

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2010-516724

(P2010-516724A)

(43) 公表日 平成22年5月20日 (2010.5.20)

| (51) Int.Cl. | F I | テーマコード (参考) |
|------------------------------|----------------|-------------|
| CO7D 275/04 (2006.01) | CO7D 275/04 | 4CO33 |
| AO1N 43/80 (2006.01) | AO1N 43/80 102 | 4CO63 |
| AO1N 25/00 (2006.01) | AO1N 25/00 101 | 4HO11 |
| CO7D 275/06 (2006.01) | AO1N 43/80 103 | |
| CO7D 417/12 (2006.01) | CO7D 275/06 | |

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 131 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2009-546711 (P2009-546711)
 (86) (22) 出願日 平成20年1月14日 (2008.1.14)
 (85) 翻訳文提出日 平成21年9月10日 (2009.9.10)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2008/050337
 (87) 国際公開番号 W02008/090048
 (87) 国際公開日 平成20年7月31日 (2008.7.31)
 (31) 優先権主張番号 60/886761
 (32) 優先日 平成19年1月26日 (2007.1.26)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

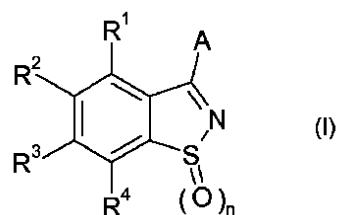
(71) 出願人 508020155
 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ
 BASF SE
 ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
 D-67056 Ludwigshafen, Germany
 (74) 代理人 100091096
 弁理士 平木 祐輔
 (74) 代理人 100096183
 弁理士 石井 貞次
 (74) 代理人 100118773
 弁理士 藤田 節

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 動物害虫を駆除するための3-アミノ-1, 2-ベンゾイソチアゾール化合物 I I

(57) 【要約】

本発明は、式(1)(式中、n、R¹、R²、R³、R⁴およびAは明細書で定義した通りである)で表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物を提供する。さらに本発明は、ある量の少なくとも1種の式(1)で表される殺虫化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩を含む農薬組成物；動物害虫を駆除するための式(1)で表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩の使用；動物害虫を駆除する方法であって、動物害虫、その生息地、繁殖場所、食糧、植物、種子、土壌、区域、材料、または動物害虫が成長している、もしくは成長し得る環境、あるいは動物による攻撃または加害から保護すべき材料、植物、種子、土壌、表面または場所を、殺虫剤として有効な量の少なくとも1種の式(1)で表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含む方法；動物害虫による攻撃または加害から作物を保護する方法であって、作物を、殺虫剤として有効な量の少なくとも1種の式(1)で表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させるこ

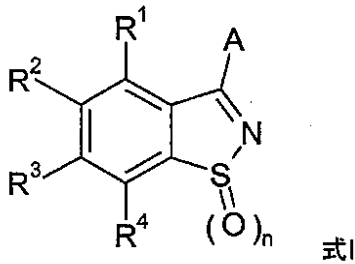


【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1:

【化1】



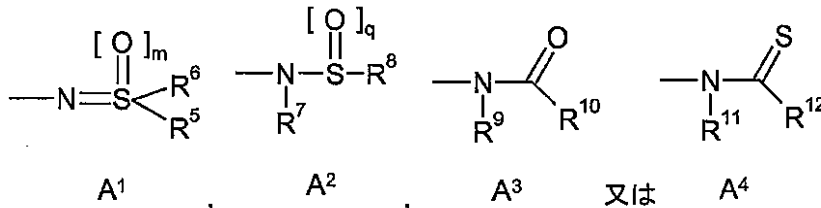
10

[式中、

nは、0、1または2であり；

Aは、

【化2】



20

であり、

ここで、

mは、0または1であり；

qは、0、1または2であり；

R⁵、R⁶、R⁸は、互いに独立して、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニルおよびナフチル、ならびに、O、S、SO、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個の非置換または置換ヘテロ原子を環員として含有する5員もしくは6員の複素環式芳香族基または3員~7員の飽和もしくは部分不飽和の複素環基から選択され、この場合、複素環基は、1、2または3個のCO基を環員としてさらに含有していてもよく、また、脂肪族基および環状基の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

30

40

R⁷またはR⁹は、水素、C(=O)-R^c、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニルおよびナフチル、ならびに、O、S、SO、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個の非置換または置換ヘテロ原子を環員として含有する5員もしくは6員の複素環式芳香族基または3員~7員の飽和もしくは部分不飽和の複素環基から選択され、この場合、複素環基は、1、2または3個のCO基を環員としてさらに含有していてもよく、また、脂肪族基は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、

50

C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく、またこの場合、環状基の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

あるいは、

R⁵およびR⁶は、これらが結合している硫黄原子と一緒にあって、場合によりC₁-C₆-アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和の4員～10員複素環を形成しており、この場合、前記環は、前記硫黄原子以外に、N、O、S、CO、SO、SO₂およびN-R^eからなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有していてもよく；

あるいは、

R⁷およびR⁸は、これらが結合している硫黄原子および窒素原子と一緒にあって、場合によりC₁-C₆-アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和の4員～10員複素環を形成しており、この場合、前記環は、前記硫黄原子および窒素原子以外に、N、O、S、CO、SO、SO₂およびN-R^eからなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有していてもよく；

R¹⁰は、R⁹に従属的に選択され、

ここで、

R⁹が水素およびCOR^c以外の置換基から選択される場合には、R¹⁰は下記のR¹²に関して定義した置換基から選択され；

あるいは、

R⁹が水素またはCOR^cから選択される場合には、R¹⁰は、O、CO、S、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和または芳香族の5員～7員複素環基から選択され、この場合、前記複素環の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、ならびにO、CO、S、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している5員もしくは6員の芳香族複素環および芳香族の8員、9員もしくは10員の縮合二環式複素環系からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、それぞれの芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルキニル、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₂-C₁₀-アルコキシカルボニル、C₁-C₁₀-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₁₀-ジアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)

アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_3-C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3-C_{10} -シクロアルキルアミノおよび C_2-C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^{11} は、水素、 $C(=O)-R^c$ 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_1-C_{10} -アルコキシおよび C_3-C_{10} -シクロアルキルから選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、NO₂、NH₂、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^{12} は、OR^d、NR^aR^b、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ナフチル、および、O、CO、S、SO₂、N、NHまたはN- C_1-C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和または芳香族の5員~7員複素環基から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子および複素環の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、NO₂、NH₂、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ならびにO、CO、S、SO₂、N、NHまたはN- C_1-C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している5員もしくは6員の芳香族複素環および芳香族の8員、9員もしくは10員の縮合二環式複素環系からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、それぞれの芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_2-C_{10} -ハロアルケニル、 C_2-C_{10} -ハロアルキニル、CN、NO₂、NH₂、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、 C_1-C_{10} -アルキルアミノカルボニル、 C_1-C_{10} -ジアルキルアミノカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_3-C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3-C_{10} -シクロアルキルアミノおよび C_1-C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^1 は、CN、NO₂、NH₂、アジド、ハロゲン、スルホニルアミノ、スルフェニルアミノ、スルフィニルアミノ、 $C(=O)R^c$ 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルフェニルおよび C_1-C_{10} -アルキルスルホニルから選択され、この場合、 C_3-C_{10} -シクロアルキルおよび記載の脂肪族基の炭素原子は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、(C_1-C_{10} -アルコキシ)カルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_8 -シクロアルキルおよびフェニルからなる群から選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-

10

20

30

40

50

C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシおよびC₁-C₁₀-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R²、R³およびR⁴は、互いに独立して、水素、ハロゲン、アジド、COR^c、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、スルホニル、スルホニルアミノ、スルフェニルアミノおよびスルファニルアミノから選択され；

またここで、

R^aおよびR^bは、互いに独立して、水素、C₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、アリール、および芳香族の飽和、部分不飽和または完全不飽和複素環からなる群から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、ハロゲンもしくはC₁-C₁₀-アルキルで部分的または完全に置換されていてもよく；

R^cは、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルアミノ、ジ(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、アリールおよび飽和、部分不飽和または芳香族の3員~7員複素環(これは、O、S、SO、SO₂、N、NHおよびN-C₁-C₆-アルキルからなる群から選択される1、2もしくは3個の非置換もしくは置換ヘテロ原子を環員として含有していてもよい)からなる群から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、または部分的もしくは完全にハロゲンもしくはC₁-C₁₀-アルキルで置換されていてもよく；

R^dは、水素、C₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、アリールおよび芳香族の飽和、部分的不飽和または完全不飽和複素環からなる群から選択され；

R^eは、水素またはC₁-C₁₀-アルキルである]

で表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩。

【請求項2】

AがA³である、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項3】

nが2であり、AがA¹またはA²から選択される、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項4】

nが1であり、AがA³である、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項5】

nが0であり、AがA³である、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項6】

nが0であり、AがA⁴である、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項7】

R¹がハロゲン、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシおよびC₁-C₁₀-ハロアルコキシから選択される、請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項8】

R¹がハロゲン、C₁-C₁₀-アルコキシおよびC₁-C₁₀-ハロアルコキシから選択される、請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項9】

R¹がフルオロ、クロロ、ジフルオロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリフルオロメトキ

10

20

30

40

50

シまたはトリクロロメトキシから選択される、請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項10】

R^2 、 R^3 および R^4 が水素およびF、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択される、請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項11】

R^2 、 R^3 および R^4 が水素またはフルオロから互いに独立して選択される、請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項12】

R^2 、 R^3 および R^4 が水素である、請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

10

【請求項13】

Aが A^1 から選択される場合、

R^5 および R^6 が、これらが結合している硫黄原子と一緒に、場合により C_1 - C_6 -アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和または芳香族の5員、6員または7員複素環を形成しており、ここで、前記環は、前記硫黄原子以外に、O、CO、S、SO、 SO_2 、N、NHまたはN- C_1 - C_6 -アルキルからなる群から選択される1、2または3個の非置換または置換ヘテロ原子を含有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

20

【請求項14】

Aが A^2 から選択される場合、

R^7 および R^8 が、これらが結合している硫黄原子および窒素原子と一緒に、場合により C_1 - C_6 -アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和または芳香族の5員、6員または7員複素環を形成しており、ここで、前記環は、硫黄原子以外に、O、CO、S、SO、 SO_2 、N、NHまたはN- C_1 - C_6 -アルキルからなる群から選択される1、2または3個の非置換または置換ヘテロ原子を含有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

30

【請求項15】

Aが A^1 または A^2 である場合、

R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 が C_1 - C_{10} -アルキルまたは C_3 - C_{10} -シクロアルキルから互いに独立して選択され、これらはともに非置換であっても、部分的または完全にハロゲン化されていてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項16】

Aが A^1 または A^2 である場合、

R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 がメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルから互いに独立して選択され、これらは非置換であっても、部分的または完全にハロゲン化されていてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

40

【請求項17】

Aが A^3 である場合、

R^9 が C_1 - C_6 -アルキルであり、

R^{10} が OR^d 、 NR^aR^b 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキルおよびフェニルから選択され、この場合、前記の基は非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルコキシカルボニル、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3 - C_{10} -シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有し

50

ていてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシおよび C_1-C_{10} -ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項18】

Aが A^3 である場合、

R^9 が水素または C_1-C_6 -アルキルから選択され；

R^{10} がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ピペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフェン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、および5員または6員の芳香族複素環からなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_2-C_{10} -ハロアルケニル、 C_2-C_{10} -ハロアルキニル、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_2-C_{10} -アルコキシカルボニル、 C_2-C_{10} -アルキルアミノカルボニル、 C_3-C_{10} -ジアルキルアミノカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_3-C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3-C_{10} -シクロアルキルアミノ、 C_1-C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項19】

Aが A^3 である場合、

R^9 が水素または C_1-C_6 -アルキルから選択され；

R^{10} がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ピペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフェン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ピリジン、ピリミジン、チオフェン、イソオキサゾールおよびイソチアゾールからなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_2-C_{10} -ハロアルケニル、 C_2-C_{10} -ハロアルキニル、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニルおよび C_1-C_{10} -ハロアルキルチオからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 2 0】

R¹がハロゲン、C₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され、
R²、R³およびR⁴が水素、F、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択される、
請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 2 1】

R¹がハロゲン、C₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され、
R²、R³およびR⁴が水素である、
請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 2 2】

AがA¹またはA²である場合、
R¹がC₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され；
R²、R³およびR⁴が水素、F、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択され；
R⁵およびR⁶がC₁-C₆-アルキルから互いに独立して選択されるか、あるいは、唯一のヘテロ原子としての硫黄原子と一緒に5員または6員の飽和複素環を形成している、
請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

10

【請求項 2 3】

AがA³である場合、
R¹がC₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され；
R²、R³およびR⁴が水素、F、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択され；
R⁹がC₁-C₆-アルキルであり；
R¹⁰がC₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₁-C₁₀-アルコキシ
およびC₃-C₁₀-シクロアルキルから選択され、ここで、記載した全ての基の炭素原子は、
非置換であるか、部分的または完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、N
O₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-
C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-
アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁
0-シクロアルキル、フェニルまたは5員もしくは6員の芳香族複素環からなる群から互いに
独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、各環に関しては、非置換で
あるか、部分的または完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂
、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ
、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルキ
ニル、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニ
ル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₂-C₁₀-アルコキシカルボニル、C₁-C₁₀-アルキルアミノ
カルボニル、C₁-C₁₀-ジアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C
10-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₃-C₁₀-シ
クロアルキルアミノ、C₁-C₁₀-アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択さ
れる1個または複数の置換基を有していてもよい、
請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

20

30

【請求項 2 4】

AがA³であり、nが0である場合、
R¹がC₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され；
R²、R³およびR⁴が水素であり；
R⁹がC₁-C₆-アルキルであり；
R¹⁰がC₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキルまたはフェニルから選択され、ここで、
これらの基の炭素原子または炭素環は非置換であるか、部分的または完全にハロゲン化さ
れていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル
、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル
、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルキニル、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アル
キルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオからなる群か
ら互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

40

50

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項25】

AがA³であり、nが0である場合、

R¹がC₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され；

R²、R³およびR⁴が水素であり；

R⁹が水素またはC₁-C₆-アルキルから選択され；

R¹⁰がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ピペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフェン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、および5員または6員の芳香族複素環からなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルキニル、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₂-C₁₀-アルコキシカルボニル、C₂-C₁₀-アルキルアミノカルボニル、C₃-C₁₀-ジアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルアミノ、C₂-C₁₀-アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項26】

請求項1~25のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、少なくとも1種の不活性液体担体および/または固体担体とを含む組成物。

【請求項27】

殺虫剤として有効な量の請求項1~25のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは農業上有用な塩と、少なくとも1種の不活性液体および/または固体の農業上許容可能な担体とを含み、所望により少なくとも1種の界面活性剤を含む、農薬組成物。

【請求項28】

昆虫、蛛形類または線虫を駆除または防除する方法であって、昆虫、蛛形類もしくは線虫またはそれらの食糧、生息地または繁殖場所を、殺虫剤として有効な量の請求項1~25のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、あるいは式Iで表される少なくとも1種のかかる化合物を含む組成物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項29】

昆虫、蛛形類または線虫による攻撃または加害から生育中の植物を保護する方法であって、植物または植物が生育している土壌もしくは水を、殺虫剤として有効な量の請求項1~25のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、あるいは式Iで表される少なくとも1種のかかる化合物を含む組成物と接触させることを含む、前記方法。

10

20

30

40

50

【請求項30】

動物害虫が同翅目または総翅目から選択される、請求項28または29に記載の方法。

【請求項31】

土壌昆虫から種子を、ならびに土壌昆虫および食葉性昆虫から実生の根およびシュートを保護する方法であって、播種前および/または発芽前処理後の種子を、請求項1~25のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、あるいは式Iで表される少なくとも1種のかかる化合物を含む組成物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項32】

式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物を種子100kg当たり100mg~10kgの量で施用する、請求項31に記載の方法。 10

【請求項33】

生じる植物の根およびシュートが保護される、請求項31に記載の方法。

【請求項34】

生じる植物のシュートがアブラムシから保護される、請求項31に記載の方法。

【請求項35】

請求項1~25のいずれか1項に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物または式Iの農業上有用な塩を種子100kg当たり0.1g~10kgの量で含む種子。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

20

【0001】

本発明は、3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物およびその異性体イミノ誘導体、ならびにそのエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩、さらにかかる化合物を含む組成物に関する。また本発明は、動物害虫類を駆除するための3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物、その塩、またはそれらを含む組成物の使用に関する。またさらに、本発明はかかる化合物の施用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

動物害虫類は、栽培中および収穫済みの作物に被害を与え、また、木造住宅および商業建築物を襲い、食糧や所有物に多大な経済的損失をもたらす。多くの殺虫剤(pesticidal agent)が知られているが、標的害虫が前記薬剤に対して耐性をつける能力を持つことから、引き続き、動物害虫類を駆除する新規薬剤が必要とされている。特に、昆虫およびダニ類(acaridae)などの動物害虫類は効果的に防除するのが困難である。

30

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

したがって、本発明の目的は、とりわけ、防除が困難な昆虫およびダニ類に対して良好な殺虫活性を有する化合物を提供することである。

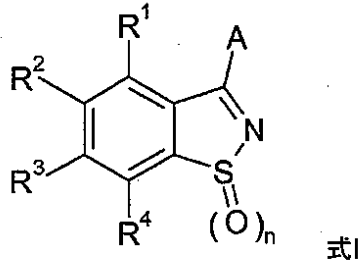
【課題を解決するための手段】

【0004】

40

これらの目的が、一般式I:

【化1】



10

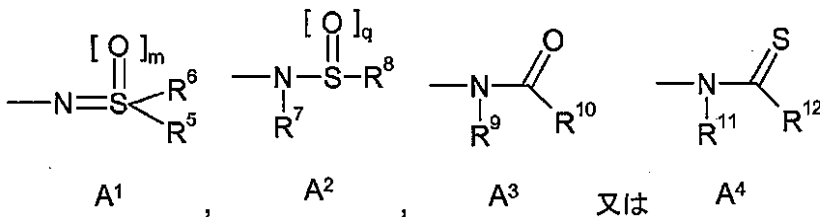
【0005】

[式中、

nは、0、1または2であり；

Aは、

【化2】



20

【0006】

であり、

ここで、

mは、0または1であり；

qは、0、1または2であり；

R⁵、R⁶、R⁸は、互いに独立して、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニルおよびナフチル(naphtyl)、ならびに、O、S、SO、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個の非置換または置換ヘテロ原子を環員として含有する5員もしくは6員の複素環式芳香族基または3員~7員の飽和もしくは部分不飽和の複素環基から選択され、この場合、複素環基は、1、2または3個のCO基を環員としてさらに含有していてもよく、また、脂肪族基および環状基の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

30

40

R⁷またはR⁹は、水素、C(=O)-R^c、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニルおよびナフチル、ならびに、O、S、SO、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個の非置換または置換ヘテロ原子を環員として含有する5員もしくは6員の複素環式芳香族基または3員~7員の飽和もしくは部分不飽和の複素環基から選択され、この場合、複素環基は、1、2または3個のCO基を環員としてさらに含有していてもよく、また、脂肪族基は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからな

50

る群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシおよび C_1-C_4 -ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく、またこの場合、環状基の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して

10

あるいは、

R^5 および R^6 は、これらが結合している硫黄原子と一緒にあって、場合により C_1-C_6 -アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和の4員~10員複素環を形成しており、この場合、前記環は、前記硫黄原子以外に、N、O、S、CO、SO、 SO_2 およびN- R^e からなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有していてもよく；

20

あるいは、

R^7 および R^8 は、これらが結合している硫黄原子および窒素原子と一緒にあって、場合により C_1-C_6 -アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和の4員~10員複素環を形成しており、この場合、前記環は、前記硫黄原子および窒素原子以外に、N、O、S、CO、SO、 SO_2 およびN- R^e からなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有していてもよく；

R^{10} は、 R^9 に従属的に選択され、

ここで、

R^9 が水素およびCOR^c以外の置換基から選択される場合には、 R^{10} は下記の R^{12} に関して定義した置換基から選択され；

30

あるいは、

R^9 が水素またはCOR^cから選択される場合には、 R^{10} は、O、CO、S、 SO_2 、N、NHまたはN- C_1-C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和または芳香族の5員~7員複素環基から選択され、この場合、前記複素環の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ならびにO、CO、S、 SO_2 、N、NHまたはN- C_1-C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している5員もしくは6員の芳香族複素環および芳香族の8員、9員もしくは10員の縮合二環式複素環系からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、それぞれの芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_2-C_{10} -ハロアルケニル、 C_2-C_{10} -ハロアルキニル、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_2-C_{10} -アルコキシカルボニル、 C_1-C_{10} -アルキルアミノカルボニル、 C_1-C_{10} -ジアルキルアミノカルボニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_3-C_{10} -ハロシクロアル

40

50

キル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキルアミノおよび C_2 - C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^{11} は、水素、 $C(=O)-R^c$ 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_1 - C_{10} -アルコキシおよび C_3 - C_{10} -シクロアルキルから選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、 NO_2 、 NH_2 、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルコキシカルボニル、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3 - C_{10} -シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシおよび C_1 - C_4 -ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^{12} は、 OR^d 、 NR^aR^b 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ナフチル(naphtly)、および、O、CO、S、 SO_2 、N、NHまたは $N-C_1$ - C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和または芳香族の5員~7員複素環基から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子および複素環の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、 NO_2 、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルコキシカルボニル、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ならびにO、CO、S、 SO_2 、N、NHまたは $N-C_1$ - C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している5員もしくは6員の芳香族複素環および芳香族の8員、9員もしくは10員の縮合二環式複素環系からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、それぞれの芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_2 - C_{10} -ハロアルケニル、 C_2 - C_{10} -ハロアルキニル、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルコキシカルボニル、 C_1 - C_{10} -アルキルアミノカルボニル、 C_1 - C_{10} -ジアルキルアミノカルボニル、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、 C_3 - C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキルアミノおよび C_1 - C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^1 は、CN、 NO_2 、 NH_2 、アジド、ハロゲン、スルホニルアミノ、スルフェニルアミノ、スルフィニルアミノ、 $C(=O)R^c$ 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフェニルおよび C_1 - C_{10} -アルキルスルホニルから選択され、この場合、 C_3 - C_{10} -シクロアルキルおよび記載の脂肪族基の炭素原子は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、(C_1 - C_{10} -アルコキシ)カルボニル、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3 - C_8 -シクロアルキルおよびフェニルからなる群から選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシおよび C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ

10

20

30

40

50

からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^2 、 R^3 および R^4 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、アジド、COR^c、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、スルホニル、スルホニルアミノ、スルフェニルアミノおよびスルファニルアミノから選択され；

またここで、

R^a および R^b は、互いに独立して、水素、C₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、アリール、および芳香族の飽和、部分不飽和または完全不飽和複素環からなる群から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、ハロゲンもしくはC₁-C₁₀-アルキルで部分的または完全に置換されていてもよく；

R^c は、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルアミノ、ジ(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、アリールおよび飽和、部分不飽和または芳香族の3員~7員複素環(これは、O、S、SO、SO₂、N、NHおよびN-C₁-C₆-アルキルからなる群から選択される1、2もしくは3個の非置換もしくは置換ヘテロ原子を環員として含有していてもよい)からなる群から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、または部分的もしくは完全にハロゲンもしくはC₁-C₁₀-アルキルで置換されていてもよく；

R^d は、水素、C₁-C₁₀-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、アリールおよび芳香族の飽和、部分的な不飽和または完全不飽和複素環からなる群から選択され；

R^e は、水素またはC₁-C₁₀-アルキルである]

で表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール誘導体またはそのエナンチオマー、ジアステレオマー(distereomer)もしくは塩により解決されることを見出した。

【0007】

置換のパターンに応じて、式Iで表される化合物は1個または複数のキラル中心を有するが、その場合、それらはエナンチオマーまたはジアステレオマーの混合物として存在する。本発明は、これらの混合物を含有する組成物を対象とするだけでなく、純粋なエナンチオマーまたはジアステレオマーを含有する組成物も対象とする。

【0008】

式Iに類似したいくつかの化合物が、特に、DE-A 1915387、WO 03/87072、JP-A 06220030、DE-A 1670920およびDE-A 1545842に記載されている。WO2006/091858では、HCV感染の治療または予防に有用なベンゾイソチアゾール類を確認することができる。しかし、式Iで表される化合物の殺虫活性、殺ダニ活性または殺線虫活性については未だ開示されていない。

【0009】

アミノ-およびアミノ-アシル化1,2-ベンゾイソチアゾール化合物は、殺虫活性に関して、DrabekによってEP-A 207891、EP-A 191734、DE-A 3544436、EP-A 138762、EP-A 133418およびEP-A 110829に開示されている。あるいは、3-アミノベンゾイソチアゾール-1,1-ジオキシドが同様の使用に関してEP-A 86748に開示されている。JP-A 01319467には、殺虫を目的とした有効成分としてのN-アシル化アミノ-ベンゾイソチアゾールおよびその1,2-ジオキシド誘導体の製法が記載されている。EP-A 0033984には、一置換3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール-1,1-ジオキシド誘導体をベースとしたスルホニル化合物および殺アブラムシ組成物が記載されている。後者のEP-A 33984には、殺アブラムシ活性を有する2-シアノベンゼンスルホンアミドが開示されている。しかし、それらの活性は満足のいくものではない。またEP-A 33984に類似の化合物がWO 2005/035486、未公開国際出願PCT/EP2006/068469、および未公開米国出願60/787809に記載されている。

【0010】

式Iで表される化合物およびその農業上許容可能な塩は、動物害虫、すなわち有害な節

足動物および線虫に対して、とりわけ防除が困難な昆虫およびダニ類に対して高い活性を持つ。

【0011】

したがって、本発明は、一般式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物およびその農業上有用な塩に関する。

【0012】

さらに、本発明は、

- ・ ある量の少なくとも1種の式Iで表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩を含む農薬組成物；

- ・ 動物害虫を駆除するための式Iで表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩の使用；

- ・ 動物害虫を駆除する方法であって、動物害虫、その生息地、繁殖場所、食糧、植物、種子、土壌、区域、材料、または動物害虫が成長している、もしくは成長し得る環境、あるいは動物による攻撃(attack)または加害(infestation)から保護すべき材料、植物、種子、土壌、表面または場所を、殺虫剤として有効な量の少なくとも1種の式Iで表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含む方法；

- ・ 動物害虫による攻撃または加害から作物を保護する方法であって、作物を、殺虫剤として有効な量の少なくとも1種の式Iで表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含む方法；

- ・ 土壌昆虫(soil insects)から種子を、ならびに土壌昆虫および食葉性昆虫(foliar insects)から実生の根およびシュートを保護する方法であって、播種前および/または発芽前処理後(after pregermination)の種子を、少なくとも1種の式Iで表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含む方法；

- ・ 式Iで表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩を含む種子に関する。

【発明を実施するための形態】

【0013】

式Iで表される化合物の塩は、好ましくは農業上許容可能な塩である。これらは、慣用の方法で、例えば、式Iで表される化合物が塩基性官能基を有する場合においては、化合物をアニオンの酸と反応させることによって、あるいは、式Iで表される酸性化合物を好適な塩基と反応させることによって形成させることができる。

【0014】

好適な農業上有用な塩は、特に、カチオンの塩または酸の酸付加塩であるが、そのカチオンおよびアニオンは、それぞれ、本発明による化合物の作用に対していかなる悪影響も及ぼすものではない。好適なカチオンは、特にアルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウムおよびカリウムのイオン、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム、マグネシウムおよびバリウムのイオン、ならびに遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛および鉄のイオン、さらにまたアンモニウム(NH₄⁺)および水素原子の1~4個がC₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ヒドロキシアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、フェニルまたはベンジルで置換されている置換アンモニウムである。置換アンモニウムイオンの例には、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチルアンモニウム、ビス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、およびベンジルトリエチルアンモニウムが含まれ、さらにはホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C₁-C₄-アルキル)スルホニウムイオン、およびスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C₁-C₄-アルキル)スルホキソニウムが含まれる。

【0015】

有用な酸付加塩のアニオンは、主として塩化物イオン、臭化物イオン、フッ化物イオン、硫酸水素イオン、硫酸イオン、二水素リン酸イオン、水素リン酸イオン、リン酸イオン、硝酸イオン、炭酸水素イオン、炭酸イオン、ヘキサフルオロケイ酸イオン、ヘキサフルオロリン酸イオン、安息香酸イオン、ならびに C_1 - C_4 -アルカン酸のアニオン、好ましくはギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオンおよび酪酸イオンである。これらは、式Iで表される化合物を対応するアニオンの酸、好ましくは塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸または硝酸と反応させることによって形成させることができる。

【0016】

可変部分の上記定義中に記載した有機部分(例えば、用語ハロゲン)は、各基の構成員の個々の記載に関する集合名である。接頭語 C_n - C_m は、いずれの場合にも、その基において可能性のある炭素原子数を示す。

10

【0017】

「ハロゲン」は、フルオロ(フッ素)、クロロ(塩素)、プロモ(臭素)およびヨード(ヨウ素)を意味する。

【0018】

「部分的もしくは完全にハロゲン化された」という用語は、所定の基の1個または複数個(例えば1、2、3、4もしくは5個)の水素原子またはすべての水素原子がハロゲン原子(特にフッ素または塩素)で置換されていることを意味する。

20

【0019】

本明細書において(ならびにまた C_n - C_m -アルキルアミノ、ジ- C_n - C_m -アルキルアミノ、 C_n - C_m -アルキルアミノカルボニル、ジ-(C_n - C_m -アルキルアミノ)カルボニル、 C_n - C_m -アルキルチオ、 C_n - C_m -アルキルスルフィニルおよび C_n - C_m -アルキルスルホニルにおいて)用いられている「 C_n - C_m -アルキル」という用語は、 $n \sim m$ 個、例えば1~10個の炭素原子、好ましくは1~6個の炭素原子を有する分岐状または非分岐状の飽和炭化水素基を意味し、例えば、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、ヘプチル、オクチル、2-エチルヘキシル、ノニルおよびデシル、ならびにその異性体である。 C_1 - C_4 -アルキルは、例えば、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、または1,1-ジメチルエチルを意味する。

30

【0020】

本明細書において(ならびにまた C_n - C_m -ハロアルキルスルフィニルおよび C_n - C_m -ハロアルキルスルホニルにおいて)用いられている「 C_n - C_m -ハロアルキル」という用語は、(上記のような) $n \sim m$ 個の炭素原子、例えば1~10個、特に1~6個の炭素原子を有する直鎖状または分岐状のアルキル基であって、これらの基中の水素原子の一部または全部が上述のようなハロゲン原子で置換されていてもよいものをいい、例えば C_1 - C_4 -ハロアルキル、例としては、クロロメチル、プロモメチル、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、1-クロロエチル、1-プロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、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などである。 C_1 - C_{10} -ハロアルキルという用語には、具体的には C_1 - C_2 -フルオロアルキルが含まれており、これは1、2、3、4または5個の水素原子がフッ素原子で置換されているメチルまたはエチルと同義であって、例え

40

50

ば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチルおよびペンタフルオロメチルである。

【0021】

同様に「 C_n-C_m -アルコキシ」および「 C_n-C_m -アルキルチオ」(または C_n-C_m -アルキルスルフェニル)はそれぞれ、アルキル基中の任意の結合でそれぞれ酸素結合または硫黄結合を介して結合されている、(上述のような) $n \sim m$ 個の炭素原子、例えば1~10個、特に1~6個または1~4個の炭素原子を有する直鎖状または分岐状のアルキル基を意味する。例としては、 C_1-C_4 -アルコキシとして、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、*sec*-ブトキシ、イソブトキシおよび*tert*-ブトキシなどが挙げられ、さら

10

【0022】

したがって、用語「 C_n-C_m -ハロアルコキシ」および「 C_n-C_m -ハロアルキルチオ」(または C_n-C_m -ハロアルキルスルフェニル)はそれぞれ、アルキル基中の任意の結合でそれぞれ酸素結合または硫黄結合を介して結合されている、(上述のような) $n \sim m$ 個の炭素原子、例えば1~10個、特に1~6個または1~4個の炭素原子を有する直鎖状または分岐状のアルキル基であって、これらの基中の水素原子の一部または全部が上述のようなハロゲン原子で置換されていてもよいものをいい、例えば C_1-C_2 -ハロアルコキシ、例としては、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-プロモエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシおよびペンタフルオロエトキシが挙げられ、さらに C_1-C_2 -ハロアルキルチオ、例としては、クロロメチルチオ、プロモメチルチオ、ジクロロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、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、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-クロロエチルチオ、1-プロモエチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2,2-トリフルオ

20

30

【0023】

本明細書で用いられている用語「 C_2-C_m -アルケニル」は、2~ m 個、例えば2~10個または2~6個の炭素原子と、任意の位置に1個の二重結合を有する分岐状または非分岐状の不飽和炭化水素基を意味し、例えば、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチル-エテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニ

40

50

ル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-1-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-1-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル、および1-エチル-2-メチル-2-プロペニルなどである。

【0024】

本明細書で用いられている用語「 C_2 - C_m -アルキニル」は、2~m個、例えば2~10個または2~6個の炭素原子と、少なくとも1個の三重結合を有する分岐状または非分岐状の不飽和炭化水素基を意味し、例えばエチニル、プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニルなどがある。

