

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号  
特許第7536656号  
(P7536656)

(45)発行日 令和6年8月20日(2024.8.20)

(24)登録日 令和6年8月9日(2024.8.9)

(51)国際特許分類	F I
C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04 1 0 6 H
C 0 7 D 487/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04 C S P
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	C 0 7 D 487/04 1 4 4
A 0 1 P 9/00 (2006.01)	C 0 7 D 471/04 1 0 7 E
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 5/00
請求項の数 10 (全148頁) 最終頁に続く	

(21)出願番号	特願2020-568273(P2020-568273)	(73)特許権者	520222106 シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 6 7
(86)(22)出願日	令和1年6月6日(2019.6.6)	(74)代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(65)公表番号	特表2021-527065(P2021-527065 A)	(74)代理人	100103610 弁理士 吉 田 和彦
(43)公表日	令和3年10月11日(2021.10.11)	(74)代理人	100109070 弁理士 須田 洋之
(86)国際出願番号	PCT/EP2019/064795	(74)代理人	100119013 弁理士 山崎 一夫
(87)国際公開番号	WO2019/234158	(74)代理人	100123777 弁理士 市川 さつき
(87)国際公開日	令和1年12月12日(2019.12.12)		
審査請求日	令和4年6月3日(2022.6.3)		
(31)優先権主張番号	201811021198		
(32)優先日	平成30年6月6日(2018.6.6)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)		
(31)優先権主張番号	18191693.3		
(32)優先日	平成30年8月30日(2018.8.30)		
	最終頁に続く		最終頁に続く

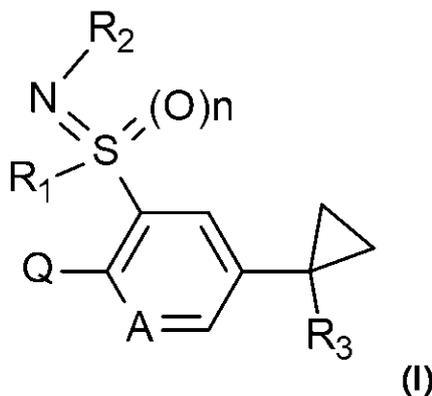
(54)【発明の名称】 スルホキシイミン含有置換基を有する殺有害生物的に活性な複素環式誘導体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(式中、

Aは、CH又はNであり、

R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり、

R<sub>2</sub>は、水素、シアノ、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>8</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又は-CONR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>であり、ここで、

R<sub>7</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルであり、R<sub>8</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；

R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>は、互いに独立して、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

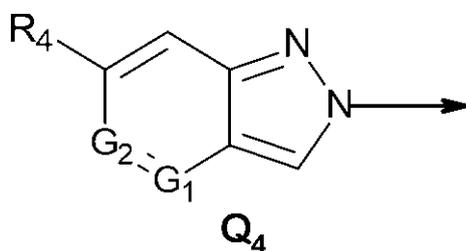
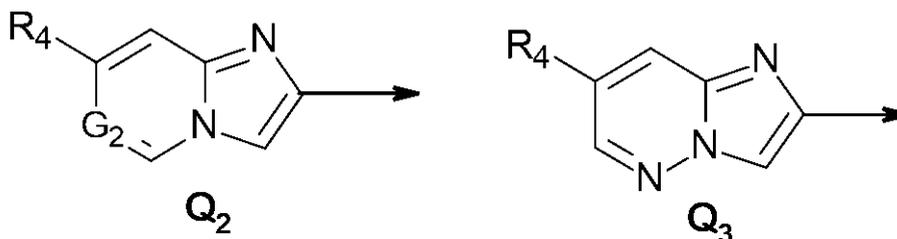
R<sub>11</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキル、シアノ、-CO<sub>2</sub>H、-CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり、

nは、0又は1であり；

Qは、式Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、及びQ<sub>4</sub>

【化2】



(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル、又はトリフルオロメチルスルホニルであり；

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、互いに独立して、N又はCHである)

からなる群から選択される基である)

の化合物又は式Iの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

【請求項2】

Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチル、プロピル又はイソプロピルであり；

R<sub>2</sub>は、水素、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキルカルボニルであり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキル、シアノ、-CO<sub>2</sub>H、-CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり；及び

nは、1である、

請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチルであり；

R<sub>2</sub>は、水素であり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキル、シアノ、-CONH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり；及び

nは、1である、

10

20

30

40

50

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

- A は、C H 又は N であり；
- R<sub>1</sub> は、エチルであり；
- R<sub>2</sub> は、水素であり；
- R<sub>3</sub> は、水素、シアノ又は C O N H<sub>2</sub> であり；及び
- n は、1 である、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

- A は、C H 又は N であり；
- R<sub>1</sub> は、エチルであり；
- R<sub>2</sub> は、水素であり；
- R<sub>3</sub> は、水素又はシアノであり；及び
- n は、1 である、

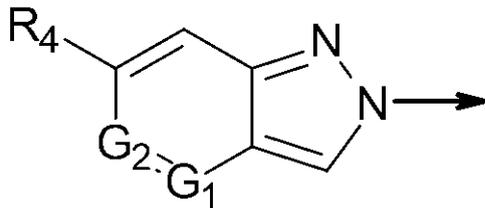
10

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

Q は、Q<sub>4</sub>

【化 1 3】



20

Q<sub>4</sub>

30

(式中、矢印は、前記基 A を組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub> は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；及び

G<sub>1</sub> は N であり、且つ G<sub>2</sub> は C H であるか、G<sub>1</sub> は C H であり、且つ G<sub>2</sub> は N であるか、G<sub>1</sub> 及び G<sub>2</sub> は C H であるか、又は、G<sub>1</sub> 及び G<sub>2</sub> は N であり；好ましくは、G<sub>1</sub> は C H であり、且つ G<sub>2</sub> は N である)

から選択される基である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

[ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 6 - (トリフルオロメチル)ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 7 ) ；

40

[ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 7 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [ 1 , 2 - b ] ピリダジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 1 6 ) ；及び

1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 6 - (トリフルオロメチル)ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 1 7 ) ；

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の式 ( I ) の化合物。

【請求項 8】

50

殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを含み、任意で助剤又は希釈剤を含む、組成物。

【請求項 9】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを適用するか、又は、請求項 8 に記載の組成物を適用する工程を含む方法。

【請求項 10】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられる場所を、請求項 8 に記載の組成物で処理する工程を含む方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、スルホキシミン置換基を含有する殺有害生物的に ( pesti c i d a l l y ) 活性な、特に殺虫的に活性な複素環式誘導体、それらの調製のためのプロセス、それらの化合物を含む組成物及び節足動物、特に昆虫又はダニ目 ( A c a r i n a ) の代表例を含む動物有害生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

硫黄含有置換基を有する殺有害生物的に活性なヘテロ - 二環式置換シクロプロピル誘導体は、公知であり、例えば国際公開第 2018 / 077565号、国際公開第 2018 / 070502号、国際公開第 2017 / 146226号、国際公開第 2017 / 089190号、国際公開第 2017 / 084879号、国際公開第 2016 / 121997号、国際公開第 2016 / 104746号、国際公開第 2016 / 096584号、国際公開第 2016 / 046071号、国際公開第 2016 / 071214号、国際公開第 2016 / 039441号、国際公開第 2016 / 026848号、国際公開第 2016 / 023954号、国際公開第 2014 / 142292号及び国際公開第 2016 / 020286号などの文献に記載されている。殺有害生物的に活性な複素環式スルホキシミン誘導体は、例えば、国際公開第 2015 / 071180号などの文献に以前に記載されている。

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

意外なことに、ここで、特定の新規な二環式スルホキシミン含有置換シクロプロピル誘導体が殺有害生物剤として好ましい特性を有することが見出された。

【0004】

本発明は、従って、式 I

10

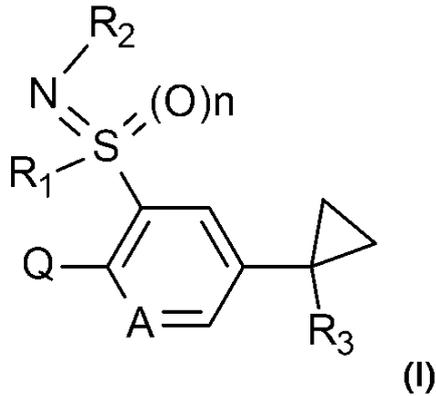
20

30

40

50

## 【化1】



10

(式中、

Aは、CH又はNであり、

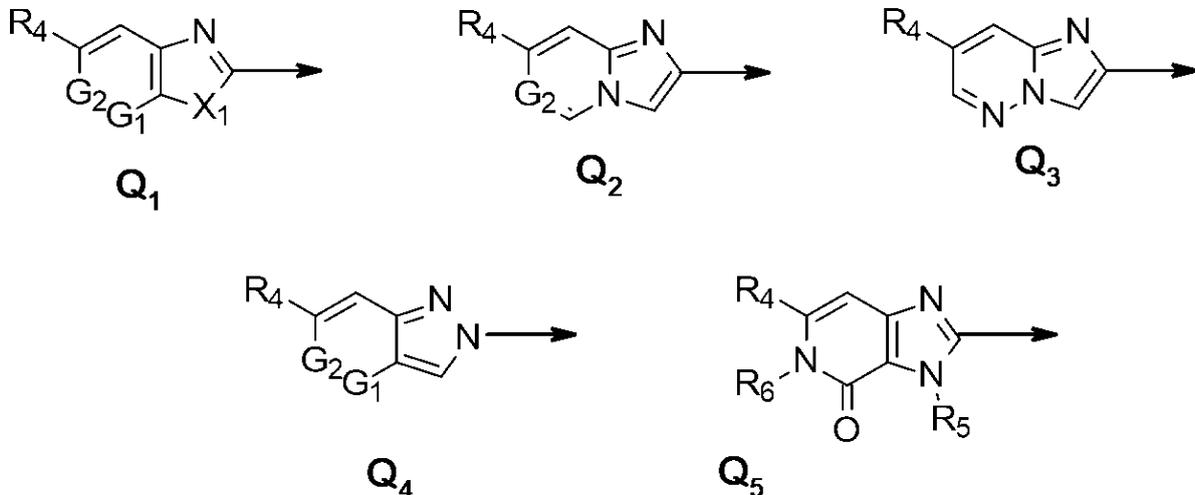
R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり、R<sub>2</sub>は、水素、シアノ、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>8</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又は-CONR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>であり、ここで、R<sub>7</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルであり、及びR<sub>8</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>は、互いに独立して、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sub>11</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキル、シアノ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>

ジアルキルアミノカルボニルであり、

nは、0又は1であり；

Qは、式Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>及びQ<sub>5</sub>

## 【化2】



20

30

40

(式中、矢印は、ラジカルAを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコ

キシであり；

X<sub>1</sub>は、O又はNR<sub>5</sub>であり；R<sub>5</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；

50

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

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、互いに独立して、N又はCHである)

からなる群から選択されるラジカルである)

の化合物又は式Iの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキsidを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0005】

少なくとも1つの塩基性中心(basic centre)を有する式Iの化合物は、例えば、酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉱酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、含硝酸、リン酸又はハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換されるC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和又は不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸又はクエン酸、又は例えば安息香酸との酸付加塩、又は有機スルホン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換されるC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルカン-又はアリールスルホン酸、例えばメタン-又はp-トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式Iの化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩又はマグネシウム塩又はアンモニア又は有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-又はトリ-低級アルキルアミン、例えばエチル-、ジエチル-、トリエチル-又はジメチルプロピルアミン又はモノ-、ジ-又はトリヒドロキシ-低級アルキルアミン、例えばモノ-、ジ-又はトリエタノールアミンを形成することができる。

【0006】

本明細書において用いられる場合、「C<sub>1</sub>~C<sub>n</sub>アルキル」という用語は、1~n個の炭素原子を有する炭素原子のいずれかを介して結合している飽和直鎖又は分岐炭化水素ラジカルであり、例えばメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソ-ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシルなどのラジカルのいずれか1種及びこれらの分岐異性体を指す。例えば、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、n-ヘキシル、n-ペンチル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピルなどのラジカルの1種も挙げる事が可能である。以下に記載のとおり、ハロアルキル、ハロアルキルスルファニル、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシ及びハロアルコキシラジカルは、アルキルラジカルから誘導される。

【0007】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。これは、対応して、ハロアルキルなどの他の意味と組み合わせてハロゲンにも適用される。

【0008】

本明細書において用いられる場合、「C<sub>1</sub>~C<sub>n</sub>ハロアルキル」という用語は、1~n個の炭素原子(上記のとおり)を有する直鎖又は分岐飽和C<sub>1</sub>~C<sub>n</sub>アルキルラジカルを指し、これらのラジカル中の水素原子のいくつか又は全ては、フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素のいずれか1つによって置き換えられ得、すなわち例えば、例としてクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブromoエチル、2-ヨードエチル、2,2

10

20

30

40

50

- ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチル、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2 - フルオロプロピル、3 - フルオロプロピル、2, 2 - ジフルオロプロピル、2, 3 - ジフルオロプロピル、2 - クロロプロピル、3 - クロロプロピル、2, 3 - ジクロロプロピル、2 - プロモプロピル、3 - プロモプロピル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、3, 3, 3 - トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1 - (フルオロメチル) - 2 - フルオロエチル、1 - (クロロメチル) - 2 - クロロエチル、1 - (プロモメチル) - 2 - プロモエチル、4 - フルオロブチル、4 - クロロブチル、4 - プロモブチル、ノナフルオロブチル、1, 1 - ジフルオロ - 2, 2, 2 - トリクロロエチル及び2, 2, 3, 3 - テトラフルオロエチル；好ましくはトリクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル及びジクロロフルオロメチルである。

【0009】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している1 ~ n個の炭素原子（上記のとおり）を有する直鎖又は分岐飽和 $C_1 \sim C_n$ アルキルラジカルを指し、すなわち例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、i - プロポキシ、n - ブトキシ、イソブトキシ、sec - ブトキシ、t - ブトキシ、1 - メチルプロポキシ、2 - メチルプロポキシ及び1, 1 - ジメチルエトキシ並びにまた異性体ペンチルオキシ及びヘキシルオキシラジカル；好ましくはメトキシ及びエトキシなどのラジカルのいずれか1種である。

【0010】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルコキシ」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ アルコキシと同様に、酸素原子を介して結合している1 ~ n個の炭素原子（上記のとおり）を有する直鎖又は分岐飽和 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルラジカルを指す。

【0011】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキルスルファニル」という用語は、硫黄原子を介して結合している1 ~ n個の炭素原子（上記のとおり）を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指し、すなわち例えばメチルチオ、エチルチオ、n - プロピルチオ、1 - メチルエチルチオ、ブチルチオ、1 - メチルプロピルチオ、2 - メチルプロピルチオ又は1, 1 - ジメチルエチルチオのいずれか1種である。

【0012】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルファニル」という用語は、フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により部分的又は完全に置換されている上記の $C_1 \sim C_n$ アルキルスルファニルラジカルを指し、すなわち例えばフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、プロモジフルオロメチルチオ、2 - フルオロエチルチオ、2 - クロロエチルチオ、2 - プロモエチルチオ、2 - ヨードエチルチオ、2, 2 - ジフルオロエチルチオ、2, 2, 2 - トリフルオロエチルチオ、2, 2, 2 - トリクロロエチルチオ、2 - クロロ - 2 - フルオロエチルチオ、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチルチオ、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、2 - フルオロプロピルチオ、3 - フルオロプロピルチオ、2 - クロロプロピルチオ、3 - クロロプロピルチオ、2 - プロモプロピルチオ、3 - プロモプロピルチオ、2, 2 - ジフルオロプロピルチオ、2, 3 - ジフルオロプロピルチオ、2, 3 - ジクロロプロピルチオ、3, 3, 3 - トリフルオロプロピルチオ、3, 3, 3 - トリクロロプロピルチオ、2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロピルチオ、ヘプタフルオロプロピルチオ、1 - (フルオロメチル) - 2 - フルオロエチルチオ、1 - (クロロメチル) - 2 - クロロエチルチオ、1 - (プロモメチル) - 2 - プロモエチルチオ、4 - フルオロブチルチオ、4 - クロロブチルチオ又は4 - プロモブチルチオのいずれか1種である。

【0013】

同様の考察は、 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルファニル（上記のとおり）を指すが、硫黄の

酸化状態が異なり、例えばそれぞれスルホキシド - S ( O ) C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>ハロアルキル又はスルホン - S ( O )<sub>2</sub> C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>ハロアルキルを指す「C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>ハロアルキルスルフィニル」及び「C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>ハロアルキルスルホニル」という用語にも適用される。従って、例えば、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル又は2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルホニルなどの群である。

## 【0014】

本明細書において用いられる場合、「C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキル」という用語は、シクロプロパン、シクロブタン、シクロプロパン、シクロペンタン及びシクロヘキサンなどの3 ~ 6員シクロアルキル基を指す。

## 【0015】

「C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>アルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル基を介して結合している1 ~ n個の炭素原子(上記のとおり)を有する直鎖又は分岐飽和C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>アルコキシラジカルを指す。

## 【0016】

「C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>アルキルアミノカルボニル」という用語は、アミノカルボニル基の窒素原子を介して結合している1 ~ n個の炭素原子(上記のとおり)を有する直鎖又は分岐飽和C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>アルキルラジカルを指す。

## 【0017】

「C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>ジアルキルアミノカルボニル」という用語は、アミノカルボニル基の窒素原子を介して結合している、同一の又は異なる1 ~ n個の炭素原子(上記のとおり)を有する2つの直鎖又は分岐飽和C<sub>1</sub> ~ C<sub>n</sub>アルキルラジカルを指す。

## 【0018】

末端単結合(フリーラジカル)は、所与の分子構造に関連してメチル基を表すか、又は可変要素基の定義に関連して結合点を表す。

## 【0019】

本発明に係る式Iの化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。

## 【0020】

本発明に係る実施形態は、以下に記載されているとおりである。

## 【0021】

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

## 【0022】

実施形態2は、実施形態1に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供し、ここで、

Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチル、プロピル又はイソプロピルであり；

R<sub>2</sub>は、水素、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>ハロアルキルカルボニルであり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>ハロアルキル、シアノ、- CO<sub>2</sub>H、- CO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり；及び

nは、1である。

## 【0023】

実施形態3は、実施形態1に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN - オキシドを提供し、ここで、

Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチルであり；

R<sub>2</sub>は、水素であり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ハロアルキル、シアノ、- CO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり；及び

nは、1である。

10

20

30

40

50

## 【 0 0 2 4 】

実施形態 4 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

A は、C H 又は N であり；

R<sub>1</sub> は、エチルであり；

R<sub>2</sub> は、水素であり；

R<sub>3</sub> は、水素、シアノ又は C O<sub>2</sub> N H<sub>2</sub> であり；及び

n は、1 である。

## 【 0 0 2 5 】

実施形態 5 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

A は、C H 又は N であり；

R<sub>1</sub> は、エチルであり；

R<sub>2</sub> は、水素であり；

R<sub>3</sub> は、水素又はシアノであり；及び

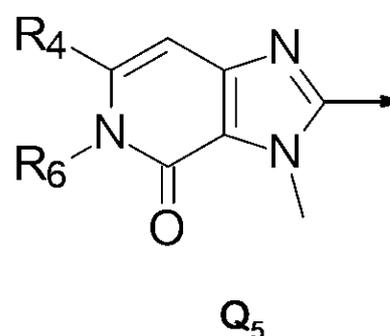
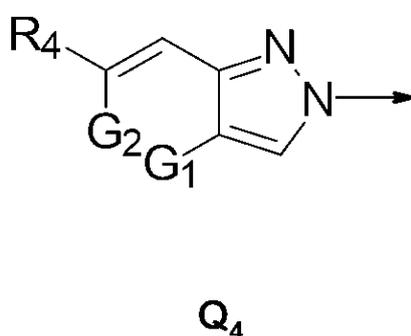
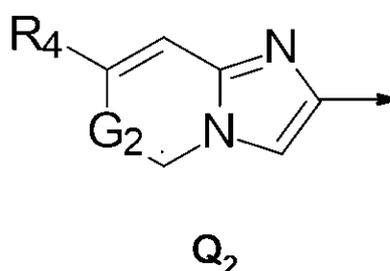
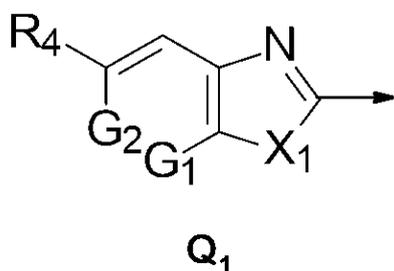
n は、1 である。

## 【 0 0 2 6 】

実施形態 6 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

Q は、Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>4</sub> 及び Q<sub>5</sub>

## 【 化 3 】



( 式中、矢印は、ラジカル A を組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ハロアルキルスルフィニル又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ハロアルキルスルホニルであり；

X<sub>1</sub> は、酸素又は N C H<sub>3</sub> であり；

R<sub>6</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> アルコキシ又はシクロプロピルであり；及び

G<sub>1</sub> 及び G<sub>2</sub> は、互いに独立して、N 又は C H である ) から選択されるラジカルである。

## 【 0 0 2 7 】

10

20

30

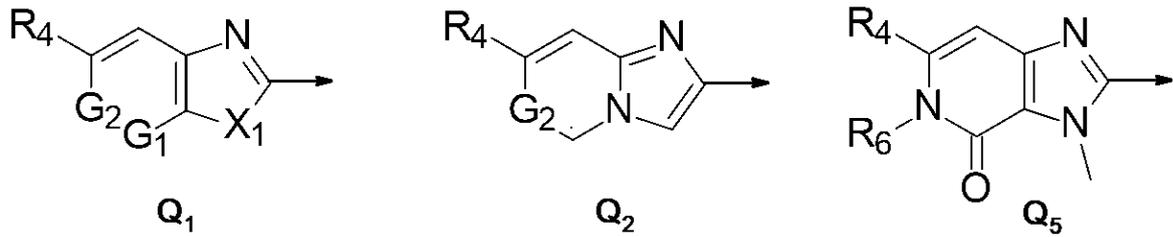
40

50

実施形態 7 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>及び Q<sub>5</sub>

【化 4】



10

(式中、矢印は、ラジカル A を組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>フルオロアルキル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルファニル、ジフルオロメチルスルフィニル又はジフルオロメチルスルホニルであり；

X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；

R<sub>6</sub>は、メチル、エチル、2,2,2-トリフルオロエチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び

G<sub>1</sub>及び G<sub>2</sub>は、互いに独立して、N又は CHである)

から選択されるラジカルである。

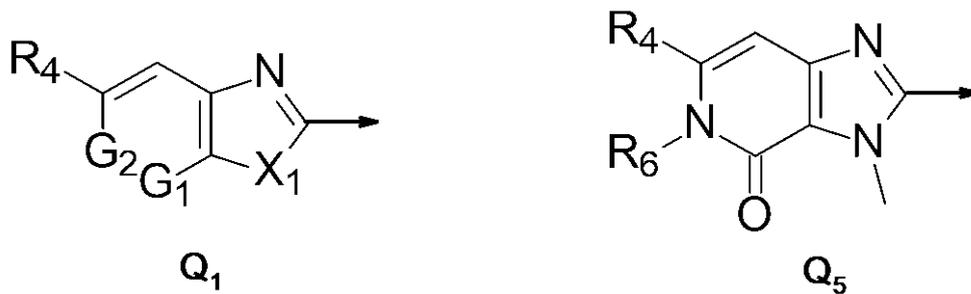
20

【0028】

実施形態 8 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

Q は、Q<sub>1</sub>及び Q<sub>5</sub>

【化 5】



30

(式中、矢印は、ラジカル A を組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；

X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；

R<sub>6</sub>は、エチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び

G<sub>1</sub>は、Nであり、且つ G<sub>2</sub>は、CHであるか、又は G<sub>1</sub>は、CHであり、且つ G<sub>2</sub>は、Nであるか、又は G<sub>1</sub>及び G<sub>2</sub>は、Nであるか、又は G<sub>1</sub>及び G<sub>2</sub>は、CHである)

から選択されるラジカルである。

40

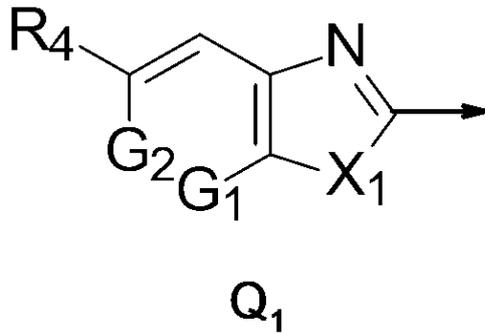
【0029】

実施形態 9 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

Q は、ラジカル Q<sub>1</sub>

50

## 【化6】



10

(式中、矢印は、ラジカルAを組み込んだ環に対する結合点を示し；

$R_4$ は、トリフルオロメチルであり；

$X_1$ は、 $NCH_3$ であり；及び

$G_1$ は、Nであり、且つ $G_2$ は、CHであるか、 $G_1$ は、CHであり、且つ $G_2$ は、Nであるか、又は $G_1$ 及び $G_2$ は、Nである)

である。

## 【0030】

実施形態10は、実施形態1に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドを提供し、ここで、

Aは、CH又はNであり；

$R_1$ は、エチル、プロピル又はイソプロピルであり；

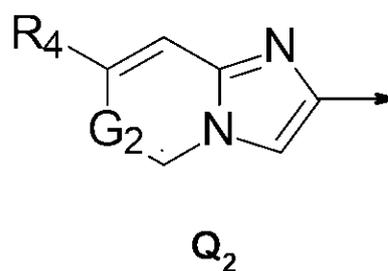
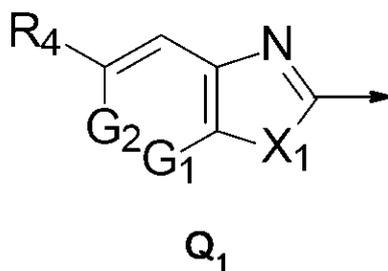
$R_2$ は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルカルボニルであり；

$R_3$ は、水素、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノカルボニルであり；

nは、1であり；

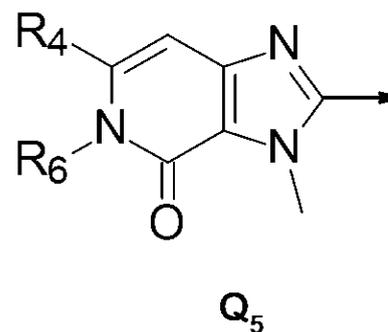
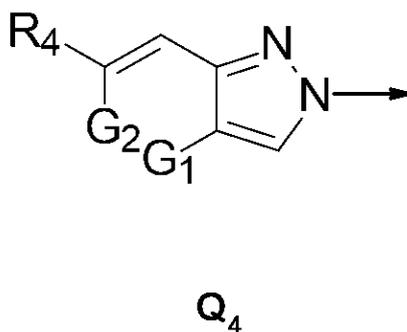
Qは、 $Q_1$ 、 $Q_2$ 、 $Q_4$ 及び $Q_5$

## 【化7】



20

30



40

50

(式中、矢印は、ラジカルAを組み込んだ環に対する結合点を示し；  
 $R_4$ は、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルホニルであり；  
 $X_1$ は、酸素又は $NCH_3$ であり；  
 $R_6$ は、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ又はシクロプロピルであり；及び  
 $G_1$ 及び $G_2$ は、互いに独立して、N又はCHである)  
 から選択されるラジカルである。

## 【0031】

実施形態11は、実施形態1に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキドを提供し、ここで、

Aは、CH又はNであり；

$R_1$ は、エチルであり；

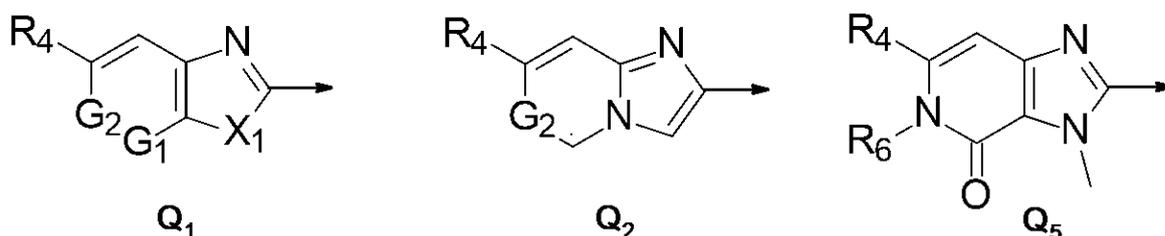
$R_2$ は、水素であり；

$R_3$ は、水素、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、シアノ、 $CO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_2$ ジアルキルアミノカルボニルであり；

nは、1であり；

Qは、 $Q_1$ 、 $Q_2$ 及び $Q_5$

## 【化8】



(式中、矢印は、ラジカルAを組み込んだ環に対する結合点を示し；

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_2$ フルオロアルキル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルファニル、ジフルオロメチルスルフィニル又はジフルオロメチルスルホニルであり；

$X_1$ は、 $NCH_3$ であり；

$R_6$ は、メチル、エチル、2,2,2-トリフルオロエチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び

$G_1$ 及び $G_2$ は、互いに独立して、N又はCHである)

から選択されるラジカルである。

## 【0032】

実施形態12は、実施形態1に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキドを提供し、ここで、

Aは、CH又はNであり；

$R_1$ は、エチルであり；

$R_2$ は、水素であり；

$R_3$ は、水素、シアノ又は $CO_2NH_2$ であり；

nは、1であり；

Qは、 $Q_1$ 及び $Q_5$

10

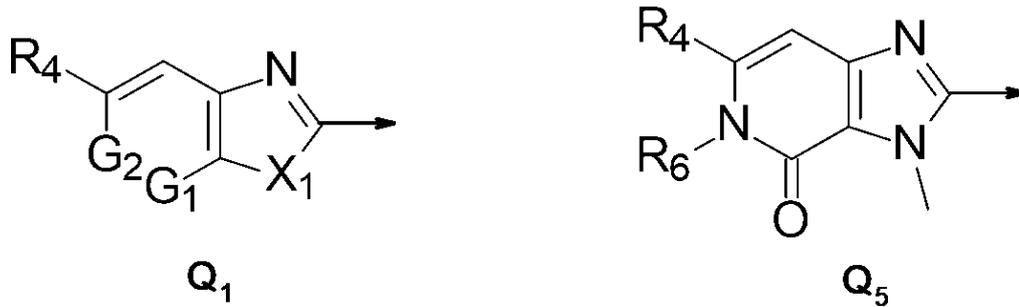
20

30

40

50

## 【化 9】



10

(式中、矢印は、ラジカル A を組み込んだ環に対する結合点を示し；  
 $R_4$  は、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルスルファニル、  
 トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；  
 $X_1$  は、 $NCH_3$  であり；  
 $R_6$  は、エチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び  
 $G_1$  は、N であり、且つ  $G_2$  は、CH であるか、又は  $G_1$  は、CH であり、且つ  $G_2$  は、N で  
 あるか、又は  $G_1$  及び  $G_2$  は、N であるか、又は  $G_1$  及び  $G_2$  は、CH である)  
 から選択されるラジカルである。

## 【0033】

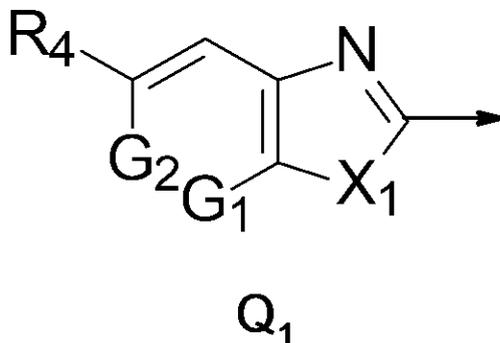
20

実施形態 13 は、実施形態 1 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異  
 性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

A は、CH 又は N であり；  
 $R_1$  は、エチルであり；  
 $R_2$  は、水素であり；  
 $R_3$  は、水素又はシアノであり；  
 $n$  は、1 であり；  
 Q は、ラジカル  $Q_1$

## 【化 10】

30



40

(式中、矢印は、ラジカル A を組み込んだ環に対する結合点を示し；  
 $R_4$  は、トリフルオロメチルであり；  
 $X_1$  は、 $NCH_3$  であり；及び  
 $G_1$  は、N であり、且つ  $G_2$  は、CH であるか、 $G_1$  は、CH であり、且つ  $G_2$  は、N である  
 か、又は  $G_1$  及び  $G_2$  は、N である)  
 である。

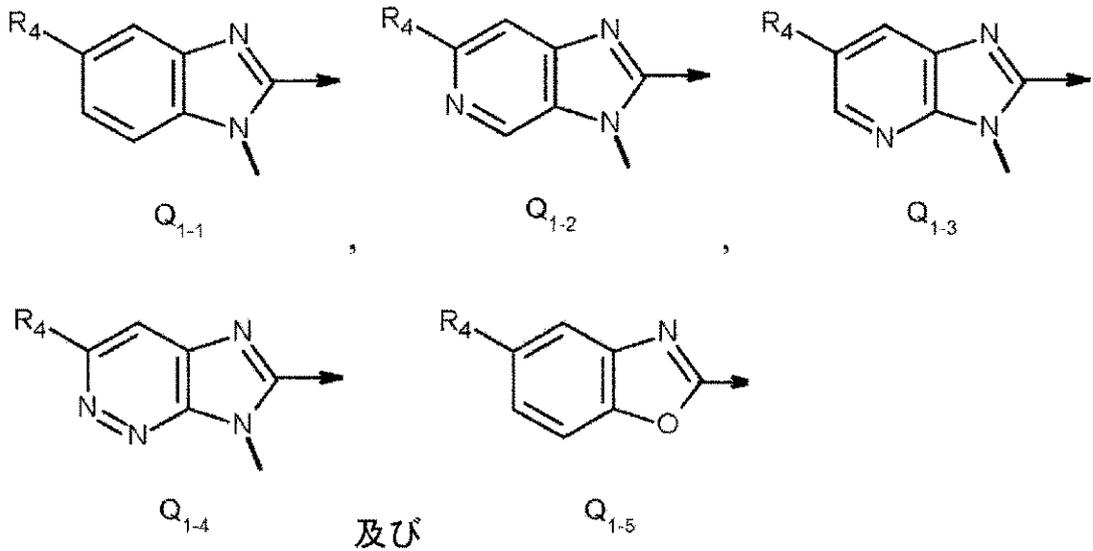
## 【0034】

実施形態 14 は、実施形態 1、2、3、4 又は 5 に係る化合物又はその農芸化学的に許  
 容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、こ  
 こで、

50

Q は、Q<sub>1-1</sub>、Q<sub>1-2</sub>、Q<sub>1-3</sub>、Q<sub>1-4</sub>及びQ<sub>1-5</sub>

【化11】



10

(式中、矢印は、ラジカルAを組み込んだ環に対する結合点を示し；及び

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルである)

20

から選択されるラジカルである。

【0035】

実施形態15は、実施形態14に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキドを提供し、ここで、

Qは、Q<sub>1-2</sub>、Q<sub>1-3</sub>、Q<sub>1-4</sub>及びQ<sub>1-5</sub>から選択されるラジカルである。

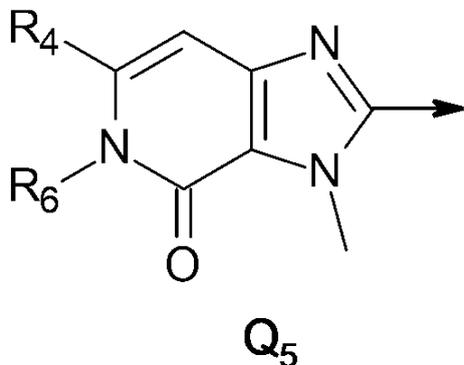
【0036】

実施形態16は、実施形態1、2、3、4又は5に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキドを提供し、ここで、

30

Qは、Q<sub>5</sub>

【化12】



40

(式中、矢印は、ラジカルAを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；及び

R<sub>6</sub>は、OCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はシクロプロピルである)

から選択されるラジカルである。

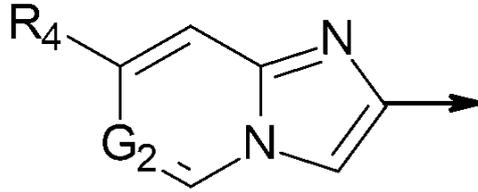
【0037】

50

実施形態 17 は、実施形態 1、2、3、4 又は 5 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

Q は、ラジカル Q<sub>2</sub>

【化 13】



10

Q<sub>2</sub>

(式中、矢印は、ラジカル A を組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；及び

G<sub>2</sub>は N 又は CH である)

である。

【0038】

実施形態 18 は、実施形態 1、2、3、4 又は 5 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

Q は、Q<sub>3</sub> であり；及び

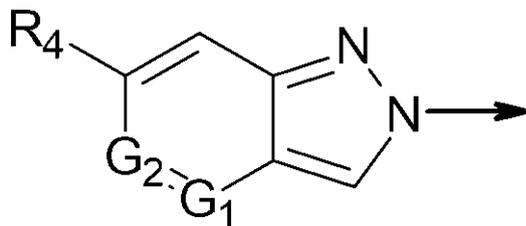
R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルである。

【0039】

実施形態 19 は、実施形態 1、2、3、4 又は 5 に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを提供し、ここで、

Q は、Q<sub>4</sub>

【化 14】



40

Q<sub>4</sub>

(式中、矢印は、ラジカル A を組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルス

50

ルホニルであり；及び

$G_1$ は、Nであり、且つ $G_2$ は、CHであるか、 $G_1$ は、CHであり、且つ $G_2$ は、Nであるか、 $G_1$ 及び $G_2$ は、CHであるか、又は $G_1$ 及び $G_2$ は、Nであり；好ましくは、 $G_1$ は、CHであり、且つ $G_2$ は、Nである）

である。

【0040】

他の態様において、本発明は、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、前述の実施形態1～19のいずれかにおいて定義されている式(I)の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドと、任意選択により助剤又は希釈剤とを含む組成物を提供する。

10

【0041】

さらなる態様において、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法を提供し、これは、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、前述の実施形態1～19のいずれかにおいて定義されている式(I)の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド或いは上記に定義されている組成物を適用するステップを含む。

【0042】

さらなる態様において、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法を提供し、これは、繁殖材料又は繁殖材料が植えられる場所を、上記に定義されている組成物で処理するステップを含む。

20

【0043】

式(I)の化合物を調製するための本発明に係るプロセスは、原理上、当業者に公知の方法によって実施される。 $n$ が0である式Iの化合物のサブグループ、すなわち $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、A及びQが上記に定義されているとおりであるスルフィルイミンIaは、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、A及びQが上記に定義されているとおりである対応する式IIのスルフィドをイミン化反応条件下で反応させることにより調製され得る(ステップA、スキーム1)。 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、A及びQが上記に定義されているとおりであるスルホキシイミンIとして定義される、 $n$ が1である式Iの化合物の特定のサブグループは、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、A及びQが上記に定義されているとおりである式Iaのスルフィルイミン化合物の酸化によって入

30

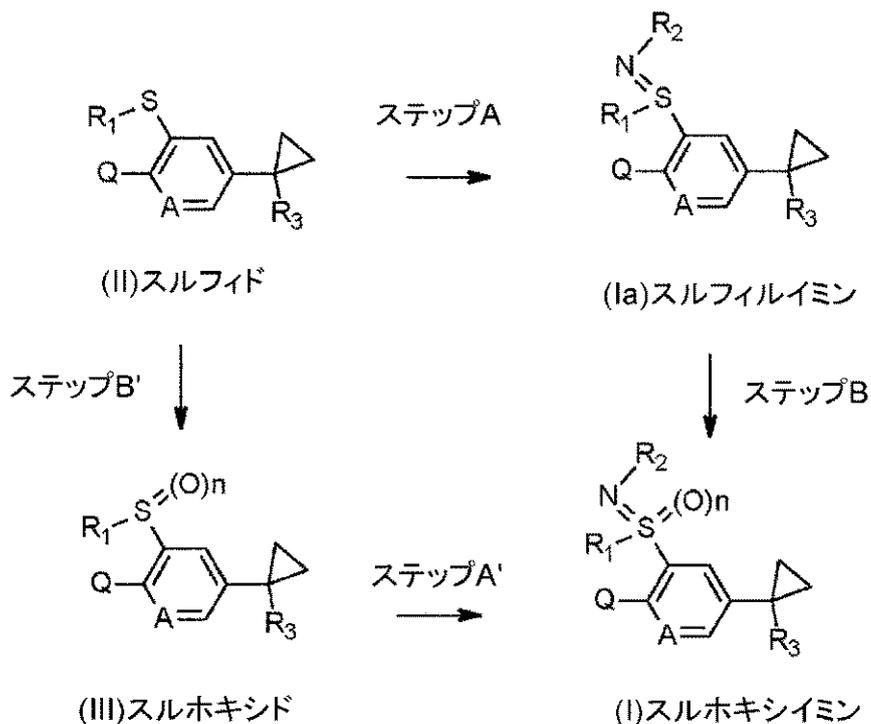
手され得る(ステップB)。

スキーム1

40

50

## 【化15】



10

20

## 【0044】

反対に、2つのステップの順番は、逆であり得、これにより、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ が上記に定義されているとおりである式Iのスルホキシイミン化合物は、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ が上記に定義されているとおりである式IIIのスルホキシドから適切なイミン化反応条件下で調製され得る(ステップA')。

## 【0045】

式Iの化合物を得るための典型的な調製方法及び反応条件(スルフィルイミンIa(ステップA)又はスルホキシイミンI(ステップA')に向かうもののいずれか)は、例えば、*H. Okamura, C. Bolm, Org. Lett., 2004, 6, 1305-1307*; *H. Okamura, C. Bolm, Chem. Lett., 2004, 33, 482-487*; *D. Leca, K. Song, M. Amatore, L. Fensterbank, E. Lacote, M. Malacria, Chem. Eur. J., 2004, 10, 906-916*; 又は *M. Reggelin, C. Zur, Synthesis, 2000, 1-64*において見出され得る。典型的なイミン化試薬/条件は、 $R_2-N_3/FeCl_2$ 、 $R_2-NH_2/Fe(acac)_3/PhI=O$ 、 $PhI=N-R_2/Fe(OTf)_2$ 、 $PhI=N-R_2/CuOTf$ 、 $PhI=N-R_2/Cu(OTf)_2$ 、 $PhI=N-R_2/CuPF_6$ 、 $PhI(OAc)_2/R_2-NH_2/MgO/Rh_2(OAc)_4$ 若しくはオキサジリジン(例えば、3-(4-シアノ-フェニル)-オキサジリジン-2-カルボン酸t-ブチルエステル)などの $NaN_3/H_2SO_4$ 、O-メシチレンスルホニル-ヒドロキシルアミン(MSH)又は金属-触媒法[*O. G. Mancheno, C. Bolm, Chem. Eur. J., 2007, 13, 6674-6681*を参照されたい]として定義され得る。

30

40

## 【0046】

式Iaのスルフィルイミン(ステップA)及び/又は式Iのスルホキシイミン(ステップA')を調製するための、式IIIのスルフィド及び/又は式IIIのスルホキシドのメタルフリーでのイミン化法が特に注目される。このようなイミン化反応には、*G. Y. Cho, C. Bolm, Tetrahedron Lett., 2005, 46, 8007-8008*に記載されているとおり、 $R_2-NH_2$ 及び酸化剤、例えば $PhI(OAc)_2/R$

50

$2-NH_2$ が用いられるか；又はC. Bolm et al., Synthesis, 2010, No 17, 2922 - 2925に記載されているとおり、N-プロモスクシイミド(NBS)/ $R_2-NH_2$ 及びナトリウム若しくはカリウムt-ブトキシドなどの塩基が用いられる。N-ヨードスクシイミド(NIS)又はヨウ素などの酸化剤も、例えば、O. G. Mancheno, C. Bolm, Org. Lett. 2007, 9, 3809 - 3811において記載されているとおりに代わりに用いられ得る。次亜塩素酸ナトリウムNaOCl又はカルシウム次亜塩素酸 $Ca(OCl)_2$ などの酸化剤として用いられる次亜塩素酸塩の一例は、国際公開第2008/106006号に記載されている。

## 【0047】

スルフィリミンIaのスルホキシイミンI(ステップB)への変換については、例えば、KMnO<sub>4</sub>、NaMnO<sub>4</sub>、mCPBA、NaIO<sub>4</sub>/RuO<sub>2</sub>、NaIO<sub>4</sub>/RuCl<sub>3</sub>、H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>、オキソンなどの古典的な酸化試薬が含まれ得る。特に、過ヨウ素酸アルカリ金属と組み合わせたルテニウム塩の使用又は過マンガン酸アルカリ金属の使用は、国際公開第2008/097235号及び国際公開第2008/106006号に記載されている。

10

## 【0048】

このようなそれぞれ式Ia及びIのスルフィリミン及び/又はスルホキシイミン化合物の合成に有用な詳細な調製条件は、例えば、国際公開第2006/061200号又は国際公開第2007/080131号にも記載されている。

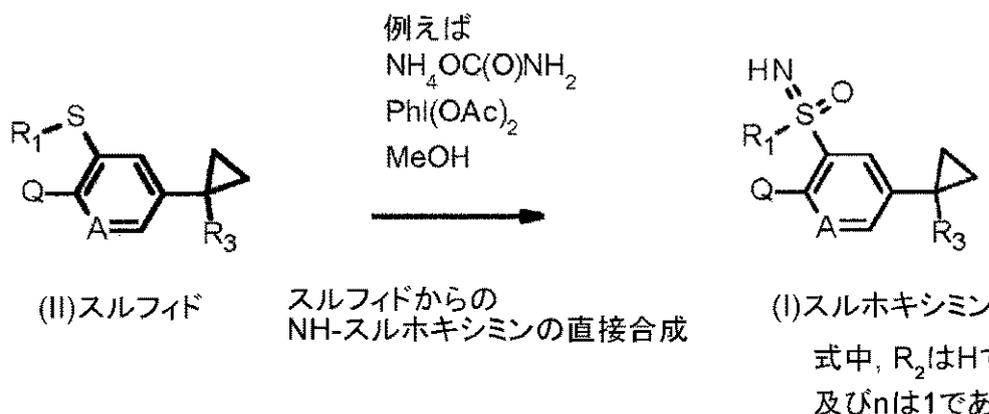
## 【0049】

代わりに、 $R_2$ が水素であり、及びnが1であり、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQが式Iにおいて定義されているとおりである式Iを含むスルホキシイミン化合物のサブグループは、

20

スキーム1a

## 【化16】



30

$R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQが式Iにおいて定義されているとおりである式IIのスルフィド化合物を、例えばアンモニア、アンモニウムカルバメート又は酢酸アンモニウム(好ましくはアンモニウムカルバメート)などの好適な窒素供給源と、ジアセトキシヨードベンゼンなどの超原子価ヨウ素試薬の存在下において、トルエン、アセトニトリル又はメタノールなどの溶剤中、0~100の温度、好ましくは略室温において、例えばChem. Commun. 53, 348 - 351; 2017(及びその中で引用されている文献)において見出される記載と同様に反応させることにより調製可能である(スキーム1a)。

40

## 【0050】

式Ibの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、nは、1であり、及び $R_2$ は、CNである)は、例えば、O. G. Mancheno, C. Bolm, Org. Lett. 2007, 9, 3809 - 3811に記載されているとおり、ジクロロメタンなどの溶剤中におけるトリフルオロ酢酸無水物による処理により、式Icの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、nは、1であり、及び $R_2$ は、 $C(O)CF_3$ である)に変換され得る。式Icの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、nは、1であり、

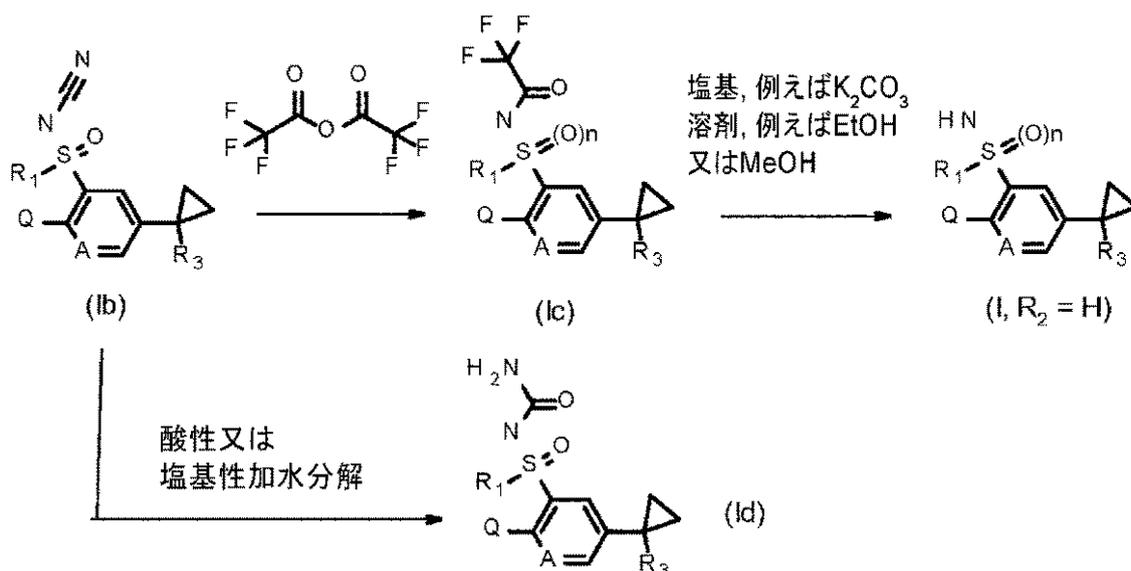
50

及び $R_2$ は、 $C(O)CF_3$ である)は、例えば、H. Okamura, C. Bolm, Org. Lett. 2004, 6, 1305-1307に記載されているとおり、メタノール又はエタノールなどの極性プロトン性溶剤中における炭酸ナトリウム又は炭酸カリウムなどの塩基による処理により、式Iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、水素である)に変換され得る。式Idの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、 $C(O)NH_2$ である)は、例えば、国際公開第09/111309号に記載されているとおり、アセトニトリルなどの有機溶剤中において、濃硫酸などの強酸による処理により、式Ibの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、CNである)から調製され得る。化学の概要をスキーム2に示す。

10

スキーム2

【化17】



20

30

【0051】

式Ieの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである)は、式LG- $R_2$ のアルキル化剤(ここで、LGは、ハロゲン(特に臭素又はヨウ素)、スルホネート $OSO_2R_{12}$ (特にメシレート又はトシレート)(ここで、 $R_{12}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、又はニトロ若しくは $C_1 \sim C_3$ アルキルにより任意選択により置換されたフェニル、又は硫酸塩(硫酸ジメチルなど)である)などの脱離基である)による処理により、好ましくは例えば炭酸ナトリウム又は炭酸カリウムなどのアルカリ金属炭酸塩、又は水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、又は水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物などの好適な塩基の存在下において、不活性溶剤中、 $-20 \sim 150$ 、好ましくは $0 \sim 80$ の温度で式Iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、水素である)から調製され得る。用いられる溶剤の例としては、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル(1,2-ジメトキシエタン)、*t*-ブチルメチルエーテル及び1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエン及びキシレンなどの芳香族炭化水素、アセトニトリルなどのニトリル又はN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセタミド、N-メチル-2-ピロリドン若しくはジメチルスルホキッドなどの極性非プロトン性溶剤が挙げられる。

40

【0052】

式Ifの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり

50

、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、 $C(O)R_7$ であり、及び $R_7$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである)は、任意選択により、4-ジメチルアミノピリジン(DMAP)などのアシル化触媒の存在下、好ましくはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン又はピリジンなどの塩基の存在下において、不活性溶剤中、 $0 \sim 50$ の温度における式 $LG_1 - C(O)R_7$ の試薬又は式 $R_7C(O) - O - C(O)R_7$ の無水物試薬(ここで、 $R_7$ は、上記に定義されているとおりであり、及び $LG_1$ は、ハロゲン(特に塩素)などの脱離基である)による処理により、式Iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ は、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、水素である)から調製され得る。使用される溶媒の例としては、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル及び1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエン及びキシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロロメタン及びクロロホルムなどのハロゲン化炭化水素、アセトニトリルなどのニトリル又は $N, N$ -ジメチルホルムアミド、 $N, N$ -ジメチルアセトアミド、 $N$ -メチル-2-ピロリドン又はジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶媒が挙げられる。この反応は、溶剤又は希釈剤としても作用し得る過剰量の塩基の存在下でも実施され得る。

