連の s 及び m, 14H), 3.28 (m, 3H), 1.7 (s, 1H)

表 - 1



#	A	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	bp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-15	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H <sub>2</sub>	L-キシロース	207 (M+H)		4.77 (d, J = 3.5 Hz) 及び 4.15 (d, J = 7.4 Hz, 合計 1H, 27:1 の α:β 比で 1:4.00 (dd, J = 11.6, 5.0 Hz, 1H), 4.03-2.93 (一連の s 及び m, 16H)
E-16	-OH	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H <sub>2</sub>	L-キシロース	175 (M-H <sub>2</sub> O)		5.23 (t, J = 3.4 Hz) 及び 4.60 (t, J = 6.3 Hz, 合計 1H 15:1 の α:β 比で ), 4.01-2.97 (一連の s 及び m, 15H)
E-17	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H <sub>2</sub>	L-キシロース	207 (M+H)		4.69 (d, J = 3.0 Hz, 1H, α:β ノーマー), 3.77 (dd, J = 10.8, 4.7 Hz, 1H), 3.62-3.32 (一連の s 及び m, 16H)
E-18	-OH	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H <sub>2</sub>	L-キシロース	175 (M-H <sub>2</sub> O)		5.18-5.11 (m, 1H, α 及び β ノーマー の混合物), 4.84 (d, J = 10.1 Hz, 0.4H), 3.98-3.37 (一連の s 及び m, 14H), 3.11 (d, J = 4.2 Hz, 0.6H)
E-19	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> O- CH <sub>3</sub>	L-グルコース	205 (M- CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )		(600 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) 4.83 (d, J = 4.1 Hz) 及び 4.14 (d, J = 7.8 Hz, 合計 1H 0.2:1 の α:β 比で), 3.66-3.36 (一連の s 及び m, 18H), 3.29-3.26 (m, 1H), 3.17-3.13 (m, 1H), 3.01-2.94 (m, 1H)

10

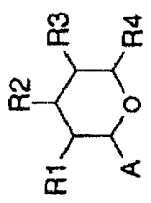
20

30

40



表 - 1  
一般式



#	A	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	bp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-20	-OH	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> O- CH <sub>3</sub>	L-グルコース	191 (M- CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )	mp 63-67 °C	5.33 (d, J = 3.7 Hz) 及び 4.58 (d, J = 7.9 Hz, 合計 1H 2.5:1.0 α:β 比で ), 3.92-3.86 (m, 0.8H), 3.65-3.08 (一連の s 及び m, 1.8H), 2.96 (dd, J = 8.8, 7.8 Hz, 0.2H)
E-21	-OCH <sub>3</sub>	-H <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> O- CH <sub>3</sub>	2-デオキシ-D- グルコース	220 (M <sup>+</sup> )		4.81 (dd, J = 3.6, 1.1 Hz) 及び 4.34 (dd, J = 9.5, 1.9 Hz, 合計 1H 0.29:1.0 α:β 比で ), 3.71-3.23 (m, 1.6H), 3.18-3.05 (m, 1H), 2.33-2.16 (m, 1H), 1.60-1.41 (m, 1H)
E-22	-OCH <sub>3</sub>	-H <sub>2</sub>	-OCH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	L- アラビノドコース			4.78 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.47 (m, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.19 (m, 1H), 2.67 (br s, 1H), 2.29 (dd, J = 4.8, 12.9 Hz, 1H), 1.51 (m, 1H), 1.32 (d, J = 6.3 Hz, 3H)

10

20

30

40

【表 2】

表 - 2

#	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	mp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-アラビノース	326.1 [M+Na] <sup>+</sup>	135 °C	5.35 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.89 (dd, J = 3.3, 2.1 Hz, 1H), 3.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.51 (m, 1H), 3.18 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.74 (s, 4H), 1.27 (d, J = 6.1 Hz, 3H)
E-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	L-アラビノース	288 [M-H]	163-166 °C	5.42 (s, 1H), 4.40 (m, 1H), 4.0 (m, 1H), 3.63 (d, J = 8 Hz, 1H), 3.55-3.45 (m, 7H), 2.78 (s, 4H), 2.2 (br s, 1H), 1.30 (d, J = 6.3 Hz, 3H)
E-25	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-アラビノース			5.35 (m, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.85 (m, 1H), 3.78-3.50 (m, 9H), 3.19 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.75 (s, 4H), 1.33-1.26 (m, 6H)
E-26	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-アラビノース	354 [M+Na] <sup>+</sup>	69-71 °C	5.35 (s, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.78-3.50 (m, 9H), 3.19 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.75 (s, 4H), 1.64 (m, 2H), 1.25 (d, J = 6.1 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-27	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-アラビノース			5.32 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.6-3.45 (m, 9H), 3.17 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.73 (s, 4H), 1.6 (m, 2H), 1.4 (m, 2H), 1.26 (d, J = 5.7 Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

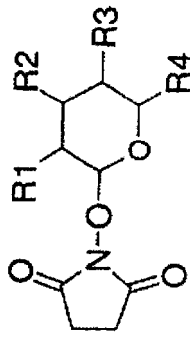
10

20

30

40

表 - 2



#	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	mp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	D-ガラクトース			5.52 (d, J = 4 Hz, 1H), 4.45 (d, J = 10 Hz, 1H), 3.68-3.47 (m, 12H), 3.4-3.27, (一連の m, 5H), 2.72 (s, 4H)
E-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	L-マンノース			5.44 (s, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.90 (m, 1H), 3.7-3.55 (m, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.53 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.73 (s, 4H)

10

20

30

40

【表 3】

表 - 3

The structure shows a furanose ring with an amino group (H<sub>2</sub>N) at the 2-position. The ring carbons are numbered 1 to 4. Substituents are: R1 at C1, R2 at C2, R3 at C3, and R4 at C4.

#	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	Mp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L- ラクトース	221.7 (M+H <sup>+</sup> )	55 °C	5.51 (s, 2H), 4.98 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.60 (m, 2H), 3.55 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.35 (dd, J = 9.2, 3.3 Hz, 1H), 3.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.34 (d, J = 6.2 Hz, 3H)
E-31	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L- ラクトース	258.1 (M+Na <sup>+</sup> )	88 °C	5.51 (s, 2H), 4.98 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.60 (m, 4H), 3.55 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.35 (dd, J = 9.2, 3.3 Hz, 1H), 3.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.34-1.26 (m, 6H)
E-32	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L- ラクトース	249.1 (M+H <sup>+</sup> )	49 °C	5.6 (s, 2H), 4.95 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.6-3.3 (m, 11H), 3.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 1.65 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-33	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L- ラクトース		40-42 °C	5.6 (s, 2H), 4.97 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.6-3.3 (m, 11H), 3.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 1.62 (m, 2H), 1.40 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-34	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	L- ラクトース	264.1 (M+Na <sup>+</sup> )	Oil	5.5 (s, 2H), 4.90 (s, 1H), 3.9 (m, 1H), 3.80-3.50 (m, 7H), 3.4 (m, 1H), 3.25 (t, J = 9 Hz, 1H), 1.35 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.27 (m, 9H)

10

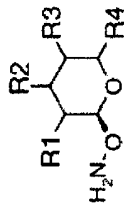
20

30

40

表 - 3

#	R1	R2	R3	R4	糖	M.S.	Mp	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ)
E-35	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	L- ラマンノース	268 (M+AcOH)	Oil	5.6 (br s, 2H), 4.96 (s, 1H), 3.7-3.5 (m, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.25 (dd, J = 10, 3 Hz, 1H), 2.75 (br s, 1H), 1.7 (d, J = 7 Hz, 3H)
E-36	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	L-マンノース	251.1 (M+H <sup>+</sup> )	58 °C	5.5 (br s, 2H), 5.04 (d, J = 2 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 4H), 3.52 (s, 3H), 3.48 (ブロード s, 6H), 3.42 (s, 3H), 3.45-3.39 (m, 2H)
E-37	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	L-ゴコース		91 °C	5.58 (s, 2H), 5.1 (d, J = 4 Hz, 1H), 3.60 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.66 (m, 1H), 3.60 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.5-3.4 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.4 Hz, 3H)
E-38	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	D-ガラクトース	251.8 (M+H <sup>+</sup> ) <sup>+</sup>	82 °C	5.6 (br. s, 2H), 5.1 (d, J = 4 Hz, 1H), 3.7 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.65-3.35 (一連の m, 3H), 3.4 (m, 1H), 3.2 (m, 2H)



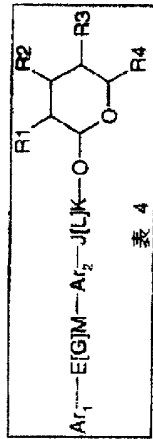
10

20

30

40

【表 4】



BAW 50	BAW HTS	化合物	Ar1	E	G	M	Ar2	J	L	K	R1	R2	R3	R4	アノマー	糖
A	A	1		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース
A	A	2		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース
B	B	3		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース
B	B	4		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース
A	B	5		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース
A	A	6		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース
A	B	7		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース
A	A	8		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH3	OC2H5	OCH2	CH3	α	シラロース

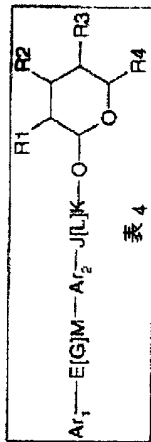
10

20

30

40

50



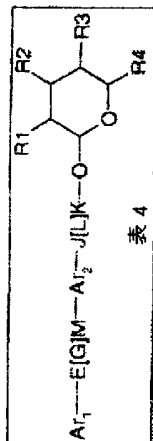
BAW 50	BAW HTS	化合物	A1	E	G	M	A2	J	L	K	R1	R2	R3	R4	アノマー	糖
A	B	9		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	シラロース
A	A	10		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	シラロース
B	A	11		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	シラロース
A	A	12		CH	二重結合	CH		CH	二重結合	N	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	シラロース
A	A	13		C	三重結合	C		CH	二重結合	N	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	シラロース
A	A	14		C	三重結合	C		CH	二重結合	N	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	シラロース
A	A	15		C	三重結合	C		CH	二重結合	N	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	シラロース

10

20

30

40



BAW 50	BAW HTS	化合物	A1	E	G	M	A2	J	L	K	R1	R2	R3	R4	アノマー	糖
A	A	16		CH	二重結合	CH		NH	単結合	CO	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	1-β-D-グルコース
A	B	17		CH	二重結合	CH		NH	単結合	CO	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	1-β-D-グルコース
A	B	18		CH	二重結合	CH		NH	単結合	CO	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	1-β-D-グルコース
A	A	19		N	二重結合	N		N	単結合	CO	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	1-β-D-グルコース
A	A	20		N	二重結合	N		N	単結合	CO	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	1-β-D-グルコース
B	A	21		N	二重結合	N		N	単結合	CO	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	1-β-D-グルコース
A	A	22		N	二重結合	N		N	単結合	CO	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	α	1-β-D-グルコース

10

20

30

40

【0084】

酸誘導体 & 塩誘導体及び溶媒和物

本発明において開示される化合物は、殺虫剤として許容可能な酸付加塩の形態が可能である。

50



## 【0085】

限定されない例として、アミン機能は、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、酢酸、安息香酸、クエン酸、マロン酸、サリチル酸、リンゴ酸、フマル酸、シュウ酸、コハク酸、酒石酸、乳酸、グルコン酸、アスコルビン酸、マレイン酸、アスパラギン酸、ベンゼンスルホン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ヒドロキシメタンスルホン酸及びヒドロキシエタンスルホン酸との塩を形成することができる。

## 【0086】

加えて、限定されない例として、酸機能は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属に由来する塩、並びに、アンモニア及びアミンに由来する塩を含めて、様々な塩を形成することができる。好ましいカチオンの例としては、ナトリウムカチオン、カリウムカチオン、マグネシウムカチオン及びアミニウムカチオンが挙げられる。