10

【0025】

本明細書で用いられている用語「 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル」は、1~4個の炭素原子を有するアルキル(例えば、上述のような具体例のもの)であって、アルキル基の1個の水素原子が C_1 - C_4 -アルコキシ基で置換されているものを意味する。

【0026】

本明細書で用いられている用語「 C_1 - C_4 -アルキルチオ- C_1 - C_4 -アルキル」は、1~4個の炭素原子を有するアルキルであって、アルキル基の1個の水素原子が C_1 - C_4 -アルキルチオ基で置換されているものを意味する。

20

【0027】

本明細書で用いられている用語「 C_3 - C_m -シクロアルキル」は、単環式で3員~m員の飽和脂環式基を意味し、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルおよびシクロデシルである。

【0028】

本明細書で用いられている用語「アリール」は芳香族炭化水素基を意味し、例えばナフチルまたは特にフェニルである。

【0029】

本明細書で用いられている用語「アリール- C_1 - C_4 -アルキル」は、 C_1 - C_4 -アルキレン基を介して分子の残部に結合されている芳香族炭化水素基であって、例えばベンジル、1-フェニルエチルまたは2-フェニルエチルを含む。

30

【0030】

本明細書において(ならびにまた「ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル」において)用いられている用語「3~7もしくは5~7」「員のヘテロシクリル」または「員の複素環基」は、3~7環員または5~7環員を有している飽和、完全不飽和もしくは部分不飽和または芳香族の複素環基であって、1、2または3環員がO、NおよびSから選択されるヘテロ原子であるか、またはS=O、S(O)₂またはN-R(ここで、RはHまたはアルキルである)から選択されるヘテロ原子団であるものを意味する。非芳香族環の例としては、アゼチジニル(azetidyl)、ピロリジニル、ピラゾリニル、イミダゾリニル、ピロリニル、ピラゾリニル、イミダゾリニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、1,3-ジオキサソラニル、ジオキサソレニル、チオラニル、ジヒドロチエニル、オキサゾリジニル、イソオキサゾリジニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、チアゾリニル、イソチアゾリニル、チアゾリジニル、イソチアゾリジニル、オキサチオラニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピラニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、チオピラニル、ジヒドロチオピラニル、テトラヒドロチオピラニル、モルホリニル、チアジニルなどが挙げられる。芳香族環の例は、以下のパラグラフに挙げている。

40

【0031】

本明細書において(ならびにまた「ヘテロアリール- C_1 - C_4 -アルキル」において)用いら

50

れている用語「3~7もしくは5~7」「員のヘテロアリアル」または「員の複素環基」は、3~7環員または5~7環員を有している芳香族複素環基であって、1、2または3環員がO、NおよびSから選択されるヘテロ原子であるか、またはS=O、S(O)₂またはN-R(ここで、RはHまたはアルキルである)から選択されるヘテロ原子団であるものを意味する。単環式で3員~7員の芳香族複素環の例としては、トリアジニル、ピラジニル、ピリミジル、ピリダジニル、ピリジル、チエニル、フリル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、イソチアゾリルおよびイソオキサゾリルが挙げられる。

【0032】

本明細書で用いられている用語「ヘテロシクリル-C₁-C₄-アルキル」は、C₁-C₄-アルキレン基を介して分子の残部に結合されている、芳香族および非芳香族の飽和、完全不飽和または部分不飽和の複素環基を意味し、「ヘテロアリアル-C₁-C₄-アルキル」は、C₁-C₄-アルキレン基を介して分子の残部に結合されている芳香族基を意味する。

10

【0033】

好ましい例

式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物の本発明による使用を鑑みると、特に好ましいのは、置換基および可変部分が、それぞれの場合、それ自体で、または組み合わせで以下の意味をもつものである。

【0034】

好ましいのは、AがA³である、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

20

【0035】

好ましいのは、nが2であり、AがA¹またはA²から選択される、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0036】

好ましいのは、特に、nが1であり、AがA³である、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0037】

また好ましいのは、nが0であり、AがA³である、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

30

【0038】

好ましいのは、R¹がハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシおよびC₁-C₆-ハロアルコキシから選択される、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。特に好ましいのは、R¹がハロゲン、C₁-C₆-アルコキシおよびC₁-C₆-ハロアルコキシから選択される、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。最も好ましいのは、R¹がフルオロ、クロロ、ジフルオロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリフルオロメトキシまたはトリクロロメトキシから選択される、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0039】

好ましいのは、R²、R³およびR⁴が水素およびF、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択される、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。とりわけ好ましいのは、R²、R³およびR⁴が水素またはフルオロから互いに独立して選択される、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。最も好ましいのは、R²、R³およびR⁴が水素である、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

40

【0040】

好ましいのは、AがA¹から選択される場合、R⁵およびR⁶が、これらが結合している硫黄原子と一緒にあって、場合によりC₁-C₅-アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和または芳香族の5員、6員または7員複素環を形成しており、ここで、前記環は、硫黄原子以外に、O、

50

CO、S、SO、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルからなる群から選択される1、2または3個の非置換または置換ヘテロ原子を含有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0041】

好ましいのは、AがA²から選択される場合、R⁷およびR⁸が、これらが結合している硫黄原子および窒素原子と一緒に、場合によりC₁-C₅-アルキルおよびハロゲンから選択される1、2、3または4個の基で置換されていてもよい、飽和、部分不飽和または完全不飽和または芳香族の5員、6員または7員複素環を形成しており、ここで、前記環は、硫黄原子以外に、O、CO、S、SO、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルからなる群から選択される1、2または3個の非置換または置換ヘテロ原子を含有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

10

【0042】

好ましいのは、AがA¹またはA²であり、R⁵およびR⁶またはR⁷およびR⁸がそれぞれ、C₁-C₆-アルキルまたはC₃-C₁₀-シクロアルキルから互いに独立して選択され、これらはともに非置換であっても、部分的または完全にハロゲン化されていてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0043】

最も好ましいのは、AがA¹またはA²であり、R⁵およびR⁶またはR⁷およびR⁸がそれぞれ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルから相互に独立して選択され、これらは非置換であっても、部分的または完全にハロゲン化されていてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

20

【0044】

好ましいのは、AがA³であり、R⁹がC₁-C₆-アルキルであり、R¹⁰がC₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルから選択され、この場合、前記の基は非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

30

【0045】

また好ましくは、AがA³であり、R⁹が水素またはC₁-C₆-アルキルから選択され、R¹⁰がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール(imidazole)、トリアゾール、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ペペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフェン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、および5員または6員の芳香族複素環からなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₆-アルキルチオ

40

50

、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_2-C_6 -アルコシカルボニル、 C_2-C_6 -アルキルアミノカルボニル、 C_3-C_6 -ジアルキルアミノカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_3-C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3-C_{10} -シクロアルキルアミノ、 C_2-C_6 -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0046】

とりわけ好ましいのは、Aが A^3 であり、 R^9 が水素または C_1-C_6 -アルキルから選択され、 R^{10} がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール(imidazole)、トリアゾール、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ペペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフェン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルコシカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ピリジン、ピリミジン、チオフェン、イソオキサゾールおよびイソチアゾールからなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニルおよび C_1-C_6 -ハロアルキルチオからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

10

20

【0047】

好ましいのは、 R^1 がハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシから選択され、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素、F、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択される、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

30

【0048】

とりわけ好ましいのは、 R^1 がハロゲン、 C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシから選択され、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素である、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0049】

好ましいのは、Aが A^1 であり、 R^1 が C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシから選択され、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素、F、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択され、 R^5 および R^6 が C_1-C_4 -アルキルから互いに独立して選択されるか、あるいは、単独のヘテロ原子としての硫黄原子と一緒に5員または6員の飽和複素環を形成している、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

40

【0050】

好ましいのは、Aが A^3 であり、 R^1 が C_1-C_6 -アルコキシまたは C_1-C_6 -ハロアルコキシから選択され、 R^2 、 R^3 および R^4 が水素、F、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択され、 R^9 が C_1-C_6 -アルキルであり、 R^{10} が C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシおよび C_3-C_{10} -シクロアルキルから選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルコシカルボニル、(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1-C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、または5員もしくは6員の芳香族

50

複素環からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、各環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₂-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルキルアミノカルボニル、C₃-C₆-ジアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルアミノ、C₂-C₆-アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0051】

とりわけ好ましいのは、AがA³であり、nが0であり、R¹がC₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され、R²、R³およびR⁴が水素であり、R⁹がC₁-C₆-アルキルであり、R¹⁰がC₁-C₆-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルまたはフェニルから選択され、この場合、これらの基の炭素原子または炭素環は非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルチオからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0052】

最も好ましいのは、AがA³であり、nが0であり、R¹がC₁-C₆-アルコキシまたはC₁-C₆-ハロアルコキシから選択され、R²、R³およびR⁴が水素であり、R⁹が水素またはC₁-C₆-アルキルから選択され、R¹⁰がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール(imidazole)、トリアゾール、チオフエン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ペペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフエン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、および5員または6員の芳香族複素環からなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₂-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルキルアミノカルボニル、C₃-C₆-ジアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルアミノ、C₂-C₆-アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物である。

【0053】

式Iで表される好ましい化合物の例は、R¹、R²、R³およびR⁴が表A1~A154に個別に定義されており、かつR⁵およびR⁶、またはR⁹およびR¹⁰が表Aに個別に定義されているものである。

10

20

30

40

50

れる化合物；

表A151：R⁴およびR²の各々の基がFであり、R³がHであり、R¹がOCF₃であって、かつ、R⁵およびR⁶、またはR⁹およびR¹⁰が表Aの1つの行で定義されている通りである、式Iで表される化合物；

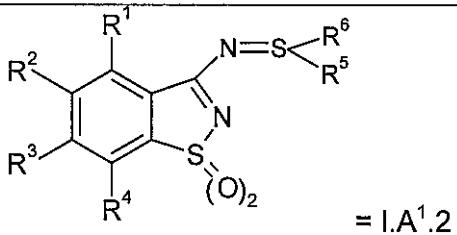
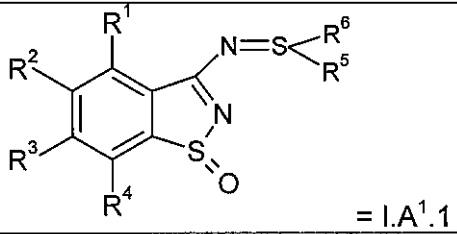
表A152：R⁴およびR²の各々の基がFであり、R³がHであり、R¹がOCHF₂であって、かつ、R⁵およびR⁶、またはR⁹およびR¹⁰が表Aの1つの行で定義されている通りである、式Iで表される化合物；

表A153：R⁴およびR²の各々の基がFであり、R³がHであり、R¹がOCCIF₂であって、かつ、R⁵およびR⁶、またはR⁹およびR¹⁰が表Aの1つの行で定義されている通りである、式Iで表される化合物；

表A154：R⁴およびR²の各々の基がFであり、R³がHであり、R¹がOCF₂CHCIFであって、かつ、R⁵およびR⁶、またはR⁹およびR¹⁰が表Aの1つの行で定義されている通りである、式Iで表される化合物。

【表 1】

表 A:

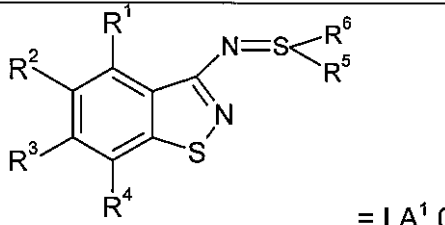
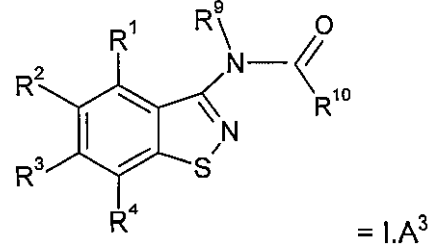
| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|--------|---|--|---|
| C.I-1 |  = I.A ^{1.2} | CH ₃ | CH ₃ |
| C.I-2 | I.A ^{1.2} | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-3 | I.A ^{1.2} | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-4 | I.A ^{1.2} | CH ₃ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-5 | I.A ^{1.2} | CH ₃ | F ₃ C |
| C.I-6 | I.A ^{1.2} | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-7 | I.A ^{1.2} | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-8 | I.A ^{1.2} | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-9 | I.A ^{1.2} | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-10 | I.A ^{1.2} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-11 | I.A ^{1.2} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-12 | I.A ^{1.2} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-13 | I.A ^{1.2} | (CH ₃) ₂ CH | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-14 | I.A ^{1.2} | (CH ₃) ₂ CH | F ₃ C |
| C.I-15 | I.A ^{1.2} | F ₃ C | F ₃ C |
| C.I-16 | I.A ^{1.2} | -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-17 | I.A ^{1.2} | -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-18 | I.A ^{1.2} | -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-19 |  = I.A ^{1.1} | CH ₃ | CH ₃ |
| C.I-20 | I.A ^{1.1} | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-21 | I.A ^{1.1} | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-22 | I.A ^{1.1} | CH ₃ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-23 | I.A ^{1.1} | CH ₃ | F ₃ C |
| C.I-24 | I.A ^{1.1} | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-25 | I.A ^{1.1} | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-26 | I.A ^{1.1} | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-27 | I.A ^{1.1} | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-28 | I.A ^{1.1} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|--------|---|--|---|
| C.I-29 | I.A ^{1.1} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-30 | I.A ^{1.1} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-31 | I.A ^{1.1} | (CH ₃) ₂ CH | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-32 | I.A ^{1.1} | (CH ₃) ₂ CH | F ₃ C |
| C.I-33 | I.A ^{1.1} | F ₃ C | F ₃ C |
| C.I-34 | I.A ^{1.1} | -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-35 | I.A ^{1.1} | -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-36 | I.A ^{1.1} | -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-37 |  = I.A ^{1.0} | CH ₃ | CH ₃ |
| C.I-38 | I.A ^{1.0} | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-39 | I.A ^{1.0} | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-40 | I.A ^{1.0} | CH ₃ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-41 | I.A ^{1.0} | CH ₃ | F ₃ C |
| C.I-42 | I.A ^{1.0} | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-43 | I.A ^{1.0} | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-44 | I.A ^{1.0} | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-45 | I.A ^{1.0} | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-46 | I.A ^{1.0} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-47 | I.A ^{1.0} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-48 | I.A ^{1.0} | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-49 | I.A ^{1.0} | (CH ₃) ₂ CH | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-50 | I.A ^{1.0} | (CH ₃) ₂ CH | F ₃ C |
| C.I-51 | I.A ^{1.0} | F ₃ C | F ₃ C |
| C.I-52 | I.A ^{1.0} | -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-53 | I.A ^{1.0} | -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-54 | I.A ^{1.0} | -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ - | |
| C.I-55 |  = I.A ^{3.0} | CH ₃ | H |
| C.I-56 | I.A ^{3.0} | CH ₃ | F ₃ C |
| C.I-57 | I.A ^{3.0} | CH ₃ | Cl ₃ C |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|--------|---------------------|--|--|
| C.I-58 | I.A ³ .0 | CH ₃ | Cl ₂ CH |
| C.I-59 | I.A ³ .0 | CH ₃ | ClCH ₂ |
| C.I-60 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ |
| C.I-61 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-62 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-63 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (CH ₃) ₃ C |
| C.I-64 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-65 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-66 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (CH ₃) ₃ CCH ₂ |
| C.I-67 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ O |
| C.I-68 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ O |
| C.I-69 | I.A ³ .0 | CH ₃ | F ₃ CCH ₂ O |
| C.I-70 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ NH |
| C.I-71 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ NH |
| C.I-72 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (CH ₃) ₂ N |
| C.I-73 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (CH ₃ CH ₂) ₂ N |
| C.I-74 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (CH ₃ CH ₂)CH ₃ N |
| C.I-75 | I.A ³ .0 | CH ₃ | C ₆ H ₅ NH |
| C.I-76 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (C ₆ H ₅)CH ₃ N |
| C.I-77 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH |
| C.I-78 | I.A ³ .0 | CH ₃ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N |
| C.I-79 | I.A ³ .0 | CH ₃ | シクロプロピル |
| C.I-80 | I.A ³ .0 | CH ₃ | シクロブチル |
| C.I-81 | I.A ³ .0 | CH ₃ | シクロペンチル |
| C.I-82 | I.A ³ .0 | CH ₃ | シクロヘキシル |
| C.I-83 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CNCH ₂ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-84 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ OCH ₂ |
| C.I-85 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ OCH ₂ |
| C.I-86 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ OCH ₂ CH ₂ |
| C.I-87 | I.A ³ .0 | CH ₃ | F ₃ C CH ₂ |
| C.I-88 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ OCOCH ₂ |
| C.I-89 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ SCH ₂ |
| C.I-90 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ SCH ₂ |
| C.I-91 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ SCH ₂ CH ₂ |
| C.I-92 | I.A ³ .0 | CH ₃ | C ₆ H ₅ CH ₂ |
| C.I-93 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₂ =CHCH ₂ |
| C.I-94 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₂ =CH |
| C.I-95 | I.A ³ .0 | CH ₃ | CH ₃ CH=CH |
| C.I-96 | I.A ³ .0 | CH ₃ | C ₆ H ₅ |
| C.I-97 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-98 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-99 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-100 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-101 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-102 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-103 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-104 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-105 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-106 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-107 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-108 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-109 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-F ₃ C-C ₆ H ₄ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-110 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-111 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-112 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-113 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-114 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-115 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-116 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-117 | I.A ³ .0 | CH ₃ | ピリジン-2-イル |
| C.I-118 | I.A ³ .0 | CH ₃ | ピリジン-3-イル |
| C.I-119 | I.A ³ .0 | CH ₃ | ピリジン-4-イル |
| C.I-120 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-メチル-ピリジン- 5-イル |
| C.I-121 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-メチル-ピリジン- 2-イル |
| C.I-122 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 3-イル |
| C.I-123 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 4-イル |
| C.I-124 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 5-イル |
| C.I-125 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-126 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-127 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチ ル-ピリジン-3-イル |
| C.I-128 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-メチルチオ-ピリ ジン-3-イル |
| C.I-129 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2,3-ジクロロ-ピリ ジン-5-イル |
| C.I-130 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2,5-ジクロロ-ピリ ジン-3-イル |
| C.I-131 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2,6-ジクロロ-ピリ ジン-3-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-132 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル |
| C.I-133 | I.A ³ .0 | CH ₃ | N-メチル-ピロール-2-イル |
| C.I-134 | I.A ³ .0 | CH ₃ | ピラジン-2-イル |
| C.I-135 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル |
| C.I-136 | I.A ³ .0 | CH ₃ | フラン-2-イル |
| C.I-137 | I.A ³ .0 | CH ₃ | フラン-3-イル |
| C.I-138 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2-テトラヒドロフラン |
| C.I-139 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-テトラヒドロフラン |
| C.I-140 | I.A ³ .0 | CH ₃ | チオフェン-2-イル |
| C.I-141 | I.A ³ .0 | CH ₃ | チオフェン-3-イル |
| C.I-142 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 1-メチル-3-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-143 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 1-メチル-5-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-144 | I.A ³ .0 | CH ₃ | イソキサゾール-5-イル |
| C.I-145 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-146 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-147 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3-メチル-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-148 | I.A ³ .0 | CH ₃ | 3,4-ジクロロ-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-149 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | H |
| C.I-150 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-151 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | Cl ₃ C |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-152 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | Cl ₂ CH |
| C.I-153 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | ClCH ₂ |
| C.I-154 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ |
| C.I-155 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-156 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-157 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₃ C |
| C.I-158 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-159 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-160 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₃ CCH ₂ |
| C.I-161 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ O |
| C.I-162 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ O |
| C.I-163 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ CCH ₂ O |
| C.I-164 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ NH |
| C.I-165 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ NH |
| C.I-166 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ N |
| C.I-167 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂) ₂ N |
| C.I-168 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂)CH ₃ N |
| C.I-169 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ NH |
| C.I-170 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (C ₆ H ₅)CH ₃ N |
| C.I-171 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH |
| C.I-172 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N |
| C.I-173 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | シクロプロピル |
| C.I-174 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | シクロブチル |
| C.I-175 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | シクロペンチル |
| C.I-176 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | シクロヘキシル |
| C.I-177 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CNCH ₂ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-178 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ |
| C.I-179 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ OCH ₂ |
| C.I-180 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ CH ₂ |
| C.I-181 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C CH ₂ |
| C.I-182 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCOCH ₂ |
| C.I-183 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ |
| C.I-184 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ SCH ₂ |
| C.I-185 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ CH ₂ |
| C.I-186 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ CH ₂ |
| C.I-187 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₂ =CHCH ₂ |
| C.I-188 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₂ =CH |
| C.I-189 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH=CH |
| C.I-190 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ |
| C.I-191 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-192 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-193 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-194 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-195 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-196 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-197 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-198 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-199 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-200 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-201 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-202 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-203 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-F ₃ C-C ₆ H ₄ |

10

20

30

40

50

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-204 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-205 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-206 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-207 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-208 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-209 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-210 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-211 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-2-イル |
| C.I-212 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-3-イル |
| C.I-213 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-4-イル |
| C.I-214 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-メチル-ピリジン- 5-イル |
| C.I-215 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチル-ピリジン- 2-イル |
| C.I-216 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 3-イル |
| C.I-217 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 4-イル |
| C.I-218 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 5-イル |
| C.I-219 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-220 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-221 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチ ル-ピリジン-3-イル |
| C.I-222 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチルチオ-ピリ ジン-3-イル |
| C.I-223 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2,3-ジクロロ-ピリ ジン-5-イル |
| C.I-224 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2,5-ジクロロ-ピリ ジン-3-イル |
| C.I-225 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2,6-ジクロロ-ピリ ジン-3-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|---|---|
| C.I-226 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル |
| C.I-227 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | N-メチピロール-2-イル |
| C.I-228 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | ピラジン-2-イル |
| C.I-229 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル |
| C.I-230 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | フラン-2-イル |
| C.I-231 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | フラン-3-イル |
| C.I-232 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2-テトラヒドロフランニル |
| C.I-233 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-テトラヒドロフランニル |
| C.I-234 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | チオフェン-2-イル |
| C.I-235 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | チオフェン-3-イル |
| C.I-236 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 1-メチル-3-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-237 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 1-メチル-5-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-238 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | イソオキサゾール-5-イル |
| C.I-239 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-240 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-241 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチル-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-242 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ | 3,4-ジクロロ-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-243 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | H |
| C.I-244 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-245 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | Cl ₃ C |

10

20

30

40

50

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|---|--|
| C.I-246 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | Cl ₂ CH |
| C.I-247 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | ClCH ₂ |
| C.I-248 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ |
| C.I-249 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-250 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-251 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃) ₃ C |
| C.I-252 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-253 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-254 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃) ₃ CCH ₂ |
| C.I-255 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ O |
| C.I-256 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ O |
| C.I-257 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | F ₃ CCH ₂ O |
| C.I-258 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ NH |
| C.I-259 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ NH |
| C.I-260 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃) ₂ N |
| C.I-261 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂) ₂ N |
| C.I-262 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂)CH ₃ N |
| C.I-263 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | C ₆ H ₅ NH |
| C.I-264 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (C ₆ H ₅)CH ₃ N |
| C.I-265 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH |
| C.I-266 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N |
| C.I-267 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | シクロプロピル |
| C.I-268 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | シクロブチル |
| C.I-269 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | シクロペンチル |
| C.I-270 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | シクロヘキシル |
| C.I-271 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CNCH ₂ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|---|---|
| C.I-272 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ |
| C.I-273 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ OCH ₂ |
| C.I-274 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ CH ₂ |
| C.I-275 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | F ₃ C CH ₂ |
| C.I-276 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ OCOCH ₂ |
| C.I-277 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ |
| C.I-278 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ SCH ₂ |
| C.I-279 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ CH ₂ |
| C.I-280 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | C ₆ H ₅ CH ₂ |
| C.I-281 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₂ =CHCH ₂ |
| C.I-282 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₂ =CH |
| C.I-283 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | CH ₃ CH=CH |
| C.I-284 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | C ₆ H ₅ |
| C.I-285 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-286 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-287 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-288 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-289 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-290 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-291 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-292 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-293 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-294 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-295 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-296 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-297 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-F ₃ C-C ₆ H ₄ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|---|--|
| C.I-298 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-299 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-300 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-301 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-302 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-303 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-304 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-305 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | ピリジン-2-イル |
| C.I-306 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | ピリジン-3-イル |
| C.I-307 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | ピリジン-4-イル |
| C.I-308 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-メチル-ピリジン- 5-イル |
| C.I-309 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-メチル-ピリジン- 2-イル |
| C.I-310 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 3-イル |
| C.I-311 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 4-イル |
| C.I-312 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 5-イル |
| C.I-313 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-314 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-315 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-トリフルオロメチ ル-ピリジン-3-イル |
| C.I-316 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-メチルチオ-ピリ ジン-3-イル |
| C.I-317 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2,3-ジクロロ-ピリ ジン-5-イル |
| C.I-318 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2,5-ジクロロ-ピリ ジン-3-イル |
| C.I-319 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2,6-ジクロロ-ピリ ジン-3-イル |

10

20

30

40

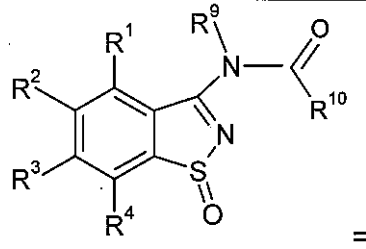
| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|---|---|
| C.I-320 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル |
| C.I-321 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | N-メチル-ピロール-2-イル |
| C.I-322 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | ピラジン-2-イル |
| C.I-323 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル |
| C.I-324 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | フラン-2-イル |
| C.I-325 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | フラン-3-イル |
| C.I-326 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2-テトラヒドロフラン |
| C.I-327 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-テトラヒドロフラン |
| C.I-328 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | チオフェン-2-イル |
| C.I-329 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | チオフェン-3-イル |
| C.I-330 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 1-メチル-3-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-331 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 1-メチル-5-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-332 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | イソオキサゾール-5-イル |
| C.I-333 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-334 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-335 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3-メチル-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-336 | I.A ³ .0 | CH ₃ CH ₂ CH ₂ | 3,4-ジクロロ-イソチアゾール-5-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|--|--|---|
| C.I-337 |  = I.A ³ .1 | CH ₃ | H |
| C.I-338 | I.A ³ .1 | CH ₃ | F ₃ C |
| C.I-339 | I.A ³ .1 | CH ₃ | Cl ₃ C |
| C.I-340 | I.A ³ .1 | CH ₃ | Cl ₂ CH |
| C.I-341 | I.A ³ .1 | CH ₃ | ClCH ₂ |
| C.I-342 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ |
| C.I-343 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-344 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-345 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (CH ₃) ₃ C |
| C.I-346 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-347 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-348 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (CH ₃) ₃ CCH ₂ |
| C.I-349 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ O |
| C.I-350 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ O |
| C.I-351 | I.A ³ .1 | CH ₃ | F ₃ CCH ₂ O |
| C.I-352 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ NH |
| C.I-353 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ NH |
| C.I-354 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (CH ₃) ₂ N |
| C.I-355 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (CH ₃ CH ₂) ₂ N |
| C.I-356 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (CH ₃ CH ₂)CH ₃ N |
| C.I-357 | I.A ³ .1 | CH ₃ | C ₆ H ₅ NH |
| C.I-358 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (C ₆ H ₅)CH ₃ N |
| C.I-359 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-360 | I.A ³ .1 | CH ₃ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N |
| C.I-361 | I.A ³ .1 | CH ₃ | シクロプロピル |
| C.I-362 | I.A ³ .1 | CH ₃ | シクロブチル |
| C.I-363 | I.A ³ .1 | CH ₃ | シクロペンチル |
| C.I-364 | I.A ³ .1 | CH ₃ | シクロヘキシル |
| C.I-365 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CNCH ₂ |
| C.I-366 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ OCH ₂ |
| C.I-367 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ OCH ₂ |
| C.I-368 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ OCH ₂ CH ₂ |
| C.I-369 | I.A ³ .1 | CH ₃ | F ₃ C CH ₂ |
| C.I-370 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ OCOCH ₂ |
| C.I-371 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ SCH ₂ |
| C.I-372 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ SCH ₂ |
| C.I-373 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ SCH ₂ CH ₂ |
| C.I-374 | I.A ³ .1 | CH ₃ | C ₆ H ₅ CH ₂ |
| C.I-375 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₂ =CHCH ₂ |
| C.I-376 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₂ =CH |
| C.I-377 | I.A ³ .1 | CH ₃ | CH ₃ CH=CH |
| C.I-378 | I.A ³ .1 | CH ₃ | C ₆ H ₅ |
| C.I-379 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-380 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-381 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-382 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-383 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-384 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-385 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-386 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-387 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-388 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-389 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-390 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-391 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-392 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-393 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-394 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-395 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-396 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-397 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-398 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-399 | I.A ³ .1 | CH ₃ | ピリジン-2-イル |
| C.I-400 | I.A ³ .1 | CH ₃ | ピリジン-3-イル |
| C.I-401 | I.A ³ .1 | CH ₃ | ピリジン-4-イル |
| C.I-402 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-メチル-ピリジン- 5-イル |
| C.I-403 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-メチル-ピリジン- 2-イル |
| C.I-404 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 3-イル |
| C.I-405 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 4-イル |
| C.I-406 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 5-イル |
| C.I-407 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-408 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-409 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル- ピリジン-3-イル |

10

20

30

40

50

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-410 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-メチルチオ-ピリジン-3-イル |
| C.I-411 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2,3-ジクロロ-ピリジン-5-イル |
| C.I-412 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2,5-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-413 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2,6-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-414 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル |
| C.I-415 | I.A ³ .1 | CH ₃ | N-メチル-ピロール-2-イル |
| C.I-416 | I.A ³ .1 | CH ₃ | ピラジン-2-イル |
| C.I-417 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル |
| C.I-418 | I.A ³ .1 | CH ₃ | フラン-2-イル |
| C.I-419 | I.A ³ .1 | CH ₃ | フラン-3-イル |
| C.I-420 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2-テトラヒドロフラン |
| C.I-421 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-テトラヒドロフラン |
| C.I-422 | I.A ³ .1 | CH ₃ | チオフェン-2-イル |
| C.I-423 | I.A ³ .1 | CH ₃ | チオフェン-3-イル |
| C.I-424 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 1-メチル-3-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-425 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 1-メチル-5-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-426 | I.A ³ .1 | CH ₃ | イソキサゾール-5-イル |
| C.I-427 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-428 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-429 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3-メチル-イソチア ゾール-5-イル |
| C.I-430 | I.A ³ .1 | CH ₃ | 3,4-ジクロロ-イソ チアゾール-5-イル |
| C.I-431 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | H |
| C.I-432 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-433 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | Cl ₃ C |
| C.I-434 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | Cl ₂ CH |
| C.I-435 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | ClCH ₂ |
| C.I-436 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ |
| C.I-437 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-438 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-439 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₃ C |
| C.I-440 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-441 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-442 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₃ CCH ₂ |
| C.I-443 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ O |
| C.I-444 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ O |
| C.I-445 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ CCH ₂ O |
| C.I-446 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ NH |
| C.I-447 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ NH |
| C.I-448 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ N |
| C.I-449 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂) ₂ N |
| C.I-450 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂)CH ₃ N |
| C.I-451 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ NH |
| C.I-452 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (C ₆ H ₅)CH ₃ N |
| C.I-453 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH |
| C.I-454 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-455 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | シクロプロピル |
| C.I-456 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | シクロブチル |
| C.I-457 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | シクロペンチル |
| C.I-458 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | シクロヘキシル |
| C.I-459 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CNCH ₂ |
| C.I-460 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ |
| C.I-461 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ OCH ₂ |
| C.I-462 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ CH ₂ |
| C.I-463 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C CH ₂ |
| C.I-464 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCOCH ₂ |
| C.I-465 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ |
| C.I-466 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ SCH ₂ |
| C.I-467 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ CH ₂ |
| C.I-468 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ CH ₂ |
| C.I-469 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₂ =CHCH ₂ |
| C.I-470 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₂ =CH |
| C.I-471 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH=CH |
| C.I-472 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ |
| C.I-473 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-474 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-475 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-476 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-477 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-478 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-479 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-480 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-481 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-482 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-483 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-484 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-485 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-486 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-487 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-488 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-489 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-490 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-491 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-492 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-493 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-2-イル |
| C.I-494 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-3-イル |
| C.I-495 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-4-イル |
| C.I-496 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-メチル-ピリジン- 5-イル |
| C.I-497 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチル-ピリジン- 2-イル |
| C.I-498 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 3-イル |
| C.I-499 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 4-イル |
| C.I-500 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 5-イル |
| C.I-501 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-502 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-503 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチ ル-ピリジン-3-イル |
| C.I-504 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチルチオ-ピリ ジン-3-イル |