10

## 【0053】

式I gの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ は、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、 $C(O)OR_8$ であり、及び $R_8$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである)は、任意選択により、4-ジメチルアミノピリジン(DMAP)などのアシル化触媒の存在下、好ましくはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン又はピリジンなどの塩基の存在下において、不活性溶剤中、 $0 \sim 50$ の温度における式 $LG_2 - C(O)OR_8$ の試薬(ここで、 $R_8$ は、上記に定義されているとおりであり、及び $LG_2$ は、ハロゲン(特に塩素)などの脱離基である)による処理により、式Iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ は、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、水素である)から調製され得る。用いられる溶剤の例としては、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、t-ブチルメチルエーテル及び1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエン及びキシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロロメタン及びクロロホルムなどのハロゲン化炭化水素、アセトニトリルなどのニトリル又は $N, N$ -ジメチルホルムアミド、 $N, N$ -ジメチルアセタミド、 $N$ -メチル-2-ピロリドン若しくはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶剤が挙げられる。この反応は、溶剤又は希釈剤としても作用し得る過剰量の塩基の存在下でも実施され得る。

20

30

## 【0054】

式I hの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ は、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、 $CONR_9R_{10}$ であり、及び $R_9$ 、 $R_{10}$ は、互いに独立して、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)は、任意選択により、4-ジメチルアミノピリジン(DMAP)などのアシル化触媒の存在下、好ましくはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン又はピリジンなどの塩基の存在下において、不活性溶剤中、 $0 \sim 50$ の温度における式 $LG_3 - C(O)NR_9R_{10}$ の試薬(ここで、 $R_9$ 及び $R_{10}$ は、上記に定義されているとおりであり、及び $LG_3$ は、ハロゲン(特に塩素)などの脱離基である)による処理により、式Iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ は、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、水素である)から調製され得る。用いられる溶剤の例としては、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、t-ブチルメチルエーテル及び1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエン及びキシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロロメタン及びクロロホルムなどのハロゲン化炭化水素、アセトニトリルなどのニトリル又は $N, N$ -ジメチルホルムアミド、 $N, N$ -ジメチルアセタミド、 $N$ -メチル-2-ピロリドン若しくはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶剤が挙げられる。この反応は、溶剤又は希釈剤としても作用し得る過剰量の塩基の存在下でも実施され得る。

40

## 【0055】

式I iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $A$ 及び $Q$ は、上記に定義されているとおりであり

50

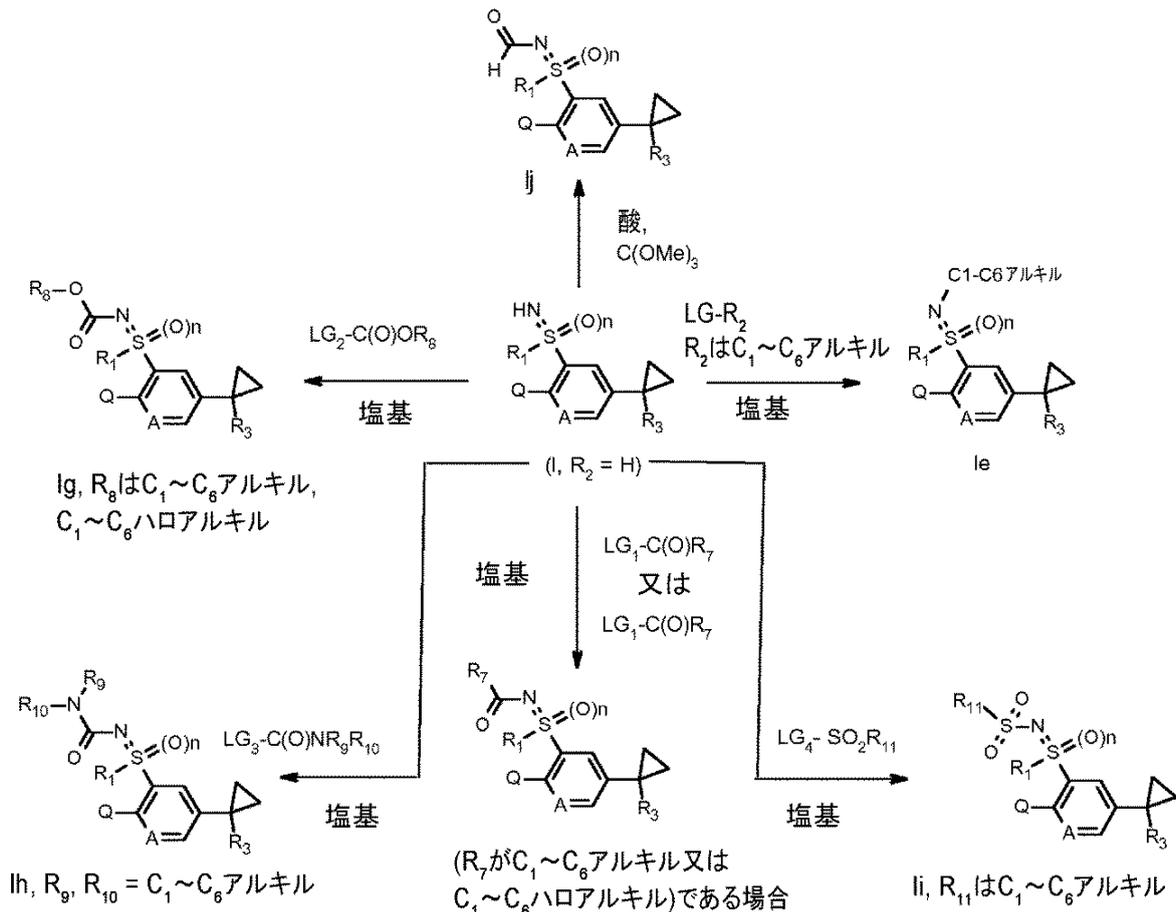
、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、 $SO_2R_{11}$ であり、及び $R_{11}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである)は、任意選択により、4-ジメチル-アミノピリジン(DMAP)などのアシル化触媒の存在下、好ましくはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン又はピリジンなどの塩基の存在下において、不活性溶剤中、 $0 \sim 50$  の温度における式LG4-SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>の試薬(ここで、 $R_{11}$ は、上記に定義されているとおりであり、及びLG4は、ハロゲン(特に塩素)などの脱離基である)による処理により、式Iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、水素である)から調製され得る。使用される溶媒の例としては、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル及び1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエン及びキシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロロメタン及びクロロホルムなどのハロゲン化炭化水素、アセトニトリルなどのニトリル又はN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン又はジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶媒が挙げられる。この反応は、溶剤又は希釈剤としても作用し得る過剰量の塩基の存在下でも実施され得る。式I<sub>j</sub>の化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、 $R_2$ は、 $C(O)R_7$ であり、及び $R_7$ は、水素である)は、任意選択により、p-トルエンサルホン酸などの酸活性化剤の存在下、任意選択により不活性有機溶剤の存在下において、 $0 \sim 180$  の温度におけるトリメチルオルトギ酸エステルなどのトリアルキルオルトギ酸エステルによる処理により、式Iの化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、A及びQは、上記に定義されているとおりであり、 $n$ は、1であり、及び $R_2$ は、水素である)から調製され得る。この反応は、溶剤又は希釈剤としても作用し得る過剰量のトリアルキルオルトギ酸エステルの存在下でも実施され得る。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2006/037945号において例示される。上記の変換をスキーム3において例示する。

10

20

スキーム3

【化18】



30

40

50

## 【 0 0 5 6 】

R<sub>3</sub>が水素である式 I I の化合物は、いくつかの場合に公知であり、例えば以下のものがある：2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( トリフルオロメトキシ ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール、CAS [ 2 1 2 8 7 0 5 - 9 9 - 5 ]、国際公開第 2 0 1 7 1 4 6 2 2 6 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( ジフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール、CAS [ 2 1 2 8 7 0 6 - 0 6 - 7 ]、国際公開第 2 0 1 7 1 4 6 2 2 6 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( ジフルオロメトキシ ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール、CAS [ 2 1 2 8 7 0 6 - 0 1 - 2 ]、国際公開第 2 0 1 7 1 4 6 2 2 6 号；5 - シクロプロピル - 2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 4 - オン、CAS [ 2 0 9 8 6 9 9 - 6 3 - 7 ]、国際公開第 2 0 1 7 0 8 9 1 9 0 号；5 - シクロプロピル - 2 - ( 4 - シクロプロピル - 2 - エチルスルファニル - フェニル ) - 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 4 - オン、CAS [ 2 0 9 8 6 9 9 - 8 0 - 8 ]、国際公開第 2 0 1 7 0 8 9 1 9 0 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール、CAS [ 1 9 7 5 1 4 7 - 9 7 - 7 ]、国際公開第 2 0 1 6 1 2 1 9 9 7 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール、CAS [ 1 9 7 5 1 4 7 - 9 4 - 4 ]、国際公開第 2 0 1 7 1 4 6 2 2 6 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 1 - メチル - 5 - ( トリフルオロメチル ) ベンズイミダゾール、CAS [ 1 9 7 5 1 4 7 - 9 1 - 1 ]、国際公開第 2 0 1 6 1 2 1 9 9 7 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) オキサゾ [ 5 , 4 - b ] ピリジン、CAS [ 1 9 7 5 1 4 7 - 8 7 - 5 ]、国際公開第 2 0 1 6 1 2 1 9 9 7 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 3 - メチル - 6 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン、CAS [ 1 9 7 5 1 4 7 - 8 5 - 3 ]、国際公開第 2 0 1 6 1 2 1 9 9 7 号；6 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 7 - メチル - 3 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン、CAS [ 1 9 5 7 1 6 8 - 9 9 - 8 ]、国際公開第 2 0 1 6 1 0 4 7 4 6 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン、CAS [ 1 9 5 1 4 1 6 - 8 9 - 9 ]、国際公開第 2 0 1 6 0 9 6 5 8 4 号；2 - ( 4 - シクロプロピル - 2 - エチルスルファニル - フェニル ) - 7 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン、CAS [ 1 9 2 3 7 8 5 - 4 1 - 4 ]、国際公開第 2 0 1 6 0 7 1 2 1 4 号；2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 7 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - c ] ピリミジン、CAS [ 1 9 2 3 7 8 4 - 3 6 - 4 ]、国際公開第 2 0 1 6 0 7 1 2 1 4 号；2 - ( 4 - シクロプロピル - 2 - エチルスルファニル - フェニル ) - 5 - エチル - 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 4 - オン、CAS [ 1 8 7 9 0 5 1 - 8 9 - 4 ]、国際公開第 2 0 1 6 0 2 3 9 5 4 号；2 - ( 4 - シクロプロピル - 2 - エチルスルファニル - フェニル ) - 3 , 5 - ジメチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 4 - オン、CAS [ 1 8 7 9 0 5 1 - 8 8 - 3 ]、国際公開第 2 0 1 6 0 2 3 9 5 4 号。

## 【 0 0 5 7 】

R<sub>3</sub>がHである式 I I の化合物、すなわち式 I I a

10

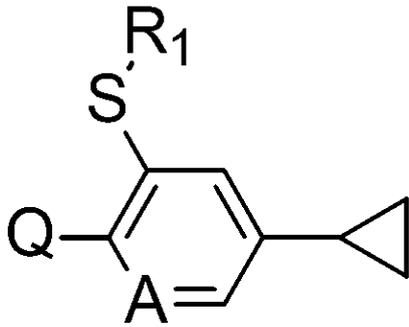
20

30

40

50

【化19】

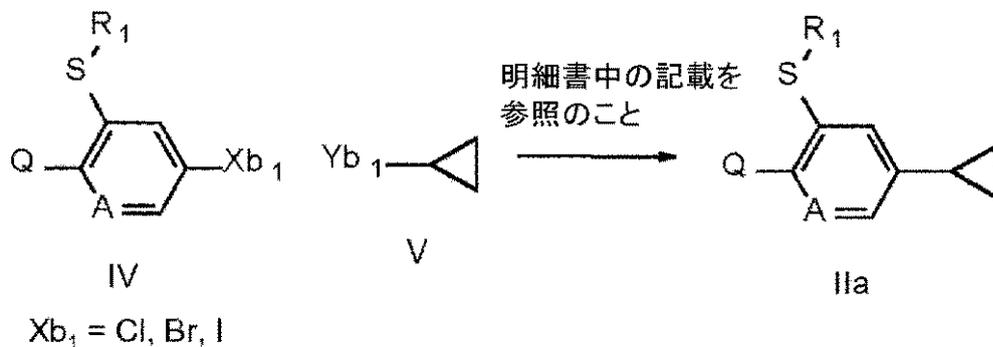


IIa

の化合物は、一般に、スキーム4において示されているとおり、式IVの化合物（ここで、A、Q及びR<sub>1</sub>は、式Iにおいて上記において定義されているとおりである）と式Vの化合物との反応により調製可能である。

スキーム4

【化20】



【0058】

より具体的には、式IIaの化合物は、（スキーム4において記載のとおり）式IIaの化合物と、式Vの化合物（ここで、X<sub>b1</sub>は、ハロゲン、好ましくは塩素、臭素又はヨウ素であり得、及びY<sub>b1</sub>は、例えば、B(OH)<sub>2</sub>などのホウ素由来の官能基又は例えばボロン酸ピナコールエステルなどのB(OR<sub>b1</sub>)<sub>2</sub>（ここで、R<sub>b1</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基であり得るか、又は2つのOR<sub>b1</sub>基は、ホウ素原子と一緒になって5員又は6員環を形成し得る）であり得る）とを反応させることにより調製可能である（スズキクロスカップリング、例えばTetrahedron Letters, 43(39), 6987-6990; 2002を参照されたい）。式IIaにおいて、A、R<sub>1</sub>及びQは、式Iにおいて記載されているとおりである。この反応は、パラジウム系触媒、例えばテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム(0)、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム(II)ジクロリド、クロロ（2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ピフェニル）[2-(2'-アミノ-1, 1'-ピフェニル)]パラジウム(II)（XPhosパラダサイクル）、（1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）-フェロセン）ジクロロパラジウム-ジクロロメタン（1:1錯体）又は酢酸パラジウム+ホスフィンリガンド（例えば、トリフェニルホスフィン又はトリシクロヘキシルホスフィンなど）により、炭酸ナトリウム、リン酸三カリウム又はフッ化セシウムのような塩基の存在下において、溶剤（トルエン、1, 2-ジメトキシ-エタンDME、テトラヒドロフラ

ン又はジオキサンなど)中又は例えば1, 2 - ジメトキシエタン (又はジオキサン、トルエン若しくはテトラヒドロフラン)と水との混合物のような溶剤混合物中、好ましくは不活性雰囲気下で触媒され得る。反応温度は、好ましくは、周囲温度 ~ 反応混合物の沸点の範囲であり得るか、又は代わりに、加熱は、マイクロ波の照射下で行われ得る。

## 【0059】

代わりに、式IVの化合物(ここで、 $X_{b1}$ は、ハロゲン、好ましくは塩素、臭素又はヨウ素であり得る)を式Vの化合物(ここで、 $Y_{b1}$ は、 $-MgBr$ などのハロゲン化マグネシウム基(クマダクロスカップリング)である)と任意選択によりハロゲン化亜鉛などの添加剤の存在下で反応させ得る(Journal of Organic Chemistry, 75(19), 6677-6680; 2010)。この反応は、パラジウム系触媒

10

## 【0060】

例えば、Synthetic Communications, 28(2), 225-232; 1998において例示されているとおり、式IVの化合物と式Vの化合物(ここで、 $Y_{b1}$ は、 $-ZnBr$ などのハロゲン化亜鉛基である(ネギシクロスカップリング))との反応も公知である。この反応は、例えば、(1, 1' - ビス(ジフェニルホスフィノ) - フェロセン)ジクロロパラジウムPd(dppf)Cl<sub>2</sub>又はビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリドを含有するパラジウム系触媒により、任意選択によりホスフィン添加剤(例えば、2 - ジシクロヘキシル - ホスフィノ - 2', 6' - ジメトキシ - ビフェニルS - PHOSなど)の存在下において、例えば1, 2 - ジメトキシエタン、ジオキサン、トルエン又はテトラヒドロフランのような溶剤中、好ましくは不活性雰囲気下で触媒され得る。反応温度は、好ましくは、周囲温度 ~ 反応混合物の沸点の範囲であり得る。

20

## 【0061】

R<sub>3</sub>がシアノである式IIの化合物は、いくつかの場合に公知であり、例えば以下のものである: 1 - [5 - エチルスルファニル - 6 - [5 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル、CAS[2225113 - 68 - 6]、国際公開第2018/077565号; 1 - [3 - エチルスルファニル - 4 - [5 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン - 2 - イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル、CAS[CAS[2225113 - 73 - 3]、国際公開第2018/077565号; 1 - [4 - [5 - シクロプロピル - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン - 2 - イル] - 3 - エチルスルファニル - フェニル]シクロプロパンカルボニトリル、CAS[2098699 - 74 - 0]、国際公開第2017/089190号; 1 - [6 - [5 - シクロプロピル - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン - 2 - イル] - 5 - エチルスルファニル - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル、CAS[2098699 - 59 - 1]、国際公開第2017/089190号; 1 - [5 - エチルスルファニル - 6 - [5 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 1, 3 - ベンゾキサゾール - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル、CAS[1975148 - 53 - 8]、国際公開第2016/121997号; 1 - [3 - エチルスルファニル - 4 - [7 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[1, 2 - c]ピリミジン - 2 - イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル、CAS[1923785 - 47 - 0]、国際公開第2016/071214号; 1 - [5 - エチルスルファニル - 6 - [7 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[1, 2 - c]ピリミジン - 2 - イル] - 3 - ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル、CAS[1923784 - 42 - 2]、国際公開第2016/071214号。

30

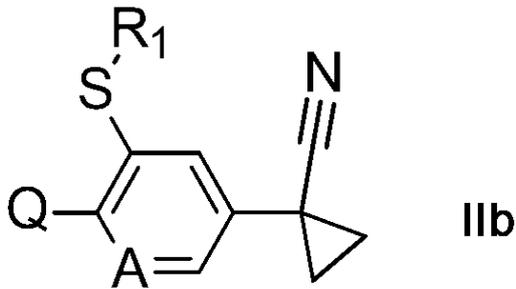
40

## 【0062】

R<sub>3</sub>がシアノであり、及びR<sub>1</sub>、A及びQが式Iにおいて定義されているとおりである他

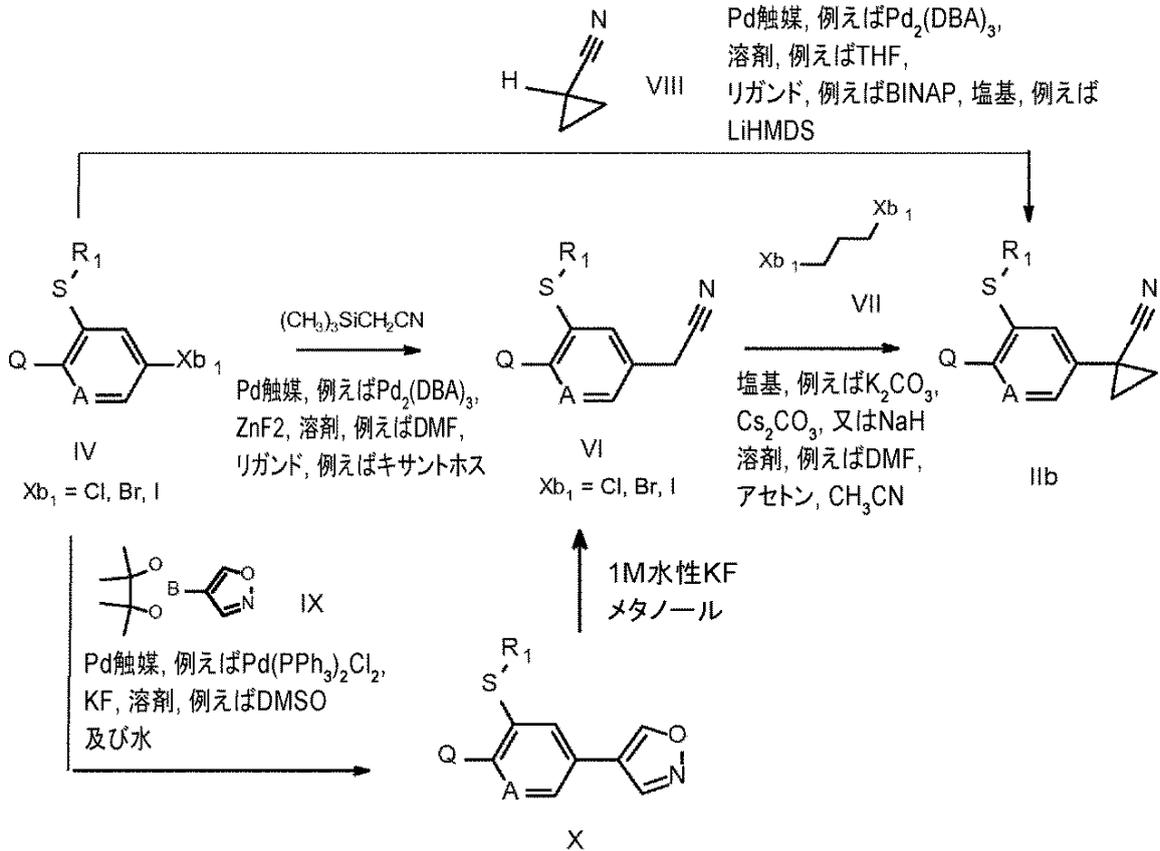
50

の式 I I の化合物、すなわち式 I I b  
【化 2 1】



10

の化合物は、スキーム 5 :  
スキーム 5  
【化 2 2】



20

30

に示されているとおり調製可能である。

40

【0063】

スキーム 5 において示されているとおり、亜鉛 ( I I ) フッ化物及びトリス ( ジベンジリデンアセトン ) ジパラジウム ( 0 ) - クロロホルム付加物 ( Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub> ) などのパラジウム ( 0 ) 触媒、例えばキサントホスなどのリガンドの存在下において、DMF などの不活性溶剤中、100 ~ 160 の温度、任意選択によりマイクロ波による加熱下におけるトリメチルシリル - アセトニトリル TMS-CN による式 I V の化合物 ( ここで、R<sub>1</sub>、Q 及び A は、式 I に記載されているとおりであり、及び Xb<sub>1</sub> は、好ましくは、ハロゲン ( さらに好ましくは塩素、臭素又はヨウ素 ) である ) の処理で式 V I の化合物がもたらされる。このような化学は、例えば、Org. Lett., 16 ( 24 ), 6314 - 6317 ; 2014 などの文献に記載されている。式 I V の化合物を、水素化ナトリウム

50

、 $K_2CO_3$ 又は $Cs_2CO_3$ などの塩基の存在下、DMF、アセトン又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中において、 $Xb_1$ が上記のとおりである式VIIの化合物で処理することで式IIbの化合物を得ることが可能である。代わりに、式IIbの化合物は、 $Pd_2(dba)_3$ 、BINAPなどのリガンド、LiHMDSなどの強塩基を伴う、THFなどの不活性溶剤中、40～70の温度における式VIIの化合物による処理により、式IVの化合物から直接調製可能である。このような化学は、例えば、*J. Am. Chem. Soc.*, 127(45), 15824-15832; 2005に記載されている。

【0064】

式IIbの化合物への他のプロセスは、フッ化カリウムKF及びビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド $Pd(PPh_3)_2Cl_2$ などのパラジウム触媒の存在下において、任意選択により水との混合物であるジメチルスルホキシドDMSOなどの不活性溶剤中、40～150の温度、任意選択によりマイクロ波による加熱下における式IVの化合物(ここで、A、 $R_1$ 及びQは、式Iにおいて記載されているとおりであり、及び $Xb_1$ は、ハロゲン、好ましくは塩素、臭素、ヨウ素である)と、4-イソキサゾールボロン酸又は4-イソキサゾールボロン酸ピナコールエステル(式IXの化合物)との反応を含み、Q、 $R_1$ 及びAが上記の式Iにおいて記載されているとおりである式IXの化合物がもたらされる。ジメチルスルホキシドDMSO又はメタノールなどの不活性溶剤中、20～150の温度、任意選択によりマイクロ波による加熱下における式IXの化合物と水性フッ化カリウムKF(0.5～3M、好ましくは1Mの濃度)との反応は、A、 $R_1$ 及びQが上記の式Iにおいて記載されているとおりである式VIの化合物をもたらし、式Vの化合物の式IIbの化合物への転換は、上記のとおりである。このような化学は、例えば、*J. Am. Chem. Soc.* 2011, 133, 6948-6951などの文献に記載されている。

【0065】

式IIbの化合物は、 $R_3$ がさらに官能基化されている式IIの化合物(スキーム6)の調製にさらに利用され得る。実際には、A、 $R_1$ 、 $X_1$ 及び $R_2$ が式Iにおいて上記において定義されているとおりである式IIbの化合物は、当業者に公知である酸性又は塩基性条件下で式IIcの化合物に部分的に加水分解され得るか、又は式IIdの化合物に完全に加水分解され得る。任意選択により、HFの存在下における $SF_4$ 又はFluolead(4-t-ブチル-2,6-ジメチルフェニルサルファートリフルオリド)などの試薬による式IIcの化合物の処理は、式IIEの化合物をもたらし(例えば、*Organic Letters*, 16, 6314-6317; 2014に記載されているとおり)。

【0066】

当業者に公知の方法であり、例えばTetrahedron, 2005, 61(46), 10827-10852に記載されている、 $R_1$ 、Q及びAが式Iにおいて定義されているとおりである式(IId)の化合物の活性化により、活性化種(IIf)(ここで、Q、 $R_1$ 及びAは、式Iにおいて定義されているとおりであり、 $X_0$ は、ハロゲン、好ましくは塩素である)が形成される。例えば、 $X_0$ がハロゲン、好ましくは塩素である化合物(IIf)は、触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドDMFの存在下において、塩化メチレン $CH_2Cl_2$ 又はテトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、20～100、好ましくは25の温度における例えば塩化オキサリル $(COCl)_2$ 又は塩化チオニル $SOCl_2$ による(IId)の処理によって形成される。代わりに、例えば、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドEDC又はジシクロヘキシルカルボジイミドDCCによる式(IId)の化合物の処理は、ピリジン又はテトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、任意選択によりトリエチルアミンなどの塩基の存在下において50～180の温度で活性化種(XII)(ここで、 $X_0$ は、それぞれ $X_{01}$ 又は $X_{02}$ である)をもたらし;このような式Iifの活性化中間体は、任意選択により、トリエチルアミン、ピリジン又はDMA Pなどの塩基の存在下、 $CH_2Cl_2$ 、THF又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中において式 $HNR_{101}R_{102}$ のアミン(ここで、 $R_{101}$ 及び $R_{102}$ は、水素又は $C_1$ ～ $C_6$ アルキルである)又は $HOR_{103}$ (ここで、 $R_{103}$ は、 $C_1$ ～ $C_6$ アル

10

20

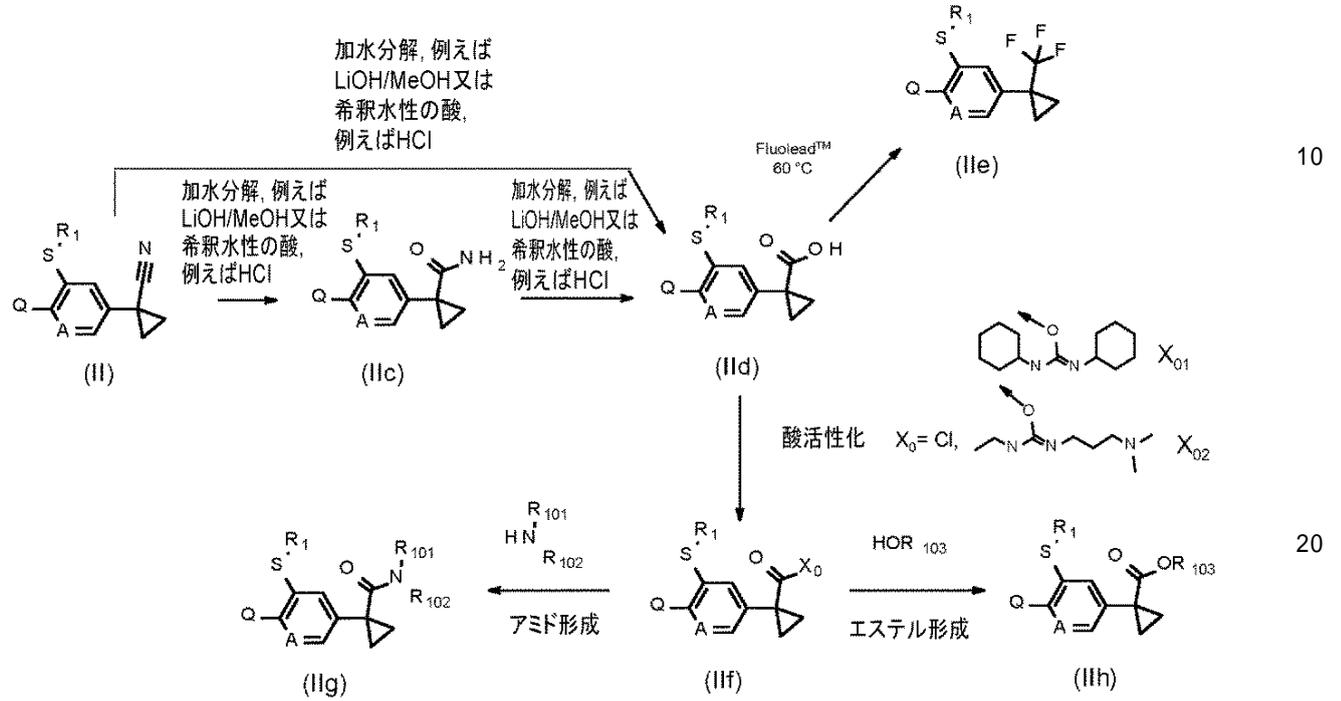
30

40

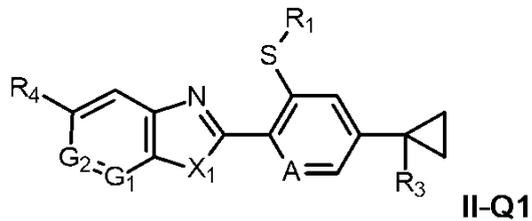
50

キルである)などの求核剤と反応させて、それぞれ式 I i g 及び I i h の化合物を得ることが可能である。このような反応は、当業者に周知である。シアノシクロプロピルの後変換をスキーム 6 に例示する。

スキーム 6  
【化 2 3】



【 0 0 6 7 】  
式 I I - Q<sub>1</sub>  
【化 2 4】



(式中、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、X<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、式 I において定義されているとおりである)

の化合物を定義する式 I I の化合物(ここで、Qは、Q<sub>1</sub>である)は、スキーム 7 に示すとおり調製可能である。

スキーム 7

10

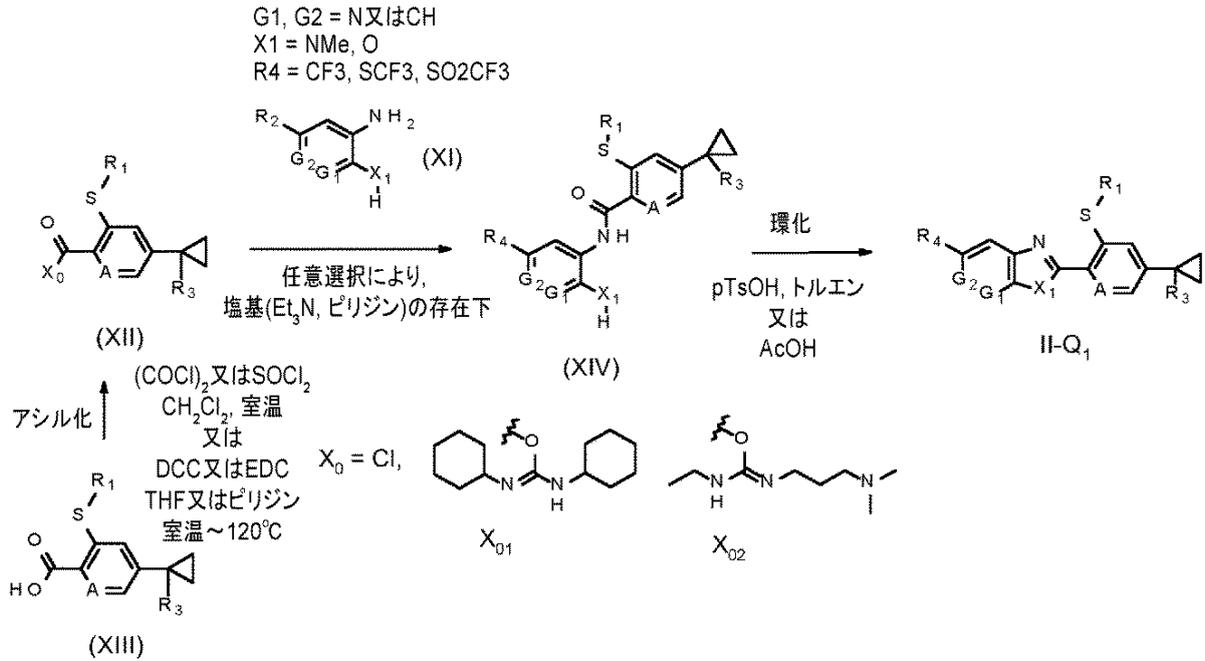
20

30

40

50

## 【化25】



10

20

## 【0068】

スキーム7において示されているとおり、式II-Q1の化合物は、例えば、酢酸又はトリフルオロ酢酸（好ましくは、X<sub>1</sub>がNR<sub>5</sub>である場合、ここで、R<sub>5</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである）中、0~180、好ましくは20~150の温度、任意選択によりマイクロ波の照射下において加熱することにより、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、A、X<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>が式Iにおいて定義されているとおりである式(XIV)の化合物を環化することにより調製可能である。式(XIV)の化合物の環化は、例えば、メタンスルホン酸又はp-トルエンスルホン酸p-TsOHなどの酸触媒の存在下において、N-メチルピロリドン、トルエン又はキシレンなどの不活性溶剤中、25~180、好ましくは100~170の温度でも達成され得る。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2016096584号において以前に記載されている。代わりに、式(XIV)の化合物は、テトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中において、20~50の温度でトリフェニルホスフィン、ジ-イソプロピルアゾジカルボキシレート（又はジ-エチルアゾジカルボキシレート）を用いることで式II-Q1の化合物（好ましくはX<sub>1</sub>がOである場合）に転換され得る。このようなミツノブ条件は、これらの変換について以前に記載されている（国際公開第2009/131237号及び国際公開第2016/121997号を参照されたい）。

30

## 【0069】

R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、A、X<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>が式Iにおいて定義されているとおりである式(XIV)の化合物は、以下によるアシル化を介して調製され得る；

i) 当業者に公知の方法及び例えば活性化種(XII)（ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>及びAは、式Iにおいて定義されているとおりであり、X<sub>0</sub>は、ハロゲン、好ましくは塩素である）が形成される、Tetrahedron, 2005, 61(46), 10827-10852に記載されている方法による、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>及びAが式Iにおいて定義されているとおりである式(XII)の化合物の活性化。例えば、X<sub>0</sub>がハロゲン、好ましくは塩素である化合物(XII)は、触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドDMFの存在下において、塩化メチレンCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>又はテトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、20~100、好ましくは25の温度における例えば塩化オキサリル(COCl)<sub>2</sub>又は塩化チオニルSOCl<sub>2</sub>による(XII)の処理によって形成される。代わりに、例えば、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドEDC又はジシクロヘキシルカルボジイミドDCCによる式(XII)の化合物の処理により、ピリジン又はテトラヒド

40

50

ロフランTHFなどの不活性溶剤中、任意選択によりトリエチルアミンなどの塩基の存在下において50~180の温度で活性化種(XII)(ここで、X<sub>0</sub>は、それぞれX<sub>01</sub>又はX<sub>02</sub>である)が生成され;これに続いて、

ii)トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピル-エチル-アミン又はピリジンなどの塩基の存在下において、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセタミド、アセトニトリル、酢酸エチル又はトルエンなどの不活性溶剤中、0~50の温度における、式(XIV)の化合物が形成される、X<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びR<sub>4</sub>が式Iにおいて定義されているとおりである式(XI)の化合物による活性化種(XII)の処理。R<sub>3</sub>がHである式XIIIの化合物、すなわちR<sub>1</sub>がエチルであり、R<sub>3</sub>がHであり、及びAがN又はCHである化合物は、公知であり、国際公開第2017146226号又は国際公開第2016121997号(5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸、CAS[1975148-58-3])及び国際公開第2016023954号(4-シクロプロピル-2-エチルスルファニル-安息香酸、CAS[1879052-58-0])に記載されている。式XIIIの化合物(ここで、R<sub>3</sub>は、シアノであり、R<sub>1</sub>は、エチルであり、及びAは、CHである)(4-(1-シアノシクロプロピル)-2-エチルスルファニル-安息香酸、CAS[2225113-79-9])及び式XIIIの化合物(ここで、R<sub>3</sub>は、シアノであり、R<sub>1</sub>は、エチルであり、及びAは、Nである)(5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸、CAS[2225113-77-7])は、公知であり、国際公開第2018/077565号に記載されている。

10

20

【0070】

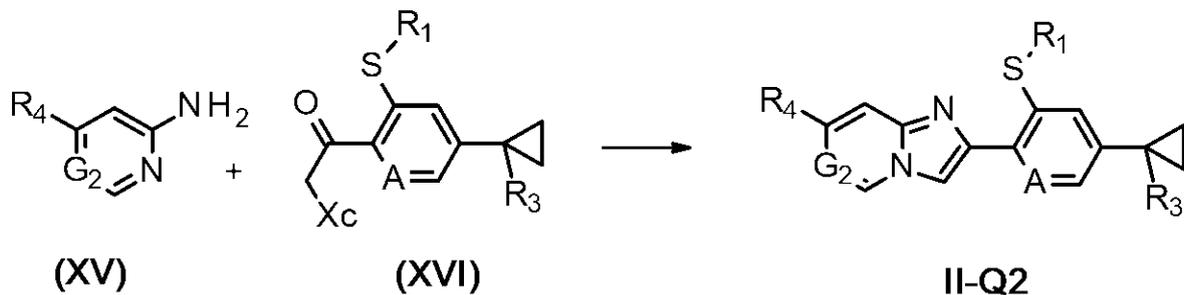
X<sub>1</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びR<sub>2</sub>が式Iにおいて定義されているとおりである式(XI)の化合物は、例えば、国際公開第2012/086848号、国際公開第2015/000715号及び国際公開第2016/116338号において既述である。

【0071】

式II-Q<sub>2</sub>の化合物(ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、A及びG<sub>2</sub>は、式Iにおいて定義されているとおりである)

スキーム8

【化26】



30

を定義する式IIの化合物(ここで、Qは、Q<sub>2</sub>である)は、例えば、エタノール又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中、任意選択により炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又は酸化マグネシウムなどの好適な塩基の存在下、80~150の温度において、任意選択によりマイクロ波による加熱条件下で式(XVI)の化合物(ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、Aは、式Iにおいて定義されているとおりであり、及びX<sub>c</sub>は、例えば、塩素、臭素又はヨウ素(好ましくは塩素又は臭素)などの脱離基である)を式(XVI)の化合物(ここで、G<sub>2</sub>及びR<sub>2</sub>は、式Iにおいて定義されているとおりである)と共に縮合することにより調製され得る(スキーム8)。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2012/49280号又は国際公開第2003/031587号において以前に記載されている。G<sub>2</sub>及びR<sub>2</sub>が式Iにおいて定義されているとおりである式(XV)の化合物は、市販されているか、又は当業者に公知の方法によって調製され得る公知の化合物である。

40

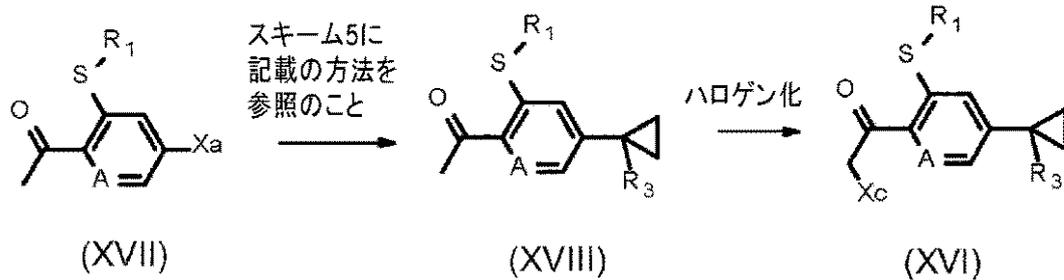
【0072】

50

式(XVI)の化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 及びAは、式Iにおいて定義されているとおりであり、及びXcは、例えば、塩素、臭素又はヨウ素(好ましくは塩素又は臭素)などの脱離基である)

スキーム9

【化27】



10

は、酢酸、 $\text{PhNMe}_3^+\text{Br}_3^-$ 、典型的にはメタノール、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、クロロホルム若しくはジクロロメタンなどの溶剤又はこれらの混合物中、0 ~ 150、好ましくは室温 ~ 120 温度、任意選択によりマイクロ波による加熱条件下における、例えばN-プロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、N-クロロスクシンイミド、 $\text{I}_2$ 、 $\text{CuBr}_2$ 、 $\text{Br}_2$ などのハロゲン化剤(「 $\text{Xc}^+$ 」供給源)による、 $R_1$ 、 $R_3$ 及びAが式Iにおいて定義されているとおりである式(XVII)の化合物の処理によって調製され得る(スキーム9)。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2016/071214号において以前に記載されている。

20

【0073】

$R_1$ 、 $R_3$ 及びAが式Iにおいて定義されているとおりである式(XVII)の化合物は、式(XVII)の化合物(ここで、 $R_1$ 及びAは、式Iにおいて定義されているとおりであり、及びXaは、例えば、塩素、臭素又はヨウ素(好ましくは塩素又は臭素)などの脱離基である)を上記で既述の条件下(スキーム5、化合物IVのIIbへの変換を参照されたい)で反応させることにより調製され得る。

【0074】

30

式(XVII)の化合物(ここで、 $R_1$ 及びAは、式Iにおいて定義されているとおりであり、Xaは、例えば、塩素、臭素又はヨウ素などの脱離基である)であって、特にXaがハロゲン(さらにより好ましくは塩素、臭素又はヨウ素;特に好ましくは塩素又は臭素)である化合物は、市販されているか、又は例えば国際公開第2016/071214号などの文献において記載されている公知の方法によって調製され得る公知の化合物である。

【0075】

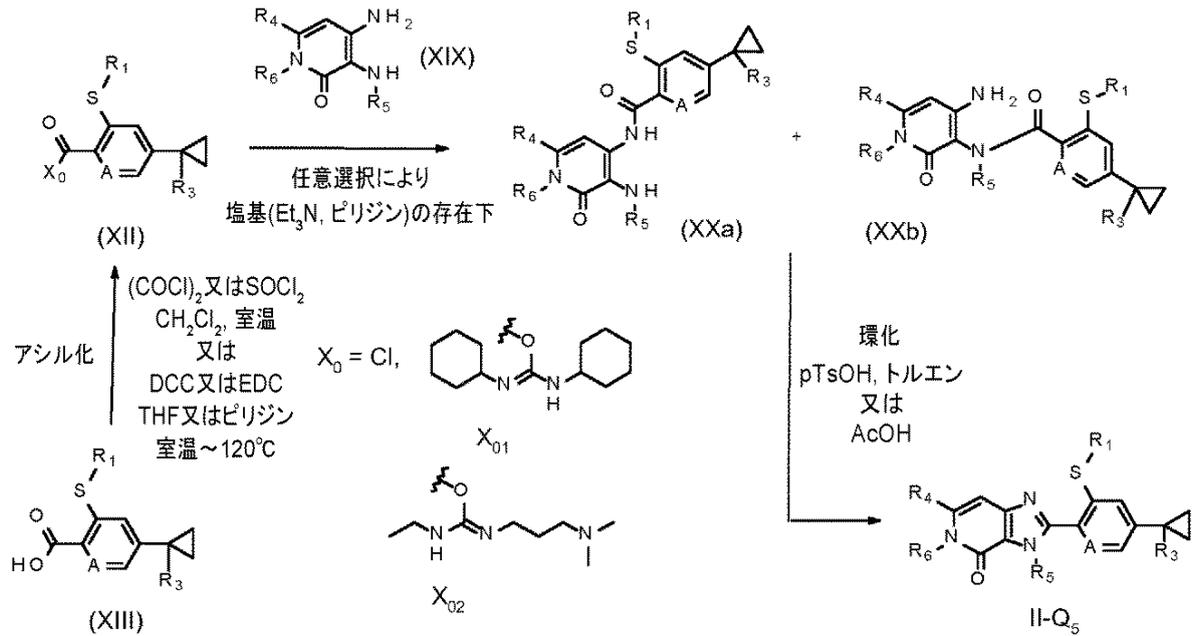
代わりに、式II-Q5の化合物(ここで、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_6$ 及びAは、式Iにおいて定義されているとおりである)

スキーム9a:

40

50

## 【化 2 8】



10

20

を定義する式 I I の化合物（ここで、Q は、Q<sub>5</sub>である）は、上記で既述の条件下（スキーム 7、化合物（X I V）の I I - Q 1 への変換を参照されたい）における、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>及び A が式 I において定義されているとおりである式（X X a）の化合物若しくは置換基の定義が同等である式（X X b）の位置異性体又はいずれかの比率でのこれらの混合物の環化により調製され得る（スキーム 9 a）。

## 【0076】

R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>及び A が式 I において定義されているとおりである式（X X a）の化合物若しくは置換基の定義が同等である式（X X b）の位置異性体又はいずれかの比率でのこれらの混合物は、上記で既述の条件下（スキーム 7、化合物（X I I）及び（X I I I）の化合物（X I V）への変換を参照されたい）における、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>及び R<sub>6</sub> が式 I において定義されているとおりである式（X I X）の化合物による上記の活性化種（X I I）の処理によって調製され得る。

30

## 【0077】

R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>及び R<sub>6</sub> が式 I において定義されているとおりである式（X I X）の化合物は、例えば、国際公開第 2016/023954号、国際公開第 2016/142326号、国際公開第 2017/133994号及び国際公開第 2018077565号において既述のものである。

## 【0078】

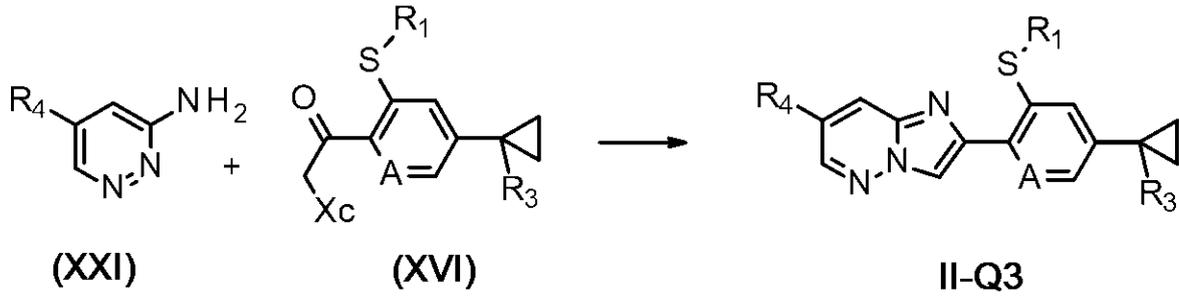
代わりに、式 I I - Q<sub>3</sub>の化合物（ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>3</sub>及び A は、式 I において定義されているとおりである）

40

スキーム 10

50

【化 2 9】



10

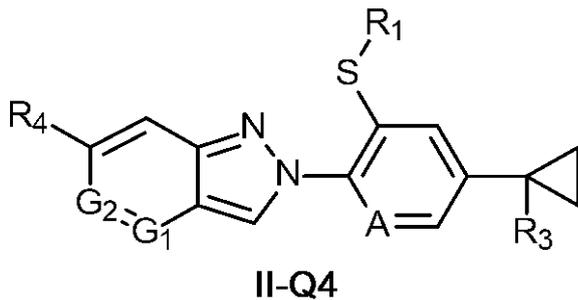
を定義する式 II の化合物（ここで、Q は、Q<sub>3</sub>である）は、不活性溶剤、例えばエタノール、トルエン又はアセトニトリル、任意選択により炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、又は炭酸セシウム（又は炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム）、又は酸化マグネシウムなどの好適な塩基の存在下、80～150 の温度、任意選択によりマイクロ波による加熱条件下において、上記の式（XVI）の化合物（ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>及びAは、式 I において定義されているとおりであり、及びXcは、例えば、塩素、臭素又はヨウ素（好ましくは塩素又は臭素）などの脱離基である）を式（XXI）の化合物（ここで、R<sub>4</sub>は、式 I において定義されているとおりである）と共に縮合することにより調製され得る（スキーム 10）。このようなプロセスは、例えば、国際公開第 2011/074658 号において以前に記載されている。R<sub>4</sub>が式 I において定義されているとおりである式（XXI）の化合物は、市販されているか、又は当業者に公知の方法によって調製され得る公知の化合物（例えば、国際公開第 2011/074658 号及び国際公開第 2010/083145 号を参照されたい）である。

20

【0079】

式 II - Q<sub>4</sub>

【化 30】



30

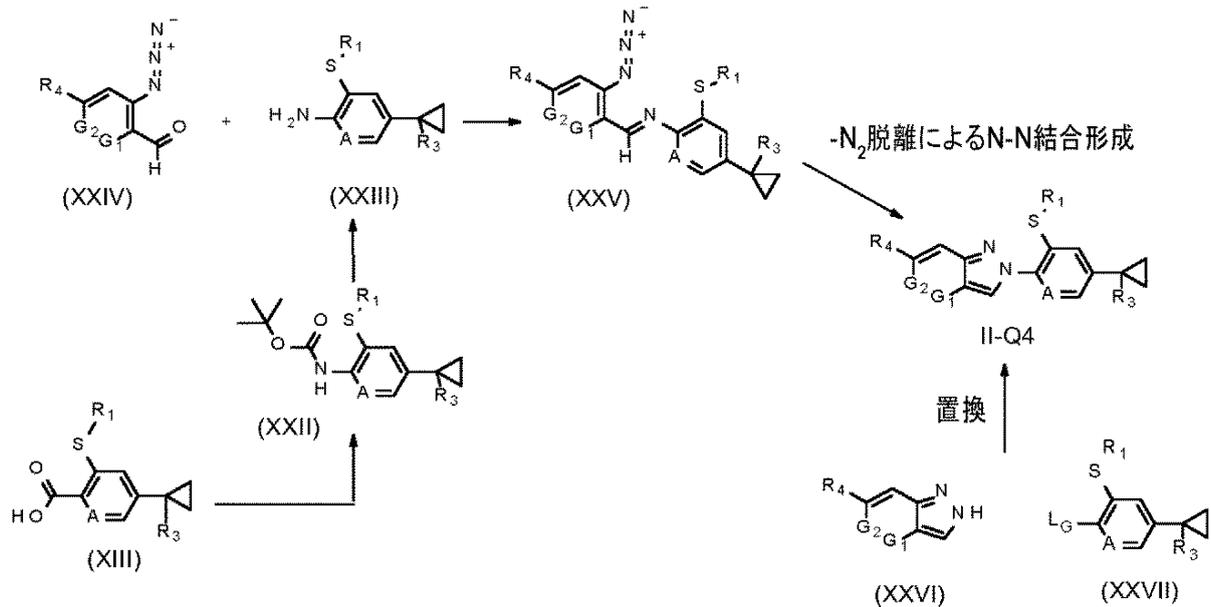
（式中、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びAは、式 I において定義されているとおりである）の化合物