10

## 【0087】

これらの塩は、フリーの塩基形態を、塩を作製するための十分な量の所望される酸と接触させることによって調製される。フリーの塩基形態が、塩を好適な薄い塩基水溶液（例えば、薄い水酸化ナトリウム水溶液（NaOH）、炭酸カリウム水溶液、アンモニア水溶液及び重炭酸ナトリウム水溶液など）により処理することによって再生され得る。一例として、多くの場合、殺虫剤は、より水溶性の形態に改変される。例えば、（2,4-ジクロロフェノキシ）酢酸ジメチルアミン塩は、周知の除草剤である（2,4-ジクロロフェノキシ）酢酸のより水溶性の形態である。

## 【0088】

20

本発明において開示される化合物はまた、複合体非形成の溶媒分子が化合物から除かれた後もそのままである溶媒分子との安定な複合体を形成することができる。これらの複合体は多くの場合、「溶媒和物」と呼ばれる。

## 【0089】

## 立体異性体

本発明において開示されるある種の化合物は1つ又はそれ以上の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体には、幾何異性体、ジアステレオマー及びエナンチオマーが含まれる。従って、本発明において開示される化合物には、ラセミ混合物、個々の立体異性体、及び、光学活性な混合物が含まれる。1つの立体異性体がそれ以外の立体異性体よりも活性であり得ることが当業者によって理解される。個々の立体異性体、及び、光学活性な混合物を、選択的合成手順によって、又は、分割された出発物質を使用する従来の合成手順によって、又は、従来の分割手順によって得ることができる。

30

## 【0090】

## 害虫

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、害虫を駆除するために使用することができる。

## 【0091】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、線形動物門（Nematoda）の害虫を駆除するために使用することができる。

## 【0092】

40

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、節足動物門（Arthropoda）の害虫を駆除するために使用することができる。

## 【0093】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、鋏角亜門（Chelicerata）の害虫を駆除するために使用することができる。

## 【0094】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、クモガタ綱（Arachnida）の害虫を駆除するために使用することができる。

## 【0095】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、多足亜門（Myriapoda）の

50

害虫を駆除するために使用することができる。

【0096】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、コムカデ綱 (Symphyla) の害虫を駆除するために使用することができる。

【0097】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、六脚亜門 (Hexapoda) の害虫を駆除するために使用することができる。

【0098】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、昆虫綱 (Insecta) の害虫を駆除するために使用することができる。

【0099】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、鞘翅類 (Coleoptera) (コウチュウ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない: アカントセリデス・エスピーピー (Acanthoscelides spp.) (ゾウムシ)、アカントセリデス・オブテクツス (Acanthoscelides obtectus) (インゲンマメゾウムシ)、アグリルス・プラニペンニス (Agrilus planipennis) (アオナガタマムシ)、アグリオテス・エスピーピー (Agriotes spp.) (ハリガネムシ)、アノプロホラ・グラブリペンニス (Anoplophora glabripennis) (ツヤハダゴマダラカミキリ)、アントノムス・エスピーピー (Anthonomus spp.) (ゾウムシ)、アントノムス・グランジス (Anthonomus grandis) (ワタミハナゾウムシ)、アフィジウス・エスピーピー (Aphidius spp.)、アピオン・エスピーピー (Apion spp.) (ゾウムシ)、アポゴニア・エスピーピー (Apogonia spp.) (地虫)、アタエニウス・スプレツルス (Ataenius spretulus) (Black Turfgrass Ataenius)、アトマリア・リネアリス (Atomaria linearis) (pygmy mangold beetle)、アウラコホレ・エスピーピー (Aulacophora spp.)、ボチノデレス・ブクチュベントリス (Bothynoderes punctiventris) (beet root weevil)、ブルクス・エスピーピー (Bruchus spp.) (ゾウムシ)、ブルクス・ピソルム (Bruchus pisorum) (エンドウマメゾウムシ)、カコエシア・エスピーピー (Cacoesia spp.)、カロソブルクス・マクラツス (Callosobruchus maculatus) (ヨツモンマメゾウムシ)、カルポフィルス・ヘミプテラス (Carpophilus hemipteras) (クリヤケシキスイ)、カッシダ・ピッタタ (Cassida vittata)、セロステルナ・エスピーピー (Ceroterna spp.)、セロトマ・エスピーピー (Cerotoma spp.) (ハムシ)、セロトマ・トリフルカタ (Cerotoma trifurcata) (bean leaf beetle)、コイトリンクス・エスピーピー (Ceutorhynchus spp.) (ゾウムシ)、コイトリンクス・アッシミリス (Ceutorhynchus assimilis) (cabbage seedpod weevil)、コイトリンクス・ナピ (Ceutorhynchus napi) (cabbage curculio)、カエトクネマ・エスピーピー (Chaetocnema spp.) (ハムシ)、コラスピス・エスピーピー (Colaspis spp.) (土壌コウチュウ)、コノデルス・スカラリス (Conoderus scalaris)、コノデルス・スチグモス (Conoderus stigmaticus)、コノトラケルス・ネヌファル (Conotrachelus nenuphar) (スモモゾウムシ)、コチヌス・ニチジス (Cotinus nitidis) (Green June beetle)、クリオセリス・アスパラギ (Crioceris asparagi) (アスパラガスハムシ)、クリプトレステス・フェルギネウス (Cryptolestes ferrugineus) (サビカクムネヒラタムシ)、クリプトレステス・プシルス (Cryptolestes pusillus) (カクムネヒラタムシ)、クリプトレステス・ツルシクス (Cryptolestes turcicus) (トルコカクムネヒラタムシ)、クテニセラ・エスピーピー (Ctenicera spp.) (ハリガネムシ)、クルクリオ・エスピーピー (Curculio spp.) (ゾウムシ)、シクロセファラ・エスピーピー (Cyclocephala spp.) (地虫)、シリンドロクプツルス・アドスペルス (Cylindrocpturus adspersus) (sunflower stem weevil)、デポラウス・マルギナツス (Deporaus marginatus) (mango leaf-cutting weevil)、デルメステス・ラルダリウス (Dermestes lardarius) (オビカツオブシムシ)、デルメステス・マクラテス (Dermestes maculatus) (ハラジロカツオブシムシ)、ジアブロチカ・エスピーピー (Diabrotica spp.) (ハムシ)、エピラクナ・パリベスチス (Epilachna

10

20

30

40

50

varivestis) (インゲンテントウ)、ファウスチヌス・クバエ (Faustinus cubae)、ヒロビウス・パレス (Hyllobius pales) (pales weevil)、ヒペラ・エスピーピー (Hypera spp.) (ゾウムシ)、ヒペラ・ポスチカ (Hypera postica) (アルファルファタコゾウムシ)、ヒペルドエス・エスピーピー (Hyperdoes spp.) (スズメノカタビラオサゾウムシ)、ヒポテナムス・ハンペイ (Hypothenemus hampei) (コーヒーノミクイムシ)、イプス・エスピーピー (Ips spp.) (クイムシ)、ラシオデルマ・セリコルネ (Lasioderma serricorne) (タバコシバンムシ)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (Leptinotarsa decemlineata) (コロラドハムシ)、リオゲニス・フスクス (Liogenys fuscus)、リオゲニス・スツラリス (Liogenys suturalis)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (Lissorhoptrus oryzophilus) (イネミズゾウムシ)、リクツス・エスピーピー (Lyctus spp.) (クイムシ/ヒラタクイムシ)、マエコラスピス・ジョリベチ (Maecolaspis jolivetii)、メガセリス・エスピーピー (Megascelis spp.)、メラノツス・コムニス (Melanotus communis)、メリゲテス・エスピーピー (Meligethes spp.)、メリゲテス・アエネウス (Meligethes aeneus) (blossom beetle)、メロロンタ・メロロンタ (Melolontha melolontha) (ヨーロッパコフキコガネ)、オベレア・ブレビス (Oberea brevis)、オベレア・リネアリス (Oberea linearis)、オリクテス・リノセロス (Oryctes rhinoceros) (タイワンカブトムシ)、オリザエフィルス・メルカトル (Oryzaephilus mercator) (オオメノコギリヒラタムシ)、オリザエフィルス・スリナメンシス (Oryzaephilus surinamensis) (ノコギリヒラタムシ)、オチオリンクス・エスピーピー (Otiorynchus spp.) (ゾウムシ)、オウレマ・メラノプス (Oulema melanopus) (クビアカクビホソハムシ)、オウレマ・オリザエ (Oulema oryzae)、パントモルス・エスピーピー (Pantomorus spp.) (ゾウムシ)、フィロファガ・エスピーピー (Phyllophaga spp.) (コフキコガネ)、フィロファガ・クヤバナ (Phyllophaga cuyabana)、フィロトレタ・エスピーピー (Phyllotreta spp.) (ハムシ)、フィンキテス・エスピーピー (Phynchites spp.)、ポピリア・ジャポニカ (Popillia japonica) (マメコガネ)、プロステファヌス・トルンカテス (Prostephanus truncates) (オオコナナガシンクイ)、リゾベルタ・ドミニカ (Rhizopertha dominica) (コナナガシンクイ)、リゾトログス・エスピーピー (Rhizotrogus spp.) (コフキコガネ)、リンコホルス・エスピーピー (Rhyncophorus spp.) (ゾウムシ)、スコリツス・エスピーピー (Scolytus spp.) (クイムシ)、シェノホルス・エスピーピー (Shenophorus spp.) (ゾウムシ)、シトナ・リネアツス (Sitona lineatus) (アカアシチビコフキゾウムシ)、シトフィルス・エスピーピー (Sitophilus spp.) (コクゾウムシ)、シトフィルス・グラナリエス (Sitophilus granaries) (グラナリアコクゾウムシ)、シトフィルス・オリザエ (Sitophilus oryzae) (ココクゾウムシ)、ステゴビウム・パニセウム (Stegobium paniceum) (ジンサンシバンムシ)、トリボリウム・エスピーピー (Tribolium spp.) (flour beetle)、トリボリウム・カスターネウム (Tribolium castaneum) (コクヌストモドキ)、トリボリウム・コンフスム (Tribolium confusum) (ヒラタコクヌストモドキ)、トロゴデルマ・バリアビレ (Trogoderma variabile) (キマダラカツオブシムシ) 及びザブルス・テネビオイデス (Zabrus tenebrioides)。

## 【0100】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、革翅類 (Dermaptera) (ハサミムシ) を駆除するために使用することができる。

## 【0101】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、網翅類 (Dictyoptera) (ゴキブリ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない：ブラッテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica) (チャパネゴキブリ)、ブラッタ・オリエンタリス (Blatta orientalis) (トウヨウゴキブリ)、パルコブラッタ・ペンシルバニカ (Parcoblatta pennsylvanica)、ペリプラネタ・アメリカナ (Periplaneta americana) (ワモンゴキブリ)、ペリプラネタ・アウストラロアジアエ (Periplaneta australoasiae) (コワモンゴキブリ)、ペ

10

20

30

40

50

リプラネタ・ブルンネア (*Periplaneta brunnea*) (トビイロゴキブリ)、ペリプラネタ・フリギノサ (*Periplaneta fuliginosa*) (クロゴキブリ)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoselus surinamensis*) (オガサワラゴキブリ) 及びスペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) (チャオビゴキブリ)。