10

20

30

40

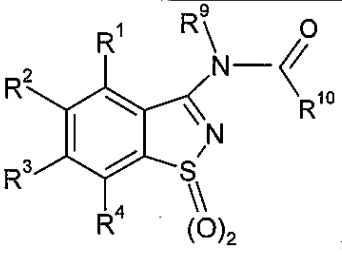
| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-505 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2,3-ジクロロ-ピリジン-5-イル |
| C.I-506 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2,5-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-507 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2,6-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-508 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル |
| C.I-509 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | N-メチピロール-2-イル |
| C.I-510 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | ピラジン-2-イル |
| C.I-511 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル |
| C.I-512 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | フラン-2-イル |
| C.I-513 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | フラン-3-イル |
| C.I-514 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2-テトラヒドロフラン |
| C.I-515 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-テトラヒドロフラン |
| C.I-516 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | チオフェン-2-イル |
| C.I-517 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | チオフェン-3-イル |
| C.I-518 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 1-メチル-3-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-519 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 1-メチル-5-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-520 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | イソオキサゾール-5-イル |
| C.I-521 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-522 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-523 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチル-イソチアゾール-5-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|--|--|---|
| C.I-524 | I.A ³ .1 | CH ₃ CH ₂ | 3,4-ジクロロ-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-525 |  = I.A ³ .2 | CH ₃ | H |
| C.I-526 | I.A ³ .2 | CH ₃ | F ₃ C |
| C.I-527 | I.A ³ .2 | CH ₃ | Cl ₃ C |
| C.I-528 | I.A ³ .2 | CH ₃ | Cl ₂ CH |
| C.I-529 | I.A ³ .2 | CH ₃ | ClCH ₂ |
| C.I-530 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ |
| C.I-531 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-532 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-533 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (CH ₃) ₃ C |
| C.I-534 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-535 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-536 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (CH ₃) ₃ CCH ₂ |
| C.I-537 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ O |
| C.I-538 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ O |
| C.I-539 | I.A ³ .2 | CH ₃ | F ₃ CCH ₂ O |
| C.I-540 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ NH |
| C.I-541 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ NH |
| C.I-542 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (CH ₃) ₂ N |
| C.I-543 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (CH ₃ CH ₂) ₂ N |
| C.I-544 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (CH ₃ CH ₂)CH ₃ N |
| C.I-545 | I.A ³ .2 | CH ₃ | C ₆ H ₅ NH |
| C.I-546 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (C ₆ H ₅)CH ₃ N |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-547 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH |
| C.I-548 | I.A ³ .2 | CH ₃ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N |
| C.I-549 | I.A ³ .2 | CH ₃ | シクロプロピル |
| C.I-550 | I.A ³ .2 | CH ₃ | シクロブチル |
| C.I-551 | I.A ³ .2 | CH ₃ | シクロペンチル |
| C.I-552 | I.A ³ .2 | CH ₃ | シクロヘキシル |
| C.I-553 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CNCH ₂ |
| C.I-554 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ OCH ₂ |
| C.I-555 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ OCH ₂ |
| C.I-556 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ OCH ₂ CH ₂ |
| C.I-557 | I.A ³ .2 | CH ₃ | F ₃ C CH ₂ |
| C.I-558 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ OCOCH ₂ |
| C.I-559 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ SCH ₂ |
| C.I-560 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH ₂ SCH ₂ |
| C.I-561 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ SCH ₂ CH ₂ |
| C.I-562 | I.A ³ .2 | CH ₃ | C ₆ H ₅ CH ₂ |
| C.I-563 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₂ =CHCH ₂ |
| C.I-564 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₂ =CH |
| C.I-565 | I.A ³ .2 | CH ₃ | CH ₃ CH=CH |
| C.I-566 | I.A ³ .2 | CH ₃ | C ₆ H ₅ |
| C.I-567 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-568 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-569 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-570 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-571 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-572 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-573 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-574 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-575 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-576 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-577 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-578 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-579 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-580 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-581 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-582 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-583 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-584 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-585 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-586 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-587 | I.A ³ .2 | CH ₃ | ピリジン-2-イル |
| C.I-588 | I.A ³ .2 | CH ₃ | ピリジン-3-イル |
| C.I-589 | I.A ³ .2 | CH ₃ | ピリジン-4-イル |
| C.I-590 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-メチル-ピリジン- 5-イル |
| C.I-591 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-メチル-ピリジン- 2-イル |
| C.I-592 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 3-イル |
| C.I-593 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 4-イル |
| C.I-594 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 5-イル |
| C.I-595 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-596 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |

10

20

30

40

50

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-597 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イル |
| C.I-598 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-メチルチオ-ピリジン-3-イル |
| C.I-599 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2,3-ジクロロ-ピリジン-5-イル |
| C.I-600 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2,5-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-601 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2,6-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-602 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル |
| C.I-603 | I.A ³ .2 | CH ₃ | N-メチル-ピロール-2-イル |
| C.I-604 | I.A ³ .2 | CH ₃ | ピラジン-2-イル |
| C.I-605 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル |
| C.I-606 | I.A ³ .2 | CH ₃ | フラン-2-イル |
| C.I-607 | I.A ³ .2 | CH ₃ | フラン-3-イル |
| C.I-608 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2-テトラヒドロフラン |
| C.I-609 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-テトラヒドロフラン |
| C.I-610 | I.A ³ .2 | CH ₃ | チオフェン-2-イル |
| C.I-611 | I.A ³ .2 | CH ₃ | チオフェン-3-イル |
| C.I-612 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 1-メチル-3-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-613 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 1-メチル-5-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-614 | I.A ³ .2 | CH ₃ | イソオキサゾール-5-イル |
| C.I-615 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-616 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-617 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3-メチル-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-618 | I.A ³ .2 | CH ₃ | 3,4-ジクロロ-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-619 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | H |
| C.I-620 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C |
| C.I-621 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | Cl ₃ C |
| C.I-622 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | Cl ₂ CH |
| C.I-623 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | ClCH ₂ |
| C.I-624 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ |
| C.I-625 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ |
| C.I-626 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ CH |
| C.I-627 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₃ C |
| C.I-628 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-629 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ |
| C.I-630 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₃ CCH ₂ |
| C.I-631 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ O |
| C.I-632 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ O |
| C.I-633 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ CCH ₂ O |
| C.I-634 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ NH |
| C.I-635 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ NH |
| C.I-636 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃) ₂ N |
| C.I-637 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂) ₂ N |
| C.I-638 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (CH ₃ CH ₂)CH ₃ N |
| C.I-639 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ NH |
| C.I-640 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (C ₆ H ₅)CH ₃ N |

10

20

30

40

50

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|--|
| C.I-641 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH |
| C.I-642 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | (2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N |
| C.I-643 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | シクロプロピル |
| C.I-644 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | シクロブチル |
| C.I-645 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | シクロペンチル |
| C.I-646 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | シクロヘキシル |
| C.I-647 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CNCH ₂ |
| C.I-648 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ |
| C.I-649 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ OCH ₂ |
| C.I-650 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCH ₂ CH ₂ |
| C.I-651 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | F ₃ C CH ₂ |
| C.I-652 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ OCOCH ₂ |
| C.I-653 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ |
| C.I-654 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH ₂ SCH ₂ |
| C.I-655 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ SCH ₂ CH ₂ |
| C.I-656 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ CH ₂ |
| C.I-657 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₂ =CHCH ₂ |
| C.I-658 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₂ =CH |
| C.I-659 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | CH ₃ CH=CH |
| C.I-660 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | C ₆ H ₅ |
| C.I-661 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-662 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-663 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-F-C ₆ H ₄ |
| C.I-664 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-665 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-Cl-C ₆ H ₄ |
| C.I-666 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-667 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-668 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-669 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ |
| C.I-670 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-671 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-672 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ |
| C.I-673 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-674 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-675 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-F ₃ C-C ₆ H ₄ |
| C.I-676 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-677 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-678 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-Br-C ₆ H ₄ |
| C.I-679 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-680 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-CN-C ₆ H ₄ |
| C.I-681 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-2-イル |
| C.I-682 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-3-イル |
| C.I-683 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | ピリジン-4-イル |
| C.I-684 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-メチル-ピリジン- 5-イル |
| C.I-685 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチル-ピリジン- 2-イル |
| C.I-686 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 3-イル |
| C.I-687 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 4-イル |
| C.I-688 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 5-イル |
| C.I-689 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |
| C.I-690 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-クロロ-ピリジン- 6-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|---------------------|--|---|
| C.I-691 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-イル |
| C.I-692 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-メチルチオ-ピリジン-3-イル |
| C.I-693 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2,3-ジクロロ-ピリジン-5-イル |
| C.I-694 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2,5-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-695 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2,6-ジクロロ-ピリジン-3-イル |
| C.I-696 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3,5-ジクロロ-ピリジン-4-イル |
| C.I-697 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | N-メチピロール-2-イル |
| C.I-698 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | ピラジン-2-イル |
| C.I-699 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル |
| C.I-700 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | フラン-2-イル |
| C.I-701 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | フラン-3-イル |
| C.I-702 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2-テトラヒドロフラン |
| C.I-703 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 3-テトラヒドロフラン |
| C.I-704 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | チオフェン-2-イル |
| C.I-705 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | チオフェン-3-イル |
| C.I-706 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 1-メチル-3-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-707 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 1-メチル-5-トリフルオロ-メチル-1H-ピラゾール-4-イル |
| C.I-708 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | イソオキサゾール-5-イル |
| C.I-709 | I.A ³ .2 | CH ₃ CH ₂ | 2,4-ジメチル-チアゾール-5-イル |

10

20

30

40

| 番号 | 式 | R ⁵ , R ⁹ (個別に) | R ⁶ , R ¹⁰ (個別に) |
|---------|--------------------|--|---|
| C.I-710 | I.A ^{3.2} | CH ₃ CH ₂ | 4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-イル |
| C.I-711 | I.A ^{3.2} | CH ₃ CH ₂ | 3-メチル-イソチアゾール-5-イル |
| C.I-712 | I.A ^{3.2} | CH ₃ CH ₂ | 3,4-ジクロロ-イソチアゾール-5-イル |

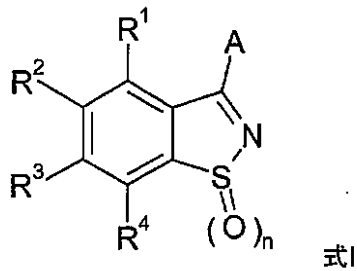
10

【 0 0 8 5 】

製造方法

式Iで表される化合物：

【化3】



20

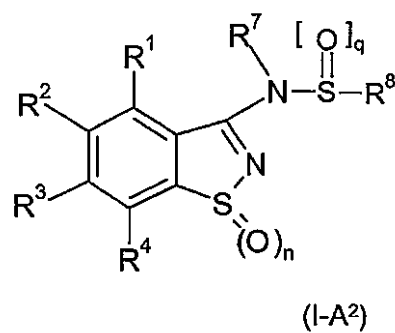
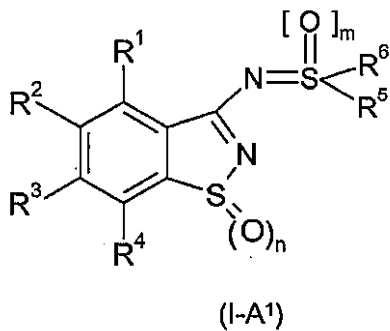
【 0 0 8 6 】

(式中、Aは、

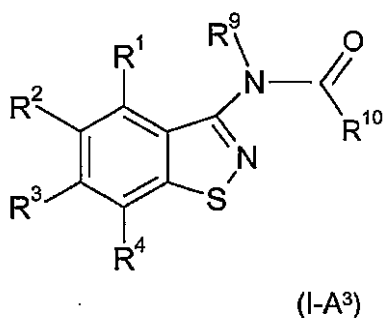
【化4】

A¹:

又は

A²:

30

又はA³:

40

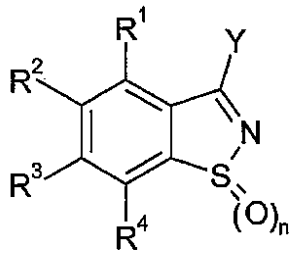
【 0 0 8 7 】

50

という意味を有しており、他の置換基および可変部分については式Iに関して上で定義した通りである)

は、一般に、式IIa:

【化5】



式II-a

10

【0088】

[式中、YはハロゲンまたはO-SO₂R(この場合、Rはアルキル、ハロアルキルまたは置換フェニルである)であり(例えば、Yはメシレート、トリフレートおよびパラ-トルエンスルノネートである)、また、R¹、R²、R³およびR⁴は式Iに関して定義した通りである]

で表される活性型のベンゾイソチアゾロンを反応させることにより製造することができる。

【0089】

AがA¹またはA²である場合、例えば、塩基の存在下で、A¹-HまたはA²-H:

20

【化6】



【0090】

(式中、可変部分R⁵、R⁶、R⁷およびR⁸は式Iに関して前で定義したのと同様である)

30

で表される化合物を用いる。

【0091】

使用可能な式II-aで表される好適な活性型のベンゾイソチアゾロン誘導体は、例えば、3-クロロベンゾイソチアゾールなどの3-ハロベンゾイソチアゾール誘導体類または上述のような対応するスルホネート類(例えばトリフレートもしくはメシレート)である。

【0092】

式II-aで表される活性型のベンゾイソチアゾロン誘導体は、以下のスキームにより得ることができる。

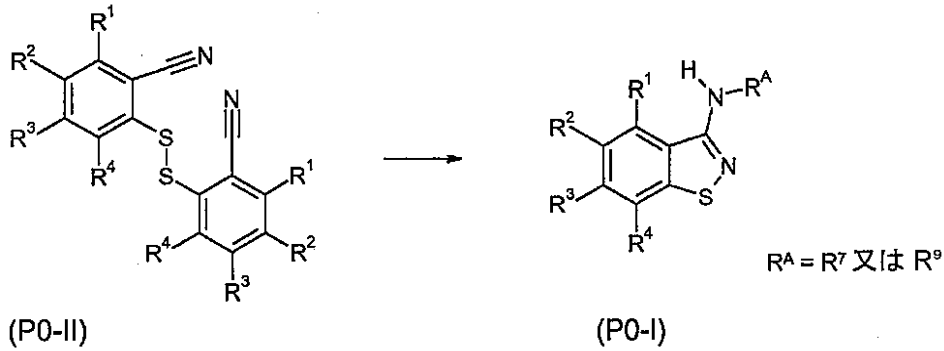
【0093】

P.0. 3-アミノ-ベンゾイソチアゾール:

40

3-アミノ-ベンゾイソチアゾール(P0-I)は、S. W. Walinskyら(Organic Process Research & Development 1999, 3, 126-130)によって記載されているようにして、適切に置換されているジスルフィド(P0-II)を、イソプロパノールなどの極性溶媒中でアミンおよび酸化剤(例えばジメチルスルホキシド(DMSO)など)と一緒に加熱することにより製造することができる。

【化7】

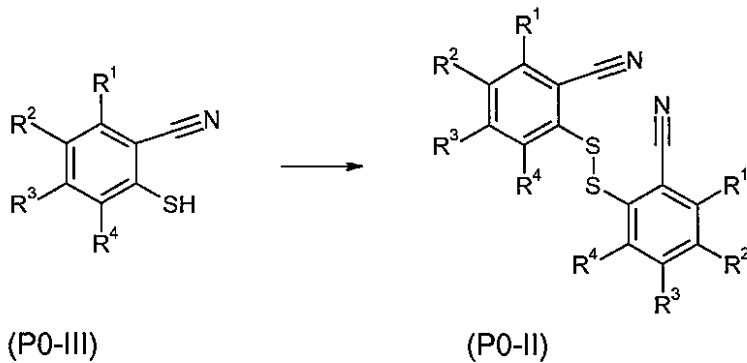


10

【0094】

2-シアノ-ジスルフィド(P0-II)は、H. Boerzelら(Inorganic Chemistry 2003, 1604-1615)によって報告されているようにして、対応するチオフェノール(P0-III)からジメチルスルホキシド(DMSO)などの酸化剤を使用することにより製造することができる。

【化8】



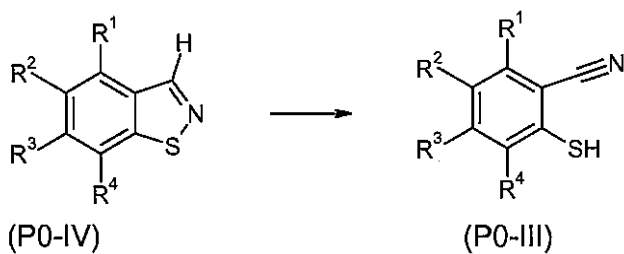
20

【0095】

2-シアノ-チオフェノール(P0-III)は、J. Markertら(Liebigs Annalen d. Chemie 1980, 768-778)によって記載されているようにして、ベンゾイソチアゾール(P0-IV)からNaOCH₃などの強塩基で処理することにより製造することができる。

30

【化9】

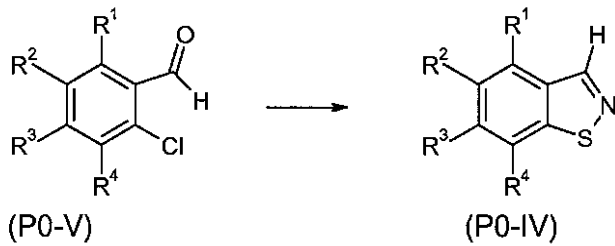


【0096】

また前記文献には、硫黄とアンモニアとの反応による、2-クロロ-ベンズアルデヒド(P0-V)からの置換ベンゾイソチアゾール(P0-IV)の合成も記載されている。

40

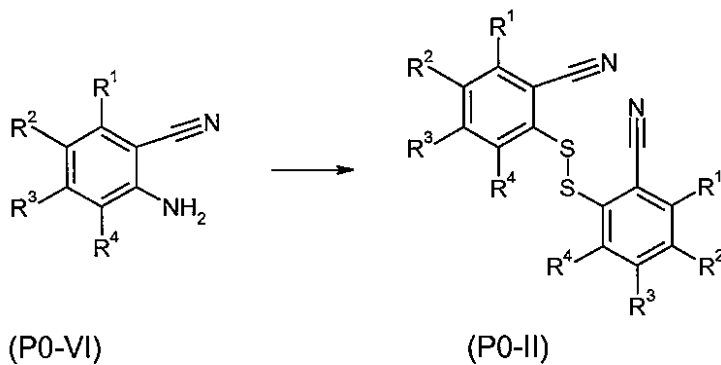
【化10】



【0097】

あるいは、2-シアノ-ジスルフィド(P0-II)は、V. M. Negrimovskyら(Phosphorus, Sulfur & The Related Elements 1995, 104, 161-167)によって記載されているようにして、2-シアノ-アニリン(P0-VI)から、ジアゾ化を行い、続いてジアゾニウム塩を Na_2S および硫黄と反応させることにより製造することができる。

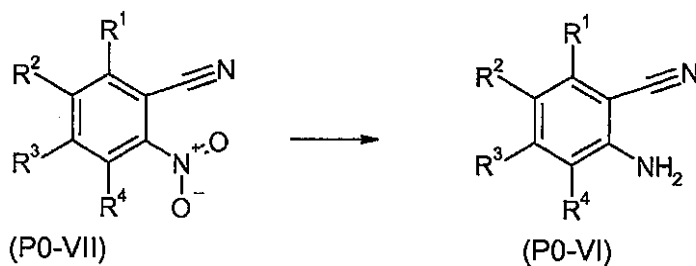
【化11】



【0098】

2-シアノ-アニリン(P0-VI)は、D. H. Klaubert (J. Med. Chem. 1981, 24, 742-748)によって記載されているようにして、鉄などの還元剤を使用して2-シアノ-ニトロベンゼン(P0-VII)から製造することができる。

【化12】



【0099】

あるいは、3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール(P0-I)は、H. Boeshagenら(Justus Liebig Annalen der Chemie, 1977, 20)によって記載されているようにして、3-クロロ-ベンゾ[d]イソチアゾール(P0-VIIIa)から製造することもできる。

【0100】

クロロ-ベンゾ[d]イソチアゾール(P0-VIIIa)は、ベンゾイソチアゾロン(P0-IX)から、(J.P. Yevichら(Journal of Medicinal Chemistry 1986, 29, 359-369)によって記載されているようにして) PCl_3 などの塩素化剤と反応させるか、(S. G. Zlutinら(Journal of Organic Chemistry 2000, 65, 8439-8443)による記載のように) $\text{PCl}_3/\text{PCl}_5$ などの塩素化剤と反応させることにより得ることができる。

【0101】

10

20

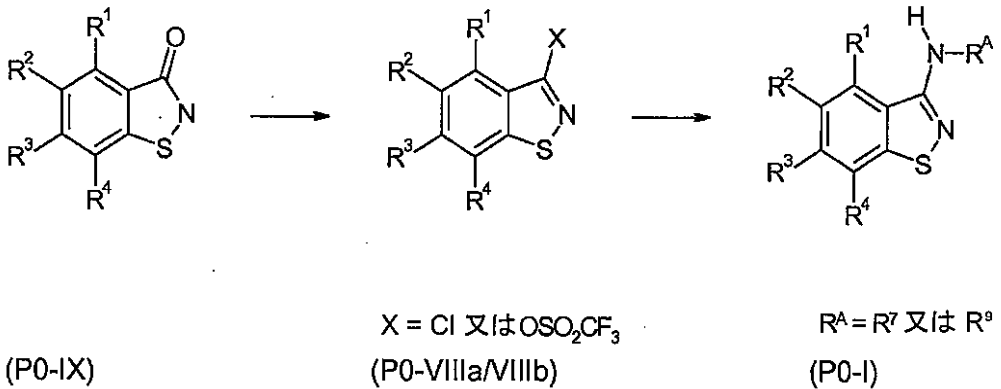
30

40

50

また3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール(P0-I)は、米国特許第5359068号(US 5359068)と同様に、トリフルオロ-メタンスルホン酸ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イルエステル(P0-VIIIb)から、前記化合物をアミンと反応させることにより得ることもできる。この後者の文献には、ベンゾイソチアゾロンから得られるトリフルオロ-メタンスルホン酸ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イルエステル(P0-VIIIb)が記載されている。

【化13】



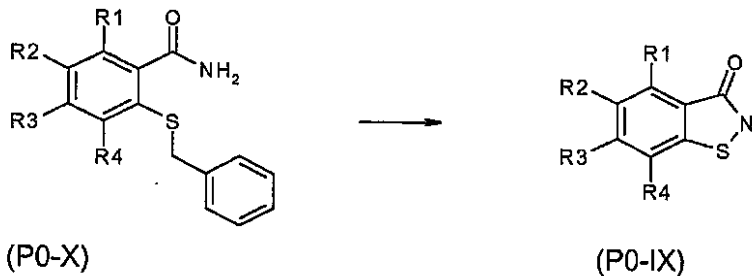
10

【0102】

さらに上述のS.G. Zlutinらの文献には、SO₂Cl₂などの酸化剤で処理することにより、2-ベンジルスルファニル-ベンズアミド(P0-X)から前記ベンゾイソチアゾロン(P0-IX)を合成することも記載されている。

20

【化14】

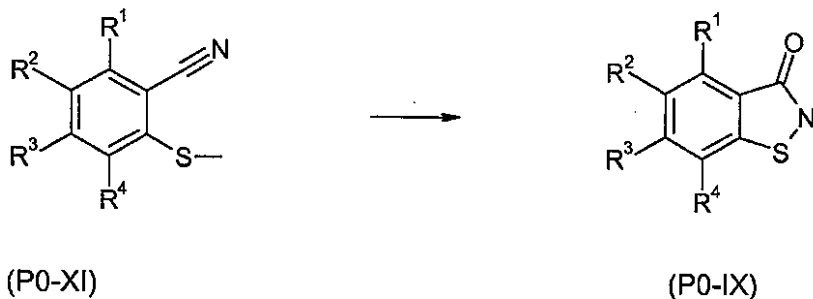


30

【0103】

あるいは、EP 1081141には、ワンポット法で2-(アルキルチオ(alkythio))ベンゾニトリル(P-XVI)からベンゾイソチアゾロン(P-XIV)を製造する別法が記載されている。

【化15】



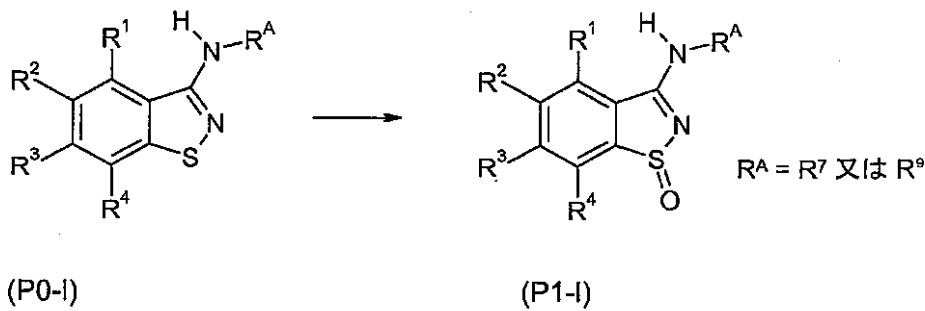
40

【0104】

P.1 アミノベンゾイソチアゾール-1-モノオキサイド

アミノベンゾイソチアゾール(P0-I)は、Chemische Berichte, 103, 3166-3181に記載の方法と同様にして酸化し、一酸化型の種(P1-I)を得ることができる。好適な酸化剤は、例えば、HNO₃、H₂O₂/酢酸またはm-クロロ過安息香酸である。

【化16】



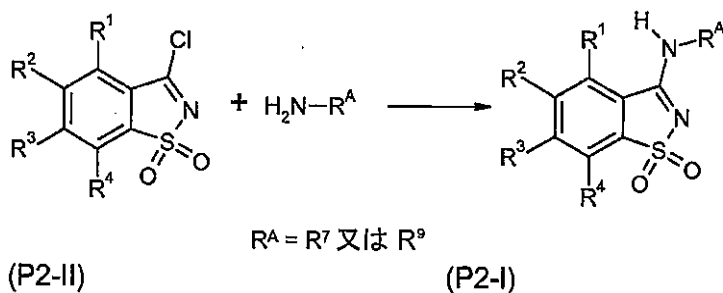
10

【0105】

P.2 3-アミノベンゾイソチアゾール-1,1-ジオキシド

3-アミノベンゾイソチアゾール-1,1-ジオキシド(P2-I)は、Journal of the Chemical Society Perkin Transaction 2, 2001, 1315-1324に記載のようにして、テトラヒドロフランまたはジオキサンなどの極性で非プロトン性の溶媒中で第一級アミンと反応させることにより、適切に置換されている3-クロロ-ベンゾ[d]イソチアゾール-1,1-ジオキシド(P2-II)から得ることができる。

【化17】



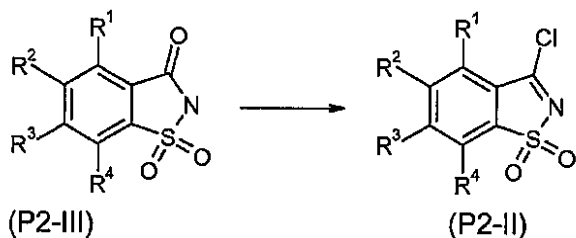
20

【0106】

3-クロロ-ベンゾ[d]イソチアゾール-1,1-ジオキシド(P2-II)は、D. Doppら (Synthesis 2001, 8, 1228-1235)によって、またはR. Salman (Chem. Eng. Data 1987, 32, 391)によって、またはR. W. Lang (Helvetica Chimica Acta 1989, 72, 1248-1252)によって記載されているようにして、適切に置換されているサッカリン(P2-III)を $\text{ClCO}_2\text{CCl}_3$ 、 PCl_5 / POCl_3 または SOCl_2 などの塩素化剤と反応させることにより製造することができる。

30

【化18】

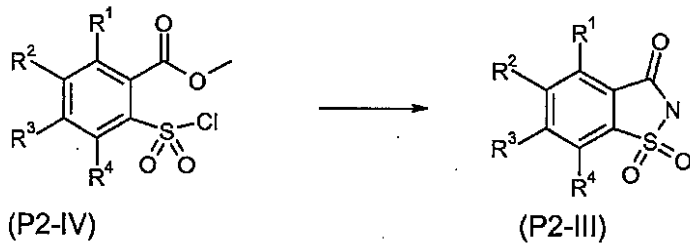


40

【0107】

置換サッカリン(P2-III)は、M. C. Bellら (Bioorganic & Medicinal Letters 1991, No. 12, 733-736)によって、またはM. L. Trudellら (Journal of Heterocyclic Chem. 2004, 41, 435f)によって記載されているようにして、2-クロロスルホニル-安息香酸エステル(P2-IV)をアンモニアと反応させることにより製造することができる。

【化19】

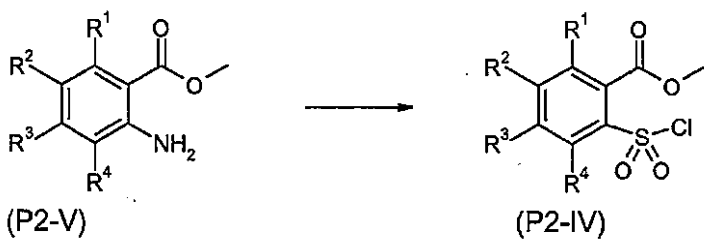


【0108】

10

また後者の文献には、ジアゾ化とその後のクロロスルホン化により、対応するメチルアントラニレート (P2-V) から記載の2-クロロスルホニル-安息香酸エステル (P2-IV) を合成することも記載されている。同様の合成手法は、G. Hamprechtら (Chimia (2004), 58, 117-122) によっても記載されている。

【化20】



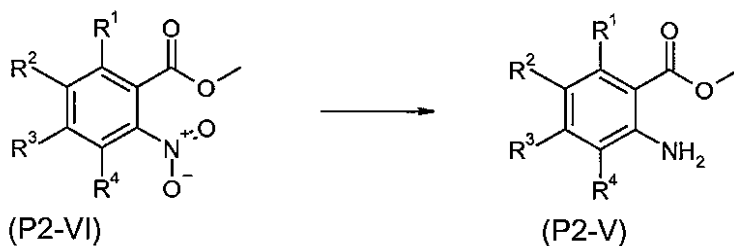
20

【0109】

メチルアントラニレート (P2-V) が市販されていない場合、J. F. W. Keanaら (Bioorganic & Medicinal Chemistry 11 (2003) 1769-1780) によって記載されているようにして、対応する2-ニトロ安息香酸メチルエステル (P2-VI) から接触水素化により製造することができる。

【化21】

30

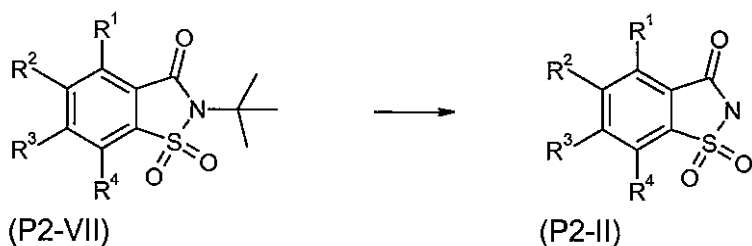


【0110】

あるいは、サッカリン (P2-II) は、K. F. Burri (Helvetica Chimica Acta 1990, 73, 69-80) によって記載されている方法で、対応するN-t-ブチルサッカリン (P2-VII) をトリフルオロ酢酸などの強酸とともに加熱することによって開裂させることで製造することができる。

40

【化22】

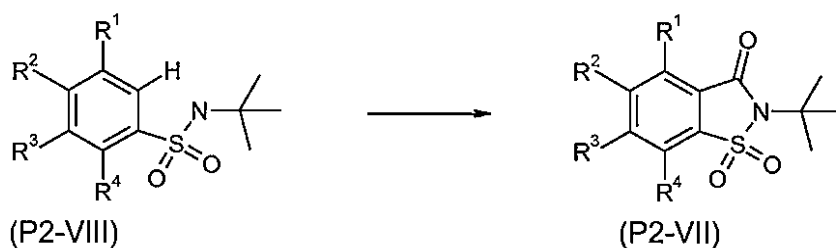


【0111】

10

N-t-ブチルサッカリン(P2-VII)は、対応するスルホンアミド(P2-VIII)から、ブチルリチウムまたはリチウムジイソプロピルアミドなどの塩基との直接オルトメタル化と、その後の閉環下における二酸化炭素によるメタル化種のトラッピングにより得ることができる。この手法は、D. Beckerら(Tetrahedron 1992, 2515-2522)によって記載されている。メタル化は、N. Murugesanら(J. Med. Chem. 1998, 41, 5198-5218)によって記載されているようにして行なうことができる。

【化23】



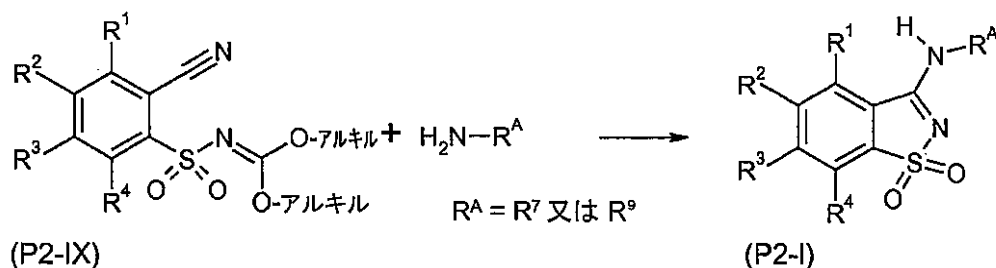
20

【0112】

あるいは、3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール-1,1-ジオキシド(P2-I)は、適切に置換されたイミダート(P2-IX)から、高温で第一級アミンと反応させることにより製造することもできる。この反応は、無溶媒条件下(neat)で、あるいは好適な溶媒(好ましくは、テトラヒドロフラン(THF)またはジオキサンなどの極性高沸点溶媒)中で行うことができる。好ましくは、この反応は無溶媒条件下で行なう。反応を無溶媒条件下で行なう場合、好ましい温度は、室温~各アミンの沸点である。反応を溶媒中に行なう場合には、好ましい温度は、室温~各溶媒の沸点である。この方法における置換基アルキルは、好ましくはメチルまたはエチルなどのアルキル置換基である。