スキーム 11

40

50

## 【化 3 1】



10

を定義する式 I I の化合物（ここで、Q は、Q<sub>4</sub>である）は、N<sub>2</sub>の排出が促進される熱分解条件下における、R<sub>1</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、A、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びR<sub>2</sub>が式 I において定義されているとおりである式 (X X V) の化合物のアジドイミンの N - N 結合形成反応を介しても調製され得る（スキーム 1 1）。代わりに、この反応は、例えば、Cu I、Cu Br、Cu Cl 若しくは Cu C N などの Cu ( I ) 触媒などの金属触媒の存在下又はより一般的に遷移金属を伴って、テトラメチルエチレンジアミン、2, 2' - ビピリジン又は 1, 1 0 - フェナントロリンなどのリガンドを組み合わせて実施され得る。好適な溶剤は、室温 ~ 2 0 0 、好ましくは 1 0 0 ~ 1 6 0 の温度、任意選択によりマイクロ波による加熱条件下におけるトルエン、クロロベンゼン又はキシレンの使用を含み得る。このような還元性環化反応条件は、例えば、Organic Letters, 2 0 1 1, Vol. 1 3, No. 1 3, 3 5 4 2 - 3 5 4 5 及び米国特許出願公開第 2 0 1 7 / 0 2 6 0 1 8 3 号明細書において記載されている。

20

30

## 【 0 0 8 0 】

R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びAが式 I において定義されているとおりである式 (X X V) の化合物は、通常、室温 ~ 2 0 0 、好ましくは 4 0 ~ 1 6 0 の温度、任意選択によりマイクロ波による加熱条件下における、例えばトルエン又はキシレンを含む使用され得る好適な溶剤中での加熱による、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>及びAが式 I において定義されているとおりである式 (X X I I I) の化合物と、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>及びR<sub>4</sub>が式 I において定義されているとおりである式 (X X I V) の化合物との反応によって調製され得る。式 (X X V) の化合物の形成では、共沸蒸留又は例えばTiCl<sub>4</sub>などの乾燥剤若しくは分子ふるいによる水の除去が必要とされ得る。このような式 (X X V) のシッフ塩基の形成は、当業者に公知であり、且つ例えば国際公開第 2 0 1 7 / 1 3 4 0 6 6 号に記載されている。式 X X I V の化合物は、文献において報告されている（国際公開第 2 0 1 8 / 0 5 2 1 3 6 号において報告されている CAS 2 2 1 1 9 0 8 - 9 6 - 0 を参照されたい）。

40

## 【 0 0 8 1 】

式 X X I I I の化合物は、HCl、H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>、H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub>、HNO<sub>3</sub>、TFAなどの酸の存在下における式 X X I I の化合物の反応によって調製され得る。N - 結合カルバメートのこのような脱保護反応は、当業者に周知であり、且つ例えばRSC Advances, 5 ( 5 ), 3 2 0 0 - 3 2 0 5 ; 2 0 1 5 に記載されている。

## 【 0 0 8 2 】

式 X X I I の化合物は、好適な塩基の存在下且つルイス酸及び溶剤の存在下又は不在下

50

、50 ~ 200 の温度における式XIIIの化合物と有機 - アジド又はアンモニア誘導体（例えば、 $\text{NH}_4\text{OH}$ 、 $\text{NH}_3$ 、 $\text{NH}_2\text{Boc}$ ）との反応により調製され得る。有機 - アジドの例としては、 $\text{TMSN}_3$ 、アジ化ナトリウム、ジフェニルホスホリルアジド又はトシルアジドが挙げられ、好適な溶剤は、 $t\text{-BuOH}$ 、トルエン、キシレン、THF又はアセトニトリルであり得る。好適なルイス酸の例としては、 $\text{Zn}(\text{OTf})_2$ が挙げられ得る。このようなカルボン酸をアミンに変換する反応は、クルチウス反応の名称で当業者に周知であり、*Org. Lett.*, 2005, 7, 4107 - 4110; *Journal of Medicinal Chemistry*, 49(12), 3614 - 3627; 2006に報告されている。

【0083】

代わりに、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ 及びAが式Iにおいて定義されているとおりである式II-Q<sub>4</sub>の化合物は、例えば、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸リチウム又は水素化ナトリウムなどの塩基の存在下、任意選択によりヨウ化銅(I)又はパラジウム触媒金属触媒の存在下において、L-プロライン、N,N'-ジメチルエチレンジアミン又はリン系リガンドなどの添加剤を伴って又は伴わず、アセトニトリル、N,N'-ジメチルホルムアミド、N-メチル-2-ピロリドン又はジメチルスルホキシドなどの不活性溶剤中、室温~200 の温度で任意選択によりマイクロ波による加熱条件下において、式(XVI)の化合物（ここで、 $R_4$ 、 $G_1$ 、 $G_2$ は、式Iにおいて定義されているとおりであり、及び $L_6$ は、例えば、塩素、臭素又はヨウ素（好ましくは塩素又は臭素）又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-、アルキル-若しくはハロアルキルスルホネートなどの脱離基である）を、 $G_1$ 、 $G_2$ 及び $R_4$ が式Iにおいて定義されているとおりである式(XVII)の化合物と反応させることにより調製され得る。このような芳香族求核置換反応条件は、例えば、国際公開第2017/134066号に記載されている。式XVIIの化合物は、ザンドマイヤー反応、すなわち $t\text{-BuOH}$ 又は水などの不活性溶剤中における、これに続く $\text{CuBr}_2$ 、 $\text{CuCl}$ 又はKIなどの無機ハロゲン化物の添加による $\text{NaNO}_2$ 又は $t\text{Bu-ONO}$ による化合物XXIIIのジアゾ化によって入手され得る。このようなザンドマイヤー反応は、文献において周知である（例えば、*Synthesis*, 2007, 2534 - 2538, *Org. Lett.*, 2008, 10, 3961 - 3964及びその中で引用されている文献を参照されたい）。

【0084】

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

【0085】

反応剤は、そのまま、すなわち溶媒又は希釈剤を加えずに互いに反応され得る。しかしながら、ほとんどの場合、不活性溶媒又は希釈剤又はこれらの混合物を加えることが有利である。反応が塩基の存在下で行われる場合、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチ

10

20

30

40

50

ルモルホリン又はN,N-ジエチルアニリンなどの過剰に用いられる塩基は、溶媒又は希釈剤としても働き得る。

【0086】

反応は、約 - 80 ~ 約 + 140、好ましくは約 - 30 ~ 約 + 100 の温度範囲、多くの場合、周囲温度から約 + 80 の範囲で行われるのが有利である。

【0087】

式Iの化合物は、式Iの出発化合物の1つ以上の置換基を、慣例的な方法で、本発明に係る他の置換基で置換することにより、式Iの別の化合物にそれ自体公知の方法で転化され得る。

【0088】

それぞれ好適な反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば1つの反応工程において、1つの置換基を本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であるか、又は複数の置換基が同じ反応工程において本発明に係る他の置換基で置換され得る。

【0089】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。従って、例えば、式Iの化合物の酸付加塩は、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩は、好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

【0090】

式Iの化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物又は好適なイオン交換試薬による処理により、遊離化合物Iの酸付加塩に、且つ例えば好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理により、塩基による塩に慣例的な方法で転化され得る。

【0091】

式Iの化合物の塩は、例えば、塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、従って反応混合物から沈殿する好適な溶媒中で例えば塩酸塩などの無機酸塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、式Iの化合物の他の塩、酸付加塩、例えば他の酸付加塩にそれ自体公知の方法で転化され得る。

【0092】

手順又は反応条件に応じて、塩形成特性を有する式Iの化合物が、遊離形態又は塩の形態で得られる。

【0093】

式Iの化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態若しくは塩形態において、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対及び相対配置に応じて及び/若しくは分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば対掌体及び/若しくはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態において又は鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物若しくはラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の1つの形態で又はこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能な全ての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記及び下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

【0094】

式Iの化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ混合物は、どの出発材料及び手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態又は塩形態において、例えば分別結晶化、蒸留及び/又はクロマトグラフィーにより、成分の物理化学的差異に基づいて純粋なジアステレオマー又はラセミ体に公知の方法で分離され得る。

【0095】

同様の方法で得られるラセミ体などの鏡像異性体混合物は、公知の方法により、例えば光学活性溶媒からの再結晶化により、キラル吸着剤におけるクロマトグラフィー、例えば好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィー(HPLC)により、例えば1つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂により、又はジアステレオマー塩への転化により、例えば塩基性最終生成物ラセミ体をカルボン酸、例えばショウノウ酸

10

20

30

40

50

、酒石酸又はリンゴ酸又はスルホン酸、例えばカンファースルホン酸などの光学活性酸と反応させ、このように得られるジアステレオマー混合物を例えば異なる溶解度に基づく分別結晶によって分離して、好適な物質、例えば塩基性物質の作用により、所望の鏡像異性体がそれから放出され得るジアステレオマーを得ることにより光学対掌体に分解され得る。

【0096】

純粋なジアステレオマー又は鏡像異性体は、本発明に従い、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的合成の一般に知られている方法によっても、例えば立体化学特性を有する出発材料を用いて、本発明に係る方法を行うことによっても得られる。

【0097】

N - オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で、式 I の化合物を好適な酸化剤、例えば H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> / 尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J . Med . Chem . , 32 ( 12 ) , 2561 - 73 , 1989 又は国際公開第 2000 / 15615 号などの文献から公知である。

【0098】

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれ、生物学的により有効な異性体、例えば鏡像異性体又はジアステレオマー又は異性体混合物、例えば鏡像異性体混合物又はジアステレオマー混合物を単離又は合成することが有利である。

【0099】

式 I の化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態又は塩形態で、必要に応じて、水和物の形態で得ることもでき、且つ / 又は他の溶媒、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

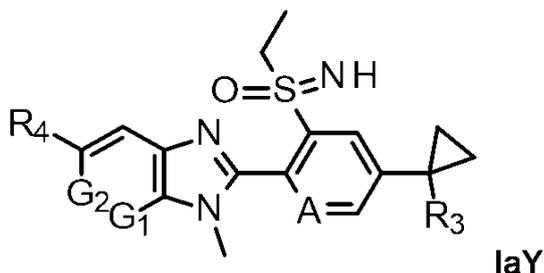
【0100】

以下の表 Y - 1 ~ Y - 8、X - 1 ~ X - 8、U - 1 ~ U - 2 及び V - 1 ~ V - 6 に表される式 I の化合物は、上述される方法に従って調製され得る。以下に続く例は、本発明を例示し、式 I の好ましい化合物を示すことが意図される。

【0101】

表 Y - 1 ~ Y - 8 は、式

【化 3 2】



の化合物を指す。

【0102】

10

20

30

40

50

## 【表 1】

表 Z: R<sub>3</sub> 及び R<sub>4</sub> の置換基定義:

インデックス	R <sub>4</sub>	R <sub>3</sub>
1	CF <sub>3</sub>	CN
2	SCF <sub>3</sub>	CN
3	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CN
4	CF <sub>3</sub>	H
5	SCF <sub>3</sub>	H
6	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
7	CF <sub>3</sub>	CONH <sub>2</sub>
8	SCF <sub>3</sub>	CONH <sub>2</sub>

10

20

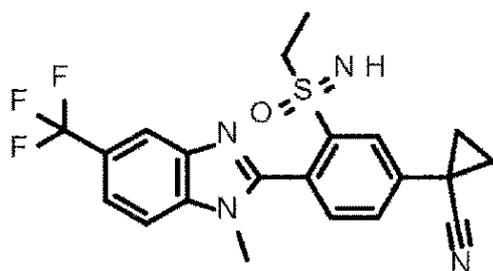
## 【0103】

表 Y - 1 は、式 I a Y の 8 種の化合物 Y - 1 . 0 0 1 ~ Y - 1 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、CH であり、G<sub>1</sub> は、CH であり、G<sub>2</sub> は、CH であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

## 【0104】

例えば、化合物 Y - 1 . 0 0 1 は、以下の構造 ;

## 【化 3 3】



(化合物 Y-1.001)

30

40

を有する。

## 【0105】

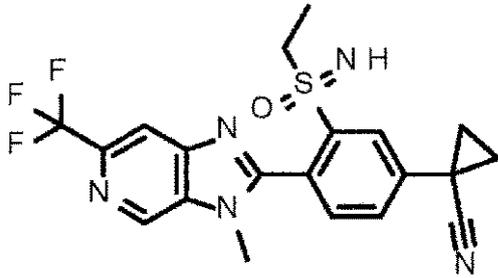
表 Y - 2 は、式 I a Y の 8 種の化合物 Y - 2 . 0 0 1 ~ Y - 2 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、CH であり、G<sub>1</sub> は、CH であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

## 【0106】

例えば、化合物 Y - 2 . 0 0 1 は、以下の構造 ;

50

【化 3 4】



(化合物 Y-2.001)

10

を有する。

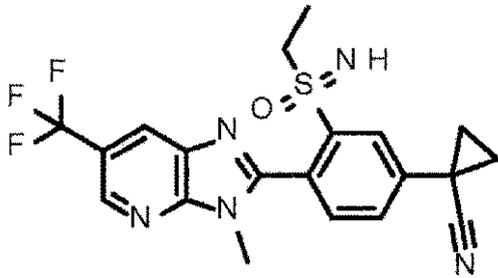
【0107】

表 Y - 3 は、式 I a Y の 8 種 の 化 合 物 Y - 3 . 0 0 1 ~ Y - 3 . 0 0 8 を 提 供 し、こ こ で、A は、C H であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、C H であり、及 び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z に お いて 定 義 さ れ て い る と お り である。

【0108】

例 えば、化 合 物 Y - 3 . 0 0 1 は、以 下 の 構 造 ；

【化 3 5】



(化合物 Y-3.001)

20

30

を有する。

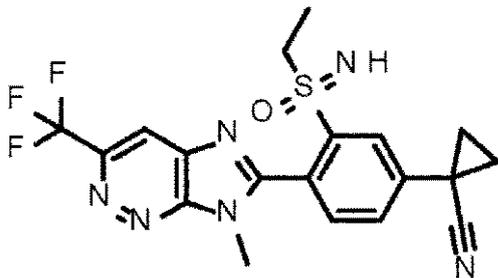
【0109】

表 Y - 4 は、式 I a Y の 8 種 の 化 合 物 Y - 4 . 0 0 1 ~ Y - 4 . 0 0 8 を 提 供 し、こ こ で、A は、C H であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及 び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z に お いて 定 義 さ れ て い る と お り である。

【0110】

例 えば、化 合 物 Y - 4 . 0 0 1 は、以 下 の 構 造 ；

【化 3 6】



(化合物 4.001)

40

を有する。

50

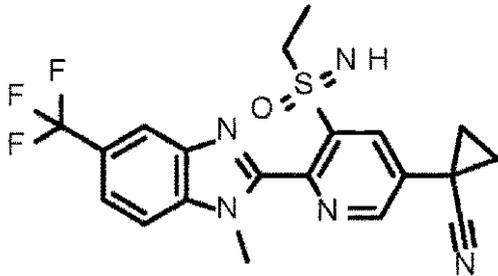
## 【0111】

表 Y - 5 は、式 I a Y の 8 種の化合物 Y - 5 . 0 0 1 ~ Y - 5 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、CH であり、G<sub>2</sub> は、CH であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

## 【0112】

例えば、化合物 Y - 5 . 0 0 1 は、以下の構造；

## 【化37】



(化合物 5.001)

10

を有する。

## 【0113】

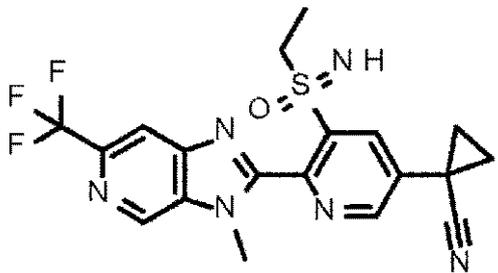
表 Y - 6 は、式 I a Y の 8 種の化合物 Y - 6 . 0 0 1 ~ Y - 6 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、CH であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

20

## 【0114】

例えば、化合物 Y - 6 . 0 0 1 は、以下の構造；

## 【化38】



(化合物 Y-6.001)

30

を有する。

## 【0115】

表 Y - 7 は、式 I a Y の 8 種の化合物 Y - 7 . 0 0 1 ~ Y - 7 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、CH であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

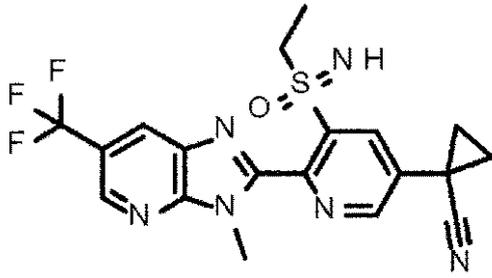
40

## 【0116】

例えば、化合物 Y - 7 . 0 0 1 は、以下の構造；

50

【化 3 9】



(化合物 Y-7.001)

10

を有する。

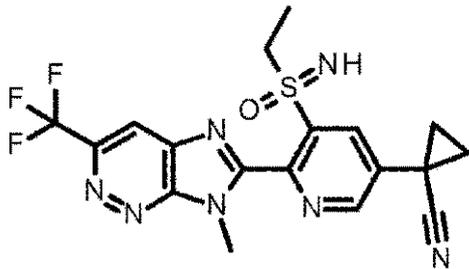
【0117】

表 Y - 8 は、式 I a Y の 8 種 の 化 合 物 Y - 8 . 0 0 1 ~ Y - 8 . 0 0 8 を 提 供 し、こ こ で、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及 び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z に お い て 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

【0118】

例 え ば、化 合 物 Y - 8 . 0 0 1 は、以 下 の 構 造；

【化 4 0】



(化合物 Y-8.001)

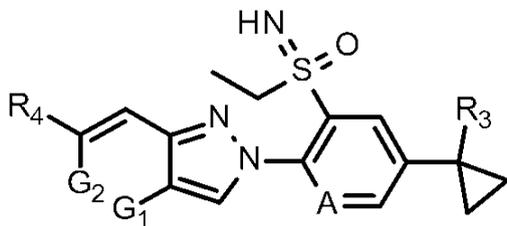
20

を有する。

【0119】

表 X - 1 ~ X - 8 は、式

【化 4 1】



(Iax)

40

の化合物を指す。

【0120】

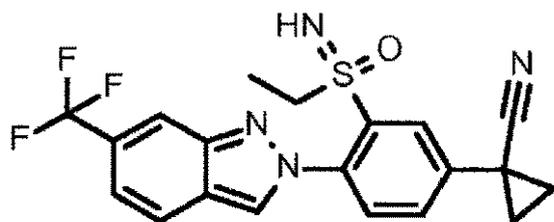
表 X - 1 は、式 I a x の 8 種 の 化 合 物 X - 1 . 0 0 1 ~ X - 1 . 0 0 8 を 提 供 し、こ こ で、A は、C H であり、G<sub>1</sub> は、C H であり、G<sub>2</sub> は、C H であり、及 び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z に お い て 定 義 さ れ て い る と お り で あ る。

【0121】

例 え ば、化 合 物 X - 1 . 0 0 1 は、以 下 の 構 造；

50

## 【化 4 2】



(化合物 X-1.001)

10

を有する。

## 【0122】

表 X - 2 は、式 I a x の 8 種の化合物 X - 2 . 0 0 1 ~ X - 2 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、CH であり、G<sub>1</sub> は、CH であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

## 【0123】

表 X - 3 は、式 I a x の 8 種の化合物 X - 3 . 0 0 1 ~ X - 3 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、CH であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、CH であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

20

## 【0124】

表 X - 4 は、式 I a x の 8 種の化合物 X - 4 . 0 0 1 ~ X - 4 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、CH であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

## 【0125】

表 X - 5 は、式 I a x の 8 種の化合物 X - 5 . 0 0 1 ~ X - 5 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、CH であり、G<sub>2</sub> は、CH であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

## 【0126】

表 X - 6 は、式 I b の 8 種の化合物 X - 6 . 0 0 1 ~ X - 6 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、CH であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

30

## 【0127】

表 X - 7 は、式 I b の 8 種の化合物 X - 7 . 0 0 1 ~ X - 7 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、CH であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

## 【0128】

表 X - 8 は、式 I b の 8 種の化合物 X - 8 . 0 0 1 ~ X - 8 . 0 0 8 を提供し、ここで、A は、N であり、G<sub>1</sub> は、N であり、G<sub>2</sub> は、N であり、及び R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub> は、表 Z において定義されているとおりである。

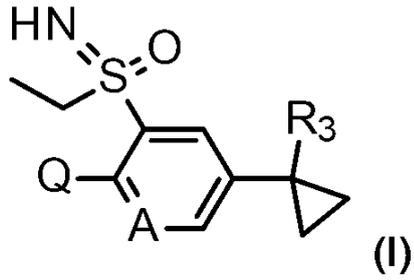
40

## 【0129】

以下の表 V - 1 ~ V - 6 は、特定の本発明の式 I の化合物（ここで、R<sub>2</sub> は、H であり、及び n は、1 である）を例示する。

50

## 【化43】



10

## 【0130】

表V-1は、式Iの9種の化合物V-1.001~V-1.009を提供し、ここで、Aは、CHであり、R<sub>3</sub>は、CNであり、及びQは、表Wにおいて定義されているとおりである。

## 【0131】

## 【表2】

表W: Qの置換基定義:

インデックス	Q	インデックス	Q	インデックス	Q
1		4		7	
2		5		8	
3		6		9	

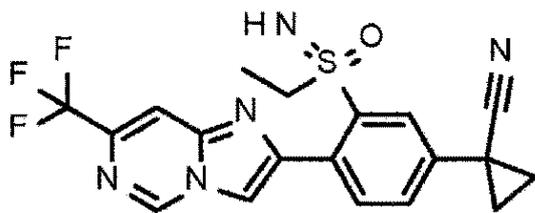
20

30

## 【0132】

例えば、化合物V-1.002は、以下の構造:

## 【化44】



(化合物V-1.002)

40

50

を有する。

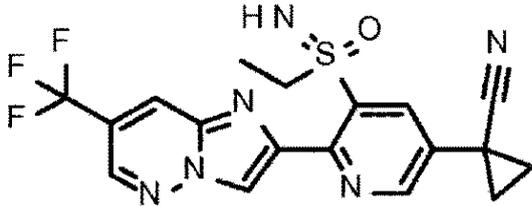
【0133】

表V-2は、式Iの9種の化合物V-2.001~V-2.009を提供し、ここで、Aは、Nであり、R<sub>3</sub>は、CNであり、及びQは、表Wにおいて定義されているとおりである。

【0134】

例えば、化合物V-2.005は、以下の構造：

【化45】



(化合物 V-2.005)

10

を有する。

【0135】

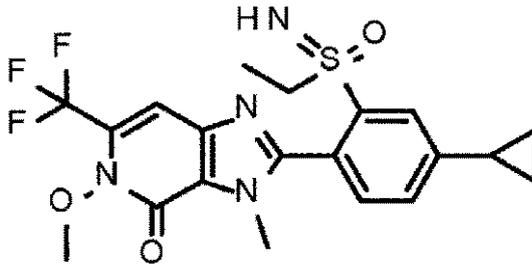
表V-3は、式Iの9種の化合物V-3.001~V-3.009を提供し、ここで、Aは、CHであり、R<sub>3</sub>は、Hであり、及びQは、表Wにおいて定義されているとおりである。

20

【0136】

例えば、化合物V-3.008は、以下の構造：

【化46】



(化合物 V-3.008)

30

を有する。

【0137】

表V-4は、式Iの9種の化合物V-4.001~V-4.009を提供し、ここで、Aは、Nであり、R<sub>3</sub>は、Hであり、及びQは、表Wにおいて定義されているとおりである。

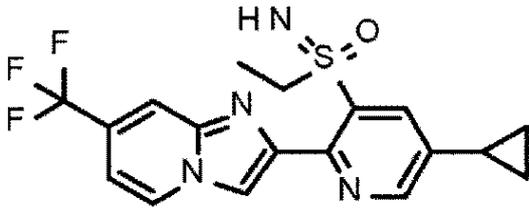
40

【0138】

例えば、化合物V-4.001は、以下の構造：

50

【化47】



(化合物 V-4.001)

10

を有する。

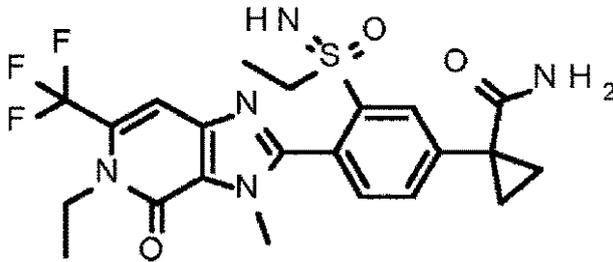
【0139】

表V-5は、式Iの9種の化合物V-5.001~V-5.009を提供し、ここで、Aは、CHであり、R<sub>3</sub>は、CONH<sub>2</sub>であり、及びQは、表Wにおいて定義されておりである。

【0140】

例えば、化合物V-5.007は、以下の構造：

【化48】



(化合物 V-5.007)

20

を有する。

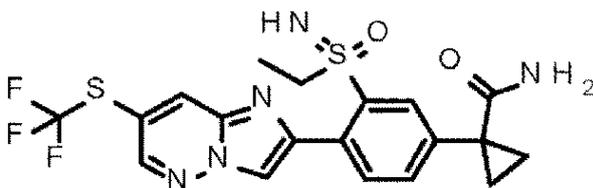
【0141】

表V-6は、式Iの9種の化合物V-6.001~V-6.009を提供し、ここで、Aは、Nであり、R<sub>3</sub>は、CONH<sub>2</sub>であり、及びQは、表Wにおいて定義されておりである。

【0142】

例えば、化合物V-6.006は、以下の構造：

【化49】



(化合物 V-6.006)

40

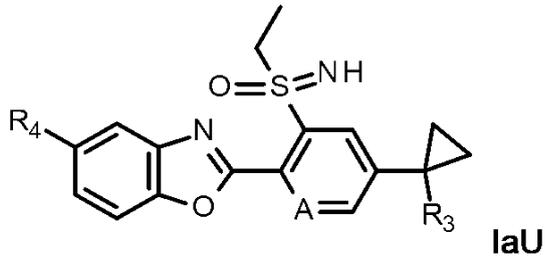
を有する。

【0143】

表U-1~U-2は、式

50

【化50】



10

の化合物を指す。

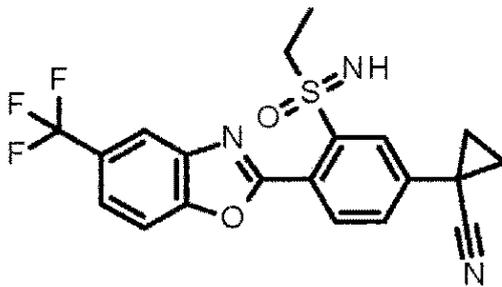
【0144】

表U-1は、式IaUの8種の化合物U-1.001~U-1.008を提供し、ここで、Aは、CHであり、及びR<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>は、表Zにおいて定義されているとおりである。

【0145】

例えば、化合物U-1.001は、以下の構造；

【化51】



(化合物 U-1.001)

20

を有する。

【0146】

表U-2は、式IaUの8種の化合物U-2.001~U-2.008を提供し、ここで、Aは、Nであり、及びR<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>は、表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0147】

本発明に係る式Iの化合物は、低い施用量でも有害生物防除の分野で予防的に及び/又は治療的に有益な有効成分であり、これは、非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類及び植物によって良好な耐容性を示される。本発明に係る有効成分は、昆虫、軟体動物、線虫又はダニ目(Acarina)の代表例など、通常感受性の動物有害生物だけでなく、耐性がある動物有害生物の全て又は個々の発育段階に対しても作用する。本発明に係る有効成分の殺虫、殺軟体動物、殺線虫又は殺ダニ活性は、それら自体、直接的に顕在化されるか(すなわち直ちに又は一定の時間が経過した後にのみ(例えば、脱皮中)生じる有害生物の死滅)、又は間接的に顕在化される(例えば、産卵及び/又は

40

【0148】

本発明に係る式(I)の化合物は、とりわけ、昆虫に対して植物を保護するための有利なレベルの生物学的活性又は農芸化学的有効成分としての使用に係る優れた特性(例えば、より高い生物学的活性、有利な活性範囲、高い安全性プロファイル、向上した物理化学的特性又は高い生分解性若しくは環境プロファイル)を含む、いずれかの数の有益性を有し得る。特に、特定の式(I)の化合物は、例えば、非標的節足動物などの非標的生物、特にミツバチ、単生ミツバチ及びマルハナバチなどの受粉媒介者に対する有利な安全性プロファイルを示すことが意外なことに見出された。より具体的には、セイヨウミツバチ(

50

*Apis mellifera*)である。

【0149】

この点に関して、特定の本発明の式(I)の化合物は、低施用量で効力が高いことにより公知の化合物と区別可能であり、これは、例えば、50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm又は0.2 ppmなどの必要に応じてより低い施用量を用いる、生物学的実施例において概述されているものと同様の又はそれらから適応される実験手法を用いて当業者により検証可能である。

【0150】

さらに、意外なことに、式(I)の化合物は、特に、低い融点、低い親油性及び高い水溶性などの作物保護における用途について有利な物理化学的特性を示すことが見出された。このような特性は、以下に列挙した特定の有害生物種を防除するために、植物による摂取及び浸透移行性分布について有利であることが見出されており、例えばA. Buchholz, S. Trapp, Pest Manag Sci 2016; 72: 929-939)を参照されたい。

【0151】

上記の動物有害生物の例は、以下のとおりである：

ダニ目(Acarina)から、例えばアカリツス属(*Acalitus* spp)、アカルス属(*Aculus* spp)、アカリカルス属(*Acaricalus* spp)、アセリア属(*Aceria* spp)、アシプトコナダニ(*Acarus siro*)、キラマダニ属(*Amblyomma* spp.)、ナガヒメダニ属(*Argas* spp.)、ウシマダニ属(*Boophilus* spp.)、ブレビパルパス属(*Brevipalpus* spp.)、ブリオビア属(*Bryobia* spp)、カリピトリメルス属(*Calipitimerus* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属(*Choriopetes* spp.)、ワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、デルマトファゴイデス属(*Dermatophagoides* spp)、エオテトラニカス属(*Eotetranychus* spp)、エリオフィエス属(*Eriophyes* spp.)、ヘミタルソネムス属(*Hemitarsonemus* spp)、イボマダニ属(*Hyalomma* spp.)、タネガタマダニ属(*Ixodes* spp.)、オリゴニクス属(*Olygonychus* spp)、カズキダニ属(*Ornithodoros* spp.)、ポリファゴタルソネ・ラタス(*Polyphagotarsonella* spp.)、パノニクス属(*Panonychus* spp.)、ミカンサビダニ(*Phyllocoptruta oleivora*)、フィトネムス属(*Phytonemus* spp)、ポリファゴタルソネムス属(*Polyphagotarsonemus* spp)、キュウセンヒゼンダニ属(*Psoroptes* spp.)、コイタマダニ属(*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属(*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属(*Sarcoptes* spp.)、ステネオタルソネムス属(*Steneotarsonemus* spp)、ホコリダニ属(*Tarsonemus* spp.)及びテトラニクス属(*Tetranychus* spp.)；

シラミ目(Anoplura)から、例えばブタジラミ属(*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属(*Linognathus* spp.)、ペディクルス属(*Pediculus* spp.)、ペムフィグス属(*Pemphigus* spp.)及びフィロキセラ属(*Phylloxera* spp.)；

鞘翅目(Coleoptera)から、例えばアグリオテス属(*Agriotes* spp.)、アンフィマロン・マジャレ(*Amphimallon majale*)、セマダラコガネ(*Anomala orientalis*)、アントノムス属(*Anthonomus* spp.)、マグソコガネ属(*Aphodius* spp)、アスチラス・アトロマクラタス(*Astylus atromaculatus*)、アテニウス属(*Ataenius* spp)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、セロトマ属(*Cerotoma* spp)、コノデルス属(*Conoderus* spp)、コスモポ

10

20

30

40

50

リテス属 (*Cosmopolites* spp.)、コチニス・ニチダ (*Cotinis nitida*)、クルクリオ属 (*Curculio* spp.)、シクロセファラ属 (*Cyclocephala* spp.)、デルメステス属 (*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属 (*Diabrotica* spp.)、アブデルスツノカブトムシ (*Diloboderus abderus*)、エピラクナ属 (*Epilachna* spp.)、エレムヌス属 (*Eremnus* spp.)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、コーヒーノミキクイムシ (*Hypothenemus hampei*)、ラグリア・フィロサ (*Lagria vilosa*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、リツソルホプトルス属 (*Lissorhopterus* spp.)、リオゲニス属 (*Liogenys* spp.)、マエ  
 コラスピス属 (*Maecolaspis* spp.)、アカビロウドコガネ (*Maladera castanea*)、メガセリス属 (*Megascelis* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Melighetes aeneus*)、メロロンタ属 (*Melolontha* spp.)、マイオクロウス・アルマツス (*Myochrous armatus*)、オリカエフィルス属 (*Orycaephilus* spp.)、オチオリンクス属 (*Otiorhynchus* spp.)、フィロファガ属 (*Phyllophaga* spp.)、フリクチヌス属 (*Phlyctinus* spp.)、ポピリア属 (*Popillia* spp.)、プシリオデス属 (*Psylliodes* spp.)、リソマツス・ア  
 ウブチリス (*Rhysosomatus aubtilis*)、リゾベルタ属 (*Rhizopertha* spp.)、コガネムシ科 (*Scarabeidae*)、シトフィルス属 (*Sitophilus* spp.)、シトトルガ属 (*Sitotroga* spp.)、ソマチカス属 (*Somaticus* spp.)、スフェノフォラス属 (*Sphenophorus* spp.)、ステルネクススブ・シグナツス (*Sternechus subsignatus*)、ゴミムシダマシ属 (*Tenebrio* spp.)、トリボリウム属 (*Tribolium* spp.) 及びトロゴデルマ属 (*Trogoderma* spp.) ;  
 双翅目 (*Diptera*) から、例えばヤブカ属 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.)、アンテリゴナ・ソカタ (*Antherigona soccata*)、オリーブミバエ (*Bactrocea oleae*)、ビビオ・ホルツ  
 ラヌス (*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属 (*Bradysia* spp.)、クロバエ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス属 (*Ceratitis* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、クテレブラ属 (*Cuterebra* spp.)、ダクス属 (*Dacus* spp.)、デリア属 (*Delia* spp.)、キイロシヨウジョ  
 ウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ガストロフィルス属 (*Gastrophilus* spp.)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツエツエバエ属 (*Glossina* spp.)、ヒフバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ヒツポボ  
 スカ属 (*Hyppobosca* spp.)、リリオミザ属 (*Liriomyza* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属 (*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、オルセオリア属 (*Orseolia* spp.)、キモグリバエ (*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属 (*Sciara* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タニア属 (*Tannia* spp.) 及びガガンボ属 (*Tipula* spp.) ;  
 半翅目 (*Hemiptera*) から、例えばアカントコリス・スカブラトル (*Acanthocoris scabrator*)、アクロステルナム属 (*Acrosternum* spp.)、ウススジカスミカメムシ (*Adelphocoris lineolatus*

)、アンブリペルタ・ニチダ (*Amblypelta nitida*)、バチコエリア・  
 タラシナ (*Bathycoelia thalassina*)、ブリサス属 (*Blissus* spp.)、トコジラミ属 (*Cimex* spp.)、クラビグララ・トメントシコロ  
 ス (*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属  
 (*Creontiades* spp.)、ジスタンチエラ・テオブロマ (*Distantiella theobroma*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジスデルクス属 (*Dysdercus* spp.)、エデッサ属 (*Ede  
 ssa* spp.)、ユースキスツス属 (*Euschistus* spp.)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、エウリガステル属 (*Eurygaster* sp  
 p.)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、ホルシアス・ノビレ  
 ルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリサ属 (*Leptocori  
 sa* spp.)、メクラカメムシ属 (*Lygus* spp.)、マルガロデス属 (*Marg  
 arodes* spp.)、ムルガンチア・ヒストリオニク (*Murgantia hist  
 rionic*)、ネオメガロトムス属 (*Neomegalotomus* spp.)、タバ  
 コカスミカメムシ (*Nesidiocoris tenuis*)、ネザラ属 (*Nezara*  
 spp.)、ニシウス・シムランス (*Nysius simulans*)、オエバルス・  
 インストラリス (*Oebalus insularis*)、ピエスマ属 (*Piesma* sp  
 p.)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodn  
 ius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella sin  
 gularis*)、スカプトコリス・カスターネア (*Scaptocoris casta  
 nea*)、スコチノファアラ属 (*Scotinophara* spp.)、チアンタ属 (*T  
 hyanta* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ヴァチガ・イルデ  
 ンス (*Vatiga illudens*) ;  
 アシルトシウム・ピスム (*Acyrtosium pisum*)、アダルゲス属 (*Ad  
 alges* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ (*Agalliana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ (*Agonosцена targionii*)、アレウ  
 ロジクス属 (*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属 (*Aleuroc  
 anthus* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus ba  
 rodensis*)、アレウロトリクス・フロッコス (*Aleurothrixus  
 floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ (*Aleyrodes brassi  
 cae*)、フタテンミドリヨコバイ (*Amarasca biguttula*)、アムリ  
 トズス・アトキンソニ (*Amritodus atkinsoni*)、アノニジエラ属 (*Aonidiella* spp.)、アリマキ科 (*Aphididae*)、ワタアブラム  
 シ属 (*Aphis* spp.)、アスピジオツス属 (*Aspidiotus* spp.)、  
 ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、バクテリセ  
 ラ・コッケレリ (*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属 (*Be  
 misia* spp.)、ブラキカウズス属 (*Brachycaudus* spp.)、ダイコ  
 ンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属 (*Cac  
 opsylla* spp.)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavariella aego  
 podii Scop.*)、セロプラスタ属 (*Ceroplaster* spp.)、クリ  
 ソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*)、オン  
 シツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyospermi*)、シ  
 カデラ属 (*Cicadella* spp.)、シロオオヨコバイ (*Cofana spect  
 ra*)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus* spp.)、シカデュリナ属 (*Ci  
 cadulina* spp.)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperid  
 um*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ジアレウロデス属  
 (*Dialeurodes* spp.)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citr  
 i*)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサフィス属 (*D  
 ysaphis* spp.)、エンポアスカ属 (*Empoasca* spp.)、リンゴワタ  
 ムシ (*Eriosoma larigerum*)、エリスロネウラ属 (*Erythron*

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

膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えばヒメハキリアリ属 (*Acromyrme* x.)、アルゲ属 (*Arge* spp.)、ハキリアリ属 (*Atta* spp. )、セフス属 (*Cephus* spp. )、ジプリオン属 (*Diprion* spp. )、マツハバチ科 (*Diprionidae*)、シマトウヒハバチ (*Gilpinia polytoma*)、ホプロカンパ属 (*Hoplocampa* spp. )、ケアリ属 (*Lasius* spp. )、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、ネオジプリオン属 (*Neodiprion* spp. )、シュウカクアリ属 (*Pogonomyrmex* spp.)、スレノプシス・インビクタ (*Slenopsis invicta*)、ソレノブ

シス属 (*Solenopsis* spp.) 及びベスパ属 (*Vespa* spp.) ;  
 等翅目 (*Isoptera*) から、例えばコプトテルメス属 (*Coptotermes*  
 spp)、コルニテルネス・クムランス (*Cornitermes cumulans*)  
 、インシテルメス属 (*Incisitermes* spp)、マクロテルメス属 (*Ma*  
*crotermes* spp)、マストテルメス属 (*Mastotermes* spp)、  
 ミクロテルメス属 (*Microtermes* spp)、ヤマトシロアリ属 (*Retic*  
*ulitermes* spp.) ; ソレノプシス・ゲミナテ (*Solenopsis ge*  
*minate*)

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

ミチムナ属 (*Mythimna* spp)、ノクツア属 (*Noctua* spp)、オペロフテラ属 (*Operophtera* spp.)、オルニオデス・インディカ (*Orniodes indica*)、アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属 (*Pammene* spp.)、パンデミス属 (*Pandemis* spp.)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属 (*Pieris* spp.)、コナガ (*Plutella xylostella*)、プレイス属 (*Prays* spp.)、シュードブルシア属 (*Pseudoplusia* spp)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga* spp.)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、スバルガノチス属 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、シレプタ・デロガテ (*Sylepta derogate*)、シナンテドン属 (*Synanthedon* spp.)、タウメトポエア属 (*Thaumetopoea* spp.)、トルトリックス属 (*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*) 及びスガ属 (*Yponomeuta* spp.) ;

10

20

食毛目 (*Mallophaga*) から、例えばダマリネア属 (*Damalinae* spp.) 及びケモノハジラミ属 (*Trichodectes* spp.) ;  
直翅目 (*Orthoptera*) から、例えばゴキブリ属 (*Blatta* spp.)、チャバネゴキブリ属 (*Blattella* spp.)、ケラ属 (*Gryllotalpa* spp.)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属 (*Locusta* spp.)、ネオクルチラ・ヘキサダクチラ (*Neocurtilla hexadactyla*)、ワモンゴキブリ属 (*Periplaneta* spp.)、スカプテリスカス属 (*Scapteriscus* spp) 及びコオロギ属 (*Schistocerca* spp.) ;

30

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) から、例えばリポセリス属 (*Liposcelis* spp.) ;  
ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えばナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp.) 及びケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) ;

総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えばカリオトリプス・ファセオリ (*Caliothrips phaseoli*)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* spp.)、ヘリオトリプス属 (*Heliothrips* spp)、ヘルシノトリプス属 (*Hercinothrips* spp.)、パルテノトリプス属 (*Parthenothrips* spp)、シルトトリプス・アウランチイ (*Scirtothrips aurantii*)、ダイズアザミウマ (*Sericothrips variabilis*)、タエニオトリプス属 (*Taeniothrips* spp.)、アザミウマ属 (*Thrips* spp) ;

40

シミ目 (*Thysanura*) から、例えばセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)。

#### 【0152】

本発明に係る有効成分は、特に植物、特に有用な植物及び農業、園芸及び森林における観賞植物又はこのような植物の果実、花、葉、茎、塊茎又は根などの器官において発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち抑制又は破壊するのに使用され得、場合によっては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままである。

50

## 【0153】

好適な標的作物は、特にコムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシ又はソルガムなどの穀物；テンサイ又は飼料用ビートなどのビート；果実、例えばリンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ又は液果類、例えばイチゴ、ラズベリー又はブラックベリーなどの仁果類、核果類又は柔らかい果物；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ又はダイズなどのマメ科作物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオ又はアメリカホドイモ (ground nut) などの油脂作物；カボチャ、キュウリ又はメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻又はジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ又はタンジェリンなどの柑橘類の果物；ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ又はピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモン又はショウノウなどのクスノキ科 (Lauraceae) の植物；及びさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物及びラテックス植物である。

10

## 【0154】

本発明の組成物及び/又は方法は、花、低木、広葉樹及び常緑樹を含む、任意の観賞植物及び/又は野菜作物にも使用され得る。

## 【0155】

例えば、本発明は、以下の観賞植物種のいずれかに使用され得る：カッコウアザミ属 (*Ageratum* spp.)、アロンソア属 (*Alonsoa* spp.)、イチリンソウ属 (*Anemone* spp.)、アニソドンテア・カペンシス (*Anisodonteacapsensis*)、アンセミス属 (*Anthemis* spp.)、キンギョソウ属 (*Antirrhinum* spp.)、シオン属 (*Aster* spp.)、ベゴニア属 (*Begonia* spp.) (例えば、エラチオールベゴニア (*B. elatior*)、シキザキベゴニア (*B. semperflorens*)、*B. tubereux*)、ブーゲンビリア属 (*Bougainvillea* spp.)、ブラキスコメ属 (*Brachycome* spp.)、アブラナ属 (*Brassica* spp.) (観賞植物)、カルセオラリア属 (*Calceolaria* spp.)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ニチニチソウ (*Catharanthus roseus*)、カンナ属 (*Canna* spp.)、ヤグルマギク属 (*Centaurea* spp.)、キク属 (*Chrysanthemum* spp.)、シネリア属 (*Cineraria* spp.) (シロタエギク (*C. maritime*))、ハルシャギク属 (*Coreopsis* spp.)、クラッスラ・コッキネア (*Crassula coccinea*)、クフエア・イグネア (*Cuphea ignea*)、ダリア属 (*Dahlia* spp.)、デルフィニウム属 (*Delphinium* spp.)、ケマンソウ (*Dicentra spectabilis*)、ドロテアンツス属 (*Dorotheantus* spp.)、トルコギキョウ (*Eustoma grandiflorum*)、レンギョウ属 (*Forsythia* spp.)、フクシア属 (*Fuchsia* spp.)、ゼラニウム・グナファリウム (*Geranium gnaphalium*)、ガーベラ属 (*Gerbera* spp.)、センニチコウ (*Gomphrena globosa*)、キダチルリソウ属 (*Heliotropium* spp.)、ヒマワリ属 (*Helianthus* spp.)、フヨウ属 (*Hibiscus* spp.)、アジサイ属 (*Hortensia* spp.)、アジサイ属 (*Hydrangea* spp.)、ソバカスソウ (*Hypoestes phyllostachya*)、ツリフネソウ属 (*Impatiens* spp.) (アフリカハウセンカ (*I. Walleriana*))、イレシネ属 (*Iresines* spp.)、カランコエ属 (*Kalanchoe* spp.)、ランタナ (*Lantana camara*)、ハナアオイ (*Lavatera trimestris*)、カエンキセワタ (*Leonotis leonurus*)、ユリ属 (*Lilium* spp.)、メセンブリアンテマ属 (*Mesembryanthemum* spp.)、ミゾホオズキ属 (*Mimulus* spp.)、ヤグルマハッカ属 (*Monar*

20

30

40

50

da spp.)、ネメシア属 (*Nemesia* spp.)、タゲテス属 (*Tagetes* spp.)、ナデシコ属 (*Dianthus* spp.) (カーネーション)、カンナ属 (*Canna* spp.)、カタバミ属 (*Oxalis* spp.)、ヒナギク属 (*Bellis* spp.)、テンジクアオイ属 (*Pelargonium* spp.) (アイビーゼラニウム (*P. peltatum*))、モンテンジクアオイ (*P. Zonale*)、スミレ属 (*Viola* spp.) (パンジー)、ペチュニア属 (*Petunia* spp.)、フロックス属 (*Phlox* spp.)、プレクトランサス属 (*Plectranthus* spp.)、ポインセチア種 (*Poinsettia* spp.)、ツタ属 (*Parthenocissus* spp.) (アメリカツタ (*P. quinquefolia*))、ツタ (*P. tricuspidata*)、サクラソウ属 (*Primula* spp.)、キンボウゲ属 (*Ranunculus* spp.)、ツツジ属 (*Rhododendron* spp.)、バラ属 (*Rosa* spp.) (バラ)、オオハongoンソウ属 (*Rudbeckia* spp.)、セントポーリア属 (*Saintpaulia* spp.)、アキギリ属 (*Salvia* spp.)、ブルーファンフラワー (*Scaevola aemola*)、コチョウソウ (*Schizanthus wisetonensis*)、マンネングサ属 (*Sedum* spp.)、ナス属 (*Solanum* spp.)、サフィニア種 (*Surfinia* spp.)、タゲテス属 (*Tagetes* spp.)、タバコ属 (*Nicotinia* spp.)、バーベナ種 (*Verbena* spp.)、ヒヤクニチソウ属 (*Zinnia* spp.) 及び他の花壇用の植物。

【0156】

例えば、本発明は、以下の野菜種のいずれかに使用され得る：ネギ属 (*Allium* spp.) (ニンニク (*A. sativum*))、タマネギ (*A. cepa*)、エシャロット (*A. oschaninii*)、リーキ (*A. Porrum*)、シャロット (*A. ascalonicum*)、ネギ (*A. fistulosum*)、チャービル (*Anthriscus cerefolium*)、セロリ (*Apium graveolus*)、アスパラガス (*Asparagus officinalis*)、テンサイ (*Beta vulgaris*)、アブラナ属 (*Brassica* spp.) (ヤセイカンラン (*B. Oleracea*))、ハクサイ (*B. Pekinensis*)、カブ (*B. rapa*)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ヒヨコマメ (*Cicer arietinum*)、エンダイブ (*Cichorium endivia*)、キクニガナ属 (*Cichorium* spp.) (チコリー (*C. intybus*))、エンダイブ (*C. endivia*)、スイカ (*Citrillus lanatus*)、キュウリ属 (*Cucumis* spp.) (サフラン (*C. sativus*))、メロン (*C. melo*)、カボチャ属 (*Cucurbita* spp.) (ペポカボチャ (*C. pepo*))、西洋カボチャ (*C. maxima*)、チョウセンアザミ属 (*Cyanara* spp.) (アーティチョーク (*C. scolymus*))、カルドン (*C. cardunculus*)、黒人参 (*Daucus carota*)、フェンネル (*Foeniculum vulgare*)、オトギリソウ属 (*Hypericum* spp.)、レタス (*Lactuca sativa*)、トマト属 (*Lycopersicon* spp.) (トマト (*L. esculentum*))、トマト (*L. lycopersicum*)、ハッカ属 (*Mentha* spp.)、バジル (*Ocimum basilicum*)、パセリ (*Petroselinum crispum*)、インゲンマメ属 (*Phaseolus* spp.) (インゲンマメ (*P. vulgaris*))、ベニバナインゲン (*P. coccineus*)、エンドウ (*Pisum sativum*)、ハツカダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マンネンロウ属 (*Rosemarinus* spp.)、アキギリ属 (*Salvia* spp.)、キバナバラモンジン (*Scorzonera hispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleracea*)、ノヂシャ属 (*Valerianella* spp.) (ノヂシャ (*V. locusta*))、イタリアンコーンサラダ (*V. eriocarpa*) 及びソラマメ (*Vicia faba*)。

## 【0157】

好ましい観賞植物種としては、セントポーリア (*African violet*)、ベゴニア属 (*Begonia*)、ダリア属 (*Dahlia*)、ガーベラ属 (*Gerbera*)、アジサイ属 (*Hydrangea*)、クマツヅラ属 (*Verbena*)、バラ属 (*Rosa*)、カランコエ属 (*Kalanchoe*)、ポインセチア (*Poinsettia*)、シオン属 (*Aster*)、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、ハルシャギク属 (*Coreopsis*)、デルフィニウム属 (*Delphinium*)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda*)、フロックス属 (*Phlox*)、オオハンゴンソウ属 (*Rudbeckia*)、マンネングサ属 (*Sedum*)、ペチュニア属 (*Petunia*)、スマレ属 (*Viola*)、ツリフネソウ属 (*Impatiens*)、フウロソウ属 (*Geranium*)、キク属 (*Chrysanthemum*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、フクシア属 (*Fuchsia*)、アキギリ属 (*Salvia*)、アジサイ属 (*Hortensia*)、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリ (*St. Johnswort*)、ミント、ピーマン、トマト及びキュウリが挙げられる。

10

## 【0158】

本発明に係る有効成分は、ワタ、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物におけるマメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ディアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) を防除するのに特に好適である。本発明に係る有効成分は、さらにマメストラ属 (*Mamestra*) (好ましくは野菜中)、コドリング (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴ中)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモ中) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネ中) を防除するのに特に好適である。

20

## 【0159】

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

30

## 【0160】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫 (内部寄生性、半内部寄生性及び外部寄生性線虫)、特にネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) 及び他のメロイドギネ属 (*Meloidogyne*) 種; シスト形成センチュウ、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及び他のグロボデラ属 (*Globodera*) 種; ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*) 及び他のヘテロデラ属 (*Hetero*