【0102】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、双翅類 (*Diptera*) (ハエ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない：アエデス・エスピーピー (*Aedes* spp.) (カ)、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*) (alfalfa blotch leafminer)、アグロミザ・エスピーピー (*Agromyza* spp.) (ハモグリバエ)、アナストレファ・エスピーピー (*Anastrepha* spp.) (ミバエ)、アナストレファ・ススペンサ (*Anastrepha suspensa*) (カリブカイミバエ)、アノフェレス・エスピーピー (*Anopheles* spp.) (カ)、バトロセラ・エスピーピー (*Batrocera* spp.) (ミバエ)、バクトロセラ・ククルビタエ (*Bactrocera cucurbitae*) (ウリミバエ)、バクトロセラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*) (ミカンコミバエ)、セラチチス・エスピーピー (*Ceratitis* spp.) (ミバエ)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*) (チチュウカイミバエ)、クリソプス・エスピーピー (*Chrysops* spp.) (メクラアブ)、コクリオミア・エスピーピー (*Cochliomyia* spp.) (アメリカオビキンバエ)、コンタリニア・エスピーピー (*Contarinia* spp.) (タマバエ)、クレキス・エスピーピー (*Culex* spp.) (カ)、ダシノイラ・エスピーピー (*Dasineura* spp.) (タマバエ)、ダシノイラ・ブラッシカエ (*Dasineura brassicae*) (ダイコンタマバエ)、デリア・エスピーピー (*Delia* spp.)、デリア・プラツラ (*Delia platura*) (タネバエ)、ドロソフィラ・エスピーピー (*Drosophila* spp.) (ショウジョウバエ)、ファンニア・エスピーピー (*Fannia* spp.) (filth flies)、ファンニア・カニクラリス (*Fannia canicularis*) (ヒメイエバエ)、ファンニア・スカラリス (*Fannia scalaris*) (コブアシヒメイエバエ)、ガステロフィルス・インテスチナリス (*Gasterophilus intestinalis*) (ウマバエ)、グラシリア・ペルセアエ (*Gracillia perseae*)、ハエマトビア・イリタンス (*Haematobia irritans*) (ノサシバエ)、ヒレミア・エスピーピー (*Hylemyia* spp.) (ネクイムシ)、ヒポデルマ・リネアツム (*Hypoderma lineatum*) (キスジウシバエ)、リリオミザ・エスピーピー (*Liriomyza* spp.) (ハモグリバエ)、リリオミザ・ブラッシカエ (*Liriomyza brassicae*) (アブラナハモグリバエ)、メロファグス・オビヌス (*Melophagus ovinus*) (ヒツジシラミバエ)、ムスカ・エスピーピー (*Musca* spp.) (muscid fly)、ムスカ・アウツムナリス (*Musca autumnalis*) (face fly)、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*) (イエバエ)、オエストルス・オビス (*Oestrus ovis*) (ヒツジバエ)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*) (frit fly)、ペゴミア・ベタエ (*Pegomyia betae*) (beet leafminer)、ホルビア・エスピーピー (*Phorbia* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*) (ニンジンサビバエ)、ラゴレチス・セラシ (*Rhagoletis cerasi*) (ヨーロッパオウトウミバエ)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*) (リンゴミバエ)、シトジプロシス・モセラナ (*Sitodiplosis mosellana*) (ムギアカタマバエ)、ストモキシス・カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*) (サシバエ)、タバヌス・エスピーピー (*Tabanus* spp.) (ウマバエ) 及びチプラ・エスピーピー (*Tipula* spp.) (ガガンボ)。

【0103】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、半翅類 (*Hemiptera*) (カメムシ類) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない：アクロステルヌム・ヒラレ (*Acrosternum hilare*) (green stink bug)、ブリッスス・ロイコプテルス (*Blissus leucopterus*) (アメリカコバネナガカメムシ)、カロコリス・ノルベギクス (*Calocoris norvegicus*) (potato mirid)、シメキス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*) (ネツタイトコジラミ)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*) (トコジラミ)、ダグベルツス・ファシアツス (*Dagbertus fasciatus*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)

s)、ジスデルクス・スツレルス (*Dysdercus suturellus*) (アカホシカメムシ)、エデッサ・メジタブンダ (*Edessa meditabunda*)、オイリガステル・マウラ (*Eurygaster maura*) (cereal bug)、オイスキスツス・ヘロス (*Euschistus heros*)、オイスキスツス・セルプス (*Euschistus servus*) (brown stink bug)、ヘロベルチス・アントニイ (*Helopeltis antonii*)、ヘロベルチス・テイボラ (*Helopeltis theivora*) (tea blight plantbug)、ラギノトムス・エスピーピー (*Lagynotomus* spp.) (カメムシ)、レプトコリサ・オラトリウス (*Leptocorisa oratorius*)、レプトコリサ・バリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、リグス・エスピーピー (*Lygus* spp.) (メクラカメムシ)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*) (western tarnished plant bug)、マコネリコックス・ヒルスツス (*Maconellicoccus hirsutus*)、ノイロコルプス・ロンギロストリス (*Neurocolpus longirostris*)、ネザラ・ビリズラ (*Nezara viridula*) (ミナミオアカメムシ)、フィトコリス・エスピーピー (*Phytocoris* spp.) (メクラカメムシ)、フィトコリス・カリホルニクス (*Phytocoris californicus*)、フィトコリス・レラチプス (*Phytocoris relativus*)、ピエゾドルス・グイルジンギ (*Piezodorus guildingi*)、ポエシロカプス・リネアツス (*Poecilocus lineatus*) (fourlined plant bug)、プサルス・バッシニコラ (*Psallus vaccinicola*)、プソイダシスタ・ペルセアエ (*Pseudacysta perseae*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*) 及びトリアトマ・エスピーピー (*Triatoma* spp.) (吸血サシガメ/オオサシガメ)。

#### 【 0 1 0 4 】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、同翅類 (Homoptera) (アブラムシ、カイガラムシ、コナジラミ、ヨコバイ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない：アクリトシホン・ピスム (*Acrythosiphon pisum*) (エンドウヒゲナガアブラムシ)、アデルゲス・エスピーピー (*Adelges* spp.) (カサアブラムシ)、アロイロデス・プロレテラ (*Aleurodes proletella*) (タマコナジラミ)、アロイロジクス・ジスペルセス (*Aleurodicus disperses*)、アロイロトリキスス・フロッコス (*Aleurothrixus floccosus*) (ミカンワタコナジラミ)、アルアカスピス・エスピーピー (*Aluacaspis* spp.)、アムラスカ・ビグテラ・ビグテラ (*Amrasca bigutella bigutella*)、アフロホラ・エスピーピー (*Aphrophora* spp.) (ヨコバイ)、アオニジエラ・アウランチイ (*Aonidiella aurantii*) (アカマルカイガラムシ)、アフィス・エスピーピー (*Aphis* spp.) (アブラムシ)、アフィス・ゴッシピイ (*Aphis gossypii*) (ワタアブラムシ)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*) (リンゴアブラムシ)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*) (ジャガイモヒゲナガアブラムシ)、ベミシア・エスピーピー (*Bemisia* spp.) (コナジラミ)、ベミシア・アルゲンチホリイ (*Bemisia argentifolii*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*) (タバココナジラミ)、ブラキコルス・ノキシウス (*Brachycolus noxius*) (Russian aphid)、ブラキコリネラ・アスパラギ (*Brachycorynella asparagi*) (asparagus aphid)、ブレベンニア・レヒ (*Brevennia rehi*)、ブレビコリネ・ブラッシカエ (*Brevicoryne brassicae*) (ダイコンアブラムシ)、セロプラステス・エスピーピー (*Ceroplastes* spp.) (カイガラムシ)、セロプラステス・ルベンス (*Ceroplastes rubens*) (ルビーロウカイガラムシ)、キオナスピス・エスピーピー (*Chionaspis* spp.) (カイガラムシ)、クリソンファルス・エスピーピー (*Chrysomphalus* spp.) (カイガラムシ)、コックス・エスピーピー (*Coccus* spp.) (カイガラムシ)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*) (オオバコアブラムシ)、エンポアスカ・エスピーピー (*Empoasca* spp.) (ヨコバイ)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*) (リンゴワタムシ)、イセリア・ブルカシ (*Icerya purchasi*) (ワタフキカイガラムシ)、イジオスコプス・ニチズルス (*Idioscopus nitidulus*) (mango leafhopper)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*) (ヒメトビウンカ)、レピドサフェス・エスピーピー (*Lepidosaphes* spp.)、マクロシフム・エスピーピー (*Macrosiphum* spp.)、マクロシフム・オイホルビアエ (*Macrosiphum euphorbiae*) (チューリップヒゲナガアブラムシ)、マクロシフム・グラナリウム (*Macrosiphum granarium*) (ムギヒゲ

10

20

30

40

50

ナガアブラムシ)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*) (イバラヒゲナガアブラムシ)、マクロステレス・クアドリリネアツス (*Macrosteles quadrilineatus*) (aster leafhopper)、マハナルバ・フリンビオラタ (*Mahanarva frimbiolata*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*) (ムギウスイロアブラムシ)、ミクチス・ロンギコルニス (*Mictis longicornis*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)、ネホテッチキス・エスピーピー (*Nephotettix* spp.) (ヨコバイ)、ネホテッチキス・シンクチペス (*Nephotettix cinctipes*) (ツマグロヨコバイ)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*) (トビイロウンカ)、パルラトリア・ペルガンジイ (*Parlatoria pergandii*) (マルクロホシカイガラムシ)、パルラトリア・ジジフィ (*Parlatoria ziziphi*) (ヒメクロカイガラムシ)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*) (トウモロコシウンカ)、フィラエヌス・エスピーピー (*Philaenus* spp.) (アワフキムシ)、フィロキセラ・ビチホリアエ (*Phylloxera vitifoliae*) (ブドウネアブラムシ)、フィソケルメス・ピセアエ (*Physokermes piceae*) (spruce bud scale)、プラノコックス・エスピーピー (*Planococcus* spp.) (コナカイガラムシ)、プソイドコックス・エスピーピー (*Pseudococcus* spp.) (コナカイガラムシ)、プソイドコックス・ブレビペス (*Pseudococcus brevipes*) (パインアップルコナカイガラムシ)、クアドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidotus perniciosus*) (ナシマルカイガラムシ)、ラパロシフム・エスピーピー (*Rhaphalosiphum* spp.) (アブラムシ)、ラパロシフム・マイダ (*Rhaphalosiphum maidi*) (トウモロコシアブラムシ)、ラパロシフム・パジ (*Rhaphalosiphum padi*) (ムギクビレアブラムシ)、サイッセチア・エスピーピー (*Saissetia* spp.) (カイガラムシ)、サイッセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*) (オリーブカタカイガラムシ)、シザフィス・グラミヌム (*Schizaphis graminum*) (ムギミドリアブラムシ)、シトピオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) (ムギヒゲナガアブラムシ)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*) (セジロウンカ)、テリオアフィス・エスピーピー (*Therioaphis* spp.) (アブラムシ)、トウメイセラ・エスピーピー (*Toumeyella* spp.) (カイガラムシ)、トキシソプテラ・エスピーピー (*Toxoptera* spp.) (アブラムシ)、トリアロイロデス・エスピーピー (*Trialeurodes* spp.) (コナジラミ)、トリアロイロデス・バボラリオルム (*Trialeurodes vaporariorum*) (オンシツコナジラミ)、トリアロイロデス・アブチロネウス (*Trialeurodes abutiloneus*) (banded wing whitefly)、ウナスピス・エスピーピー (*Unaspis* spp.) (カイガラムシ)、ウナスピス・ヤノネンシス (*Unaspis yanonensis*) (ヤネノカイガラムシ) 及びズリア・エントレリアナ (*Zulia entreriana*)。

## 【0105】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、膜翅類 (Hymenoptera) (アリ、スズメバチ及びミツバチ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない: アクロミルメキス・エスピーピー (*Acromyrmex* spp.)、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ・エスピーピー (*Atta* spp.) (ハキリアリ)、カンポノツス・エスピーピー (*Camponotus* spp.) (オオアリ)、ジプリオン・エスピーピー (*Diprion* spp.) (ハバチ)、ホルミカ・エスピーピー (*Formica* spp.) (アリ)、イリドミルメキス・フミリス (*Iridomyrmex humilis*) (アルゼンチンアリ)、モノモリウム・エスピーピー (*Monomorium* spp.)、モノモリウム・ミニムム (*Monomorium minimum*) (イエヒメアリ)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*) (ファラオアリ)、ネオジプリオン・エスピーピー (*Neodiprion* spp.) (ハバチ)、ポゴノミルメキス・エスピーピー (*Pogonomyrmex* spp.) (シュウカクアリ)、ポリステス・エスピーピー (*Polistes* spp.) (アシナガバチ)、ソレノプシス・エスピーピー (*Solenopsis* spp.) (カミアリ)、タポイノマ・セッシレ (*Tapinoma sessile*) (odorous house ant)、テトラノモリウム・エスピーピー (*Tetranomorium* spp.) (pavement ant)、ベスプラ・エスピーピー (*Vespula* spp.) (スズメバチ) 及びキシロコパ・エスピーピー (*Xylocopa* spp.) (クマバチ)。