30

【化24】

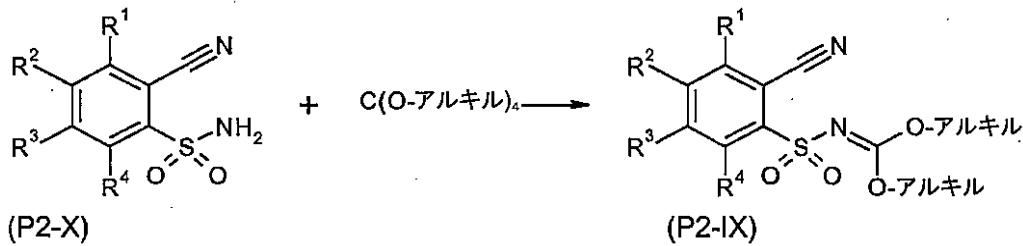


40

【0113】

前記イミダート(P2-IX)は、Journal of Organic Chemistry 1963, 28, 2902-2903に記載の方法と同様の方法で、2-シアノベンゼンスルホンアミド(P2-X)を炭酸オルトエステルと反応させることにより得ることができる。前記シアノベンゼンスルホンアミド(P2-X)は、WO 2005/035486に記載されているように製造することができる。

【化25】

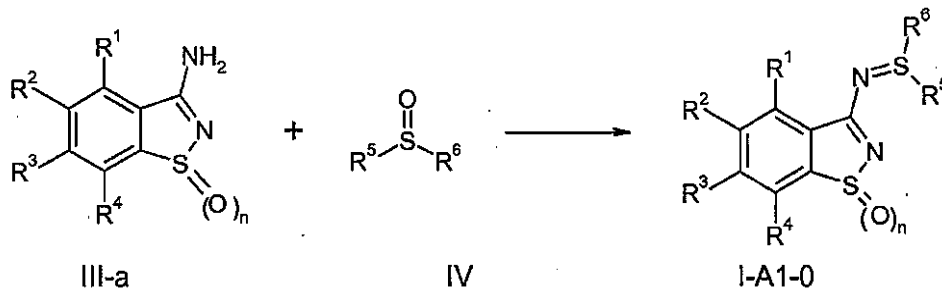


【0114】

10

本発明の化合物I-A¹-0(これに関し、AはA¹に定義した通りの意味を有し、mは0である)は、適切な縮合剤との組み合わせで、アミノベンゾイソチアゾール誘導体III-aを適切に置換されたスルホキシドIVと縮合反応させることにより調製することができる。適切な縮合剤は、例えば、オキシ塩化リン、酸化リン(V)、塩化メタンスルホニル、塩化スルフリル、三塩化硫黄、三フッ化ホウ素、ジシクロヘキシルカルボジイミド、アリールシアネート、または酸無水物、好ましくは無水トリフルオロ酢酸または無水トリフルオロメタンスルホン酸である。

【化26】



20

【0115】

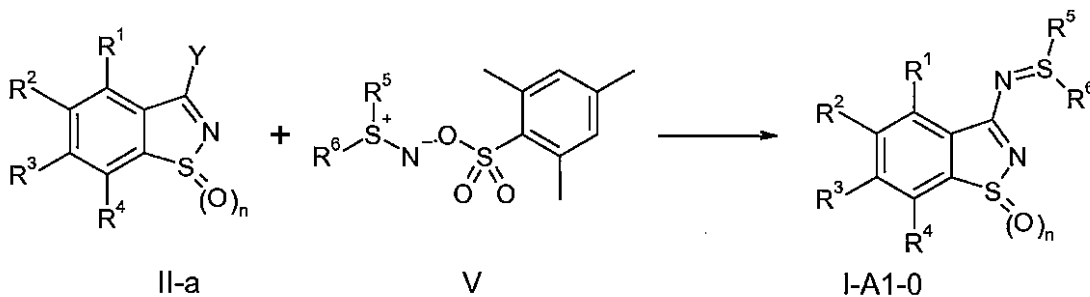
式IVで表されるスルホキシドは、当技術分野で公知の方法、例えば、J. March, *Advanced Organic Chemistry*, 第4版, Wiley, 1992, p.1297に記載されているように得ることができる。

30

【0116】

あるいは、前記化合物は、適切に置換された活性型のベンゾイソチアゾロンII-aを塩基の存在下で適切に置換されたチオ化合物Vと反応させることにより製造することができる。好ましくは、この塩基は、トリエチルアミンまたはN-ジイソプロピルエチルアミン(Hue nig塩基)などのアミンである。

【化27】



40

【0117】

チオ化合物Vは、*Tetrahedron* 1975, 31, 3035-3040に記載されている方法に従って製造することができる。

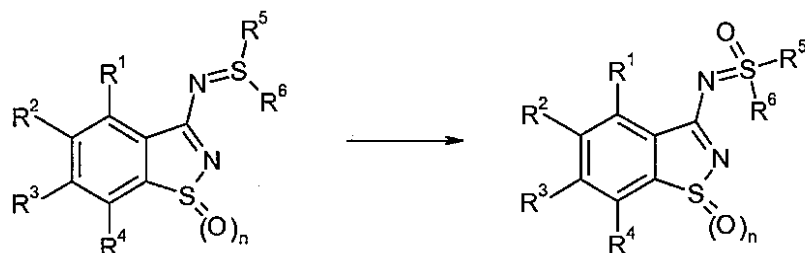
【0118】

式中、nが0、1または2である場合に、mが1である化合物I-A1-1は、*Journal of Heteroc*

50

yclic Chemistry 2005, 42, 599-607 (H₂O₂)、Journal of Organic Chemistry 1984, 49, 2282-2284 (NaOCl)またはHeterocycles 1998, 49, 181-190 (メタクロロ過安息香酸(mcpba))に記載されている合成と同様の合成法で、mが0である化合物I-A1-0から、適切な酸化剤(H₂O₂、NaOClまたは3-クロロ過安息香酸など)で処理することにより得ることができる。

【化28】

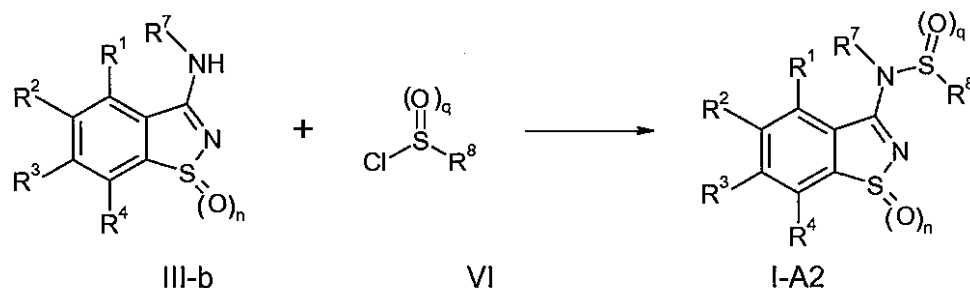


10

【0119】

AがA²に関して記載されている意味を有する化合物I-A2は、Farmaco 1992, 47, 265-274に記載の合成と同様にして、アミノベンゾイソチアゾール誘導体III-bから、塩基の存在下で適切に置換されたチオ化合物VIと反応させることにより得ることができる。適切な塩基は、アミン類、例えばトリエチルアミン、Huenig塩基またはピリジンなどである。

【化29】

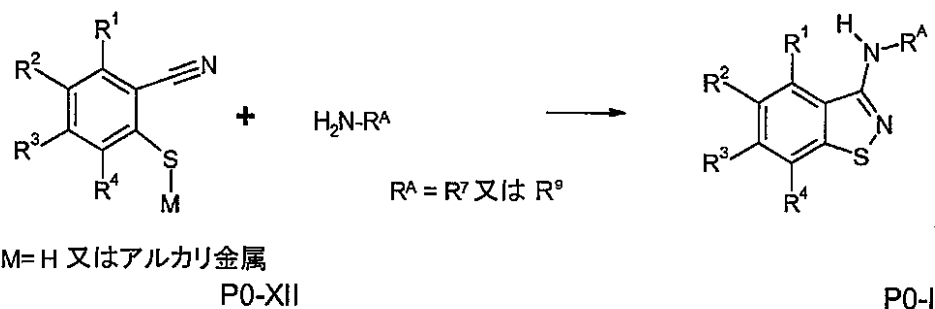


20

【0120】

3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール(P0-I)は、2-メルカプトベンゾニトリル(P0-XII)またはそれらのアルカリ金属塩から、L.K.A. Rahmanら, J.Chem.Soc. Perkin Trans I, 1983, 2973-2977と同様にして、前記化合物をアミンと反応させることにより得ることができる。

【化30】



40

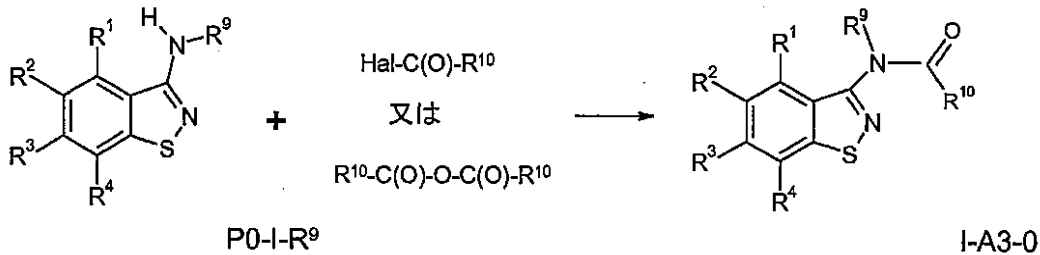
【0121】

AがA³に関して記載されている意味を有する化合物I-A3は、当技術分野で公知の方法(例えばEP 133418)に従い、適切な塩基の存在下において、アミノベンゾイソチアゾール誘導体から、ハロゲン化アシル(Hal-C(O)-R¹⁰)、特に塩化アシル、酸無水物(R¹⁰-C(O)-O-C(O)-R¹⁰)または混合酸無水物との反応により得ることができる。適切な塩基としては、有機

50

塩基、例えば第三級アミン類、具体的には脂肪族アミン類、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミンまたはジイソプロピルエチルアミン、脂環式第三級アミン類、例えばN-メチルピペリジン、あるいは芳香族アミン類、例えばピリジン、置換ピリジン類、例えば2,4,6-コリジン、2,4-ルチジンまたは4-ジメチルアミノピリジンなどが挙げられる。

【化31】



10

【0122】

上記の製造方法においては、可変部分のR¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹およびR¹⁰は、上で定義した意味(特に好ましいものとして記載した意味)を有している。

【0123】

上述の経路により各化合物を得ることができない場合は、他の化合物Iを誘導体化することにより、あるいは記載した合成経路を従来的に変更することにより製造することができる。

20

【0124】

反応混合物は、慣用の方法、例えば水と混合し、それらの相を分離し、必要に応じて粗生成物をクロマトグラフィー(例えばアルミナまたはシリカゲルのもの)で精製することにより後処理する。一部の間体と最終生成物は無色または薄茶色の粘稠な油状物で得られることもあるが、その場合、減圧下で、かつ適度に高い温度で、それらから揮発成分を除去して精製する。中間体と最終生成物が固体で得られる場合、それらは再結晶または温浸により精製することができる。

【0125】

式Iで表される化合物の農業上許容可能な塩は、慣用の方法で、例えば、対象のアニオンの酸との反応によって形成させることができる。

30

【0126】

害虫類

式Iで表される化合物は、特に以下の分類の害虫類を効果的に防除するのに好適である

鱗翅類(鱗翅目)の分類の昆虫：例えば、タマナヤガ(アグロチス・イプシロン(Agrotis ypsilon))、カブラヤガ(アグロチス・セゲツム(Agrotis segetum))、アラバマ・アルギラセア(Alabama argillacea)、アンチカルシア・ゲンマタリス(Anticarsia gemmatalis)、リンゴヒメシンクイ(アルギレスチア・コンジュゲラ(Argyresthia conjugella))、ガマキンウバ(オートグラフィア・ガンマ(Autographa gamma))、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、カコエシア・ムリナナ(Cacoecia murinana)、カプア・レチクラナ(Capua reticulana)、ケイマトビア・ブルマタ(Cheimatobia brumata)、トウヒノシントメハマキ(コリストネウラ・フミフェラナ(Choristoneura fumiferana))、コリストネウラ・オシデンタリス(Choristoneura occidentalis)、アワヨトウ(シルフィス・ユニプンクタ(Cirphis unipuncta))、コドリング(シジア・ポモネラ(Cydia pomonella))、デンドロリムス・ピニ(Dendrolimus pini)、アメリカウリノメイガ(ジアファニア・ニチダリス(Diaphania nitidalis))、サウスウエスタンコンボラー(ジアトラエア・グランジオセラ(Diatraea grandiosella))、ミスジアオリング(エアリアス・インスラナ(Earias insulana))、モロコシマダラメイガ(エラスモパルプス・リグノセルス(Elasmopalpus lignosellus))、ブドウホソハマキ(ユーポエシリア・アンビグエラ(Eupoecilia ambiguella))、エベトリア・ポウリアナ(Evetria bouliana)、フェルチア・サブテラネア(Feltia subterranea)

40

50

、ハチノスツツリガ(ガレリア・メロネラ(*Galleria mellonella*))、グラホリタ・フネブラナ(*Grapholitha funebrana*)、ナシヒメシンクイ(グラホリタ・モレスタ(*Grapholitha molesta*))、タバコガ(ヘリオチス・アルミゲラ(*Heliothis armigera*))、オオタバコガ(ヘリオチス・ビレセンス(*Heliothis virescens*))、ヘリオチス・ゼア(*Heliothis zea*)、ハイマダラノメイガ(ヘルラ・ウンダリス(*Hellula undalis*))、ヒベルニア・デホリアリア(*Hibernia defoliaria*)、アメリカシロヒトリ(ヒファントリア・クネア(*Hyphantria cunea*))、ヒボノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコベルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、ランブジナ・フィセラリア(*Lambdina fiscellaria*)、シロイチモンジヨトウ(ラフィグマ・エキシグア(*Laphygma exigua*))、ロイコプテラ・コフエエラ(*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、リトコレチス・ブランカルデラ(*Lithocolletis blancardella*)、ホソバヒメハマキ(ロベシア・ボトラナ(*Lobesia botrana*))、ロキソステージ・スチクチカリス(*Loxostege sticticalis*)、マイマイガ(リマントリア・ジスパル(*Lymantria dispar*))、ノンネマイマイ(リマントリア・モナカ(*Lymantria monacha*))、モモハモグリガ(リオネチア・クレルケラ(*Lyonetia clerkella*))、オビカレハ(マラコソマ・ネウストリア(*Malacosoma neustria*))、ヨトウガ(マメストラ・ブラッシカエ(*Mamestra brassicae*))、オルギア・プソイドツガタ(*Orgyia pseudotsugata*)、ヨーロッパアワノメイガ(オストリニア・ヌビラリス(*Ostrinia nubilalis*))、マツキリガ(パノリス・フランメア(*Panolis flammea*))、ワタアカミムシガ(ペクチノホラ・ゴッシピエラ(*Pectinophora gossypiella*))、ニセタマナヤガ(ペリドロマ・サウシア(*Peridroma saucia*))、ファレラ・ブセファラ(*Phalera bucephala*)、ジャガイモキバガ(フトリマエア・オペルクレラ(*Phthorimaea operculella*))、ミカンハモグリガ(フィロクニスチス・シトレラ(*Phyllocnistis citrella*))、オオモンシロチョウ(ピエリス・ブラッシカ(*Pieris brassicae*))、プラチペナ・スカブラ(*Plathypena scabra*)、コナガ(プルテラ・キシロステラ(*Plutella xylostella*))、プソイドブルシア・インクルデンス(*Pseudoplusia includens*)、リアシオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、スクロビバルブラ・アブソルタ(*Scrobipalpula absoluta*)、バクガ(シトトロガ・セラレラ(*Sitotroga cerealella*))、テングハマキ(スパルガノチス・ピレリアナ(*Sparganothis pilleriana*))、ツマジロクサヨトウ(スポドプテラ・フルギペルダ(*Spodoptera frugiperda*))、アフリカヨトウ(スポドプテラ・リットラリス(*Spodoptera littoralis*))、ハスモンヨトウ(スポドプテラ・リツラ(*Spodoptera litura*))、タウマトポエア・ピチオカンパ(*Thaumatopoea pityocampa*)、トルトリキス・ピリダナ(*Tortrix viridana*)、イラクサギンウワバ(トリコプルシア・ニ(*Trichoplusia ni*))、およびゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*) ;

鞘翅類(鞘翅目) : 例えば、アカバナガタマムシ(アグリルス・シヌアツス(*Agrilus sinuatus*))、アグリオテス・リネアツス(*Agriotes lineatus*)、アグリオテス・オブスクルス(*Agriotes obscurus*)、アンフィマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスパル(*Anisandrus dispar*)、ワタミハナゾウムシ(アントノムス・グランジス(*Anthonomus grandis*))、ナシハナゾウムシ(アントノムス・ボモルム(*Anthonomus pomorum*))、アフトナ・ユーホリダエ(*Aphthona euphoridae*)、ツヤハダコメツキムシ(アトウス・ヘモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*))、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、ブラストファグス・ピニペルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダータ(*Blitophaga undata*)、ソラマメゾウムシ(ブルクス・ルフイマヌス(*Bruchus rufimanus*))、エンドウマメゾウムシ(ブルクス・ピソルム(*Bruchus pisorum*))、ブルクス・レンチス(*Bruchus lentis*)、ドロハマキチョッキリ(ビクチスクス・ベツラ(*Byctiscus betulae*))、カメノコハムシ(カッシダ・ネブロサ(*Cassida nebulosa*))、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、キンイロハナムグリ(セトニア・アウラタ(*Cetonia aurata*))、コイトリンクス・アッシミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、コイトリンクス・ナピ(*Ceuthorrhynchus napi*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、コノデルス・ベスペルチヌス(*Conoderus vespertinus*)、クリオセリス・アスパラギ(*Crioceris asparagi*)、クテニセラ科の種(*Ctenicera* ssp.)、ジアプロチカ・

10

20

30

40

50

ロンギコルニス(*Diabrotica longicornis*)、ジアブロチカ・セミプンクタタ(*Diabrotica semipunctata*)、ジアブロチカ・12-プンクタタ(*Diabrotica 12-punctata*)、ジアブロチカ・スペシオサ(*Diabrotica speciosa*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ(*Diabrotica virgifer*)、インゲンテントウ(エピラクナ・パリベスチス(*Epilachna varivestis*))、エピトリキス・ヒルチペンニス(*Epitrix hirtipennis*)、ユーチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、マツアナアキゾウムシ(ヒルオビウス・アビエチス(*Hyllobius abietis*))、ヒペラ・ブルンネイペンニス(*Hypera brunneipennis*)、アルファルフアタコゾウムシ(ヒペラ・ポスチカ(*Hypera postica*))、ヤツバキクイ(イプス・チボグラフィス(*Ips typographus*))、レマ・ビリネアタ(*Lema bilineata*)、レマ・メラノプス(*Lema melanopus*)、コロラドハムシ(レプチノタルサ・デセムリネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*))、リモニウス・カリホルニクス(*Limonius californicus*)、イネミズゾウムシ(リッソロプトルス・オリゾフィルス(*Lissorhoptrus oryzophilus*))、メラノツス・コムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、メロロンタ・ヒッポカスタニ(*Melolontha hippocastani*)、ヨーロッパコフキコガネ(メロロンタ・メロロンタ(*Melolontha melolontha*))、イネクビホソハムシ(オウレマ・オリザエ(*Oulema oryzae*))、オルチオリンクス・スルカツス(*Ortiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オパツス(*Otiorrhynchus ovatus*)、ファエドン・コクレアリエ(*Phaedon cochleariae*)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロトレタ・クリソセファラ(*Phyllotreta chrysocephala*)、コガネムシ科の種(フィロファガ sp. (*Phyllophaga* sp.))、フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、キスジノミハムシ(フィロトレタ・ネモルム(*Phyllotreta nemorum*))、キスジノミハムシ(フィロトレタ・ストリオラタ(*Phyllotreta striolata*))、マメコガネ(ポピリア・ジャポニカ(*Popillia japonica*))、アカアシチビコフキゾウムシ(シトナ・リネアツス(*Sitona lineatus*))、およびシトフィルス・グラナリア(*Sitophilus granaria*) ;

ハエ、カ類(双翅目)、例えば、ネッタイシマカ(アエデス・アエギブチ(*Aedes aegypti*))、ヒトスジシマカ(アエデス・アルボピクツス(*Aedes albopictus*))、キンイロヤブカ(アエデス・ベキサンス(*Aedes vexans*))、アナストレファ・ルデンス(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペンニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルシアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、ガンビエハマダラカ(アノフェレス・ガンビエ(*Anopheles gambiae*))、アノフェレス・フレエボルニ(*Anopheles freeborni*)、ハマダラカ(アノフェレス・ロイコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*))、コガタハマダラカ(アノフェレス・ミニムス(*Anopheles minimus*))、アノフェレス・クアドリマクラツス(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(カリホラ・ビシナ(*Calliphora vicina*))、チチュウカイミバエ(セラチチス カピタータ(*Ceratitis capitata*))、クリソミア・ベッジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラキス(*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マセラリア(*Chrysomya macellaria*)、サシバエ(クリソプス・ジスカリス(*Chrysops discalis*))、クリソプス・シラセア(*Chrysops silacea*)、クリソプス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、ラセンウジバエ(コクリオミア・ホミニボラキス(*Cochliomyia hominivorax*))、ソルガムタマバエ(コンタリニア・ソルジヒコラ(*Contarinia sorghicola*))、ヒトクイバエ(コルジルオビア・アントロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*))、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、アカイエカ(クレックス・ピピエンス(*Culex pipiens*))、クレックス・ニグリバルプス(*Culex nigripalpus*)、ネッタイエカ(クレックス・キンクファシアツス(*Culex quinquefasciatus*))、コガタアカイエカ(クレックス・タルサリス(*Culex tarsalis*))、クリセタ・イノルナタ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ウリミバエ(ダクス・ククルビタ(*Dacus cucurbitae*))、オリーブミバエ(ダクス・オレア(*Dacus oleae*))、ダシネウラ・ブラッシカ(*Dasineura brassicae*)、デリア・アンチーク(*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ(*Delia coarctata*)、タネバエ(デリア・ブラツラ(*Delia platura*))、デリア・ラディカム(*Delia radicum*)、ヒトヒフバエ(デルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*))、ヒメイエバエ(ファンニア・カニクラリス(*Fannia canicularis*))、ゲ

10

20

30

40

50

オマイザ・トリブクタタ(*Geomyza Tripunctata*)、ウマバエ(*ガステロフィルス・インテスチナリス*(*Gasterophilus intestinalis*))、ツェツェバエ(*グロッシナ・モルシタンス*(*Glossina morsitans*))、*グロッシナ・パルパリス*(*Glossina palpalis*)、*グロッシナ・フスシペス*(*Glossina fuscipes*)、*グロッシナ・タキノイデス*(*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ(*ハエマトビア・イリタンス*(*Haematobia irritans*))、*ハプロジプロシス・エクエストリス*(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス科の種(*Hippelates* spp.)、*ヒルエミイア・プラツラ*(*Hylemyia platura*)、*ヒポデルマ・リネアタ*(*Hypoderma lineata*)、*レプトコノプス・トレンス*(*Leptoconops torrens*)、*トマトハモグリバエ*(*リリオマイザ・サチベ*(*Liriomyza sativae*))、*マメハモグリバエ*(*リリオマイザ・トリホリイ*(*Liriomyza trifolii*))、*ルシリア・カブリナ*(*Lucilia caprina*)、*ヒツジキンバエ*(*ルシリア・クブリナ*(*Lucilia cuprina*))、*ヒロズキンバエ*(*ルシリア・セリカタ*(*Lucilia sericata*))、*リコリア・ペクトラリス*(*Lycoria pectoralis*)、*マンソニア・チチラヌス*(*Mansonia titillanus*)、*ヘシアンバエ*(*マイエチオラ・デストルクトル*(*Mayetiola destructor*))、*ムスカ・オータムナリス*(*Musca autumnalis*)、*イエバエ*(*ムスカ・ドメスチカ*(*Musca domestica*))、*オオイエバエ*(*ムシナ・スタブラン*(*Muscina stabulans*))、*ヒツジバエ*(*オエストルス・オビス*(*Oestrus ovis*))、*オボミザ・フロルム*(*Opomyza florum*)、*オシネラ・フリット*(*Oscinella frit*)、*ペゴミア・ヒソシアミ*(*Pegomya hysocyami*)、*ホルビア・アンチクア*(*Phorbia antiqua*)、*ホルビア・ブラッシカ*(*Phorbia brassicae*)、*ホルビア・コアルクタタ*(*Phorbia coarctata*)、*サシチョウバエ*(*フレボトムス・アルゲンチペス*(*Phlebotomus argentipes*))、*プソロホラ・コロンビエ*(*Psorophora columbiae*)、*ニンジンサビバエ*(*プシラ・ロザエ*(*Psila rosae*))、*プソロホラ・ジスコロール*(*Psorophora discolor*)、*プロシムリウム・ミクスタム*(*Prosimulium mixtum*)、*ヨーロッパオウトウミバエ*(*ラゴレチス・セラシ*(*Rhagoletis cerasi*))、*リンゴミバエ*(*ラゴレチス・ポモネラ*(*Rhagoletis pomonella*))、*サルコファガ・ヘモロイダリス*(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、*ニクバエ科の種*(*サルコファガ* sp. (*Sarcophaga* sp.))、*シムリウム・ビッタツム*(*Simulium vittatum*)、*サシバエ*(*ストモキス・カルシトランス*(*Stomoxys calcitrans*))、*タバヌス・ボビヌス*(*Tabanus bovinus*)、*タバヌス・アトラツス*(*Tabanus atratus*)、*タバヌス・リネオラ*(*Tabanus lineola*)、*およびタバヌス・シミリス*(*Tabanus similis*)、*チブラ・オレラセア*(*Tipula oleracea*)、*およびガガンボ*(*チブラ・パルドサ*(*Tipula paludosa*)) ;

アザミウマ類(総翅目) : 例えば、*ジクロモトリプス・コルベッチ*(*Dichromothrips corbettii*)、*ジクロモトリプス科の種*(*Dichromothrips* spp.)、*フランクリニエラ・フスカ*(*Frankliniella fusca*)、*ミカンキイロアザミウマ*(*フランクリニエラ・オシデンタリス*(*Frankliniella occidentalis*))、*フランクリニエラ・トリチシ*(*Frankliniella tritici*)、*シルトトリプス・シトリ*(*Scirtothrips citri*)、*トリプス・オリザエ*(*Thrips oryzae*)、*ミナミキイロアザミウマ*(*トリプス・パルミ*(*Thrips palmi*))、*およびネギアザミウマ*(*トリプス・タバシ*(*Thrips tabaci*)) ;

シロアリ類(等翅目) : 例えば、*カロテルメス・フラビコリス*(*Caloterme flavicollis*)、*ロイコテルメス・フラビペス*(*Leucotermes flavipes*)、*ヘテロテルメス・アウレアス*(*Heterotermes aureus*)、*アメリカ東部地下シロアリ*(*レチクリテルメス・フラビペス*(*Reticulitermes flavipes*))、*アメリカ東南部地下シロアリ*(*レチクリテルメス・ビルギニクス*(*Reticulitermes virginicus*))、*地中海沿岸生息シロアリ*(*レチクリテルメス・ルシフグス*(*Reticulitermes lucifugus*))、*レチクリテルメス・サントネンシス*(*Reticulitermes san-tonensis*)、*レチクリテルメス・グラセイ*(*Reticulitermes grassei*)、*テルメス・ナタレンシス*(*Termes natalensis*)、*およびイエシロアリ*(*コプトテルメス・ホルモサヌス*(*Coptotermes formosanus*)) ;

ゴキブリ類(ゴキブリ目 - 網翅目) : 例えば、*チャバネゴキブリ*(*ブラッテラ・ゲルマニカ*(*Blattella germanica*))、*オキナワチャバネゴキブリ*(*ブラッテラ・アサヒネ*(*Blattella asahinae*))、*ワモンゴキブリ*(*ペリプラネタ・アメリカナ*(*Periplaneta americana*))、*ヤマトゴキブリ*(*ペリプラネタ・ジャポニカ*(*Periplaneta japonica*))、*トビイロゴキブリ*(*ペリプラネタ・ブルンネア*(*Periplaneta brunnea*))、*クロゴキブリ*(*ペリプラネタ・フリ*

ギノサ(*Periplaneta fuliginosa*))、コワモンゴキブリ(ペリプラネタ・アウストララシエ(*Periplaneta australasiae*))、およびトウヨウゴキブリ(ブラッタ・オリエンタリス(*Blattea orientalis*)) ;

ナンキンムシ、アブラムシ、ヨコバイ、コナジラミ、カイガラムシ、セミ(半翅目)、例えば、アオクサカメムシ(アクロステルヌム・ヒラレ(*Acrosternum hilare*))、アメリカコバネナガカメムシ(ブリスス・ロイコプテルス(*Blissus leucopterus*))、シルトペルチス・ノタツス(*Cyrtopeltis notatus*)、アカホシカメムシ(ジスデルクス・シングラツス(*Dysdercus cingulatus*))、ジスデルクス・インテルメジウス(*Dysdercus intermedius*)、ムギチャイロカメムシ(ユリガステル・インテグリセプス(*Eurygaster integriceps*))、ユスキスツス・インピクチベントリス(*Euschistus impictiventris*)、レプトグロッシス・フィロプス(*Leptoglossus phyllopus*)、サビイロカスミカメ(リグス・リネオラリス(*Lygus lineolaris*))、リグス・プラテンシス(*Lygus pratensis*)、ミナミアオカメムシ(ネザラ・ビリズラ(*Nezara viridula*))、ピエスマ・クアドラタ(*Piesma quadrata*)、ソルベア・インストラリス(*Solubea insularis*)、チアンタ・ペルジトル(*Thyanta perditor*)、アシルトシホン・オノブリキス(*Acyrtosiphon onobrychis*)、カラマツカサアブラムシ(アデルゲス・ラリシス(*Adelges laricis*))、アフイズラ・ナスツルチイ(*Aphidula nasturtii*)、マメクロアブラムシ(アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*))、イチゴネアブラムシ(アフィス・ホルベシ(*Aphis forbesii*))、ヨーロッパリンゴアブラムシ(アフィス・ポミ(*Aphis pomi*))、ワタアブラムシ(アフィス・ゴシピイ(*Aphis gossypii*))、アフィス・グロスラリア(*Aphis grossulariae*)、アフィス・スクネイデリ(*Aphis schneideri*)、ユキヤナギアブラムシ(アフィス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*))、ニワトコアブラムシ(アフィス・サンブシ(*Aphis sambuci*))、エンドウヒゲナガアブラムシ(アシルトシホン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*))、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(オーラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum solani*))、シルバーリーフコナジラミ(ベミサ・アルゲンチホリイ(*Bemisa argentifoliae*))、ブラキカウズス・カルズイ(*Brachycaudus cardui*)、ムギワラギクオマルアブラムシ(ブラキカウズス・ヘリクリシ(*Brachycaudus helichrysi*))、ブラキカウズス・ペルシカ(*Brachycaudus persicae*)、ブラキカウズス・ブルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ダイコンアブラムシ(ブレビコリン・ブラッシカ(*Brevicoryne brassicae*))、カピトホルス・ホルニ(*Capitophorus horni*)、セロシファ・ゴシピイ(*Cerosiphia gossypii*)、イチゴケナガアブラムシ(カエトシホン・フラガエホリイ(*Chaetosiphon fragaefoliae*))、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、ドレイフシア・ノルドマンニアナ(*Dreyfusia normanniana*)、ドレイフシア・ピセア(*Dreyfusia piceae*)、ギシギシネアブラムシ(ジサフィス・ラジコラ(*Dysaphis radicola*))、ジサウラコルツム・プソイドソラニ(*Dysaulacorthum pseudosolani*)、パラリンゴアブラムシ(ジサフィス・プランタギネア(*Dysaphis plantaginea*))、ジサフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、ジャガイモヒメヨコバイ(エンポアスカ・ファバエ(*Empoasca fabae*))、モモコフキアブラムシ(ヒアロプテルス・ブルニ(*Hyalopterus pruni*))、チシャミドリアブラムシ(ヒペロミズス・ラクツカエ(*Hyperomyzus lactucae*))、ムギヒゲナガアブラムシ(マクロシフム・アベナエ(*Macrosiphum avenae*))、チューリップヒゲナガアブラムシ(マクロシフム・ユーホルビエ(*Macrosiphum euphorbiae*))、マクロシホン・ロサエ(*Macrosiphon rosae*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ(メゴウラ・ビシエ(*Megoura viciae*))、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyraeae*)、ムギウスイロアブラムシ(メトポロフィウム・ジロズム(*Metopolophium dirhodum*))、ミゾデス・ペルシカエ(*Myzodes persicae*)、ミズス・アスカロニクス(*Myzus ascalonicus*)、ニワウメクロコブアブラムシ(ミズス・セラシ(*Myzus cerasi*))、カワリコブアブラムシ(ミズス・バリアンズ(*Myzus varians*))、レタスアブラムシ(ナソノビア・リビスニグリ(*Nasonovia ribisnigri*))、トビイロウンカ(ニラパルパタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*))、ペンフィグス・ブルサリウス(*Pemphigus bursarius*)、クロフツノウンカ(ペルクンシエラ・サッカリシダ(*Perkinsiella saccharicida*))、ホップイボアブラムシ(ホロドン・フムリ(*Phorodon humuli*))、リンゴキジラミ(プシルラ・マリ(*Psylla mali*))、プシルラ・ピリ(*Psylla pyri*)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、トウモロコシアブラ