40

50

dera)種; タネコブセンチュウ、アンギナ属 (Anguina)種; クキセンチュウ  
 及びハセンチュウ、アフエレンコイデス属 (Aphelenchoides)種; 刺毛セ  
 ンチュウ (Sting nematode)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (Be  
 lonolaimus longicaudatus) 及び他のベロノライムス属 (Be  
 lonolaimus)種; マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ (Bursaphe  
 lenchus xylophilus) 及び他のバーサフェレンカス属 (Bursap  
 helenchus)種; ワセンチュウ (Ring nematode)、クリコネマ属  
 (Criconema)種、クリコネメラ属 (Criconemella)種、クリコネ  
 モイデス属 (Criconemoides)種、メソクリコネマ属 (Mesocrico  
 nema)種; クキ及びリンケイセンチュウ、イモグサレセンチュウ (Ditylenc  
 hus destructor)、ナミクキセンチュウ (Ditylenchus dipsaci) 及び他のジチレンクス属 (Ditylenchus)種; キリセンチュウ (A  
 wl nematode)、ドリコドルス属 (Dolichodorus)種; ラセンセ  
 ンチュウ (Spiral nematode)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス  
 (Helicotylenchus multicinctus) 及び他のヘリオコチ  
 レンクス属 (Helicotylenchus)種; サヤセンチュウ及びサヤワセンチュ  
 ウ (Sheath and sheathoid nematode)、ヘミシクリオホラ  
 属 (Hemicycliophora)種及びヘミクリコネモイデス属 (Hemicri  
 conemoides)種; ヒルスマンニエラ属 (Hirshmanniella)種;  
 ヤリセンチュウ (Lance nematode)、ホプロライムス (Hoploaim  
 us)種; ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (Nacobbus)種; ハリセンチュウ  
 (Needle nematode)、ロンギドルス・エロンガツス (Longidor  
 us elongatus) 及び他のロンギドルス属 (Longidorus)種; ピン  
 センチュウ (Pin nematode)、プラチレンクス属 (Pratylenchu  
 s)種; ネグサレセンチュウ (Lesion nematode)、ムギネグサレセンチ  
 ュウ (Pratylenchus neglectus)、キタネグサレセンチュウ (P  
 ratylenchus penetrans)、プラチレンクス・カービタツス (Pr  
 atylenchus curvittatus)、プラチレンクス・ゴオデイ (Prat  
 ylenchus goodeyi) 及び他のプラチレンクス属 (Pratylench  
 us)種; ネモグリセンチュウ (Burrowing nematode)、バナナネモ  
 グリセンチュウ (Radopholus similis) 及び他のラドホルス属 (Ra  
 dopholus)種; ニセフクロセンチュウ (Reniform nematode)  
 、ロチレンクス・ロボスタス (Rotylenchus robustus)、ロチレン  
 クス・レニフォルミス (Rotylenchus reniformis) 及び他のロチ  
 レンクス属 (Rotylenchus)種; スクテロネマ属 (Scutellonema  
 )種; ミハリセンチュウ (Stubby root nematode)、トリコドルス・  
 プリミチプス (Trichodorus primitivus) 及び他のトリコドルス  
 属 (Trichodorus)種、パラトリコドルス属 (Paratrichodoru  
 s)種; イシュクセンチュウ (Stunt nematode)、ナミイシュクセンチュ  
 (Tylenchorhynchus claytoni)、チレンコリンクス・デュビ  
 ウス (Tylenchorhynchus dubius) 及び他のチレンコリンクス属  
 (Tylenchorhynchus)種; ミカンセンチュウ (Citrus nema  
 tode)、チレンクルス属 (Tylenchulus)種; オオハリセンチュウ (Da  
 gger nematode)、キシフィネマ属 (Xiphinema)種などの植物寄  
 生性線虫; 並びにスバングナ属 (Subanguina spp.)、ヒプソペリン属 (H  
 ypsoperine spp.)、マクロポストニア属 (Macroposthonia  
 spp.)、メリニウス属 (Melinius spp.)、プンクトデラ属 (Pu  
 nctodera spp.) 及びキニスルシウス属 (Quinisulcius spp  
 .) などの他の植物寄生性線虫種による植物及び植物の部分への被害を防除する方法にも  
 関する。

10

20

30

40

50

## 【0161】

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

## 【0162】

「作物」という用語は、例えば、毒素産生細菌、特にバチルス属 (*Bacillus*) の細菌に由来する公知のような1つ又は複数の選択的に作用する毒素を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。

## 【0163】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) 又はバチルス・ポピリエ (*Bacillus popilliae*) に由来する殺虫タンパク質 ; 又は - エンドトキシン、例えば *Cry1Ab*、*Cry1Ac*、*Cry1F*、*Cry1Fa2*、*Cry2Ab*、*Cry3A*、*Cry3Bb1* 又は *Cry9C* など、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する殺虫タンパク質又は植物性殺虫タンパク質 (*Vip*)、例えば *Vip1*、*Vip2*、*Vip3* 又は *Vip3A* ; 又は細菌コロニー形成線虫、例えば *Photobabdas luminescens*、*キセノラバダス・ネマトフィルス* (*Xenorhabdus nematophilus*) などの *Photobabdas* 属 (*Photobabdas spp.* 又は *キセノラバダス* 属 (*Xenorhabdus spp.*) の殺虫タンパク質 ; サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素及び他の昆虫に特有の神経毒素など、動物によって産生される毒素 ; *Streptomyces* 属 (*Streptomyces*) 毒素など、真菌によって産生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチン又はユキノハナレクチンなどの植物レクチン ; 凝集素 ; トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤 ; リシン、トウモロコシ - RIP、アブリン、ルフィン、サボリン又はブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 (RIP) ; 3 - ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド - UDP - グリコシル - ト

ランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

【0164】

本発明に関連して、 $\delta$ -エンドトキシンは、例えば、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1又はCry9C又は植物性殺虫タンパク質(Vip)、例えばVip1、Vip2、Vip3又はVip3A、また、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素及び改変毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組合せによって組み換えにより産生される(例えば、国際公開第2002/15701号を参照されたい)。切断毒素、例えば切断Cry1Abが公知である。改変毒素の場合、天然毒素の1つ又は複数のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が毒素に挿入され、例えばCry3A055の場合、カテプシン-G-認識配列がCry3A毒素に挿入される(国際公開第2003/018810号を参照されたい)。

10

【0165】

このような毒素又はこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第1993/07278号、国際公開第1995/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書及び国際公開第2003/052073号に開示されている。

20

【0166】

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。CryI型のデオキシリボ核酸及びそれらの調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書及び国際公開第1990/13651号から公知である。

【0167】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、甲虫(鞘翅目(Coleoptera))、双翅昆虫(双翅目(Diptera))及び蛾(鱗翅目(Lepidoptera))において特に一般的に見られる。

30

【0168】

殺虫剤耐性をコードし、1つ又は複数の毒素を発現する1つ又は複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、YieldGard(登録商標)(Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種); YieldGard Rootworm(登録商標)(Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種); YieldGard Plus(登録商標)(Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種); Starlink(登録商標)(Cry9C毒素を発現するトウモロコシ品種); Herculex I(登録商標)(Cry1Fa2毒素及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るための酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現するトウモロコシ品種); NuCOTN 33B(登録商標)(Cry1Ac毒素を発現するワタ品種); Bollgard I(登録商標)(Cry1Ac毒素を発現するワタ品種); Bollgard II(登録商標)(Cry1Ac及びCry2Ab毒素を発現するワタ品種); VipCot(登録商標)(Vip3A及びCry1Ab毒素を発現するワタ品種); NewLeaf(登録商標)(Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種); NatureGard(登録商標)、Agrisure(登録商標)GT Advantage(

40

50

GA 21 グリホサート耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt 11 アワノメイガ (CB) 形質) 及び Protecta (登録商標) である。

【0169】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製の Bt 11 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。切断 Cry 1Ab 毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*) 及びセサミア・ノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt 11 トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素 PAT も遺伝子組み換えにより発現する。

10

【0170】

2. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製の Bt 176 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。Cry 1Ab 毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*) 及びセサミア・ノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt 176 トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素 PAT も遺伝子組み換えにより発現する。

20

【0171】

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製の MIR 604 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。改変 Cry 3A 毒素のトランスジェニック発現により、耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン - G - プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾された Cry 3A 055 である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第 2003/018810 号に記載されている。

【0172】

4. Monsanto Europe S.A. (270 - 272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製の MON 863 トウモロコシ、登録番号 C/DE/02/9。MON 863 は、Cry 3Bb1 毒素を発現し、特定の鞘翅目 (Coleoptera) 昆虫に対する耐性を有する。

30

【0173】

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

【0174】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tescos, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の 1507 トウモロコシ、登録番号 C/NL/00/10。特定の鱗翅目 (Lepidoptera) 昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質 Cry 1F 及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために PAT タンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。

40

【0175】

7. Monsanto Europe S.A. (270 - 272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製の NK 603 x MON 810 トウモロコシ、登録番号 C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え品種 NK 603 及び MON 810 を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK 603 x MON 810 トウモロコシは、除草剤 Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属

50

(*Agrobacterium* sp.) 菌株 CP4 から得られるタンパク質 CP4 EPS 及びヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目 (*Lepidoptera*) に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) から得られる Cry1Ab 毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

【0176】

昆虫耐性植物のトランスジェニック作物は、BATS (*Zentrum fuer Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland*) Report 2003, (<http://bats.ch>) にも記載されている。

10

【0177】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい) など、選択的作用を有する抗病原性物質を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書、国際公開第1995/33818号及び欧州特許出願公開第0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を産生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。

【0178】

20

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、例えばウイルス性KP1、KP4又はKP6毒素；スチルベンシターゼ；ピベンジルシターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP；例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい)；微生物によって産生される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質又は複素環式抗生物質(例えば、国際公開第1995/33818号を参照されたい)又は植物病原体防御に関与するタンパク質又はポリペプチド因子(国際公開第2003/000906号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」)が挙げられる。

【0179】

30

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品及び貯蔵室の保護及び原料(木材及び織物など)、床仕上げ材及び建築物の保護及び衛生分野において、特に上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜及び生産性家畜の保護である。

【0180】

本発明は、有害生物(蚊及び他の病原媒介動物など；[http://www.who.int/malaria/vector\\_control/irs/en/](http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)も参照されたい)を防除するための方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除するための方法は、本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材にブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井又は床面などの表面のIRS(屋内残留噴霧)施用が、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、このような組成物を網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態(又はこれらの製造に使用され得る形態)の不織布又は布帛材料などの基材に施用することが想定されている。

40

【0181】

一実施形態において、このような有害生物を防除するための方法は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面又は基材に与えるように、殺有害生物的に有効な量の本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材に施用する工程を含む。このような施用は、本発明の殺有害生物組成物をブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬することによって行われ得る。例として、壁、天井又は床面などの表面におけるIRS施用は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面に与えるように、本発明の方法によって想定さ

50

れている。別の実施形態において、網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の布帛材料などの基材における有害生物の残存性防除のためにこのような組成物を施用することが想定されている。

【0182】

処理されるべき不織布、布帛又は網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布若しくは羊毛などの天然繊維又はポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成繊維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005/113886号又は国際公開第2007/090739号から公知である。

10

【0183】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、全ての観賞用樹木並びにあらゆる種類の果樹及び堅果の成る木の樹幹注入／幹処理の分野である。

【0184】

樹幹注入／幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（Lepidoptera）及び鞘翅目（Coleoptera）の木材穿孔性昆虫に対して、特に以下の表A及びBに列挙される木材穿孔性昆虫に対して特に好適である。

20

【0185】

【表3】

表 A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

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

30

40

【0186】

50

## 【表 4 - 1】

表 B. 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス ( <i>Agrilus anxius</i> )	カバノキ
	アグリルス・ポリツス ( <i>Agrilus politus</i> )	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ ( <i>Agrilus sayi</i> )	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス ( <i>Agrilus vittaticollis</i> )	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、サーブスベリー、サンザシ
	クリソボトリス・フェモラタ ( <i>Chrysobothris femorata</i> )	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカエデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニレ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ナナカマド、オーク、ペカン、セイヨウナシ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、マルメロ、アメリカハナズオウ、サーブスベリー、スズカケノキ、クルミ、ヤナギ
テキサニア・カンペストリス ( <i>Texania campestris</i> )	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、スズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ	
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	ゴエス・プルベルレンツス ( <i>Goes pulverulentus</i> )	ブナ、ニレ、ナットール (Nuttall)、ヤナギ、クロガシワ、アメリカカレハガシワ (Cherrybark oak)、ミズナラ、スズカケノキ
	ゴエス・チグリヌス ( <i>Goes tigrinus</i> )	オーク
	ネオクリツス・アクミナツス ( <i>Neoclytus acuminatus</i> )	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オーク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、イースタンホップホーンビーム (Eastern hophornbeam)、ハナミズキ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリカサイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカハリグワ、サッサfras、ライラック、マウンテン・マホガニー、セイヨウナシ、サクランボ、プラム、モモ、リンゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ

10

20

30

40

50

【表 4 - 2】

科	種	寄生される宿主又は作物
	ネオプテコデス・トリリネツス ( <i>Neoptychodes trilineatus</i> )	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、 ネットリーフハックベリー (Netleaf hackberry)
	オベレア・オセラータ ( <i>Oberea ocellata</i> )	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイ ヨウナシ、スグリ、ブラックベリー (Blackberry)
	オベレア・トリプンクタータ ( <i>Oberea tripunctata</i> )	ハナミズキ、ガマズミ属 ( <i>Viburnum</i> )、ニレ、サワーウッド、ブ ルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月 桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ
	オンシデレス・シングラータ ( <i>Oncideres cingulata</i> )	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワ ーウッド、シナノキ、アメリカサイカ チ、ハナミズキ、ユーカリ属 ( <i>Eucalyptus</i> )、オーク、エノキ、カエ デ、果樹
	サペルダ・カルカラタ ( <i>Saperda calcarata</i> )	ポプラ
	ストロフィオナ・ニテンス ( <i>Strophiona nitens</i> )	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブ ナ、カエデ
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルス・コロンビアヌス ( <i>Corthylus columbianus</i> )	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネ リコバノカエデ、スズカケノキ、カバ ノキ、シナノキ、クリ、ニレ
	デンドロクトヌス・フロンタリス ( <i>Dendroctonus frontalis</i> )	マツ
	ドリオコエテス・ベツラエ ( <i>Dryocoetes betulae</i> )	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミ ザクラ、ブナ、セイヨウナシ
	モナルトルム・ファスシアツム ( <i>Monarthrum fasciatum</i> )	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミ ジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッ コリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ
	フロエオトリプス・リミナリス ( <i>Phloeotribus liminaris</i> )	モモ、サクランボ、プラム、アメリカ ザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド
	シュードピチオフトルス・プルイノスス ( <i>Pseudopityophthorus pruinosis</i> )	オーク、アメリカブナ、アメリカザク ラ、チッカソープラム ( <i>Chickasaw plum</i> )、クリ、カエデ、ヒッコリー、シ デ、アサダ

10

20

30

40

50

【表 4 - 3】

科	種	寄生される宿主又は作物
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネ・シムランス ( <i>Paranthrene simulans</i> )	オーク、アメリカグリ
	サンニナ・ウロセリフォルミス ( <i>Sannina uroceriformis</i> )	カキ
	シナンテドン・エキシチオサ ( <i>Synanthedon exitiosa</i> )	モモ、プラム、ネクタリン、サクランボ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ
	シナンテドン・ピクチペス ( <i>Synanthedon pictipes</i> )	モモ、プラム、サクランボ、ブナ、アメリカザクラ
	シナンテドン・ルブロファスシア ( <i>Synanthedon rubrofascia</i> )	アメリカヌママミズキ
	シナンテドン・シツラ ( <i>Synanthedon scitula</i> )	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属 ( <i>Viburnum</i> )、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ
	ビタセア・ポリスチフォルミス ( <i>Vitacea polistiformis</i> )	ブドウ

10

20

30

## 【0187】

本発明は、例えば、甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ (ground pearl)、ヤスデ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、マダニ、アワフキムシ、サウザンチンクバグ (southern chinch bug) 及び地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。本発明は、卵、幼虫、若虫及び成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

## 【0188】

特に本発明は、地虫 (コガネカブト属 (*Cyclocephala* spp.)) (例えば、マスクドコガネムシ (masked chafer)、*C. lurida*)、リゾトログス属 (*Rhizotrogus* spp.) (例えば、ヨーロッパコガネムシ、*R. majalis*)、コチヌス属 (*Cotinus* spp.) (例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida*)、ポピリア属 (*Popillia* spp.) (例えば、マメコガネ (Japanese beetle)、*P. japonica*)、フィロファガ属 (*Phyllophaga* spp.) (例えば、コガネムシ (May/June beetle))、アテニウス属 (*Ataenius* spp.) (例えば、ブラック・ターフグラス・アテニウス (*Black turfgrass ataenius*)、*A. spretnus*)、マラデラ属 (*Maladera* spp.) (例えば、アカビロウドコガネ、*M. castanea*) 及びトマルス属 (*Tomarus* spp.

40

50

.)など)、ワタフキカイガラムシ(マルガロデス属(*Margarodes* spp.))、ケラ(タウニー(*tawny*)、サウザン(*southern*)及び短翅型;スカプテリスクス属(*Scapteriscus* spp.)、ケラ(*Gryllotalpa africana*)及びレザージャケット(*leather jacket*)(ヨーロッパアンクレーンフライ(*European crane fly*)、ガガンボ属(*Tipula* spp.))を含む、芝草の根を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

## 【0189】

本発明は、ヨトウムシ(ツマジロクサヨトウ(*Spodoptera frugiperda*)及び一般的なヨトウムシ(*common armyworm*)(プセウダレチア・ウニプンクタ(*Pseudaletia unipuncta*)など)、ネキリムシ、ゾウムシ(スフェノホルス属(*Sphenophorus* spp.)、シバオサゾウムシ(*S. venatus verstitus*)及び*S. parvulus*)など)及びソッドウェブワーム(*sod webworm*)(クラムプス属(*Crambus* spp.)及び熱帯ソッドウェブワーム(*tropical sod webworm*)、ケナシクロオビクロノメイガ(*Herpetogramma phaeopteralis*)など)を含む、藁に住む芝草の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

## 【0190】

本発明は、ヒメコガネナガカメムシ(サウザンキンクバグ、ブリスス・インスラリス(*Blissus insularis*)など)、ギョウギシバ(*Bermudagrass*)のダニ(エリオフィエス・シノドニエンシス(*Eriophyes cynodoniensis*)、アフリカヒゲシバ(*rhodesgrass*)のコナカイガラムシ(チガヤシロオカイガラムシ(*Antonina graminis*))、2本線のあるアワフキムシ(*two-lined spittlebug*)(プロサピア・ピシンクタ(*Propisapia bicincta*))、ヨコバイ、ネキリムシ(ヤガ科(*Noctuidae*))及びムギミドリアブラムシを含む、地上に生息し、芝草の葉を餌とする昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

## 【0191】

本発明は、芝生にアリ塚を作製するアカヒアリ(*Solenopsis invicta*)など、芝草の他の有害生物を防除するのにも使用され得る。

## 【0192】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ(*hard tick*)、ヒメダニ(*soft tick*)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ(サシバエ及び舐性(*licking*)のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ及びノミなどの外部寄生生物に対して有効である。このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目(*Anoplurida*)のうち：ブタジラミ属(*Haematopinus* spp.)、ホソジラミ属(*Linognathus* spp.)、ペディクルス属(*Pediculus* spp.)及びケジラミ属(*Phtirus* spp.)、ソレノポテス属(*Solenopotes* spp.)。

## 【0193】

ハジラミ目(*Mallophagida*)のうち：トリメノポン属(*Trimenopon* spp.)、タンカクハジラミ属(*Menopon* spp.)、トリノトン属(*Trinoton* spp.)、ボビコラ属(*Bovicola* spp.)、ウェルネッキエラ属(*Werneckiella* spp.)、レピケントロン属(*Lepikentron* spp.)、ダマリナ属(*Damalina* spp.)、トリコデクテス属(*Trichodectes* spp.)及びフェリコラ属(*Felicola* spp.)。

## 【0194】

双翅目(*Diptera*)並びにその亜目であるネマトセリナ亜目(*Nematocetrina*)及び短角亜目(*Brachycerina*)のうち、例えばヤブカ属(*Aedes* spp.)、ハマダラカ属(*Anopheles* spp.)、イエカ属(*Cule*

10

20

30

40

50

x spp.）、ブヨ属 (*Simulium* spp.)、ツノマユブユ属 (*Eusimulium* spp.)、サシチョウバエ属 (*Phlebotomus* spp.)、ルツオミヤ属 (*Lutzomyia* spp.)、キュリコイデス属 (*Culicoides* spp.)、メクラアブ属 (*Chrysops* spp.)、ヒボミトラ属 (*Hybomitra* spp.)、キイロアブ属 (*Atylotus* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、ゴマフアブ属 (*Haematopota* spp.)、フィリポミア属 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属 (*Braula* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、トゲアシメマトイ属 (*Hydrotaea* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、ヘマトビア属 (*Haematobia* spp.)、モレリア属 (*Morellia* spp.)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ツエツエバエ属 (*Glossina* spp.)、オオクロバエ属 (*Calliphora* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、ヴォールファールトニクバエ属 (*Wohlfahrtia* spp.)、ニクバエ属 (*Sarcophaga* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、ウシバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ウマバエ属 (*Gasterophilus* spp.)、シラミバエ属 (*Hippobosca* spp.)、シカシラミバエ属 (*Lipoptena* spp.) 及びヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)。

## 【0195】

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

## 【0196】

異翅目 (*Heteropterida*) のうち、例えばトコジラミ属 (*Cimex* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、パンストロギルス属 (*Panstrongylus* spp.)。

## 【0197】

ゴキブリ目 (*Blattarida*) のうち、例えばトウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャパネゴキブリ (*Blattella germanica*) 及びスベラ属 (*Supella* spp.)。

## 【0198】

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) 並びにマダニ亜目 (*Metastigmata*) 及び中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えばナガヒメダニ属 (*Argas* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属 (*Otobius* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、キララマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)、チマダニ属 (*Haemophysalis* spp.)、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニスス属 (*Dermanssus* spp.)、ライリエチア属 (*Raillietia* spp.)、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.) 及びバロア属 (*Varroa* spp.)。

## 【0199】

ダニ目 (*Actinedida*) (前気門類 (*Prostigmata*)) 及びカイチュウ目 (*Acaridida*) (コナダニ亜目 (*Astigmata*)) のうち、例えばアカラピス属 (*Acarapis* spp.)、ツメダニ属 (*Cheyletiella* spp.)、オルニソケイレチア属 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属 (*Myobia* spp.)、ヒツジツメダニ属 (*Psorergates*

10

20

30

40

50

pp. )、ニキビダニ属 (*Demodex* spp. )、ツツガムシ属 (*Trombicula* spp. )、リストロホルス属 (*Listrophorus* spp. )、コナダニ属 (*Acarus* spp. )、チロファグス属 (*Tyrophagus* spp. )、ゴミコナダニ属 (*Caloglyphus* spp. )、ヒポデクテス属 (*Hypodectes* spp. )、プテロリクス属 (*Pterolichus* spp. )、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp. )、ショクヒヒゼンダニ属 (*Chorioptes* spp. )、ミミヒゼンダニ属 (*Otodectes* spp. )、ヒゼンダニ属 (*Sarcoptes* spp. )、ショウセンコウヒゼンダニ属 (*Notoedres* spp. )、クネミドコプテス属 (*Knemidocoptes* spp. )、シトジテス属 (*Cytodites* spp. ) 及びラミノシオプテス属 (*Laminosioptes* spp. )。

10

## 【0200】

本発明に係る組成物は、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙及び厚紙、皮革、床仕上げ材及び建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのにも好適である。

## 【0201】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム (*Xestobium rufovillosum*)、プチリヌスペクチコルニス (*Ptilinus specticornis*)、デンドロビウム・ベルチネクス (*Dendrobium pertinex*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Priobium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテスルギコリス (*Minthesrugicollis*)、キシルボルス属種 (*Xyleborus* spec. )、トリプトデンドロン属種 (*Tryptodendron* spec. )、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシンス (*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種 (*Sinoxylon* spec. ) 及びチビタケナガシクイムシ (*Dinoderus minutus*) などの甲虫並びにさらにコルリキバチ (*Sirex juvencus*)、モミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas taignus*) 及びウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*) などの膜翅類の昆虫 (hymenopteran) 並びにカロテルメス・フラヴィコリス (*Kaloterme flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ (*Cryptoterme brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ (*Heteroterme indicola*)、キアシシロアリ (*Reticuliterme flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス (*Reticuliterme santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス (*Reticuliterme lucifugus*)、ムカシシロアリ (*Mastoterme darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*) 及びイエシロアリ (*Coptoterme formosanus*) などのシロアリ並びにセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) などのシミ。

20

30

40

## 【0202】

本発明に係る化合物は、非修飾形態で有害生物防除剤として使用され得るが、それらは

50

、一般に担体、溶媒及び表面活性物質などの製剤化補助剤を用いて、様々な方法で組成物に製剤化される。製剤は、様々な物理的形態、例えば粉剤、ゲル、水和剤、水和性粒剤、水分散性錠剤、発泡性ペレット、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、水中油乳剤、油性フロアブル剤、水性分散液、油性分散液、サスポエマルジョン、カプセル懸濁剤、乳化性粒剤、可溶性液体、水溶性濃縮物（担体として水又は水混和性有機溶媒を含む）、含浸ポリマーフィルム形態又は例えば the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010) から公知の他の形態であり得る。このような製剤は、直接使用されるか又は使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量栄養素、生物有機体、油又は溶媒を用いて行われ得る。

10

#### 【0203】

製剤は、微粉化された固体、粒剤、液剤、分散液又は乳剤の形態の組成物を得るために、例えば有効成分を製剤化補助剤と混合することによって調製され得る。有効成分は、微粉化された固体、鉱油、植物若しくは動物由来の油、植物若しくは動物由来の変性油、有機溶媒、水、表面活性物質又はそれらの組合せなどの他の補助剤と共に製剤化され得る。

#### 【0204】

有効成分は、微細なマイクロカプセル中にも含有され得る。マイクロカプセルは、多孔質担体中に有効成分を含有する。これにより、有効成分を制御された量で環境中に放出させることができる（例えば、持続放出）。マイクロカプセルは、通常、0.1 ~ 500 μm の直径を有する。マイクロカプセルは、カプセル重量の約 25 ~ 95 重量% の量で有効成分を含有する。有効成分は、モノリシック固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微粒子の形態又は好適な溶液の形態であり得る。封入用の膜は、例えば、天然若しくは合成ゴム、セルロース、スチレン/ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリ尿素、ポリウレタン又は化学修飾ポリマー及びデンブンキサンテート又は当業者に公知の他のポリマーを含み得る。代わりに、有効成分が基剤の固体マトリクス中に微粉化された粒子の形態で含まれた微細なマイクロカプセルが形成され得るが、このマイクロカプセル自体は封入されない。

20

#### 【0205】

本発明に係る組成物の調製に好適な製剤化補助剤は、それ自体公知である。液体担体として、以下のものが使用され得る：水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、炭酸ブチレン、クロロベンゼン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアピエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、炭酸エチレン、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 $\alpha$ -ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 $\gamma$ -ブチロラクトン、グリセロール、酢酸グリセロール、二酢酸グリセロール、三酢酸グリセロール、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、酸化メシチル、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサノール、n-オクチルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、乳酸プロピル、炭酸プロピレン、プロピレ

30

40

50

ングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p - キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、ペルクロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノールなどのより高い分子量のアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N - メチル - 2 - ピロリドンなど。

【0206】

好適な固体担体は、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石粘土、シリカ、アタパルジャイト粘土、珪藻土、石灰石、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿実殻、小麦粉、大豆粉、軽石、木粉、粉碎されたクルミ殻、リグニン及び同様の物質である。

10

【0207】

多くの表面活性物質が、固体及び液体製剤の両方中、特に使用前に担体で希釈され得る製剤中で有利に使用され得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、非イオン性又はポリマーであり得、それらは、乳化剤、湿潤剤又は懸濁化剤として又は他の目的のために使用され得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどの硫酸アルキルの塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノール/アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなどのアルコール/アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石けん；ナトリウムジブチルナフタレンスルホネートなどのアルキルナフタレンスルホネートの塩；ナトリウムジ(2 - エチルヘキシル)スルホスクシネートなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；オレイン酸ソルビトールなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなどの第四級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びにモノ - 及びジ - アルキルリン酸エステルの塩；並びにさらに例えば McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981) に記載されているさらなる物質が挙げられる。

20

30

【0208】

殺有害生物製剤に使用され得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整剤、懸濁化剤、染料、酸化防止剤、発泡剤、光吸収剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤又はpH調整物質及び緩衝液、腐食防止剤、香料、湿潤剤、吸収向上剤、微量栄養素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤並びに液体及び固体肥料が挙げられる。

【0209】

本発明に係る組成物は、植物若しくは動物由来の油、鉱油、このような油のアルキルエステル又はこのような油と油誘導体との混合物を含む添加剤を含み得る。本発明に係る組成物中の油添加剤の量は、一般に施用される混合物を基準にして、0.01 ~ 10%である。例えば、油添加剤は、スプレー混合物が調製された後、所望の濃度でスプレータンクに加えられ得る。好ましい油添加剤は、鉱油又は植物由来の油、例えばナタネ油、オリーブ油若しくはヒマワリ油、乳化植物油、植物由来の油のアルキルエステル、例えばメチル誘導体又は魚油若しくは牛脂などの動物由来の油を含む。好ましい油添加剤は、C<sub>8</sub> ~ C<sub>22</sub>脂肪酸のアルキルエステル、特にC<sub>12</sub> ~ C<sub>18</sub>脂肪酸のメチル誘導体、例えばラウリン酸、パルミチン酸及びオレイン酸のメチルエステル(それぞれ、ラウリン酸メチル、パルミチン酸メチル及びオレイン酸メチル)を含む。多くの油誘導体が、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10<sup>th</sup> Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

40

【0210】

50

本発明の組成物は、一般に0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の本発明の化合物及び1～99.9重量%の製剤化補助剤（これは、好ましくは、0～25重量%の表面活性物質を含む）を含む。市販の製品は、好ましくは、濃縮物として製剤化され得るが、最終使用者は、通常、希釈製剤を用いるであろう。

【0211】

施用量は、広い範囲内で変化し、土壌の性質、施用方法、作物植物、防除される有害生物、そのときの気候条件並びに施用方法、施用の時期及び標的作物に左右される他の要因に応じて決まる。一般的な指針として、化合物は、1～2000l/ha、特に10～1000l/haの割合で施用され得る。

【0212】

好ましい製剤は、以下の組成を有し得る（重量%）。

【0213】

乳剤：

有効成分：1～95%、好ましくは60～90%

表面活性剤：1～30%、好ましくは5～20%

液体担体：1～80%、好ましくは1～35%

【0214】

ダスト剤：

有効成分：0.1～10%、好ましくは0.1～5%

固体担体：99.9～90%、好ましくは99.9～99%

【0215】

懸濁濃縮物：

有効成分：5～75%、好ましくは10～50%

水：94～24%、好ましくは88～30%

表面活性剤：1～40%、好ましくは2～30%

【0216】

水和剤：

有効成分：0.5～90%、好ましくは1～80%

表面活性剤：0.5～20%、好ましくは1～15%

固体担体：5～95%、好ましくは15～90%

【0217】

粒剤：

有効成分：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固体担体：99.5～70%、好ましくは97～85%

【0218】

以下の実施例は、本発明をさらに例示するが、本発明を限定するものではない。

【0219】

【表5】

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

10

20

30

40

50

## 【0220】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が、好適なミルにおいて十分に粉碎され、これにより、水和剤が得られ、これは、水で希釈されて、所望の濃度の懸濁液が得られる。

## 【0221】

## 【表6】

乾燥種子処理用の粉剤	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高度に分散したケイ酸	5 %	5 %	-
カオリン	65 %	40 %	-
タルカム	-		20

10

## 【0222】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が、好適なミルにおいて十分に粉碎され、種子処理に直接使用され得る粉剤が得られる。

## 【0223】

## 【表7】

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

20

30

## 【0224】

植物保護に使用され得る、任意の所要の希釈率の乳剤が、水による希釈により、この濃縮物から得られる。

## 【0225】

## 【表8】

ダスト剤	a)	b)	c)
有効成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	-	-
カオリン	-	94 %	-
無機充填剤	-	-	96 %

40

## 【0226】

即時使用可能なダスト剤が、担体と組み合わせて混合し、混合物を好適なミルにおいて粉碎することによって得られる。このような粉末は、種子の乾式粉衣にも使用され得る。

## 【0227】

50

【表 9】

押出粒剤	
有効成分	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

## 【0228】

この組合せは、補助剤と混合され、粉碎され、混合物は、水で濡らされる。混合物は、押し出され、次に空気流中で乾燥される。

## 【0229】

【表 10】

被覆粒剤	
有効成分	8 %
ポリエチレングリコール (分子量200)	3 %
カオリン	89 %

## 【0230】

この微粉化された組合せは、ミキサー中で、ポリエチレングリコールで濡らされたカオリンに均一に適用される。このように、ほこりのない被覆粒剤が得られる。

## 【0231】

【表 11】

## 懸濁濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル (15モルのエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコーン油 (水中75%の乳剤の形態)	1 %
水	32 %

## 【0232】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物並びに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生から保護され得る。

## 【0233】

10

20

30

40

50

## 【表 1 2】

## 種子処理用のフロアブル濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノールP0/E0	2 %
10~20モルのE0を含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン（水中20%の溶液の形態）	0.5 %
モノアゾ-顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油（水中75%の乳剤の形態）	0.2 %
水	45.3 %

10

## 【0 2 3 4】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物並びに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生から保護され得る。

## 【0 2 3 5】

持続放出性カプセル懸濁剤

20

2 8 部のこの組合せを 2 部の芳香族溶媒及び 7 部のトルエンジイソシアネート / ポリメチレン - ポリフェニルイソシアネート - 混合物 ( 8 : 1 ) と混合する。この混合物を、所望の粒度が得られるまで、1 . 2 部のポリビニルアルコールと、0 . 0 5 部の消泡剤と、5 1 . 6 部の水との混合物中で乳化する。この乳剤に 5 . 3 部の水中の 2 . 8 部の 1 , 6 - ジアミノヘキサンを混合する。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られたカプセル懸濁剤を 0 . 2 5 部の増粘剤及び 3 部の分散剤を加えることによって安定化させる。カプセル懸濁剤製剤は、2 8 % の有効成分を含有する。カプセルの中間直径は 8 ~ 1 5  $\mu\text{m}$  である。得られた製剤を、該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に施用する。

## 【0 2 3 6】

30

製剤のタイプとしては、乳剤濃縮物 ( E C )、懸濁濃縮物 ( S C )、サスポエマルジョン ( S E )、カプセル懸濁剤 ( C S )、水和性粒剤 ( W G )、乳化性粒剤 ( E G )、油中水乳剤 ( E O )、水中油乳剤 ( E W )、マイクロエマルジョン ( M E )、油性分散液 ( O D )、油混和性フロアブル剤 ( O F )、油混和性液体 ( O L )、可溶性濃縮物 ( S L )、微量散布用懸濁剤 ( S U )、微量散布用液剤 ( U L )、工業用濃縮物 ( T K )、分散性濃縮物 ( D C )、水和剤 ( W P )、可溶性粒剤 ( S G ) 又は農学的に許容できる補助剤と組み合わされた任意の技術的に実現可能な製剤が挙げられる。

## 【実施例】

## 【0 2 3 7】

調製実施例：

40

「M p」は、融点 ( ) を意味する。遊離基は、メチル基を表す。<sup>1</sup>H NMR 測定を B r u c k e r 4 0 0 M H z 分光計で記録し、化学シフトを T M S 標準に関して p p m で示す。示されるように、スペクトルを重水素化溶媒中で測定する。以下の L C M S 方法のいずれか一方を用いて、化合物を特性評価した。各化合物について得られた特徴的な L C M S 値は、保持時間 (「R<sub>t</sub>」、分単位で記録される) 及び分子イオン ( M + H )<sup>+</sup> 又は ( M - H )<sup>-</sup> の実測値であった。

## 【0 2 3 8】

L C M S 及び G C M S 方法：

方法 1：

スペクトルは、エレクトロスプレーソース ( 極性：陽イオン及び陰イオン、キャピラリ

50

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

【0239】

10

方法2：

スペクトルは、エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン及び陰イオン)、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：50 l/h、脱溶剤ガス流：650 l/h、質量範囲：100～900 Da)を備えるWaters製の質量分光計(SQD、SQDIIシングル四重極型質量分光計)並びにWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器及びELSD検出器で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30×2.1 mm、温度：60、DAD波長範囲(nm)：210～500、溶剤勾配：A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH、B=アセトニトリル+0.05% HCOOH、勾配：2.7分間で10から100%B；流量(ml/min)0.85。

20

【0240】

方法3：

スペクトルは、エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン及び陰イオン)、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：50 l/h、脱溶剤ガス流：650 l/h、質量範囲：100～900 Da)を備えるWaters製の質量分光計(SQD、SQDII又はZQシングル四重極型質量分光計)並びにWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器及びELSD検出器で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30×2.1 mm、温度：60、DAD波長範囲(nm)：210～500、溶剤勾配：A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH、B=アセトニトリル+0.05% HCOOH、勾配：2.5分間で0から10%B；流量(ml/min)0.85。

30

【0241】

方法4：

スペクトルは、エレクトロスプレーソース(極性：陽イオン及び陰イオン)、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：50 l/h、脱溶剤ガス流：650 l/h、質量範囲：100～900 Da)を備えるWaters製の質量分光計(SQD、SQDIIシングル四重極型質量分光計)及びWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器及びELSD検出器で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30×2.1 mm、温度：60、DAD波長範囲(nm)：210～500、溶剤勾配：A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH、B=アセトニトリル+0.05% HCOOH、勾配：1.2分間で40から100%B；流量(ml/min)0.85。

40

【0242】

方法5：

スペクトルは、エレクトロスプレーソース(極性：陽及び陰極性スイッチ、キャピラリー：3.00 kV、コーン電圧：41.00 V、ソース温度：150、脱溶剤ガス流：1000 L/Hr.、脱溶剤温度：500、ガス流@コーン：50 L/hr.、質量範囲

50

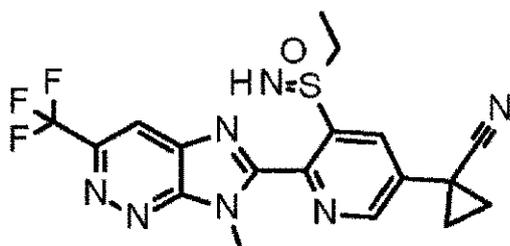
: 110 ~ 800 Da、PDA波長範囲: 210 ~ 400 nmを備えるWaters製の質量分光計 (Acquity SDS質量分光計) で記録した。カラム: Acquity UPLC HSS T3 C18、全長30mm、直径2.1mm、粒径1.8 μm。カラムオープン温度40。溶剤勾配: A = 水 + 0.1%ギ酸: アセトニトリル (95:5 v/v)。B = アセトニトリル + 0.05%ギ酸。勾配 = 0分間90% A、10% B; 0.2分間50% A、50% B; 0.7 ~ 1.3分間0% A、100% B; 1.4 ~ 1.6分間90% A、10% B。流量0.6 mL/min。

【0243】

実施例H1: 1-[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[7-メチル-3-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリダジン-6-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル (表P、実施例P10) の調製

10

【化52】

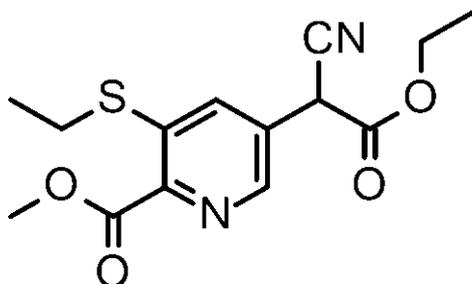


(表P, 実施例P10)

20

ステップ1: メチル5-(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソ-エチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートの調製

【化53】



30

国際公開第2017/089190号に記載されているとおり調製したメチル5-ブromo-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレート (32g、115.88 mmol) をジメチルスルホキシド (350 mL) 中に溶解した。次いで、エチル2-シアノアセテート (18.5 mL、173.82 mmol)、炭酸カリウム (40.442 g、289.70 mmol) 及び臭化テトラブチルアンモニウム (3.81 g、11.588 mmol) を室温で順次に添加した。得られた懸濁液を90で一晚攪拌し、次いで室温に冷却した。水及び酢酸エチルを添加し、得られた混合物を0で冷却し、塩酸 (2 M) をゆっくりと添加して反応をpH 4 ~ 5に酸性化した。水性層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られた粗生成物を80でエタノール (250 mL) 中において1時間加熱した。得られた溶液を0に冷却し、1時間攪拌し、ろ過した。沈殿物を冷エタノールで洗浄して、メチル5-(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソ-エチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートを得た。

40

LCMS (方法1): 309 (M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 0.85分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム-D) ppm 1.33 (t, J = 7.15 Hz, 3H) 1.45 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 2.98 - 3.05 (m, 2H)

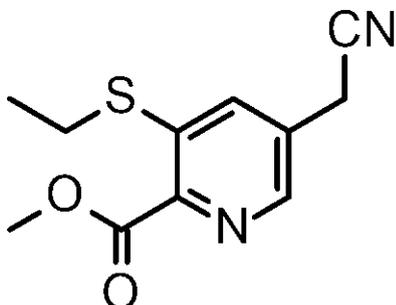
50

4.04 (s, 3H) 4.28 - 4.35 (m, 2H) 4.84 (s, 1H) 7.83 (d, J = 1.83 Hz, 1H) 8.49 (d, J = 1.83 Hz, 1H)。

【0244】

ステップ2：メチル5-(シアノメチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートの調製

【化54】



10

メチル5-(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキシ-エチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-(7.3 g、24 mmol)をジメチルスルホキシド(70 mL)中に溶解した。これにNaCl(14 g、240 mmol)及び水(35 mL)を順次室温で添加した。得られた懸濁液を125 で3時間撹拌した。反応混合物を室温に冷却し、50 mLの水及び100 mLの酢酸エチルで希釈した。水性層を酢酸エチルで3回抽出した。有機層を組み合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルで精製して、メチル5-(シアノメチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートを得た。

20

LCMS(方法1): 237 (M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 0.72分間。

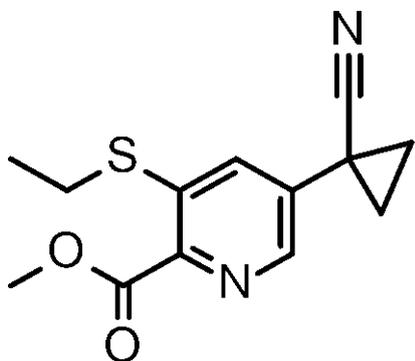
<sup>1</sup>H NMR(400 MHz, クロロホルム-D) ppm 1.45 (t, J = 7.52 Hz, 3H) 3.01 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 3.87 (s, 2H) 4.04 (s, 3H) 7.72 (d, J = 1.83 Hz, 1H) 8.35 - 8.41 (m, 1H)。

【0245】

ステップ3：メチル5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートの調製

30

【化55】



40

メチル5-(シアノメチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレート(5 g、21.16 mmol)をアセトニトリル(170 mL)中に溶解し、室温において炭酸セシウム(20.7 g、63.48 mmol)及び1,2-ジブロモエタン(2.19 mL、25.39 mmol)で処理した。得られた混合物を80 で3時間30分、次いで室温で一晩撹拌した。反応混合物を水及び酢酸エチルで希釈した。水性層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して粗生成物を得、これをクロマトグラフィにより精製して、

50

メチル 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレートを得た。

LCMS (方法 1) : 263 (M + H)<sup>+</sup>; 保持時間 : 0.85 分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム - D) ppm 1.45 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.54 - 1.62 (m, 2H) 1.89 - 1.96 (m, 2H) 3.01 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 4.02 (s, 3H) 7.74 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.17 (d, J = 1.83 Hz, 1H)。

【0246】

ステップ 4 : 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸の調製

【化 5 6】



メチル 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート ( 2.63 g、10.0 mmol ) をテトラヒドロフラン ( 50 mL ) 及び水 ( 15 mL ) 中に溶解した。次いで、水酸化リチウム ( 0.375 g、15.0 mmol ) を添加し、反応を室温で一晩撹拌した。その後、さらなる分量の水酸化リチウム ( 0.160 g、7.0 mmol ) を添加し、反応をさらに 2 時間、室温で撹拌した。反応混合物を減圧中で濃縮し、残渣をジクロロメタン中に溶解した。水性 HCl 1 M を添加し、水性層 ( pH 1 ) をジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸を得た。

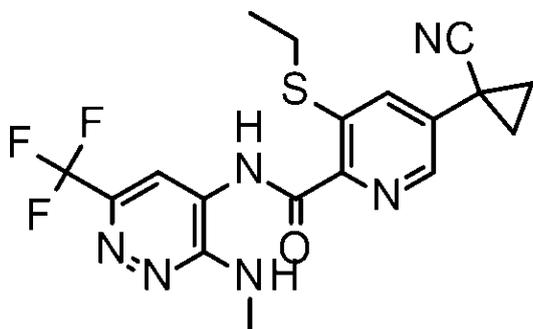
LCMS (方法 1) : 249 (M + H)<sup>+</sup>; 保持時間 : 0.67 分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO - d 溶媒) ppm 1.26 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.70 - 1.78 (m, 2H) 1.83 - 1.92 (m, 2H) 3.03 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 7.63 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.37 (d, J = 1.83 Hz, 1H) 13.16 - 13.40 (m, 1H)。

【0247】

ステップ 5 . 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 3 - (メチルアミノ) - 6 - (トリフルオロメチル)ピリダジン - 4 - イル ]ピリジン - 2 - カルボキサミドの調製

【化 5 7】



10

20

30

40

50

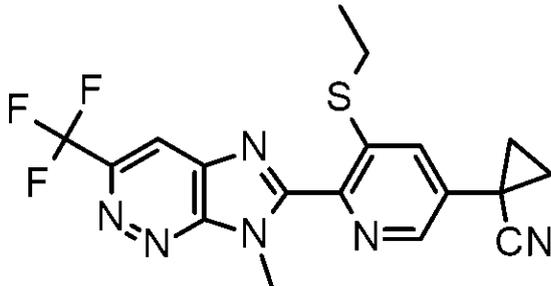
5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボ  
ン酸 ( 2 0 0 m g , 0 . 8 0 5 5 m m o l ) をジクロロメタン ( 1 0 m L ) 中に溶解し、  
N , N - ジメチルホルムアミド ( 1 0 . 0  $\mu$  L ) を添加した。この懸濁液にシリンジを介  
して二塩化オキサリル ( 0 . 1 1 8 m L , 1 . 3 6 9 m m o l ) を滴下した。得られた黄  
色がかった懸濁液を室温で攪拌した。1 . 5 時間後、反応混合物を減圧中で濃縮して、5  
- ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - 塩化カルボ  
ニルを得た。新しい5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリ  
ジン - 2 - 塩化カルボニル ( 2 5 0 m g , 0 . 9 3 7 0 m m o l ) をテトラヒドロフラン  
( 1 2 m L ) 中に溶解し、N , N - ジエチルエタンアミン ( 0 . 2 7 m L , 1 . 9 3 3 m  
m o l ) を滴下し、次いでテトラヒドロフラン ( 1 2 m L ) 中のN 3 - メチル - 6 - ( ト  
リフルオロメチル ) ピリダジン - 3 , 4 - ジアミン ( 6 5 1 m g , 3 . 2 2 2 m m o l )  
を0 で添加した。得られた混合物を室温で1 2 時間攪拌した。次いで、反応混合物を水  
( 2 0 m l ) 中に注ぎ入れ、ジクロロメタン ( 3  $\times$  2 0 m l ) で抽出した。組み合わせた  
抽出物を塩水 ( 3 0 m l ) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮し  
た。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、N - [ 4 - アミノ -  
6 - ( トリフルオロメチル ) ピリダジン - 3 - イル ] - 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) -  
3 - エチルスルファニル - N - メチル - ピリジン - 2 - カルボキサミドを得た。

LCMS ( 方法 2 ) : 保持時間 : 1 . 0 4 分間、4 2 3 ( M + H ) <sup>+</sup>。

【 0 2 4 8 】

ステップ 6 : 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 7 - メチル - 3 - ( トリフルオロメ  
チル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリダジン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパン  
カルボニトリルの調製

【 化 5 8 】



5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 3 - ( メチルア  
ミノ ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリダジン - 4 - イル ] ピリジン - 2 - カルボキサ  
ミド ( 2 4 0 m g , 0 . 5 6 8 2 m m o l ) 及び氷酢酸 ( 3 m L ) を混合し、還流で一晩  
攪拌し、次いで室温に冷却した。酢酸を減圧下で除去し、得られた残渣を酢酸エチル中に  
溶解し、重炭酸塩水溶液を用いて塩基性化した。水性層を酢酸エチル ( 3  $\times$  2 0 m l ) で  
抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗  
生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、1 - [ 5 - エチルスルファ  
ニル - 6 - [ 7 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリダジ  
ン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルを得た。

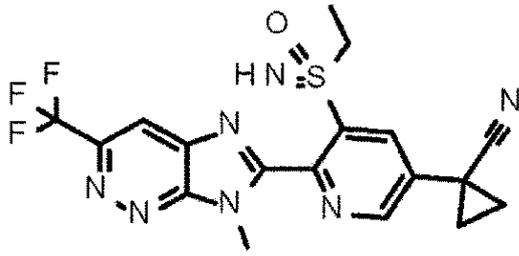
LCMS ( 方法 2 ) : 保持時間 : 1 . 0 5 分間、( M + H ) <sup>+</sup> 4 0 5 。

<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , クロロホルム - d )  $\delta$  p p m 1 . 3 4 - 1 . 4 6 ( m ,  
1 H ) 1 . 3 8 ( s , 2 H ) 1 . 6 2 - 1 . 6 6 ( m , 2 H ) 1 . 8 9 - 2 . 0 2 ( m ,  
2 H ) 2 . 9 7 - 3 . 1 0 ( m , 2 H ) 4 . 2 6 ( s , 3 H ) 7 . 7 6 - 7 . 8 4 ( m ,  
1 H ) 8 . 2 2 - 8 . 2 7 ( m , 1 H ) 8 . 3 4 - 8 . 4 1 ( m , 1 H ) 。

【 0 2 4 9 】

ステップ 7 : 1 - [ 5 - ( エチルスルホンイミドイル ) - 6 - [ 7 - メチル - 3 - ( トリ  
フルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリダジン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] シク  
ロプロパンカルボニトリル ( 表 P 、 実施例 P 1 0 ) の調製

## 【化59】



(表P, 実施例P10)

10

1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 7 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリダジン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 120 mg、0.2967 mmol ) をメタノール ( 6 mL ) 中に溶解した。次いで、アンモニウムカルバメート ( 46 mg、0.5935 mmol ) 及び ( ジアセトキシヨード ) ベンゼン ( 243 mg、0.7418 mmol ) を室温で添加した。数分後に得られた懸濁液は、溶液となり、2時間室温で撹拌した。反応混合物を水 ( 20 mL ) で失活させ、ジクロロメタン ( 3 × 20 mL ) で抽出した。組み合わせた有機層を塩水 ( 30 mL ) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。残渣を、メタノール及びジクロロメタンを用いるシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、1 - [ 5 - ( エチルスルホンイミドイル ) - 6 - [ 7 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリダジン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルを得た。

20

LCMS ( 方法 2 ) : 保持時間 : 0.85 分間、436.36 ( M + H )<sup>+</sup>。

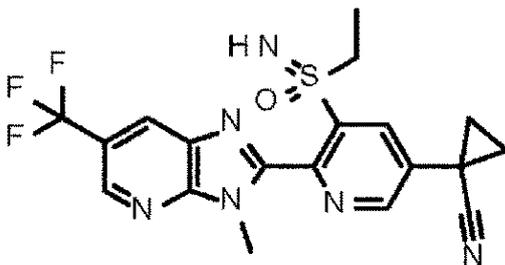
<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz, クロロホルム - d ) δ ppm 1.14 - 1.32 ( m, 3 H ) 1.25 - 1.32 ( m, 2 H ) 1.37 - 1.44 ( m, 3 H ) 1.67 - 1.77 ( m, 2 H ) 2.03 - 2.12 ( m, 1 H ) 2.06 - 2.10 ( m, 1 H ) 2.11 ( br dd, J = 3.48, 2.38 Hz, 1 H ) 2.68 - 2.84 ( m, 1 H ) 3.71 - 3.81 ( m, 1 H ) 3.84 - 3.94 ( m, 1 H ) 4.00 - 4.14 ( m, 3 H ) 8.18 ( s, 1 H ) 8.36 ( d, J = 2.20 Hz, 1 H ) 9.04 ( d, J = 2.20 Hz, 1 H )

