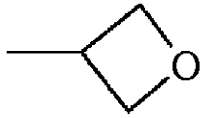


$-CH_2-F$ 、 $-CH_2-CH_2-OH$ 、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 又は

【化2】



であり；

R^{2a} は、水素、トリフルオロメチル、シアノ、 $CONH_2$ 、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} は、水素、塩素、トリフルオロメチル、メトキシ又は $NHCOCH_3$ であり；

R^3 は、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチル、塩素、 $4-CF_3(C_6H_4)$ 、 $4-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル、 $3-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル又は $4-(CF_3)$ イミダゾール-1-イルであり；

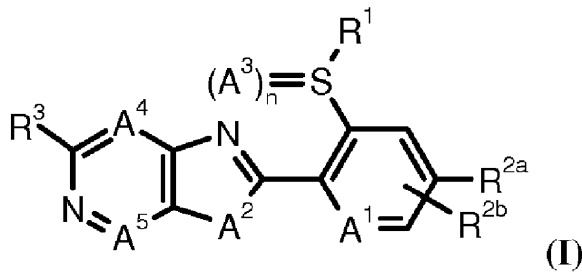
n は、0、1又は2である]

で表される化合物。

【請求項2】

式(I)

【化3】



〔式中、

A^1 は、窒素(N)又は $=C-H$ であり；

A^2 は、 $-N-CH_3$ 又は酸素(O)であり；

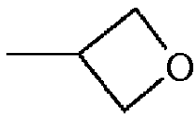
A^3 は、酸素であり；

A^4 は、窒素(N)又は $=C-H$ であり；

A^5 は、 $=C-H$ であり；

R^1 は、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、トリフルオロメチル、 $-CH_2-CH_2-F$ 、 $-CH_2-CH_2-OH$ 、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 又は

【化4】



であり；

R^{2a} は、水素、トリフルオロメチル、シアノ、 $CONH_2$ 、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} は、メトキシ、エトキシ又は $NHCO$ -メチルであり；

R^3 は、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチル、塩素、 $4-CF_3(C_6H_4)$ 、 $4-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル、 $3-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル又は $4-$

(CF₃)イミダゾール-1-イルであり；
nは、0、1又は2である]

で表される化合物。

【請求項3】

R¹、R^{2 a}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnが、それぞれ、請求項1で定義されている通りであり；及び、

R^{2 b}が、メトキシ又はNHCOCH₃である；

請求項1に記載の式(I)で表される化合物。

【請求項4】

組成物であって、請求項1に記載の式(I)で表される少なくとも1種類の化合物並びに慣習的な増量剤及び/又は界面活性剤を含んでいることを特徴とする、前記組成物。

10

【請求項5】

有害生物を防除する方法であって、請求項1に記載の式(I)で表される化合物又は請求項4に記載の組成物を該有害生物及び/又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とし、ただし、人間における有害生物を防除する方法を除く、前記方法。

【請求項6】

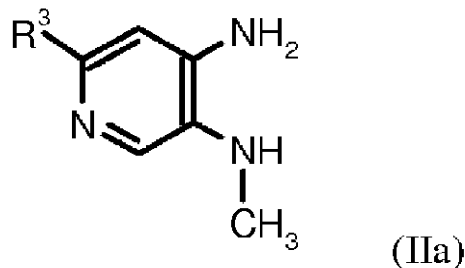
有害生物を防除するための、請求項1に記載の式(I)で表される化合物又は請求項4に記載の組成物の使用、ただし、人間への使用を除く、前記使用。

【請求項7】

式(IIa)

20

【化5】



30

〔式中、

R³は、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル又は(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニルであり、その際、R³は、CF₃又はCHF₂ではない]

で表される化合物。

【請求項8】

R³が、CH₂F、C₂H₄F、C₂H₃F₂、C₂H₂F₃、C₂HF₄、C₂F₅、n-C₃F₇、i-C₃F₇、OCH₂F、SCH₂F、SOCH₂F、SO₂CH₂F、OCHF₂、SCHF₂、SOCHF₂、SO₂CHF₂、OCF₃、OCF₂Cl、OCFC1₂、SCF₃、SOCF₃、SO₂CF₃、OC₂H₄F、SC₂H₄F、SOC₂H₄F、SO₂C₂H₄F、OC₂H₃F₂、SC₂H₃F₂、SOC₂H₃F₂、SO₂C₂H₃F₂、OC₂H₂F₃、SC₂H₂F₃、SOC₂H₂F₃、SO₂C₂H₂F₃、OC₂HF₄、SC₂HF₄、SOC₂HF₄、SO₂C₂HF₄、OC₂F₅、SC₂F₅、SOC₂F₅、SO₂C₂F₅、n-OC₃F₇、n-SC₃F₇、n-SOC₃F₇、n-SO₂C₃F₇、i-OC₃F₇、i-SC₃F₇、i-SOC₃F₇又はi-SO₂C₃F₇である；

請求項7に記載の式(IIa)で表される化合物。

【請求項9】

R³が、CH₂F、OCF₃、C₂H₄F、C₂H₃F₂、C₂H₂F₃、C₂HF₄

50

、 C_2F_5 、 SCF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である；
請求項 7 に記載の式 (I I a) で表される化合物。

【請求項 10】

R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、下記表中の実施例 I - 1 ~ 実施例 I - 77 において定義されているとおりであり、ただし A^3 が酸素である、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

実施例	R^1	n	A^4	A^5	R^3	A^2	A^1	R^{2a}	R^{2b}
I-1	CH_3	0	N	CH	CF_3	O	CH	Cl	H
I-2	C_2H_5	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-3	CH_3	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-4	CH_3	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	F	H
I-5	CH_3	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	CF_3	H
I-6	CH_3	0	N	CH	CF_3	N-メチル	CH	Cl	H
I-7	$-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-8	$i-C_3H_7$	1	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-9	C_2H_5	0	N	CH	CF_3	O	CH	H	H
I-10	CH_3	1	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	Cl	H
I-11	CH_3	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	Cl	H
I-12	CH_3	1	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	F	H
I-13	C_2H_5	1	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-14	CH_3	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	CF_3	H
I-15	C_2H_5	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	H	H
I-16	$i-C_3H_7$	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-17	C_2H_5	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	H	H
I-18	C_2H_5	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	H	H
I-19	C_2H_5	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-20	CH_3	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	F	H
I-21	C_2H_5	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-22	C_2H_5	1	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	H	H
I-23	$-(CH_2)_2-S-C_2H_5$	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-24	C_2H_5	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	H	H
I-25	CH_3	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	Cl	H
I-26	CH_3	1	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-27	オキセタン-3-イル	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	H	H
I-28	C_2H_5	0	N	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-29	CF_3	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	H	H
I-30	CH_3	1	CH	CH	CF_3	N-メチル	CH	CF_3	H
I-31	$n-C_3H_7$	0	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H
I-32	$n-C_3H_7$	2	CH	CH	CF_3	N-メチル	N	CF_3	H

10

20

30

40

実施例	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-33	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-36	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-37	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-40	オキセタン-3-イル	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-42	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-43	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-44	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-45	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-46	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-47	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	CF ₃	H
I-48	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-49	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-NHCOMe*
I-50	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-NHCOMe*
I-51	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-52	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-メチル	N	CF ₃	H
I-53	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*

10

20

30

40

実施例	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-54	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-55	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-メチル	N	CF ₃	H
I-56	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CONH ₂	H
I-57	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-58	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-59	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-60	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CONH ₂	H
I-61	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-62	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	3-Cl*
I-63	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	CF ₃	H
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-メチル	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)ピラ ゾール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃)ピラ ゾール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *

10

20

30

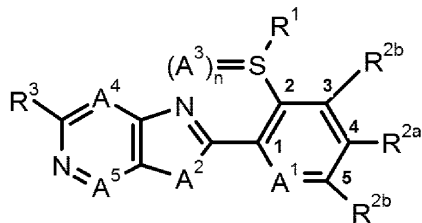
40

実施例	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)イミダゾール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)イミダゾール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)ピラゾール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃)ピラゾール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H

10

20

ここで、上記表において「*」印が付された R^{2b} は、次式で示されているとおり 3 位又は 5 位で結合している：

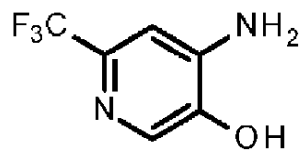


30

【請求項 11】

式 (II-02)

【化 6】



40

で表される化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式 (I) で表される新規 2 - (ヘタ) アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体、害虫 (animal pest) を防除するための、特に、節足動物 (とりわけ、昆虫類及びクモ形類動物) を防除するための、殺ダニ剤及び / 又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを調製するための調製方法及び中間体に関する。

50

【0002】

殺虫特性を有している2-(ヘタ)アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体は、文献中に、例えば、WO 2010/125985、WO 2012/074135、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2014/142292及びWO 2014/148451、並びに、さらに、WO 2015/000715などの中に、既に記載されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】国際特許出願公開第2010/125985号

10

【特許文献2】国際特許出願公開第2012/074135号

【特許文献3】国際特許出願公開第2012/086848号

【特許文献4】国際特許出願公開第2013/018928号

【特許文献5】国際特許出願公開第2014/142292号

【特許文献6】国際特許出願公開第2014/148451号

【特許文献7】国際特許出願公開第2015/000715号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

しかしながら、上記で引用されている文献によって既に知られている活性成分は、狭い適用範囲しか示さないという理由で、又は、十分な殺虫活性若しくは殺ダニ活性を有していないという理由で、施用において幾つか不利点を有している。

20

【課題を解決するための手段】

【0005】

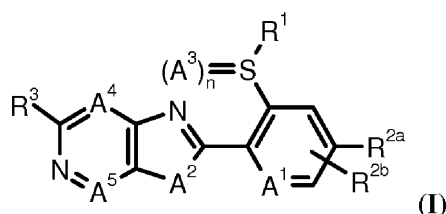
新規2-(ヘタ)アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体が見いだされ、そして、これらは、既に知られている化合物よりも有利点を有している。そのような有利点の例は、より良好な生物学的特性又は環境に関する特性、より広い範囲の施用方法、向上した殺虫活性又は殺ダニ活性、及び、さらに、作物植物との良好な適合性である。該2-(ヘタ)アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体は、効力(特に、防除が困難な昆虫類に対する効力)を向上させるための別の作用剤と組合せて使用することが可能である。

30

【0006】

従って、本発明は、式(I)

【化1】



40

【0007】

〔式中、

A¹ は、窒素、= N⁺ - O⁻ 又は = C - R⁴ であり；

A² は、- N - R⁵、酸素又は硫黄であり；

A³ は、酸素、= N - H 又は = N - CN であり；

A⁴ は、窒素、= N⁺ - O⁻ 又は = C - R⁴ であり；

A⁵ は、窒素、= N⁺ - O⁻ 又は = C - R⁴ であり；

R¹ は、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル、(C₁ - C₆) シアノアルキル、(C₁ - C₆) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ -

50

C_6) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) アルケニル、($C_2 - C_6$) アルケニルオキシ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルケニルオキシ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) アルキニル、($C_2 - C_6$) アルキニルオキシ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルキニルオキシ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルキニル、($C_2 - C_6$) シアノアルキニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル - ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキル - ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、ハロ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、アミノ、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノ、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニルアミノ、($C_1 - C_6$) アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキルであり；又は、

10

20

($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_2 - C_6$) アルケニル、($C_2 - C_6$) アルキニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように1置換又は多置換されており、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) 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、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) トリアルキルシリル又はベンジルで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよい]であり；又は、

30

R^1 は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) 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、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) トリアルキルシリル、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は

40

50

(=O)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) で同じように又は異なるように1置換又は多置換されている] であり;

R^{2a}、R^{2b}、R³及びR⁴は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C₁-C₆)アルキルシリル、(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₃-C₈)シクロアルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)ハロアルキル、(C₁-C₆)シアノアルキル、(C₁-C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)ハロアルケニル、(C₂-C₆)シアノアルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)ハロアルキニル、(C₂-C₆)シアノアルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)ハロアルコキシ、(C₁-C₆)シアノアルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)アルキル-(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)ハロアルキル-(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)ハロアルキルチオ、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルチオ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルカルボニル、(C₁-C₆)アルキルチオカルボニル、(C₁-C₆)ハロアルキルカルボニル、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、(C₁-C₆)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₂-C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ(C₂-C₆)-アルケニルアミノカルボニル、(C₃-C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁-C₆)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁-C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₃-C₈)シクロアルキルアミノであり;

アリール又はヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように1置換又は多置換されており、その際、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである: シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C₁-C₆)アルキルシリル、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)ハロアルキル、(C₁-C₆)シアノアルキル、(C₁-C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁-C₆)-アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)ハロアルケニル、(C₂-C₆)シアノアルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)ハロアルキニル、(C₂-C₆)シアノアルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)ハロアルコキシ、(C₁-C₆)シアノアルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)アルキル-

10

20

30

40

50

$C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル - $(C_1 - C_6)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニルアミノカルボニル、ジ $(C_2 - C_6)$ - アルケニルアミノカルボニル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルアミノ] であり；

R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_6)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルケニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルキニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルキニル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル - $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキル - $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルチオ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルフィニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルホニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルカルボニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシカルボニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、アミノカルボニル - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ - $(C_1 - C_6)$ アルキル又は $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルアミノ - $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

ここで、 $n = 2$ である場合、 A^3 の意味は、同一でも又は異なってもよい] で表される新規化合物を提供する。

【0008】

さらに、式 (I) で表される化合物が、殺有害生物剤として、好ましくは、殺虫剤及び/又は殺ダニ剤として、極めて優れた効力を有して、及び、さらに、概して、植物との極めて良好な適合性、特に、作物植物に関して、植物との極めて良好な適合性を示すと

10

20

30

40

50

ということが、見いだされた。

【発明を実施するための形態】

【0009】

本発明の化合物は、式(I)によって概括的に定義される。上記及び下記に記載されている式の中で与えられている好ましい置換基又はラジカルの好ましい範囲について、以下で説明する。

【0010】

A¹は、好ましくは、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

A²は、好ましくは、-N-R⁵、酸素又は硫黄であり；

A³は、好ましくは、酸素、=N-H又は=N-CNであり；

A⁴は、好ましくは、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

A⁵は、好ましくは、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

R¹は、好ましくは、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)シアノアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)アルケニルオキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)ハロアルケニルオキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)アルキニルオキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)ハロアルキニルオキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ、(C₃-C₆)シクロアルキルアミノ、(C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルカルボニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルアミノであり；又は、

(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₃-C₆)シクロアルキル[ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキル、(C₃-C₄)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィミノで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり；又は、