10

20

30

40

50

ムシ(ロパロシフム・マイジス(*Rhopalosiphum maidis*)), ムギクビレアブラムシ(ロパロシフム・パジ(*Rhopalosiphum padi*)), ロパロシフム・インセルツム(*Rhopalosiphum insertum*), サッパフィス・マラ(*Sappaphis mala*), サッパフィス・マリ(*Sappaphis mali*), ムギミドリアブラムシ(スチザフィス・グラミヌム(*Schizaphis graminum*)), スチゾネウラ・ラヌギノサ(*Schizoneura lanuginosa*), ムギヒゲナガアブラムシ(シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)), オンシツコナジラミ(トリアロイロデス・バボラリオルム(*Triaurodes vaporariorum*)), コミカンアブラムシ(トキシソプテラ・オーランチイ(*Toxoptera aurantii*)), およびブドウネアブラムシ(ビテウス・ビチホリイ(*Viteus vitifolii*)), トコジラミ(シメクス・レクツラリウス(*Cimex lectularius*)), ナンキンムシ(シメクス・ヘミプテルス(*Cimex hemipterus*)), レズビウス・セニリス(*R^eduvius senilis*)), サシガメ科の種(トリアトマ spp. (*Triatoma* spp.)), およびア rilus・クリタツス(*Arilus critatus*);

10

アリ、ミツバチ、スズメバチ、ハバチ類(膜翅目)、例えば、カブラハバチ(アタリア・ロサエ(*Athalia rosae*)), ハキリアリ(アッタ・セファロテス(*Atta cephalotes*)), アッタ・カピグアラ(*Atta capiguara*), ハキリアリ(アッタ・セファロテス(*Atta cephalotes*)), アッタ・ラエビガタ(*Atta laevigata*), アッタ・ロボスタ(*Atta robusta*), チャイロハキリアリ(アッタ・セキスデンス(*Atta sexdens*)), テキサスハキリアリ(アッタ・テキサナ(*Atta texana*)), シリアゲアリ科の種(クレマトガステル spp. (*Crematogaster* spp.)), ホプロカンパ・ミヌタ(*Hoplocampa minuta*), ホプロカンパ・テスツジネア(*Hoplocampa testudinea*)), トビイロケアリ(ラシウス・ニゲル(*Lasius niger*)), イエヒメアリ(モノモリウム・ファラオニス(*Monomorium pharaonis*)), アカカミアリ(ソレノプシス・ゲミナタ(*Solenopsis geminata*)), ヒアリ(ソレノプシス・インビクタ(*Solenopsis invicta*)), ソレノプシス・リクテリ(*Solenopsis richteri*), ソレノプシス・キシロニ(*Solenopsis xyloni*)), アカシュウカクアリ(ポゴノミルメックス・バルバツス(*Pogonomyrmex barbatus*)), ポゴノミルメックス・カリホルニクス(*Pogonomyrmex californicus*)), ツヤオオツアリ(フェイドール・メガセファーラ(*Pheidole megacephala*)), アリモドキバチ(ダシムチラ・オッシデンタリス(*Dasymutilla occidentalis*)), マルハナバチ科の種(ボンブス spp. (*Bombus* spp.)), ベスブラ・スクアモサ(*Vespula squamosa*), パラベスブラ・ブルガリス(*Paravespula vulgaris*), パラベスブラ・ペンシルバニカ(*Paravespula pennsylvanica*), パラベスブラ・ゲルマニカ(*Paravespula germanica*), クロスズメバチ(ドリコベスブラ・マクラタ(*Dolichovespula maculata*)), モンスズメバチ(ベスバ・クラブロ(*Vespa crabro*)), ポリステス・ルビギノサ(*Polistes rubiginosa*), カンボノツス・フロリダヌス(*Camponotus floridanus*), およびアルゼンチンアリ(リネピテマ・フミル(*Linepithema humile*));

20

30

コオロギ、バッタ、イナゴ類(直翅類)、例えば、ヨーロツパイエコオロギ(アケタ・ドメスチカ(*Acheta domestica*)), グリルロタルパ・グリルロタルパ(*Gryllotalpa gryllotalpa*), トノサマバッタ(ロクスタ・ミグラトリア(*Locusta migratoria*)), メラノブルス・ビビッタツス(*Melanoplus bivittatus*)), メラノブルス・フェムルブルム(*Melanoplus femurrubrum*)), メラノブルス・メキシカヌス(*Melanoplus mexicanus*)), メラノブルス・サンガイニペス(*Melanoplus sanguinipes*)), メラノブルス・スプレツス(*Melanoplus spretus*)), アカトビバッタ(ノマダクリス・セプテンファシアタ(*Nomadacris septemfasciata*)), アメリカイナゴ(スキストセルカ・アメリカナ(*Schistocerca americana*)), サバクトビバッタ(スキストセルカ・グレガリア(*Schistocerca gregaria*)), モロッコイナゴ(ドシオスタウルス・マロッカヌス(*Dociostaurus maroccanus*)), クラズミウマ(タキシネス・アシナモルス(*Tachycines asynamorus*)), オエダロイス・セネガレンシス(*Oedaleus senegalensis*)), ゾノゼルス・パリエガツス(*Zonozelus variegatus*)), ヒエログリフス・ダガネンシス(*Hieroglyphus daganensis*)), クラウッサリア・アングリフェラ(*Kraussaria angulifera*)), カリプタムス・イタリクス(*Calliptamus italicus*)), オーストラリア群れバッタ(コルトイセテス・テルミニフェラ(*Chortoicetes terminifera*)), およびブラウンイナゴ(ロクスタナ・パルダリナ(*Locustana pardalina*));

40

50

蛛形類(Arachnoidea)、例えばダニ類(ダニ目)、例えば、ヒメダニ科(Argasidae)、マダニ科(Ixodidae)、およびヒゼンダニ科(Sarcoptidae)のもの、例えば、アメリカキラマダニ(アンブリオンマ・アメリカヌム(Amblyomma americanum))、アンブリオンマ・バリエガツム(Amblyomma variegatum)、アンブリオンマ・マクラツム(Amblyomma maculatum)、アルガス・ベルシクス(Argas persicus)、ボオフィルス・アンヌラツス(Boophilus annulatus)、ボオフィルス・デコロラツス(Boophilus decoloratus)、オウシマダニ(ボオフィルス・ミクロプルス(Boophilus microplus))、デルマセントル・シルバルム(Dermacentor silvarum)、デルマセントル・アンデルソニ(Dermacentor andersoni)、アメリカイヌカクダニ(デルマセントル・パリアピリス(Dermacentor variabilis))、ヒアロンマ・トルンカツム(Hyalomma truncatum)、タネガタマダニ(イキシソデス・リシヌス(Ixodes ricinus))、イキシソデス・ルビクンズス(Ixodes rubicundus)、クロアシマダニ(イキシソデス・スカブラリス(Ixodes scapularis))、オーストラリアマダニ(イキシソデス・ホロシクルス(Ixodes holocyclus))、西部クロアシマダニ(イキシソデス・パシフィクス(Ixodes pacificus))、オルニトドルス・モウバタ(Ornithodoros moubata)、オルニトドルス・ヘルムシ(Ornithodoros hermsi)、オルニトドルス・ツリカタ(Ornithodoros turicata)、イエダニ(オルニトニッスス・パコチ(Ornithonyssus bacoti))、オトビウス・メグニニ(Otobius megnini)、ワクモ(デルマニッスス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae))、ヒツジキュウセンヒゼンダニ(プソロプテス・オビス(Psoroptes ovis))、タリイロコイタマダニ(リピセファルス・サンガイネウス(Rhipicephalus sanguineus))、コイタマダニ(リピセファルス・アッペンジクラツス(Rhipicephalus appendiculatus))、リピセファルス・エベルトシ(Rhipicephalus evertsi)、ヒゼンダニ(サルコプテス・スカビエイ(Sarcoptes scabiei))、ならびにフシダニ科の種(Eriophyidae spp.)、例えば、リンゴサビダニ(アクルス・スクレクテンダリ(Aculus schlechtendali))、フィロコプトラタ・オレイボラ(Phyllocoptrata olivora)、およびエリオフィエス・シェルドニ(Eriophyes sheldoni)；ホコリダニ科の種(Tarsonemidae spp.)、例えば、シクラメンホコリダニ(フィトネムス・パリズス(Polyphagotarsonemus latus))；ヒメハダニ科の種(Tenuipalpidae spp.)、例えば、ミナミヒメハダニ(ブレビパルプス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis))；ハダニ科の種(Tetranychidae spp.)、例えば、ニセナミハダニ(テトラニクス・シンナバリヌス(Tetranychus cinnabarinus))、カンザワハダニ(テトラニクス・カンザワイ(Tetranychus kanzawai))、オウトウハダニ(テトラニクス・パシフィクス(Tetranychus pacificus))、ニセナミハダニ(テトラニクス・テラリウス(Tetranychus telarius))、およびナミハダニ(テトラニクス・ウルチカエ(Tetranychus urticae))、リンゴハダニ(パノニクス・ウルミ(Panonychus ulmi))、ミカンハダニ(パノニクス・シトリ(Panonychus citri))、およびオリゴニクス・プラテンシス(oligonychus pratensis)；真正クモ目、例えば、クロゴケグモ(ラトロデクツス・マクタンズ(Latrodectus mactans))、およびドクイトグモ(ロキソセレス・レクルサ(Loxosceles reclusa))；

10

20

30

ノミ(ノミ(隠翅)目(Siphonaptera))、例えば、ネコノミ(クテノセファリデス・フェリス(Ctenocephalides felis))、イヌノミ(クテノセファリデス・カニス(Ctenocephalides canis))、ケオプスネズミノミ(キセノプシラ・ケオプシス(Xenopsylla cheopsis))、ヒトノミ(プレックス・イリタンズ(Pulex irritans))、スナノミ(ツンガ・ペネトランス(Tunga penetrans))、およびヨーロッパネズミノミ(ノソプシルルス・ファシアツス(Nosopsyllus fasciatus))；

40

シミ、マダラシミ(総尾目)、例えば、セイヨウシミ(レピスマ・サッカリナ(Lepisma saccharina))およびマダラシミ(テルモビア・ドメスチカ(Thermobia domestica))；

ムカデ(唇脚綱)、例えば、イエムカデ(スクチゲラ・コレオプトラタ(Scutigera coleoptrata))；

ヤスデ(倍脚綱)、例えば、ナルセウス科の種(Narceus spp.)；

ハサミムシ(革翅目)、例えば、ヨーロップクギヌキハサミムシ(ホルフィクラ・アウリクラリア(forficula auricularia))；

50

シラミ(シラミ目)、例えば、アタマジラミ(ペジクルス・ヒューマヌス・カピチス(*Pediculus humanus capitis*))、コロモジラミ(ペジクルス・ヒューマヌス・コルポリス(*Pediculus humanus corporis*))、ケジラミ(プチルス・プビス(*Pthirus pubis*))、ウシジラミ(ヘマトピヌス・ユーリステルヌス(*Haematopinus eurysternus*))、ブタジラミ(ヘマトピヌス・スイス(*Haematopinus suis*))、ウシホソジラミ(リノグナツス・ビツリ(*Linognathus vituli*))、ウシハジラミ(ボビコラ・ボビス(*Bovicola bovis*))、ニワトリハジラミ(メノポン・ガリナエ(*Menopon gallinae*))、ニワトリオオハジラミ(メナカンツス・ストラミネウス(*Menacanthus stramineus*))、およびケブカウシジラミ(ソレノポテス・カピラツス(*Solenopotes capillatus*)) ;

トビムシ(トビムシ目) : 例えば、トビムシ科の種(オニキウルス ssp. (*Onychiurus* ssp.))。 10

【 0 1 2 7 】

また、これらは以下の線虫類の防除にも適している : 植物寄生線虫、例えば、ネコブセンチュウ類(*root knot nematodes*)のキタネコブセンチュウ(メロイドギネ・ハブラ(*Meloidogyne hapla*))、サツマイモネコブセンチュウ(メロイドギネ・インコグニタ(*Meloidogyne incognita*))、ジャワネコブセンチュウ(メロイドギネ・ジャバニカ(*Meloidogyne javanica*))、および他のメロイドギネ(*Meloidogyne*)の種 ; シストセンチュウ類(*cyst-forming nematodes*)のジャガイモシストセンチュウ(グロボデラ・ロストキエンシス(*Globodera rostochiensis*))、および他のグロボデラ(*Globodera*)の種 ; ムギシストセンチュウ(ヘテロデラ・アベナエ(*Heterodera avenae*))、ダイズシストセンチュウ(ヘテロデラ・グリシネス(*Heterodera glycines*))、テンサイシストセンチュウ(ヘテロデラ・スカクチイ(*Heterodera schachtii*))、クローバシストセンチュウ(ヘテロデラ・トリホリイ(*Heterodera trifolii*))、および他のヘテロデラ (*Heterodera*)の種 ; 種子虫コブセンチュウ類(*Seed gall nematodes*)のアングイナ(*Anguina*)の種 ; クキおよびハセンチュウ類(*Stem and foliar nematodes*)のアフェレンコイデス(*Aphelenchoides*)の種 ; 刺毛センチュウ類(*Sting nematodes*)のブドウオオハリセンチュウ(ベロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*))、および他のベロノライムス(*Belonolaimus*)の種 ; マツセンチュウ類(*Pine nematodes*)のマツノザイセンチュウ(ブルサフェレンクス・キシロフィルス(*Bursaphelenchus xylophilus*))および他のブルサフェレンクス(*Bursaphelenchus*)の種 ; ワセンチュウ類(*Ring nematodes*)のクリコネマ(*Criconema*)の種、クリコネメラ(*Criconemella*)の種、 30
クリコネモイデス(*Criconemoides*)の種、メソクリコネマ(*Mesocriconema*)の種 ; クキおよびリンケイセンチュウ類(*Stem and bulb nematodes*)のイモグサレセンチュウ(ジチレンクス・デストルクター(*Ditylenchus destructor*))、ナミクキセンチュウ(ジチレンクス・ジブサシ(*Ditylenchus dipsaci*))、および他のジチレンクス(*Ditylenchus*)の種 ; 突錐センチュウ類(*Awl nematodes*)のドリコドルス(*Dolichodorus*)の種 ; ラセンセンチュウ類(*Spiral nematodes*)のヘリオコチレンクス・ムルチシンクツス(*Helicotylenchus multicinctus*)、および他のヘリオコチレンクス(*Helicotylenchus*)の種 ; 鞘センチュウおよび有鞘センチュウ類(*Sheath and sheathoid nematodes*)のヘミシクリオホラ(*Hemicycliophora*)の種およびヘミクリコネモイデス(*Hemicriconemoides*)の種 ; ヒルスマンニエラ(*Hirshmanniella*)の種 ; ヤリセンチュウ類(*Lance nematodes*)のホプロアイムス(*Hoploaimus*)の種 ; ニセネコブセンチュウ類(*false rootknot nematodes*)のナコブス(*Nacobbus*)の種 ; ハリセンチュウ類(*Needle nematodes*)のロンギドルス・エロンガテス(*Longidorus elongates*)および他のロンギドルス(*Longidorus*)種 ; ネグサレセンチュウ類(*Lesion nematodes*)のプラチレンクス・ネグレクツス(*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ(プラチレンクス・ペネトランス(*Pratylenchus penetrans*))、ピンセンチュウ(プラチレンクス・クルビタツス(*Pratylenchus curvatus*))、プラチレンクス・ゴージェイ(*Pratylenchus good eyi*)、および他のプラチレンクス(*Pratylenchus*)の種 ; ネモグリセンチュウ類(*Burrowing nematodes*)のパナナネモグリセンチュウ(ラドホルス・シミリス(*Radopholus similis*))および他のラドホルス(*Radopholus*)の種 ; ニセフクロセンチュウ類(*Reniform nematodes*)のロチレンクス・ロボスツス(*Rotylenchus robustus*)および他のロチレンクス(*Rotylench* 40 50

us)の種；スクテロネマ(*Scutellonema*)の種；ユミハリセンチュウ類(*Stubby root nematodes*)のトリコドルス・プリミチプス(*Trichodorus primitivus*)および他のトリコドルス(*Trichodorus*)の種、パラトリコドルス(*Paratrichodorus*)の種；イシュクセンチュウ類(*Stunt nematodes*)のナミイシュクセンチュウ(チレンコリンクス・クライトニ(*Tylenchorhynchus claytoni*))、チレンコリンクス・ズビウス(*Tylenchorhynchus dubius*)および他のチレンコリンクス(*Tylenchorhynchus*)の種；ミカンセンチュウ類(*Citrus nematodes*)のチレンクルス(*Tylenchulus*)の種；オオハリセンチュウ類(*Dagger nematodes*)のキシフィネマ(*Xiphinema*)の種；ならびに他の植物寄生線虫の種。

【 0 1 2 8 】

式Iで表される化合物は、昆虫、好ましくは吸汁性昆虫または刺咬性昆虫(例えば、総翅類、膜翅類、直翅類および半翅類の種類から選択される昆虫)、特に以下の種の防除に特に有用である：

総翅類(アザミウマ科)：フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、ミカンキイロアザミウマ(フランクリニエラ・オシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*))、フランクリニエラ・トリチシ(*Frankliniella tritici*)、シルトトリプス・シトリ(*Scirtothrips citri*)、トリプス・オリザエ(*Thrips oryzae*)、ミナミキイロアザミウマ(トリプス・パルミ(*Thrips palmi*))、およびネギアザミウマ(トリプス・タバシ(*Thrips tabaci*))；

膜翅類：カブラハバチ(アタリア・ロサエ(*Athalia rosae*))、ハキリアリ(アッタ・セファロテス(*Atta cephalotes*))、チャイロハキリアリ(アッタ・セキスデンス(*Atta sexdens*))、テキサスハキリアリ(アッタ・テキサナ(*Atta texana*))、ホプロカンパ・ミヌタ(*Hoplocampa minuta*)、ホプロカンパ・テスツジネア(*Hoplocampa testudinea*)、イエヒメアリ(モノモリウム・ファラオニス(*Monomorium pharaonis*))、アカカミアリ(ソレノプシス・ゲミナタ(*Solenopsis geminata*))、およびヒアリ(ソレノプシス・インビクタ(*Solenopsis invicta*))；

直翅類：ヨーロッパイエコオロギ(アケタ・ドメスチカ(*Acheta domestica*))、トウヨウゴキブリ(ブラッタ・オリエンタリス(*Blatta orientalis*))、チャバネゴキブリ(ブラッテラ・ゲルマニカ(*Blattella germanica*))、クギヌキハサミムシ(ホルフィクラ・アウリクラリア(*Forficula auricularia*))、グリルロタルパ・グリルロタルパ(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、トノサマバッタ(ロクスタ・ミグラトリア(*Locusta migratoria*))、メラノブルス・ビピッタツス(*Melanoplus bivittatus*)、メラノブルス・フェムルブルム(*Melanoplus femurrubrum*)、メラノブルス・メキシカヌス(*Melanoplus mexicanus*)、メラノブルス・サングイニペス(*Melanoplus sanguinipes*)、メラノブルス・スプレツス(*Melanoplus spretus*)、アカトビバッタ(ノマダクリス・セプテンファシアタ(*Nomadacris septemfasciata*))、ワモンゴキブリ(ペリプラネタ・アメリカナ(*Periplaneta americana*))、アメリカイナゴ(スキストセルカ・アメリカナ(*Schistocerca americana*))、スキストセルカ・ペレグリナ(*Schistocerca peregrina*)、スタウロノツス・マロッカヌス(*Stauronotus maroccanus*)、およびクラズミウマ(タキシネス・アシナモルス(*Tachycines asynamorus*))；

半翅類、特にアブラムシ：アシルトシホン・オノブリキス(*Acyrtosiphon onobrychis*)、カラマツカサアブラムシ(アデルゲス・ラリシス(*Adelges laricis*))、アフィズラ・ナスツルチイ(*Aphidula nasturtii*)、マメクロアブラムシ(アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*))、イチゴネアブラムシ(アフィス・ホルベシ(*Aphis forbesii*))、ヨーロッパリンゴアブラムシ(アフィス・ポミ(*Aphis pomi*))、ワタアブラムシ(アフィス・ゴシピイ(*Aphis gossypii*))、アフィス・グロスラリア(*Aphis grossulariae*)、アフィス・スクネイデリ(*Aphis schneideri*)、ユキヤナギアブラムシ(アフィス・スピラエコラ(*Aphis spiraeicola*))、ニワトコアブラムシ(アフィス・サンブシ(*Aphis sambuci*))、エンドウヒゲナガアブラムシ(アシルトシホン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*))、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(オーラコルツム・ソラニ(*Aulacorthum solani*))、ブラキカウズス・カルズイ(*Brachycaudus cardui*)、ムギワラギクオマルアブラムシ(ブラキカウズス・ヘリクリシ(*Brachycaudus helichrysi*))、ブラキカウズス・ペルシカ(*Brachycaudus persicae*)、ブラキカウズス・ブルニコラ(*Brachycaudus prunicola*)、ダイコンアブラムシ(ブレピコリン・ブラッシカ(*Bre*

vicoryne brassicae)), カピトホルス・ホルニ (Capitophorus horni)、セロシファ・ゴシパイ (Cerosipha gossypii)、イチゴケナガアブラムシ(カエトシホン・フラガエホリイ (Chaetosiphon fragaefolii))、クリプトミズス・リビス (Cryptomyzus ribis)、ドレイフシア・ノルドマンニアナ (Dreyfusia nordmanniana)、ドレイフシア・ピセア (Dreyfusia piceae)、ギシギシネアブラムシ(ジサフィス・ラジコラ (Dysaphis radicola))、ジサウラコルツム・プソイドソラニ (Dysaulacorthum pseudosolani)、バラリンゴアブラムシ(ジサフィス・プランタギネア (Dysaphis plantaginea))、ジサフィス・ピリ (Dysaphis pyri)、ジャガイモヒメヨコバイ (エンポアスカ・ファバエ (Empoasca fabae))、モモコフキアブラムシ(ヒアロプテルス・プルニ (Hyalopterus pruni))、チシャミドリアブラムシ(ヒペロミズス・ラクツカエ (Hyperomyzus lactucae))、ムギヒゲナガアブラムシ(マクロシフム・アベナエ (Macrosiphum avenae))、チューリップヒゲナガアブラムシ(マクロシフム・ユーホルビエ (Macrosiphum euphorbiae))、マクロシホン・ロサエ (Macrosiphon rosae)、ソラマメヒゲナガアブラムシ(メゴウラ・ビシエ (Megoura viciae))、メラナフィス・ピラリウス (Melanaphis pyrius)、ムギウスイロアブラムシ(メトポロフィウム・ジロズム (Metopolophium dirhodum))、ミゾデス・ペルシカエ (Myzodes persicae)、ミズス・アスカロニクス (Myzus ascalonicus)、ニワウメクロコブアブラムシ(ミズス・セラシ (Myzus cerasi))、カワリコブアブラムシ(ミズス・バリアンス (Myzus varians))、レタスアブラムシ(ナソノビア・リビスニグリ (Nasonovia ribisnigri))、トビイロウンカ(ニラパルバタ・ルゲンス (Nilaparvata lugens))、ペンフィグス・ブルサリウス (Pemphigus bursarius)、クロフツノウンカ(ペルキンシエラ・サッカリシダ (Perkinsiella saccharicida))、ホップイボアブラムシ(ホロドン・フムリ (Phorodon humuli))、リンゴキジラミ(プシルラ・マリ (Psylla mali))、プシルラ・ピリ (Psylla piri)、ロパロミズス・アスカロニクス (Rhopalosiphum ascalonicus)、トウモロコシアブラムシ(ロパロシフム・マイジス (Rhopalosiphum maidis))、ムギクビレアブラムシ(ロパロシフム・パジ (Rhopalosiphum padi))、ロパロシフム・インセルツム (Rhopalosiphum insertum)、サツパフィス・マラ (Sappaphis mala)、サツパフィス・マリ (Sappaphis mali)、ムギミドリアブラムシ(スチザフィス・グラミヌム (Schizaphis graminum))、スチゾネウラ・ラヌギノサ (Schizoneura lanuginosa)、ムギヒゲナガアブラムシ(シトビオン・アベナエ (Sitobion avenae)、オンシツコナジラミ(トリアロイロデス・パボラリオルム (Trialeurodes vaporariorum))、コミカンアブラムシ(トキソプテラ・オーランチイ (Toxoptera aurantii))、およびブドウネアブラムシ(ビテウス・ビチホリイ (Viteus vitifolii))。

【 0 1 2 9 】

式Iで表される化合物は、半翅類および総翅類の系列の昆虫の防除、さらに好ましくはアブラムシの防除に特に有用である。

【 0 1 3 0 】

製剤

化合物Iは、本発明による方法で使用するために、慣用の製剤、例えば液剤、エマルジョン剤、懸濁剤、散剤、粉剤、ペースト剤、粒剤および直接散布可能な液剤に変換することができる。使用剤形は、特定の目的および施用方法によって決まる。剤形および施用方法は、いずれの場合も、本発明による式Iで表される化合物の微細で均一な分散が確実になされるように選択する。

【 0 1 3 1 】

製剤は、公知の方法(例えば、概説についての米国特許第3,060,084号、EP-A 707 445 (液体濃縮物について)、Browning, 「Agglomeration」, Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147~48、Perry's Chemical Engineer's Handbook, 第4版, McGraw-Hill, New York, 1963, 8~57ページを参照されたい。またWO 91/13546、米国特許第4,172,714号、米国特許第4,144,050号、米国特許第3,920,442号、米国特許第5,180,587号、米国特許第5,232,701号、米国特許第5,208,030号、GB 2,095,558、米国特許第3,299,566号、Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961、Hanceら, Weed Control Handbook, 第8版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989、

ならびにMollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2、D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8)も参照されたい)で調製され、例えば、本活性化合物を農薬製剤に適した補助剤、例えば溶媒および/または担体と、所望の場合は乳化剤、界面活性剤および分散剤、防腐剤、消泡剤、不凍剤と一緒に、種子処理剤に関しては、さらに場合により着色剤および/または結合剤および/またはゲル化剤と一緒にのばして調製される。

【0132】

好適な溶媒/担体は、例えば以下のものである：

・ 溶媒、例えば、水、芳香族溶媒(例えば、Solvess製品、キシレンなど)、パラフィン類(例えば鉱物画分)、アルコール類(例えばメタノール、ブタノール、ペンタノール、ベンジルアルコール)、ケトン類(例えばシクロヘキサノン、 γ -ブチロラクトン)、ピロリドン類(N-メチル-ピロリドン(NMP)、N-オクチルピロリドン NOP)、アセテート類(二酢酸グリコール)、乳酸アルキル類、ラクトン類(例えば γ -ブチロラクトン)、グリコール類、脂肪酸ジメチルアミド類、脂肪酸および脂肪酸エステル類、トリグリセリド類、植物または動物由来の油および変性油(例えばアルキル化植物油)。基本的には、溶媒混合物も使用可能である。

10

【0133】

・ 担体、例えば、粉碎天然鉱物および粉碎合成鉱物、例えばシリカゲル、微粉ケイ酸、シリケート、タルク、カオリン、アタクレ、石灰石、石灰、チョーク、膠灰粘土、黄土、クレイ、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウムおよび硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、粉碎された合成材料、肥料、例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素および植物由来の製品、例えば、穀粉、樹皮粉、木粉および堅果殻粉、セルロース粉末、ならびに他の固体担体。

20

【0134】

好適な乳化剤は、非イオン性乳化剤およびアニオン性乳化剤(例えば、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、アルキルスルホネートおよびアリアルスルホネート)である。

【0135】

分散剤の例は、リグノ亜硫酸廃液およびメチルセルロースである。

30

【0136】

好適な界面活性剤は、リグノスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩およびアンモニウム塩、アリアルスルホン酸アルキル、硫酸アルキル、スルホン酸アルキル、硫酸脂肪アルコール、脂肪酸ならびに硫酸化脂肪アルコールグリコールエーテル、さらに、スルホン化ナフタレンおよびナフタレン誘導体とホルムアルデヒドの縮合物、ナフタレンまたはナフタレンスルホン酸とフェノールおよびホルムアルデヒドの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、オクチルフェノール、ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、トリステアリルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、アルコールおよび脂肪アルコール/エチレンオキシドの縮合物、エトキシ化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、エトキシ化ポリオキシプロピレン、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタール、ソルビトールエステルである。

40

【0137】

さらに不凍剤(例えば、グリセリン、エチレングリコール、プロピレングリコールなど)および殺菌剤なども本製剤に加えることができる。

【0138】

好適な消泡剤は、例えば、シリコンまたはステアリン酸マグネシウムをベースとした消泡剤である。

50

【0139】

好適な防腐剤は、例えばジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールである。

【0140】

好適な増粘剤は、製剤に偽塑性流動特性(すなわち、静止時に高粘度で、攪拌工程では低粘性)を与える化合物である。これに関しては、例えば、多糖類ベースの市販増粘剤、例えばXanthan Gum(登録商標)(Kelzan(登録商標)、Kelco製)、Rhodopol(登録商標)23(Rhone Poulenc)、もしくはVeegum(登録商標)(R.T.Vanderbilt製)など、または有機修飾されたフィロケイ酸塩類、例えばAttaclay(登録商標)(Engelhardt製)などを挙げることができる。本発明による分散剤に好適な消泡剤は、例えばシリコンエマルジョン(例えば、Silikon(登録商標)SRE、WackerもしくはRhodorsil(登録商標)、Rhodia製など)、長鎖アルコール、脂肪酸、有機フッ素化合物、およびこれらの混合物である。本発明による組成物を微生物の攻撃に対して安定化させるためには、殺生物剤を添加することができる。好適な殺生物剤は、例えば以下の商品名: Proxel(登録商標)(Avecia(もしくはArch)製)またはActicide(登録商標)RS(Thor Chemie製)およびKathon(登録商標)MK(Rohm & Haas製)で販売されている化合物などのイソチアゾロンをベースとするものである。好適な不凍剤は有機ポリオール類、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールまたはグリセロールである。これらは通常、活性化化合物組成物の総重量に対して10重量%以下の量で使用する。場合によっては、pHを調節するため、本発明による活性化化合物組成物に、製造する製剤の総重量に対して1~5重量%のバッファーを含ませてもよい。使用するバッファーの量およびタイプは、その活性化化合物または活性化化合物群の化学的特性によって決定する。バッファーの例は、無機もしくは有機の弱酸、例えばリン酸、ホウ酸、酢酸、プロピオン酸、クエン酸、フマル酸、酒石酸、シュウ酸およびコハク酸のアルカリ金属塩である。

10

20

【0141】

直接散布可能な液剤、エマルジョン剤、ペースト剤、またはオイル分散剤を製造するのに適している物質は、中~高沸点の鉱油画分、例えばケロシンまたはディーゼルオイル、さらにはコールタールオイル、および植物または動物由来の油、脂肪族、環状および芳香族炭化水素、例えばトルエン、キシレン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンもしくはその誘導体、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール、シクロヘキサノン、イソホロン、強極性溶剤、例えばジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドンおよび水である。

30

粉剤、広域散布用剤および散剤は、本活性物質と固体担体を混合するか、または同時に粉砕することによって製造することができる。

【0142】

粒剤(例えば、被覆粒剤(coated granule)、含浸粒剤(impregnated granule)および均質粒剤(homogeneous granule)など)は、本活性成分を固体担体に結合させることにより製造することができる。固体担体の例は、鉱物質土類(mineral earth)(例えばシリカゲル、シリケート、タルク、カオリン、アタクレー(attaclay)、石灰石、石灰、チョーク、膠灰粘土、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウムなど)、粉砕された合成材料、肥料(例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素など)、植物由来の製品(例えば、穀粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉など)、セルロース粉末、ならびに他の固体担体である。

40

【0143】

一般に、本製剤は、本活性成分を0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%含んでいる。本活性成分は、純度90%~100%、好ましくは95%~100%(NMRスペクトルによる)で用いる。

【0144】

目的が種子処理の場合、それぞれの製剤は2~10倍に希釈して、直ぐに使用可能な調製品の濃度の0.01~60(活性化化合物)重量%(好ましくは0.1~40重量%)とする。

【0145】

50

式Iで表される化合物は、散布(spraying)、噴霧(atomizing)、散粉(dusting)、広域散布(spreading)、または散水(pouring)により、そのまま、その製剤の形態で、または当該製剤から調製される施用の形態で、例えば直接散布可能な液剤、粉剤、懸濁剤もしくは分散剤、エマルジョン剤、オイル分散剤、ペースト剤、粉散性製品(dustable product)、広域散布用製品、または粒剤の形態で使用することができる。施用の形態は、もっぱらその意図する目的によって決まるが、いずれの場合も、本発明による活性化合物が確実に可能な限り微細に分散されるようなものであるべきである。