## 【0106】

10

20

30

40

50

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、等翅類 (Isoptera) (シロアリ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない: コプトテルメス・エスピーピー (Coptotermes spp.)、コプトテルメス・クルビグナツス (Coptotermes curvignathus)、コプトテルメス・フレンチイ (Coptotermes frenchii)、コプトテルメス・ホルモサヌス (Coptotermes formosanus) (イエシロアリ)、コルニテメス・エスピーピー (Cornitermes spp.) (nasute termite)、クリプトテルメス・エスピーピー (Cryptotermes spp.) (カンザイシロアリ)、ヘテロテルメス・エスピーピー (Heterotermes spp.) (desert subterranean termite)、ヘテロテルメス・アウレウス (Heterotermes aureus)、カロテルメス・エスピーピー (Kalotermes spp.) (カンザイシロアリ)、インシスチテルメス・エスピーピー (Incistitermes spp.) (カンザイシロアリ)、マクロテルメス・エスピーピー (Macrotermes spp.) (fungus growing termite)、マルギニテルメス・エスピーピー (Marginitermes spp.) (カンザイシロアリ)、ミクロセロテルメス・エスピーピー (Microcerotermes spp.) (harvester termite)、ミクロテルメス・オベシ (Microtermes obesi)、プロコルニテルメス・エスピーピー (Procornitermes spp.)、レチクリテルメス・エスピーピー (Reticulitermes spp.) (subterranean termite)、レチクリテルメス・パニウレンシス (Reticulitermes banyulensis)、レチクリテルメス・グラッセイ (Reticulitermes grassei)、レチクリテルメス・フラビペス (Reticulitermes flavipes) (eastern subterranean termite)、レチクリテルメス・ハゲニ (Reticulitermes hageni)、レチクリテルメス・ヘスペルス (Reticulitermes hesperus) (western subterranean termite)、レチクリテルメス・サントネンシス (Reticulitermes santonensis)、レチクリテルメス・スペラツス (Reticulitermes speratus)、レチクリテルメス・チビアリス (Reticulitermes tibialis)、レチクリテルメス・ビルギニクス (Reticulitermes virginicus)、スケドリノテルメス・エスピーピー (Schedorhinotermes spp.) 及びゾオテルモプシス・エスピーピー (Zootermopsis spp.) (rotten?wood termite)。

【 0 1 0 7 】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、鱗翅類 (Lepidoptera) (ガ及びチョウ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない: アコエア・ジャナタ (Achoea janata)、アドキソフィエス・エスピーピー (Adoxophyes spp.)、アドキソフィエス・オラナ (Adoxophyes orana)、アグロチス・エスピーピー (Agrotis spp.) (ネキリムシ)、アグロチス・イプシロン (Agrotis ipsilon) (タマナヤガ)、アラバマ・アルギラセア (Alabama argillacea) (cotton leafworm)、アモルビア・クネアナ (Amorbia cuneana)、アミエロシス・トランシテラ (Amyelosis transitella) (navel orangeworm)、アナカンプトデス・デフェクタリア (Anacamptodes defectaria)、アナルシア・リネアテラ (Anarsia lineatella) (モモキバガ)、アノミス・サブプリフェラ (Anomis sabulifera) (jute looper)、アンチカルシア・ゲンマタリス (Anticarsia gemmatalis) (velvetbean caterpillar)、アルキプス・アルギロスピラ (Archips argyrospila) (fruittree leafroller)、アルキプス・ロサナ (Archips rosana) (rose leaf roller)、アルギロタエニア・エスピーピー (Argyrotaenia spp.) (ハマキガ)、アルギロタエニア・シトラナ (Argyrotaenia citrana) (ミカンコハマキ)、アウトグラファ・ガンマ (Autographa gamma)、ボナゴタ・クラナオデス (Bonagota cranaodes)、ボルボ・シンナラ (Borbo cinnara) (rice leaf folder)、ブククラトリキス・ツルベリエラ (Bucculatrix thurberiella) (cotton leafperforator)、カロプチリア・エスピーピー (Caloptilia spp.) (ハモグリムシ)、カブラ・レチクラナ (Capua reticulana)、カルボシナ・ニボネンシス (Carpocapsa niponensis) (モモシンクイガ)、キロ・エスピーピー (Chilo spp.)、クルメチア・トランスベルサ (Chlumetia transversa) (マンゴーフサヤガ)、コリストノイラ・ロサセアナ (Choristoneura rosaceana) (ハスオビハマキ)、クリソデイキシス・エスピーピー (Chrysodeixis spp.)、クナファロセルス・メジナリス (Cnaphalocerus medinalis) (grass leafroller)、コリアス・エスピーピー (Colias spp.)

、コンボモルファ・クラメレラ (*Conpomorpha cramerella*)、コッスス・コッスス (*Cossus cossus*) (オオボクトウ)、クランブス・エスピーピー (*Crambus* spp.) (Sod webworm)、シジア・フネブラナ (*Cydia funebrana*) (スモモヒメハマキ)、シジア・モレスタ (*Cydia molesta*) (ナシヒメシンクイ)、シジア・ニグニカナ (*Cydia nignicana*) (pea moth)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*) (コドリングア)、ダルナ・ジズクタ (*Darna diducta*)、ジアファニア・エスピーピー (*Diaphania* spp.) (stem borer)、ジアトラエア・エスピーピー (*Diatraea* spp.) (stalk borer)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*) (sugarcane borer)、ジアトラエア・グランジオセラ (*Diatraea grandiosella*) (southwester corn borer)、エアリアス・エスピーピー (*Earias* spp.) (bollworm)、エアリアス・インストラタ (*Earias insulata*) (Egyptian bollworm)、エアリアス・ビテラ (*Earias vitella*) (rough northern bollworm)、エクトポファ・アウランチアヌム (*Ecdytopopha aurantianum*)、エラスモパルプス・リゲノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*) (モロコシマダラメイガ)、エピフィシアス・ポストルッタナ (*Epiphysias postruttana*) (light brown apple moth)、エフェスチア・エスピーピー (*Epehstia* spp.) (flour moth)、エフェスチア・カウテラ (*Epehstia cautella*) (スジマダラメイガ)、エフェスチア・エルテラ (*Epehstia elutella*) (チャマダラメイガ)、エフェスチア・クエーニエラ (*Epehstia kuehniella*) (スジコナマダラメイガ)、エピメセス・エスピーピー (*Epimeces* spp.)、エピノチア・アポレマ (*Epilotia aporema*)、エリオノタ・トラキス (*Erionota thrax*) (トガリバナナセセリ)、オイポエシリア・アンビグエラ (*Eupoecilia ambiguella*) (ブドウホソハマキ)、オイキソア・アウキシリアリス (*Euxoa auxiliaris*) (army cutworm)、フェルチア・エスピーピー (*Feltia* spp.) (ネキリムシ)、ゴルチナ・エスピーピー (*Gortyna* spp.) (stem borer)、グラホリタ・モレスタ (*Grapholita molesta*) (ナシヒメシンクイ)、ヘジレプタ・インジカタ (*Hedylepta indicata*) (マエウスキノメイガ)、ヘリコベルパ・エスピーピー (*Helicoverpa* spp.) (ヤガ)、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*) (オオタバコガ)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*) (アメリカタバコガ)、ヘリオチス・エスピーピー (*Heliothis* spp.) (ヤガ)、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*) (ニセアメリカタバコガ)、ヘルラ・ウンダリス (*Helicoverpa undalis*) (ハイマダラノメイガ)、インダルベラ・エスピーピー (*Indarbela* spp.) (ネクイムシ)、ケイフェリア・リコベルシセラ (*Keiferia lycopersicella*) (tomato pinworm)、ロイシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*) (ナスノメイガ)、ロイコプテラ・マリホリエラ (*Leucoptera malifoliella*)、リトコレクチス・エスピーピー (*Litocolletis* spp.)、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*) (grape fruit moth)、ロキサグロチス・エスピーピー (*Loxagrotis* spp.) (ヤガ)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*) (western bean cutworm)、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar*) (マイマイガ)、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*) (キンモンホソガ)、マハセナ・コルベッチ (*Mahasena corbetti*) (oil palm bagworm)、マラコソマ・エスピーピー (*Malacosoma* spp.) (テンマクケムシ)、マメストラ・ブラッシカエ (*Mamestra brassicae*) (ヨトウガ)、マルカ・テストラリス (*Maruca testulalis*) (マメノメイガ)、メチサ・プラナ (*Metisa plana*) (ミノガ)、ミチムナ・ウニプンクタ (*Mythimna unipuncta*) (アメリカキヨトウ)、ネオロイシノデス・エレガンタリス (*Neoleucinodes elegantalis*) (small tomato borer)、ニンフラ・デプンクタリス (*Nymphula depunctalis*) (rice caseworm)、オペロフテラ・ブルマタ (*Operophtera brumata*) (ナミスジフユナミシヤク)、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*) (ヨーロッパアワノメイガ)、オキシジア・ベスリア (*Oxydia vesulia*)、パンデミス・セラサナ (*Pandemis cerasana*) (common currant tortrix)、パンデミス・ヘパラナ (*Pandemis heparana*) (トビハマキ)、パピリオ・デモドクス (*Papilio demodocus*)、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*) (ワタアカミムシガ)、ペリドロマ・エスピーピー (*Peridroma* spp.) (ネキリムシ)、ペリドロマ・サウシア (*Peridroma saucia*) (ニセタマナヤガ)、ペリロイコプテラ・コフェラ (*Perileucoptera* spp.)



ra coffeella) (white coffee leafminer)、フトリマエア・オペルクレラ (Phthorimaea operculella) (potato tuber moth)、フィロクニシチス・シトレラ (Phyllocnistis citrella)、フィロノリクテル・エスピーピー (Phyllonorycter spp.) (ハモグリムシ)、ピエリス・ラパエ (Pieris rapae) (アオムシ)、プラチベナ・スカブラ (Plathypena scabra)、プロジア・インテルプンクテラ (Plodia interpunctella) (ノシメマダラメイガ)、プルテラ・キシロステラ (Plutella xylostella) (コナガ)、ポリクロシス・ビテアナ (Polychrosis viteana) (ブドウヒメハマキ)、プライス・エンドカルパ (Prays endocarpa)、プライス・オレアエ (Prays oleae) (olive moth)、プソイダレチア・エスピーピー (Pseudaletia spp.) (ヤガ)、プソイダレチア・ウニプンクタタ (Pseudaletia unipunctata) (ヨトウムシ)、プソイドブルシア・インクルデンス (Pseudoplusia includens) (soybean looper)、ラキブルシア・ヌ (Rachiplusia nu)、シルポファガ・インセルツラス (Scirpophaga incertulas)、セサミア・エスピーピー (Sesamia spp.) (stemborer)、セサミア・インフェレンス (Sesamia inferens) (イネヨトウ)、セサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides)、セトラ・ニテンス (Setora nitens)、シトトロガ・セラアレラ (Sitotroga cerealella) (バクガ)、スパルガノチス・ピレリアナ (Sparganothis pilleriana)、スポドプテラ・エスピーピー (Spodoptera spp.) (ヨトウムシ)、スポドプテラ・エキシグア (Spodoptera exigua) (シロイチモンジヨトウ)、スポドプテラ・フルギベルダ (Spodoptera frugiperda) (ツマジロクサヨトウ)、スポドプテラ・オリダニア (Spodoptera oridania) (southern armyworm)、シナンテドン・エスピーピー (Synanthedon spp.) (ネクイムシ)、テクラ・バシリデス (Thecla basilides)、テルミシア・ゲンマタリス (Thermisia gemmatalis)、チネオラ・ビッセリエラ (Tineola bisselliella) (コイガ)、トリコブルシア・ニ (Trichoplusia ni) (イラクサギンウワバ)、ツタ・アブソルタ (Tuta absoluta)、イポノモイタ・エスピーピー (Yponomeuta spp.)、ゾイゼラ・コフェアエ (Zeuzera coffeae) (コーヒーゴマフボクトウ) 及びゾイゼラ・ピリナ (Zeuzera pyrina) (leopard moth)。