R¹は、好ましくは、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、(C₁-C₄)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィミノ、(C₁-C₄)アルキルスルホキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₃-C₄)トリアルキルシリル、(=O)(ヘテロシクリルの場合のみ)又は(=O)₂(ヘテロシクリルの場合のみ)で同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり；

R^{2a}、R^{2b}、R³及びR⁴は、好ましくは、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C₁-C₄)アル

10

20

30

40

50

キルシリル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₂ - C₄)シアノアルキニル、(C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)シアノアルコキシ、(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イミノ、(C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキル - (C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキル - (C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニルであり；

10

20

フェニル又はヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように1置換又は2置換されており、その際、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₂ - C₄)シアノアルキニル、(C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)シアノアルコキシ、(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イミノ、(C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキル - (C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキル - (C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル]であり；

30

40

R⁵は、好ましくは、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)アルケニルオキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)ハ

50

ロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)アルキニルオキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルであり；

nは、好ましくは、0、1又は2であり；

ここで、n = 2である場合、A³の意味は、同一でも又は異なってもよい。

【0011】

A¹は、さらに好ましくは、窒素又は = C - R⁴であり；

A²は、さらに好ましくは、- N - R⁵又は酸素であり；

A³は、さらに好ましくは、酸素又は = N - Hであり；

A⁴は、さらに好ましくは、窒素又は = C - R⁴であり；

A⁵は、さらに好ましくは、窒素又は = C - R⁴であり；

R¹は、さらに好ましくは、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキルであり；又は、

(C₁ - C₄)アルキル[ここで、該アルキルは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルで

1置換されていてもよく、その際、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルは、それぞれ、ハロゲン、(C₁ - C₄)アルキル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり；又は、

R¹は、さらに好ましくは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニル[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、(C₁ - C₄)アルキル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり；

R^{2a}は、さらに好ましくは、水素、ハロゲン、(C₁ - C₄)アルキル(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニルであり；

R^{2b}は、さらに好ましくは、水素又はハロゲンであり；

R³は、さらに好ましくは、水素、(C₁ - C₄)アルキル(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニルであり；

R⁴は、さらに好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ又は(C₁ - C₃)アルキルであり；

R⁵は、さらに好ましくは、(C₁ - C₄)アルキル又は(C₁ - C₄)アルコキシ -

10

20

30

40

50

(C₁ - C₄) アルキルであり；

n は、さらに好ましくは、0、1 又は 2 であり；

ここで、n = 2 である場合、A³ の意味は、同一でも又は異なってもよい。

【0012】

A¹ は、一層さらに好ましくは、窒素又は = C - R⁴ であり；

A² は、一層さらに好ましくは、- N - R⁵ 又は酸素であり；

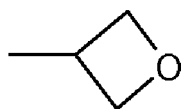
A³ は、一層さらに好ましくは、酸素であり；

A⁴ は、一層さらに好ましくは、窒素又は = C - H であり；

A⁵ は、一層さらに好ましくは、窒素又は = C - H であり；

R¹ は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、シクロプロピル、n - ブチル、i - ブチル、tert - ブチル、シクロブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、- (CH₂)₂ - S - C₂H₅、- (CH₂)₂ - SO₂ - C₂H₅ 又は

【化 2】



10

20

【0013】

であり；

R^{2a} は、一層さらに好ましくは、水素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} は、一層さらに好ましくは、水素、フッ素又は塩素であり；

R³ は、一層さらに好ましくは、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルフィニルであり；

R⁴ は、一層さらに好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素又はシアノであり；

R⁵ は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、i - プロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

n は、一層さらに好ましくは、0、1 又は 2 である。

【0014】

A¹ は、特に、窒素 (N) 又は = C - H であり；

A² は、特に、- N - CH₃ 又は酸素 (O) であり；

A³ は、特に、酸素 (O) であり；

A⁴ は、特に、窒素 (N) 又は = C - H であり；

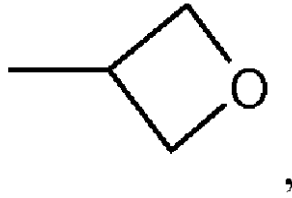
A⁵ は、特に、= C - H であり；

R¹ は、特に、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、トリフルオロメチル、- (CH₂)₂ - S - C₂H₅、- (CH₂)₂ - SO₂ - C₂H₅ 又は

30

40

【化3】



【0015】

10

であり；

R^{2a} は、特に、水素、トリフルオロメチル、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} は、特に、水素又は塩素であり；

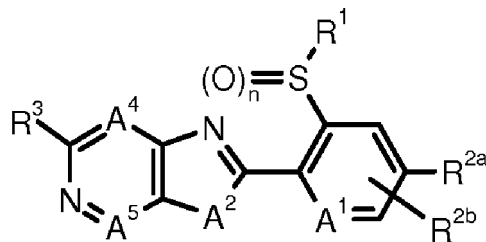
R^3 は、特に、トリフルオロメチルであり；

n は、特に、0、1又は2である。

【0016】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-A)

【化4】



20

【0017】

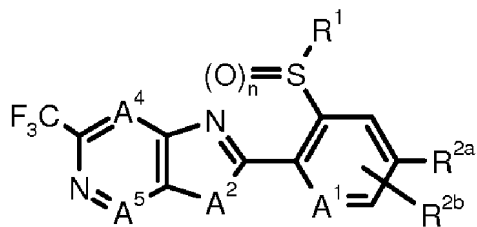
で表される化合物に関する。

【0018】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-B)

30

【化5】



【0019】

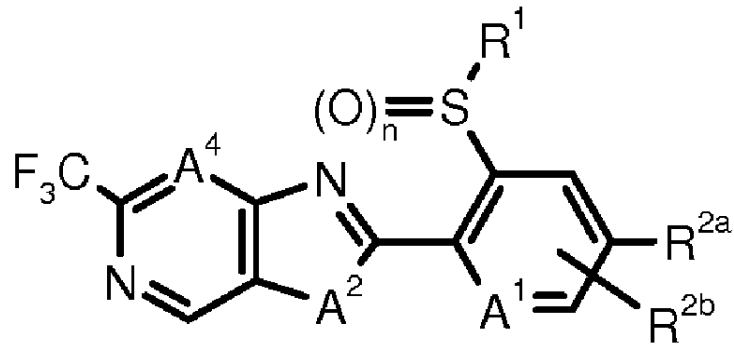
で表される化合物に関する。

40

【0020】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-C)

【化6】



10

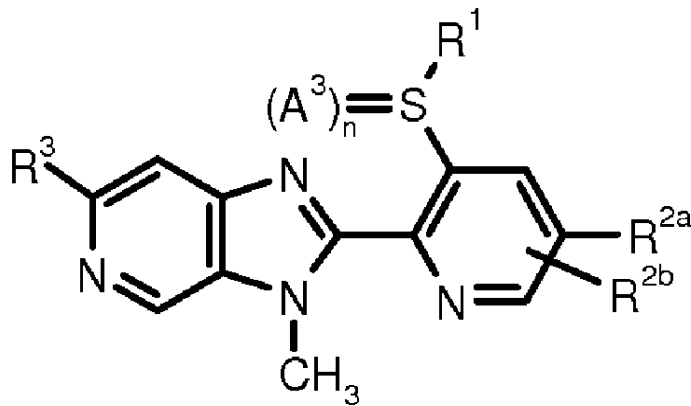
【0021】

で表される化合物に関する。

【0022】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-D)