【0146】

以下は製剤の例である：

1. 水で希釈する製品。目的が種子処理の場合、かかる製品は、希釈して種子に施用してもよいし、希釈せずに施用することもできる。 10

【0147】

A) 液剤(water-soluble concentrates) (SL、LS)

10重量部の本活性化合物を90重量部の水または水溶性溶媒に溶解させる。別法として、湿潤剤または他の補助剤を添加する。本活性化合物は水で希釈すると溶解する。この方法で、活性化合物の含量が10% (w/w)である製剤が得られる。

【0148】

B) 分散製剤(dispersible concentrates) (DC)

20重量部の本活性化合物を、70重量部のシクロヘキサノンに10重量部の分散剤(例えば、ポリビニルピロリドン)を加えて溶解させる。水で希釈することにより分散液が得られる。これにより、活性化合物を20% (w/w)含む製剤が得られる。 20

【0149】

C) 乳剤(emulsifiable concentrates) (EC)

15重量部の本活性化合物を、7重量部のキシレンにドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレート(いずれも5重量部)を加えて溶解させる。水で希釈すると乳液が得られ、これにより、活性化合物を15% (w/w)含む製剤が得られる。

【0150】

D) エマルジョン製剤(emulsions) (EW、EO、ES)

25重量部の本活性化合物を、35重量部のキシレンにドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレート(いずれも5重量部)を加えて溶解させる。この混合物を、乳化装置(例えば、Ultraturrax)を用いて30重量部の水中に導入し、均質なエマルジョンとする。水で希釈すると乳液が得られる。これにより、活性化合物を25% (w/w)含む製剤が得られる。 30

【0151】

E) 懸濁製剤(suspensions) (SC、OD、FS)

攪拌下にあるボールミル内で、20重量部の本活性化合物に10重量部の分散剤、湿潤剤および70重量部の水または有機溶媒を添加して粉碎することにより、微細活性化合物懸濁液が得られる。水で希釈すると活性化合物の安定した懸濁液が得られる。これにより、活性化合物を20% (w/w)含む製剤が得られる。

【0152】

F) 顆粒水和剤(Water-dispersible granules)および顆粒水溶剤(Water-soluble granules) (WG、SG)

50重量部の本活性化合物に50重量部の分散剤および湿潤剤を添加して微粉碎し、専用の装置(例えば、押出機、噴霧塔、流動床など)を用いて顆粒水和剤または顆粒水溶剤とする。水で希釈すると活性化合物の安定な分散液または溶液が得られる。これにより、活性化合物を50% (w/w)含む製剤が得られる。

【0153】

G) 粉末水和剤(Water-dispersible powders)および粉末水溶剤(Water-soluble powders) (WP、SP、SS、WS)

ローター・ステーターミル(rotor-stator mill)内で、75重量部の本活性化合物に25重 50

量部の分散剤、湿潤剤およびシリカゲルを添加して粉碎する。水で希釈すると活性化化合物の安定な分散液または溶液が得られる。これにより、活性化化合物を75% (w/w) 含む製剤が得られる。

【0154】

H) ゲル製剤(GF)

攪拌下にあるボールミル内で、20重量部の本活性化化合物に10重量部の分散剤、1重量部のゲル化剤、湿潤剤、および70重量部の水または有機溶媒を添加して粉碎することにより、微細活性化化合物懸濁液が得られる。水で希釈すると活性化化合物の安定した懸濁液が得られる。これにより、活性化化合物を20% (w/w) 含む製剤が得られる。

【0155】

2. 葉面散布用の希釈せずに施用する製品。目的が種子処理の場合、かかる製品は、希釈して種子に施用してもよいし、希釈せずに施用することもできる。

【0156】

I) 散粉剤(Dustable powder) (DP、DS)

5重量部の本活性化化合物を微粉碎し、95重量部の微粉碎カオリンと十分に混合する。これにより、活性化化合物を5% (w/w) 含む散粉製品(dustable product)が得られる。

【0157】

J) 粒剤(Granules) (GR、FG、GG、MG)

0.5重量部の本活性化化合物を微粉碎し、95.5重量部の担体と組み合わせる。これにより、活性化化合物を0.5% (w/w) 含む製剤が得られる。通常の方法は、押出、噴霧乾燥、または流動床である。これにより、葉面用途の希釈せずに施用する粒剤が得られる。

【0158】

K) ULV溶液剤(UL)

10重量部の本活性化化合物を、90重量部の有機溶媒(例えばキシレン)に溶解させる。これにより、葉面用途の希釈せずに施用する、活性化化合物を10% (w/w) 含む製品が得られる。

【0159】

水性の施用形態は、乳剤(emulsion concentrate)、ペースト剤または水和性粉剤(散布用粉剤、油性分散剤)に水を加えることによって調製することができる。乳剤、ペースト剤、またはオイル分散剤を調製するには、そのままの、あるいは油または溶媒に溶解させた本物質を、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤を用いて水に均質化させることができる。しかしまた、活性物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤もしくは乳化剤、また必要に応じて溶媒もしくは油からなる濃縮物を調製することもできるが、かかる濃縮物は水で希釈するのに適している。

【0160】

そのまま使用可能な製品における本活性成分の濃度は、比較的広い範囲で変えることができる。一般に、この濃度は、0.0001~10重量%、好ましくは、0.01~1重量%である。

【0161】

さらに、本活性成分(群)は超微量(ULV(ultra-low volume))法においても良好に使用することもでき、95重量%超の本活性成分を含む製剤を、あるいは添加剤を含まない本活性成分そのものを施用することができる。

【0162】

本発明の方法では、化合物Iは、他の活性成分、例えば他の農薬(pesticides)、殺虫剤(insecticides)、除草剤、肥料、例えば硝酸アンモニウム、尿素、炭酸カリウムおよび過リン酸塩など、ならびに植物毒性剤および植物成長調節剤、毒性緩和剤および殺線虫剤を含んでいてもよい。これらの追加成分は、上述の組成物と逐次的に、または組み合わせて使用することができるが、必要であれば、使用直前に添加することもできる(タンク混合)。例えば、植物には、他の活性成分で処理する前または後に、本発明の組成物を散布することができる。

【0163】

10

20

30

40

50

本発明による化合物と一緒に使用でき、有望な相乗効果を得ることができる以下のリストMの農薬は、組み合わせの可能性について説明するためのものであり、いかなる限定をも意図するものではない：

M.1. 有機(チオ)ホスフェート系：アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、クロレトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クマホス、シアノホス、デメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロロボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタアミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン-メチル、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロペタンホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリンホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン；

M.2. カルバメート系：アルジカルブ、アラニカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、トリアザメート；

M.3. ピレスロイド系：アクリナトリン、アレトリン、d-シス-トランスアレトリン、d-トランスアレトリン、ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリンS-シルクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、ガンマ-シハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ベータ-シペルメトリン、シータ-シペルメトリン、ゼータ-シペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ-フルバリナート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、レスメトリン、RU 15525、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、ZXI 8901；

M.4. 幼若ホルモン様物質(mimics)：ヒドロプレン、キノプレン、メトプレン、フェノキシカルブ、ピリプロキシフェン；

M.5. ニコチン受容体アゴニスト/アンタゴニスト化合物：アセタミプリド、ベンスルタップ、カルタップヒドロクロリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、チアメトキサム、ニテンピラム、ニコチン、スピノサド(アロステリックアゴニスト)、チアクロプリド、チオシクラム、チオスルタップ-ナトリウム、およびAKD 1022；

M.6. GABA作動性塩化物イオンチャンネルアンタゴニスト化合物：クロルデン、エンドスルファン、ガンマ-HCH(リンデン)；アセトプロール、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロール、バニリプロール、式M^{6.1}のフェニルピラゾール化合物；

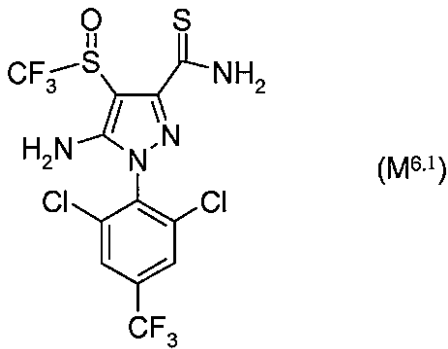
10

20

30

40

【化32】



10

【0164】

M.7. クロリドチャネル活性化因子：アバメクチン、エマメクチンベンゾエート、ミルベメクチン、レピメクチン；

M.8. MET1 I化合物：フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、フルフェネリム、ロテノン；

M.9. MET1 IIおよびIII化合物：アセキノシル、フルアシプリム、ヒドラメチルノン；

M.10. 酸化的リン酸化の脱共役剤：クロルフェナビル、DNOC；

M.11. 酸化的リン酸化の阻害剤：アゾシクロチン、シヘキサチン、ジアフェンチウロン、酸化フェンブタズ、プロバルギット、テトラジホン；

20

M.12. 脱皮攪乱物質：シロマジン、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；

M.13. 相乗剤(Synergist)：ピペロニルブトキシド、トリブホス；

M.14. ナトリウムチャンネル遮断薬化合物：インドキサカルブ、メタフルミゾン；

M.15. 燻蒸剤：メチルプロミド、クロロピクリンフッ化スルフルル；

M.16. 選択的摂食阻害薬(Selective feeding blocker)：クリロチエ、ピメトロジン、フロニカミド；

M.17. ダニ成長阻害剤：クロフェンテジン、ヘキシチアゾックス、エトキサゾール；

M.18. キチン合成阻害剤：ブプロフェジン、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン；

30

M.19. 脂質生合成阻害剤：スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト；

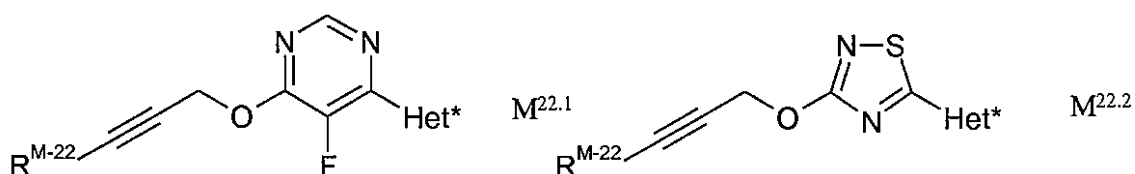
M.20. オクタパミン作動性(octapaminergic)アゴニスト：アミトラズ；

M.21. リアノジン受容体モジュレーター：フルベンジアミド；

M.22. 各種薬剤：リン化アルミニウム、アミドフルメト、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、ホウ砂、プロモプロピレート、シアン化物、シエノピラフェン、シフルメトフェン、キノメチオネート、ジコホール、フルオロアセテート、ホスフィン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、硫黄、有機硫黄化合物、吐酒石；ピリミジニルアルキニルエーテル化合物M^{22.1}またはチアジアゾリルアルキニルエーテル化合物M^{22.2}；

40

【化33】



【0165】

(式中、R^{M-22}はメチルまたはエチルであり、Het*は3,3-ジメチルピロリジン-1-イル、3-メチルピペリジン-1-イル、3,5-ジメチルピペリジン-1-イル、3-トリフルオルメチルピペ

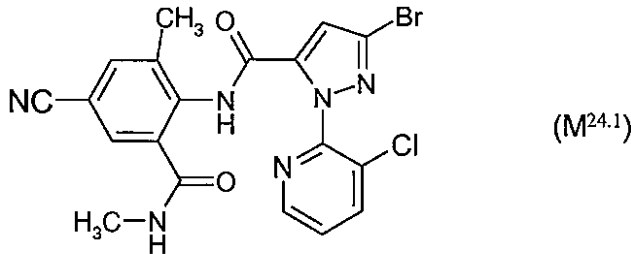
50

リジン-1-イル、ヘキサヒドロアゼピン-1-イル、2,6-ジメチルヘキサヒドロアゼピン-1-イルまたは2,6-ジメチルモルホリン-4-イルである)；

M.23. N-R'-2,2-ジハロ-1-R''シクロ-プロパンカルボキサミド-2-(2,6-ジクロロ- , , -トリフルオロ-p-トリル)ヒドラゾンまたはN-R'-2,2-ジ(R''')プロピオンアミド-2-(2,6-ジクロロ- , , -トリフルオロ-p-トリル)-ヒドラゾン(式中、R'はメチルまたはエチルであり、ハロはクロロまたはブromoであり、R''は水素またはメチルであり、R'''はメチルまたはエチルである)；

M.24. アントラニルアミド：クロラントラニリプロール、式M^{24.1}の化合物；

【化34】



10

【0166】

M.25. マロノニトリル化合物：CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₃ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)マロノニトリル、CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₅CF₂H、(2-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,7,7-ドデカフルオロ-ヘプチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)-マロノニトリル、CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂C(CF₃)₂F (2-(3,4,4,4-テトラフルオロ-3-トリフルオロメチル-ブチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)-マロノニトリル、CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂(CF₂)₃CF₃ (2-(3,3,4,4,5,5,6,6,6-ノナフルオロ-ヘキシル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)-マロノニトリル、CF₂H(CF₂)₃CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H (2,2-ビス-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロ-ペンチル)-マロノニトリル、CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₃ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,5-ノナフルオロ-ペンチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)-マロノニトリル、CF₃(CF₂)₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H (2-(2,2,3,3,4,4,4-ヘプタフルオロ-ブチル)-2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロ-ペンチル)-マロノニトリル、CF₃CF₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロ-ペンチル)-2-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロ-プロピル)-マロノニトリル、CF₂HCF₂CF₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₂CF₃ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロブチル)-マロノジニトリル、CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-ブチル)-マロノニトリル)；

20

30

M.26. 微生物攪乱物質(Microbial disruptors)：パチルス・スリングエンシス亜種イスラエレンシ(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*)、パチルス・スファエリクス(*Bacillus sphaericus*)、パチルス・スリングエンシス亜種アイザワイ(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*)、パチルス・スリングエンシス亜種クルスタキ(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*)、パチルス・スリングエンシス亜種テネブリオニス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*)。

40

【0167】

群Mの市販化合物は、いくつかある刊行物の中で特にThe Pesticide Manual, 第13版, British Crop Protection Council (2003)で確認することができる。

【0168】

式M^{6.1}のチオアミドおよびその製法は、WO 98/28279に記載されている。レピメクチンは、Agro Project, PJB Publications Ltd, November 2004により公知である。ベンクロチアズとその製造法は、EP-A1 454621に記載されている。メチダチオンおよびパラオクソンならびにそれらの製造法は、Farm Chemicals Handbook, 第88巻, Meister Publishing Company, 2001に記載されている。アセトプロールおよびその製造法は、WO 98/28277に記

50

載されている。メタフルミゾンとその製造法は、EP-A1 462 456に記載されている。フルピラゾホスは、Pesticide Science 54, 1988, p.237~243、およびUS 4822779に記載されている。ピラフルプロールとその製造法は、JP 2002193709およびWO 01/00614に記載されている。ピリプロールとその製造法は、WO 98/45274およびUS 6335357に記載されている。アミドフルメトとその製造法は、US 6221890およびJP 21010907に記載されている。フルフェネリムとその製造法は、WO 03/007717およびWO 03/007718に記載されている。AKD 1022およびその製造法は、US 6300348に記載されている。クロラントラニリプロールは、WO 01/70671、WO 03/015519およびWO 05/118552に記載されている。式M^{24.1}のアントラニルアミド誘導体は、WO 01/70671、WO 04/067528およびWO 05/118552に記載されている。シフルメトフェンおよびその製造法は、WO 04/080180に記載されている。アミノキナゾリノン化合物ピリフルキナゾンは、EP A 109 7932に記載されている。アルキニルエーテル化合物M^{22.1}およびM^{22.2}は、例えば、JP 2006131529に記載されている。有機硫黄化合物は、WO 2007060839に記載されている。マロノニトリル化合物は、WO 02/089579、WO 02/090320、WO 02/090321、WO 04/006677、WO 05/068423、WO 05/068432およびWO 05/063694に記載されている。

10

【 0 1 6 9 】

殺菌混合パートナーは、以下からなる群 F から選択されるものである：

F.1 アシルアラニン類、例えばベナラキシル、メタラキシル、オフラース、オキサジキシル；

F.2 アミン誘導体、例えばアルジモルフ、ドジン、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、フェンプロピジン、グアザチン、イミノクタジン、スピロキサミン、トリデモルフ；

F.3 アニリノピリミジン類、例えばピリメタニル、メバニピリムまたはシロジニル(cyrodinyl)；

F.4 抗生物質、例えばシクロヘキシミド、グリセオフルピン、カスガマイシン、ナタマイシン、ポリオキシシンまたはストレプトマイシン；

F.5 アゾール類、例えばビテルタノール、プロモコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニトロコナゾール、エポキシコナゾール、フェンプロコナゾール、フルキコナゾール(flucyconazole)、フルシラゾール、ヘキサコナゾール、イマザリル、メトコナゾール、マイクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロクロラズ、プロチオコナゾール、テブコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリフルミゾール、トリチコナゾール、フルトリアホール；

F.6 ジカルボキシミド類、例えばイプロジオン、マイクロゾリン、プロシミドン、ピンクロゾリン；

F.7 ジチオカーバメート類、例えばファーバム、ナバム、マネブ、マンコゼブ、メタム、メチラム、プロピネブ、ポリカーバメート、チラム、ジラム、ジネブ；

F.8 複素環式化合物、例えばアニラジン、ベノミル、ボスカリド、カルベンダジム、カルボキシシン、オキシカルボキシシン、シアゾファミド、ダゾメット、ジチアノン、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナリモール、フベリダゾール、フルトラニル、フラメトピル、イソプロチオラン、メプロニル、ヌアリモル、プロベナゾール、プロキナジド、ピリフェノックス、ピロキロン、キノキシフェン、シルチオフアム、チアベンダゾール、チフルザミド、チオフアナート-メチル、チアジニル、トリシクラゾール、トルホリン；

F.9 銅殺菌剤、例えばボルドー液、酢酸銅、オキシ塩化銅、塩基性硫酸銅；

F.10 ニトロフェニル誘導体、例えばピナバクリル、ジノカップ、ジノブトン、ニトロフタリソプロピル(nitrophthalisopropyl)；

F.11 フェニルピロール類、例えばフェンピクロニルまたはフルジオキシソニル；

F.12 ストロビルリン類、例えばアゾキシストロピン、ジモキシストロピン、フルオキサストロピン、クレソキシム-メチル、メトミノストロピン、オリサストロピン、ピコキシストロピンまたはトリフロキシストロピン；

F.13 スルフェン酸誘導体、例えばカプタホール、カプタン、ジクロフルアニド、フォルベト、トリルフルアニド；

50

F.14 シンナムアミド類 (cinnemamides) および類似体、例えばジメトモルフ、フルメトパールまたはフルモルフ；

F.15 硫黄、および他の殺菌剤、例えばアシベンゾラル-S-メチル、ベンチアバリカルブ、カルプロパミド、クロロタロニル、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、ジクロメジン、ジクロシメット、ジエトフェンカルブ、エジフェンホス、エタボキサム、フェンヘキサミド、酢酸フェンチン、フェノキサニル、フェリムゾン、フルアジナム、ホセチル、ホセチル-アルミニウム、イプロバリカルブ、ヘキサクロロベンゼン、メトラフェノン、ペンシクロン、プロパモカルブ、フタリド、トロクロホス-メチル、キントゼン、ゾキサミド。

【0170】

施用

動物害虫(すなわち昆虫、蛛形類および線虫)、植物、植物が生育している土壌または水は、当技術分野で公知の任意の施用方法によって、本化合物I(群)またはそれを含有する組成物(群)と接触させることができる。かかる場合、「接触(させること)」とは、直接的な接触(本化合物/組成物を動物害虫または植物に、一般的には植物の葉、茎または根に、直接施用すること)と、間接的な接触(本化合物/組成物を動物害虫または植物の場所に施用すること)の両方を含む。

【0171】

式Iで表される化合物またはそれを含む殺虫剤組成物は、植物/作物を殺虫剤として有効な量の式Iで表される化合物と接触させることによって、生育中の植物および作物を動物害虫、特に昆虫、ダニ類または蛛形類による攻撃または加害から保護するのに用いることができる。「作物」という用語は、生育中の作物と収穫された作物の両方を意味する。

【0172】

さらに動物害虫は、標的とする害虫、その食糧、生息地、繁殖場所またはその場所を、殺虫剤として有効な量の式Iで表される化合物と接触させることにより防除することができる。かかる場合、施用は、その場所、生育中の作物または収穫された作物の害虫による加害の前後に行うことができる。

【0173】

また本発明の化合物は、害虫の発生が予想される場所に予防的に施用することもできる。

【0174】

また式Iで表される化合物は、植物を殺虫剤として有効な量の式Iで表される化合物と接触させることにより、害虫による攻撃または加害から生育中の植物を保護するために用いることもできる。かかる場合、「接触(させること)」とは、直接的な接触(本化合物/組成物を害虫または植物に、一般的には植物の葉、茎または根に、直接施用すること)と、間接的な接触(本化合物/組成物を害虫および/または植物の場所に施用すること)の両方を含む。

【0175】

「場所」とは、害虫または寄生生物が成長しているか、または成長の可能性のある生息地、繁殖場所、植物、種子、土壌、区域、材料、または環境を意味する。

【0176】

一般に、「殺虫剤として有効な量」とは、成長に対する目に見える効果(ネクロシス、死滅、遅延、予防、および除去、駆除の作用を含む)を得るために必要とされる活性成分の量、さもなければ、標的生物の発生および活性を減じるのに必要とされるその量を意味する。殺虫剤として有効な量は、本発明で用いられる各種化合物/組成物によって変わり得る。また本組成物の殺虫剤として有効な量は、例えば、所望の殺虫作用および持続期間、天候、標的種、部位、施用方法等の一般的な条件により変わる。

【0177】

土壌処理の場合または害虫生息地もしくは巣へ施用する場合、活性成分の量は、100m²当たり0.0001~500g、好ましくは100m²当たり0.001~20gの範囲である。

10

20

30

40

50

【0178】

材料保護における慣用の施用率は、例えば、処理する材料1m²当たり0.01g～1000g、望ましくは1m²当たり0.1g～50gの活性化化合物である。

【0179】

材料の注入で使用する場合の殺虫剤組成物は、一般に0.001～95重量%、好ましくは0.1～45重量%、さらに好ましくは1～25重量%の少なくとも1種の忌避剤および/または殺虫剤を含有する。

【0180】

作物の処理で使用する場合には、本発明の活性成分の施用率は、1ヘクタール当たり0.1g～4000g、望ましくは1ヘクタール当たり25g～600g、さらに望ましくは1ヘクタール当たり50g～500gの範囲であってもよい。

10

【0181】

式Iで表される化合物は、接触(土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物の各種部分または動物の各種部分を介した接触)、および摂食(餌または植物の各種部分)のいずれによっても有効である。

【0182】

本発明の化合物は、アリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、カ、コオロギまたはゴキブリなどの非作物害虫に対して施用することもできる。前記非作物害虫に対する使用に関しては、式Iで表される化合物を餌組成物で用いるのが好ましい。

【0183】

餌は、液状、固形または半固形の調製物(例えばゲル)であってもよい。固形の餌は、それぞれの施用に好適な各種形状および形態(例えば粒状、ブロック状、スティック状、円盤状)に成形することができる。液状の餌は、適切な施用が確実に行われる各種器具(例えば、オープン容器、スプレー器具、液滴発生器または蒸気発生器)へ充填することができる。ゲル状の餌は、水性マトリックスまたは油性マトリックスをベースとし、粘性、水分または老化特性の点から特定のニーズにあった製品に成形することができる。

20

【0184】

本組成物で用いられる餌は、それを食べるアリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、カ、コオロギなどの昆虫またはゴキブリを刺激するのに十分な誘引性のある製品である。摂食刺激物質または性フェロモンを用いることにより誘引性を調整することができる。摂食刺激物質は、例えば、これらに限定されるものではないが、動物タンパク質および/または植物タンパク質(肉粉、魚粉または血粉、昆虫の各種部分、卵黄)から、動物および/または植物由来の油脂、あるいはモノ、オリゴまたはポリオルガノサッカライド類、特にスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、デンプン、ペクチンまたはモラッセまたは蜂蜜などから選択する。フルーツ、作物、植物、動物、昆虫またはその特定部分の新鮮な部分または腐敗部分もまた摂食刺激物質として利用することができる。性フェロモンは多くの昆虫に固有であることが知られている。文献には具体的なフェロモンが記載されており、当業者には公知である。

30

【0185】

餌組成物で使用する場合には、活性成分の典型的な含有量は、0.001重量%～15重量%、望ましくは0.001重量%～5重量%(活性化化合物重量%)である。

40

【0186】

エアロゾル(例えば噴霧(スプレー)缶中のエアロゾル)、油性噴霧剤またはポンプ式噴霧剤としての式Iの化合物の製剤は、ハエ、ノミ、ダニ、カまたはゴキブリなどの害虫の防除用として、専門外ユーザーに非常に好適である。エアロゾル処方は、好ましくは、本活性化化合物、溶媒、例えば低級アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール)、ケトン(例えばアセトン、メチルエチルケトン)、沸点範囲が約50～250のパラフィン族炭化水素(例えばケロシン)、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素、例えばトルエン、キシレン、水、さらに乳化剤などの補助剤、例えばソルビトールモノオレエート、3～7molのエチレンオキシドを含

50

むオレイルエトキシレート、脂肪アルコールエトキシレート、香油、例えば芳香油、中級脂肪酸と低級アルコールのエステル、芳香族化合物カルボニル化合物、必要に応じて安定剤、例えば安息香酸ナトリウム、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチル、さらに所望により噴射剤、例えばプロパン、ブタン、窒素、圧搾空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素またはこれらのガスの混合物からなる。

【0187】

油性噴霧剤は、噴射剤を用いない点でエアゾル処方とは異なる。

【0188】

噴霧剤組成物で使用する場合には、活性成分の含有量は、0.001~80重量%、好ましくは0.01~50重量%、最も好ましくは0.01~15重量%である。

10

【0189】

また、式Iで表される化合物およびその各組成物は、蚊取線香および燻し型線香(fumigating coil)、排煙カートリッジ、気化器(vaporizer plate)または長期間型気化器(long-term vaporizer)で、また虫取り紙、防虫パッド(moth pad)または他の非加熱性の気化器系統で用いることもできる。

【0190】

また、式Iで表される化合物およびその各組成物で、昆虫によって伝搬される感染症(例えばマラリア、デング熱および黄熱病、リンパ性系状虫症および皮膚リーシュマニア症)を予防する方法は、小屋および住居の表面処理、空気噴霧、ならびにカーテン、テント、衣料品、蚊帳、ツェツェパエ用捕獲具等への注入を含む。繊維、織物、ニットウェア、不織布、ネット状材料またはホイルおよび防水布へ施用するための殺虫剤組成物は、好ましくは、本殺虫剤を含み、場合により忌避剤および少なくとも1種の結合剤を含んでいる混合物を含む。好適な忌避剤は、例えば、N,N-ジエチル-メタ-トルアミド(DEET)、N,N-ジエチルフェニルアセトアミド(DEPA)、1-(3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル)-2-メチルピペリン、(2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)酢酸ラクトン、2-エチル-1,3-ヘキサンジオール、インダロン、メチルネオデカンアミド(MNDA)、昆虫防除で用いられていないピレスロイド、例えば、{(+/)-3-アリル-2-メチル-4-オキシシクロペンタ-2-(+)-エニル-(+)-トランス-クリサンテメート(Esbiothrin)、植物抽出物由来の忌避剤または植物抽出物と同じ忌避剤、例えば、リモネン、オイゲノール、(+)-ユーカマロール(Eucamalol)(1)、(-)-1-epi-ユーカマロール、またはユーカリプツス・マクラタ(Eucalyptus maculata)、

20

30

【0191】

カーテンおよび蚊帳への注入は、主として、その繊維材料を殺虫剤のエマルジョンまたは分散液に浸漬することによるか、または蚊帳上にそれらを噴霧することにより行う。

40

【0192】

式Iで表される化合物およびその組成物は、アリおよび/またはシロアリから、木製材料(例えば木、板塀、枕木など)、および建物(例えば家、離れ家、製造所など)、また建築材料、家具、皮革、繊維、ビニル物品、電線、ケーブル等を保護するため、ならびに作物またはヒトに危害を加えること(例えば、害虫が家屋や公共施設へ侵入する場合など)からアリおよびシロアリを防除するために用いることができる。式Iで表される化合物は、木製材料を保護するために周囲の土壌表面または床下の土壌へ施用されるだけでなく、床下のコンクリート、アルコーブポスト、梁、合板、家具などの表面のような材木品、削片板、ハーフボードなどの木製品、およびコーティングされている電線、ビニールシートなどの

50

ビニール製品、発泡スチロールなどの断熱材などにも施用することができる。作物またはヒトへ危害を加えるアリに対して施用する場合には、本発明のアリ防除剤は、作物または周囲の土壤に施用するか、直接アリの巣等に施用する。

【0193】

種子処理

式Iで表される化合物は、害虫から(特に土壤中に生息している害虫から)種子を保護し、生じる植物の根およびシュートを土壤害虫および食葉性昆虫に対して保護するための種子処理にも適している。

【0194】

式Iで表される化合物は、土壤害虫からの種子の保護と、土壤害虫および食葉性昆虫に対するそれから生じる植物の根およびシュートの保護に特に有用である。好ましいのは、生じる植物の根およびシュートの保護である。より好ましいのは、昆虫が生じる植物のシュートに刺しこみ、吸汁することから保護することであり、この場合、最も好ましいのはアブラムシからの保護である。

【0195】

したがって、本発明には、昆虫から(特に土壤昆虫から)種子を保護する方法、昆虫から(特に土壤昆虫および食葉性昆虫から)実生の根およびシュートを保護する方法、播種前(before sowing)および/または発芽前処理後(after pregermination)の種子を一般式Iで表される化合物またはその塩と接触させることを含む前記方法が含まれる。特に好ましいのは、植物の根およびシュートを保護する方法、さらに好ましいのは、植物のシュートを昆虫の吸汁から保護する方法、特に好ましいのは、植物のシュートをアブラムシから保護する方法である。

【0196】

種子という用語には、本来の種子、種子の一部、吸根、球茎、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、切片(cutting)、挿し芽(cut shoot)などをはじめとする(ただし、これらに限定されるものではない)、すべての種類の種子および植物珠芽が含まれるが、好ましい実施形態においては、本来の種子を意味する。

【0197】

種子処理という用語には、種子粉衣法(seed dressing)、種子コーティング法(seed coating)、種子散粉法(seed dusting)、種子浸漬法(seed soaking)および種子ペレットリング法(seed pelleting)などの当技術分野で周知の好適な種子処理技術がすべて含まれる。

【0198】

また本発明は、本活性化化合物でコーティングした種子または本活性化化合物を含有する種子も含む。

【0199】

「~でコーティングした、および/または、~を含有する」という用語は、一般に、施用時に活性成分が伝播物(propagation product)の表面上にその大半があることを意味する。その場合、施用方法に応じて、程度の差はあってもその成分の一部が伝播物に入り込んでいてもよい。前記伝播物が(再)植栽される場合には、その活性成分が吸収され得る。

【0200】

好適な種子は、禾穀類、根菜類、油料作物、野菜、香辛料および観賞植物の種子であり、例えば、デュラムコムギおよび他のコムギ、オオムギ、オートミール、ライムギ、トウモロコシ(飼料用コーンおよびシュガーコーン/スイートコーンおよびフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、カブラ、テンサイ、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、牧草、芝生(lawn)、芝地(turf)、飼料草、トマト、ニラ、パンプキン/カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種、メロン、マメ、エンドウ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、ジャガイモのような塊茎植物、サトウキビ、タバコ、ブドウの木、ペチュニア属の植物、ゼラニウム/テンジクアオイ、パンジーおよびインパチェンスなどの種子である。

【0201】

10

20

30

40

50

さらに、本活性化合物は、育種(遺伝子工学手法を含む)によって除草剤または殺菌剤または殺虫剤の作用に耐性を持つ植物から得た種子の処理に用いることもできる。

【0202】

例えば、本活性化合物は、スルホニル尿素誘導体、イミダゾリノン、グルホシネート-アンモニウムまたはグリホサート-イソプロピルアンモニウムおよび類似活性物質からなる群から選択される除草剤に耐性のある植物(例えば以下を参照:EP-A-0242236、EP-A-242246)(WO 92/00377)(EP-A-0257993、米国特許第5,013,659号)、あるいは、バチルス・チューリングシス(*Bacillus thuringiensis*)毒素(Bt毒素)を産出する能力を持ち、植物に特定の害虫に対する耐性が付与されたトランスジェニック作物(例えばワタの木)(EP-A-0142924、EP-A-0193259)から得た種子の処理で使用することができる。

10

【0203】

さらに、本活性化合物は、例えば、従来の育種法および/もしくは突然変異体作製法または組換え手法によって作製され得る、既存の植物と比べた場合に特性が変化している植物から得た種子の処理に用いることもできる。例えば、植物中で合成されるデンプンの改変を目的とした作物の組換え改変体に関する多くの事例が開示されている(例えば、WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)。あるいは、脂肪酸組成を改変したトランスジェニック作物の多くの事例が開示されている(WO 91/13972)。