30

## 【0250】

実施例 H 2 . 1 - [ 5 - ( エチルスルホンイミドイル ) - 6 - [ 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 実施例 P 6、表 P ) の調製

## 【化60】



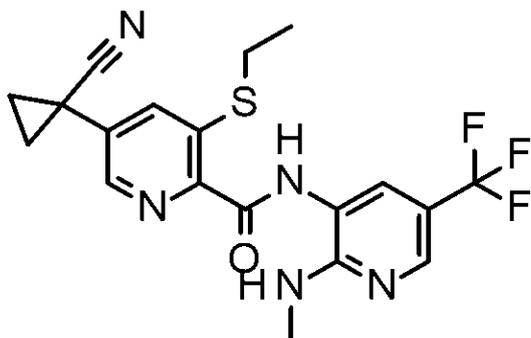
(実施例P6, 表P)

40

ステップ 1 : 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 2 - ( メチルアミノ ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] ピリジン - 2 - カルボキサミドの調製

50

## 【化61】



10

5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸 ( 2 . 4 g 、 9 . 7 m m o l ) をジクロロメタン ( 1 0 0 m L ) 中に溶解した。N , N - ジメチルホルムアミド ( 1 0 . 0 μ L ) を添加し、続いてシリンジを介して二塩化オキサリル ( 1 m L 、 1 2 m m o l ) を滴下した。得られた黄色がかった懸濁液を室温で1時間攪拌し、次いで溶剤を減圧中で濃縮した。得られた固体をテトラヒドロフラン ( 3 0 m l ) 中に溶解し、N 2 - メチル - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 , 3 - ジアミン ( 1 . 8 g 、 9 . 7 m m o l ) 及びN , N - ジエチルエタンアミン ( 3 . 3 m L 、 2 3 m m o l ) のテトラヒドロフラン ( 7 5 m L ) 中の溶液に0 で添加した。得られた混合物を0 で30分間、次いで室温で2時間攪拌した。反応混合物をNH<sub>4</sub>Cl飽和溶液で処理し、酢酸エチルで希釈した。水性層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮して、5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 2 - ( メチルアミノ ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] ピリジン - 2 - カルボキサミドを得、この粗生成物を次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。

20

LCMS ( 方法 1 ) : 4 2 2 ( M + H ) <sup>+</sup> ; 保持時間 : 1 . 0 3 分間。

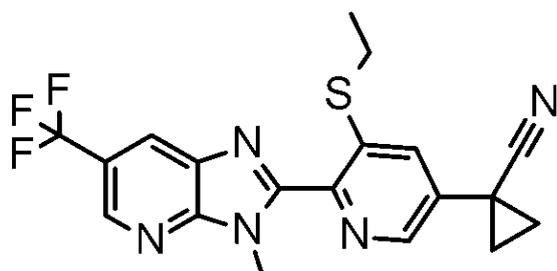
<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , クロロホルム - d ) p p m 1 . 4 8 ( t , J = 7 . 3 4 H z , 3 H ) 1 . 5 8 - 1 . 6 3 ( m , 2 H ) 1 . 9 3 - 1 . 9 9 ( m , 2 H ) 3 . 0 1 ( q , J = 7 . 3 4 H z , 2 H ) 3 . 0 9 ( d , J = 4 . 7 7 H z , 3 H ) 5 . 0 2 ( b r d , J = 4 . 0 3 H z , 1 H ) 7 . 7 1 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 7 . 9 4 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 8 . 1 6 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 8 . 3 6 ( d , J = 0 . 7 3 H z , 1 H ) 9 . 5 3 - 9 . 6 0 ( m , 1 H ) 。

30

## 【0251】

ステップ2 : 1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルの調製

## 【化62】



40

5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 2 - ( メチルアミノ ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] ピリジン - 2 - カルボキサミド ( 4 . 2 g 、 1 0 m m o l ) を酢酸 ( 1 0 0 m L ) 中に溶解し、得られた溶液を18時間、

50

110 で攪拌した。酢酸を減圧中で除去し、粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( Mp 142 - 144 ) を得た。

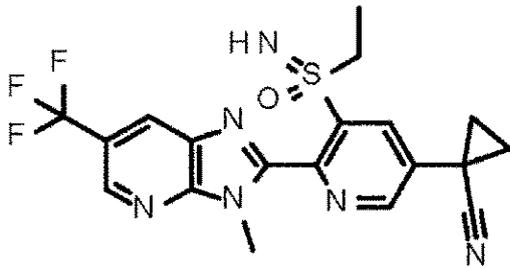
LCMS (方法1) : 404 (M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 1.07分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm 1.40 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.59 - 1.64 (m, 2H) 1.90 - 1.97 (m, 2H) 3.03 (q, J = 7.46 Hz, 2H) 4.07 (s, 3H) 7.77 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.35 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.42 (d, J = 1.47 Hz, 1H) 8.73 - 8.78 (m, 1H)。

【0252】

ステップ3: 1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( (実施例P6、表P) ) の調製

【化63】



(実施例P6, 表P)

実施例H1、ステップ7と同様のスルホキシイミン形成。

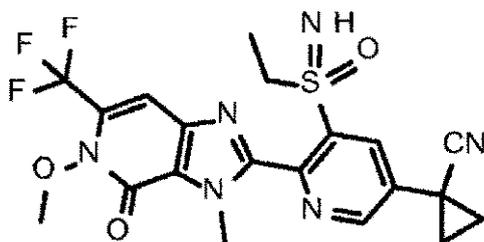
LCMS (方法1) : 435 (M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 0.87分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.44 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.75 - 1.80 (m, 2H) 2.02 - 2.08 (m, 2H) 3.94 (s, 3H) 3.94 - 4.26 (m, 2H) 8.33 (d, J = 1.47 Hz, 1H) 8.39 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.79 (d, J = 1.47 Hz, 1H) 9.06 - 9.09 (m, 1H)。

【0253】

実施例H3: 1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 5 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (実施例P8、表P) の調製

【化64】



(実施例P8, 表P)

ステップ1: N - [ 4 - ブロモ - 6 - (ジフルオロメチル) - 1 - メトキシ - 2 - オキソ - 3 - ピリジル ] - 2,2,2 - トリフルオロ - N - メチル - アセトアミドの調製

10

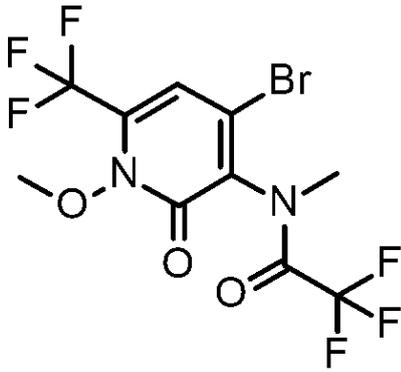
20

30

40

50

## 【化65】



10

4 - ブロモ - 1 - メトキシ - 3 - (メチルアミノ) - 6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - オン (5.0 g、16.61 mmol) のジクロロメタン (100 mL) 中の溶液にトリフルオロ酢酸無水物 (7.09 mL、49.82 mmol) を室温で添加した。反応混合物を室温で30分間攪拌し、次いで減圧中で濃縮した。水 (100 mL)、次いで飽和炭酸カリウム水溶液 (50 mL) を添加し、水性層を酢酸エチル (100 mL) で抽出した。有機層を塩水 (100 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルで精製して、純粋な N - [4 - ブロモ - 6 - (ジフルオロメチル) - 1 - メトキシ - 2 - オキソ - 3 - ピリジル] - 2, 2, 2 - トリフルオロ - N - メチル - アセトアミドを得た。この材料を次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。

20

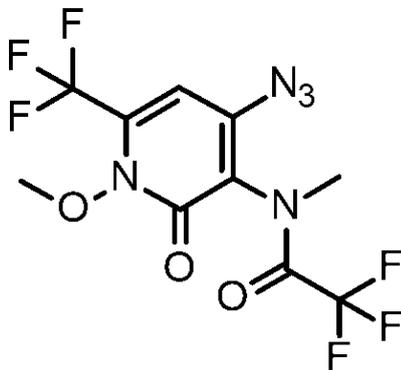
LCMS (方法5) : 397 / 399 (M+H)<sup>+</sup>、保持時間 0.96 分間。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 3.27 (s, 3H), 4.16 (s, 3H), 6.84 (s, 1H)。

## 【0254】

ステップ2 : N - [4 - アジド - 1 - メトキシ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 2, 2, 2 - トリフルオロ - N - メチル - アセトアミドの調製

## 【化66】

30



40

N - [4 - ブロモ - 1 - メトキシ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 2, 2, 2 - トリフルオロ - N - メチル - アセトアミド (11.8 g、29.7 mmol) の N, N - ジメチルホルムアミド (110 mL) 中の溶液にアジ化ナトリウム (2.9 g、44.6 mmol) を室温で添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌した。上記の反応を別々に重複して行い、次いで組み合わせた反応混合物を冷水 (500 mL) で希釈し、酢酸エチル (3 × 150 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を水 (100 mL) 及び塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、40 未満で減圧中で濃縮して、N - [4 - アジド - 1 - メトキシ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) -

50

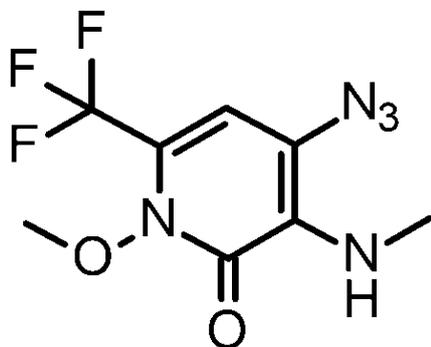
3 - ピリジル] - 2, 2, 2 - トリフルオロ - N - メチル - アセトアミドを得た。この材料を次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。

LCMS (方法5) : 360 (M+H)<sup>+</sup>、保持時間0.90分間。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 3.23 (s, 3H), 4.15 (s, 3H), 6.40 (s, 1H)。

【0255】

ステップ3 : 4 - アジド - 1 - メトキシ - 3 - (メチルアミノ) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - オンの調製

【化67】



10

20

N - [4 - アジド - 1 - メトキシ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 2, 2, 2 - トリフルオロ - N - メチル - アセトアミド (4.6 g, 13.0 mmol) のメタノール (100 mL) 中の溶液に炭酸カリウム (4.7 g, 33.0 mmol) を添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌し、次いで水 (150 mL) で希釈した。水性層を酢酸エチル (2 × 75 mL) で抽出し、組み合わせた有機層を塩水 (150 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲル (シクロヘキサン中の40%酢酸エチル) で精製して、4 - アジド - 1 - メトキシ - 3 - (メチルアミノ) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - オン (2.2 g, 8.4 mmol) を得た。

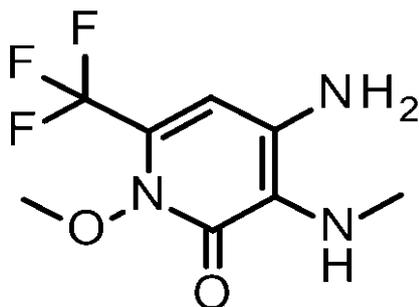
LCMS (方法E) : 264 (M+H)<sup>+</sup>、保持時間0.94分間。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 3.18 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 6.46 (s, 1H)。

30

【0256】

ステップ4 : 4 - アミノ - 1 - メトキシ - 3 - (メチルアミノ) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - オンの調製

【化68】



40

4 - アジド - 1 - メトキシ - 3 - (メチルアミノ) - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - オン (1.7 g, 6.5 mmol) のテトラヒドロフラン (50 mL) 及び水 (5 mL) 中の溶液に室温でトリフェニルホスフィン (5.1 g, 19 mmol) を添加し、得られた混合物を室温で2時間攪拌した。2 M 塩酸水溶液 (9 mL, 18 mmol、

50

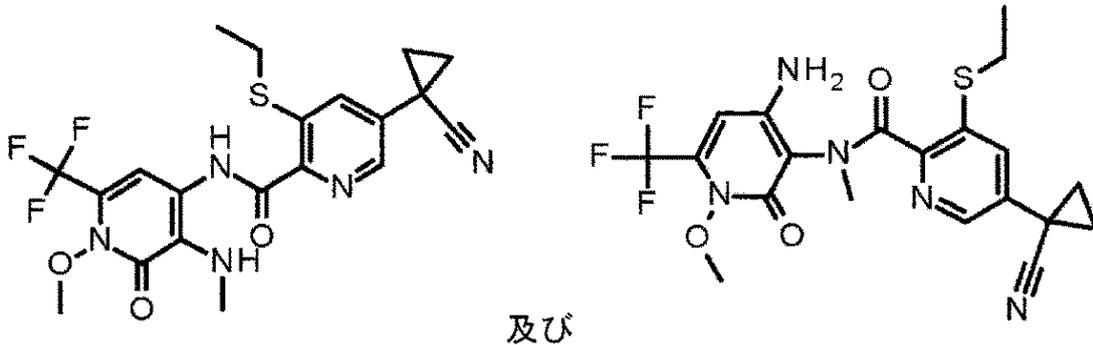
2 mol/L)を添加し、攪拌室温で一晩継続した。反応混合物を濃縮し、飽和炭酸カリウム水溶液(20 mL)を用いて失活させた。水性層を酢酸エチル(2 × 75 mL)で抽出し、組み合わせた有機層を塩水(100 mL)で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。残渣をシリカゲル(シクロヘキサン中の50~60%酢酸エチル)で精製して、4-アミノ-1-メトキシ-3-(メチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-オンを得た。

LCMS(方法5): 238(M+H)<sup>+</sup>、保持時間0.18分間。<sup>1</sup>H NMR(400 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO) ppm 2.60(s, 3H), 3.98(s, 3H), 5.75(s, 2H), 6.42(s, 1H)。

【0257】

ステップ5: 5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-N-[1-メトキシ-3-(メチルアミノ)-2-オキソ-6-(トリフルオロメチル)-4-ピリジル]ピリジン-2-カルボキサミド及びN-[4-アミノ-1-メトキシ-2-オキソ-6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-N-メチル-ピリジン-2-カルボキサミド(異性体混合物)の調製

【化69】



5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸(400 mg、1.61 mmol)のジクロロメタン(16 mL)中の懸濁液に触媒量のN,N-ジメチルホルムアミド(2滴)及び塩化オキサリル(3.22 mmol、0.287 mL)を滴下した。反応を室温で6時間攪拌し、溶剤を減圧中で除去して、5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-塩化カルボニルを得た。

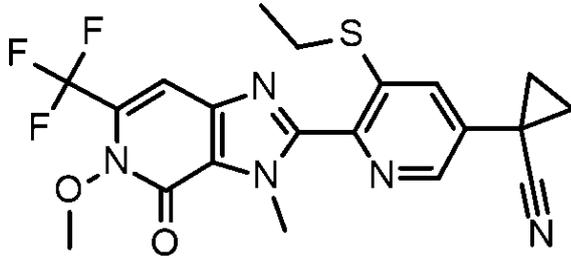
【0258】

上記の5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-塩化カルボニル(428 mg、1.60 mmol)の乾燥テトラヒドロフラン(20 mL)中の溶液を4-アミノ-1-メトキシ-3-(メチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-オン(456.6 mg、1.92 mmol)及びトリエチルアミン(0.678 mL、4.81 mmol)のテトラヒドロフラン(9.6 mL)中の混合物にゆっくりと添加した。反応混合物を室温で2時間攪拌し、次いで水で失活させ、ジクロロメタン(100 mL)で抽出した。組み合わせた有機層を水及び塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧中で濃縮して、5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-N-[1-メトキシ-3-(メチルアミノ)-2-オキソ-6-(トリフルオロメチル)-4-ピリジル]ピリジン-2-カルボキサミド及びN-[4-アミノ-1-メトキシ-2-オキソ-6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-N-メチル-ピリジン-2-カルボキサミド(750 mg、1.60 mmol)の所望の異性体混合物を得た。この材料を次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。

LCMS(方法5): 468(M+H)<sup>+</sup>、保持時間0.86分間。

【0259】

ステップ6：1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 5 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリルの調製  
【化70】



10

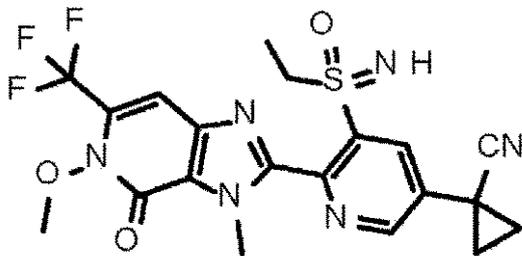
上記の5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - [ 1 - メトキシ - 3 - (メチルアミノ) - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリジル ] ピリジン - 2 - カルボキサミド及びN - [ 4 - アミノ - 1 - メトキシ - 2 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル ] - 5 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 3 - エチルスルファニル - N - メチル - ピリジン - 2 - カルボキサミド ( 750 mg、1.60 mmol ) の異性体混合物の酢酸 ( 4.8 mL ) 中の溶液を100 に48時間加熱した。室温に冷却した後、反応混合物を減圧中で濃縮した。残渣を水に注ぎ入れ、酢酸エチル ( 3 × 100 mL ) で抽出し、組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルにおけるクロマトグラフィ ( シクロヘキサン中の40%酢酸エチル ) により精製して、所望の生成物1 - [ 5 - エチルスルファニル - 6 - [ 5 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 350 mg ) を固体として得た。LCMS ( 方法E ) : 450 ( M + H ) <sup>+</sup>、保持時間1.03分間。<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz , CDCl<sub>3</sub> ) ppm 1.37 ( t , 3 H ) , 1.59 ( m , 2 H ) , 1.93 ( m , 2 H ) , 3.01 ( q , 2 H ) , 4.20 ( s , 3 H ) , 4.21 ( s , 3 H ) , 7.25 ( s , 1 H ) , 7.76 ( d , J = 2.0 Hz , 1 H ) , 8.32 ( d , J = 2.0 Hz , 1 H )。

20

30

【0260】

ステップ7：1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 5 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル ( 実施例 P 8、表 P ) の調製  
【化71】



40

(実施例P8, 表P)

実施例H1、ステップ7と同様のスルホキシイミン形成。

LCMS ( 方法5 ) : 481 ( M + H ) <sup>+</sup> ; 保持時間 : 0.85分間。

<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz , DMSO - d<sub>6</sub> ) ppm 1.14 ( t , J = 7.40 H

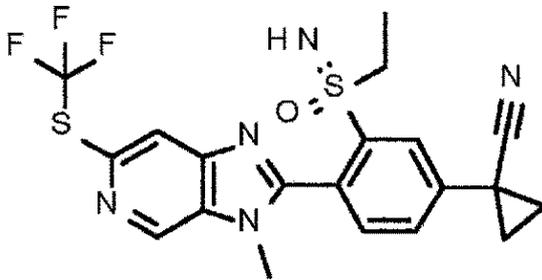
50

z, 3 H) 1.83 - 1.94 (m, 2 H) 1.97 - 2.06 (m, 2 H) 3.44 - 3.66 (m, 2 H) 3.86 (s, 3 H) 4.12 (s, 3 H) 4.56 (s, 1 H) 7.41 (s, 1 H) 8.38 (d, J = 2.20 Hz, 1 H) 8.90 (d, J = 2.20 Hz, 1 H)。

【0261】

実施例H4：1 - [3 - (エチルスルホンイミドイル) - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン - 2 - イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル(実施例P9、表P)の調製

【化72】

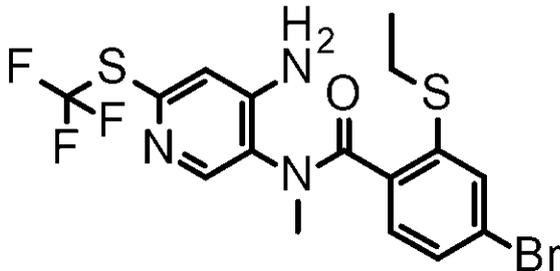


(実施例P9, 表P)

10

ステップ1：N - [4 - アミノ - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 3 - ピリジン] - 4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - N - メチル - ベンズアミドの調製

【化73】



20

30

アルゴン雰囲気下において、4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸(国際公開第2016/120182号に記載のとおり調製した(1.96 g、7.51 mmol))をジクロロメタン(30 mL)中に懸濁させ、2滴のDMFを添加した。二塩化オキサリル(1.24 g、0.851 mL、9.76 mmol)を滴下したところ、ガスの発生が観察された。混合物を4時間室温で攪拌し、次いで減圧中で濃縮して、4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - 塩化ベンゾイルを第1のステップの生成物として得た。アルゴン雰囲気下において、新たに調製した粗4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - 塩化ベンゾイル(2.07 g、7.39 mmol)をテトラヒドロフラン(20 mL)中に溶解し、国際公開第2016/169886号に記載のとおり調製したN3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)ピリジン - 3,4 - ジアミン(1.50 g、6.72 mmol)を添加した。得られた混合物を室温で一晩、次いで70 °Cで8時間攪拌した。室温で冷却した後、重炭酸ナトリウム及び水を添加した。水性層を酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮して、N - [4 - アミノ - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) - 3 - ピリジン] - 4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - N - メチル - ベンズアミドを含む混合物を得た。

40

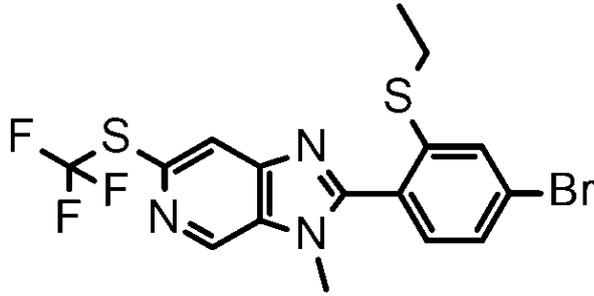
LCMS(方法1)：450(M+H)<sup>+</sup>；保持時間：1.14分間。

【0262】

ステップ2：2 - (4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - フェニル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジンの調製

50

## 【化74】



10

N - [ 4 - アミノ - 6 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 3 - ピリジル ] - 4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - N - メチル - ベンズアミド ( 3 . 4 g 、 5 . 1 mmol ) を酢酸 ( 51 mL ) 中に溶解した。得られた溶液を 120 で一晩攪拌し、次いで室温で冷却した。酢酸を減圧下で除去し、粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製した。得られた混合物を酢酸エチル中に溶解し、重炭酸塩で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮して、2 - ( 4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - フェニル ) - 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジンを得た。

LCMS ( 方法 1 ) : 450 ( M + H ) <sup>+</sup> ; 保持時間 : 1 . 14 分間。

20

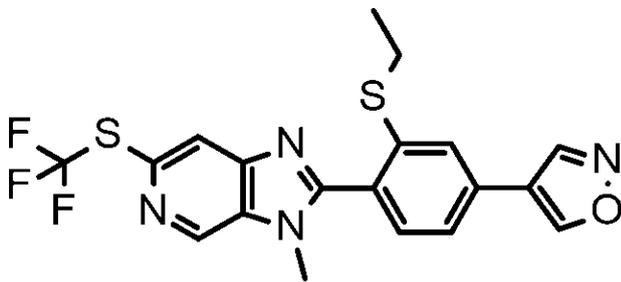
<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz , クロロホルム ) ppm 1 . 29 ( t , J = 7 . 34 Hz , 3 H ) 2 . 92 ( q , J = 7 . 34 Hz , 2 H ) 3 . 79 ( s , 3 H ) 7 . 32 ( d , J = 8 . 07 Hz , 1 H ) 7 . 50 ( dd , J = 8 . 07 , 1 . 83 Hz , 1 H ) 7 . 61 ( d , J = 1 . 83 Hz , 1 H ) 8 . 15 - 8 . 17 ( m , 1 H ) 8 . 90 ( d , J = 1 . 10 Hz , 1 H ) 。

## 【0263】

ステップ 3 : 4 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] イソキサゾールの調製

## 【化75】

30



DMSO ( 1 . 11 mL ) 及び水 ( 0 . 53 mL ) をマイクロ波バイアル中にアルゴン雰囲気下に加え、溶液をアルゴンで 5 分間パージした。次いで、2 - ( 4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - フェニル ) - 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン ( 0 . 2 g 、 0 . 446 mmol ) 、 4 - イソキサゾールボロン酸ピナコールエステル ( 0 . 104 g 、 0 . 535 mmol ) 及びフッ化カリウム ( 0 . 077 g 、 1 . 33 mmol ) を添加した。ジクロロパラジウム ; トリフェニルホスファン ( 0 . 0031 g 、 0 . 0044 mmol ) を添加し、得られた混合物をアルゴンで 5 分間パージし、90 でマイクロ波システム中において 40 分間攪拌し、室温で冷却し、次いで氷水中に注ぎ入れた。水性層をジクロロメタンで 3 回抽出した。次いで、白濁した水性層をろ過し、得られた固体をジクロロメタン中に溶解し、有機層に加えた。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られた

40

50

油を水で洗浄した。水中に形成した沈殿物をろ過し、次いでジクロロメタン中に再度溶解し、溶剤を減圧中で濃縮して、4 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] イソオキサゾールを得、これを次のステップにおいてそのまま用いた。

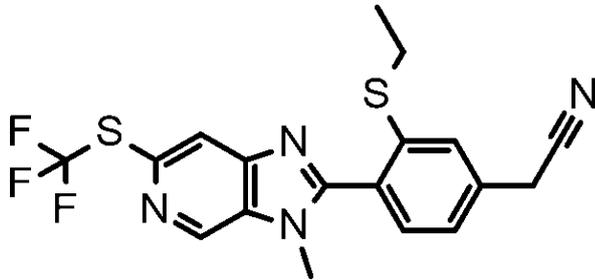
LCMS (方法1) : 437 (M + H)<sup>+</sup>; 保持時間 : 0.95 分間。

【0264】

ステップ4 : 2 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] アセトニトリルの調製

【化76】

10



4 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] イソオキサゾール (236 mg、0.3785 mmol、70 質量%) をメタノール (2 mL) 及び水 (1.14 mL) 中に溶解し、フッ化カリウム (1.14 mL、1.135 mmol) を添加した。反応混合物を 90 で 3 時間攪拌した。濃い赤色の反応混合物 (懸濁液) をろ過し、ジクロロメタンで洗浄し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムによるクロマトグラフィにより精製して、2 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] アセトニトリルを得た。

20

LCMS (方法1) : 409 (M + H)<sup>+</sup>; 保持時間 : 0.98 分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.29 (t, J = 7.34 Hz, 4H) 2.93 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 3.80 (s, 3H) 3.89 (s, 2H) 7.34 (dd, J = 7.89, 1.65 Hz, 1H) 7.47 - 7.48 (m, 1H) 7.48 - 7.51 (m, 1H) 8.16 - 8.18 (m, 1H) 8.92 (d, J = 0.73 Hz, 1H)。

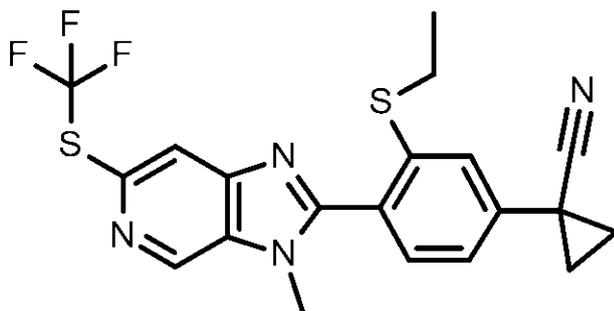
30

【0265】

ステップ5 : 1 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] シクロプロパンカルボニトリルの調製

【化77】

40



1 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスル

50

アニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル(0.108g, 0.2644mmol)をアセトニトリル(1.322mL)中に溶解した。次いで、炭酸二セシウム(0.2584g, 0.7931mmol)及び1,2-ジプロモエタン(0.1490g, 0.0683mL, 0.7931mmol)を添加した。反応混合物をマイクロ波システム下において100で2時間攪拌した。反応混合物を減圧中で濃縮した。残渣を酢酸エチル中に溶解し、水及び塩水で数回洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィで精製して、1-[3-エチルスルファニル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリルを得た。

10

LCMS(方法1): 435(M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 1.04分間。

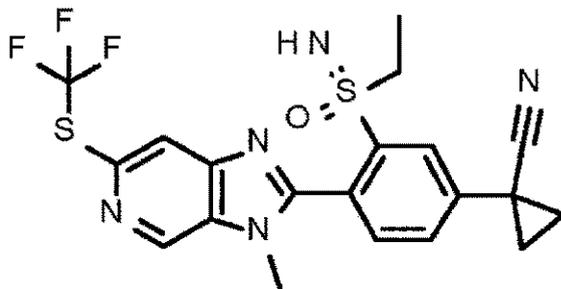
<sup>1</sup>H NMR(400MHz, クロロホルム) ppm 1.28(t, J=7.34Hz, 4H) 1.55(br d, J=2.20Hz, 2H) 1.86-1.91(m, 2H) 2.93(q, J=7.58Hz, 2H) 3.79(s, 3H) 7.17(dd, J=7.89, 2.02Hz, 1H) 7.44-7.47(m, 1H) 7.52(d, J=1.83Hz, 1H) 8.16(d, J=0.73Hz, 1H) 8.91(d, J=0.73Hz, 1H)。

【0266】

ステップ6: 1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル(実施例P9、表P)の合成

20

【化78】



(実施例P9, 表P)

30

スルホキシイミン形成を、実施例H1、ステップ7に記載されているとおり実施した。

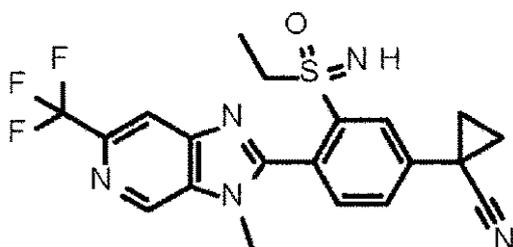
LCMS(方法1): 466(M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 0.86分間。

【0267】

実施例H5: 1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル(実施例P13、表P)の合成

【化79】

40

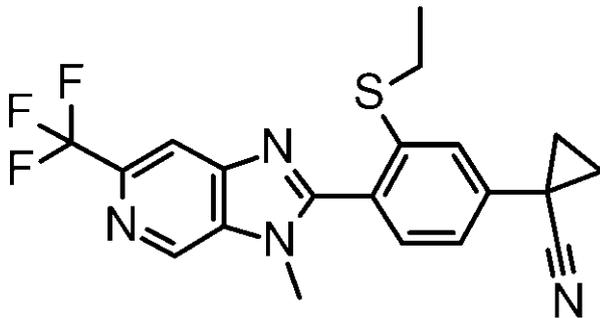


(実施例P13, 表P)

50

ステップ1：1 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4 , 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ]フェニル ]シクロプロパンカルボニトリルの調製

【化80】



10

テトラヒドロフラン ( 1 . 2 mL ) 中の、国際公開第 2 0 1 6 / 0 3 0 2 2 9 号に記載のとおり調製した 2 - ( 4 - ブロモ - 2 - エチルスルファニル - フェニル ) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4 , 5 - c ]ピリジン ( 0 . 5 g、1 . 2 0 1 mmol )、Pd<sub>2</sub>dba<sub>3</sub> ( 0 . 0 5 6 g、0 . 0 6 0 mmol ) 及び BINAP ( 0 . 0 7 7 g、0 . 1 2 0 mmol ) の混合物にシクロプロパンカルボニトリル ( 0 . 0 9 0 g、1 . 3 2 mmol ) 及びシクロプロピルメチルエーテル ( 1 . 2 0 mL ) をアルゴン雰囲気下において室温で添加した。混合物を - 2 5 ° で冷却し、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド ( 1 . 3 mL、1 . 3 2 1 mmol ) を - 2 5 °、アルゴン雰囲気下で滴下した。混合物を 8 0 ° で 2 時間攪拌した。室温で冷却した後、混合物をセライトパッドでろ過し、これを酢酸エチルで洗浄した。ろ液を水で洗浄した。水性層を分離し、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を組み合わせ、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、1 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4 , 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ]フェニル ]シクロプロパンカルボニトリルを得た。

20

LCMS (方法1) : 403 (M+H)<sup>+</sup>; 保持時間 : 1 . 0 0 分間。

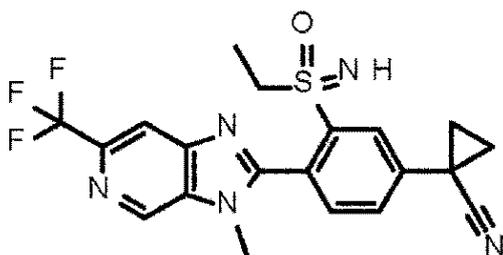
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1 . 2 7 ( t , J = 7 . 3 4 Hz , 3 H ) 1 . 5 2 - 1 . 5 7 ( m , 2 H ) 1 . 8 6 - 1 . 9 1 ( m , 2 H ) 2 . 9 1 ( q , J = 7 . 4 6 Hz , 2 H ) 3 . 8 2 ( s , 3 H ) 7 . 1 8 ( d d , J = 8 . 0 7 , 1 . 8 3 Hz , 1 H ) 7 . 4 6 ( d , J = 8 . 0 7 Hz , 1 H ) 7 . 5 2 ( d , J = 1 . 8 3 Hz , 1 H ) 8 . 1 4 ( d , J = 0 . 7 3 Hz , 1 H ) 8 . 9 5 ( s , 1 H ) 。

30

【0268】

ステップ2：1 - [ 3 - (エチルスルホンイミドイル) - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4 , 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ]フェニル ]シクロプロパンカルボニトリル (実施例 P 1 3、表 P) の合成

【化81】



(実施例P13, 表P)

40

所望の生成物を、ステップ7、実施例 H 1 に記載の標準的な手法を用いて調製した。

50

LCMS (方法1): 434 (M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 0.83分間。

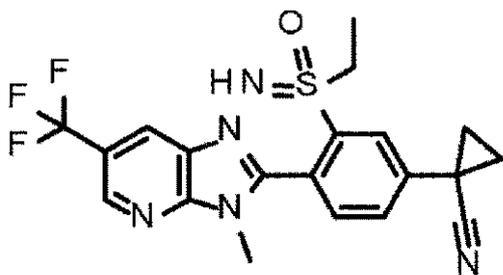
<sup>1</sup>H NMR (400MHz, クロロホルム) ppm 1.28 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.63 - 1.68 (m, 2H) 1.96 - 2.01 (m, 2H) 3.42 - 3.62 (m, 2H) 3.75 (s, 3H) 7.56 (d, J = 8.07 Hz, 1H) 7.89 (dd, J = 7.89, 2.02 Hz, 1H) 8.05 (d, J = 1.83 Hz, 1H) 8.10 (d, J = 0.73 Hz, 1H) 8.93 - 8.96 (m, 1H)。

【0269】

実施例H5: 1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパノカルボニトリル(実施例P15、表P)の合成

10

【化82】

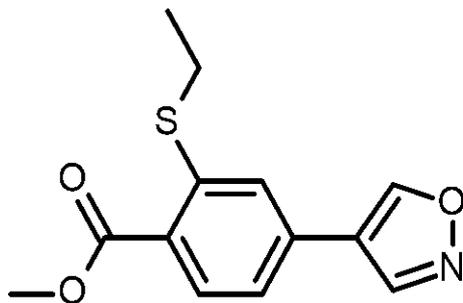


(実施例P15, 表P)

20

ステップ1: メチル2-エチルスルファニル-4-イソキサゾール-4-イル-安息香酸塩の合成

【化83】



30

メチル4-プロモ-2-エチルスルファニル-安息香酸塩(国際公開第2016/023954号)(250mg、0.91mmol)のジメチルスルホキシド(8mL)中の溶液にアルゴン雰囲気下で水(4mL)、4-イソキサゾールボロン酸ピナコールエステル(213mg、1.09mmol)及びフッ化カリウム(158mg、2.73mmol)を添加した。濃い反応混合物をアルゴンで5分間パージし、次いでビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド(6.4mg、0.009mmol)を添加した。バイアルをシールし、混合物をマイクロ波中において90℃で40分間撹拌した。反応混合物を氷水に注ぎかけ、得られた黄色がかった懸濁液をろ過し、冷水で洗浄した。この固体をジクロロメタン中に溶解し、溶液を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で乾燥するまで低減させて、メチル2-エチルスルファニル-4-イソキサゾール-4-イル-安息香酸塩を黄色がかった固体として得た。この材料を次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。

40

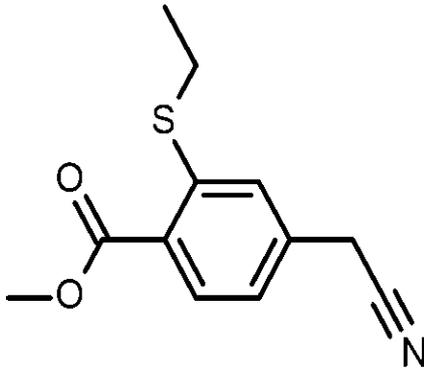
LCMS (方法1): 262 (M-H)<sup>-</sup>; 保持時間0.88分間。

【0270】

ステップ2: メチル4-(シアノメチル)-2-エチルスルファニル-安息香酸塩の合成

50

## 【化 8 4】



10

メチル 2 - エチルスルファニル - 4 - イソキサゾール - 4 - イル - 安息香酸塩 ( 7 6 0 mg、2 . 8 9 mmol ) のメタノール ( 1 5 mL ) 中の溶液に水中の 1 M フッ化カリウム溶液 ( 8 . 6 6 mL、8 . 6 6 mmol ) を添加した。反応混合物を還流で 3 時間攪拌した。冷却した後、懸濁液をろ過し、ろ液を減圧中で濃縮した。残渣をシリカゲルによる Combi flash により精製して、メチル 4 - ( シアノ - メチル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸塩をガムとして得た。

LCMS ( 方法 5 ) : 2 3 6 ( M + H ) <sup>+</sup>、保持時間 0 . 9 0 分間。

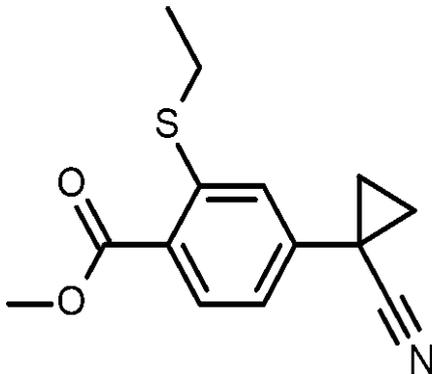
20

<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) ppm 1 . 4 2 ( t, 3 H ), 2 . 9 9 ( q, 2 H ), 3 . 8 0 ( s, 2 H ), 3 . 9 3 ( s, 3 H ), 7 . 1 0 ( dd, 1 H ), 7 . 2 8 ( d, 1 H ), 7 . 9 9 ( d, 1 H )。

## 【 0 2 7 1】

ステップ 3 : メチル 4 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸塩の合成

## 【化 8 5】



30

メチル 4 - ( シアノ - メチル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸塩 ( 3 0 0 mg、1 . 2 7 5 mmol ) のアセトニトリル ( 1 5 mL ) 中の溶液に炭酸セシウム ( 1 . 2 4 g、3 . 8 2 5 mmol ) 及び 1 , 2 - ジブロモエタン ( 7 1 9 mg、3 . 8 2 5 mmol ) を添加した。反応混合物を還流で 9 0 分間攪拌した。冷却した後、懸濁液をろ過し、ろ液を減圧中で濃縮した。残渣をシリカゲルによる Combi flash により精製して、メチル 4 - ( シアノ - メチル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸塩を油として得た。LCMS ( 方法 1 ) : 2 6 2 ( M + H ) <sup>+</sup>、保持時間 0 . 9 8 分間。<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) ppm 1 . 4 3 ( t, 3 H ), 1 . 4 8 ( m, 2 H ), 1 . 8 2 ( m, 2 H ), 3 . 0 1 ( q, 2 H ), 3 . 9 2 ( s, 3 H ), 6 . 8 8 ( dd, 1 H ), 7 . 3 5 ( d, 1 H ), 7 . 9 4 ( d, 1 H )。

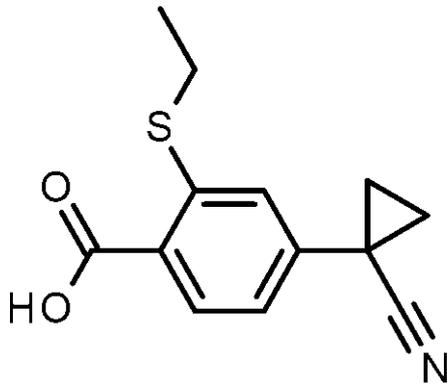
40

## 【 0 2 7 2】

50

ステップ4：4 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸の合成

【化86】



10

メチル4 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸塩 ( 198 mg、0.758 mmol ) の、テトラヒドロフラン ( 9 mL ) 及び水 ( 3 mL ) の混合物中の溶液に0 ~ 5 で水酸化リチウム ( 1.5 当量、1.137 mmol ) を添加し、反応混合物を室温で一晩攪拌した。溶液を減圧中で濃縮し、残渣を t - ブチルメチルエーテル ( 10 mL ) で希釈し、1 M 塩酸水溶液 ( 10 mL ) で酸性化した。有機層を分離し、水性層を t - ブチルメチルエーテルで抽出し、組み合わせた有機層を水及び塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮して、4 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸を固体として得た。この材料を次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。

20

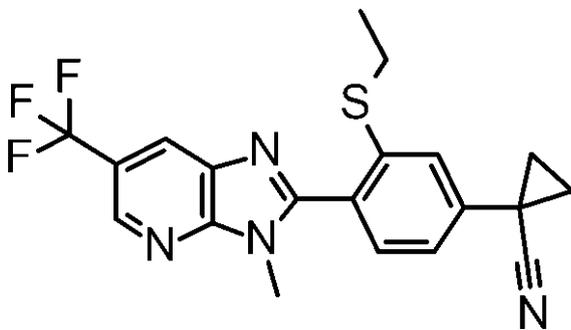
LCMS ( 方法5 ) : 246 ( M - H )<sup>-</sup>、保持時間0.83分間。<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) ppm 1.44 ( t, 3H ), 1.51 ( m, 2H ), 1.85 ( m, 2H ), 3.03 ( q, 2H ), 6.90 ( dd, 1H ), 7.41 ( d, 1H ), 8.10 ( d, 1H )。

【0273】

ステップ5 . 1 - [ 3 - エチルスルファニル - 4 - [ 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4, 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] シクロプロパンカルボニトリルの調製

30

【化87】



40

4 - ( 1 - シアノシクロプロピル ) - 2 - エチルスルファニル - 安息香酸 ( 1.7 g、6.9 mmol ) をニトロベンゼン ( 14 mL ) 中に溶解し、N2 - メチル - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2, 3 - ジアミン ( 国際公開第2017/043342号 ) ( 1.6 g、1.2 当量 ) を添加し、続いて塩化ホスホリル ( 1.6 mL、17 mmol ) を室温でゆっくりと添加した。得られた溶液を120 で7時間加熱し、TLC及びLC-MSで監視した。反応塊を30%水酸化ナトリウム溶液で失活させ、水 ( 100 mL

50

)を添加した。水性層を酢酸エチル(3×100ml)で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をクロマトグラフィにより精製して、1-[3-エチルスルファニル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリルを得た。

LCMS(方法2): 403(M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 1.18分間。

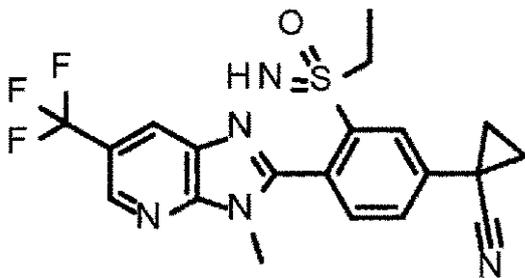
<sup>1</sup>H NMR(400MHz, クロロホルム-d) δ ppm 1.26(t, J=7.34 Hz, 3H) 1.44-1.61(m, 2H) 1.80-1.92(m, 2H) 2.91(q, J=7.42 Hz, 2H) 3.78(s, 3H) 7.16(dd, J=8.01, 1.77 Hz, 1H) 7.44(d, J=7.60 Hz, 1H) 7.50(s, 1H) 8.33(s, 1H) 8.72(s, 1H)。

10

【0274】

ステップ6: 1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル(実施例P15、表P)の調製

【化88】



20

(実施例P15, 表P)

所望の生成物を、実施例H1、ステップ7に記載されている標準的な手法を用いて調製した。

LCMS(方法1): 434(M+H)<sup>+</sup>; 保持時間: 0.88分間。

<sup>1</sup>H NMR(400MHz, クロロホルム) δ ppm 1.28(t, J=7.34 Hz, 4H) 1.63-1.68(m, 2H) 1.96-2.01(m, 2H) 3.41-3.62(m, 2H) 3.75(s, 3H) 7.56(d, J=8.07 Hz, 1H) 7.89(dd, J=7.89, 2.02 Hz, 1H) 8.05(d, J=1.83 Hz, 1H) 8.10(d, J=0.73 Hz, 1H) 8.94-8.97(m, 1H)。

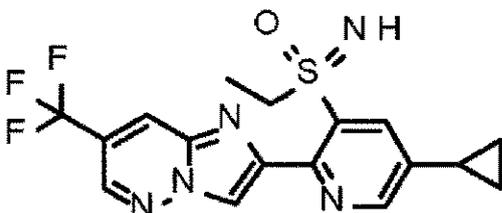
30

【0275】

実施例H6: [5-シクロプロピル-2-[7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-6-スルファン(実施例P16、表P)の合成。

【化89】

40



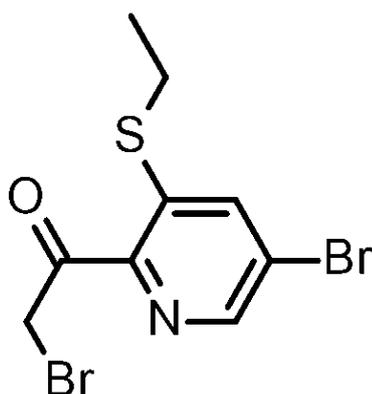
(実施例P16, 表P)

ステップ1.2-ブロモ-1-(5-ブロモ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)

50

## エタノンの調製

【化90】



10

1 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) エタノン (国際公開第 2016/071214号に記載の調製) (1 g、3.8439 mmol) のサンプルをアセトニトリル (3 mL) 及びクロロホルム (3 mL) 中に懸濁させた。ジプロモ銅 (1.7171 g、7.6879 mmol) を添加し、反応混合物を 70 に加熱し、22 時間攪拌し、その後、LC-MS が反応の完了を示した。反応混合物を、セライトを通してジクロロメタンでろ過した。ろ液を減圧中で濃縮し、得られた残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2 - ブロモ - 1 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) エタノンを得た。

20

LCMS (方法 1) : 保持時間 1.10 分間 ; 339 / 341 (M + H)<sup>+</sup>。

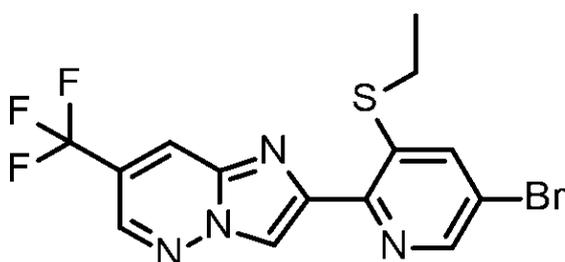
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO) ppm 1.28 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 3.06 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 4.93 (s, 2H) 8.11 (d, J = 1.83 Hz, 1H) 8.58 - 8.60 (m, 1H)。

【0276】

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

30

【化91】



40

還流凝縮器を取り付けた 3 首フラスコ中において、2 - ブロモ - 1 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) エタノン (0.50 g、1.5 mmol) 及び 5 - (トリフルオロメチル) ピリダジン - 3 - アミン (CAS [1211591-88-6]) (0.27 g、1.5 mmol) をアセトニトリル (11 mL) 中に懸濁させ、酸化マグネシウム (0.12 g、2.9 mmol) を添加した。得られた混合物を 90 に加熱し、一晚攪拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を減圧中で濃縮した。得られた固体を酢酸エチル中に溶解し、NaHCO<sub>3</sub> 飽和溶液で 1 回洗浄した。有機層を塩水で前乾燥させ、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - b] ピリダジンを得た。

50

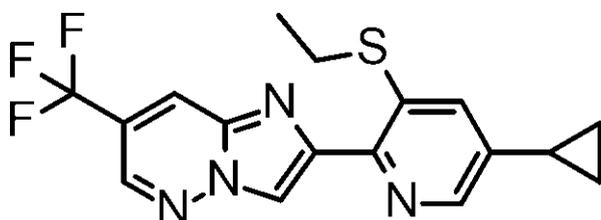
LCMS (方法1): 保持時間 1.15 分間; 403 / 405 (M+H)<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 1.44 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 3.04 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 7.82 (d, J = 1.83 Hz, 1H) 8.33 - 8.39 (m, 1H) 8.57 (dd, J = 3.85, 2.02 Hz, 2H) 8.81 - 8.86 (m, 1H)。

【0277】

ステップ3: 2-(5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-b]ピリダジンの調製

【化92】



10

100 ml の三つ首フラスコ中にトルエン (14 mL) 及び水 (0.69 mL) を仕込み、アルゴンで5分間フラッシュした。アルゴン雰囲気下において、2-(5-プロモ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-b]ピリダジン (0.30 g、0.74 mmol)、シクロプロピルボロン酸 (0.087 g、0.97 mmol)、リン酸三カリウム (0.58 g、2.6 mmol)、トリシクロヘキシルホスファン (0.022 g、0.074 mmol) 及び酢酸パラジウム (II) (0.0084 g、0.050 当量、0.037 mmol) を添加した。茶色の反応混合物を 110 °C 以下で加熱し、一晚攪拌した。次いで、混合物を室温で冷却し、水及び酢酸エチルを添加した。得られた混合物をセライトでろ過し、セライトケーキを酢酸エチルで洗浄した。有機層を分離し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2-(5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-b]ピリダジンを得た。

20

30

LCMS (方法1): 保持時間 1.08 分間; 365 (M+H)<sup>+</sup>。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム) ppm 0.81 - 0.86 (m, 2H) 1.09 - 1.16 (m, 2H) 1.39 (t, J = 7.34 Hz, 3H) 1.94 - 2.03 (m, 1H) 3.00 (q, J = 7.34 Hz, 2H) 7.36 - 7.39 (m, 1H) 8.33 (d, J = 1.83 Hz, 1H) 8.33 (s, 1H) 8.54 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.83 - 8.86 (m, 1H)。

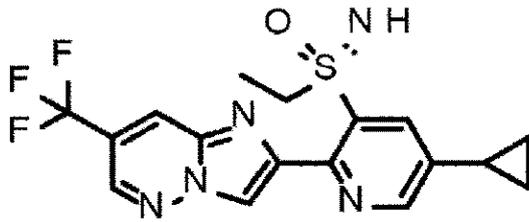
【0278】

ステップ4: [5-シクロプロピル-2-[7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-6-スルファン ( (実施例 P16、表P) ) の調製。

40

50

## 【化93】



(実施例P16, 表P)

10

2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 7 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] ピリダジン ( 0 . 0 7 g , 0 . 1 9 2 1 m m o l ) をメタノール ( 0 . 5 7 6 3 m L ) 中に懸濁させ、PhI(OAc)2 ( 0 . 1 8 9 4 g , 0 . 5 7 6 3 m m o l ) 及びアンモニウムカルバメート ( 0 . 0 3 8 2 6 g , 0 . 4 8 0 2 m m o l ) を室温で添加した。反応を室温で攪拌し、45分後、これを氷水及びチオ硫酸ナトリウムで失活させた。水性層を酢酸エチルで2回抽出した。有機層を組み合わせ、塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、[ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 7 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] ピリダジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファンを得た。