【化7】



20

30

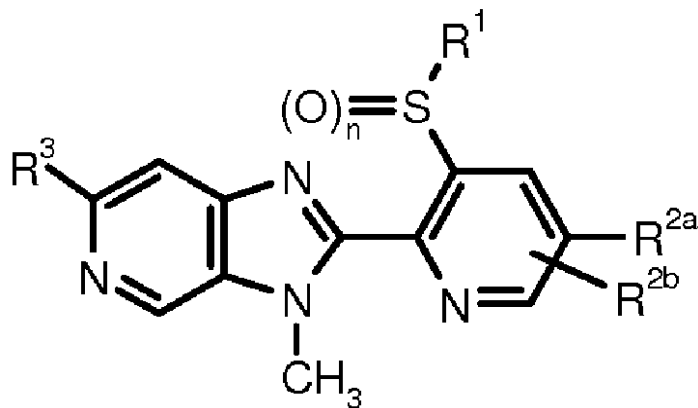
【0023】

で表される化合物に関する。

【0024】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-E)

【化8】



40

【0025】

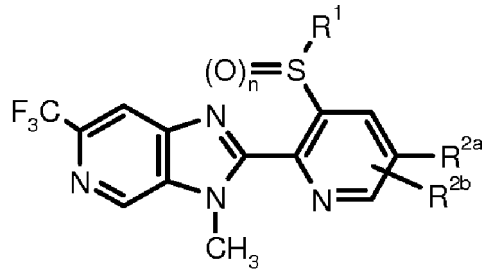
で表される化合物に関する。

50

【0026】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-F)

【化9】



10

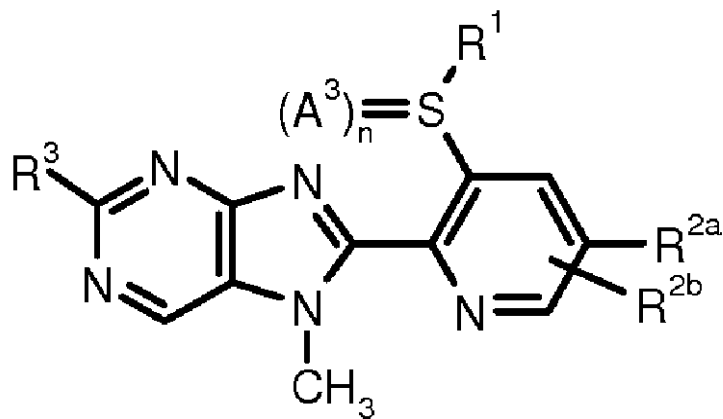
【0027】

で表される化合物に関する。

【0028】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-G)

【化10】



20

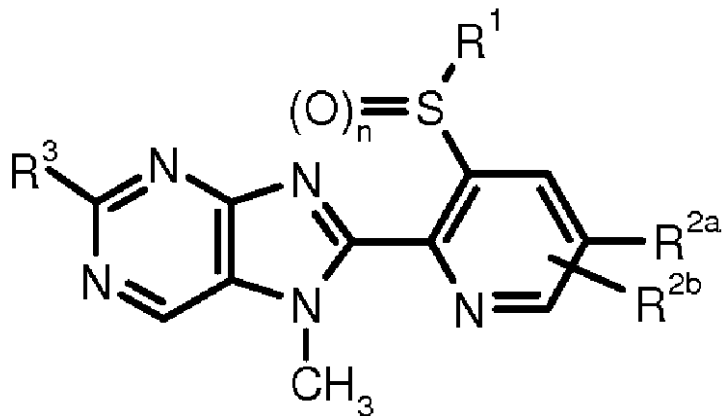
【0029】

で表される化合物に関する。

【0030】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-H)

【化11】



40

【0031】

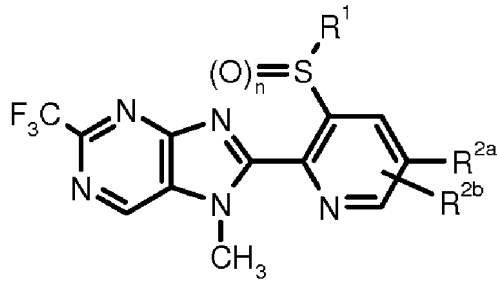
で表される化合物に関する。

50

【 0 0 3 2 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - I)

【 化 1 2 】



10

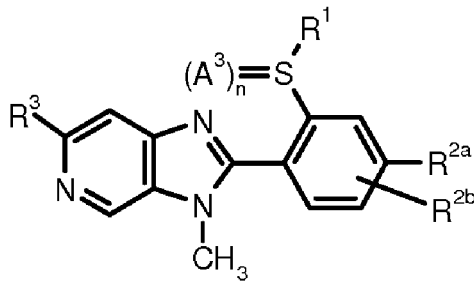
【 0 0 3 3 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 3 4 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - J)

【 化 1 3 】



20

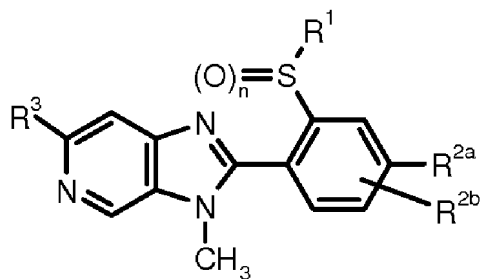
【 0 0 3 5 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 3 6 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - K)

【 化 1 4 】



30

【 0 0 3 7 】

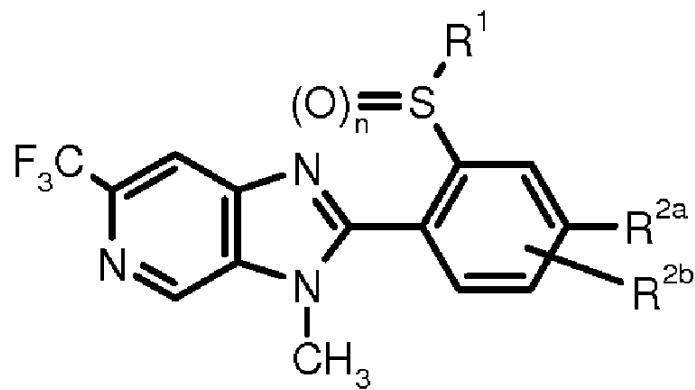
で表される化合物に関する。

【 0 0 3 8 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - L)

40

【化15】



10

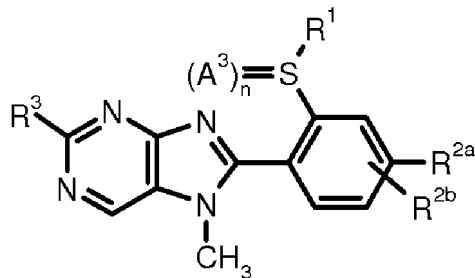
【0039】

で表される化合物に関する。

【0040】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-M)

【化16】



20

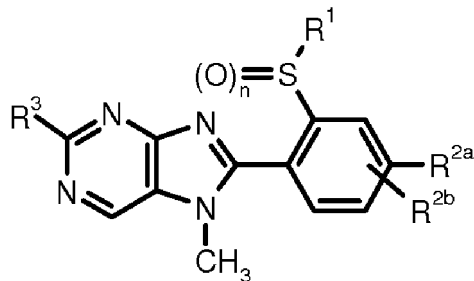
【0041】

で表される化合物に関する。

【0042】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-N)