## 【0108】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、食毛類 (Mallophage) (ハジラミ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、それらに限定されない：ボビコラ・オビス (Bovicola ovis) (ヒツジハジラミ)、メナカンツス・ストラミネウス (Menacanthus stramineus) (ニワトリオオハジラミ) 及びメノポン・ガリナエ (Menopon gallinae) (ニワトリハジラミ)。

## 【0109】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、直翅類 (Orthoptera) (バッタ、イナゴ及びゴオロギ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、これらに限定されない：アナブルス・シンプレキス (Anabrus simplex) (モルモンクリケット)、グリロタルピデア (Gryllotalpidae) (ケラ)、ロクスタ・ミグラトリア (Locusta migratoria)、メラノプルス・エスピーピー (Melanoplus spp.) (バッタ)、マイクロセントルム・レチネルベ (Microcentrum retinerve) (angularwinged katydid)、プテロフィラ・エスピーピー (Pterophylla spp.) (キリギリス)、シストセルカ・グレガリア (Schistocerca gregaria)、スクデリア・フルカタ (Scudderia furcata) (forktailed bush katydid) 及びバランガ・ニグリコルニス (Valanga nigricornis)。

## 【0110】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、シラミ目 (Phthiraptera) (シラミ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、これらに限定されない：ハエマトピヌス・エスピーピー (Haematopinus spp.) (ウシ及びブタのシラミ)、リノグナツス・オビルス (Linognathus ovillus) (ヒツジのシラミ)、ペジクルス・フマヌス・カピチス (Pediculus humanus capitis) (アタマジラミ)、ペジクルス・フマヌス・フマヌス (Pediculus humanus humanus) (コロモジラミ) 及びプチルス・プビス (Pthirus pubis) (ケジラミ)。

## 【 0 1 1 1 】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、隠翅目 (Siphonaptera) (ノミ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、これらに限定されない：クテノセファリデス・カニス (Ctenocephalides canis) (イヌノミ)、クテノセファリデス・フェリス (Ctenocephalides felis) (ネコノミ) 及びプレキス・イリタンス (Pulex irritans) (ヒトノミ)。

## 【 0 1 1 2 】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、総翅類 (Thysanoptera) (アザミウマ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、これらに限定されない：フランクリニエラ・フスカ (Frankliniella fusca) (タバコアザミウマ)、フランクリニエラ・オッシデンタリス (Frankliniella occidentalis) (ミカンキイロアザミウマ)、フランクリニエラ・シュルツエイ (Frankliniella shultzei)、フランクリニエラ・ウィリアムシ (Frankliniella williamsi) (トウモロコシアザミウマ)、ヘリオトリプス・ハエモライダリス (Heliothrips haemorrhoidalis) (オンシツアザミウマ)、リフィホロトリプス・クルエンタツス (Rhipiphorothrips cruentatus)、シルトトリプス・エスピーピー (Scirtothrips spp.)、シルトトリプス・シトリ (Scirtothrips citri) (citrus thrips)、シルトトリプス・ドルサリス (Scirtothrips dorsalis) (チャノキイロアザミウマ)、タエニオトリプス・ローランテンナリス (Taeniothrips rhopalantennalis) 及びトリプス・エスピーピー (Thrips spp.)。

## 【 0 1 1 3 】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、総尾類 (Thysanura) (シミ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、これらに限定されない：レピスマ・エスピーピー (Lepisma spp.) (セイヨウシミ) 及びテルモビア・エスピーピー (Thermobia spp.) (マダラシミ)。

## 【 0 1 1 4 】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、ダニ目 (Acarina) (ダニ及びマダニ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、これらに限定されない：アカラプシス・ウオオジ (Acarapsis woodi) (アカリンダニ；ミツバチの気管ダニ)、アカルス・エスピーピー (Acarus spp.) (食品ダニ)、アカルス・シロ (Acarus siro) (アシフトコナダニ)、アセリア・マンギフェラエ (Aceria mangiferae) (mango bud mite)、アクロプス・エスピーピー (Aculops spp.)、アクロプス・リコベルシシ (Aculops lycopersici) (トマトサビダニ)、アクロプス・ペレカシ (Aculops pelekasi)、アクルス・ペレカッシ (Aculus pelekassi)、アクルス・スレクテンダリ (Aculus schlechtendali) (リンゴサビダニ)、アンブリオンマ・アメリカヌム (Amblyomma americanum) (アメリカキララマダニ)、ボオフィルス・エスピーピー (Boophilus spp.) (マダニ)、ブレビパルプス・オボパツス (Brevipalpus obovatus) (チャノヒメハダニ)、ブレビパルプス・ホエニシス (Brevipalpus phoenicis) (ミナミヒメハダニ)、デモデキス・エスピーピー (Demodex spp.) (ヒゼンダニ)、デルマセントル・エスピーピー (Dermacentor spp.) (カタダニ)、デルマセントル・バリアビリス (Dermacentor variabilis) (アメリカイヌカクダニ)、デルマトファゴイデス・プテロニッシヌス (Dermatophagoides pteronyssinus) (ヒョウヒダニ)、エオテトラニクス・エスピーピー (Eotetranychus spp.)、エオテトラニクス・カルピニ (Eotetranychus carpini) (yellow spider mite)、エピチメルス・エスピーピー (Epitimerus spp.)、エリオフィエス・エスピーピー (Eriophyes spp.)、イキソデス・エスピーピー (Ixodes spp.) (マダニ)、メタテトラニクス・エスピーピー (Metatetranychus spp.)、ノトエドレス・カチ (Notoedres cati)、オリゴニクス・エスピーピー (Oligonychus spp.)、オリゴニクス・コフェ (Oligonychus coffee)、オリゴニクス・イリクス (Oligonychus ilicis) (southern red mite)、パノニクス・エスピーピー (Panonychus spp.)、パノニクス・シトリ (Panonychus citri) (ミカンハダニ)、

パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (リンゴハダニ)、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*) (ミカンサビダニ)、ポリファゴタルソネムン・ラッス (*Polyphagotarsonemum latus*) (チャノホコリダニ)、リピセファルス・サンガイネウス (*Rhipicephalus sanguineus*) (クリイロコイタマダニ)、リゾグリフス・エスピーピー (*Rhizoglyphus* spp.) (ネダニ)、サルコプテス・スカビエイ (*Sarcoptes scabiei*) (ヒゼンダニ)、テゴロフス・ペルセアフロラエ (*Tegolophus perseiflorae*)、テトラニクス・エスピーピー (*Tetranychus* spp.)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*) (ナミハダニ) 及びバロア・デストルクトル (*Varroa destructor*) (ミツバチヘギイタダニ)。

## 【0115】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、線虫類 (*Nematoda*) (センチュウ) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、下記の害虫が含まれるが、これらに限定されない：アフエレンコイデス・エスピーピー (*Aphelenchoides* spp.) (芽及び葉&松材のセンチュウ)、ベロノライムス・エスピーピー (*Belonolaimus* spp.) (sting nematode)、クリコネメラ・エスピーピー (*Criconemella* spp.) (ring nematode)、ジロフィラリア・インミチス (*Dirofilaria immitis*) (犬糸状虫)、ジチレンクス・エスピーピー (*Ditylenchus* spp.) (茎及び球根のセンチュウ)、ヘテロデラ・エスピーピー (*Heterodera* spp.) (シストセンチュウ)、ヘテロデラ・ゼアエ (*Heterodera zeae*) (トウモロコシのシストセンチュウ)、ヒルスマンニエラ・エスピーピー (*Hirschmanniella* spp.) (root nematode)、ホプロライムス・エスピーピー (*Hoplolaimus* spp.) (lance nematode)、メロイドギネ・エスピーピー (*Meloidogyne* spp.) (ネコブセンチュウ)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*) (ネコブセンチュウ)、オンコセルカ・ボルブルス (*Onchocerca volvulus*) (回糸状虫)、プラチレンクス・エスピーピー (*Pratylenchus* spp.) (ネグサレセンチュウ)、ラドホルス・エスピーピー (*Radopholus* spp.) (ネモグリセンチュウ) 及びロチレンクス・レニホルミス (*Rotylenchus reniformis*) (ニセフクロセンチュウ)。

## 【0116】

別の実施形態において、本文書において開示される発明は、結合類 (*Symphyla*) (コムカデ類) を駆除するために使用することができる。これらの害虫の非網羅的列挙には、スクチゲレラ・インマクラタ (*Scutigera immaculata*) が含まれるが、これに限定されない。

## 【0117】

より詳細な情報については、Arnold Mallis による “Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests” (第9版、著作権：GIE Media Inc. (2004年)) を参照のこと。

## 【0118】

## 混合物

本文書において開示される発明との組合せで有益に用いることができる殺虫剤のいくつかには、下記の殺虫剤が含まれるが、それらに限定されない：

1, 2 - ジクロロプロパン、1, 3 - ジクロロプロペン、

アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アセチオン (acethion)、アセトプロール、アクリナトリン、アクリロニトリル、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アルドリン、アレスリン、アロサミジン (allosamidin)、アリキシカルブ、アルファシペルメトリン、アルファエクジソン、アルファエンドスルファン、AKD - 1022、アミジチオン、アミドフルメット、アミノカルブ、アミトン (amiton)、アミトラズ、アナバシン (anabasine)、三酸化ヒ素、アチダチオン、アザジラクチン (azadirachtin)、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、アゾベンゼン、アゾシクロチン、アゾトエート、

バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、ヘキサフルオロケイ酸バリウム、バルトリン (barthrin)、ベンクロチアズ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ

10

20

30

40

50

、ベノミル、ベノキサホス (benoxafos)、ベンスルタップ、ベンゾキシメート、安息香酸ベンジル、ベータシフルトリン、ベータシベルメトリン、ピフェナゼート、ピフェントリン、ピナパクリル、ピオアレトリン (bioallethrin)、ピオエタノメトリン (bioethan omethrin)、ピオベルメトリン、ピストリフルロン、ホウ砂、ホウ酸、プロムフェンピンフォス、プロモDDT、プロモシクレン、プロモホス、プロモホスエチル、プロモプロピレート、プフェンカルブ、ププロフェジン、プタカルブ、プタチオホス、プトカルボキシム、プトネート、プトキシカルボキシム、