20

LCMS ( 方法 1 ) : 保持時間 0 . 8 7 分間 ; 3 9 6 ( M + H ) <sup>+</sup>。

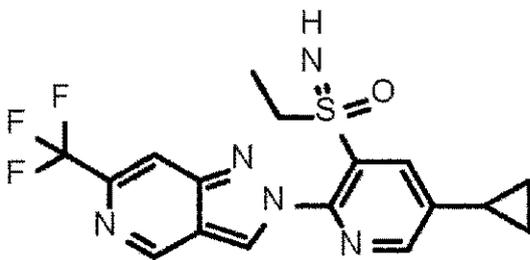
<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , クロロホルム ) p p m 0 . 8 9 - 0 . 9 5 ( m , 2 H ) 1 . 1 8 - 1 . 2 5 ( m , 2 H ) 1 . 3 6 ( t , J = 7 . 5 2 H z , 3 H ) 2 . 0 8 ( t t , J = 8 . 4 4 , 5 . 1 4 H z , 1 H ) 3 . 2 1 - 3 . 3 7 ( b r s , 1 H ) 3 . 7 1 - 3 . 9 8 ( m , 2 H ) 8 . 1 9 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 8 . 2 6 - 8 . 2 9 ( m , 1 H ) 8 . 5 8 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 8 . 6 4 ( d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H ) 8 . 7 1 - 8 . 7 4 ( m , 1 H ) 。

## 【0279】

実施例H7 : [ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン ( 実施例 P 7 、 表 P ) の合成

30

## 【化94】



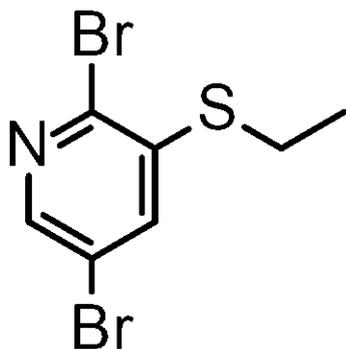
(実施例P7, 表P)

40

ステップ1 : 2 , 5 - ジブromo - 3 - エチルスルファニル - ピリジンの調製

50

## 【化 9 5】



10

ジエチルジスルフィド (7.76 g、63.5 mmol、2.00 当量) 及び亜硝酸 t-ブチル (4.91 g、47.6 mmol、1.50 当量) の DCE (60 mL) 及び DCM (40 mL) 中の溶液を 40 に加熱した。この混合物に 2,5-ジブロモピリジン-3-アミン (8.00 g、31.7 mmol、1.00 当量) のジクロロエタン (200 mL) 中の溶液を 90 分間かけてゆっくりと添加し、反応混合物を 40 でさらに 1 時間攪拌した。反応が完了した後、反応塊を冷却し、水 (100 mL) で希釈し、ジクロロメタン (2 × 100 mL) で抽出した。有機層を分離し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をカラムクロマトグラフィ (シリカゲル、5 ~ 15% 酢酸エチル/シクロヘキサン) により精製して、2,5-ジブロモ-3-エチルスルファニル-ピリジンを得た。

20

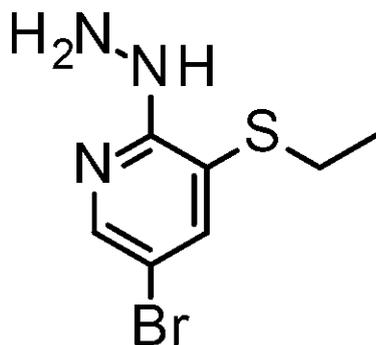
LCMS (方法 4) : 296 (M+H)<sup>+</sup>、保持時間 1.16 分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) / ppm : 1.32 (t, 3H), 2.98 (m, 2H), 7.52 (s, 1H) 8.19 (s, 1H)。

## 【0280】

ステップ 2 : (5-ブロモ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル) ヒドラジンの調製

## 【化 9 6】



30

2,5-ジブロモ-3-エチルスルファニル-ピリジン (1 g、3.3669 mmol) の 1,4-ジオキサン (10.34 g) 中の溶液にヒドラジン-水和物 (1.0113 g、20.201 mmol) を添加し、得られた混合物を 120 で 10 時間攪拌した。反応が完了した後、混合物を水 (30 mL) で希釈し、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を水 (20 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮して、(5-ブロモ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル) ヒドラジンを得た。

40

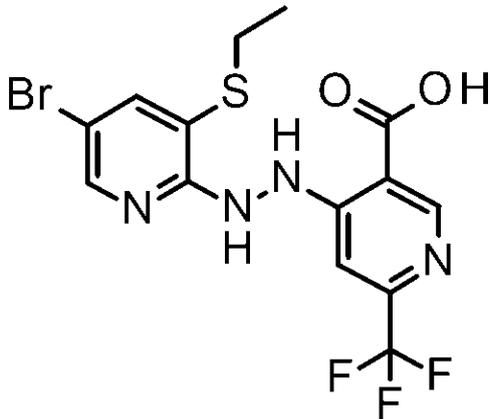
LCMS : 250 (M+H)<sup>+</sup>、保持時間 0.6 分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) / ppm : 1.26 (t, 3H) 2.81 (q, 2H) 3.10 (br, 2H) 6.67 (br, s, 1H) 7.65 (d, 1H) 8.15 (d, 1H)。

## 【0281】

50

ステップ 3 : 4 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) ヒドラジノ ] - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - カルボン酸の調製  
【化 9 7】



10

4 - クロロ - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - カルボン酸 ( CAS [ 1 0 6 0 8 1 0 - 6 6 - 3 ] ) ( 2 0 g 、 8 8 . 6 7 2 m m o l ) 、 ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) ヒドラジン ( 3 3 . 0 0 5 g 、 1 3 3 . 0 1 m m o l ) 及びペンタン - 1 - オール ( 1 2 0 m L ) を混合し、混合物を 1 1 0 °C で 1 5 時間攪拌した。反応が完了した後、混合物を減圧中で濃縮して全てのペンタノールを除去した。得られた残渣をトルエンと同時に蒸発させた。粗生成物を水 ( 1 0 0 m L ) 、塩水 ( 1 0 0 m L ) で希釈し、酢酸エチル ( 3 x 2 0 0 m L ) で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。得られた固体をシクロヘキサンで倍散して、4 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) ヒドラジノ ] - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - カルボン酸を得た。

20

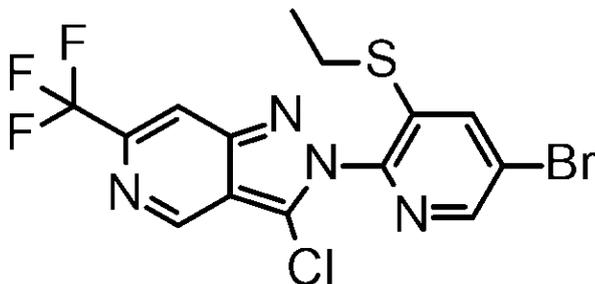
LCMS ( 方法 5 ) : 保持時間 1 . 5 0 分間、4 3 9 ( M + 2 ) +。

<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , D M S O - d 6 ) δ p p m 1 . 2 6 ( t , 3 H ) 3 . 0 5 ( q , 2 H ) 7 . 1 6 ( s , 1 H ) 7 . 8 9 ( d , 1 H ) 8 . 1 1 ( d , 1 H ) 8 . 7 7 ( s , 1 H ) 8 . 8 8 ( s , 1 H ) 9 . 8 3 ( s , 1 H ) 1 3 . 3 8 - 1 4 . 3 6 ( m , 1 H ) 。

30

【 0 2 8 2 】

ステップ 4 : 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 3 - クロロ - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジンの調製  
【化 9 8】



40

4 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) ヒドラジノ ] - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - カルボン酸 ( 2 2 . 8 7 m m o l 、 1 0 g ) をオキシ塩化リン ( 1 0 0 m L ) 中に溶解し、得られた混合物を 1 1 0 °C で加熱した。1 1 0 °C で得られた清透な溶液を 5 0 分間還流した。反応が完了した後、混合物を濃縮し ( 減圧下でオキシ塩化リンが留去 ) 、反応をジクロロメタン ( 1 1 0 m L ) で希釈し、氷水 (

50

200 mL) に注ぎ入れた。水性層をジクロロメタン (2 × 100 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を水 (200 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 3 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジンを得た。

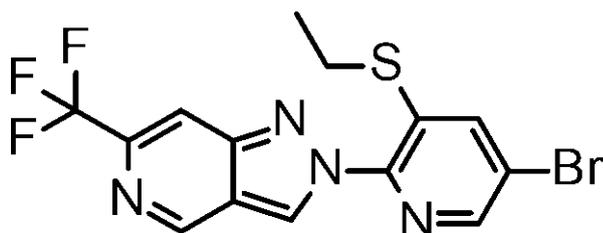
LCMS : 437 (M + H)<sup>+</sup>、保持時間 1.21 分間。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) δ ppm 1.34 (m, 3H) 2.85 (m, 2H) 7.92 (s, 2H) 8.02 (m, 1H) 8.60 (m, 1H) 9.32 (m, 1H)。

【0283】

ステップ5 : 2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジンの調製

【化99】



2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 3 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン (0.2 mmol, 0.1 g) を酢酸 (2 mL) 中に溶解し、亜鉛 (0.5 mmol, 0.03 g) を混合物にゆっくりと添加した。反応塊を 55 °C で 40 分間攪拌した。反応を LCMS & TLC により監視した。完了した後、反応混合物を水 (30 mL) に注ぎ入れ、得られた溶液を酢酸エチル (20 mL × 3) で抽出した。組み合わせた有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液 (30 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィに供して、2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジンを得た。

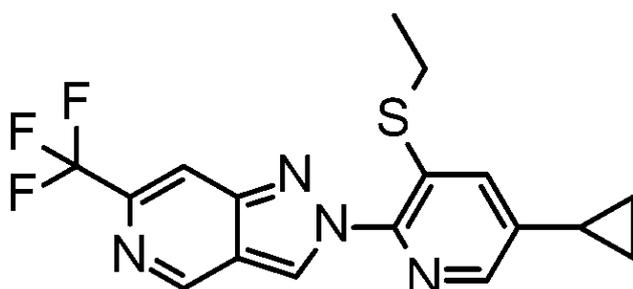
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) δ ppm 1.29 (m, 4H) 2.95 (m, 2H) 7.85 (m, 1H) 8.35 (m, 1H) 8.38 (d, 1H) 8.95 (m, 1H) 9.44 (m, 1H)。

LCMS : 保持時間 1.6 分間、403 (M + H)<sup>+</sup>。

【0284】

ステップ6 : 2 - (5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジンの調製

【化100】



マイクロ波バイアル中にトルエン (2 mL) 及び水 (1 mL) 中の 2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4,

3 - c ]ピリジン ( 0 . 1 g、0 . 2 mmol )、シクロプロピルボロン酸 ( 0 . 03 g、0 . 3 mmol )、リン酸三カリウム ( 0 . 2 g、0 . 9 mmol )、トリシクロヘキシルホスファン ( 0 . 007 g、0 . 02 mmol )を加えた。反応塊を窒素で30分間パーズした。次いで、これに酢酸パラジウム ( II ) ( 0 . 003 g、0 . 01 mmol )を添加し、反応混合物を150 でマイクロ波下において4時間攪拌した。次いで、室温で反応混合物を酢酸エチル ( 20 mL )で希釈し、水 ( 20 mL )で洗浄した。有機層を水 ( 20 mL )で洗浄し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過し、減圧中で濃縮した。化合物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより単離して、2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 6 - ( トリフルオロメチル )ピラゾロ [ 4 , 3 - c ]ピリジンを得た。

10

LCMS : 365 ( M + H )<sup>+</sup>、保持時間 1 . 12 分間。

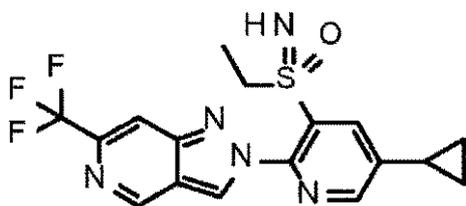
<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz , クロロホルム - d ) δ ppm 0 . 86 ( m , 2 H ) 1 . 13 ( br , 2 H ) 1 . 23 ( m , 4 H ) 2 . 90 ( q , 2 H ) 7 . 47 ( d , 1 H ) 8 . 13 ( m , 2 H ) 8 . 94 ( s , 1 H ) 9 . 40 ( m , 1 H )。

【 0285 】

ステップ7 : [ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 6 - ( トリフルオロメチル )ピラゾロ [ 4 , 3 - c ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン実施例 P 7、表 P ) の合成

【 化 101 】

20



(実施例P7, 表P)

所望の生成物を、実施例 H 1、ステップ7に記載の標準的な方法を用いて調製した。

LCMS ( 方法 5 ) : 保持時間 0 . 94 分間、396 ( M + H )<sup>+</sup>。

30

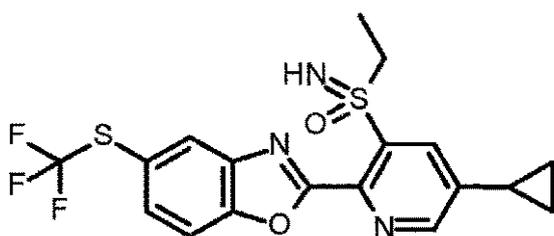
<sup>1</sup>H NMR ( 400 MHz , クロロホルム - d ) δ ppm 1 . 25 ( m , 4 H ) 1 . 44 ( m , 3 H ) 2 . 16 ( m , 1 H ) 3 . 87 ( m , 2 H ) 8 . 06 ( s , 1 H ) 8 . 29 ( d , 1 H ) 8 . 56 ( d , 1 H ) 8 . 87 ( d , 1 H ) 9 . 40 ( s , 1 H )。

【 0286 】

実施例 H 8 : [ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン ( 実施例 P 18、表 P ) の合成

【 化 102 】

40



(実施例P18, 表P)

所望の生成物を、実施例 H 1、ステップ7に記載の標準的な方法を用い、2 - ( 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール ( 国際公開第 19 / 009307 号から公知 )

50

から開始して調製した。

LCMS (方法5) : 428 (M+H)<sup>+</sup>、保持時間 : 1.03 分間。

【0287】

本発明のさらなる化合物は、上記の方法と同様に調製可能である。本発明をさらに例示するために調製した化合物を表Pに列挙する。

【0288】

【表13-1】

項目	IUPAC名	構造	RT (min)	[M+H] <sup>+</sup> (実測)	方法	MP°C
P1	1-[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[7-メチル-3-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-6-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボキサミド		0.87	454	5	253 - 255
P2	1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボキサミド		0.88	452	5	235 - 237
P3	[5-シクロプロピル-2-[3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルホニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.91	474	1	-
P4	[5-シクロプロピル-2-[3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.90	442	1	-
P5	[5-シクロプロピル-2-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.85	411	1	-
P6	1-[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		0.87	435	1	-
P7	[5-シクロプロピル-2-[6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.94	396	5	75 - 77

10

20

30

40

50

【表 1 3 - 2】

P8	1-[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[5-メトキシ-3-メチル-4-オキソ-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		0.85	481	5	163 - 165
P9	1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル		0.86	466	1	191 - 193
P10	1-[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[7-メチル-3-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリダジン-6-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		0.82	436	5	182 - 184
P11	[5-シクロプロピル-2-[7-メチル-3-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリダジン-6-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.84	411	1	-
P12	[5-シクロプロピル-2-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.89	410	1	-
P13	1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]シクロプロパンカルボニトリル		0.83	434	1	-
P14	1-[6-[5-エチル-3-メチル-4-オキソ-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-5-(エチルスルホンイミドイル)-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		0.92	479	5	176 - 178

10

20

30

40

50

【表 13 - 3】

P15	1-[3-(エチルスルホンイミドイル)-4-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)フェニル]シクロプロパンカルボニトリル		0.88	434	1	117 - 117
P16	[5-シクロプロピル-2-[7-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		0.87	396	1	119-121
P17	1-[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-2-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		0.91	421	5	170 - 172
P18	[5-シクロプロピル-2-[5-(トリフルオロメチルスルファニル)-1,3-ベンゾキサゾール-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.03	428	5	224 - 226
P19	[5-シクロプロピル-2-[5-(トリフルオロメチルスルホニル)-1,3-ベンゾキサゾール-2-イル]-3-ピリジル]-エチル-イミノ-オキソ-λ <sup>6</sup> -スルファン		1.10	460	5	-

10

20

30

## 【0289】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的に、殺ダニ的に及び/又は殺真菌的に活性な成分を加えることにより、かなり範囲が拡大され、一般的な状況に適合され得る。式Iの化合物と、他の殺虫的に、殺ダニ的に及び/又は殺真菌的に活性な成分との混合物が、より広い意味で、相乗活性として記載されることもあるさらなる意外な利点も有し得る。例えば、植物によるより良好な耐容性、減少した植物毒性、昆虫がそれらの異なる発育段階で防除され得ること又はそれらの製造中、例えば粉碎若しくは混合中、それらの貯蔵中若しくはそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

40

## 【0290】

本明細書における有効成分への好適な添加剤は、例えば、以下の種類の有効成分が代表例である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼若ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイド及びバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

## 【0291】

式Iの化合物と、有効成分との以下の混合物が好ましい(「TX」という略語は、「本発明の表Y-1~Y-8、X-1~X-8、U-1~U-2及びV-1~V-6並びに表

50

Pに記載される化合物からなる群から選択される1つの化合物」を意味する) :

石油(代替名)(628)+TXからなる物質の群から選択される補助剤、

1,1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール(IUPAC名)(910)+TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1059)+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセドアミド(IUPAC名)(1295)+TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン(IUPAC名)(981)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセキノシル(3)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、シペルメトリン(202)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドフルメト[CCN]+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミトン(875)+TX、アミトンシュウ酸水素塩(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アラマイト(881)+TX、三酸化二ヒ素(882)+TX、AVI 382(化合物コード)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888)+TX、アゾシクロチン(46)+TX、アゾトエート(889)+TX、ベノミル(62)+TX、ベノキサホス(代替名)[CCN]+TX、ベンゾキシメート(71)+TX、安息香酸ベンジル(IUPAC名)[CCN]+TX、ピフェナゼート(74)+TX、ピフェントリン(76)+TX、ピナバクリル(907)+TX、プロフェンバレレート(代替名)+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホス-エチル(921)+TX、プロモプロピレート(94)+TX、プロプロフェジン(99)+TX、プトカルボキシム(103)+TX、プトキシカルボキシム(104)+TX、プチルピリダベン(代替名)+TX、多硫化カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロル(941)+TX、カーバノレート(943)+TX、カルバリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、カルボフェノチオン(947)+TX、CGA 50'439(開発コード)(125)+TX、キノメチオナト(126)+TX、クロルベンシド(959)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルム塩酸塩(964)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、クロルフェネトール(968)+TX、クロルフェンソン(970)+TX、クロルフェンスルフィド(971)+TX、クロルフェンピンホス(131)+TX、クロロベンジレート(975)+TX、クロロメブホルム(977)+TX、クロロメチウロン(978)+TX、クロロプロピレート(983)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホス-メチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、シネリンI(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリン(696)+TX、クロフェンテジン(158)+TX、クロサンテル(代替名)[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クロタミトン(代替名)[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クフラネブ(1013)+TX、シアントエート(1020)+TX、シフルメトフェン(CAS登録番号:400882-07-7)+TX、シハロトリン(196)+TX、シヘキサチン(199)+TX、シペルメトリン(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン-O(1037)+TX、デメフィオン-S(1037)+TX、デメトン(1038)+TX、デメトン-メチル(224)+TX、デメトン-O(1038)+TX、デメトン-O-メチル(224)+TX、デメトン-S(1038)+TX、デメトン-S-メチル(224)+TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039)+TX、ジアフェンチウロン(226)+TX、ジムプロピリダズ+TX、ジアリホス(1042)+TX、ジアジノン(227)+TX、ジクロフルアニド(230)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジコホル(242)+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジエノクロル(1071)+TX、ジメホックス(1081)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジナクチン(代替名)(653)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクス-ジクレキシシ(1089)+TX、ジノプトン(269)+TX、ジノカップ(270)+TX、ジノカッ

10

20

30

40

50

プ - 4 [CCN] + TX、ジノカップ - 6 [CCN] + TX、ジノクトン (1090) + TX、ジノペントン (1092) + TX、ジノスルホン (1097) + TX、ジノテルボン (1098) + TX、ジオキサチオン (1102) + TX、ジフェニルスルホン (IUPAC名) (1103) + TX、ジスルフィラム (代替名) [CCN] + TX、ジスルホトン (278) + TX、DNOC (282) + TX、ドフェナピン (1113) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エンドスルファン (294) + TX、エンドチオン (1121) + TX、EPN (297) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エチオン (309) + TX、エトエート - メチル (1134) + TX、エトキサゾール (320) + TX、エトリムホス (1142) + TX、フェナザフロル (1147) + TX、フェナザキン (328) + TX、酸化フェンブタズ (330) + TX、フェノチオカルブ (337) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンピロキシメート (345) + TX、フェンゾン (1157) + TX、フェントリファニル (1161) + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィプロニル (354) + TX、フルアクリピリム (360) + TX、フルアズロン (1166) + TX、フルベンジミン (1167) + TX、フルシクロクスロン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネチル (1169) + TX、フルフェノクスロン (370) + TX、フルメトリン (372) + TX、フルオルベンシド (1174) + TX、フルバリネート (1184) + TX、FMC 1137 (開発コード) (1185) + TX、ホルメタネート (405) + TX、塩酸ホルメタネート (405) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート (1193) + TX、HCH (430) + TX、グリオジン (1205) + TX、ハルフェンブロックス (424) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート (IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (1216) + TX、ヘキシチアゾクス (441) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イソカルボホス (代替名) (473) + TX、イソプロピルO - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチレート (IUPAC名) (473) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリンI (696) + TX、ジャスモリンII (696) + TX、ヨードフェンホス (1248) + TX、リンダン (430) + TX、ルフェヌロン (490) + TX、マラチオン (492) + TX、マロノベン (1254) + TX、メカルバム (502) + TX、メホスホラン (1261) + TX、メスルフェン (代替名) [CCN] + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メトミル (531) + TX、臭化メチル (537) + TX、メトルカルブ (550) + TX、メピンホス (556) + TX、メキサカルベート (1290) + TX、ミルベメクチン (557) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、ミパホックス (1293) + TX、モノクロトホス (561) + TX、モルホチオン (1300) + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ナレド (567) + TX、NC - 184 (化合物コード) + TX、NC - 512 (化合物コード) + TX、ニフルリジド (1309) + TX、ニコマイシン (代替名) [CCN] + TX、ニトリラカルブ (1313) + TX、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 (1313) + TX、NNI - 0101 (化合物コード) + TX、NNI - 0250 (化合物コード) + TX、オメトエート (594) + TX、オキサミル (602) + TX、オキシデプロホス (1324) + TX、オキシジスルホトン (1325) + TX、pp' - DDT (219) + TX、パラチオン (615) + TX、ベルメトリン (626) + TX、石油 (代替名) (628) + TX、フェンカプトン (1330) + TX、フェントエート (631) + TX、ホレート (636) + TX、ホサロン (637) + TX、ホスホラン (1338) + TX、ホスメット (638) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホキシム (642) + TX、ピリミホス - メチル (652) + TX、ポリクロロテルペン (慣用名) (1347) + TX、ポリナクチン (代替名) (653) + TX、プロクロノール (1350) + TX、プロフェノホス (662) + TX、プロマシル (1354) + TX、プロパルギット (671) + TX、プロペタンホス (673) + TX、プロボク

10

20

30

40

50

サー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロトエート(1362)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、キナルホス(711)+TX、キンチオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、RA-17(開発コード)(1383)+TX、ロテノン(722)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、ソファミド(1402)+TX、スピロジクロフェン(738)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、SSI-121(開発コード)(1404)+TX、スルフィラム(代替名)[CCN]+TX、スルフアルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、硫黄(754)+TX、SZE-121(開発コード)(757)+TX、フルバリネート(398)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、TEPP(1417)+TX、テルバム(代替名)+TX、テトラクロルピンホス(777)+TX、テトラジホン(786)+TX、テトラナクチン(代替名)(653)+TX、テトラスル(1425)+TX、チアフェノックス(代替名)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオファノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオキノックス(1436)+TX、ツリンギエンシン(代替名)[CCN]+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアラテン(1443)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリクロルホン(824)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリナクチン(代替名)(653)+TX、バミドチオン(847)+TX、バニリプロール[CCN]及びYI-5302(化合物コード)+TXからなる物質の群から選択される殺ダニ剤、

10

20

ベトキサジン[CCN]+TX、ジオクタン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、硫酸銅(172)+TX、シプトリン[CCN]+TX、ジクロン(1052)+TX、ジクロロフェン(232)+TX、エンドタール(295)+TX、フェンチン(347)+TX、消石灰[CCN]+TX、ナーバム(566)+TX、キノクラミン(714)+TX、キノナミド(1379)+TX、シマジン(730)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)及び水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TXからなる物質の群から選択される殺藻剤、

30

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

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

40

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン(IUPAC名)(1222)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、8-ヒドロキシキノリン硫酸塩(446)+TX、プロノポール(97)+TX、ジオクタン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、水酸化銅(IUPAC名)(169)+TX、クレゾール[CCN]+TX、ジクロロフェン(232)+TX、ジピリチオン(1105)+TX、ドジシン(1112)+TX、フェナミノスルフ(1144)+TX、ホルムアルデヒド(404)+TX、ヒドラルガフェン(代替名)[CCN]+TX、カスガマイシン(483)+TX、塩酸カスガマイシン水和物(483)+TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308)+TX、ニトラピリン(580)+TX、オクチリノン(590)+TX、オキソリン酸(606)

50

) + TX、オキシテトラサイクリン ( 6 1 1 ) + TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩 ( 4 4 6 ) + TX、プロベナゾール ( 6 5 8 ) + TX、ストレプトマイシン ( 7 4 4 ) + TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン ( 7 4 4 ) + TX、テクロフタラム ( 7 6 6 ) + TX 及びチオメルサル ( 代替名 ) [ C C N ] + TX からなる物質の群から選択される殺菌剤、

コカクモンハマキ ( *Adoxophyes orana* ) GV ( 代替名 ) ( 1 2 ) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター ( *Agrobacterium radiobacter* ) ( 代替名 ) ( 1 3 ) + TX、ムチカブリダニ属 ( *Amblyseius* spp. ) ( 代替名 ) ( 1 9 ) + TX、アナグラファ・ファルシフェラ ( *Anagrapta falcifera* ) NPV ( 代替名 ) ( 2 8 ) + TX、アナグルス・アトムス ( *Anagrus atomus* ) ( 代替名 ) ( 2 9 ) + TX、アフエリヌス・アブドミナリス ( *Aphelinus abdominalis* ) ( 代替名 ) ( 3 3 ) + TX、アフイジウス・コレマニ ( *Aphidius colemani* ) ( 代替名 ) ( 3 4 ) + TX、アフイドレテス・アフイディマイザ ( *Aphidoletes aphidimyza* ) ( 代替名 ) ( 3 5 ) + TX、オートグラファ・カリフォルニカ ( *Autographa californica* ) NPV ( 代替名 ) ( 3 8 ) + TX、バチルス・フィルムス ( *Bacillus firmus* ) ( 代替名 ) ( 4 8 ) + TX、バチルス・スフェリクス・ネイデ ( *Bacillus sphaericus Neide* ) ( 学名 ) ( 4 9 ) + TX、バチルス・チューリングェンシス・ベルリナー ( *Bacillus thuringiensis Berliner* ) ( 学名 ) ( 5 1 ) + TX、バチルス・チューリングェンシス亜種アイザワイ ( *Bacillus thuringiensis subsp. aizawai* ) ( 学名 ) ( 5 1 ) + TX、バチルス・チューリングェンシス亜種イスラエンス ( *Bacillus thuringiensis subsp. israelensis* ) ( 学名 ) ( 5 1 ) + TX、バチルス・チューリングェンシス亜種ジャポネンシス ( *Bacillus thuringiensis subsp. japonensis* ) ( 学名 ) ( 5 1 ) + TX、バチルス・チューリングェンシス亜種クルスターキ ( *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* ) ( 学名 ) ( 5 1 ) + TX、バチルス・チューリングェンシス亜種テネブリオニス ( *Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis* ) ( 学名 ) ( 5 1 ) + TX、ビューベリア・バシアナ ( *Beauveria bassiana* ) ( 代替名 ) ( 5 3 ) + TX、ビューベリア・ブロングニアルティ ( *Beauveria brongniartii* ) ( 代替名 ) ( 5 4 ) + TX、ヤマトクサカゲロウ ( *Chrysoperla carnea* ) ( 代替名 ) ( 1 5 1 ) + TX、ツマアカオオテントウムシ ( *Cryptolaemus montrouzieri* ) ( 代替名 ) ( 1 7 8 ) + TX、コドリンガ ( *Cydia pomonella* ) GV ( 代替名 ) ( 1 9 1 ) + TX、ハモグリコマコバチ ( *Dacnusa sibirica* ) ( 代替名 ) ( 2 1 2 ) + TX、イサエアヒメコバチ ( *Diglyphus isaea* ) ( 代替名 ) ( 2 5 4 ) + TX、オンシツツヤコバチ ( *Encarsia formosa* ) ( 学名 ) ( 2 9 3 ) + TX、サバクツヤコバチ ( *Eretmocerus eremicus* ) ( 代替名 ) ( 3 0 0 ) + TX、アメリカタバコガ ( *Helicoverpa zea* ) NPV ( 代替名 ) ( 4 3 1 ) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ ( *Heterorhabditis bacteriophora* ) 及び H. メギディス ( *H. megidis* ) ( 代替名 ) ( 4 3 3 ) + TX、サカハチテントウ ( *Hippodamia convergens* ) ( 代替名 ) ( 4 4 2 ) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ ( *Leptomastix dactylopii* ) ( 代替名 ) ( 4 8 8 ) + TX、マクロロフス・カリギノスス ( *Macrolophus caliginosus* ) ( 代替名 ) ( 4 9 1 ) + TX、ヨトウガ ( *Mamestra brassicae* ) NPV ( 代替名 ) ( 4 9 4 ) + TX、メタフィカス・ヘルボルス ( *Metaphycus helvolus* ) ( 代替名 ) ( 5 2 2 ) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリズム ( *Metarhizium anisopliae var. acridum* ) ( 学名 ) ( 5 2 3 ) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソ

10

20

30

40

50

プリエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び *N. lecontei* NPV (代替名) (575) + TX、オリウス属 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 多カブシド核多角体病ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナーネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、  
 スタイナーネマ・カルボカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・フェルティアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・グラッセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、  
 スタイナーネマ・リオブラビス (*Steinernema riobravis*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ属 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラムマ属 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及び  
 パーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、  
 ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及び臭化メチル (537) + TX からなる物質の群から選択される土壤滅菌剤、  
 アフォレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘンパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアフォレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、  
 チオヘンパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] 及びウレデパ (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される不妊化剤、  
 (E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテート及び (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC 名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オール及び 4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC 名) (544) +

10

20

30

40

50

TX、 - マルチストリアチン（代替名）[CCN] + TX、プレビコミン（代替名）[CCN] + TX、コドレリア（代替名）[CCN] + TX、コドレモン（代替名）(167) + TX、キューリア（代替名）(179) + TX、ディスパールア(277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート（IUPAC名）(286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート（IUPAC名）(287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート（IUPAC名）(284) + TX、ドミニカルア（代替名）[CCN] + TX、4 - メチルオクタン酸エチル（IUPAC名）(317) + TX、オイゲノール（代替名）[CCN] + TX、フロンタリン（代替名）[CCN] + TX、ゴシッブルア（代替名）(420) + TX、グランドルア(421) + TX、グランドルアI（代替名）(421) + TX、グランドルアII（代替名）(421) + TX、グランドルアIII（代替名）(421) + TX、グランドルアIV（代替名）(421) + TX、ヘキサルア[CCN] + TX、イブスジエノール（代替名）[CCN] + TX、イブセノール（代替名）[CCN] + TX、ジャポニルア（代替名）(481) + TX、リネアチン（代替名）[CCN] + TX、リトルア（代替名）[CCN] + TX、ルーブルア（代替名）[CCN] + TX、メドルア[CCN] + TX、メガトモ酸（代替名）[CCN] + TX、メチルオイゲノール（代替名）(540) + TX、ムスカルア(563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート（IUPAC名）(588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート（IUPAC名）(589) + TX、オルフラルア（代替名）[CCN] + TX、オリクタールア（代替名）(317) + TX、オストラモン（代替名）[CCN] + TX、シグルア[CCN] + TX、ソルジジン（代替名）(736) + TX、スルカトール（代替名）[CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート（IUPAC名）(785) + TX、トリメドルア(839) + TX、トリメドルアA（代替名）(839) + TX、トリメドルアB<sub>1</sub>（代替名）(839) + TX、トリメドルアB<sub>2</sub>（代替名）(839) + TX、トリメドルアC（代替名）(839) 及びトランク - コール（trunc - call）（代替名）[CCN] + TXからなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

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

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン（IUPAC / ケミカルアブストラクツ名）(1058) + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス(4 - エチルフェニル)エタン（IUPAC名）(1056)、+ TX、1, 2 - ジクロロプロパン（IUPAC / ケミカルアブストラクツ名）(1062) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン及び1, 3 - ジクロロプロペン（IUPAC名）(1063) + TX、1 - ブロモ - 2 - クロロエタン（IUPAC / ケミカルアブストラクツ名）(916) + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル)エチルアセテート（IUPAC名）(1451) + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルルホスフェート（IUPAC名）(1066) + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル)フェニルジメチルカルバメート（IUPAC / ケミカルアブストラクツ名）(1109) + TX、2 - (2 - ブトキシエトキシ)エチルチオシアネート（IUPAC / ケミカルアブストラクツ名）(935) + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル)フェニルメチルカルバメート（IUPAC / ケミカルアブストラクツ名）(1084) + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ)エタノール（IUPAC名）(986) + TX、2 - クロロビニルジエチルホスフェート（IUPAC名）(984) + TX、2 - イミダゾリドン（IUPAC名）(1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン

10

20

30

40

50

( I U P A C 名 ) ( 1 2 4 6 ) + T X、 2 - メチル ( プロパ - 2 - イニル ) アミノフェニルメチルカルバメート ( I U P A C 名 ) ( 1 2 8 4 ) + T X、 2 - チオシアナトエチルラウレート ( I U P A C 名 ) ( 1 4 3 3 ) + T X、 3 - ブロモ - 1 - クロロプロバ - 1 - エン ( I U P A C 名 ) ( 9 1 7 ) + T X、 3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート ( I U P A C 名 ) ( 1 2 8 3 ) + T X、 4 - メチル ( プロパ - 2 - イニル ) アミノ - 3、 5 - キシリルメチルカルバメート ( I U P A C 名 ) ( 1 2 8 5 ) + T X、 5、 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート ( I U P A C 名 ) ( 1 0 8 5 ) + T X、 アバメクチン ( 1 ) + T X、 アセフェート ( 2 ) + T X、 アセタミプリド ( 4 ) + T X、 アセチオン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 アセトプロール [ C C N ] + T X、 アクリナトリン ( 9 ) + T X、 アクリロニトリル ( I U P A C 名 ) ( 8 6 1 ) + T X、 アラニカルブ ( 1 5 ) + T X、 アルジカルブ ( 1 6 ) + T X、 アルドキシカルブ ( 8 6 3 ) + T X、 アルドリン ( 8 6 4 ) + T X、 アレトリン ( 1 7 ) + T X、 アロサミジン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 アリキシカルブ ( 8 6 6 ) + T X、 - シペルメトリン ( 2 0 2 ) + T X、 - エクジソン ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 リン化アルミニウム ( 6 4 0 ) + T X、 アミジチオン ( 8 7 0 ) + T X、 アミドチオエート ( 8 7 2 ) + T X、 アミノカルブ ( 8 7 3 ) + T X、 アミトン ( 8 7 5 ) + T X、 アミトンシュウ酸水素塩 ( 8 7 5 ) + T X、 アミトラズ ( 2 4 ) + T X、 アナバシン ( 8 7 7 ) + T X、 アチダチオン ( 8 8 3 ) + T X、 A V I 3 8 2 ( 化合物コード ) + T X、 A Z 6 0 5 4 1 ( 化合物コード ) + T X、 アザジラクチン ( 代替名 ) ( 4 1 ) + T X、 アザメチホス ( 4 2 ) + T X、 アジンホス - エチル ( 4 4 ) + T X、 アジンホス - メチル ( 4 5 ) + T X、 アゾトエート ( 8 8 9 ) + T X、 バチルス・チューリゲンシス ( *Bacillus thuringiensis* ) デルタエンドトキシン ( 代替名 ) ( 5 2 ) + T X、 ヘキサフルオロケイ酸バリウム ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 多硫化バリウム ( I U P A C / ケミカルアブストラクツ名 ) ( 8 9 2 ) + T X、 パルトリン [ C C N ] + T X、 Bayer 2 2 / 1 9 0 ( 開発コード ) ( 8 9 3 ) + T X、 Bayer 2 2 4 0 8 ( 開発コード ) ( 8 9 4 ) + T X、 ベンジオカルブ ( 5 8 ) + T X、 ベンフラカルブ ( 6 0 ) + T X、 ベンスルタップ ( 6 6 ) + T X、 - シフルトリン ( 1 9 4 ) + T X、 - シペルメトリン ( 2 0 3 ) + T X、 ビフェントリン ( 7 6 ) + T X、 ビオアレトリン ( 7 8 ) + T X、 ビオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 ( 代替名 ) ( 7 9 ) + T X、 ビオエタノメトリン [ C C N ] + T X、 ビオペルメトリン ( 9 0 8 ) + T X、 ビオレスメトリン ( 8 0 ) + T X、 ビス ( 2 - クロロエチル ) エーテル ( I U P A C 名 ) ( 9 0 9 ) + T X、 ビストリフルロン ( 8 3 ) + T X、 ホウ砂 ( 8 6 ) + T X、 プロフェンバレレート ( 代替名 ) + T X、 プロムフェンピンホス ( 9 1 4 ) + T X、 プロモシクレン ( 9 1 8 ) + T X、 プロモ - D D T ( 代替名 ) [ C C N ] + T X、 プロモホス ( 9 2 0 ) + T X、 プロモホス - エチル ( 9 2 1 ) + T X、 プフェンカルブ ( 9 2 4 ) + T X、 ププロフェジン ( 9 9 ) + T X、 プタカルブ ( 9 2 6 ) + T X、 プタチオホス ( 9 2 7 ) + T X、 プトカルボキシム ( 1 0 3 ) + T X、 プトネート ( 9 3 2 ) + T X、 プトキシカルボキシム ( 1 0 4 ) + T X、 プチルピリダベン ( 代替名 ) + T X、 カズサホス ( 1 0 9 ) + T X、 ヒ酸カルシウム [ C C N ] + T X、 シアン化カルシウム ( 4 4 4 ) + T X、 多硫化カルシウム ( I U P A C 名 ) ( 1 1 1 ) + T X、 カンフェクロル ( 9 4 1 ) + T X、 カーバノレート ( 9 4 3 ) + T X、 カルバリル ( 1 1 5 ) + T X、 カルボフラン ( 1 1 8 ) + T X、 二硫化炭素 ( I U P A C / ケミカルアブストラクツ名 ) ( 9 4 5 ) + T X、 四塩化炭素 ( I U P A C 名 ) ( 9 4 6 ) + T X、 カルボフェノチオン ( 9 4 7 ) + T X、 カルボスルファン ( 1 1 9 ) + T X、 カルタップ ( 1 2 3 ) + T X、 カルタップ塩酸塩 ( 1 2 3 ) + T X、 セバジン ( 代替名 ) ( 7 2 5 ) + T X、 クロルピシクレン ( 9 6 0 ) + T X、 クロルダン ( 1 2 8 ) + T X、 クロルデコン ( 9 6 3 ) + T X、 クロルジメホルム ( 9 6 4 ) + T X、 クロルジメホルム塩酸塩 ( 9 6 4 ) + T X、 クロルエトキシホス ( 1 2 9 ) + T X、 クロルフェナピル ( 1 3 0 ) + T X、 クロルフェンピンホス ( 1 3 1 ) + T X、 クロルフルアズロン ( 1 3 2 ) + T X、 クロルメホス ( 1 3 6 ) + T X、 クロロホルム [ C C N ] + T X、 クロロピクリン ( 1 4 1 ) + T X、 クロルホキシム ( 9 8 9 ) + T X、 クロルプラゾホス (

10

20

30

40

50

990) + TX、クロルピリホス(145) + TX、クロルピリホス - メチル(146) + TX、クロルチオホス(994) + TX、クロマフェノジド(150) + TX、シネリン I(696) + TX、シネリン II(696) + TX、シネリン(696) + TX、シス - レスメトリン(代替名) + TX、シスメトリン(80) + TX、クロシトリン(代替名) + TX、クロエトカルブ(999) + TX、クロサンテル(代替名) [CCN] + TX、クロチアニジン(165) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、ヒ酸銅 [CCN] + TX、オレイン酸銅 [CCN] + TX、クマホス(174) + TX、クミトエート(1006) + TX、クロタミトン(代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス(1010) + TX、クルホマート(1011) + TX、氷晶石(代替名)(177) + TX、CS 708(開発コード)(1012) + TX、シアノフェンホス(1019) + TX、シアノホス(184) + TX、シアントエート(1020) + TX、シクレトリン [CCN] + TX、シクロプロトリン(188) + TX、シフルトリン(193) + TX、シハ口トリン(196) + TX、シペルメトリン(201) + TX、シフェノトリン(206) + TX、シロマジン(209) + TX、サイチオアート(代替名) [CCN] + TX、d - リモネン(代替名) [CCN] + TX、d - テトラメトリン(代替名)(788) + TX、DAEP(1031) + TX、ダゾメット(216) + TX、DDT(219) + TX、デカルボフラン(1034) + TX、デルタメトリン(223) + TX、デメフィオン(1037) + TX、デメフィオン - O(1037) + TX、デメフィオン - S(1037) + TX、デメトン(1038) + TX、デメトン - メチル(224) + TX、デメトン - O(1038) + TX、デメトン - O - メチル(224) + TX、デメトン - S(1038) + TX、デメトン - S - メチル(224) + TX、デメトン - S - メチルスルホン(1039) + TX、ジアフェンチウロン(226) + TX、ジアリホス(1042) + TX、ジアミダホス(1044) + TX、ジアジノン(227) + TX、ジカプチオン(1050) + TX、ジクロフェンチオン(1051) + TX、ジクロルボス(236) + TX、ジクリホス(代替名) + TX、ジクレシル(代替名) [CCN] + TX、ジクロトホス(243) + TX、ジシクラニル(244) + TX、ジエルドリン(1070) + TX、ジエチル5 - メチルピラゾール - 3 - イルホスフェート(IUPAC名)(1076) + TX、ジフルベンズロン(250) + TX、ジロール(代替名) [CCN] + TX、ジメフルトリン [CCN] + TX、ジメHOOKS(1081) + TX、ジメタン(1085) + TX、ジメトエート(262) + TX、ジメトリン(1083) + TX、ジメチルピンホス(265) + TX、ジメチラン(1086) + TX、ジネクス(1089) + TX、ジネクス - ジクレキシシ(1089) + TX、ジノプロブ(1093) + TX、ジノサム(1094) + TX、ジノセブ(1095) + TX、ジノテフラン(271) + TX、ジオフェノラン(1099) + TX、ジオキサベンゾホス(1100) + TX、ジオキサカルブ(1101) + TX、ジオキサチオン(1102) + TX、ジスルホトン(278) + TX、ジチクロホス(1108) + TX、DNOC(282) + TX、ドラメクチン(代替名) [CCN] + TX、DSP(1115) + TX、エクジステロン(代替名) [CCN] + TX、EI 1642(開発コード)(1118) + TX、エマメクチン(291) + TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、EMPC(1120) + TX、エンペントリン(292) + TX、エンドスルファン(294) + TX、エンドチオン(1121) + TX、エンドリン(1122) + TX、EPBP(1123) + TX、EPN(297) + TX、エポフェノナン(1124) + TX、エブリノメクチン(代替名) [CCN] + TX、エスフェンバレレート(302) + TX、エタホス(代替名) [CCN] + TX、エチオフェンカルブ(308) + TX、エチオン(309) + TX、エチプロール(310) + TX、エトエート - メチル(1134) + TX、エトプロホス(312) + TX、ギ酸エチル(IUPAC名) [CCN] + TX、エチル - DDD(代替名)(1056) + TX、二臭化エチレン(316) + TX、二塩化エチレン(化学名)(1136) + TX、エチレンオキシド [CCN] + TX、エトフェンプロックス(319) + TX、エトリムホス(1142) + TX、EXD(1143) + TX、ファンファー(323) + TX、フェナミホス(326) + TX、フェナザフロル(11

10

20

30

40

50

47) + TX、フェンクロルホス(1148) + TX、フェネタカルブ(1149) + TX、  
 フェンフルトリン(1150) + TX、フェニトロチオン(335) + TX、フェノ  
 ブカルブ(336) + TX、フェノキサクリム(1153) + TX、フェノキシカルブ(340) + TX、  
 フェンピリトリン(1155) + TX、フェンプロパトリン(342) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、  
 フェンスルホチオン(1158) + TX、フェンチオン(346) + TX、フェンチオン - エチル[CCN] + TX、  
 フェンバレレート(349) + TX、フィプロニル(354) + TX、フロニカミド(358) + TX、フルベンジアミド(CAS登録番号: 272451-65-7) + TX、フルコフロン(1168) + TX、フルシクロクスロン(366) + TX、フルシトリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェネリム[CCN] + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルフェンプロックス(1171) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルバリネート(1184) + TX、FMC 1137(開発コード)(1185) + TX、ホノホス(1191) + TX、ホルメタネート(405) + TX、塩酸ホルメタネート(405) + TX、ホルモチオン(1192) + TX、ホルムパラネート(1193) + TX、ホスメチラン(1194) + TX、ホスピレート(1195) + TX、ホスチアゼート(408) + TX、ホスチエタン(1196) + TX、フラチオカルブ(412) + TX、フレトリン(1200) + TX、  
 - シハロトリン(197) + TX、  
 - HCH(430) + TX、グアザチン(422) + TX、酢酸グアザチン(422) + TX、GY-81(開発コード)(423) + TX、ハルフェンプロックス(424) + TX、ハロフェノジド(425) + TX、HCH(430) + TX、HEOD(1070) + TX、ヘプタクロル(1211) + TX、ヘプテノホス(432) + TX、ヘテロホス[CCN] + TX、ヘキサフルムロン(439) + TX、HHDN(864) + TX、ヒドラメチルノン(443) + TX、シアン化水素(444) + TX、ハイドロブレン(445) + TX、ヒキンカルブ(1223) + TX、イミダクロプリド(458) + TX、イミプロトリン(460) + TX、インドキサカルブ(465) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、IPSP(1229) + TX、イサゾホス(1231) + TX、イソベンザン(1232) + TX、イソカルボホス(代替名)(473) + TX、イソドリル(1235) + TX、イソフェンホス(1236) + TX、イソラン(1237) + TX、イソプロカルブ(472) + TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473) + TX、イソプロチオラン(474) + TX、イソチオエート(1244) + TX、イソキサチオン(480) + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、ジャスモリンI(696) + TX、ジャスモリンII(696) + TX、ヨードフェンホス(1248) + TX、幼若ホルモンI(代替名)[CCN] + TX、幼若ホルモンII(代替名)[CCN] + TX、幼若ホルモンIII(代替名)[CCN] + TX、ケレバン(1249) + TX、キノブレン(484) + TX、  
 - シハロトリン(198) + TX、ヒ酸鉛[CCN] + TX、レピメクチン(CCN) + TX、レプトホス(1250) + TX、リンダン(430) + TX、リリムホス(1251) + TX、ルフエヌロン(490) + TX、リチダチオン(1253) + TX、m-クメニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1014) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、マラチオン(492) + TX、マロノベン(1254) + TX、マジドックス(1255) + TX、メカルバム(502) + TX、メカルフォン(1258) + TX、メナゾン(1260) + TX、メホスホラン(1261) + TX、塩化第一水銀(513) + TX、メスルフェンホス(1263) + TX、メタフルミゾン(CCN) + TX、メタム(519) + TX、メタム - カリウム(代替名)(519) + TX、メタム - ナトリウム(519) + TX、メタクリホス(1266) + TX、メタミドホス(527) + TX、フッ化メタンスルホニル(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1268) + TX、メチダチオン(529) + TX、メチオカルブ(530) + TX、メトクロトホス(1273) + TX、メトミル(531) + TX、メトブレン(532) + TX、メトキン - ブチル(1276) + TX、メトトリル(代替名)(533) + TX、メトキシクロル(534) + TX、メトキシフ

10

20

30

40

50

エノジド(535)+TX、臭化メチル(537)+TX、メチルイソチオシアネート(543)+TX、メチルクロロホルム(代替名)[CCN]+TX、塩化メチレン[CCN]+TX、メトフルトリン[CCN]+TX、メトルカルブ(550)+TX、メトキサジアゾン(1288)+TX、メビンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホックス(1293)+TX、ミレックス(1294)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナフタロホス(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、ナフタレン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1303)+TX、NC-170(開発コード)(1306)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、ニコチン(578)+TX、硫酸ニコチン(578)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニテンピラム(579)+TX、ニチアジン(1311)+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、ノルニコチン(慣用名)(1319)+TX、ノバルロン(585)+TX、ノビフルムロン(586)+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057)+TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1074)+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1075)+TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424)+TX、オレイン酸(IUPAC名)(593)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデメトン-メチル(609)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN]+TX、パラチオン(615)+TX、パラチオン-メチル(616)+TX、ペンフルロン(代替名)[CCN]+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623)+TX、ベルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、PH 60-38(開発コード)(1328)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェノトリン(630)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスニクロール(1339)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、ホキシム(642)+TX、ホキシム-メチル(1340)+TX、ピリメタホス(1344)+TX、ピリミカルブ(651)+TX、ピリミホス-エチル(1345)+TX、ピリミホス-メチル(652)+TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、カリウムチオシアネート[CCN]+TX、プラレトリン(655)+TX、プレコセンI(代替名)[CCN]+TX、プレコセンII(代替名)[CCN]+TX、プレコセンIII(代替名)[CCN]+TX、プリミドホス(1349)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロフルトリン[CCN]+TX、プロマシル(1354)+TX、プロメカルブ(1355)+TX、プロパホス(1356)+TX、プロペタンホス(673)+TX、プロポクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフェンビュート[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン(1367)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシフェン(708)+TX、クアッシア(代替名)[CCN]+TX、キナルホス(711)+TX、キナルホス-メチル(