【化17】



40

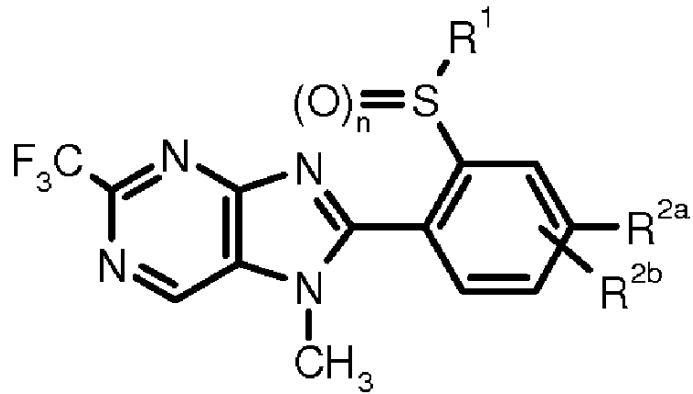
【0043】

で表される化合物に関する。

【0044】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-O)

【化18】



10

【0045】

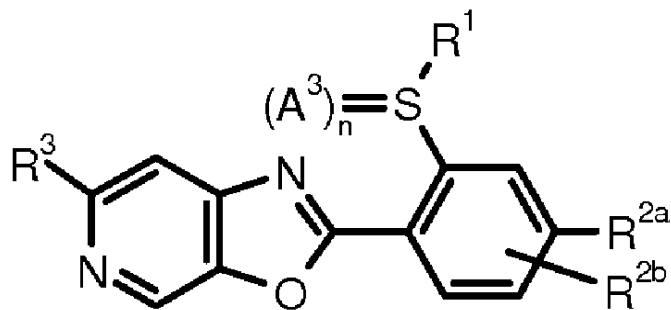
で表される化合物に関する。

【0046】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-P)

【化19】

20



30

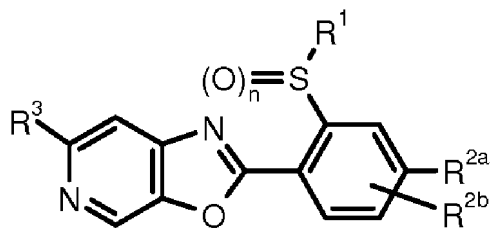
【0047】

表される化合物に関する。

【0048】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-Q)

【化20】



40

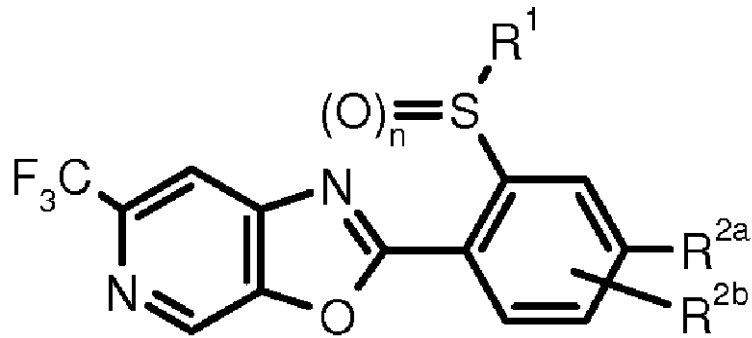
【0049】

で表される化合物に関する。

【0050】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-R)

【化 2 1】



10

【 0 0 5 1】

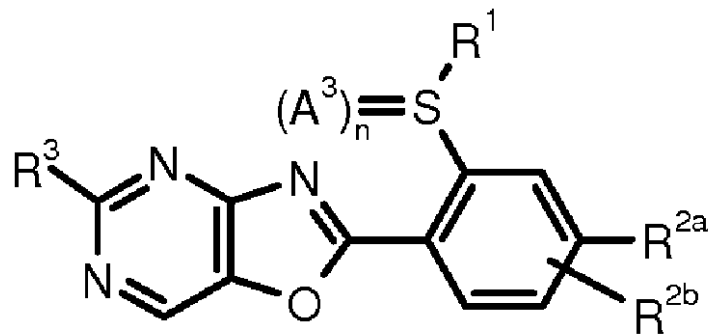
で表される化合物に関する。

【 0 0 5 2】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - S)

【化 2 2】

20



30

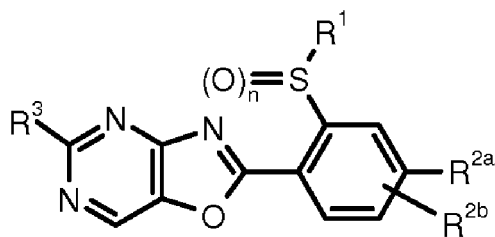
【 0 0 5 3】

で表される化合物に関する。

【 0 0 5 4】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - T)

【化 2 3】



40

【 0 0 5 5】

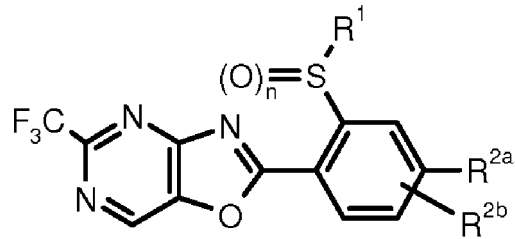
で表される化合物に関する。

【 0 0 5 6】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - U)

50

【化24】



10

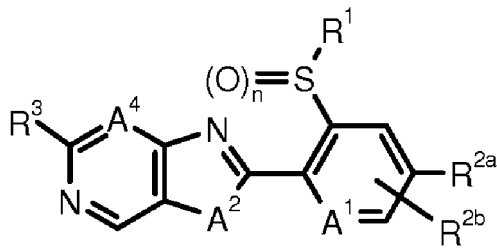
【0057】

で表される化合物に関する。

【0058】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-V)

【化25】



20

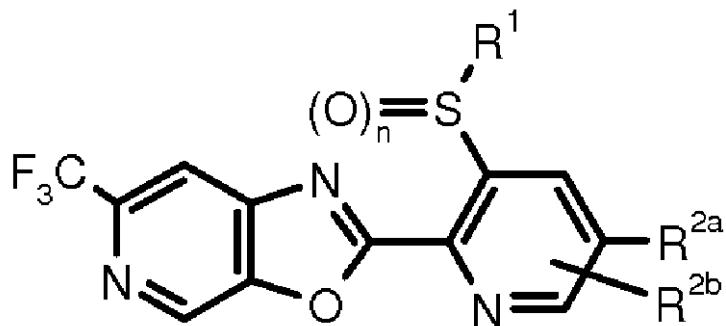
【0059】

で表される化合物に関する。

【0060】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-W)

【化26】



40

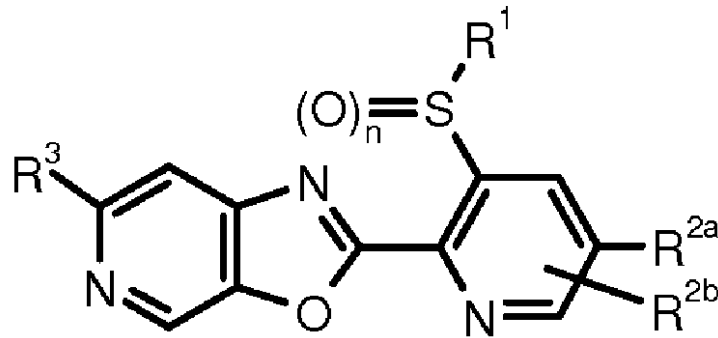
【0061】

で表される化合物に関する。

【0062】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-X)