【0204】

本活性化合物の種子処理における施用は、植物の播種前および植物の出芽前に、種子に噴霧または散布することによって行なわれる。

20

【0205】

種子処理で特に有用な組成物は、例えば、次のものである：

- A 液剤(soluble concentrates) (SL、LS)、
- D エマルジョン製剤(emulsions) (EW、EO、ES)、
- E 懸濁製剤(suspensions) (SC、OD、FS)、
- F 顆粒水和剤(water-dispersible granule)および顆粒水溶剤(water-soluble granules) (WG、SG)、
- G 粉末水和剤(water-dispersible powders)および粉末水溶剤(water-soluble powders) (WP、SP、WS)、
- H ゲル製剤(GF)、
- I 散粉剤(dustable powder) (DP、DS)。

30

【0206】

慣用の種子処理製剤としては、例えば、流動性濃縮剤(FS)、液剤(LS)、乾燥処理用粉剤(DS)、スラリー処理用粉末水和剤(WS)、粉末水溶剤(SS)およびエマルジョン製剤(ESおよびEC)、ならびゲル製剤(GF)が挙げられる。これらの製剤は、種子に希釈して施用してもよいし、希釈しないで施用することもできる。種子への施用は、播種前に種子に直接か、または発芽前処理後に行う。

【0207】

好ましい実施形態では、FS製剤を種子処理に用いる。典型的には、FS製剤は、1~800g/Lの活性成分、1~200g/Lの界面活性剤、0~200g/Lの不凍剤、0~400g/Lの結合剤、0~200g/Lの着色剤、および1リットル以下の溶媒(好ましくは水)を含むことができる。

40

【0208】

種子処理用の式Iで表される化合物の特に好ましいFS製剤は、通常、0.1~80重量%(1~800g/L)の活性成分、0.1~20重量%(1~200g/L)の少なくとも1種の界面活性剤、例えば0.05~5重量%の湿潤剤、および0.5~15重量%の分散剤、20重量%以下(例えば5~20%)の不凍剤、0~15重量%(例えば1~15重量%)の着色剤および/または色素、0~40重量%(例えば1~40重量%)の結合剤(固着剤/付着剤)、場合によっては5重量%以下(例えば0.1~5重量%)の増粘剤、場合によっては0.1~2%の消泡剤、場合によっては例えば0.01~1重量%の量の防腐剤(例えば殺生物剤、抗酸化物質など)、ならびに100重量%以下の充填剤/ビヒクルを含む。

50

【0209】

また種子処理剤は、さらに結合剤を含んでいてもよく、場合によっては着色剤を含んでいてもよい。

【0210】

結合剤は、処理後の種子への活性物質の付着性を高めるために加えることができる。好適な結合剤は、エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドなどのアルキレンオキシドのホモポリマーおよびコポリマー、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、およびそれらのコポリマー、エチレン-酢酸ビニルコポリマー、アクリルホモポリマーおよびコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミドおよびポリエチレンイミン、セルロース、チロースおよびデンプンなどの多糖類、ポリオレフィンホモポリマーおよびオレフィン/無水マレイン酸コポリマーなどのコポリマー、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンホモポリマーおよびコポリマーである。

10

【0211】

場合によっては、着色剤を本製剤に入れることもできる。種子処理用製剤に好適な着色剤または色素は、ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112、C.I.ソルベントレッド1、ピグメントブルー-15：4、ピグメントブルー-15：3、ピグメントブルー-15：2、ピグメントブルー-15：1、ピグメントブルー-80、ピグメントイエロー-1、ピグメントイエロー-13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48：2、ピグメントレッド48：1、ピグメントレッド57：1、ピグメントレッド53：1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベイシックバイオレット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー-9、アシッドイエロー-23、ベイシックレッド10、ベイシックレッド108である。

20

【0212】

ゲル化剤の例は、カラギーン(Satiagel(登録商標))である。

【0213】

種子処理においては、本化合物Iの施用率は、通常、種子100kg当たり0.1g~10kg、好ましくは種子100kg当たり1g~5kg、より好ましくは種子100kg当たり1g~1000g、特に種子100kg当たり1g~200gである。

30

【0214】

したがって、本発明はまた、本明細書で定義した、式Iで表される化合物または式Iの農業上有用な塩を含む種子に関する。化合物Iまたはその農業上有用な塩の量は、一般に、種子100kg当たり0.1g~10kg、好ましくは種子100kg当たり1g~5kg、特に種子100kg当たり1g~1000gで変動する。レタスなどの特定の作物では、その率は高くなり得る。

【0215】

ここで、以下の実施例により、本発明をさらに詳細に説明する。

【実施例】

【0216】

ここで、以下の実施例により、本発明をさらに詳細に説明する。

【0217】

以下の表Cで、好ましい化合物の例の一部をそれらの物性データにより特性決定している。生成物は、連結高速液体クロマトグラフィー/質量分析法(HPLC/MS)により、NMRにより、またはそれらの融点により特性決定した。

40

【0218】

分析用HPLCカラム：RP-18カラム(Chromolith Speed ROD、Merck KgaA(ドイツ)製)。溶離：アセトニトリル+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)/水+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)、40 で5分間、5：95~95：5の比率で実施。

【0219】

別法として、化合物はそれらの融点により、追加的に、または代替として特性決定した。

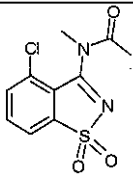
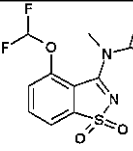
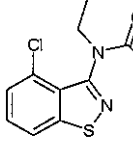
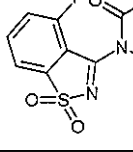
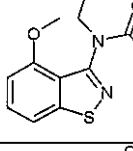
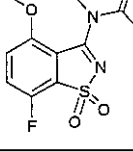
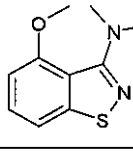
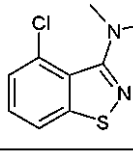
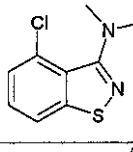
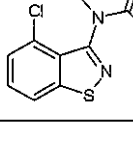
50

【 0 2 2 0 】

一部の化合物は ^1H -NMRによって特性決定した。シグナルは、テトラメチルシランに対する化学シフト(ppm)によって、その多重度によって、またその積分(所定の水素原子の相対数)によって特性決定した。以下の略語は、シグナルの多重度を特性決定するために使用している：M=多重項、q=四重項、t=三重項、d=二重項およびs=一重項。

【表 2】

表C:

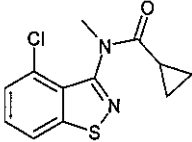
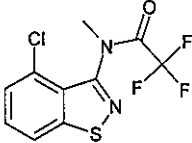
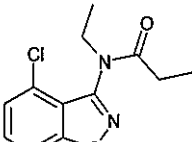
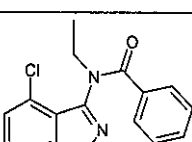
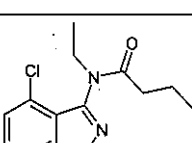
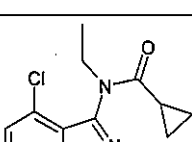
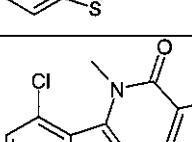
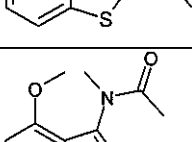
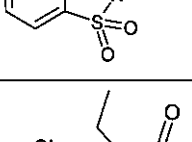
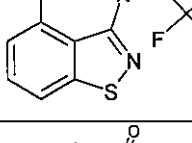
| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 1. |  | | t _r = 2.16 min, m/z= 295 [M+23] |
| 2. |  | | t _r = 2.31 min, m/z= 305 [M+1] |
| 3. |  | | t _r = 2.75 min, m/z= 255 [M+1] |
| 4. |  | | t _r = 2.11 min, m/z= 257 [M+1] |
| 5. |  | | t _r = 2.62 min, m/z= 251 [M+1] |
| 6. |  | | t _r = 2.25 min, m/z= 245 [M+1] |
| 7. |  | | t _r = 2.32 min, m/z= 237 [M+1] |
| 8. |  | | t _r = 2.45 min, m/z= 241 [M+1] |
| 9. |  | | t _r = 2.79 min, m/z= 255 [M+1] |
| 10. |  | | t _r = 3.07 min, m/z= 269 [M+1] |

10

20

30

40

| 化合物実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|--------|---|---------------------------|--|
| 11. |  | | t _r = 2.84 min, m/z= 267 [M+1] |
| 12. |  | | t _r = 3.39 min, m/z= 295 [M+1] |
| 13. |  | | t _r = 3.08 min, m/z= 269 [M+1] |
| 14. |  | | t _r = 3.39 min, m/z= 317 [M+1] |
| 15. |  | | t _r = 3.35 min, m/z= 283 [M+1] |
| 16. |  | | t _r = 3.12 min, m/z= 281 [M+1] |
| 17. |  | | t _r = 3.14 min, m/z= 303 [M+1] |
| 18. |  | | t _r = 2.06 min, m/z= 291 [M+1] |
| 19. |  | | t _r = 3.69 min, m/z= 309 [M+1] |
| 20. |  | | t _r = 2.93 min, m/z= 301 [M+1] |

10

20

30

40

| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|--------|---------------------------|--|
| 21. | | | t _r = 3.14 min, m/z= 327 [M+1] |
| 22. | | | t _r = 2.86 min, m/z= 301 [M+1] |
| 23. | | | t _r = 3.28 min, m/z= 349 [M+1] |
| 24. | | | t _r = 3.15 min, m/z= 315 [M+1] |
| 25. | | | t _r = 2.53 min, m/z= 273 [M+1] |
| 26. | | | t _r = 2.62 min, m/z= 341 [M+1] |
| 27. | | | t _r = 2.84 min, m/z= 287 [M+1] |
| 28. | | | t _r = 2.35 min, m/z= 327 [M+1] |
| 29. | | | t _r = 2.89 min, m/z= 299 [M+1] |
| 30. | | | t _r = 2.79 min, m/z= 287 [M+1] |

10

20

30

40

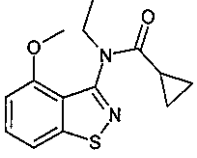
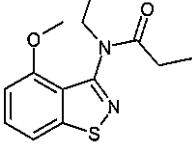
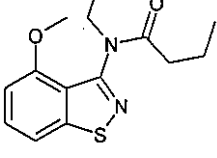
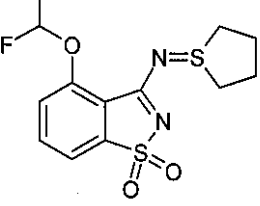
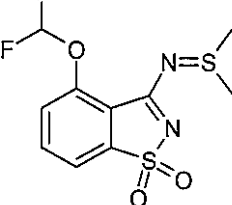
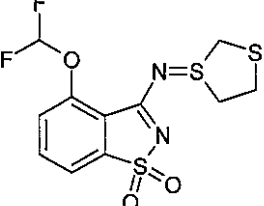
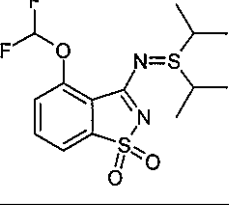
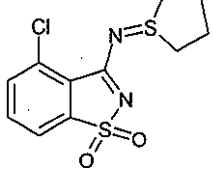
| 化合物実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|--------|--------|---------------------------|--|
| 31. | | | t _r = 3.16 min, m/z= 335 [M+1] |
| 32. | | | t _r = 3.12 min, m/z= 313 [M+1] |
| 33. | | | ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] = 1.04 (t, 3H), 1.20 (t, 3H), 1.89 (m, 1H), 2.10 (m, 1H), 3.41 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 6.68 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.75 (d, 1H) |
| 34. | | | t _r = 3.12 min, m/z= 349 [M+1] |
| 35. | | | t _r = 2.95 min, m/z= 335 [M+23] |
| 36. | | | t _r = 2.63 min, m/z= 251 [M+1] |
| 37. | | | t _r = 2.95 min, m/z= 299 [M+1] |
| 38. | | | ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] = 0.50 (m, 1H), 0.61 (m, 1H), 1.02 (m, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.79 (d, 1H), 7.48 (m, 2H) |
| 39. | | | t _r = 2.90 min, m/z= 265 [M+1] |
| 40. | | | t _r = 3.17 min, m/z= 313 [M+1] |

10

20

30

40

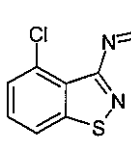
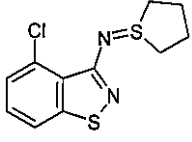
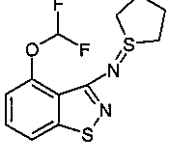
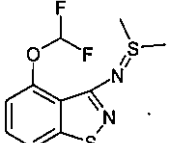
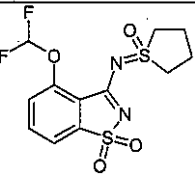
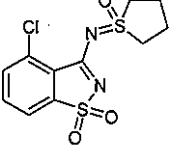
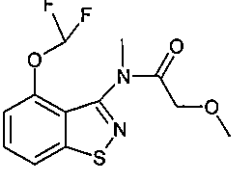
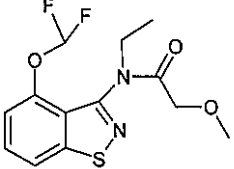
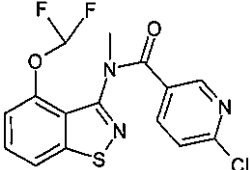
| 化合物実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|--------|---|---------------------------|--|
| 41. |  | | t _r = 3.07 min, m/z= 277 [M+1] |
| 42. |  | | t _r = 2.89 min, m/z= 265 [M+1] |
| 43. |  | | t _r = 3.12 min, m/z= 279 [M+1] |
| 44. |  | 189-192 | t _r = 2.32 min, m/z= 335 [M+1] |
| 45. |  | | t _r = 2.00 min, m/z= 309 [M+1] |
| 46. |  | 188-192 | t _r = 2.35 min, m/z= 353 [M+1] |
| 47. |  | 112-113 | t _r = 2.75 min, m/z= 365 [M+1] |
| 48. |  | | t _r = 2.27 min, m/z= 303 [M+1] |

10

20

30

40

| 化合物実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|--------|---|---------------------------|--|
| 49. |  | 95-97 | |
| 50. |  | | t _r = 1.80 min, m/z= 271 [M+1] |
| 51. |  | | t _r = 2.04 min, m/z= 303 [M+1] |
| 52. |  | | t _r = 1.90 min, m/z= 277 [M+1] |
| 53. |  | | t _r = 2.44 min, m/z= 351 [M+1] |
| 54. |  | | t _r = 2.35 min, m/z= 319 [M+1] |
| 55. |  | | t _r = 2.49 min, m/z= 303 [M+1] |
| 56. |  | | t _r = 2.74 min, m/z= 317 [M+1] |
| 57. |  | | t _r = 3.03 min, m/z= 370 [M+1] |

10

20

30

40

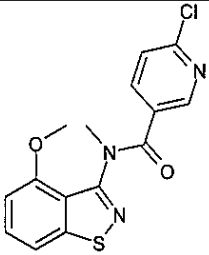
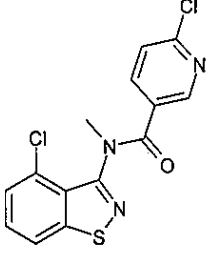
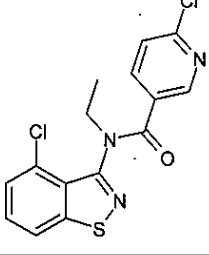
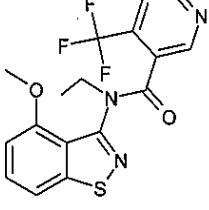
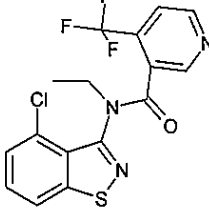
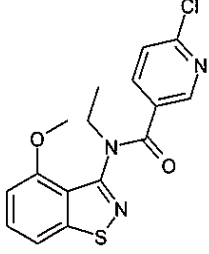
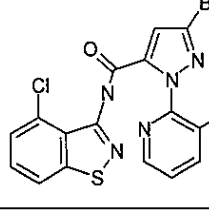
| 化合物実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|--------|--------|---------------------------|--|
| 58. | | | t _r = 3.26 min, m/z= 384 [M+1] |
| 59. | | | t _r = 2.39 min, m/z= 271 [M+1] |
| 60. | | 141-143°C | |
| 61. | | | t _r = 2.97 min, m/z= 301 [M+1] |
| 62. | | | t _r = 3.06 min, m/z= 271 [M+1] |
| 63. | | | t _r = 3.35 min, m/z= 325 [M+1] |
| 64. | | | t _r = 2.95 min, m/z= 284 [M+1] |
| 65. | | | t _r = 2.34 min, m/z= 270 [M+1] |
| 66. | | | t _r = 3.17 min, m/z= 368 [M+1] |
| 67. | | | t _r = 2.97 min, m/z= 354 [M+1] |

10

20

30

40

| 化合物実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|--------|---|---------------------------|--|
| 68. |  | | t _r = 2.88 min, m/z= 334 [M+1] |
| 69. |  | | t _r = 2.97 min, m/z= 338 [M+1] |
| 70. |  | | t _r = 3.23 min, m/z= 352 [M+1] |
| 71. |  | | t _r = 3.23 min, m/z= 382 [M+1] |
| 72. |  | | t _r = 3.31 min, m/z= 386 [M+1] |
| 73. |  | | t _r = 3.11 min, m/z= 348 [M+1] |
| 74. |  | | t _r = 3.2 min, m/z= 470 [M+1] |

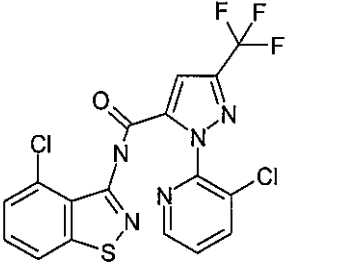
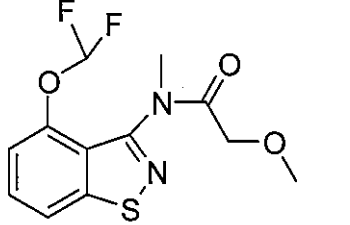
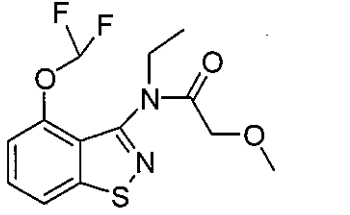
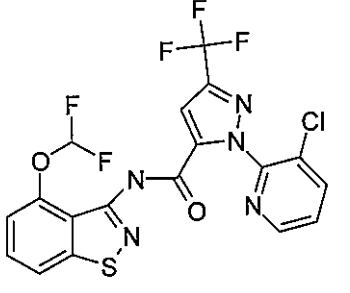
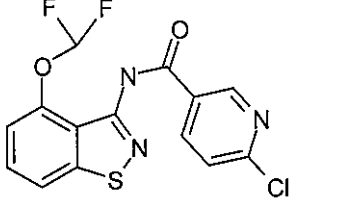
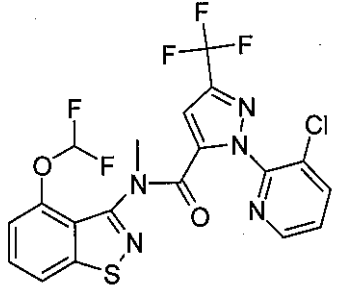
10

20

30

40

50

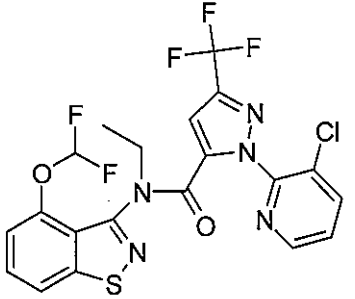
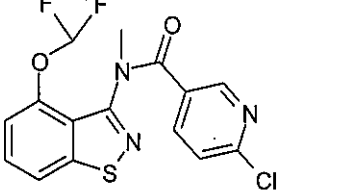
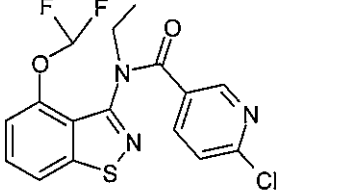
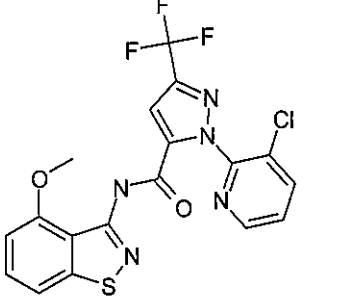
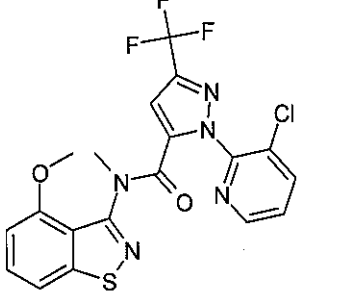
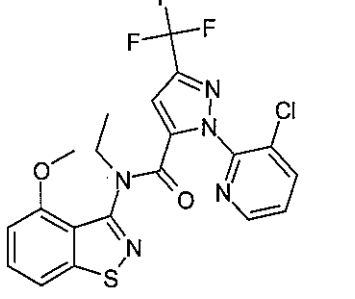
| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 75. |  | | t _r = 3.5 min, m/z= 458 [M+1] |
| 76. |  | | t _r = 2.49 min, m/z= 303 [M+1] |
| 77. |  | | t _r = 2.74 min, m/z= 317 [M+1] |
| 78. |  | | t _r = 3.49 min, m/z= 490 [M+1] |
| 79. |  | | t _r = 2.81 min, m/z= 356 [M+1] |
| 80. |  | | t _r = 3.66 min, m/z= 504 [M+1] |

10

20

30

40

| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 81. |  | | t _r = 3.83 min, m/z= 518 [M+1] |
| 82. |  | | t _r = 3.03 min, m/z= 370 [M+1] |
| 83. |  | | t _r = 3.24 min, m/z= 384 [M+1] |
| 84. |  | 178-179 | |
| 85. |  | 117-120 | |
| 86. |  | | t _r = 3.87 min, m/z= 482 [M+1] |

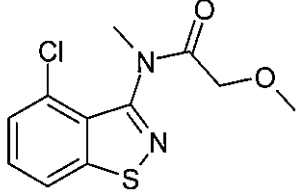
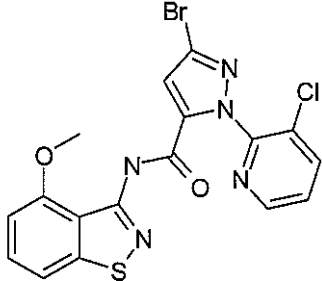
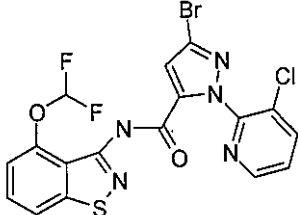
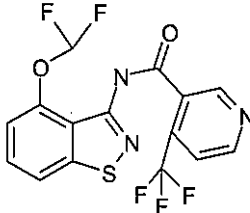
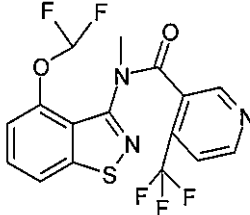
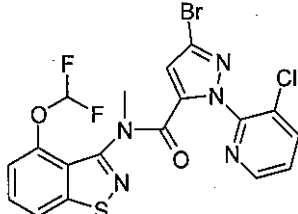
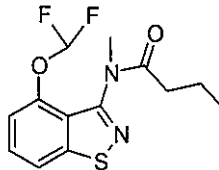
10

20

30

40

50

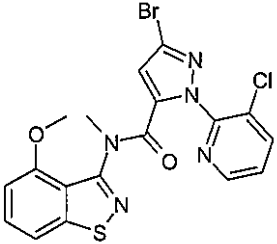
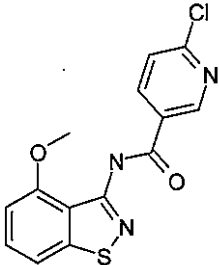
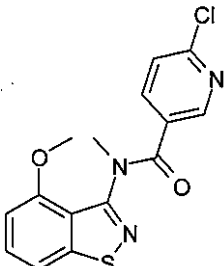
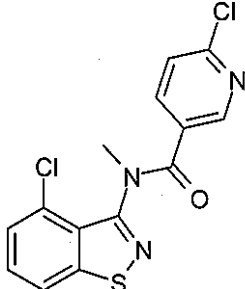
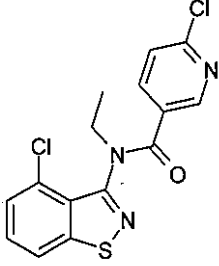
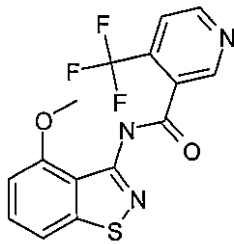
| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 87. |  | | t _r = 2.39 min, m/z= 271 [M+1] |
| 88. |  | | t _r = 3.27 min, m/z= 466 [M+1] |
| 89. |  | | t _r = 3.27 min, m/z= 502 [M+1] |
| 90. |  | | t _r = 2.89 min, m/z= 390 [M+1] |
| 91. |  | 141-143 | |
| 92. |  | | t _r = 3.42 min, m/z= 516 [M+1] |
| 93. |  | | t _r = 2.97 min, m/z= 301 [M+1] |

10

20

30

40

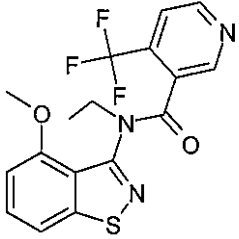
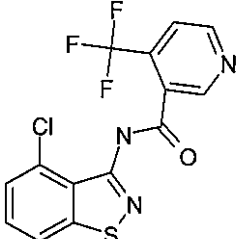
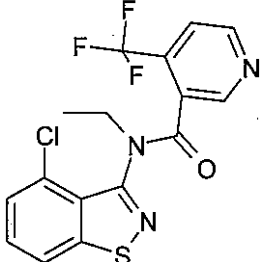
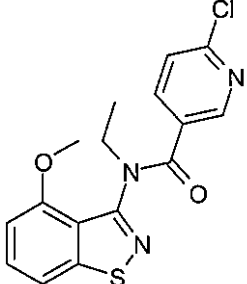
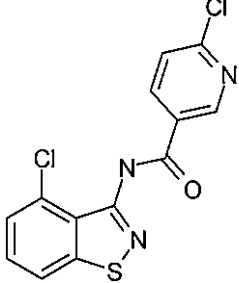
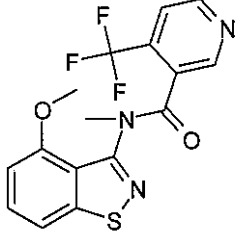
| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 94. |  | | ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] = 3.32 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 5.51 (s, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.49 (m, 2H), 7.89 (d, 1H), 8.48 (d, 1H) |
| 95. |  | | t _r = 2.74 min, m/z= 320 [M+1] |
| 96. |  | | t _r = 2.88 min, m/z= 334 [M+1] |
| 97. |  | | t _r = 2.97min, m/z= 338 [M+1] |
| 98. |  | | t _r = 3.23 min, m/z= 352 [M+1] |
| 99. |  | | t _r = 2.77 min, m/z= 354 [M+1] |

10

20

30

40

| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 100. |  | | t _r = 3.23 min, m/z= 382 [M+1] |
| 101. |  | | t _r = 2.69 min, m/z= 358 [M+1] |
| 102. |  | | t _r = 3.31 min, m/z= 386 [M+1] |
| 103. |  | | t _r = 3.11 min, m/z= 348 [M+1] |
| 104. |  | | t _r = 2.67 min, m/z= 324 [M+1] |
| 105. |  | | t _r = 3.00 min, m/z= 368 [M+1] |

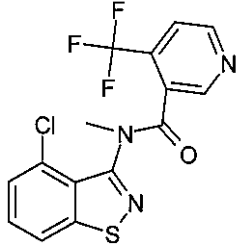
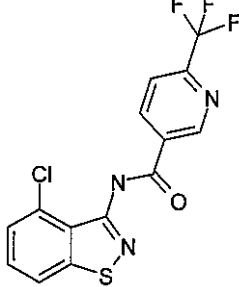
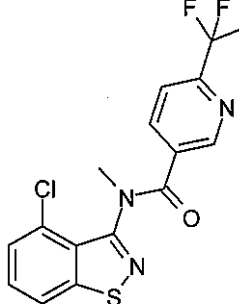
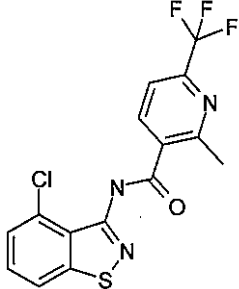
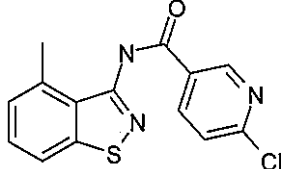
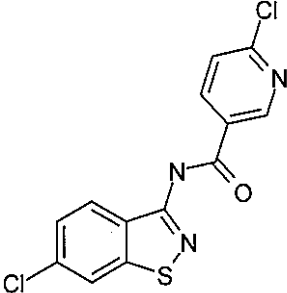
10

20

30

40

50

| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 106. |  | | t _r = 3.07 min, m/z= 372 [M+1] |
| 107. |  | | t _r = 3.04 min, m/z= 358 [M+1] |
| 108. |  | | t _r = 3.31 min, m/z= 372 [M+1] |
| 109. |  | | t _r = 3.06 min, m/z= 372 [M+1] |
| 110. |  | | t _r = 2.63 min, m/z= 304 [M+1] |
| 111. |  | | t _r = 2.94 min, m/z= 324 [M+1] |

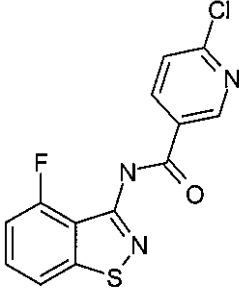
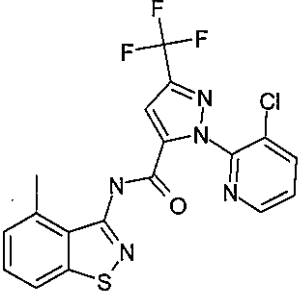
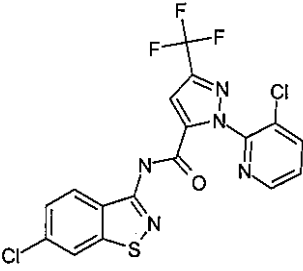
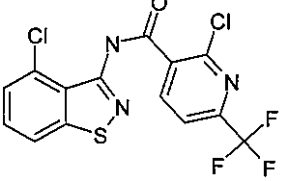
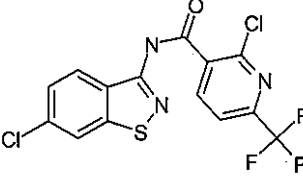
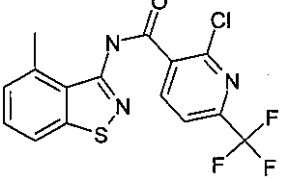
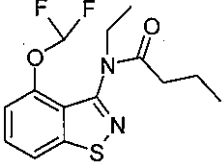
10

20

30

40

50

| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 112. |  | | t _r = 2.87 min, m/z= 309 [M+1] |
| 113. |  | | t _r = 3.28 min, m/z= 438 [M+1] |
| 114. |  | | t _r = 3.51 min, m/z= 458 [M+1] |
| 115. |  | | t _r = 3.12 min, m/z= 392 [M+1] |
| 116. |  | | t _r = 3.33 min, m/z= 392 [M+1] |
| 117. |  | | t _r = 3.09 min, m/z= 372 [M+1] |
| 118. |  | | t _r = 3.20 min, m/z= 315 [M+1] |

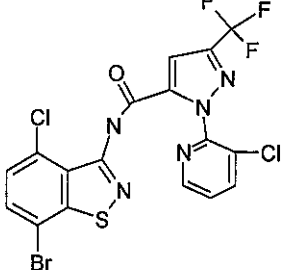
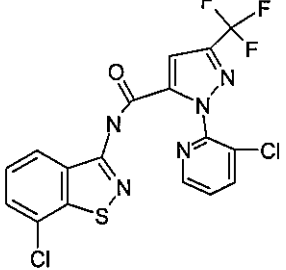
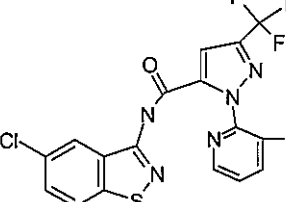
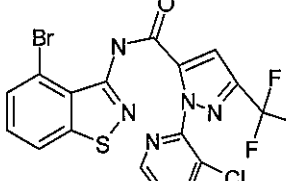
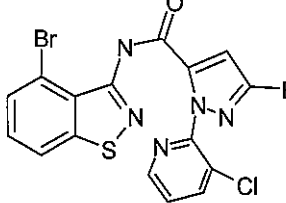
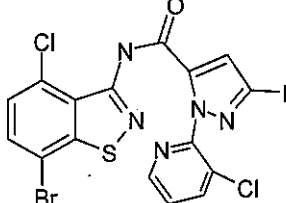
10

20

30

40

50

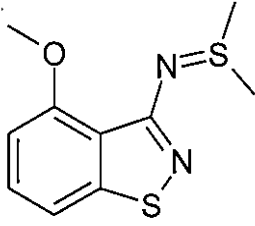
| 化合物 実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|------------|---|---------------------------|--|
| 119. |  | | t _r = 3.85 min, m/z= 538 [M+1] |
| 120. |  | | t _r = 3.78 min, m/z= 458 [M+1] |
| 121. |  | | t _r = 3.59 min, m/z= 460 [M+1] |
| 122. |  | | t _r = 3.54 min, m/z= 504 [M+1] |
| 123. |  | | t _r = 3.27 min, m/z= 514 [M+1] |
| 124. |  | | t _r = 3.62 min, m/z= 550 [M+1] |