10

20

30

40

50

1376) + TX、キノチオン(1380) + TX、キンチオキス(1381) + TX、  
 R-1492(開発コード)(1382) + TX、ラフォキサニド(代替名)[CCN]  
 + TX、レスメトリン(719) + TX、ロテノン(722) + TX、RU 15525  
 (開発コード)(723) + TX、RU 25475(開発コード)(1386) + TX  
 、リアニア(代替名)(1387) + TX、リアノジン(慣用名)(1387) + TX、  
 サバジラ(代替名)(725) + TX、シュラーダン(1389) + TX、セブホス(代  
 替名) + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、SI-0009(化合物コー  
 ド) + TX、SI-0205(化合物コード) + TX、SI-0404(化合物コード)  
 + TX、SI-0405(化合物コード) + TX、シラフルオフエン(728) + TX、  
 SN 72129(開発コード)(1397) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + T  
 X、シアン化ナトリウム(444) + TX、フッ化ナトリウム(IUPAC/ケミカルア  
 プストラクツ名)(1399) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400) +  
 TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623) + TX、セレン酸ナトリウム(I  
 UPAC名)(1401) + TX、ナトリウムチオシアネート[CCN] + TX、ソファ  
 ミド(1402) + TX、スピノサド(737) + TX、スピロメシフェン(739) +  
 TX、スピロテトラマト(CCN) + TX、スルコフロン(746) + TX、スルコフロ  
 ン-ナトリウム(746) + TX、スルフルアミド(750) + TX、スルホテップ(7  
 53) + TX、フッ化スルフリル(756) + TX、スルプロオス(1408) + TX、  
 タール油(代替名)(758) + TX、 -フルバリネート(398) + TX、タジムカ  
 ルブ(1412) + TX、TDE(1414) + TX、テブフェノジド(762) + TX  
 、テブフェンピラド(763) + TX、テブピリムホス(764) + TX、テフルベンズ  
 ロン(768) + TX、テフルトリン(769) + TX、テメホス(770) + TX、T  
 EPP(1417) + TX、テラレトリン(1418) + TX、テルバム(代替名) + T  
 X、テルブホス(773) + TX、テトラクロロエタン[CCN] + TX、テトラクロル  
 ピンホス(777) + TX、テトラメトリン(787) + TX、 -シペルメトリン(2  
 04) + TX、チアクロプリド(791) + TX、チアフェノックス(代替名) + TX、  
 チアメトキサム(792) + TX、チクロホス(1428) + TX、チオカルボキシム(1  
 431) + TX、チオシクラム(798) + TX、チオシクラムシュウ酸水素塩(79  
 8) + TX、チオジカルブ(799) + TX、チオファノックス(800) + TX、チオ  
 メトン(801) + TX、チオナジン(1434) + TX、チオスルタップ(803) +  
 TX、チオスルタップ-ナトリウム(803) + TX、ツリンギエンシン(代替名)[C  
 CN] + TX、トルフェンピラド(809) + TX、トラロメトリン(812) + TX、  
 トランスフルトリン(813) + TX、トランスペルメトリン(1440) + TX、トリ  
 アミホス(1441) + TX、トリアザメート(818) + TX、トリアゾホス(820  
 ) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリクロ  
 ルメタホス-3(代替名)[CCN] + TX、トリクロロナート(1452) + TX、トリ  
 フェノホス(1455) + TX、トリフルムロン(835) + TX、トリメタカルブ(8  
 40) + TX、トリプレン(1459) + TX、バミドチオン(847) + TX、バニ  
 リプロール[CCN] + TX、ベラトリジン(代替名)(725) + TX、ベラトリン(代  
 替名)(725) + TX、XMC(853) + TX、キシリルカルブ(854) + TX  
 、YI-5302(化合物コード) + TX、 -シペルメトリン(205) + TX、ゼタ  
 メトリン(zetamethrin)(代替名) + TX、リン化亜鉛(640) + TX、  
 ゴラプロホス(1469)及びZXI 8901(開発コード)(858) + TX、シア  
 ントラニリプロール[736994-63-19] + TX、クロラントラニリプロール[5  
 00008-45-7] + TX、シエノピラフェン[560121-52-0] + TX、  
 シフルメトフェン[400882-07-7] + TX、ピリフルキナゾン[337458  
 -27-2] + TX、スピネトラム[187166-40-1+187166-15-0  
 ] + TX、スピロテトラマト[203313-25-1] + TX、スルホキサフロール[  
 946578-00-3] + TX、フルフィプロール[704886-18-0] + TX  
 、メペルフルトリン[915288-13-0] + TX、テトラメチルフルトリン[84

10

20

30

40

50

937-88-2]+TX、トリフルメゾピリム(国際公開第2012/092115号に開示される)+TXからなる物質の群から選択される殺虫剤、フルキサメタミド(国際公開第2007/026965号)+TX、-メトフルトリン[240494-71-7]+TX、-モンフルオロトリン[1065124-65-3]+TX、フルアザインドリジン[1254304-22-7]+TX、クロロプラレトリン[399572-87-3]+TX、フルキサメタミド[928783-29-3]+TX、シハロジアミド[1262605-53-7]+TX、チオキサザフェン[330459-31-9]+TX、プロフラニリド[1207727-04-5]+TX、フルフィプロール[704886-18-0]+TX、シクラニリプロール[1031756-98-5]+TX、テトラニリプロール[1229654-66-3]+TX、グアジピル(国際公開第2010/060231号に記載)+TX、シクロキサプリド(国際公開第2005/077934号に記載)+TX、スピロピジオン+TX、アフィドピロペン+TX、フルピリミン+TX、モンフルオロトリン+TX、-ビフェントリン+TX、-テフルトリン+TX、ジクロロメゾチアズ+TX、テトラクロラニリプロール+TX、ベンズピリモキサン+TX;

10

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913)+TX、プロモアセトアミド[CCN]+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、クロエトカルブ(999)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、硫酸銅(172)+TX、フェンチン(347)+TX、リン酸第二鉄(IUPAC名)(352)+TX、メタルデヒド(518)+TX、メチオカルブ(530)+TX、ニクロサミド(576)+TX、ニクロサミド-

20

オールアミン(576)+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623)+TX、タジムカルブ(1412)+TX、チオジカルブ(799)+TX、酸化トリブチルスズ(913)+TX、トリフェンモルフ(1454)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)及び水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TX、ピリプロール[394730-71-3]+TXからなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、AKD-3088(化合物コード)+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1045)+TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1062)+TX、1,2-ジクロロプロパン及び1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063)+TX、1,3-ジクロロプロペン(233)+TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1065)+TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルローダニン(IUPAC名)(980)+TX、5-メチル-

30

6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸(IUPAC名)(1286)+TX、6-イソペンテニルアミノプリン(代替名)(210)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、ベンクロチアズ[CCN]+TX、ベノミル(62)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、カズサホス(109)+TX、カルボフラン(118)+TX、二硫化炭素(945)+TX、カルボスルファン(119)+TX、クロロピクリン(141)+TX、クlorピリホス(145)+TX、クロエトカルブ(999)+TX、サイトカニン(代替名)(210)+TX、ダゾメット(216)+TX、DBCP(1045)+TX、DCIP(218)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ジクロフェンチオン(1051)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジメトエート(262)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エブリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エトプロホス(312)+TX、二臭化エチレン(316)+TX、フェナミホス(326)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、ホスチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、フルフラール(代替名)[CCN]+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ヘテロ

40

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913)+TX、プロモアセトアミド[CCN]+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、クロエトカルブ(999)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、硫酸銅(172)+TX、フェンチン(347)+TX、リン酸第二鉄(IUPAC名)(352)+TX、メタルデヒド(518)+TX、メチオカルブ(530)+TX、ニクロサミド(576)+TX、ニクロサミド-

50

ホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、キネチン (代替名) (210) + TX、メカルフォン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタム - カリウム (代替名) (519) + TX、メタム - ナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC - 184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロチオフェン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1422) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノール [CCN] + TX、YI - 5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [318290 - 98 - 1] + TX、フルオピラム + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤、

10

エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX からなる物質の群から選択される硝化阻害剤、

アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル - S - メチル (6) + TX、プロベナゾール (658) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、

20

2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC名) (1246) + TX、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンシルホンアミド (IUPAC名) (748) + TX、 - クロロヒドリル [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、アンチュ (*antú*) (880) + TX、三酸化二ヒ素 (882) + TX、炭酸バリウム (891) + TX、ビスチオセミ (912) + TX、プロディファコウム (89) + TX、プロマジオロン (91) + TX、プロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、クロラロース (127) + TX、クロロファシノン (140) + TX、コレカルシフェロール (代替名) (850) + TX、クマクロール (1004) + TX、クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (1009) + TX、ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジファシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン (357) + TX、フルオロアセトアミド (379) + TX、フルプロパダイン (1183) + TX、フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、 - HCH (430) + TX、HCH (430) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、リンダン (430) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) + TX、臭化メチル (537) + TX、ノルボルミド (1318) + TX、ホサセチム (1336) + TX、ホスフィン (IUPAC名) (640) + TX、リン [CCN] + TX、ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリヌロン (1371) + TX、シリロシド (1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム (735) + TX、ストリキニーネ (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン (851) 及びリン化亜鉛 (640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤、

30

2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルピペロニレート (IUPAC名) (934) + TX、5 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エノン (IUPAC名) (903) + TX、ファルネソール及びネロリドール (代替名) (324) + TX、MB - 599 (開発コード) (498) + TX、MGK 264 (開発コード) (296) + TX、ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタル (1343) + TX、プロピル異性体 (1358) + TX、S421 (開発コード) (724

40

50

) + TX、セサメクス ( 1 3 9 3 ) + TX、セサモリン ( 1 3 9 4 ) 及びスルホキシド ( 1 4 0 6 ) + TX からなる物質の群から選択される共力剤、

アントラキノ ( 3 2 ) + TX、クロラコース ( 1 2 7 ) + TX、ナフテン酸銅 [ C C N ] + TX、オキシ塩化銅 ( 1 7 1 ) + TX、ジアジノン ( 2 2 7 ) + TX、ジシクロペンタジエン ( 化学名 ) ( 1 0 6 9 ) + TX、グアザチン ( 4 2 2 ) + TX、酢酸グアザチン ( 4 2 2 ) + TX、メチオカルブ ( 5 3 0 ) + TX、ピリジン - 4 - アミン ( I U P A C 名 ) ( 2 3 ) + TX、チラム ( 8 0 4 ) + TX、トリメタカルブ ( 8 4 0 ) + TX、ナフテン酸亜鉛 [ C C N ] 及びジラム ( 8 5 6 ) + TX からなる物質の群から選択される動物忌避剤、

イマニン ( 代替名 ) [ C C N ] 及びリバピリン ( 代替名 ) [ C C N ] + TX からなる物質の群から選択される殺ウイルス剤、

酸化第二水銀 ( 5 1 2 ) + TX、オクチリノン ( 5 9 0 ) 及びチオファネート - メチル ( 8 0 2 ) + TX からなる物質の群から選択される傷保護剤、及び

アザコナゾール ( 6 0 2 0 7 - 3 1 - 0 ) + TX、ピテルタノール [ 7 0 5 8 5 - 3 6 - 3 ] + TX、プロムコナゾール [ 1 1 6 2 5 5 - 4 8 - 2 ] + TX、シプロコナゾール [ 9 4 3 6 1 - 0 6 - 5 ] + TX、ジフェノコナゾール [ 1 1 9 4 4 6 - 6 8 - 3 ] + TX、ジニコナゾール [ 8 3 6 5 7 - 2 4 - 3 ] + TX、エポキシコナゾール [ 1 0 6 3 2 5 - 0 8 - 0 ] + TX、フェンブコナゾール [ 1 1 4 3 6 9 - 4 3 - 6 ] + TX、フルキンコナゾール [ 1 3 6 4 2 6 - 5 4 - 5 ] + TX、フルシラゾール [ 8 5 5 0 9 - 1 9 - 9 ] + TX、フルトリアホル [ 7 6 6 7 4 - 2 1 - 0 ] + TX、ヘキサコナゾール [ 7 9 9 8 3 - 7 1 - 4 ] + TX、イマザリル [ 3 5 5 5 4 - 4 4 - 0 ] + TX、イミベンコナゾール [ 8 6 5 9 8 - 9 2 - 7 ] + TX、イブコナゾール [ 1 2 5 2 2 5 - 2 8 - 7 ] + TX、メトコナゾール [ 1 2 5 1 1 6 - 2 3 - 6 ] + TX、ミクロブタニル [ 8 8 6 7 1 - 8 9 - 0 ] + TX、ペフラゾエート [ 1 0 1 9 0 3 - 3 0 - 4 ] + TX、ベンコナゾール [ 6 6 2 4 6 - 8 8 - 6 ] + TX、プロチオコナゾール [ 1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6 ] + TX、ピリフェノックス [ 8 8 2 8 3 - 4 1 - 4 ] + TX、プロクロラズ [ 6 7 7 4 7 - 0 9 - 5 ] + TX、プロピコナゾール [ 6 0 2 0 7 - 9 0 - 1 ] + TX、シメコナゾール [ 1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7 ] + TX、テブコナゾール [ 1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3 ] + TX、テトラコナゾール [ 1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3 ] + TX、トリアジメホン [ 4 3 1 2 1 - 4 3 - 3 ] + TX、トリアジメノール [ 5 5 2 1 9 - 6 5 - 3 ] + TX、トリフルミゾール [ 9 9 3 8 7 - 8 9 - 0 ] + TX、トリチコナゾール [ 1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7 ] + TX、アンシミドール [ 1 2 7 7 1 - 6 8 - 5 ] + TX、フェナリモル [ 6 0 1 6 8 - 8 8 - 9 ] + TX、ヌアリモル [ 6 3 2 8 4 - 7 1 - 9 ] + TX、ブピリメート [ 4 1 4 8 3 - 4 3 - 6 ] + TX、ジメチリモール [ 5 2 2 1 - 5 3 - 4 ] + TX、エチリモル [ 2 3 9 4 7 - 6 0 - 6 ] + TX、ドデモルフ [ 1 5 9 3 - 7 7 - 7 ] + TX、フェンプロピジン [ 6 7 3 0 6 - 0 0 - 7 ] + TX、フェンプロピモルフ [ 6 7 5 6 4 - 9 1 - 4 ] + TX、スピロキサミン [ 1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8 ] + TX、トリデモルフ [ 8 1 4 1 2 - 4 3 - 3 ] + TX、シプロジニル [ 1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2 ] + TX、メパニピリム [ 1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7 ] + TX、ピリメタニル [ 5 3 1 1 2 - 2 8 - 0 ] + TX、フェンピクロニル [ 7 4 7 3 8 - 1 7 - 3 ] + TX、フルジオキソニル [ 1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1 ] + TX、ベナラキシル [ 7 1 6 2 6 - 1 1 - 4 ] + TX、フララキシル [ 5 7 6 4 6 - 3 0 - 7 ] + TX、メタラキシル [ 5 7 8 3 7 - 1 9 - 1 ] + TX、R - メタラキシル [ 7 0 6 3 0 - 1 7 - 0 ] + TX、オフレース [ 5 8 8 1 0 - 4 8 - 3 ] + TX、オキサジキシル [ 7 7 7 3 2 - 0 9 - 3 ] + TX、ベノミル [ 1 7 8 0 4 - 3 5 - 2 ] + TX、カルベンダジム [ 1 0 6 0 5 - 2 1 - 7 ] + TX、デバカルブ [ 6 2 7 3 2 - 9 1 - 6 ] + TX、フベリダゾール [ 3 8 7 8 - 1 9 - 1 ] + TX、チアベンダゾール [ 1 4 8 - 7 9 - 8 ] + TX、クロゾリネート [ 8 4 3 3 2 - 8 6 - 5 ] + TX、ジクロゾリン [ 2 4 2 0 1 - 5 8 - 9 ] + TX、イブプロジオン [ 3 6 7 3 4 - 1 9 - 7 ] + TX、マイクロゾリン [ 5 4 8 6 4 - 6 1 - 8 ] + TX、プロシミドン [ 3 2 8 0 9 - 1 6 - 8 ] + TX、ピンクロゾリン [ 5 0 4 7 1 - 4 4 - 8 ] + TX、ボスカリド [ 1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6 ]

10

20

30

40

50

+ TX、カルボキシ [ 5 2 3 4 - 6 8 - 4 ] + TX、フェンフラム [ 2 4 6 9 1 - 8 0 - 3 ] + TX、フルトラニル [ 6 6 3 3 2 - 9 6 - 5 ] + TX、メプロニル [ 5 5 8 1 4 - 4 1 - 0 ] + TX、オキシカルボキシ [ 5 2 5 9 - 8 8 - 1 ] + TX、ベンチオピラド [ 1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3 ] + TX、チフルザミド [ 1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7 ] + TX、グアザチン [ 1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6 ] + TX、ドジン [ 2 4 3 9 - 1 0 - 3 ] [ 1 1 2 - 6 5 - 2 ] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [ 1 3 5 1 6 - 2 7 - 3 ] + TX、アゾキシストロピン [ 1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8 ] + TX、ジモキシストロピン [ 1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4 ] + TX、エネステロブリン { Proc . B C P C , Int . Congr . , Glasg ow , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + TX、フルオキサストロピン [ 3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9 ] + TX、クレソキシム - メチル [ 1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0 ] + TX、メトミノストロピン [ 1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1 ] + TX、トリフロキシストロピン [ 1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7 ] + TX、オリザストロピン [ 2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0 ] + TX、ピコキシストロピン [ 1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5 ] + TX、ピラクロストロピン [ 1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0 ] + TX、フェルパム [ 1 4 4 8 4 - 6 4 - 1 ] + TX、マンコゼブ [ 8 0 1 8 - 0 1 - 7 ] + TX、マネブ [ 1 2 4 2 7 - 3 8 - 2 ] + TX、メチラム [ 9 0 0 6 - 4 2 - 2 ] + TX、プロピネブ [ 1 2 0 7 1 - 8 3 - 9 ] + TX、チラム [ 1 3 7 - 2 6 - 8 ] + TX、ジネブ [ 1 2 1 2 2 - 6 7 - 7 ] + TX、ジラム [ 1 3 7 - 3 0 - 4 ] + TX、カプタホール [ 2 4 2 5 - 0 6 - 1 ] + TX、カプタン [ 1 3 3 - 0 6 - 2 ] + TX、ジクロフルアニド [ 1 0 8 5 - 9 8 - 9 ] + TX、フルオロイミド [ 4 1 2 0 5 - 2 1 - 4 ] + TX、ホルベット [ 1 3 3 - 0 7 - 3 ] + TX、トリルフルアニド [ 7 3 1 - 2 7 - 1 ] + TX、ボルドー液 [ 8 0 1 1 - 6 3 - 0 ] + TX、水酸化銅 [ 2 0 4 2 7 - 5 9 - 2 ] + TX、オキシ塩化銅 [ 1 3 3 2 - 4 0 - 7 ] + TX、硫酸銅 [ 7 7 5 8 - 9 8 - 7 ] + TX、酸化銅 [ 1 3 1 7 - 3 9 - 1 ] + TX、マンコッパー ( manco p p e r ) [ 5 3 9 8 8 - 9 3 - 5 ] + TX、オキシ銅 [ 1 0 3 8 0 - 2 8 - 6 ] + TX、ジノカップ [ 1 3 1 - 7 2 - 6 ] + TX、ニトロタール - イソプロピル [ 1 0 5 5 2 - 7 4 - 6 ] + TX、エジフェンホス [ 1 7 1 0 9 - 4 9 - 8 ] + TX、イプロベンホス [ 2 6 0 8 7 - 4 7 - 8 ] + TX、イソプロチオラン [ 5 0 5 1 2 - 3 5 - 1 ] + TX、ホスジフェン [ 3 6 5 1 9 - 0 0 - 3 ] + TX、ピラゾホス [ 1 3 4 5 7 - 1 8 - 6 ] + TX、トルクロホス - メチル [ 5 7 0 1 8 - 0 4 - 9 ] + TX、アシベンゾラル - S - メチル [ 1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2 ] + TX、アニラジン [ 1 0 1 - 0 5 - 3 ] + TX、ベンチアバリカルブ [ 4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7 ] + TX、ブラストサイジン - S [ 2 0 7 9 - 0 0 - 7 ] + TX、キノメチオナト [ 2 4 3 9 - 0 1 - 2 ] + TX、クロロネブ [ 2 6 7 5 - 7 7 - 6 ] + TX、クロロタロニル [ 1 8 9 7 - 4 5 - 6 ] + TX、シフルフェナミド [ 1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3 ] + TX、シモキサニル [ 5 7 9 6 6 - 9 5 - 7 ] + TX、ジクロン [ 1 1 7 - 8 0 - 6 ] + TX、ジクロシメット [ 1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4 ] + TX、ジクロメジン [ 6 2 8 6 5 - 3 6 - 5 ] + TX、ジクロラン [ 9 9 - 3 0 - 9 ] + TX、ジエトフェンカルブ [ 8 7 1 3 0 - 2 0 - 9 ] + TX、ジメトモルフ [ 1 1 0 4 8 8 - 7 0 - 5 ] + TX、S Y P - L I 9 0 (フルモルフ) [ 2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9 ] + TX、ジチアノン [ 3 3 4 7 - 2 2 - 6 ] + TX、エタボキサム [ 1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3 ] + TX、エトリジアゾール [ 2 5 9 3 - 1 5 - 9 ] + TX、ファモキサドン [ 1 3 1 8 0 7 - 5 7 - 3 ] + TX、フェナミドン [ 1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7 ] + TX、フェノキサニル [ 1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7 ] + TX、フェンチン [ 6 6 8 - 3 4 - 8 ] + TX、フェリムゾン [ 8 9 2 6 9 - 6 4 - 7 ] + TX、フルアジナム [ 7 9 6 2 2 - 5 9 - 6 ] + TX、フルオピコリド [ 2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7 ] + TX、フルスルファミド [ 1 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6 ] + TX、フェンヘキサミド [ 1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8 ] + TX、ホセチル - アルミニウム [ 3 9 1 4 8 - 2 4 - 8 ] + TX、ヒメキサゾール [ 1 0 0 0 4 - 4 4 - 1 ] + TX、イプロバリカルブ [ 1 4 0 9 2 3 - 1 7 - 7 ] + TX、I K F - 9 1 6 (シアゾファミド) [ 1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3 ] + TX、カスガマイシン [ 6 9 8 0 - 1 8 - 3 ] + TX、メタスルホカルブ [ 6 6 9 5 2 - 4 9 - 6 ] + TX、メトラフェノン [ 2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6 ] + TX、ペンシクロン [ 6 6 0 6 3 - 0 5 - 6 ] + TX、フタリド [ 2 7

10

20

30

40

50

355 - 22 - 2 ] + TX、ポリオキシシ [ 11113 - 80 - 7 ] + TX、プロベナゾール [ 27605 - 76 - 1 ] + TX、プロパモカルブ [ 25606 - 41 - 1 ] + TX、プロキンアジド [ 189278 - 12 - 4 ] + TX、ピロキロン [ 57369 - 32 - 1 ] + TX、キノキシフェン [ 124495 - 18 - 7 ] + TX、キントゼン [ 82 - 68 - 8 ] + TX、硫黄 [ 7704 - 34 - 9 ] + TX、チアジニル [ 223580 - 51 - 6 ] + TX、トリアゾキシド [ 72459 - 58 - 6 ] + TX、トリシクラゾール [ 41814 - 78 - 2 ] + TX、トリホリン [ 26644 - 46 - 2 ] + TX、バリダマイシン [ 37248 - 47 - 8 ] + TX、ゾキサミド (RH7281) [ 156052 - 68 - 5 ] + TX、マンジプロパミド [ 374726 - 62 - 2 ] + TX、イソピラザム [ 881685 - 58 - 1 ] + TX、セダキサ [ 874967 - 67 - 6 ] + TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 - ジクロロメチレン - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノ - ナフタレン - 5 - イル) - アミド (国際公開第2007/048556号に開示される) + TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3', 4', 5' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第2006/087343号に開示される) + TX、[ (3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS) - 3 - [ (シクロプロピルカルボニル) オキシ ] - 1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b - デカヒドロ - 6, 12 - ジヒドロキシ - 4, 6a, 12b - トリメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2H, 11Hナフト [ 2, 1 - b ] ピラノ [ 3, 4 - e ] ピラン - 4 - イル ] メチル - シクロプロパンカルボキシレート [ 915972 - 17 - 7 ] + TX 及び 1, 3, 5 - トリメチル - N - (2 - メチル - 1 - オキソプロピル) - N - [ 3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [ 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル ] フェニル ] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [ 926914 - 55 - 8 ] + TX からなる物質の群から選択される生物学的に活性な化合物及びランコトリオン [ 1486617 - 21 - 3 ] + TX、フロルピラウキシフェン [ 943832 - 81 - 3 ] + TX、イプフェントリフルコナゾール [ 1417782 - 08 - 1 ] + TX、メフェントリフルコナゾール [ 1417782 - 03 - 6 ] + TX、キノフメリン [ 861647 - 84 - 9 ] + TX、クロロプラレトリン [ 399572 - 87 - 3 ] + TX、シハロジアミド [ 1262605 - 53 - 7 ] + TX、フルアザインドリジン [ 1254304 - 22 - 7 ] + TX、フルキサメタミド [ 928783 - 29 - 3 ] + TX、 - メトフルトリン [ 240494 - 71 - 7 ] + TX、 - モンフルオロトリン [ 1065124 - 65 - 3 ] + TX、ピジフルメトフェン [ 1228284 - 64 - 7 ] + TX、 - ビフェントリン [ 439680 - 76 - 9 ] + TX、プロフラニリド [ 1207727 - 04 - 5 ] + TX、ジクロロメゾチアズ [ 1263629 - 39 - 5 ] + TX、ジピメチトロン [ 16114 - 35 - 5 ] + TX、ピラジフルミド [ 942515 - 63 - 1 ] + TX 及び - テフルトリン [ 391634 - 71 - 2 ] + TX、フェンピコキサミド [ 517875 - 34 - 2 ] + TX ; フルフェンピロリドン + TX、ベンズピリモキサ [ 1449021 - 97 - 9 ] + TX ; イソシクロセラム + TX、レスカルレ [ 64309 - 03 - 1 ] + TX ; アミノピリフェン [ 1531626 - 08 - 0 ] + TX ; 及び

以下のものを含む微生物 : アシネトバクター・ルオフィイ ( *Acinetobacter lwoffii* ) + TX、アクレモニウム・アルタナツム ( *Acremonium alternatum* ) + TX + TX、アクレモニウム・セファロスポリウム ( *Acremonium cephalosporium* ) + TX + TX、アクレモニウム・ディオスピリ ( *Acremonium diospyri* ) + TX、アクレモニウム・オブクラバツム ( *Acremonium obclavatum* ) + TX、リンゴコカクモンハマキ顆粒病ウイルス ( *Adoxophyes orana granulovirus* ) ( AdoxGV ) ( Capex ( 登録商標 ) ) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター ( *Agrobacterium radiobacter* ) 菌株 K84 ( Galltrol - A ( 登録商標 ) ) + TX、アルテルナリア・アルテルナータ ( *Alternaria a*

10

20

30

40

50

lternate)+TX、アルテルナリア・カシアエ(Alternaria cas  
 sia)+TX、アルテルナリア・デストルエンズ(Alternaria destr  
 uens)(Smolder(登録商標))+TX、アンペロマイセス・キスカリス(A  
 mpelomyces quisqualis)(AQ10(登録商標))+TX、アス  
 ペルギルス・フラブス(Aspergillus flavus)AF36(AF36(登  
 録商標))+TX、アスペルギルス・フラブス(Aspergillus flavu  
 s)NRRL 21882(Aflaguard(登録商標))+TX、アスペルギルス  
 属(Aspergillus spp.)+TX、アウレオバシジウム・プルランス(A  
 ureobasidium pullulans)+TX、アゾスピリルム属(Azos  
 pirillum)+TX、(MicroAZ(登録商標))+TX、TAZO B(登録  
 商標))+TX、アゾトバクター属(Azotobacter)+TX、アゾトバクター  
 ・クロオコッカム(Azotobacter chroococcum)(Azotom  
 eal(登録商標))+TX、アゾトバクター(Azotobacter)シスト(cy  
 st)(Bionatural Blooming Blossoms(登録商標))+TX、  
 バチルス・アミロリケファシエンズ(Bacillus amyloliquefa  
 ciens)+TX、セレウス菌(Bacillus cereus)+TX、バチルス  
 ・キチノスポルス(Bacillus chitinosporus)菌株CM-1+T  
 X、バチルス・キチノスポルス(Bacillus chitinosporus)菌株  
 AQ746+TX、バチルス・リケニフォルミス(Bacillus lichenif  
 ormis)菌株HB-2(Biostart(商標)Rhizoboost(登録商標  
 ))+TX、バチルス・リケニフォルミス(Bacillus licheniform  
 is)菌株3086(EcoGuard(登録商標))+TX、Green Releaf  
 (登録商標))+TX、バチルス・サーキュランス(Bacillus circula  
 ns)+TX、バチルス・フィルムス(Bacillus firmus)(BioSa  
 fe(登録商標))+TX、BioNem-WP(登録商標))+TX、VOTiVO(登録  
 商標))+TX、バチルス・フィルムス(Bacillus firmus)菌株I-1  
 582+TX、バチルス・マセランス(Bacillus macerans)+TX、  
 バチルス・マリスマルトゥイ(Bacillus marismortui)+TX、バ  
 チルス・メガテリウム(Bacillus megaterium)+TX、バチルス・  
 ミコイデス(Bacillus mycoides)菌株AQ726+TX、バチルス・  
 ポピリエ(Bacillus papillae)(Milky Spore Powde  
 r(登録商標))+TX、バチルス・プミルス種(Bacillus pumilus s  
 pp.)+TX、バチルス・プミルス(Bacillus pumilus)菌株GB3  
 4(Yield Shield(登録商標))+TX、バチルス・プミルス(Bacil  
 lus pumilus)菌株AQ717+TX、バチルス・プミルス(Bacillus  
 pumilus)菌株QST 2808(Sonata(登録商標))+TX、Ballad  
 Plus(登録商標))+TX、バチルス・スフェリカス(Bacillus spah  
 ericus)(VectoLex(登録商標))+TX、バチルス属(Bacillu  
 s spp.)+TX、バチルス属(Bacillus spp.)菌株AQ175+TX  
 、バチルス属(Bacillus spp.)菌株AQ177+TX、バチルス属(Ba  
 cillus spp.)菌株AQ178+TX、枯草菌(Bacillus subtil  
 is)菌株QST 713(CEASE(登録商標))+TX、Serenade(登録  
 商標))+TX、Rhapsody(登録商標))+TX、枯草菌(Bacillus s  
 ubtilis)菌株QST 714(JAZZ(登録商標))+TX、枯草菌(Bac  
 illus subtilis)菌株AQ153+TX、枯草菌(Bacillus su  
 btilis)菌株AQ743+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)  
 菌株QST3002+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)菌株QST  
 3004+TX、枯草菌変種アミロリケファシエンズ(Bacillus subtil  
 is var. amyloliquefaciens)菌株FZB24(Taegro(登  
 録商標))+TX、Rhizopro(登録商標))+TX、バチルス・チューリゲンシ

10

20

30

40

50

ス (*Bacillus thuringiensis*) Cry 2Ae+TX、パチルス・  
 チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry 1Ab+T  
 X、パチルス・チューリゲンシス・アイザワイ (*Bacillus thuringi  
 ensis aizawai*) GC 91 (Agree (登録商標))+TX、パチルス・  
 チューリゲンシス・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis  
 israelensis*) (BMP123 (登録商標))+TX、Aquabac (登録商  
 標)+TX、VectoBac (登録商標))+TX、パチルス・チューリゲンシス・  
 クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (J  
 avelin (登録商標))+TX、Deliver (登録商標))+TX、CryMax ( 10  
 登録商標)+TX、Bonide (登録商標))+TX、Scutella WP (登録商  
 標)+TX、Turilav WP (登録商標))+TX、Astuto (登録商標)+T  
 X、Dipel WP (登録商標))+TX、Biobit (登録商標))+TX、Fora  
 y (登録商標))+TX、パチルス・チューリゲンシス・クルスターキ (*Bacill  
 us thuringiensis kurstaki*) BMP 123 (Bariton  
 e (登録商標))+TX、パチルス・チューリゲンシス・クルスターキ (*Bacill  
 us thuringiensis kurstaki*) HD-1 (Bioprotect-  
 CAF/3P (登録商標))+TX、パチルス・チューリゲンシス (*Bacillus  
 thuringiensis*) 菌株BD#32+TX、パチルス・チューリゲンシス (*Bacillus  
 thuringiensis*) 菌株AQ52+TX、パチルス・チュ  
 ーリゲンシス変種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis var  
 . aizawai*) (Xentari (登録商標))+TX、DiPel (登録商標))+  
 TX、細菌種 (*bacteria spp.*) (GROWMEND (登録商標))+TX、  
 GROWSWEET (登録商標))+TX、Shootup (登録商標))+TX、クラビ  
 バクター・ミシガネシス (*Clavipacter michiganensis*) の  
 バクテリオファージ (AgriPhage (登録商標))+TX、Bakflor (登録  
 商標))+TX、ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) (B  
 eaugenic (登録商標))+TX、Brocaril WP (登録商標))+TX、  
 ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) GHA (Mycot  
 rol ES (登録商標))+TX、Mycotrol O (登録商標))+TX、Botan  
 iGuard (登録商標))+TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (*Beauve  
 ria brongniartii*) (Engerlingspilz (登録商標))+T  
 X、Schweizer Beauveria (登録商標))+TX、Melocont ( 30  
 登録商標))+TX、ビューベリア属 (*Beauveria spp.*) +TX、灰色か  
 び病菌 (*Botrytis cineria*) +TX、ブラディリゾビウム・ジャポニク  
 ム (*Bradyrhizobium japonicum*) (TerraMax (登録商  
 標))+TX、ブレビパチルス・ブレビス (*Brevibacillus brevis*  
 )+TX、パチルス・チューリゲンシス・テネブリオニス (*Bacillus thu  
 ringiensis tenebrionis*) (Novodor (登録商標))+T  
 X、BtBooster+TX、パークホルデリア・セバシア (*Burkholderi  
 a cepacia*) (Deny (登録商標))+TX、Intercept (登録商標) 40  
 +TX、Blue Circle (登録商標))+TX、パークホルデリア・グラディ (*Burkholderia gladii*) +TX、パークホルデリア・グラディオリ (*Burkholderia gladioli*) +TX、パークホルデリア属 (*Burkholderia spp.*) +TX、  
 セイヨウトゲアザミの菌 (*Canadian thistle fungus*) (CBH  
 Canadian Bioherbicide (登録商標))+TX、カンジダ・ブチリ  
 (*Candida butyri*) +TX、カンジダ・ファマータ (*Candida fa  
 mata*) +TX、カンジダ・フルクタス (*Candida fructus*) +TX、  
 カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*) +TX、カンジダ・ギリエ  
 ルモンディ (*Candida guilliermondii*) +TX、カンジダ・メリ 50

ピオシカ (*Candida melibiosica*) + TX、カンジダ・オレオフィラ (*Candida oleophila*) 菌株 O + TX、カンジダ・パラプシロシス (*Candida parapsilosis*) + TX、カンジダ・ペリキュローザ (*Candida pelliculosa*) + TX、カンジダ・プルケリマ (*Candida pulcherrima*) + TX、カンジダ・レウカウフィ (*Candida reukaufii*) + TX、カンジダ・サイトアナ (*Candida saitoana*) (Bio-Coat (登録商標)) + TX、Biocure (登録商標) + TX、カンジダ・サケ (*Candida sake*) + TX、カンジダ属 (*Candida spp.*) + TX、カンジダ・テヌイス (*Candida tenuis*) + TX、セデセア・ダビセ (*Edeceea dravisae*) + TX、セルロモナス・フラビゲナ (*Cellulomonas flavigena*) + TX、カエトミウム・コクリオイデス (*Chaetomium cochliodes*) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、カエトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、クロモバクテリウム・スブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株 PRAA4-1T (Grandevo (登録商標)) + TX、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) + TX、クラドスポリウム・オキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*) + TX、クラドスポリウム・クロロセファルム (*Cladosporium chlorocephalum*) + TX、クラドスポリウム属 (*Cladosporium spp.*) + TX、クラドスポリウム・テヌイシマム (*Cladosporium tenuissimum*) + TX、クロノスタキス・ロゼア (*Clonostachys rosea*) (EndoFine (登録商標)) + TX、コレトトリクム・アクタータム (*Colletotrichum acutatum*) + TX、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*) (Cotans WG (登録商標)) + TX、コニオチリウム属 (*Coniothyrium spp.*) + TX、クリプトコッカス・アルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS (登録商標)) + TX、クリプトコッカス・フミコラ (*Cryptococcus humicola*) + TX、クリプトコッカス・インフィルモ・ミニアツス (*Cryptococcus infirmo-miniatus*) + TX、クリプトコッカス・ローレンティ (*Cryptococcus laurentii*) + TX、クリプトフレビア・レウコトレタ顆粒病ウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (Cryptex (登録商標)) + TX、カプリアビダス・カンピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) + TX、コドリング顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X (登録商標)) + TX、コドリング顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (Madex (登録商標)) + TX、Madex Plus (登録商標) + TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標) + TX、エピコウヤクタケ (*Cylindrobasidium laeve*) (Stumpout (登録商標)) + TX、シリンドロクラジウム属 (*Cylindrocladium*) + TX、デバリオマイセス・ハンセニイ (*Debaromyces hansenii*) + TX、ドレクスレラ・ハワイエンシス (*Drechslera hawaiiensis*) + TX、エンテロバクター・クロアカ (*Enterobacter cloacae*) + TX、腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*) + TX、エントモフトラ・ビルレンタ (*Entomophthora virulenta*) (Vektor (登録商標)) + TX、エピコッカム・ニグラム (*Epicoccum nigrum*) + TX、エピコッカム・パーパラセンス (*Epicoccum purpurascens*) + TX、エピコッカム属 (*Epicoccum spp.*) + TX、フィロバシディウム・フロリフォルメ (*Filobasidium floriforme*) + TX、フザリウム・アクミナツム (*Fusarium acuminatum*) + TX、フザリウム・クラミドスポルム (*Fusarium chlam*

10

20

30

40

50

ydosporum) + TX、フザリウム・オキシスポルム (Fusarium oxysporum) (Fusaclean (登録商標) / Biofox C (登録商標)) + TX、フザリウム・プロリフェラツム (Fusarium proliferatum) + TX、フザリウム属 (Fusarium spp.) + TX、ガラクトマイセス・ゲオトリスム (Galactomyces geotrichum) + TX、グリオクラジウム・カテナラツム (Gliocladium catenulatum) (Primastop (登録商標)) + TX、Prestop (登録商標) + TX、グリオクラジウム・ロセウム (Gliocladium roseum) + TX、グリオクラジウム属 (Gliocladium spp.) (Soilgard (登録商標)) + TX、グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) (Soilgard (登録商標)) + TX、顆粒病ウイルス (Granulovirus) (Granupom (登録商標)) + TX、ハロバチルス・ハロフィラス (Halobacillus halophilus) + TX、ハロバチルス・リトラリス (Halobacillus litoralis) + TX、ハロバチルス・トルウエペリ (Halobacillus trueperi) + TX、ハロモナス属 (Halomonas spp.) + TX、ハロモナス・スブグラシエスコラ (Halomonas subglaciescola) + TX、ハロビブリオ・バリアビリス (Halovibrio variabilis) + TX、ハンセニアスポラ・ウバルム (Hanseniaspora uvarum) + TX、オオタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus) (Helicovex (登録商標)) + TX、アメリカタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus) (Gemstar (登録商標)) + TX、イソフラボン・ホルモノネチン (Myconate (登録商標)) + TX、クロエケラ・アピキュラータ (Kloeckera apiculata) + TX、クロエケラ属 (Kloeckera spp.) + TX、ラゲニジウム・ギガンテウム (Lagenidium giganteum) (Laginex (登録商標)) + TX、レカニシリウム・ロンギスポルム (Lecanicillium longisporum) (Vertiblast (登録商標)) + TX、レカニシリウム・ムスカリウム (Lecanicillium muscarium) (Vertikil (登録商標)) + TX、マイマイガ核多角体病ウイルス (Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis virus) (Disparvirus (登録商標)) + TX、マリノコッカス・ハロフィルス (Marinococcus halophilus) + TX、メイラ・ゲウラコニギイ (Meira geulakonigii) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhizium anisopliae) (Met52 (登録商標)) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhizium anisopliae) (Destruxin WP (登録商標)) + TX、メチニコピア・フルクチコラ (Metschnikowia fruticola) (Shemer (登録商標)) + TX、メチニコピア・プルケリマ (Metschnikowia pulcherrima) + TX、ミクロドチウム・ジメルム (Microdochium dimerum) (Antibot (登録商標)) + TX、ミクロモノスポラ・ケルレア (Micromonospora coerulea) + TX、ミクロスファエロプシス・オクラセ (Microsphaeropsis ochracea) + TX、ムスコドル・アルプス (Muscodor albus) 620 (Muscudor (登録商標)) + TX、ムスコドル・ロセウス (Muscodor roseus) 菌株 A3-5 + TX、ミコリザエ属 (Mycorrhizae spp.) (AMykor (登録商標)) + TX、Root Maximizer (登録商標) + TX、クワ暗斑病菌 (Myrothecium verrucaria) 菌株 AARC-0255 (DiTera (登録商標)) + TX、BROS PLUS (登録商標) + TX、オフィオストマ・ピリフェルム (Ophiostoma piliiferum) 菌株 D97 (Sylvanex (登録商標)) + TX、ペシロマイセス・ファリノスス (Paecilomyces f

10

20

30

40

50

arinosus) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus) (PFR-97 (登録商標) + TX、PreFeRal (登録商標) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (Paecilomyces linacinus) (Biostat WP (登録商標) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (Paecilomyces lilacinus) 菌株 251 (MeloCon WG (登録商標) + TX、パエニバチルス・ポリミキサ (Paenibacillus polymyxa) + TX、パントエア・アグロメランズ (Pantoea agglomerans) (BlightBan C9-1 (登録商標) + TX、パントエア属 (Pantoea spp.) + TX、パストーリア属 (Pasteuria spp.) (Econem (登録商標) + TX、パストーリア・ニシザワエ (Pasteuria nishizawae) + TX、ペニシリウム・オーランティオグリセウム (Penicillium aurantiogriseum) + TX、ペニシリウム・ビライ (Penicillium billai) (Jumpstart (登録商標) + TX、Tag Team (登録商標) + TX、ペニシリウム・ブレピコンパクトム (Penicillium brevicompactum) + TX、ペニシリウム・フレクエンタス (Penicillium frequentans) + TX、ペニシリウム・グリセオフルバム (Penicillium griseofulvum) + TX、ペニシリウム・ブルプロゲナム (Penicillium purpurogenum) + TX、ペニシリウム属 (Penicillium spp.) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (Penicillium viridicatum) + TX、フレビオブシス・ギガンテア (Phlebiopsis gigantea) (Rotstop (登録商標) + TX、リン酸塩溶解細菌 (Phosphomeal (登録商標) + TX、フィットファトラ・クリプトゲア (Phytophthora cryptogea) + TX、フィットファトラ・パルミボラ (Phytophthora palmivora) (Devine (登録商標) + TX、ピヒア・アノマラ (Pichia anomala) + TX、ピヒア・ギリエルモンディ (Pichia guilermundii) + TX、ピヒア・メンブранаファシエンス (Pichia membranaefaciens) + TX、ピヒア・オニキス (Pichia onychis) + TX、ピヒア・スチピチス (Pichia stipites) + TX、緑膿菌 (Pseudomonas aeruginosa) + TX、シュードモナス・オーレオファシエンス (Pseudomonas aureofaciens) (Spot-Less Biofungicide (登録商標) + TX、シュードモナス・セパシア (Pseudomonas cepacia) + TX、シュードモナス・クロロラフィス (Pseudomonas chlororaphis) (AtEze (登録商標) + TX、シュードモナス・コルガータ (Pseudomonas corrugate) + TX、蛍光菌 (Pseudomonas fluorescens) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標) + TX、シュードモナス・プチダ (Pseudomonas putida) + TX、シュードモナス・リアクタンズ (Pseudomonas reactans) + TX、シュードモナス属 (Pseudomonas spp.) + TX、シュードモナス・シリंगाエ (Pseudomonas syringae) (Bio-Save (登録商標) + TX、シュードモナス・ビリジフラバ (Pseudomonas viridiflava) + TX、蛍光菌 (Pseudomonas fluorescens) (Zequanox (登録商標) + TX、シュードジマ・フロクロサ (Pseudozyma flocculosa) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標) + TX、プッシニア・カナリクラタ (Puccinia canaliculata) + TX、プッシニア・テラスベオス (Puccinia thlaspeos) (Wood Warrior (登録商標) + TX、ピシウム・パレカンドルム (Pythium paroecandrum) + TX、ピシウム・オリガンドルム (Pythium oligandrum) (Polygandron (登録商標) + TX、Polyversum (登録商標) + TX、ピシウム病菌 (Pythium periplocum) + TX、ラーネラ・ア

10

20

30

40

50

クアティリス (*Rhanelia aquatilis*) + TX、ラーネラ属 (*Rhanelia* spp.) + TX、リゾビウム属 (*Rhizobia*) (Dormal (登録商標)) + TX、Vault (登録商標)) + TX、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) 菌株 AQ719 + TX、ロドスポリジウム・ディオボバタム (*Rhodosporeidium diobovatum*) + TX、ロドスポリジウム・トルロイデス (*Rhodosporeidium toruloides*) + TX、ロドトルラ属 (*Rhodotorula* spp.) + TX、ロドトルラ・グルチニス (*Rhodotorula glutinis*) + TX、ロドトルラ・グラミニス (*Rhodotorula graminis*) + TX、ロドトルラ・ムチラギノーザ (*Rhodotorula mucilagnosa*) + TX、ロドトルラ・ルブラ (*Rhodotorula rubra*) + TX、サッカロマイセス・セレビシエ (*Saccharomyces cerevisiae*) + TX、サリニコッカス・ロセウス (*Salinococcus roseus*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia minor*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia minor*) (SARRITOR (登録商標)) + TX、スキタリジウム属 (*Scytalidium* spp.) + TX、スキタリジウム・ウレジニコラ (*Scytalidium uredinicola*) + TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus*) (Spod-X (登録商標)) + TX、Spexit (登録商標)) + TX、セラチア・マルセッセンス (*Serratia marcescens*) + TX、セラチア・プリムシカ (*Serratia plymuthica*) + TX、セラチア属 (*Serratia* spp.) + TX、ソルダリア・フィミコーラ (*Sordaria fimicola*) + TX、エジプトヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus*) (Littovir (登録商標)) + TX、スポロボロマイセス・ロセウス (*Sporobolomyces roseus*) + TX、ステノトロホモナス・マルトフィリア (*Stenotrophomonas maltophilia*) + TX、ストレプトマイセス・ヒグロスコピクス (*Streptomyces ahngroscopicus*) + TX、ストレプトマイセス・アルバドゥンカス (*Streptomyces albaduncus*) + TX、ストレプトマイセス・エクスフォリエーテス (*Streptomyces exfoliates*) + TX、ストレプトマイセス・ガルバス (*Streptomyces galbus*) + TX、ストレプトマイセス・グリセオプラヌス (*Streptomyces griseoplanus*) + TX、ストレプトマイセス・グリセオビリディス (*Streptomyces griseoviridis*) (Mycostop (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (*Streptomyces lydicus*) (Actinovate (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (*Streptomyces lydicus*) WYEC-108 (ActinoGrow (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・ビオラセウス (*Streptomyces violaceus*) + TX、チレチオプシス・ミノル (*Tilletiopsis minor*) + TX、チレチオプシス属 (*Tilletiopsis* spp.) + TX、トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) (T34 Biocontrol (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ガムシイ (*Trichoderma gamsii*) (Tenet (登録商標)) + TX、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) (Plantmate (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハマツム (*Trichoderma hamatum*) TH 382 + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*Trichoderma harzianum rifai*) (Mycostar (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) T-22 (Trianium-P (登録商標)) + TX、PlantShield HC (登録商標) + T

10

20

30

40

50

X、Trianium - G (登録商標) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-39 (Trichodex (登録商標) + TX、トリコデルマ・インハマタム (Trichoderma inhamatum) + TX、トリコデルマ・コニンギ (Trichoderma koningii) + TX、トリコデルマ属 (Trichoderma spp.) LC 52 (Sentinel (登録商標) + TX、トリコデルマ・リグノルム (Trichoderma lignorum) + TX、トリコデルマ・ロンギブラキアタム (Trichoderma longibrachiatum) + TX、トリコデルマ・ポリスポラム (Trichoderma polysporum) (Binab T (登録商標) + TX、トリコデルマ・タキシ (Trichoderma taxi) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (旧グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) GL-21) (Soil Guard (登録商標) + TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) + TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標) + TX、トリコスポロン・プルランス (Trichosporon pullulans) + TX、トリコスポロン属 (Trichosporon spp.) + TX、トリコセシウム属 (Trichothecium spp.) + TX、トリコセシウム・ロセウム (Trichothecium roseum) + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94670 + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94671 + TX、ウロクラジウム・アトラム (Ulocladium atrum) + TX、ウロクラジウム・オウデマンシイ (Ulocladium oudemansii) (Botry-Zen (登録商標) + TX、トウモロコシ黒穂病菌 (Ustilago maydis) + TX、様々な細菌及び補助微量栄養素 (Natural II (登録商標) + TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標) + TX、バーチシリウム・クラミドスポリウム (Verticillium chlamydosporium) + TX、バーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) (Mycotal (登録商標) + TX、Vertalec (登録商標) + TX、Vip3Aa20 (VIPTera (登録商標) + TX、ビルジバチルス・マリスモルツイ (Virgibacillus marismortui) + TX、キサントモナス・カムペストリス病原型ポアエ (Xanthomonas campestris pv. Poae) (Camperico (登録商標) + TX、ゼノラブダス・ボヴィエニイ (Xenorhabdus bovienii) + TX、ゼノラブダス・ネマトフィラ (Xenorhabdus nematophilus) ; 及び

以下のものを含む植物抽出物：松油 (Retenol (登録商標) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標) + TX、AzaGuard (登録商標) + TX、MeemAzal (登録商標) + TX、Molt-X (登録商標) + TX、植物性の昆虫成長制御剤 (Botanical IGR) (Neemazad (登録商標) + TX、Neemix (登録商標) + TX、ナタネ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標) + TX、アメリカアリタソウ (Chenopodium ambrosioides near ambrosioides) (Requiem (登録商標) + TX、キク属 (Chrysanthemum) 抽出物 (Crisant (登録商標) + TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標) + TX、シソ科植物 (Labiatae) の精油 (Botania (登録商標) + TX、クローブローズマリーペパーミント及びタイム油の抽出物 (Garden insect killer (登録商標) + TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標) + TX、ニンニク + TX、レモングラス油 (GreenMatch (登録商標) + TX、ニーム油 + TX、イヌハッカ (Nepeta cataria) (キャットニップ油) + TX、イヌハッカ (Nepeta catarina) + TX、ニコチン + TX、オレガノ油 (Moss B

10

20

30

40

50

uster (登録商標) + TX、ゴマ科植物 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標) + TX、除虫菊 + TX、シャボンノキ (Quillaja saponaria) (NemaQ (登録商標) + TX、オオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) (Regalia (登録商標) + TX、Sakalia (登録商標) + TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標) + TX、ミカン科植物 (Rutaceae) 抽出物 (Soleo (登録商標) + TX、大豆油 (Ortho ecosense (登録商標) + TX、ティーツリー油 (Timorex Gold (登録商標) + TX、タイム油 + TX、AGNIQUE (登録商標) MMF + TX、Bug Oil (登録商標) + TX、ローズマリーゴマペパーミントタイム及びシナモン抽出物の混合物 (EF 300 (登録商標) + TX、クローブローズマリー及びペパーミント抽出物の混合物 (EF 400 (登録商標) + TX、クローブペパーミントニク油及びミントの混合物 (Soil Shot (登録商標) + TX、カオリン (Screen (登録商標) + TX、褐藻類の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標) ); 及び

10

以下のものを含むフェロモン: クロネハイロヒメハマキ (blackheaded fireworm) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標) + TX、コドリングガ (Codling Moth) フェロモン (Paramount dispenser - (CM) / Isomate C - Plus (登録商標) + TX、グレープベリーモス (Grape Berry Moth) フェロモン (3M MEC - GBM Sprayable Pheromone (登録商標) + TX、ハマキガ科のガ (Leafroller) フェロモン (3M MEC - LR Sprayable Pheromone (登録商標) + TX、ムスカモン (Snip7 Fly Bait (登録商標) + TX、Starbar Premium Fly Bait (登録商標) + TX、ナシヒメシンクイ (Oriental Fruit Moth) フェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標) + TX、スカシバガ科のガ (Peachtree Borer) フェロモン (Isomate - P (登録商標) + TX、トマトピンworm (Tomato Pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標) + TX、Entostat 粉末 (ヤシの木からの抽出物) (Exosex CM (登録商標) + TX、(E + TX, Z + TX, Z) - 3 + TX, 8 + TX, 11 テトラデカトリエニルアセテート + TX、(Z + TX, Z + TX, E) - 7 + TX, 11 + TX, 13 - ヘキサデカトリエナール + TX、(E + TX, Z) - 7 + TX, 9 - ドデカジエンジエン - 1 - イルアセテート + TX、2 - メチル - 1 - ブタノール + TX、酢酸カルシウム + TX、Scenturion (登録商標) + TX、Biolure (登録商標) + TX、Check - Mate (登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオアート (Lavandulyl senecioate); 及び