【化 2 7】



10

【 0 0 6 3】

で表される化合物に関する。

【 0 0 6 4】

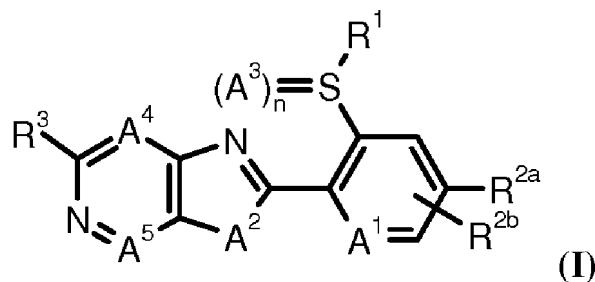
式 (I - A) ~ 式 (I - X) において、 R^1 ラジカル、 R^{2a} ラジカル、 R^{2b} ラジカル、 R^3 ラジカル、 A^1 ラジカル、 A^2 ラジカル、 A^3 ラジカル、 A^4 ラジカル、 A^5 ラジカル及び n ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

20

【 0 0 6 5】

さらなる実施形態 (構成 1) では、本発明は、式 (I)

【化 2 8】



30

【 0 0 6 6】

〔式中、

 A^1 は、窒素、 $=N^+ - O^-$ 又は $=C - R^4$ であり； A^2 は、 $-N - R^5$ 、酸素又は硫黄であり； A^3 は、酸素であり； A^4 は、窒素、 $=N^+ - O^-$ 又は $=C - R^4$ であり； A^5 は、 $=C - H$ であり；

R^1 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_6)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルケニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルキニルオキシ - $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルキニル、(

40

50

$C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル - ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキル - ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、ハロ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、アミノ、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノ、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニルアミノ、($C_1 - C_6$) アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキルであり；又は、

いずれの場合にもアリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように 1 置換又は多置換されていてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_2 - C_6$) アルケニル、($C_2 - C_6$) アルキニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル [ここで、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) 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、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) トリアルキルシリル又はベンジルで同じように又は異なるように 1 置換又は多置換されていてもよい] であり；又は、

R^1 は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) - アルコキシ、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) 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、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ - ($C_2 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_3 - C_6$) トリアルキルシリル、($=O$) (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は ($=O$)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) で同じように又は異なるように 1 置換又は多置換されていてもよい] であり；

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - ($C_1 - C_6$) アルキルシリル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル - ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキル - ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、ハロ($C_3 - C_8$)

10

20

30

40

50

シクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)シアノアルキル、(C₁ - C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)ハロアルケニル、(C₂ - C₆)シアノアルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₂ - C₆)ハロアルキニル、(C₂ - C₆)シアノアルキニル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ、(C₁ - C₆)シアノアルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキル - (C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキル - (C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルチオカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₂ - C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノ、NHCO - (C₁ - C₆)アルキル((C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ)であり；

アリール又はヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよく、その際、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C₁ - C₆)アルキルシリル、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)シアノアルキル、(C₁ - C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)ハロアルケニル、(C₂ - C₆)シアノアルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₂ - C₆)ハロアルキニル、(C₂ - C₆)シアノアルキニル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ、(C₁ - C₆)シアノアルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキル - (C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキル - (C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、

10

20

30

40

50

(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノ]であり；

10

R⁵は、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)シアノアルキル、(C₁ - C₆)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルケニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルケニル、(C₂ - C₆)シアノアルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₂ - C₆)アルキニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルキニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルキニル、(C₂ - C₆)シアノアルキニル、(C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₃ - C₈)シクロアルキル - (C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキル - (C₃ - C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、アミノカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ - (C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ - (C₁ - C₆)アルキル又は(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノ - (C₁ - C₆)アルキルであり；

20

30

nは、0、1又は2である]

で表される化合物に関する。

40

【0067】

好ましいもの(構成2)は、式(I)〔式中、

A¹は、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

A²は、-N-R⁵、酸素又は硫黄であり；

A³は、酸素であり；

A⁴は、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

A⁵は、=C-Hであり；

R¹は、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C

50

4) アルケニル、(C₂ - C₄) アルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) アルキニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルキニルオキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノであり；又は、

(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル[ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィミノで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり；又は、

R¹ は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィミノ、(C₁ - C₄) アルキルスルホキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、(C₃ - C₆) トリアルキルシリル、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は(=O)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) で同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり；

R^{2a}、R^{2b}、R³ 及び R⁴ は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C₁ - C₄) アルキルシリル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) シアノアルコキシ、(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イミノ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキル - (C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキル - (C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)

10

20

30

40

50

アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、 $NHCO - (C_1 - C_4)$ アルキル $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニルアミノ)であり；

フェニル又はヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように1置換又は2置換されており、その際、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルキニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル]であり；

R^5 は、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル- $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

n は、0、1又は2である]

で表される化合物である。

【0068】

特に好ましいものに(構成3)は、式(I)〔式中、

10

20

30

40

50

A¹ は、窒素又は = C - R⁴ であり；

A² は、- N - R⁵ 又は酸素であり；

A³ は、酸素であり；

A⁴ は、窒素又は = C - R⁴ であり；

A⁵ は、= C - H であり；

R¹ は、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキルであり；又は、

(C₁ - C₄) アルキル [ここで、該アルキルは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルで1置換されていてもよく、その際、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルは、それぞれ、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル又は(C₁ - C₄) ハロアルキルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい] であり；又は、

R¹ は、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル又は(C₁ - C₄) ハロアルキルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい] であり；

R^{2 a} は、水素、シアノ、アミノカルボニル、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル又は(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニルであり；

R^{2 b} は、水素、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルキル、NHCO - (C₁ - C₄) アルキル又はハロゲンであり；

R³ は、水素、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニルであるか、又は、フェニル、ピラゾリル若しくはイミダゾリル [ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで1置換されていてもよい] であり；

R⁴ は、水素、ハロゲン、シアノ又は(C₁ - C₃) アルキルであり；

R⁵ は、(C₁ - C₄) アルキル又は(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキルであり；

n は、0、1又は2である]

で表される化合物である。

【0069】

極めて特に好ましいもの(構成4)は、式(I)〔式中、

A¹ は、窒素又は = C - R⁴ であり；

A² は、- N - R⁵ 又は酸素であり；

A³ は、酸素であり；

A⁴ は、窒素又は = C - H であり；

A⁵ は、= C - H であり；

R¹ は、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、シクロプロピル、n - ブチル、i - ブチル、tert - ブチル、シクロブチル、ヒドロキシエチル(-CH₂-CH₂

10

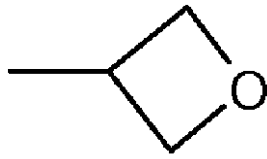
20

30

40

50

-OH)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{C}_2\text{H}_5$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{SO}_2-\text{C}_2\text{H}_5$ 又は
【化29】



10

【0070】

であり；

R^{2a} は、水素、シアノ、アミノカルボニル (CONH_2)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} は、水素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、メチルカルボニルアミノ (NHCO -メチル)、フッ素又は塩素であり；

20

R^3 は、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであるか、又は、フェニル、ピラゾール-1-イル若しくはイミダゾール-1-イル[ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで1置換されていてもよい]であり；

R^4 は、水素、フッ素、塩素、臭素又はシアノであり；

R^5 は、メチル、エチル、*i*-プロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

n は、0、1又は2である；

30

で表される化合物である。

【0071】

重要なもの(構成5)は、式(I)〔

A^1 は、窒素(N)又は=C-Hであり；

A^2 は、-N-CH₃又は酸素(O)であり；

A^3 は、酸素(O)であり；

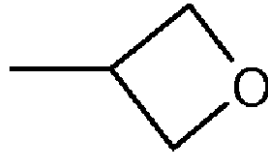
A^4 は、窒素(N)又は=C-Hであり；

A^5 は、=C-Hであり；

R^1 は、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、シクロプロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*tert*-ブチル、シクロブチル、ヒドロキシエチル(-CH₂-CH₂-OH)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{C}_2\text{H}_5$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{SO}_2-\text{C}_2\text{H}_5$ 又は