カズサホス、ヒ酸カルシウム、多硫化カルシウム、カンフェクロール、カーバノレート、カルパリル、カルボフラン、二硫化炭素、四塩化炭素、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カルタップ、キノメチオナート、クロラントラニリプロール、クロルベンシド、クロルピシクレン、クロルデン、クロルデコン、クロルジメホルム、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェネトール、クロルフェンソン、クロルフェンスルフィド、クロルフェンピンホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロロベンジレート、3 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - オキサ - 1 - アザスピロ [4, 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン、3 - (4' - クロロ - 2, 4 - ジメチル [1, 1' - ピフェニル] - 3 - イル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - オキサ - 1 - アザスピロ [4, 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン、4 - [ [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] メチルアミノ] - 2 (5H) - フラノン、4 - [ [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] シクロプロピルアミノ] - 2 (5H) - フラノン、3 - クロロ - N2 - [(1S) - 1 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) エチル] - N1 - [2 - メチル - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] - 1, 2 - ベンゼンジカルボキサミド、クロロホルム、クロロメブホルム、クロロメチウロン、クロロピクリン、クロロプロピレート、クロロホキシム、クロルプラゾホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クロルチオホス、クロマフェノジド、シネリン (cinerin) I、シネリン II、シスメトリン、クロエトカルブ、クロフェンテジン、クロサンテル、クロチアニジン、アセト亜ヒ酸銅、ヒ酸銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、クマホス、クミトエート、クロタミトン (crotamiton)、クロトキシホス、クルエンタレン (cruentaren) A 及びクルエンタレン B、クルホメート、クリオリト (cryolite)、シアノフェンホス、シアノホス、シアントエート、シアントラニリプロール、シクレトリン (cyclothrin)、シクロプロトリン、シエノピラフェン、シフルメトフェン、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シベルメトリン、シフェノトリン、シロマジン、シチオエート (cythioate)、2 - シアノ - N - エチル - 4 - フルオロ - 3 - メトキシ - ベンゼンスルホンアミド、2 - シアノ - N - エチル - 3 - メトキシ - ベンゼンスルホンアミド、2 - シアノ - 3 - ジフルオロメトキシ - N - エチル - 4 - フルオロ - ベンゼンスルホンアミド、2 - シアノ - 3 - フルオロメトキシ - N - エチル - ベンゼンスルホンアミド、2 - シアノ - 6 - フルオロ - 3 - メトキシ - N, N - ジメチル - ベンゼンスルホンアミド、2 - シアノ - N - エチル - 6 - フルオロ - 3 - メトキシ - N - メチル - ベンゼンスルホンアミド、2 - シアノ - 3 - ジフルオロメトキシ - N, N - ジメチルベンゼンスルホンアミド、

d - リモネン、ダゾメット、DBCP、DCIP、DDT、デカルボフラン、デルタメトリン、デメフィオン、デメフィオンO、デメフィオンS、デメトン、デメトンメチル、デメトンO、デメトンOメチル、デメトンS、デメトンSメチル、デメトンSメチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、ジアミダホス、ダイアジノン、ジカプトン (dicapton)、ジクロフェンチオン、ジクロフルアニド、ジクロルボス、ジコホル、ジクレシル (dicresyl)、ジクロトホス、ジシクラニル、ディルドリン、ジエノクロル、ジフロビダジン、ジフルベンズロン、3 - (ジフルオロメチル) - N - [2 - (3, 3 - ジメチルブチル) フェニル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、ジロール (dilor)、ジメフルトリン、ジメホックス、ジメタン (dimetan)、ジメトエート、ジメトリン、ジメチルピンホス、ジメチラン (dimetilan)、ジネックス、ジノプトン、ジノカップ、ジノカップ4、ジノカップ6、ジノクトン、ジノペントン、ジノプロップ、ジノサム、ジノスルホン、ジノテフラン、ジノテルボン、ジオフェノラン、ジオキサベンゾホス

10

20

30

40

50

、ジオキサカルブ、ジオキサチオン、ジフェニルスルホン、ジスルフィラム (disulfiram)、ジスルホトン、ジチクロホス、D N O C、ドフェナピン、ドラメクチン、

エクジステロン (ecdysterone)、エマメクチン、エマメクチンベンゾエート、E M P C、エムペントリン、エンドスルファン、エンドチオン、エンドリン、E P N、エポフェノナン、エプリノメクチン (epinomectin)、エスフェンバレレート、エタホス (etaphos)、エチオフエンカルブ、エチオン、エチプロール、エトエートメチル、エトプロホス、エチルD D D、ギ酸エチル、エチレンジプロミド、エチレンジクロリド、エチレンオキシド、エトフェンプロックス、エトキサゾール、エトリムホス、E X D、

F 1 0 5 0、ファムフル (famphur)、フェナミホス、フェナザフロル、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェンクロルホス、フェネタカルブ、フェンフルトリン、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノチオカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンピリトリン、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、フェンソン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェンチオンエチル、フェントリファニル、フェンバレレート、フィプロニル、F K I - 1 0 3 3、フロニカミド、フルアクリピリム、フルアズロン、フルベンジアミド、フルベンジミン、フルコフロン、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルエネチル、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンプロックス、フルメトリン、フルオルベンシド、フルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホルモチオン、ホルムパラネート、ホスメチラン、ホスピレート、ホスチアゼート、ホスチエタン、ホスチエタン、フラチオカルブ、フレトリン (furethrin)、フルフラール、ガンマシハロトリン、ガンマH C H、

ハロフェンプロックス、ハロフェノジド、H C H、H E O D、ヘブタクロル、ヘブテノホス、ヘテロホス (heterophos)、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、H H D N、ヒドラメチルノン、シアン化水素、ヒドロプレン、ヒキンカルブ、

イミシアホス、イミダクロブリド、イミダクロチズ (imidaclothiz)、イミプロトリン、インドキサカルブ、ヨードメタン、I P S P、イサミドホス、イサゾホス、イソベンザン、イソカルボホス (isocarbophos)、イソドリン (isodrin)、イソフェンホス、イソプロカルブ、イソプロチオラン、イソチオエート、イソキサチオン、イベルメクチン、

ジャスモリン (jasmolin) I、ジャスモリン I I、ジョードフェンホス、幼若ホルモン I、幼若ホルモン I I、幼若ホルモン I I I、J S 1 1 8、

ケレバン、キノプレン、

ラムダシハロトリン、ヒ酸鉛、レピメクチン、レプトホス、リンデン、リリムホス、ルフェヌロン、リチダチオン、

マラチオン、マロノベン、マジドックス、メカルバム、メカルホン、メナゾン、メホスホラン、塩化第一水銀、メスルフェン (mesulfen)、メスルフェンホス、メタフルミゾン、メタム、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチオカルブ、メトクロトホス、メソミル、メトプレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メチルプロミド、メチルイソチオシアネート、メチルクロロホルム、メチレンクロリド、メトフルトリン、メトカルブ、メトキサジアゾン、メピンホス、メキサカルベート、ミルベメクチン、ミルベマイシンオキシム (milbemycin oxime)、ミパホックス、ミレックス、M N A F、モノクロトホス、モルホチオン、モキシデクチン (moxidecthin)、

ナフタロホス (naftalofos)、ナレド、ナフタレン、ネレイストキシン (nereistoxin)、N - エチル - 2, 2 - ジメチルプロピオンアミド - 2 - ( 2, 6 - ジクロロ - , , - トリフルオロ - p - トリル) ヒドラゾン、N - エチル - 2, 2 - ジクロロ - 1 - メチルシクロプロパンカルボキサミド - 2 - ( 2, 6 - ジクロロ - , , - トリフルオロ - p - トリル) ヒドラゾン、ニコチン、ニフルリジッド、ニッコマイシン (nikkomycin) 類、ニテンピラム、ニチアジン、ニトリラカルブ、ノバルロン、ノビフルムロン、

オメトエート、オキサミル、オキシデメトンメチル、オキシデプロホス、オキシジスルホトン、

パラジクロロベンゼン、パラチオン、パラチオンメチル、ペンフルロン (penfluron)、ペンタククロロフェノール、ペントメトリン (pentmethrin)、ベルメトリン、フェンカ

10

20

30

40

50

プトン、フェノトリン、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスホラン、ホスメット、ホスニクロル、ホスファミドン、ホスフィン、ホスホカルブ、ホキシム、ホキシムメチル、ピペロニルブトキシド、ピリメタホス、ピリミカルブ、ピリミホスエチル、ピリミホスメチル、亜ヒ酸カリウム、チオシアン酸カリウム、p p ' - D D T、プラレトリン、プレコセン (precocene) I、プレコセン I I、プレコセン I I I、プリミドホス、プロクロノール (proclonol)、プロフェノホス、プロフルトリン、プロマシル (promacyl)、プロメカルブ、プロパホス、プロパルギット、プロペタンホス、プロボキスル、プロチダチオン、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンブト、ピラクロホス、ピラフルプロール、ピラゾホス、ピレスメトリン、ピレトリン I、ピレトリン I I、ピリダベン、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリフルキナゾン、ピリミジフェン、ピリミテート、ピリプロール、ピリプロキシフェン、

10

Q c i d e、カッシア、キナルホス、キナルホスメチル、キノチオン (quinothion)、クアンチオホス、

ラフォキサニド、レスメトリン、ロテノン、リアニア、

サバジラ、シュラーダン、セラメクチン (selamectin)、シラフルオフエン、亜ヒ酸ナトリウム、フッ化ナトリウム、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム、チオシアン酸ナトリウム、ソファミド、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルコフロン、スルフィラム (sulfiram)、スルフラミド、スルホテップ、スルホキサフルル、イオウ、フッ化スルフリル、スルプロホス、

タウフルバリネート、タジムカルブ、T D E、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムホス、テフルベンズロン、テフルスリン、テメホス、T E P P、テラレトリン、テルブホス、テトラクロロエタン、テトラクロロピンホス、テトラジホン、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、テトラナクチン (tetranactin)、テTRASル、シータシペルメトリン、チアクロブリド、チアメトキサム、チクロホス、チオカルボキシム、チオシクラム、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオナジン、チオキノックス、チオスルタップ、チューリングエンシン (thuringiensin)、トルフェンピラド、トラロメトリン、トランスフルトリン、トランスペルメトリン、トリアラテン、トリアザメート、トリアゾホス、トリクロルホン、トリクロルメタホス 3 (trichlormetaphos 3)、トリクロロナート、トリフェノホス、トリフルムロン、トリメタカルブ、トリプレン、

20

バミドチオン、バニリプロール、ベルチシリド (verticilide)、

30

X M C、キシリルカルブ、

ゼータシペルメトリン及びゾラプロホス。

#### 【 0 1 1 9 】

加えて、上記殺虫剤のどのような組合せも使用することができる。

#### 【 0 1 2 0 】

本文書において開示される発明はまた、効率的使用及び相乗作用の両方の理由で、除草剤及び殺カビ剤とともに使用することができる。

#### 【 0 1 2 1 】

本文書において開示される発明は、効率的使用及び相乗作用の理由で、抗菌剤、殺細菌剤、枯葉剤、毒性緩和剤、相乗剤、殺藻剤、誘引剤、乾燥剤、フェロモン、忌避剤、動物浸液、殺鳥剤、消毒剤、情報化学物質及び軟体動物駆除剤 (これらの分類は必ずしも相互に排他的ではない) とともに用いることができる。

40

#### 【 0 1 2 2 】

加えて、下記的一般に公知な化合物を本発明とともに使用することができる：ルエンズルホン (luensulfone)、フフェノジド (fufenozide)、ピメトロジン、I K A - 2 0 0 2、I K I - 2 0 0 2、Z J 0 9 6 7、I P P - 1 0、J T - L 0 0 1、N - エチル - 2、2 - ジクロロ - 1 - メチルシクロプロパンカルボキサミド - 2 - ( 2、6 - ジクロロ -、 - トリフルオロ - p - トリル) ヒドラゾン。

#### 【 0 1 2 3 】

さらに多くの情報については、本文書の出願日当時の <http://www.alan>

50

wood.net/pesticides/index.htmlにある“Compendium of Pesticide Common Names”を参照のこと。“The Pesticide Manual”(第14版、編者：CDS Tomlin、著作権(2006年): British Crop Production Council)もまた参照のこと。

#### 【0124】

##### 相乗作用混合物

本文書において開示される発明は、混合物における化合物の作用様式が同じであるか、又は類似しているか、又は異なる相乗作用混合物を形成するために、他の化合物とともに使用することができ、例えば、「混合物」の見出しのもとで述べられる化合物などとともに使用することができる。

10

#### 【0125】

作用様式の例としては、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤、ナトリウムチャンネル調節剤、キチン生合成阻害剤、GABA作動性塩素イオンチャンネルアンタゴニスト、GABA作動性かつグルタミン酸作動性の塩素イオンチャンネルアゴニスト、アセチルコリン受容体アゴニスト、MET I阻害剤、Mg刺激ATPase阻害剤、ニコチン性アセチルコリン受容体、中腸膜破壊剤及び酸化的リン酸化破壊剤が含まれるが、これらに限定されない。