20

30

以下のものを含む生物 (Microbials): アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Aphelinus - System (登録商標) + TX、アセロファガス・パパイヤ (Acerophagus papaya) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia - System (登録商標) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ (Ageniaspis citricola) + TX、アゲニアスピス・フシコリス (Ageniaspis fuscicollis) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標) + TX、Andersoni - System (登録商標) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標) + TX、Spical (登録商標) + TX、アンブリセイウス・ククメリス (Amb

40

50

lyseius cucumeris) (Thripex (登録商標) + TX、Bugline cucumeris (登録商標) + TX、アンブリセイウス・ファラキス (Amblyseius fallacis) (Fallacis (登録商標) + TX、アンブリセイウス・スウィルスキイ (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標) + TX、Swirskii-Mite (登録商標) + TX、アンブリセイウス・ウォマースレイ (Amblyseius womersleyi) (WomersMite (登録商標) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (Amitus hesperidum) + TX、アナグルス・アトムス (Anagrus atomus) + TX、アナギルス・フスシベントリス (Anagrus fusciventris) + TX、アナギルス・カマリ (Anagrus kamali) + TX 10、アナギルス・ロエッキ (Anagrus loeckii) + TX、アナギルス・シュードコッカス (Anagrus pseudococci) (Citripar (登録商標) + TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus benefices) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) + TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris-System (登録商標) + TX、アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標) + TX、Aphiline (登録商標) + TX、アフェリヌス・アシキス (Aphelinus asychis) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (Ahipar (登録商標) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Ervipar (登録商標) + TX、アフィジウス・ギフエンシス (Aphidius gifuensis) + TX、アフィジウス・マトリカリアエ (Aphidius matricariae) (Ahipar-M (登録商標) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標) + TX、アフィチス・リングナネンシス (Aphytis lingnanensis) + TX、アフィチス・メリヌス (Aphytis melinus) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウィイ (Aprostocetus hagenowii) + TX、アセタ・コリアリア (Atheta coriaria) (Staphyline (登録商標) + TX、マルハナバチ属 (Bombus spp.) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Natupol Beehive (登録商標) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeline (登録商標) + TX、Tripol (登録商標) + TX、セファロミア・ステファノデリス (Cephalonomia stephanoderis) + TX、チノコルス・ニグリツス (Chilocorus nigritus) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysoline (登録商標) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysopa (登録商標) + TX、クリソペルラ・ルフィラブリス (Chrysoperla rufilabris) + TX、シロスピルス・インゲヌウス (Cirrospilus ingenuus) + TX、シロスピルス・クアドリストラアツス (Cirrospilus quadristriatus) + TX、シトロスティクス・フィロクニストイデス (Citrostichus phyllocnistoides) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (Closterocerus chamaeleon) + TX、クロステロセルス属 (Closterocerus spp.) + TX、コシドキシノイデス・ペルミヌツス (Coccidoxenoides perminutus) (Planopar (登録商標) + TX、コッコファグス・コウペリ (Coccophagus cowperi) + TX、コッコファグス・リシムニア (Coccophagus lycimnia) + TX、キアシサムライコマユバチ (Cotesia flavipes) + TX、コナガサムライコマユバチ (Cotesia plutell 50

ae) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (*Cryptobug* (登録商標) + TX、*Cryptoline* (登録商標)) + TX、キムネタマキスイ (*Cybocephalus nipponicus*) + TX、ハモグリコマコバチ (*Dacnusa sibirica*) + TX、ハモグリコマコバチ (*Dacnusa sibirica*) (*Minusa* (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Diminex* (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (*Delphastus catalinae*) (*Delphastus* (登録商標)) + TX、デルファスツス・プシルス (*Delphastus pusillus*) + TX、ディアカスミモルファ・クラウシイ (*Diachasmimorpha krausii*) + TX、ディアカスミモルファ・ロンギカウダタ (*Diachasmimorpha longicaudata*) + TX、ディアパルシス・ジュクンダ (*Diaparsis jucunda*) + TX、ディアホレンシルツス・アリガレンシス (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Miglyphus* (登録商標)) + TX、*Digline* (登録商標)) + TX、ハモグリコマコバチ (*Dacnusa sibirica*) (*DacDigline* (登録商標) + TX、*Minex* (登録商標)) + TX、ディベルシネルプス属 (*Diversinervus spp.*) + TX、エンカルシア・シトリナ (*Encarsia citrina*) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max* (登録商標) + TX、*Encarline* (登録商標) + TX、*En-Strip* (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Enermix* (登録商標)) + TX、エンカルシア・グアデロウパエ (*Encarsia guadeloupae*) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス (*Encarsia haitiensis*) + TX、ホソヒラタアブ (*Episyrphus balteatus*) (*Syrphidend* (登録商標)) + TX、エルトモセルス・シフォニニ (*Eretmocerus siphonini*) + TX、エルトモセルス・カリフォルニクス (*Eretmocerus californicus*) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Ercal* (登録商標) + TX、*Eretline e* (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Bemimix* (登録商標)) + TX、エルトモセルス・ハヤチ (*Eretmocerus hayati*) + TX、エルトモセルス・ムンツス (*Eretmocerus mundus*) (*Bemipar* (登録商標) + TX、*Eretline m* (登録商標)) + TX、エルトモセルス・シフォニニ (*Eretmocerus siphonini*) + TX、エキソコムス・クアドリプスツラツス (*Exochomus quadripustulatus*) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Spidend* (登録商標)) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiella acarisuga*) (*Feltiline* (登録商標)) + TX、フォピウス・アリサヌス (*Fopius arisanus*) + TX、フォピウス・セラチチボルス (*Fopius ceratitivorius*) + TX、ホルモノネチン (*Wirless Beehome* (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (*Franklinothrips vespiformis*) (*Vespop* (登録商標)) + TX、ガレンドロムス・オシデンタリス (*Galendromus occidentalis*) + TX、ゴニオズス・レグネリ (*Goniozus legneri*) + TX、シマメイガコマコバチ (*Habrobracon hebetor*) + TX、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*) (*HarmoBeetle* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (*Heterorhabditis spp.*) (*Lawn Patrol* (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) (*NemaShield HB* (登録商標) + TX、*Nemaseek* (登録商標) + TX、*Terra*

10

20

30

40

50

nem - Nam (登録商標) + TX、Terranem (登録商標) + TX、Larvanem (登録商標) + TX、B - Green (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nematop (登録商標) + TX、ヘテロラブディティス・メジ  
 ディス (Heterorhabditiis megidis) (Nemasys H (登録商標) + TX、BioNem H (登録商標) + TX、Exhibitline hm (登録商標) + TX、Larvanem - M (登録商標) + TX、サカハチテントウ (Hippodamia convergens) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (Hypoaspis aculeifer) (Aculeifer - System (登録商標) + TX、Entomite - A (登録商標) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspis miles) (Hypoline m (登録商標) + TX、Entomite - M (登録商標) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Lbalia leucospoides) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (Lecanoideus floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンツス (Lemophagus errabundus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Leptomastidea abnormis) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ (Leptomastix dactylopii) (Leptopar (登録商標) + TX、レプトマスティクス・エポナ (Leptomastix epona) + TX、リンドルス・ロファンタエ (Lindorus lophanthae) + TX、リボレクシス・オレグマエ (Lipolexis oregmae) + TX、ルシリア・カエサル (Lucilia caesar) (Natufly (登録商標) + TX、リシフレブス・テストケイペス (Lysiphlebus testaceipes) + TX、マクロロフス・カリギノス (Macrolophus caliginosus) (Mirical - N (登録商標) + TX、Macroline c (登録商標) + TX、Mirical (登録商標) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (Mesoseiulus longipes) + TX、メタフィクス・フラブス (Metaphycus flavus) + TX、メタフィクス・ロウンズブレイ (Metaphycus lounsburyi) + TX、ミクロムス・アングラツス (Micromus angulatus) (Milacewing (登録商標) + TX、マイクロテリス・フラブス (Microterys flavus) + TX、ムスシディフラクス・ラボトレルス (Muscidifurax raptorellus) 及びスパランギア・カメロニ (Spalangia cameroni) (Biopar (登録商標) + TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (Neodryinus typhlocybae) + TX、ミヤコカブリダニ (Neoseiulus californicus) + TX、ネオセイウルス・ククメリス (Neoseiulus cucumeris) (THRYPEX (登録商標) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neoseiulus fallacis) + TX、ネシデオコリス・テヌイス (Nesideocoris tenuis) (NesidioBug (登録商標) + TX、Nesibug (登録商標) + TX、オフィラ・アエネセンス (Ophyra aenescens) (Biofly (登録商標) + TX、シノビハナカメムシ (Orius insidiosus) (Thripor - I (登録商標) + TX、Oriline i (登録商標) + TX、エルヒメハナカメムシ (Orius laevigatus) (Thripor - L (登録商標) + TX、Oriline l (登録商標) + TX、オリウス・マジユスクルス (Orius majusculus) (Oriline m (登録商標) + TX、タイリクヒメハナカメムシ (Orius strigicollis) (Thripor - S (登録商標) + TX、パウエシア・ジュニペロルム (Pauesia juniperorum) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pediobius foveolatus) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (Phasmarhabditiis hermaphrodita) (Nemaslug (登録商標) + TX、フィマスティクス・コフエア (Phymastichus coffea) + TX、フィットセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulus macropilus) + TX、チリカブリダニ (Phytos

10

20

30

40

50

*eiulus persimilis*) (*Spidex* (登録商標) + TX、*Phytoline p* (登録商標) + TX、*Podisus maculiventris*) (*Podisus* (登録商標) + TX、*Pseudacteon curvatus*) + TX、*Pseudacteon obtusus*) + TX、*Pseudacteon tricuspis*) + TX、*Pseudaphycus maculipennis*) + TX、*Pseudleptomastix mexicana*) + TX、*Psyllaephagus pilosus*) + TX、*Psytalia concolor*) (複合体) + TX、*Quadrastichus spp.*) + TX、*Rhyzobius lophanthae*) + TX、*Rodolia cardinalis*) + TX、*Rumina decollate*) + TX、*Semielacher petiolatus*) + TX、*Sitobion avenae*) (*Ervibank* (登録商標) + TX、*Steinernema carpocapsae*) (*Nematac C* (登録商標) + TX、*Millenium* (登録商標) + TX、*BioNem C* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemastar* (登録商標) + TX、*Capsanem* (登録商標) + TX、*Steinernema feltiae*) (*NemaShield* (登録商標) + TX、*Nemasys F* (登録商標) + TX、*BioNem F* (登録商標) + TX、*Steinernema-System* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemaplus* (登録商標) + TX、*Exhibitline sf* (登録商標) + TX、*Scia-rid* (登録商標) + TX、*Entonem* (登録商標) + TX、*Steinernema krausseii*) (*Nemasys L* (登録商標) + TX、*BioNem L* (登録商標) + TX、*Exhibitline srb* (登録商標) + TX、*Steinernema riobrave*) (*BioVector* (登録商標) + TX、*BioVektor* (登録商標) + TX、*Steinernema scapterisci*) (*Nematac S* (登録商標) + TX、*Steinernema spp.*) + TX、*Steinernematid spp.*) (*Guardian Nematodes* (登録商標) + TX、*Stethorus punctillum*) (*Stethorus* (登録商標) + TX、*Tamarixia radiate*) + TX、*Tetrastichus setifer*) + TX、*Thripobius semiluteus*) + TX、*Torymus sinensis*) + TX、*Trichogramma brassicae*) (*Tricholine b* (登録商標) + TX、*Trichogramma brassicae*) (*Tricho-Strip* (登録商標) + TX、*Trichogramma evanescens*) + TX、*Trichogramma minutum*) + TX、*Trichogramma ostrinia*) + TX、*Trichogramma platneri*) + TX、*Trichogramma pretiosum*) + TX、*Xanthopimpla stemmator*) ; 及び  
 以下のものを含む他の生物学的製剤：*Abshijin* 酸 + TX、*BioSea* (登録商標) + TX、*Chondrostereum purpureum*) (*Chontrol Paste* (登録商標) + TX、*コレトトリクム・グ*

10

20

30

40

50

レオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*) (Collego (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (Cueva (登録商標)) + TX、デルタトラップ (Trapline d (登録商標)) + TX、エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) (ハーピン) (ProAct (登録商標)) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標) + TX、リン酸第二鉄 (Ferri-phosphate) (Ferramol (登録商標)) + TX、ファネルトラップ (Trapline y (登録商標)) + TX、Gallex (登録商標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (Homobrassonolide) + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標)) + TX 10  
 、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標)) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (*Microctonus hyperodae*) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (*Mycoleptodiscus terrestris*) (Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Aminomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (Thripline ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (MilStop (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム+チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登録商標) + TX  
 、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (*Nosema locustae*) (Semaspore Organic Grasshopper Control (登録商標)) + TX 20  
 、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標)) + TX、Rebell Amarello (登録商標) + TX 及びトラップ (Takitrapline y + b (登録商標)) + TX ; 又は  
 ブロフルトリネート + TX、ジフロヴィダジン + TX、フロメトキン + TX、フルヘキサホン + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) グラニューローシスウイルス + TX、コドリガ (*Cydia pomonella*) グラニューローシスウイルス + TX、イミシアホス + TX、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) 核多核体ウイルス + TX、ヘリオチスブクチゲラ (*Heliothis punctigera*) 核多核体ウイルス + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多核体ウイルス + TX、スポドプテラフルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*) 核多核体ウイルス + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) 核多核体ウイルス + TX、p-シメン + TX、ピフルブミド + TX、ピラフルプロール + TX、QRD420 + TX、QRD452 + TX、QRD460 + TX、テルペノイドブレンド + TX、テルペノイド + TX、テトラニリプロール + TX 及び  
 -テルピネン + TX から選択される生物学的に有効な成分若しくは薬剤 ; 又は  
 コード AE1887196 (BSC-BX60309) + TX、コード NNI-0745GR + TX、コード IKI-3106 + TX、コード JT-L001 + TX、コード ZNQ-08056 + TX、コード IPPA152201 + TX、コード HNPC-A9908 (CAS: [660411-21-2]) + TX、コード HNPC-A2005 (CAS: [860028-12-2]) + TX、コード JS118 + TX、コード ZJ0967 + TX、コード ZJ2242 + TX、コード JS7119 (CAS: [929545-74-4]) + TX、コード SN-1172 + TX、コード HNPC-A9835 + TX、コード HNPC-A9955 + TX、コード HNPC-A3061 + TX、コード Chuanhua89-1 + TX、コード IPP-10 + TX、コード ZJ3265 + TX、コード JS9117 + TX、コード ZJ3757 + TX、コード ZJ4042 + TX、コード ZJ4014 + TX、コード ITM-121 + TX、コード DPX-RAB55 (DKI-2301) + TX、コード NA-89 + TX、コード MIE-1209 + TX、コード MCI-8007 + TX、コード BCS-CL73507 + TX、コード S-1871 + TX、コード DPX-RDS63 + TX、コード AKD-1193 + TX などのコー 50

ド+TXによって参照される有効物質；又は  
 キノフメリン+TX、メフェントリフルコナゾール+TX、フェンピコキサミド+TX、  
 フルインダビル+TX、インビルフルキサム+TX又はインジフルメトビル+TX、イソ  
 フルシプラム+TX、ピラプロポイン+TX、フロリルピコキサミド+TX、メチルテト  
 ラプロール+TX、イブプルフェノキン+TX、ピリダクロメチル+TX又はクロピリジ  
 フル+TX、テトラクロラントラニリプロール+TX、テトラクロラニリプロール+TX  
 、テトフルピロリメト+TX、トリフルフェンピロリドン+TX、チクロピラゾフル  
 +TX、フルピリミン+TX又はピリフルラミド+TX、ベンズピリモキサン+TX、ベフ  
 ルプタミド-M+TX、ベンゾスフィル+TX又はオキサソスルフィル+TX、エトピラ  
 フェン+TX、アシノナビル+TX又はピリノナフェン+TX、オキソトリオン+TX、  
 ビクスロゾン+TX又はクロフェンジゾン+TX又はジクロロキシゾン+TX、シクロピ  
 ラニル+TX又はピラゾシクロニル+TX又はシクロピラゾニル+TX、 -プロマジオ  
 ロン+TX、オキサチアピプロリン+TX、フルオピラム+TX、ペンフルフェン+TX  
 、フルオキソピロサド+TX、フルオキサピプロリン+TX及びフルピラジフロン+TX  
 から選択される他の生物学的に有効な成分若しくは薬剤。

【0292】

有効成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば[3878-19-1]は、ケミカル  
 アブストラクツ登録番号を意味する。上記の混合の相手は、公知である。有効成分が、“  
 The Pesticide Manual”[The Pesticide Manual  
 - A World Compendium; Thirteenth Edition; E  
 ditor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会(The British  
 Crop Protection Council)]に含まれている場合、それらは、特  
 定の化合物について上記において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されて  
 あり；例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号(1)で記載されている。「[C  
 CN]」が、上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“C  
 ompendium of Pesticide Common Names”に含まれており  
 、それは、インターネット上でアクセス可能であり[A. Wood; Compendiu  
 m of Pesticide Common Names, (著作権)1995-200  
 4]；例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス：[http  
 ://www.alanwood.net/pesticides/acetoprol  
 e.html](http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html)に記載されている。

【0293】

上記の本明細書において、上記の有効成分の大部分は、個々の事例において用いられる  
 、いわゆる「慣用名」、関連する「ISO慣用名」又は他の「慣用名」によって参照され  
 ている。「慣用名」による呼称ではない場合、代わりに用いられる呼称の性質は、特定の  
 化合物について丸括弧内に記載されており；この場合、IUPAC名、IUPAC/Ch  
 emical Abstracts名、「化学名」、「慣習名」、「化合物名」若しくは  
 「開発コード」が用いられるか、又はこれらの呼称若しくは「慣用名」のいずれも用いら  
 れていない場合、「代替名」が採用される。「CAS登録番号」とは、Chemical  
 Abstracts Registry Numberを意味する。

【0294】

表Y-1~Y-8、X-1~X-8、U-1~U-2及びV-1~V-6並びに表Pから  
 選択される式Iの化合物と、上記の有効成分との有効成分混合物は、表Y-1~Y-8  
 、X-1~X-8、U-1~U-2及びV-1~V-6並びに表Pから選択される化合物  
 及び上記の有効成分を好ましくは100:1~1:6000、特に50:1~1:50の  
 混合比、より特に20:1~1:20、さらにより特に10:1~1:10、非常に特に  
 5:1及び1:5の比率で(2:1~1:2の比率が特に好ましく、4:1~2:1の比  
 率が同様に好ましい)、とりわけ1:1、又は5:1、又は5:2、又は5:3、又は5  
 :4、又は4:1、又は4:2、又は4:3、又は3:1、又は3:2、又は2:1、又  
 は1:5、又は2:5、又は3:5、又は4:5、又は1:4、又は2:4、又は3:4

10

20

30

40

50

、又は1：3、又は2：3、又は1：2、又は1：600、又は1：300、又は1：150、又は1：35、又は2：35、又は4：35、又は1：75、又は2：75、又は4：75、又は1：6000、又は1：3000、又は1：1500、又は1：350、又は2：350、又は4：350、又は1：750、又は2：750、又は4：750の比率で含む。それらの混合比は、重量基準である。

【0295】

上記の混合物は、有害生物を防除するための方法に使用され得、この方法は、上記の混合物を含む組成物を有害生物又はその環境に施用する工程を含むが、手術又は治療による人又は動物の身体の治療のための方法及び人又は動物の身体において実施される診断方法を除く。

10

【0296】

表Y-1～Y-8、X-1～X-8、U-1～U-2及びV-1～V-6並びに表Pから選択される式Iの化合物と、上記の1つ又は複数の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一のレディミックス形態で、「タンクミックス」などの単一の有効成分の別個の製剤から構成される組み合わせられたスプレー混合物として、且つ逐次、すなわち数時間又は数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の有効成分の併用で施用され得る。表Y-1～Y-8、X-1～X-8、U-1～U-2及びV-1～V-6並びに表Pから選択される式Iの化合物及び上記の有効成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。

【0297】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば非エポキシ化又はエポキシ化植物油（例えば、エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又は大豆油）、消泡剤、例えばシリコーン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤及び/又は粘着付与剤、肥料又は特定の効果を得るための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤又は除草剤などのさらなる固体又は液体助剤も含み得る。

20

【0298】

本発明に係る組成物は、例えば、固体有効成分を粉砕し、篩にかけ、且つ/又は圧縮することにより、助剤の非存在下において、且つ例えば有効成分を1つ又は複数の助剤と均質混合し、且つ/又は粉砕することにより、少なくとも1つの助剤の存在下で、それ自体公知の方法で調製される。この組成物の調製のためのこれらの方法及びこれらの組成物の調製のための化合物Iの使用も本発明の主題である。

30

【0299】

この組成物のための施用方法、すなわち噴霧、霧化、散布、はけ塗り、粉衣、拡散又は注ぎかけ（これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである）など、上記のタイプの有害生物を防除する方法及び上記のタイプの有害生物を防除するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1～1000 ppm、好ましくは0.1～500 ppmの有効成分である。1ヘクタール当たりの施用量は、一般に1ヘクタール当たり1～2000 gの有効成分、特に10～1000 g/ha、好ましくは10～600 g/haである。

【0300】

作物保護の分野における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用（葉面施用）であり、該当する有害生物による寄生の危険性に合わせて施用頻度及び施用量を選択することができる。代わりに、有効成分は、植物の生息地に液体組成物を灌注することにより、又は固体形態の有効成分を、植物の生息地、例えば土壤中に例えば粒剤の形態で導入すること（土壌施用）により、根系（全身作用）を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。

40

【0301】

本発明の化合物及びその組成物は、上記のタイプの有害生物からの植物繁殖材料、例えば果実、塊茎又は穀粒などの種子又は苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。代わりに、

50

この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することにより、又は固体組成物の層を塗布することにより、種子仁に塗付され得る（コーティング）。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を例えばドリルまき時に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法及びこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物及び防除される有害生物／真菌に応じて決まり、一般に100kgの種子当たり1～200グラム、好ましくは100kgの種子当たり5～150グラム（100kgの種子当たり10～100グラムなど）である。

#### 【0302】

種子という用語は、真正種子、種子片、吸枝、トウモロコシ粒、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽などを含むがこれらに限定されないあらゆる種類の種子及び植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

10

#### 【0303】

本発明は、式Iの化合物で被覆若しくは処理されるか又はそれを含有する種子も含む。「で被覆又は処理されるか及び／又はそれを含有する」という用語は、一般に、有効成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、有効成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、式（I）の化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これにより、式（I）の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。

20

#### 【0304】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬及び種子ペレットティングなど、当技術分野において公知の全ての好適な種子処理技術を含む。式（I）の化合物の種子処理適用は、種まきの前又は種まき／種子の植え付け時に噴霧又は種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。

#### 【0305】

生物学的実施例

実施例B1：タバココナジラミ（*Bemisia tabaci*）（綿コナジラミ）に対する活性

綿の葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置き、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に成虫のコナジラミを外寄生させた。6日間のインキュベーション後、死亡率についてサンプルを確認した。

30

#### 【0306】

以下の化合物は、00ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P3、P4、P6、P8、P10、P13、P14及びP15。

#### 【0307】

実施例B2：ディアブロチカ・バルテアタ（*Diabrotica balteata*）（トウモロコシハムシ）に対する活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置かれたトウモロコシの芽を、噴霧により10,000ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫（1ウェル当たり6～10匹）を外寄生させた。外寄生から4日後、死亡率及び成長阻害について非処理のサンプルと比較してサンプルを評価した。

40

#### 【0308】

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

P3、P4、P5、P7、P8、P10、P11、P12、P13、P14及びP16。

#### 【0309】

実施例B3：ユースキスツスヘロス（*Euschistus heros*）（ネオトロピカルブラウンスティンクバグ（*Neotropical Brown Stink Bug*）

50

) ) に対する活性

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

【0310】

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

P3、P4、P8、P9、P10、P13、P14及びP15。

【0311】

実施例 B4：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) に対する活性：

ヒマワリ葉片を24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。外寄生から6日後、死亡率についてサンプルを評価した。

【0312】

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

P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16及びP17。

【0313】

実施例 B5：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) に対する活性。

様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させたエンドウマメの苗の根を、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製された試験水溶液に直接入れた。苗を試験溶液に入れてから6日後、死亡率についてサンプルを評価した。

【0314】

以下の化合物は、24 ppm の試験量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16及びP17。

【0315】

実施例 B6：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ) に対する活性

人工餌料の入った24 ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに L2 幼虫 (1 ウェル当たり10~15匹) を外寄生させた。外寄生から5日後、死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比較してサンプルを評価した。

【0316】

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

P3、P4、P5、P6、P7、P8、P11、P12、P14及びP15。

【0317】

実施例 B7：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) に対する活性

綿の葉片を24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹の L1 幼虫を外寄生させた。外寄生から3日後、死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について未処理のサンプルと比較してサンプルを評価した。死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害の少なくとも1つのカテゴリが未処理のサンプルより高い場合、テストサンプルによるエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除が得られたとする。

10

20

30

40

50

## 【0318】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：  
P3、P4、P5、P7、P8、P11、P12、P14、P15及びP16。

## 【0319】

実施例B8：トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) (トビイロウンカ) に対する活性

イネ植物をスプレーチャンバ中において希釈テスト溶液で処理した。乾燥させた後、植物に約20匹のN3若虫を外寄生させた。処理の7日後、死亡率及び成長調節についてサンプルを評価した。

P6、P10、P11、P12、P13及びP15

10

## 【0320】

実施例B9：トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) (トビイロウンカ) に対する活性

栄養栽培系において、栄養液中において栽培したイネ植物を希釈テスト溶液で処理した。適用から1日後、植物に約20匹のN3若虫を外寄生させた。外寄生から7日後、死亡率及び成長調節についてサンプルを評価した。

P6、P10、P11、P12、P13及びP15

## 【0321】

実施例B10：ハダニ (*Tetranychus urticae*) (ナミハダニ) に対する活性：

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のインゲンマメ葉片に、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な年齢のダニ個体群を外寄生させた。外寄生から8日後、混合個体群(可動状態)における死亡率についてサンプルを評価した。

20

## 【0322】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：  
P3。

## 【0323】

実施例B11：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ) に対する活性

人工餌料の入った24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、コナガの卵をプラスチック製のステンシルを介してゲル吸い取り紙上にピペットし、プレートをこれで閉じた。外寄生から8日後、死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比較してサンプルを評価した。

30

## 【0324】

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

P16、P17、P18及びP19。

## 【0325】

実施例B12：テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*) に対する活性、96ウェルプレートにおける幼虫易動性インビトロプロファイリング

テスト溶液を10,000 ppmのDMSOストック溶液からTECANロボットで調製して、20 µLの500、100、50、25、12.5及び6.25 ppmを得る。各濃度について3回の反復を行う。各ウェルに、100~150匹の新たに採取したテンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*) の第2期幼虫を含む80 µLの線虫溶液を加える。プレートにカバーをし、室温で暗중에保管し、48時間インキュベートする。処理したウェルにおいて露出された幼虫の易動性を画像化ツールを用いて計測し、12匹の未処理の反復の平均と比較する。

40

## 【0326】

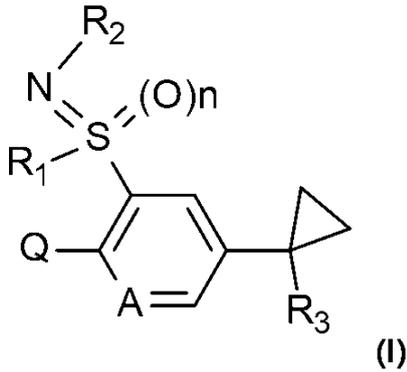
50

以下の化合物は、48時間後、100ppmで少なくとも60%の防除を達成した：  
P10、P15。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕式(I)

【化103】



10

(式中、

Aは、CH又はNであり、

R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり、

R<sub>2</sub>は、水素、シアノ、-C(O)R<sub>7</sub>、-C(O)OR<sub>8</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又は-C  
ONR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>であり、ここで、

R<sub>7</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルであり、R<sub>8</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ア  
ルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；

R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>は、互いに独立して、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

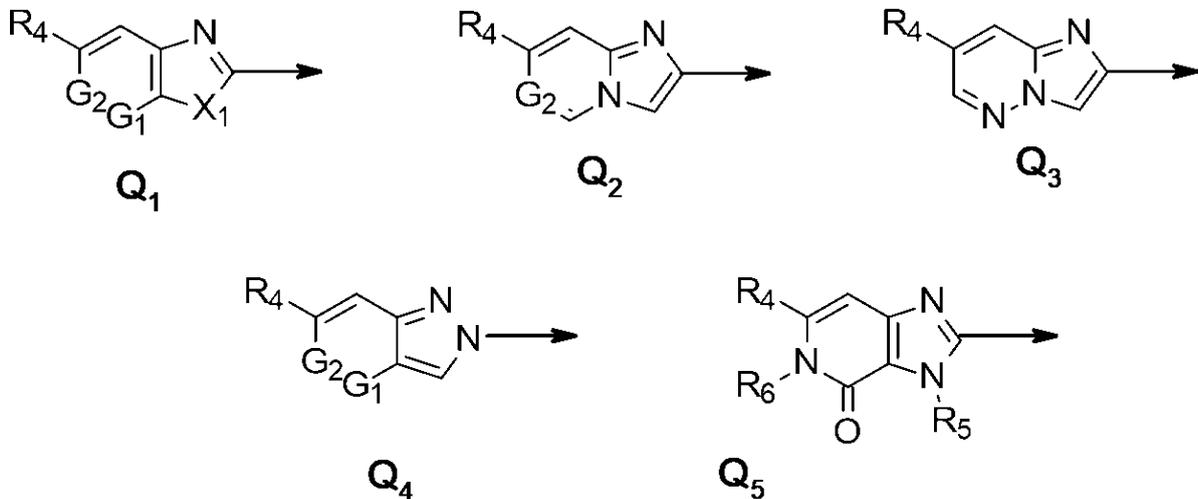
R<sub>11</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキル、シアノ、-CO<sub>2</sub>H、-CO  
<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>  
ジアルキルアミノカルボニルであり、

nは、0又は1であり；

Qは、式Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>及びQ<sub>5</sub>

【化104】



40

(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>~  
C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアル

50

コキシであり；

X<sub>1</sub>は、O又はNR<sub>5</sub>であり；

R<sub>5</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり；

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

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、互いに独立して、N又はCHである)

からなる群から選択される基である)

の化合物又は式Iの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

〔2〕Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチル、プロピル又はイソプロピルであり；

R<sub>2</sub>は、水素、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキルカルボニルであり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキル、シアノ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり；及び

nは、1である、

前記〔1〕に記載の化合物。

〔3〕Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチルであり；

R<sub>2</sub>は、水素であり；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキル、シアノ、-CO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり；及び

nは、1である、

前記〔1〕に記載の化合物。

〔4〕Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチルであり；

R<sub>2</sub>は、水素であり；

R<sub>3</sub>は、水素、シアノ又はCO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>であり；及び

nは、1である、

前記〔1〕に記載の化合物。

〔5〕Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチルであり；

R<sub>2</sub>は、水素であり；

R<sub>3</sub>は、水素又はシアノであり；及び

nは、1である、

前記〔1〕に記載の化合物。

〔6〕Qは、Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>4</sub>及びQ<sub>5</sub>

10

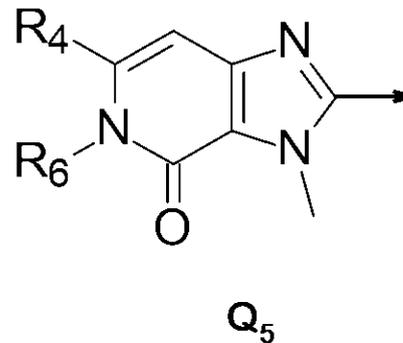
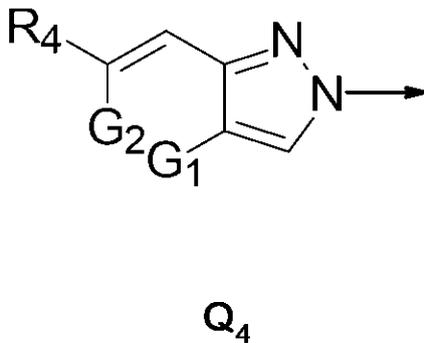
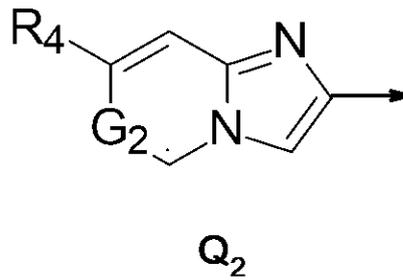
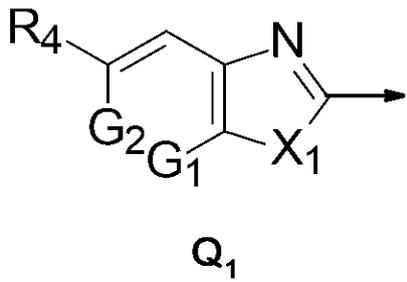
20

30

40

50

## 【化105】



(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキルスルフィニル又はC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキルスルホニルであり；

X<sub>1</sub>は、酸素又はNCH<sub>3</sub>であり；

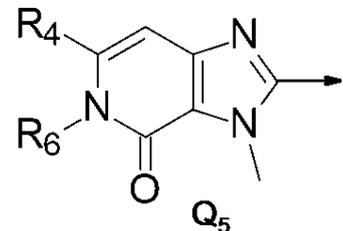
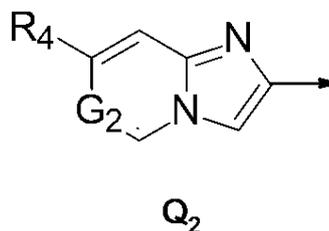
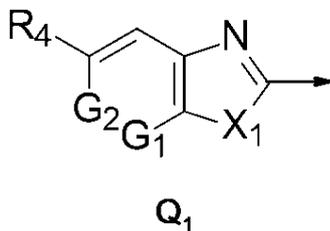
R<sub>6</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルコキシ又はシクロプロピルであり；及び

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、互いに独立して、N又はCHである)

から選択される基である、前記〔1〕~〔5〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔7〕Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>及びQ<sub>5</sub>

## 【化106】



(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>フルオロアルキル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルファニル、ジフルオロメチルスルフィニル又はジフルオロメチルスルホニルであり；

X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；

R<sub>6</sub>は、メチル、エチル、2,2,2-トリフルオロエチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、互いに独立して、N又はCHである)

から選択される基である、前記〔1〕~〔5〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔8〕Qは、Q<sub>1</sub>及びQ<sub>5</sub>

10

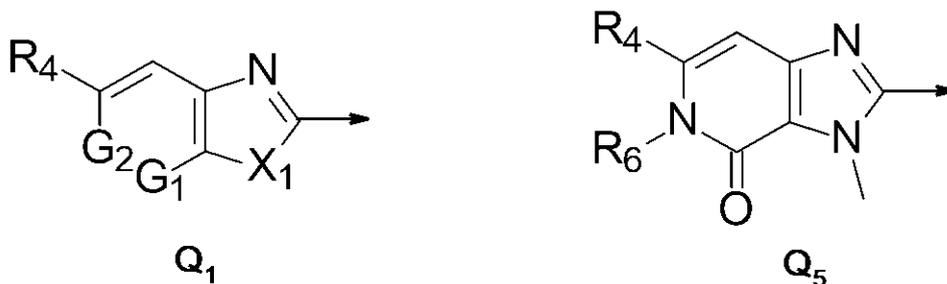
20

30

40

50

【化107】



10

(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；

X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；

R<sub>6</sub>は、エチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び

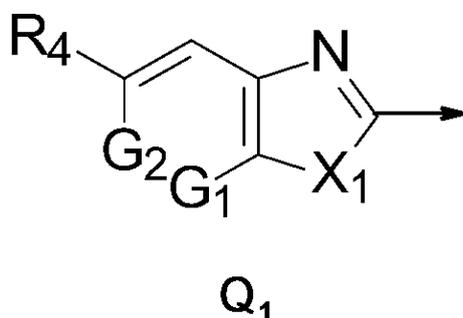
G<sub>1</sub>はNであり、且つG<sub>2</sub>はCHであるか、又は、G<sub>1</sub>はCHであり、且つG<sub>2</sub>はNであるか、又は、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>はNであるか、又は、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>はCHである)

から選択される基である、前記〔1〕～〔5〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔9〕Qは、ラジカルQ<sub>1</sub>

【化108】

20



30

(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>2</sub>は、トリフルオロメチルであり；

X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；及び

G<sub>1</sub>はNであり、且つG<sub>2</sub>はCHであるか、G<sub>1</sub>はCHであり、且つG<sub>2</sub>はNであるか、又は、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>はNである)

である、前記〔1〕～〔5〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔10〕Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチル、プロピル又はイソプロピルであり；

R<sub>2</sub>は、水素、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキルカルボニルであり；

40

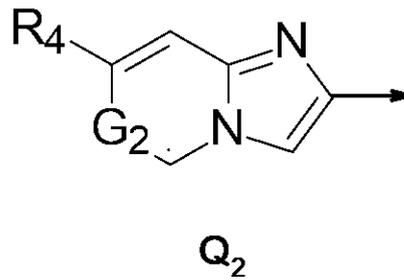
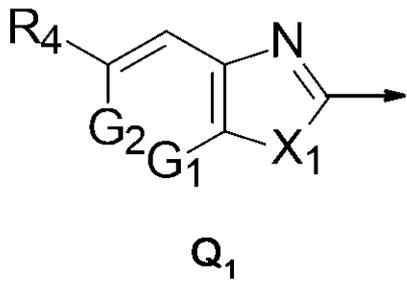
R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキル、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ジアルキルアミノカルボニルであり；

nは、1であり；

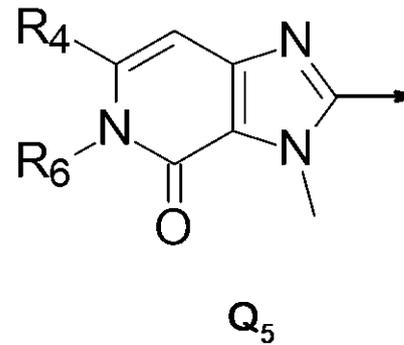
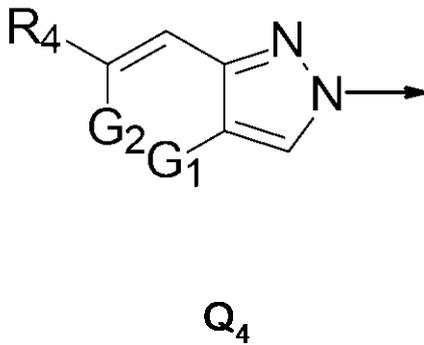
Qは、Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>4</sub>及びQ<sub>5</sub>

50

【化109】



10



20

(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルホニルであり；

$X_1$ は、酸素又は $NCH_3$ であり；

$R_6$ は、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ又はシクロプロピルであり；及び

$G_1$ 及び $G_2$ は、互いに独立して、N又はCHである)

から選択される基である、前記〔1〕に記載の化合物。

30

〔11〕Aは、CH又はNであり；

$R_1$ は、エチルであり；

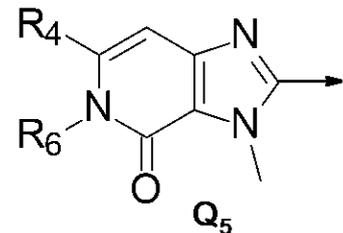
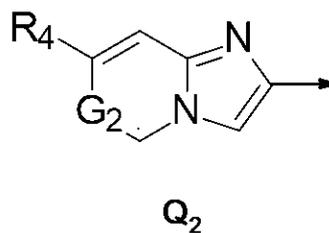
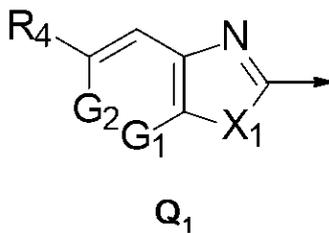
$R_2$ は、水素であり；

$R_3$ は、水素、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、シアノ、 $CO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_2$ ジアルキルアミノカルボニルであり；

$n$ は、1であり；

Qは、 $Q_1$ 、 $Q_2$ 及び $Q_5$

【化110】



40

(式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_2$ フルオロアルキル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルファニル、ジフルオロメチルスルフィニル又はジフルオロメチルスルホニルであり；

50

X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；

R<sub>6</sub>は、メチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び

G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>は、互いに独立して、N又はCHである）  
から選択される基である、前記〔1〕に記載の化合物。

〔12〕Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチルであり；

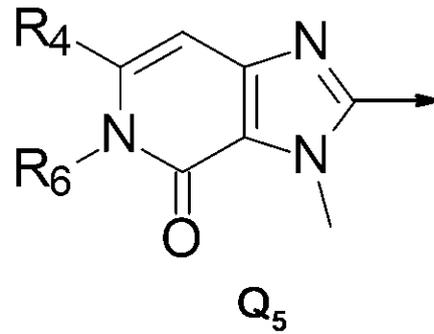
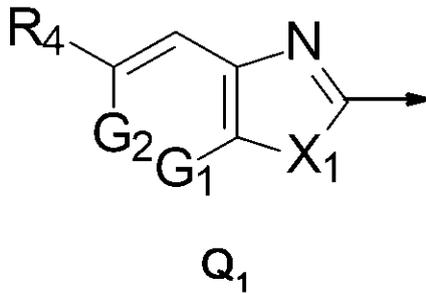
R<sub>2</sub>は、水素であり；

R<sub>3</sub>は、水素、シアノ又はCO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>であり；

nは、1であり；

Qは、Q<sub>1</sub>及びQ<sub>5</sub>

【化111】



（式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；

X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；

R<sub>6</sub>は、エチル、メトキシ又はシクロプロピルであり；及び

G<sub>1</sub>はNであり、且つG<sub>2</sub>はCHであるか、又は、G<sub>1</sub>はCHであり、且つG<sub>2</sub>はNであるか、又は、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>はNであるか、又は、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>はCHである）

から選択される基である、前記〔1〕に記載の化合物。

〔13〕Aは、CH又はNであり；

R<sub>1</sub>は、エチルであり；

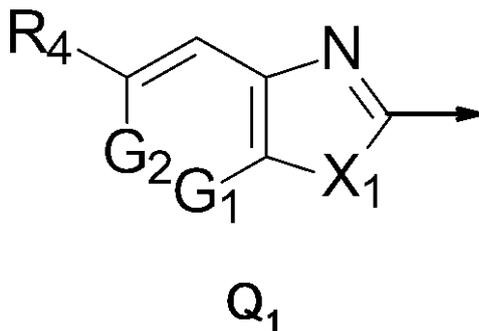
R<sub>2</sub>は、水素であり；

R<sub>3</sub>は、水素又はシアノであり；

nは、1であり；

Qは、基Q<sub>1</sub>

【化112】



（式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>2</sub>は、トリフルオロメチルであり；

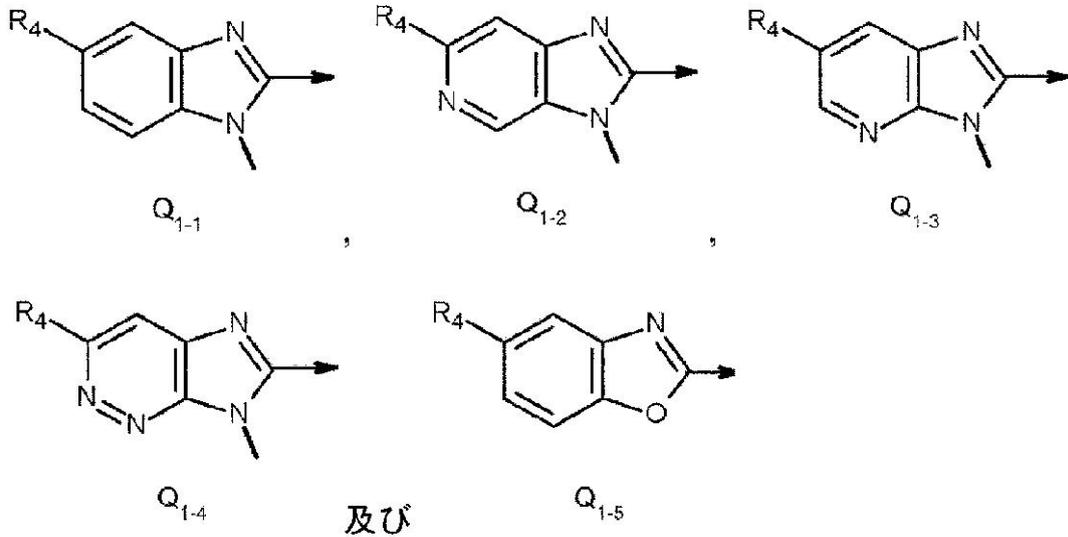
X<sub>1</sub>は、NCH<sub>3</sub>であり；及び

G<sub>1</sub>はNであり、且つG<sub>2</sub>はCHであるか、G<sub>1</sub>はCHであり、且つG<sub>2</sub>はNであるか、又は、G<sub>1</sub>及びG<sub>2</sub>はNである）

である、前記〔1〕に記載の化合物。

〔14〕Qは、Q<sub>1-1</sub>、Q<sub>1-2</sub>、Q<sub>1-3</sub>、Q<sub>1-4</sub>及びQ<sub>1-5</sub>

【化113】



10

20

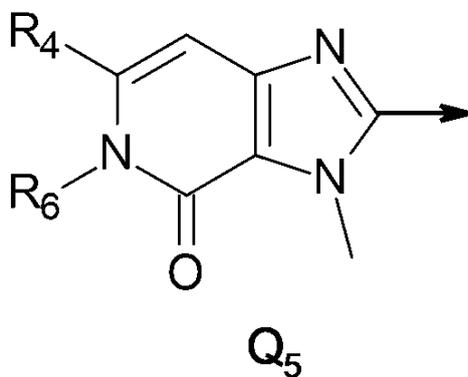
（式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；及び

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルである）

から選択される基であり；好ましくは、Qは、Q<sub>1-2</sub>、Q<sub>1-3</sub>、Q<sub>1-4</sub>及びQ<sub>1-5</sub>から選択される基である、前記〔1〕～〔5〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔15〕Qは、Q<sub>5</sub>

【化114】



30

40

（式中、矢印は、前記基Aを組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；及び

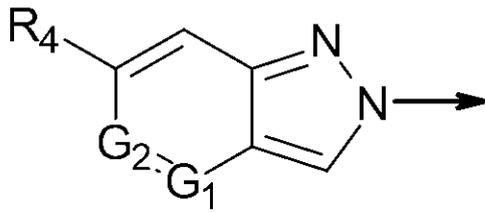
R<sub>6</sub>は、OCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はシクロプロピルである）

から選択される基である、前記〔1〕～〔5〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔16〕Qは、Q<sub>4</sub>

50

【化 1 1 5】

Q<sub>4</sub>

(式中、矢印は、前記基 A を組み込んだ環に対する結合点を示し；

R<sub>4</sub>は、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；及び

G<sub>1</sub>は N であり、且つ G<sub>2</sub>は CH であるか、G<sub>1</sub>は CH であり、且つ G<sub>2</sub>は N であるか、G<sub>1</sub>及び G<sub>2</sub>は CH であるか、又は、G<sub>1</sub>及び G<sub>2</sub>は N であり；好ましくは、G<sub>1</sub>は CH であり、且つ G<sub>2</sub>は N である)

から選択される基である、前記〔1〕～〔5〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔17〕1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4, 5 - c ]ピリダジン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボキサミド (化合物 P 1) ；

1 - [ 3 - (エチルスルホンイミドイル) - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4, 5 - b ]ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] シクロプロパンカルボキサミド (化合物 P 2) ；

[ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルホニル)イミダゾ[ 4, 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 3) ；

[ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[ 4, 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 4) ；

[ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4, 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 5) ；

1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4, 5 - b ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 6) ；

[ 5 - シクロプロピル - 2 - [ 6 - (トリフルオロメチル)ピラゾロ[ 4, 3 - c ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン (化合物 P 7) ；

1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 5 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4, 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 8) ；

1 - [ 3 - (エチルスルホンイミドイル) - 4 - [ 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[ 4, 5 - c ]ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 9) ；

1 - [ 5 - (エチルスルホンイミドイル) - 6 - [ 7 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[ 4, 5 - c ]ピリダジン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパン

10

20

30

40

50

カルボニトリル（化合物 P 1 0）；

〔 5 - シクロプロピル - 2 - [ 7 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリダジン - 6 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン（化合物 P 1 1）；

〔 5 - シクロプロピル - 2 - [ 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン（化合物 P 1 2）；

1 - [ 3 - ( エチルスルホンイミドイル ) - 4 - [ 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] シクロプロパンカルボニトリル（化合物 P 1 3）；

1 - [ 6 - [ 5 - エチル - 3 - メチル - 4 - オキソ - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 5 - ( エチルスルホンイミドイル ) - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル（化合物 P 1 4）；

1 - [ 3 - ( エチルスルホンイミドイル ) - 4 - [ 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] フェニル ] シクロプロパンカルボニトリル（化合物 P 1 5）；

〔 5 - シクロプロピル - 2 - [ 7 - ( トリフルオロメチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] ピリダジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン（化合物 P 1 6）；

1 - [ 5 - ( エチルスルホンイミドイル ) - 6 - [ 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] シクロプロパンカルボニトリル（化合物 P 1 7）；

〔 5 - シクロプロピル - 2 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン（化合物 P 1 8）；及び

〔 5 - シクロプロピル - 2 - [ 5 - ( トリフルオロメチルスルホニル ) - 1 , 3 - ベンゾキサゾール - 2 - イル ] - 3 - ピリジル ] - エチル - イミノ - オキソ - <sup>6</sup> - スルファン（化合物 P 1 9）

からなる群から選択される、前記〔 1 〕に記載の式（ I ）の化合物。

〔 1 8 〕殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、前記〔 1 〕～〔 1 7 〕のいずれか一項に記載の式（ I ）の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを含み、任意で助剤又は希釈剤を含む、組成物。

〔 1 9 〕昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、前記〔 1 〕～〔 1 7 〕のいずれか一項に記載の式（ I ）の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N - オキシドを適用するか、又は、前記〔 1 8 〕に記載の組成物を適用する工程を含む方法。

〔 2 0 〕昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられる場所を、前記〔 1 7 〕に記載の組成物で処理する工程を含む方法。

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

## (51)国際特許分類

A 0 1 P 7/02 (2006.01)  
 A 0 1 N 43/90 (2006.01)  
 A 0 1 N 47/02 (2006.01)  
 A 0 1 N 53/12 (2006.01)  
 A 0 1 N 53/14 (2006.01)  
 C 0 7 D 413/04 (2006.01)

## F I

A 0 1 P 9/00  
 A 0 1 P 7/04  
 A 0 1 P 7/02  
 A 0 1 N 43/90 1 0 4  
 A 0 1 N 47/02  
 A 0 1 N 53/12  
 A 0 1 N 53/14  
 A 0 1 N 43/90 1 0 5  
 C 0 7 D 471/04 1 0 7 K  
 C 0 7 D 471/04 1 0 7 Z  
 C 0 7 D 413/04

## (33)優先権主張国・地域又は機関

欧州特許庁(EP)

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100196405

弁理士 小松 邦光

(72)発明者 エドマンズ アンドリュウ

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

(72)発明者 ミューレバツハ ミシェル

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

(72)発明者 レンドラー セバスチャン

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

(72)発明者 ブッフホルツ アンケ

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

(72)発明者 エメリー ダニエル

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

(72)発明者 シケルヴァル ヴィカス

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム シンジェンタ バイオサイエンシーズ プライベ  
 ート リミテッド サンタ モニカ ワークス内

(72)発明者 ラワル ギリッシュ

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム シンジェンタ バイオサイエンシーズ プライベ  
 ート リミテッド サンタ モニカ ワークス内

(72)発明者 セン インディラ

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム シンジェンタ バイオサイエンシーズ プライベ  
 ート リミテッド サンタ モニカ ワークス内

審査官 土橋 敬介

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

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

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

国際公開第 2 0 1 6 / 1 2 1 9 9 7 ( W O , A 1 )

(58)調査した分野 (Int.Cl., D B 名)

C 0 7 D

A 0 1 N

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