40

【化 3 0】



【 0 0 7 2】

(オキセタン - 3 - イル) であり ;

10

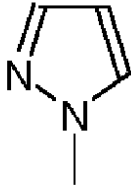
R^{2a} は、水素、シアノ、アミノカルボニル (CONH_2)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり ;

R^{2b} は、水素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、メチルカルボニルアミノ (NHCO -メチル)、フッ素又は塩素であり ;

R^3 は、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであるか、又は、フェニル、

20

【化 3 1】

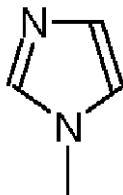


30

【 0 0 7 3】

(ピラゾール - 1 - イル) 若しくは

【化 3 2】



40

【 0 0 7 4】

(イミダゾール - 1 - イル) [ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで 1 置換されていてよい] であり ;

n は、0、1 又は 2 である]

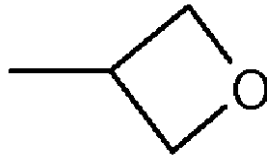
で表される化合物である。

【 0 0 7 5】

特に重要なもの (構成 6) は、式 (I) [式中、

50

A^1 は、窒素 (N) 又は $=C-H$ であり ;
 A^2 は、 $-N-CH_3$ 又は酸素 (O) であり ;
 A^3 は、酸素 (O) であり ;
 A^4 は、窒素 (N) 又は $=C-H$ であり ;
 A^5 は、 $C-H$ であり ;
 R^1 は、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、トリフルオロメチル、 $-CH_2-CH_2-F$ 、 $-CH_2-CH_2-OH$ 、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 又は
 【化 33】



10

【0076】

であり ;

R^{2a} は、水素、トリフルオロメチル、シアノ、 $CONH_2$ 、フッ素又は塩素であり ;

20

R^{2b} は、水素、塩素、トリフルオロメチル、メトキシ又は $NHCOCH_3$ であり ;

R^3 は、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチル、塩素、 $4-CF_3(C_6H_4)$ 、 $4-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル、 $3-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル又は $4-(CF_3)$ イミダゾール-1-イルであり ;

n は、0、1 又は 2 である]

で表される化合物である。

【0077】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成 (1) 又は構成 (2) 又は構成 (3) 又は構成 (4) 又は構成 (5) 又は構成 (6) において定義されているとおりであり ; 及び、

30

R^{2b} は、アセチル、アミノ、 SCN 、トリ- (C_1-C_6) アルキルシリル、 (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_3-C_8) シクロアルキル- (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_1-C_6) アルキル (C_3-C_8) シクロアルキル(ここで、結合は、アルキルで置換されているシクロアルキルを介している)、ハロ (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) ハロアルケニル、 (C_2-C_6) シアノアルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、 (C_2-C_6) ハロアルキニル、 (C_2-C_6) シアノアルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) ハロアルコキシ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルヒドロキシイミノ、 (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) ハロアルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) アルコキシ- (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) ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (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) ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルチオカルボニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル

40

50

、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₂ - C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ-(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホキシミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノ、NHCO - (C₁ - C₆)アルキル((C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ)であり；

10

いずれの場合にも同じように又は異なるように1回又は複数回置換されていてもよいヘタリール[ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基はいずれの場合にも以下のものである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C₁ - C₆)アルキルシリル、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)シアノアルキル、(C₁ - C₆)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル-(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)ハロアルケニル、(C₂ - C₆)シアノアルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₂ - C₆)ハロアルキニル、(C₂ - C₆)シアノアルキニル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ、(C₁ - C₆)シアノアルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル-(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキル-(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキル-(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルチオ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ-(C₂ - C₆) - アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ-(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノ]である]

20

30

40

で表される化合物に関する。

【0078】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R^{2 a}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnは、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成(1)又は構成(2)又は構成(3)又は構成(4)又は構成(5)又は構成(6)において定義されているとおりであり；及び、

R^{2 b}は、アセチル、アミノ、SCN、トリ-(C₁ - C₄)アルキルシリル、(C₃

50

- C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル(C₃-C₆)シクロアルキル(ここで、結合は、アルキルで置換されているシクロアルキルを介している)、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(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イミノ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、NHCO-(C₁-C₄)アルキル((C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノ)であり;

いずれの場合にも同じように又は異なるように1回又は2回置換されているヘタリール [ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基はいずれの場合にも以下のものである: シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)シアノアルキル、(C₁-C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)シアノアルコキシ、(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イミノ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルチオ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ-(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル]である]

で表される化合物に関する。

【0079】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R^{2 a}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnは、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成(1)又は構成(2)又は構成(3)又は構成(4)又は構成(5)又は構成(6)において定義されているとおりであり;及び、

R^{2 b}は、(C₁-C₄)アルコキシ又はNHCO-(C₁-C₄)アルキルである〕で表される化合物に関する。

【0080】

10

20

30

40

50

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成 (1) 又は構成 (2) 又は構成 (3) 又は構成 (4) 又は構成 (5) 又は構成 (6) において定義されているとおりであり；及び、

R^{2b} は、メトキシ、エトキシ又は NHCO -メチルである]

で表される化合物に関する。

【0081】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成 (1) 又は構成 (2) 又は構成 (3) 又は構成 (4) 又は構成 (5) 又は構成 (6) において定義されているとおりであり；及び、

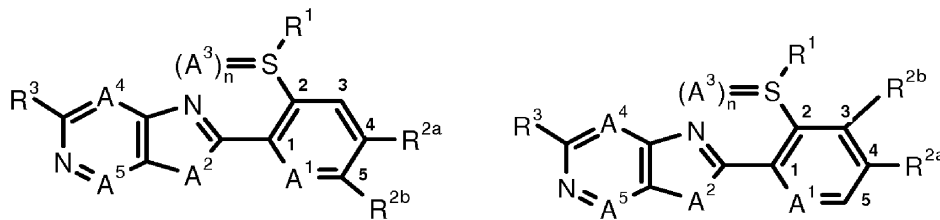
R^{2b} は、メトキシ又は NHCO -メチルである]

で表される化合物に関する。

【0082】

R^{2b} は、3位又は5位において結合している：

【化34】



【0083】

好ましい定義において、別途示されていない限り：

ハロゲンとは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択され；

アリール（これは、より大きな単位（例えば、アリールアルキル）の一部としてのアリールを包含する）は、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルからなる群から選択され、そして、好ましくは、フェニルであり；

ヘタリール（「ヘテロアリール」と同義；これは、より大きな単位（例えば、ヘタリールアルキル）の一部としてのヘタリールを包含する）は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル及びインドリジニルからなる群から選択され；

ヘテロシクリルは、1個若しくは2個の窒素原子及び/又は1個の酸素原子及び/又は1個の硫黄原子を含んでいる4員、5員又は6員の飽和環、例えば、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、オキセタニル、テトラヒドロフランニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、チエタニル、テトラヒドロチオフェニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル及びチオモルホリニルなどである。

【0084】

特に好ましい定義において、別途示されていない限り：

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択され；

アリール（これは、より大きな単位（例えば、アリールアルキル）の一部としてのアリールを包含する）は、フェニル、ナフチル、アントリル及びフェナントレニルからなる群から選択され、そして、好ましくは、フェニルであり；