#### 【0126】

加えて、下記の化合物が相乗剤として公知であり、本文書において開示される発明とともに使用することができる：ピペロニルブトキシド、ピプロタル(piprotal)、プロピルイソム(propyl isome)、セサメックス(sesamex)、セサモリン(sesamol in)及びスルホキシド。

20

#### 【0127】

##### 配合物

殺虫剤は、その純粋な形態で適用するために好適であることは希である。通常の場合には、他の物質を加え、その結果、殺虫剤が、要求される濃度で、かつ、適切な形態で使用され得るようにすることが必要であり、このことは、容易な適用、取り扱い、輸送、貯蔵及び最大の殺虫剤活性を可能にする。従って、殺虫剤は、例えば、餌、高濃度エマルジョン剤、粉剤、乳剤、燻蒸剤、ゲル剤、粒剤、マイクロカプセル封入剤、種子処理剤、懸濁高濃度剤、サスポエマルジョン剤、錠剤、水溶性液剤、水和性顆粒剤又はドライフロアブル剤、水和剤及び超低体積(ultra low volume)溶液に配合される。

30

#### 【0128】

配合物タイプに関するさらなる情報については、“Catalogue of Pesticide Formulation Types and International Coding System”、Technical Monograph No.2(第5版、編集：CropLife International(2002))を参照のこと。

#### 【0129】

殺虫剤は、ほとんどの場合、当該殺虫剤の高濃度配合物から調製される水性の懸濁物又はエマルジョンとして提供される。そのような水溶性配合物、水に懸濁可能な配合物又は乳化可能な配合物は、固体(これは通常、水和性粉末として公知である)、又は、水和性顆粒剤であるか、或いは、通常的には乳剤として公知である液体、又は、水性懸濁物であるかのどちらかである。水和性粉末は、水和性顆粒剤を形成するために圧縮成形され得ることがあるが、殺虫剤、担体及び界面活性剤の均質な混合物を含む。殺虫剤の濃度は通常、重量比で約10%~約90%である。担体は通常、アタパルジャイト粘土、モンモリロナイト粘土、珪藻土又は精製されたケイ酸塩の中から選ばれる。約0.5%~約10%の水和性粉末を含む場合、効果的な界面活性剤が、スルホン化リグニン、縮合ナフタレンスルホナート、ナフタレンスルホナート、アルキルベンゼンスルホナート、アルキルスルファート及び非イオン性界面活性剤(例えば、アルキルフェノールのエチレンオキシド付加物など)の中に見出される。

40

#### 【0130】

殺虫剤の乳剤は、水混和性溶媒であるか、又は、水非混和性有機溶媒及び乳化剤の混合

50

物であるかのどちらかである担体に溶解される殺虫剤の好都合な濃度（例えば、1リットルの液体あたり約50グラム～約500グラムなど）を含む。有用な有機溶媒には、芳香族系溶媒、とりわけ、キシレン系、及び、石油分画物、とりわけ、高沸点のナフタレン系、並びに、石油のオレフィン部分（例えば、重質芳香族ナフサなど）が含まれる。他の有機溶媒もまた使用することができ、例えば、テルペン系溶媒（ロジン誘導体を含む）、脂肪族ケトン（例えば、シクロヘキサノンなど）及び複合アルコール（例えば、2-エトキシエタノールなど）を使用することができる。乳剤のための好適な乳化剤が、従来のアニオン性界面活性剤及び非イオン性界面活性剤から選ばれる。

#### 【0131】

水性懸濁物は、水性担体に約5重量%～約50重量%の範囲における濃度で懸濁される水不溶性殺虫剤の懸濁物を含む。懸濁物が、殺虫剤を細かく粉碎し、粉碎物を、水及び界面活性剤から構成される担体に激しく混合することによって調製される。様々な成分、例えば、無機塩及び合成ゴム又は天然ゴムなどもまた、水性担体の密度及び粘度を増大させるために加えることができる。所定の装置（例えば、サンドミル、ボールミル又はピストン型ホモジナイザーなど）においてそのような水性混合物を調製し、それを均質化することによって殺虫剤を同時に粉碎及び混合することが多くの場合、最も効果的である。

10

#### 【0132】

殺虫剤はまた、土壌への適用のために特に有用である粒状組成物として適用することができる。粒状組成物は通常、約0.5重量%～約10重量%の殺虫剤を、粘土又は類似する物質を含む担体に分散されて含有する。そのような組成物は通常、殺虫剤を好適な溶媒に溶解し、それを、約0.5mm～3mmの範囲で、適切な粒子サイズに事前に形成されている粒状担体に加えることによって調製される。そのような組成物はまた、担体及び化合物の練り粉又はペーストを作製し、破碎及び乾燥して、所望される粒状粒子サイズを得ることによって配合することができる。

20

#### 【0133】

殺虫剤を含有する粉剤が、粉末化形態の殺虫剤を好適な粉末状の農業用担体（例えば、カオリン粘土及び粉碎された火山岩など）と均質に混合することによって調製される。粉剤は好適には、約1%～約10%の殺虫剤を含有することができる。粉剤は種子粉衣剤（seed dressing）として適用することができ、又は、粉剤ブロー機器を用いて葉面適用剤として適用することができる。

30

#### 【0134】

殺虫剤を適切な有機溶媒（通常的には石油、例えば、農業化学において広範囲に使用されるスプレー油など）における溶液の形態で適用することが、同等に実用的である。

#### 【0135】

殺虫剤はまた、エアロゾル組成物の形態で適用することができる。そのような組成物において、殺虫剤は、圧力発生用の噴射剤混合物である担体に溶解又は分散される。エアロゾル組成物は、混合物が噴霧バルブを介して施される容器に詰められる。

#### 【0136】

殺虫剤が食物又は誘因剤又は両者と混合されるとき、殺虫剤餌が形成される。害虫がそのような餌を食べるとき、害虫は殺虫剤を摂取する。餌は、顆粒、ゲル、フロアブル粉末、液体又は固体の形態を取ることができる。餌は害虫の生息場所において使用される。

40

#### 【0137】

燻蒸剤は、比較的高い蒸気圧を有し、従って、土壌又は閉ざされた空間において害虫を殺すために、十分な濃度でガスとして存在することができる殺虫剤である。燻蒸剤の毒性はその濃度及び暴露時間に比例する。燻蒸剤は、拡散についての良好な能力によって特徴づけられ、害虫の呼吸器系に浸透することによるか、又は、害虫の角皮から吸収されることによって作用する。燻蒸剤は、ガス不透過性シートの下、ガス封止された部屋又は建物の中、或いは、特別なチャンバーの中における貯蔵製造物の害虫を駆除するために適用される。

#### 【0138】

50



殺虫剤は、殺虫剤の粒子又は液滴を様々なタイプの可塑性ポリマーに懸濁することによってマイクロカプセル化することができる。ポリマーの化学的性質を変えることによって、又は、加工における様々な要因を変化させることによって、様々なサイズ、溶解性、壁厚、及び、様々な程度の浸透性を有するマイクロカプセルを形成することができる。これらの要因により、内部の有効成分が放出される速度が決定され、このことは、その結果として、製造物の残留性能、作用速度及び臭気に影響を及ぼす。

【0139】

油性溶液の高濃度物が、殺虫剤を溶解状態で保ち得る溶媒に殺虫剤を溶解することによって作製される。殺虫剤の油性溶液は通常、溶媒自身が殺虫作用を有すること、及び、外皮のワックス様被覆の溶解が殺虫剤の取り込み速度を増大させることにより、他の配合物よりも速い害虫の撃退及び殺傷をもたらす。油性溶液の他の利点には、貯蔵安定性がより良好であること、隙間への浸透がより良好であること、及び、油で汚れた表面への付着がより良好であることが含まれる。

10

【0140】

別の実施形態が水中油型エマルジョンであり、この場合、エマルジョンは、それぞれがラメラ状の液晶被覆を備え、かつ、水相に分散される油性の小滴を含み、そして、それぞれの油性の小滴が、農業的に活性である少なくとも1つの化合物を含み、かつ、(1)少なくとも1つの非イオン性親油性表面活性剤、(2)少なくとも1つの非イオン性親水性表面活性剤、及び、(3)少なくとも1つのイオン性表面活性剤を含むモノラメラ層又はオリゴラメラ層により個々に覆われ、このとき、小滴は平均粒子直径が800ナノメートル未満である。この実施形態に関するさらなる情報が、特許出願番号第11/495,228号を有する2007年2月1日発行の米国特許出願公開第20070027034号に開示される。使用を容易にするために、この実施形態は「O I W E」と呼ばれる。

20

【0141】

さらなる情報については、D. Dentによる“*Insect Pest Management*”(第2版、著作権：CAB International(2000))を参照のこと。加えて、より詳細な情報については、Arnold Mallisによる“*Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests*”(第9版、著作権(2004年)：GIE Media Inc.)を参照のこと。

【0142】

他の配合成分

一般に、本文書において開示される発明は、配合物で使用されるとき、そのような配合物はまた、他の成分を含有することができる。これらの成分には、湿潤剤、展着剤、固着剤、浸透剤、緩衝剤、金属イオン封鎖剤、ドリフト軽減剤、相容性薬剤、消泡剤、清浄化剤及び乳化剤が含まれるが、これらに限定されない(これは、非網羅的な、相互に排他的でない列挙である)。少数の成分が次に記載される。

30

【0143】

湿潤化剤は、液体に加えられたとき、液体と、液体が拡がりつつある表面との間の界面張力を低下させることによって、液体の拡がり又は浸透力を増大させる物質である。湿潤化剤が、農薬配合物における2つの大きな機能のために、すなわち、加工時及び製造時には、水における粉末の濡れ速度を増大させて、可溶性液剤のための高濃度物、又は、懸濁高濃度物を作製するために、そして、製造物をスプレータンクにおいて水と混合しているときには、水和性粉末の湿潤時間を短くし、かつ、水和性顆粒剤の中への水の浸透を改善するために使用される。水和性粉末配合物、懸濁高濃度物配合物及び水和性顆粒剤配合物において使用される湿潤化剤の例が、ラウリル硫酸ナトリウム、ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、アルキルフェノールエトキシラート及び脂肪族アルコールエトキシラートである。

40

【0144】

分散化剤は、粒子の表面に吸着し、粒子の分散状態を保つことを助け、かつ、粒子が再凝集することを防止する物質である。分散化剤が、製造時における分散及び懸濁を容易に

50

するために、また、粒子がスプレータンクにおいて水に再分散することを保証するために農薬配合物に加えられる。分散化剤が、水和性粉末、懸濁高濃度物及び水和性顆粒剤において広範囲に使用される。分散化剤として使用される界面活性剤は、粒子表面に強く吸着し、粒子の再凝集に対する電荷バリア又は立体的バリアを提供することができる。最も一般に使用されている界面活性剤が、アニオン性、又は、非イオン性、又は、これら2つのタイプの混合物である。水和性粉末配合物については、最も一般的な分散化剤がリグノスルホン酸ナトリウムである。懸濁高濃度物については、非常に良好な吸着及び安定化が、高分子電解質を使用して、例えば、ナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物などを使用して得られる。トリスチリルフェノールエトキシラートホスファートエステルもまた使用される。非イオン性のもの、例えば、アルキルアリアルエチレンオキシド縮合物及びEO-POブロックコポリマーなどが時には、懸濁高濃度物のための分散化剤としてアニオン性のものと組み合わされる。近年では、新しいタイプの非常に高分子量のポリマー界面活性剤が分散化剤として開発されている。これらは、非常に長い疎水性「骨格」と、「くし」型界面活性剤の「歯」を形成する多数のエチレンオキシド鎖とを有する。これらの高分子量ポリマーは、疎水性骨格が粒子表面への多くの固定点を有するので、非常に良好な長期間安定性を懸濁高濃度物に与えることができる。農薬配合物において使用される分散化剤の例が、リグノスルホン酸ナトリウム、ナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物、トリスチリルフェノールエトキシラートホスファートエステル、脂肪族アルコールエトキシラート、アルキルエトキシラート、EO-POブロックコポリマー及びグラフトコポリマーである。