10

20

30

40

| 化合物実施例 | 化合物の構造 | 融点 F _p [°C] | HPLC-MS (t _r = 保持時間)又は ¹ H NMR (in CDCl ₃): δ [ppm] |
|--------|---|---------------------------|--|
| 125. |  | | t _r = 1.91 min, m/z= 241 [M+1] |

10

【 0 2 3 7 】

合成実施例

S.1 4-ジフルオロメトキシ-3-S-ジメチル-チオニトロソ-ベンゾ[d]イソチアゾール1,1-ジオキシド [(表Cの)化合物実施例45]

ステップ1: S,S ジメチル-S-アミノスルホニウムメシチレンスルホネートを、Y. Tamuraら, Tetrahedron, 1975, 31, 3035-3040にしたがって調製した。

【 0 2 3 8 】

3-クロロ-4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール1,1-ジオキシドを、9.50g(38.1mmol)の4-ジフルオロメトキシ-サッカリン、6.8g(57.0mmol)の塩化チオニルおよび0.4mlのジメチルホルムアミド(DMF)を50mlの1,4-ジオキサソリンに添加し、29時間加熱還流することにより調製した。この混合物を室温まで冷却し、すべての揮発性成分を蒸留により除去した。9.3gの3-クロロ-4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール1,1-ジオキシド化合物が粗生成物として得られ、これをそれ以上精製することなく次のステップに使用した。

20

【 0 2 3 9 】

ステップ2: 0.51g(1.90mmol)の3-クロロ-4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール1,1-ジオキシドを室温で15mlのジクロロメタン中に溶解した。0.49gのHuenig塩基を加え、続いて1.05g(3.80mmol)のS,S ジメチル-S-アミノスルホニウムメシチレン-スルホネートを加えた。室温での攪拌を一晩続けた。溶媒を蒸留により除去し、残渣をシリカ(溶離液: シクロヘキサノール/酢酸エチル 1:1)により精製したところ、表Cの化合物実施例45が155mg(0.50mmol)得られた。

30

【 0 2 4 0 】

S.2 (4-クロロ-1,1-ジオキソ-1H-1λ⁶⁺-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イル)-(1-オキソ-テトラヒドロ-1λ⁶⁺-チオフェン-1-イリデン)-アミン [(表Cの)化合物実施例54]:

100mg(0.33mmol)の化合物5(化合物2と同様にして調製したもの)を2.5mlのジクロロメタン中に室温で溶解した。5mlの酢酸エチルに溶解した50mgの臭化テトラブチルアンモニウムを加え、続いて10mlの12.5wt.% NaOCl溶液を加えた。室温での攪拌を72時間続けた。水を加え、各層を分離させた。水層を酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を蒸留により除去し、残渣をシリカ(溶離液: シクロヘキサノール/酢酸エチル 1:2)により精製したところ、化合物11が20mg(0.06mmol)得られた。

40

【 0 2 4 1 】

S.3 N-エチル-N-(4-メトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イル)-アセトアミド [(表Cの)化合物実施例5]

ステップ1: 7.0g(42mmol)の4-メトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール[Drug.Res. 30(11), 11 (1980), 1831-1838]を150mlのメチルグリコールに溶解させ、4.7g(85mmol)のナトリウムメチラートを室温に加えた。この混合物を80°Cで4時間加熱し、次いで、さらに2.4g(42mmol)のナトリウムメチラートを加え、混合物を1時間攪拌した。2時間後、またさらに4時間後に、追加の2.4g(42mmol)のナトリウムメチラートを加えた。この混合物を室温で一晩攪拌した。得られたナトリウム塩は、それ以上精製を行うことなく使用した。

50

【0242】

この反応混合物に82g(1.3mol)のエチルアミン水溶液(70%)を加え、溶液を0~5℃に冷却し、20分かけて40gの12%次亜塩素酸ナトリウム水溶液を滴下添加した。混合物をこの温度で1時間攪拌し、次いで水を加え、生成物を酢酸エチルへ抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、溶媒を蒸留により除去し、残渣をシリカ(溶離液:シクロヘキサン/酢酸エチル)により精製したところ、エチル-(4-メトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イル)-アミンが5.7g(27mmol)得られた[¹H NMR (CDCl₃): [ppm] = 1.32 (t, 3H), 3.58 (q, 2H), 3.98 (s, 3H), 6.28 (bs, 1H), 6.62 (d, 1H), 7.30 (m, 2H)]。

【0243】

ステップ2: 0.5g(2.4mmol)のエチル-(4-メトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イル)-アミンを室温で20mlのアセトニトリルに溶解した。0.76g(9.6mmol)のピリジンを触媒量のジメチルアミノピリジンと一緒に加え、その後0.58g(7.2mmol)の塩化アセチルを加えた。室温での攪拌を一晩継続した。水を加え、生成物をジクロロメタンで抽出した。有機層をHCl水溶液(10%)、飽和重炭酸ナトリウム溶液および水で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を蒸留により除去し、残渣をシリカ(溶離液:シクロヘキサン/酢酸エチル)により精製したところ、(表Cの)化合物実施例5が0.47g(1.88mmol)得られた。

10

【0244】

S.4 N-(4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イル)-N-エチル-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド [(表Cの)化合物実施例26]

ステップ1: 40mlの濃HCl、20mlの水および20mlのエタノールの混合物を0~5℃に冷却した。10g(37mmol)の2-シアノ-3-ジフルオロメトキシ-ベンゼンスルホニルクロリド(WO 2006/56433)をその攪拌溶液に加え、続いて12.2g(0.19mol)の亜鉛粉を少量ずつ加えた。攪拌を室温で2時間続けた。水および酢酸エチルを加え、硫酸ナトリウムで有機層を乾燥させた。溶媒を蒸留により除去し、残渣をシリカ(溶離液:トルエン/アセトン)により精製したところ、2.62g(12mmol)の2-ジフルオロメトキシ-6-メルカプト-ベンズアミドが得られた。

20

【0245】

ステップ2: 2.1g(9.6mmol)の2-ジフルオロメトキシ-6-メルカプト-ベンズアミドを90mlのメタノールに溶解した。90mlの水に溶解した0.76gの水酸化カリウム(85%)の溶液を加えた。1.6gのヒドロキシルアミン-O-スルホン酸および1.26gの水酸化カリウム(85%)を90mlの水に溶解し、この溶液を0℃で前記反応混合物に滴下添加した。攪拌を0℃で3時間継続した。反応混合物をジクロロメタンで3回抽出した。水層をHCl水溶液(10%)で酸性化し、生成物をジクロロメタンで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を蒸発させ、1.2g(4.4mmol)の4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-オンを得た(m.p. 176~177℃)。

30

【0246】

ステップ3: 3.1g(14mmol)のジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-オンを室温で100mlのジクロロメタンに溶解した。1.13g(14mmol)のピリジンを加えた。4.0g(14mmol)の無水トリフルオロメタンスルホン酸を滴下添加した。室温での攪拌を2時間続けた。水を加え、生成物をジクロロメタンで抽出した。有機層をHCl水溶液(10%)および水で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を蒸留により除去したところ、4.3gのトリフルオロ-メタンスルホン酸4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イルエステルが得られた。これをそれ以上精製することなく次のステップに使用した。

40

【0247】

ステップ4: 0.5g(1.4mmol)の4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イルエステルを20mlのテトラヒドロフランに溶解し、0.23gのトリエチルアミンを加えた。この溶液を気体エチルアミンで5分間処理し、さらに30分間室温で攪拌した。水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を炭酸カリウム水溶液(5%)および水で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を蒸留により除去し、残渣をシリカ(溶離液:シクロヘキサン/酢酸エチル)により精製したところ、0.14g(0.46mmol)の(4-ジフルオロ

50

メトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イル)-エチルアミンが得られた。

【0248】

ステップ5：0.8g(3.4mmol)の(4-ジフルオロメトキシ-ベンゾ[d]イソチアゾール-3-イル)-エチルアミンを室温で50mlのアセトニトリルに溶解した。1.1g(13.4mmol)のピリジンを触媒量のジメチルアミノピリジンと一緒に加えた。20mlのアセトニトリルに溶解した0.72g(3.4mmol)の無水トリフルオロ酢酸の溶液を滴下添加した。室温で4時間攪拌を続けた。水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層をHCl水溶液(10%)および水で洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を蒸留により除去し、残渣をメチルtert-ブチルエーテルで処理することにより精製したところ、0.35g(1.03mmol)の(表Cの)化合物実施例26が得られた。

10

【0249】

B. 害虫に対する作用の生物学的実施例

他に記載のない限り、本活性化合物を50vol.%アセトン：50vol.%水の混合物中で製剤化した。溶液中には非イオン性界面活性剤(Kinetic(商標))を0.01%v/vで入れた。

【0250】

以下の試験では、本活性化合物を製剤化した溶液剤を300ppmの有効成分濃度まで希釈し、その希釈溶液を以下に記載した試験で施用した。

【0251】

害虫に対する式Iで表される化合物の作用は、以下の実験によって証明した。

【0252】

20

B.1 ワタアブラムシ(アフィス・ゴシピイ(*Aphis gossypii*))

子葉期のワタ植物に、処理の前に、アブラムシの主要コロニーから得た重度に蔓延している葉を各子葉の上面の上に置くことにより蔓延させた。アブラムシを一晩で移動させ、宿主葉を除いた。次いで、蔓延させた子葉を3秒間試験溶液に浸漬、攪拌し、換気フード中で乾燥させた。試験植物を25℃で相対湿度20~40%の蛍光下(光周期24時間)で保持した。5日後、処理植物におけるアブラムシの死滅率を未処理の比較対照植物群における致死率と比べることにより判定した。

【0253】

この試験では、化合物実施例の1~25、27~59、76~78、80~83、86、87、89、91、92、94、96~103、105、106、108、115、118および125が、300ppmにおいて、未処理対照群と比較して少なくとも89%のワタアブラムシ(アフィス・ゴシピイ、混合ライフステージ)の致死率を示した。

30

【0254】

B.2 モモアカアブラムシ(ミズス・ペルシカエ(*Myzus persicae*))

第1本葉期のピーマン植物に、処理前に、試験植物の最上部にアブラムシの主要コロニーから得た重度に蔓延している葉を置くことにより蔓延させた。一植物当たり30~40匹のアブラムシが蔓延するように一晩アブラムシを移動させ、宿主葉を取り除いた。次いで、蔓延させた試験植物の葉を3秒間試験溶液に浸漬、攪拌し、換気フード中で乾燥させた。試験植物を25℃で相対湿度20~40%の蛍光下(光周期24時間)で保持した。5日後、処理植物における死滅率を未処理の比較対照植物群における致死率と比べることにより判定した。

40

【0255】

この試験では、化合物実施例の1~19、25、27~43、44~52、55~59、76、77、82、83、87、89~91、96~98、100~103、118および125が、300ppmにおいて、未処理対照群と比較して少なくとも89%のモモアカアブラムシの致死率を示した。

【0256】

B.3 マメアブラムシ(アフィス・クラッキボラ(*aphis craccivora*))

1:1(vol:vol)の蒸留水：アセトンの混合物中に、活性化合物を所望の濃度で溶解させる。試験溶液は使用する日に調製する。

【0257】

様々なステージの約100~150匹のアブラムシがコロニーを形成している鉢植えのササゲ

50

植物に、この害虫個体群の記録をとった後、噴霧した。24時間後、72時間後、および120時間後に個体群の減少を記録した。

【0258】

この試験では、化合物76、77、81、82、87、90～92、94、96～103、105、106、108および118が、300ppmにおいて、未処理対照群と比較して89%を超える致死率を示した。

【0259】

B.4 南方アワヨトウ(スポドプテラ・エリダニア(*spodoptera eridania*))、第2齢幼虫 50:50のアセトン:水(vol)および100ppmのKinetica(商標)界面活性剤中で活性化化合物を製剤化した。

【0260】

シーバライマメ(*Sieva lima bean*)の一組の第1本葉を試験溶液に浸漬し、乾燥させた。その後、これらの葉を有孔プラスチックジップバッグに入れ、10匹の第2齢幼虫を加えた。4日後、致死率および給餌阻害について観察した。

【0261】

この試験では、化合物74、75および113が、300ppmにおいて、未処理対照群と比較して89%を超える致死率を示した。

【0262】

B.5 コナガ(プルテラ・キシロステラ(*plutella xylostella*))

1:1(vol:vol)の蒸留水:アセトン混合物中に、活性化化合物を所望の濃度で溶解させる。試験溶液は使用する日に調製する。

【0263】

白菜の葉を試験溶液に浸漬し、風乾した。湿った濾紙で内側を覆ったペトリ皿に処理した白菜の葉を置き、第3齢幼虫を入れた。処理した24、72および120時間後に致死率を記録した。

【0264】

この試験では、化合物105および113が、300ppmにおいて、未処理対照群と比較して89%を超える致死率を示した。

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月28日(2009.9.28)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

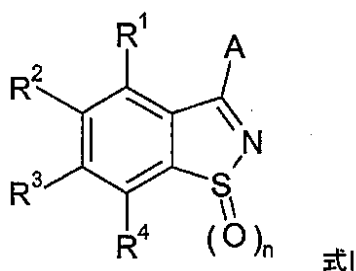
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】

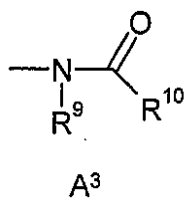


[式中、

nは、0、1または2であり；

Aは、A³：

【化2】



であり、

R⁹は、水素、C(=O)-R^c、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニルおよびナフチル、ならびに、O、S、SO、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個の非置換または置換ヘテロ原子を環員として含有する5員もしくは6員の複素環式芳香族基または3員~7員の飽和もしくは部分不飽和の複素環基から選択され、この場合、複素環基は、1、2または3個のCO基を環員としてさらに含有していてもよく、また、脂肪族基は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく、またこの場合、環状基の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシおよびC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R¹⁰は、R⁹に従属的に選択され、

ここで、

R⁹が水素およびCOR^c以外の置換基から選択される場合には、R¹⁰は下記のR¹²に関して定義した置換基から選択され；

あるいは、

R⁹が水素またはCOR^cから選択される場合には、R¹⁰は、O、CO、S、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和または芳香族の5員~7員複素環基から選択され、この場合、前記複素環の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、ならびにO、CO、S、SO₂、N、NHまたはN-C₁-C₆-アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している5員もしくは6員の芳香族複素環および芳香族の8員、9員もしくは10員の縮合二環式複素環系からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、それぞれの芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコ

キシ、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_2-C_{10} -ハロアルケニル、 C_2-C_{10} -ハロアルキニル、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_2-C_{10} -アルコキシカルボニル、 C_1-C_{10} -アルキルアミノカルボニル、 C_1-C_{10} -ジアルキルアミノカルボニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_3-C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3-C_{10} -シクロアルキルアミノおよび C_2-C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

$R^{1,2}$ は、 OR^d 、 NR^aR^b 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ナフチル、および、O、CO、S、 SO_2 、N、NHまたはN- C_1-C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和または芳香族の5員~7員複素環基から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子および複素環の環員は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、OH、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、フェニル、ならびにO、CO、S、 SO_2 、N、NHまたはN- C_1-C_6 -アルキルから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有している5員もしくは6員の芳香族複素環および芳香族の8員、9員もしくは10員の縮合二環式複素環系からなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、それぞれの芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_2-C_{10} -ハロアルケニル、 C_2-C_{10} -ハロアルキニル、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルコキシカルボニル、 C_1-C_{10} -アルキルアミノカルボニル、 C_1-C_{10} -ジアルキルアミノカルボニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_3-C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3-C_{10} -シクロアルキルアミノおよび C_1-C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^1 は、CN、 NO_2 、 NH_2 、アジド、ハロゲン、スルホニルアミノ、スルフェニルアミノ、スルフィニルアミノ、 $C(=O)R^c$ 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルフェニルおよび C_1-C_{10} -アルキルスルホニルから選択され、この場合、 C_3-C_{10} -シクロアルキルおよび記載の脂肪族基の炭素原子は、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 $(C_1-C_{10}$ -アルコキシ)カルボニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、 C_3-C_8 -シクロアルキルおよびフェニルからなる群から選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシおよび C_1-C_{10} -ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよく；

R^2 、 R^3 および R^4 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、アジド、 COR^c 、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_3-C_{10} -シクロアルキル、 C_1-C_{10} -ハロアルキル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルチオ、 C_1-C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1-C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1-C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1-C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル、 $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、ジ- $(C_1-C_{10}$ -アルキル)アミノ、スルホニル、スルホニルアミノ、スルフェニルアミノおよびスルファニルアミノから選択され；

またここで、

R^a および R^b は、互いに独立して、水素、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、アリール、および芳香族の飽和、部分不飽和または完全不飽和複素環からなる群から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、ハロゲンもしくは C_1 - C_{10} -アルキルで部分的または完全に置換されていてもよく；

R^c は、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルアミノ、ジ(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、アリールおよび飽和、部分不飽和または芳香族の3員~7員複素環(これは、O、S、SO、 SO_2 、N、NHおよびN- C_1 - C_6 -アルキルからなる群から選択される1、2もしくは3個の非置換もしくは置換ヘテロ原子を環員として含有していてもよい)からなる群から選択され、この場合、記載した全ての基の炭素原子は、非置換であるか、または部分的もしくは完全にハロゲンもしくは C_1 - C_{10} -アルキルで置換されていてもよく；

R^d は、水素、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、アリールおよび芳香族の飽和、部分的不飽和または完全不飽和複素環からなる群から選択される]

で表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩。

【請求項2】

n が1である、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項3】

n が0である、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項4】

R^1 がハロゲン、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシおよび C_1 - C_{10} -ハロアルコキシから選択される、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項5】

R^1 がハロゲン、 C_1 - C_{10} -アルコキシおよび C_1 - C_{10} -ハロアルコキシから選択される、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項6】

R^1 がフルオロ、クロロ、ジフルオロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリフルオロメトキシまたはトリクロロメトキシから選択される、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項7】

R^2 、 R^3 および R^4 が水素およびF、Cl、BrまたはIからなる群から互いに独立して選択される、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項8】

R^2 、 R^3 および R^4 が水素またはフルオロから互いに独立して選択される、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項9】

R^2 、 R^3 および R^4 が水素である、請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項10】

R^9 が C_1 - C_6 -アルキルであり、

R^{10} が OR^d 、 NR^aR^b 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_3 - C_{10} -シクロアルキルおよびフェニルから選択され、この場合、前記の基は非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルコキシカ

ルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキルおよびフェニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、フェニルに関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシおよびC₁-C₁₀-ハロアルコキシからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項11】

R⁹が水素またはC₁-C₆-アルキルから選択され；

R¹⁰がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ピペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフェン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、および5員または6員の芳香族複素環からなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルキニル、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₂-C₁₀-アルコキシカルボニル、C₂-C₁₀-アルキルアミノカルボニル、C₃-C₁₀-ジアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルアミノ、C₁-C₁₀-アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項12】

R⁹が水素またはC₁-C₆-アルキルから選択され；

R¹⁰がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ピペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフェン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、ピリジン、ピリミジン、チオフェン、イソオキサゾールおよびイソチアゾールからなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルキニル、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニルおよびC₁-C₁₀-ハロアルキルチオからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 1 3】

R^1 がハロゲン、 C_1 - C_6 -アルコキシまたは C_1 - C_6 -ハロアルコキシから選択され、
 R^2 、 R^3 および R^4 が水素、F、Cl、BrまたはIからなる群から互いに独立して選択される、
 請求項1または2に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 1 4】

R^1 がハロゲン、 C_1 - C_6 -アルコキシまたは C_1 - C_6 -ハロアルコキシから選択され、
 R^2 、 R^3 および R^4 が水素である、
 請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 1 5】

R^1 が C_1 - C_6 -アルコキシまたは C_1 - C_6 -ハロアルコキシから選択され；
 R^2 、 R^3 および R^4 が水素、F、Cl、BrまたはJからなる群から互いに独立して選択され；
 R^9 が C_1 - C_6 -アルキルであり；
 R^{10} が C_1 - C_{10} -アルキル、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ
 および C_3 - C_{10} -シクロアルキルから選択され、ここで、記載した全ての基の炭素原子は、
 非置換であるか、部分的または完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、N
 O_2 、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 -
 C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_1 - C_{10} -
 アルコキシカルボニル、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、 C_3 - C_1
 0 -シクロアルキル、フェニルまたは5員もしくは6員の芳香族複素環からなる群から互いに
 独立して選択される1個または複数の基を有していてもよく、各環に関しては、非置換で
 あるか、部分的または完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2
 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキル、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ
 、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル、 C_2 - C_{10} -ハロアルケニル、 C_2 - C_{10} -ハロアルキ
 ニル、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニ
 ル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオ、 C_2 - C_{10} -アルコキシカルボニル、 C_1 - C_{10} -アルキルアミノ
 カルボニル、 C_1 - C_{10} -ジアルキルアミノカルボニル、(C_1 - C_{10} -アルキル)アミノ、ジ-(C_1 - C
 10 -アルキル)アミノ、 C_3 - C_{10} -シクロアルキル、 C_3 - C_{10} -ハロシクロアルキル、 C_3 - C_{10} -シ
 クロアルキルアミノ、 C_1 - C_{10} -アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択さ
 れる1個または複数の置換基を有していてもよい、
 請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 1 6】

n が0である場合、
 R^1 が C_1 - C_6 -アルコキシまたは C_1 - C_6 -ハロアルコキシから選択され；
 R^2 、 R^3 および R^4 が水素であり；
 R^9 が C_1 - C_6 -アルキルであり；
 R^{10} が C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルまたはフェニルから選択され、ここで、
 これらの基の炭素原子または炭素環は非置換であるか、部分的または完全にハロゲン化さ
 れられていてもよく、かつ/または、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_1 - C_{10} -アルキル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキル
 、 C_1 - C_{10} -アルコキシ、 C_1 - C_{10} -ハロアルコキシ、 C_2 - C_{10} -アルケニル、 C_2 - C_{10} -アルキニル
 、 C_2 - C_{10} -ハロアルケニル、 C_2 - C_{10} -ハロアルキニル、 C_1 - C_{10} -アルキルチオ、 C_1 - C_{10} -アル
 キルスルフィニル、 C_1 - C_{10} -アルキルスルホニル、 C_1 - C_{10} -ハロアルキルチオからなる群か
 ら互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、
 請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項 1 7】

n が0である場合、
 R^1 が C_1 - C_6 -アルコキシまたは C_1 - C_6 -ハロアルコキシから選択され；
 R^2 、 R^3 および R^4 が水素であり；
 R^9 が水素または C_1 - C_6 -アルキルから選択され；
 R^{10} がピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、
 チオフェン、チアゾール、オキサゾール、フラン、イソチアゾール、イソオキサゾール、

ピペリジン、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、チオラン、ジヒドロチオフエン、ピロリジン、ジヒドロピロール、ジヒドロピラゾール、ジヒドロオキサゾール、ジヒドロチアゾール、オキサチオランまたはオキサゾリジンから選択され、各環は、場合により、CN、OH、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₁-C₁₀-アルコキシカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、フェニル、および5員または6員の芳香族複素環からなる群から互いに独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、芳香族環または芳香族複素環に関しては、非置換であるか、部分的もしくは完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/または、CN、NO₂、NH₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₁-C₁₀-アルコキシ、C₁-C₁₀-ハロアルコキシ、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルキニル、C₁-C₁₀-アルキルチオ、C₁-C₁₀-アルキルスルフィニル、C₁-C₁₀-アルキルスルホニル、C₁-C₁₀-ハロアルキルチオ、C₂-C₁₀-アルコキシカルボニル、C₂-C₁₀-アルキルアミノカルボニル、C₃-C₁₀-ジアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、ジ-(C₁-C₁₀-アルキル)アミノ、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルアミノ、C₂-C₁₀-アルキルカルボニルからなる群から互いに独立して選択される1個または複数の置換基を有していてもよい、

請求項1に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物。

【請求項18】

請求項1~17のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、少なくとも1種の不活性液体担体および/または固体担体とを含む組成物。

【請求項19】

殺虫剤として有効な量の請求項1~17のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは農業上有用な塩と、少なくとも1種の不活性液体および/または固体の農業上許容可能な担体とを含み、所望により少なくとも1種の界面活性剤を含む、農薬組成物。

【請求項20】

昆虫、蛛形類または線虫を駆除または防除する方法であって、昆虫、蛛形類もしくは線虫またはそれらの食糧、生息地または繁殖場所を、殺虫剤として有効な量の請求項1~17のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、あるいは式Iで表される少なくとも1種のかかる化合物を含む組成物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項21】

昆虫、蛛形類または線虫による攻撃または加害から生育中の植物を保護する方法であって、植物または植物が生育している土壌もしくは水を、殺虫剤として有効な量の請求項1~17のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、あるいは式Iで表される少なくとも1種のかかる化合物を含む組成物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項22】

動物害虫が同翅目または総翅目から選択される、請求項20または21に記載の方法。

【請求項23】

土壌昆虫から種子を、ならびに土壌昆虫および食葉性昆虫から実生の根およびシュートを保護する方法であって、播種前および/または発芽前処理後の種子を、請求項1~17のいずれか1項に記載の少なくとも1種の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と、あるいは式Iで表される少なくとも1種のかかる化合物を含む組成物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項 24】

式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物を種子100kg当たり100mg～10kgの量で施用する、請求項23に記載の方法。

【請求項 25】

生じる植物の根およびシュートが保護される、請求項23に記載の方法。

【請求項 26】

生じる植物のシュートがアブラムシから保護される、請求項23に記載の方法。

【請求項 27】

請求項1～17のいずれか1項に記載の式Iで表される3-アミノ-1,2-ベンゾイソチアゾール化合物または式Iの農業上有用な塩を種子100kg当たり0.1g～10kgの量で含む種子。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

| | | International application No PCT/EP2008/050337 |
|---|---|---|
| A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D275/06 C07D275/04 C07D417/12 C07D417/14 A01N43/80 | | |
| According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC | | |
| B. FIELDS SEARCHED | | |
| Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N | | |
| Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched | | |
| Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data | | |
| C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
| X A | EP 0 033 984 A (DUPHAR INT RES [NL]) 19 August 1981 (1981-08-19) cited in the application claims 1,3,11,14,17; examples III-VI | 1,2,4,5, 7-12, 17-21, 23-35 3,13,15, 16,22 |
| X A | EP 0 110 829 A (CIBA GEIGY AG [CH]) 13 June 1984 (1984-06-13) cited in the application claims; examples 2-7 | 1,2,4,5, 7-12, 17-21, 23-35 3,13,15, 16,22 |
| ----- -/- | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. | | <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex. |
| * Special categories of cited documents : | | |
| *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance | | *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention |
| *E* earlier document but published on or after the international filing date | | *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone |
| *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) | | *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. |
| *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means | | *Z* document member of the same patent family |
| *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed | | |
| Date of the actual completion of the international search 12 September 2008 | | Date of mailing of the international search report 01/10/2008 |
| Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016 | | Authorized officer Ladenburger, Claude |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2008/050337

| C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
|--|--|---|
| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
| X A | EP 0 133 418 A (CIBA GEIGY AG [CH]) 20 February 1985 (1985-02-20) cited in the application claims; examples | 1,2,4,5, 7-12, 17-21, 23-35 3,13,15, 16,22 |
| X A | DE 35 44 436 A1 (CIBA GEIGY AG [CH]) 19 June 1986 (1986-06-19) cited in the application claims; examples | 1,2,4,5, 7-12, 17-21, 23-35 3,13,15, 16,22 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2008/050337**Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain Claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:

see additional sheet

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.
1(part), 2, 3(part), 4, 5, 7-12(part), 13, 15(part), 16(part), 17-19
20-22(part), 23-25, 26-35(part)
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

International Application No. PCT/EP2008/050337

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. claims: 1(part), 3(part), 7-12(part), 13, 15(part), 16(part), 20-22(part), 26-35(part)

compounds of formula I wherein A is A1

2. claims: 1(part), 3(part), 7-12(part), 14, 15(part), 16(part), 20-22(part), 26-35(part)

compounds of formula I wherein A is A2

3. claims: 1(part), 2(part), 4(part), 5(part), 7-12(part), 17, 18-21(part), 23, 24, 25-35(part)

compounds of formula I wherein A is A3 and R9 is selected from substituents other than H and CORc

4. claims: 1(part), 2(part), 4(part), 5(part), 7-12(part), 18-21(part), 25-35(part)

compounds of formula I wherein A is A3 and R9 is H or CORc

5. claims: 1(part), 6, 7-12(part), 20(part), 21(part), 26-35(part)

compounds of formula I wherein A is A4

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2008/050337

| Patent document cited in search report | | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|--|------------|------------------|-------------------------|------------------|
| EP 0033984 | A | 19-08-1981 | AR 226871 A1 | 31-08-1982 |
| | | | AU 6636081 A | 30-07-1981 |
| | | | BR 8100281 A | 04-08-1981 |
| | | | CA 1167043 A1 | 08-05-1984 |
| | | | CS 219348 B2 | 25-03-1983 |
| | | | DD 157071 A5 | 13-10-1982 |
| | | | DE 3162624 D1 | 12-07-1984 |
| | | | DK 24181 A | 24-07-1981 |
| | | | ES 8200654 A1 | 01-02-1982 |
| | | | ES 8201965 A1 | 01-04-1982 |
| | | | GR 72782 A1 | 05-12-1983 |
| | | | HU 186379 B | 29-07-1985 |
| | | | IE 50835 B1 | 23-07-1986 |
| | | | IL 61942 A | 29-11-1985 |
| | | | JP 56120664 A | 22-09-1981 |
| | | | NZ 196046 A | 12-04-1983 |
| | | | PL 229285 A1 | 13-04-1982 |
| | | | RO 81451 A1 | 02-04-1984 |
| | | | SU 1093247 A3 | 15-05-1984 |
| | | | US 4379157 A | 05-04-1983 |
| | | | YU 14981 A1 | 31-10-1983 |
| ZA 8100382 A | 24-02-1982 | | | |
| EP 0110829 | A | 13-06-1984 | AU 570654 B2 | 24-03-1988 |
| | | | AU 2169183 A | 31-05-1984 |
| | | | BR 8306506 A | 03-07-1984 |
| | | | CA 1211117 A1 | 09-09-1986 |
| | | | DE 3382093 D1 | 07-02-1991 |
| | | | DK 540983 A | 27-05-1984 |
| | | | ES 8505975 A1 | 16-10-1985 |
| | | | IL 70317 A | 30-01-1987 |
| | | | MA 19959 A1 | 01-07-1984 |
| | | | NZ 206402 A | 29-05-1987 |
| | | | PH 20434 A | 05-01-1987 |
| | | | US 4760076 A | 26-07-1988 |
| EP 0133418 | A | 20-02-1985 | JP 60056969 A | 02-04-1985 |
| | | | US 4698358 A | 06-10-1987 |
| DE 3544436 | A1 | 19-06-1986 | NONE | |

フロントページの続き

(51) Int. Cl. F I テーマコード (参考)
C 0 7 D 417/14 (2006.01) C 0 7 D 417/12
 C 0 7 D 417/14

(81) 指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

(74) 代理人 100122389

弁理士 新井 栄一

(72) 発明者 フォン ディーン, ヴォルフガング

ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 5 ノイシュタット, アン デア ブライヒ 2 4

(72) 発明者 ポールマン, マティアス

ドイツ連邦共和国 6 7 2 5 1 フラインスハイム, アム ランゲンstein 1 3

(72) 発明者 カイザー, フローリアン

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, シュベルツェンシュトラーセ 9

(72) 発明者 ディックハウト, ヨアヒム

ドイツ連邦共和国 6 9 1 2 1 ハイデルベルク, クライン レーピングスガッセ 4 / 3

(72) 発明者 アンスポー, ダグラス ディー.

アメリカ合衆国 2 7 5 0 2 ノースカロライナ州, アペックス, ワインコット ドライブ 4 0 0 7

(72) 発明者 カルバートソン, デボラ エル.

アメリカ合衆国 2 7 5 2 6 ノースカロライナ州, フクウェイ ヴァリナ, ピンテージ リッジ レーン 6 4 0 0

(72) 発明者 オロウミ - サデギ, ハッサン

アメリカ合衆国 2 7 6 1 4 ノースカロライナ州, ローリー, ポウリーズ ミル サークル 1 2 1 0 5

F ターム(参考) 4C033 AA02 AA07 AA12 AA17

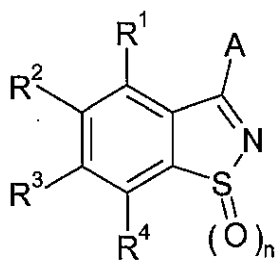
4C063 AA01 AA03 BB09 CC61 CC92 CC97 DD12 DD22 DD61 EE03

4H011 AC01 AC04 BA01 BB10 BC05 BC18

【要約の続き】

とを含む方法; 土壌昆虫から種子を、ならびに土壌昆虫および食葉性昆虫から実生の根およびシュートを保護する方法であって、播種前および/または発芽前処理後の種子を、少なくとも1種の式(I)で表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩と接触させることを含む方法; 式(I)で表される化合物またはそのエナンチオマー、ジアステレオマーもしくは塩を含む種子を提供する。

【化1】



I