10

20

## 【0145】

乳化剤は、1つの液相の液滴の、別の液相における懸濁を安定化する物質である。乳化剤を用いない場合、これら2つの液体は2つの非混和性の液相に分離すると考えられる。最も一般に使用されている乳化剤ブレンド混合物は、12以上のエチレンオキシドユニットを有するアルキルフェノール又は脂肪族アルコールと、ドデシルベンゼンスルホン酸の油溶性カルシウム塩とを含有する。8から18までの範囲の親水性親油性比（「HLB」）値が通常、良好な安定エマルジョンをもたらす。エマルジョンの安定性を時には、少量のEO-POブロックコポリマー界面活性剤の添加によって改善することができる。

## 【0146】

可溶化剤は、臨界ミセル濃度を超える濃度で水においてミセルを形成する界面活性剤である。その場合、ミセルは、水不溶性物質をミセルの疎水性部分の内部に溶解又は可溶化することができる。可溶化のために通常的に使用されるタイプの界面活性剤が非イオン性のものであり、例えば、ソルビタンモノオレアート、ソルビタンモノオレアートエトキシラート及びメチルオレアートエステルである。

30

## 【0147】

界面活性剤は時には、標的に対する殺虫剤の生物学的成績を改善するために、スプレータンクミックスに対する補助剤として単独で使用されるか、又は、他の添加剤（例えば、鉱油又は植物油など）とともに使用される。生物学的強化のために使用される界面活性剤のタイプは、一般には殺虫剤の性質及び作用様式に依存する。しかしながら、生物学的強化のために使用される界面活性剤は多くの場合、非イオン性のものであり、例えば、アルキルエトキシラート、線状脂肪族アルコールエトキシラート、脂肪族アミンエトキシラートである。

40

## 【0148】

農業用配合物における担体又は希釈剤は、要求される強さの製造物を与えるために殺虫剤に加えられる物質である。担体は通常、大きい吸収能を有する物質であり、一方、希釈剤は通常、小さい吸収能を有する物質である。様々な担体及び希釈剤が、粉剤、水和性粉末、粒剤及び水和性顆粒剤の配合において使用される。

## 【0149】

有機溶媒が、乳剤、ULV配合物の配合において主に使用され、また、より少ない程度であるが、粒状配合物において使用される。時には、溶媒の混合物が使用される。溶媒の

50

第1の主要な群が、脂肪族パラフィン油、例えば、ケロシン又は精製パラフィンなどである。第2の主要な群、すなわち、最も一般的な群が、芳香族溶媒、例えば、キシレン、並びに、C<sub>9</sub>芳香族溶媒及びC<sub>10</sub>芳香族溶媒のより高分子量の分画物などである。塩素化炭化水素が、配合物が水に乳化されるとき、殺虫剤の結晶化を防止するための共溶媒として有用である。アルコールが時には、溶媒力を増大させるために共溶媒として使用される。

#### 【0150】

増粘剤又はゲル化剤が、液体のレオロジー又は流動特性を改変するために、また、分散された粒子又は液滴の分離及び沈降を防止するために、懸濁高濃度物、エマルジョン剤及びサスポエマルジョン剤の配合において主に使用される。増粘剤、ゲル化剤及び沈降防止剤は一般に、2つのカテゴリーに、すなわち、水不溶性粒状物と、水溶性ポリマーとに分けられる。粘土及びシリカを使用して懸濁高濃度物配合物を製造することが可能である。これらのタイプの物質の例としては、モンモリロナイト（例えば、ベントナイト）、ケイ酸アルミニウムマグネシウム及びアタパルジャイトが挙げられるが、これらに限定されない。水溶性多糖が、長年にわたって増粘剤/ゲル化剤として使用されている。最も一般に使用される多糖のタイプが種子及び海草の天然抽出物であり、又は、セルロースの合成誘導体である。これらのタイプの物質の例としては、グアーゴム、ローカストビーンガム、カラギーナン、アルギン酸塩、メチルセルロース、ナトリウムカルボキシメチルセルロース（SCMC）、ヒドロキシエチルセルロース（HEC）が挙げられるが、これらに限定されない。他のタイプの沈降防止剤が、修飾デンプン、ポリアクリラート、ポリビニルアルコール及びポリエチレンオキシドに基づく。別の良好な沈降防止剤がキサンタンガムである。

#### 【0151】

様々な微生物が、配合された製造物を損なう原因となる。従って、保存剤が、それらの影響を除くために、又は、それらの影響を軽減するために使用される。そのような薬剤の例としては、プロピオン酸及びそのナトリウム塩、ソルビン酸及びそのナトリウム塩又はカリウム塩、安息香酸及びそのナトリウム塩、p-ヒドロキシ安息香酸ナトリウム塩、p-ヒドロキシ安息香酸メチル、並びに、1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン（BIT）が挙げられるが、これらに限定されない。

#### 【0152】

界面活性剤の存在は、界面張力を低下させるが、多くの場合、水系配合物が、製造における混合操作の期間中に、また、スプレータンクからの適用における混合操作の期間中に泡立つことを生じさせる。発泡傾向を軽減するために、消泡剤が多くの場合、製造段階の期間中に、又は、ビンに充填する前に、そのどちらかで加えられる。一般に、2つのタイプの消泡剤が存在する。すなわち、シリコーン系消泡剤と、非シリコーン系消泡剤とが存在する。シリコーン系消泡剤は通常、ジメチルポリシロキサン（シリコーン）の水性エマルジョンであり、一方、非シリコーン系消泡剤は水不溶性オイル（例えば、オクタノール及びノナノールなど）又はシリカである。両方の場合において、消泡剤の機能は、界面活性剤を空気・水の境界から追い出すことである。

#### 【0153】

さらなる情報については、“Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations”（D. A. Knowles 編集、著作権（1998年）：Kluwer Academic Publishers）を参照のこと。“Insecticides in Agriculture and Environment - Retrospects and Prospects”（A. S. Perry、I. Yamamoto、I. Ishaaya及びR. Perry、著作権（1998年）：Springer-Verlag）もまた参照のこと。

#### 【0154】

適用

害虫の場所に適用されるべき殺虫剤の実際の量は重要でなく、当業者によって容易に決定することができる。一般には、1ヘクタールあたり約0.01グラムの殺虫剤から1ヘ

10

20

30

40

50

クターあたり約5000グラムの殺虫剤までの濃度が、良好な駆除をもたらすことが予想される。

【0155】

殺虫剤が適用される場所は、害虫が生息するどのような場所も可能であり、例えば、野菜作物、果樹及び堅果樹、ブドウのツル、観賞植物、家畜、建物の室内面又は屋外面、並びに、建物の周りの土壌が可能である。

【0156】

一般に、餌に関しては、餌が、例えば、シロアリが餌と接触し得る地面に置かれる。餌はまた、例えば、アリ、シロアリ、ゴキブリ及びハエが餌と接触し得る建物の表面（水平表面、垂直表面又は傾斜表面）に適用することができる。

10

【0157】

一部の害虫は、その卵が殺虫剤に抵抗し得る特異な能力を有するので、反復適用が、新たに現れた幼虫を駆除するために望ましい場合がある。

【0158】

植物における殺虫剤の全身移行を、植物の1つの部分における害虫を、殺虫剤をその植物の異なる部分に適用することによって駆除するために利用することができる。例えば、葉を食べる昆虫の駆除を、点滴灌漑又は畦間適用によって、或いは、種子を種まき前に処理することによって管理することができる。種子処理を、特殊化された形質を発現するために遺伝的に形質転換された植物が成長する種子を含めて、すべてのタイプの種子に対して適用することができる。代表的な例としては、無脊椎動物害虫に対して毒性のあるタンパク質及びノ又は二本鎖RNA（例えば、パチルス・チューリングエンシス、Bt Cryトキシン、Bt Vipトキシン、又は、他の殺昆虫性トキシンなど）を発現する種子又は植物、除草剤抵抗性を発現する種子又は植物（例えば、「Roundup Ready」種子など）、或いは、殺昆虫性トキシン、除草剤抵抗性、栄養強化又は何らかの他の有益な形質を発現する「積み重ねられた」外来遺伝子を有する種子又は植物が含まれる。その上、本文書において開示される発明によるそのような種子処理は、ストレスが多い生育条件により良く耐える植物の能力をさらに高めることができる。この結果、より健康で、より元気な植物がもたらされ、このような植物は収穫期においてより大きい収穫量をもたらすことができる。

20

【0159】

本発明が、特殊化された形質（例えば、パチルス・チューリングエンシス、RNAi又は他の殺昆虫性トキシンなど）を発現するために遺伝的に形質転換された植物、除草剤抵抗性を発現する植物、或いは、殺昆虫性トキシン、除草剤抵抗性、栄養強化又は何らかの他の有益な形質を発現する「積み重ねられた」外来遺伝子を有する植物とともに使用されることは容易に明らかであるに違いない。

30

【0160】

本文書において開示される発明は、動物医療部門において、又は、動物飼育の分野（これには、疑いを避けるために、ペット、例えば、ネコ、イヌ及び鳥類が含まれる）において内部寄生虫及び外部寄生虫を駆除するために好適である。本発明による化合物は、この場合、公知である様式で適用され、例えば、錠剤、カプセル、飲料物、顆粒の形態での経口投与、及び、例えば、浸漬、噴霧、浴びせること、スポッティング及び粉散布の形態での皮膚投与、及び、例えば、注射の形態での非経口投与などによって適用される。

40

【0161】

本文書において開示される発明はまた、家畜飼育において、例えば、ウシ、ヒツジ、ブタ、ニワトリ及びガチョウにおいて都合良く用いることができる。好適な配合物が、飲料水又は飼料とともに動物に経口投与される。好適である投薬量及び配合物は動物種に依存する。

【0162】

殺虫剤が使用され得るか、又は、商業的に販売され得る前に、当該殺虫剤は、様々な政府当局（地方、地域、州、国家及び国家間）による長期の評価プロセスを受ける。膨大な

50

データ要求が規制当局によって定められており、製造物登録者によるか、又は、製造物登録者に代わる他者によるデータ作製及びデータ提出によって取り扱われなければならない。その後、これらの政府当局は当該データを検討し、安全であるという決定が結論される場合、可能性のある使用者又は販売者に製造物登録承認を与える。その後、製造物登録が与えられ、かつ、支持される地方において、当該使用者又は販売者は当該殺虫剤を使用又は販売することができる。

【 0 1 6 3 】

本文書における見出しは便宜的なものにすぎず、従って、どのような一部分であれ、その一部分を解釈するために使用してはならない。

## フロントページの続き

- (74)代理人 100104282  
弁理士 鈴木 康仁
- (72)発明者 クラウス, ガリー  
アメリカ合衆国 インディアナ州 46062, ノブレスビル, イースト 146 ストリート  
5069
- (72)発明者 スパークス, トーマス  
アメリカ合衆国 インディアナ州 46140, グリーンフィールド, グリーンヒルズ ロード  
1322
- (72)発明者 マクラウド, カサンドラ  
アメリカ合衆国 インディアナ州 46220, インディアナポリス, ハーバーフォード アベニ  
ュー 6034
- (72)発明者 ブラウン, アネット  
アメリカ合衆国 インディアナ州 46268, インディアナポリス, ショットテリー テラス  
8132
- (72)発明者 シッドル, トーマス  
アメリカ合衆国 インディアナ州 46077, ジオンズビル, サウス 900 イースト 19  
25

審査官 江間 正起

- (56)参考文献 特表2000-516260(JP, A)  
特開2000-050895(JP, A)  
特開平05-043403(JP, A)  
特表2011-514330(JP, A)

## (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07H 15/04 - 15/10  
A01N 25/00 - 25/34  
A01N 43/16  
A01P 7/04  
CAplus/REGISTRY(STN)