ヘタリール（これは、より大きな単位（例えば、ヘタリールアルキル）の一部としてのヘタリールを包含する）は、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ピリダジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、チアゾリル及びテトラゾリルからなる群から選択され；

ヘテロシクリルは、オキセタニル、テトラヒドロフリル及びピペラジニルからなる群から選択される。

【0085】

本発明に関連して、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロアルキル）、1～12個の炭素原子を有する飽和脂肪族炭化水素基のラジカルを意味するものと理解され、そして、直鎖又は分枝鎖であることができる。C₁-C₁₂-アルキルラジカルの例は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、1-エチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、n-デシル、n-ウンデシル及びn-ドデシルである。これらのアルキルラジカルの中で、特に好ましいのは、C₁-C₆-アルキルラジカルである。特別に好ましいのは、C₁-C₄-アルキルラジカルである。

【0086】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルケニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の二重結合を有している直鎖又は分枝鎖のC₂-C₁₂-アルケニルラジカル、例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ペンタジエニル、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-ヘキセニル及び1,4-ヘキサジエニルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、C₂-C₆-アルケニルラジカルであり、特に好ましいのは、C₂-C₄-アルケニルラジカルである。

【0087】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の三重結合を有している直鎖又は分枝鎖のC₂-C₁₂-アルキニルラジカル、例えば、エチニル、1-プロピニル及びプロパルギルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、C₃-C₆-アルキニルラジカルであり、特に好ましいのは、C₃-C₄-アルキニルラジカルである。該アルキニルラジカルは、少なくとも1の二重結合も含むことができる。

【0088】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「シクロアルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、C₃-C₈-シクロアルキルラジカル、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、シクロヘプチル及びシクロオクチルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、C₃-C₆-シクロアルキルラジカルである。

【0089】

用語「アルコキシ」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロ

10

20

30

40

50

アルコキシ)、O-アルキルラジカルを意味するものと理解され、ここで、用語「アルキル」は、上記で定義されているとおりである。

【0090】

ハロゲンで置換されているラジカル(例えば、ハロアルキル)は、モノハロゲン化されているか、又は、置換基の可能な最大数までポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化されている場合、該ハロゲン原子は同一であっても又は異なってもよい。この場合、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、特に、フッ素、塩素又は臭素である。

【0091】

別途示されていない限り、置換されていてもよいラジカルは、1置換又は多置換されることができ、ここで、多置換の場合における該置換基は、同一であっても又は異なってもよい。

10

【0092】

概括的に又は好ましい範囲内において上記で与えられているラジカルの定義又は説明は、最終生成物に当てはまり、及び、対応するように、出発物質及び中間体に当てはまる。ラジカルについてのこれらの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの好ましい範囲の間の組合せを包含する。

【0093】

本発明に従って好ましいのは、好ましいものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式(I)で表される化合物の使用である。

20

【0094】

本発明に従って特に好ましいのは、特に好ましいものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式(I)で表される化合物の使用である。

【0095】

本発明に従って極めて特に好ましいのは、極めて特に好ましいものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式(I)で表される化合物の使用である。

【0096】

本発明に従って重要なのは、特別なものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式(I)で表される化合物の使用である。

【0097】

本発明に従って特に重要なのは、極めて特別なものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式(I)で表される化合物の使用である。

30

【0098】

式(I)で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態でも、及び/若しくは、光学活性異性体の形態でも、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態でも、存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の所望の混合物を包含する。

【0099】

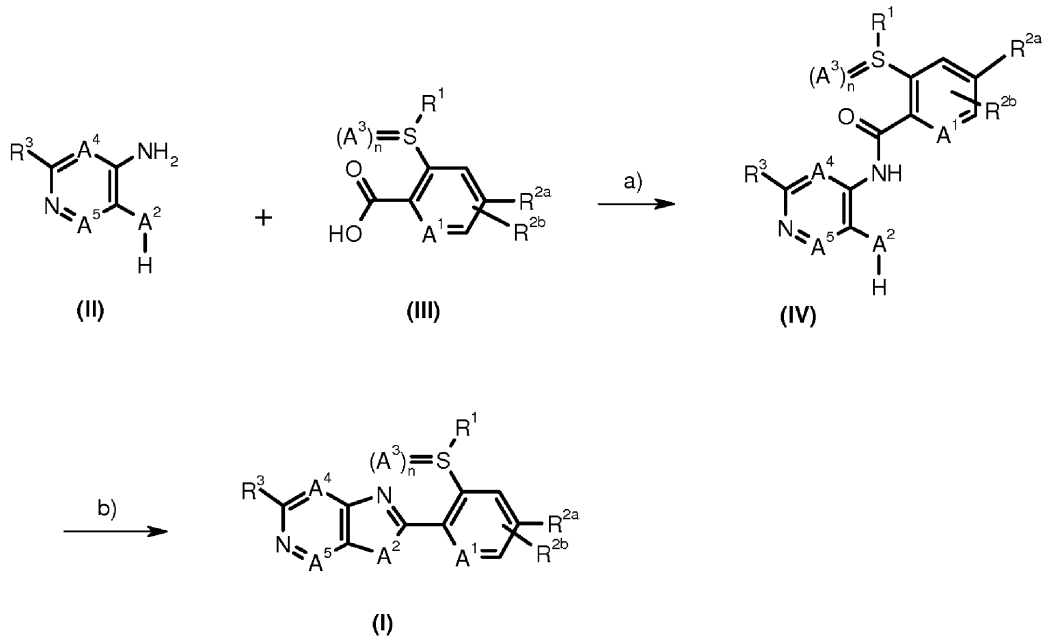
式(I)で表される本発明化合物は、以下のスキームにおいて示されている調製方法によって得ることができる。

40

【0100】

調製方法 A

【化35】



10

【0101】

R¹、R^{2a}、R^{2b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

20

【0102】

段階(a)

式(IV)で表される化合物は、US5576335に記載されている調製方法と同様にして、式(II)で表される化合物を、縮合剤の存在下で、式(III)で表されるカルボン酸と反応させることによって、調製することができる。

【0103】

式(II)で表される化合物は、は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2003/69257若しくはWO2006/65703に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

30

【0104】

式(III)で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2010/234604、WO2012/61926若しくは「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18(2008), 5023-5026」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0105】

式(II)で表される化合物と式(III)で表されるカルボン酸の反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

40

【0106】

適切な縮合剤は、例えば、カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロ

50

ピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (E D C I) 又は 1 , 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミドなどである。

【 0 1 0 7 】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 0 ~ 1 8 0 の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、 2 0 ~ 1 4 0 の温度で実施する。

【 0 1 0 8 】

段階 (b)

式 (I) で表される化合物は、例えば、W O 2 0 1 2 / 8 6 8 4 8 に記載されている調製方法と同様にして、式 (I V) で表される化合物を縮合させることによって、調製することができる。

10

【 0 1 0 9 】

式 (I) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン、tert - ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド又はN - メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

20

【 0 1 1 0 】

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

【 0 1 1 1 】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (E D C I) 又は 1 , 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル (例えば、アゾジカルボン酸ジエチル) の混合物。

【 0 1 1 2 】

記載されている反応において使用することが可能な適切な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、パラ - トルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

30

【 0 1 1 3 】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2, 6 - ルチジン、1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン (D B U) ；第 3 級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN, N - ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

【 0 1 1 4 】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

40

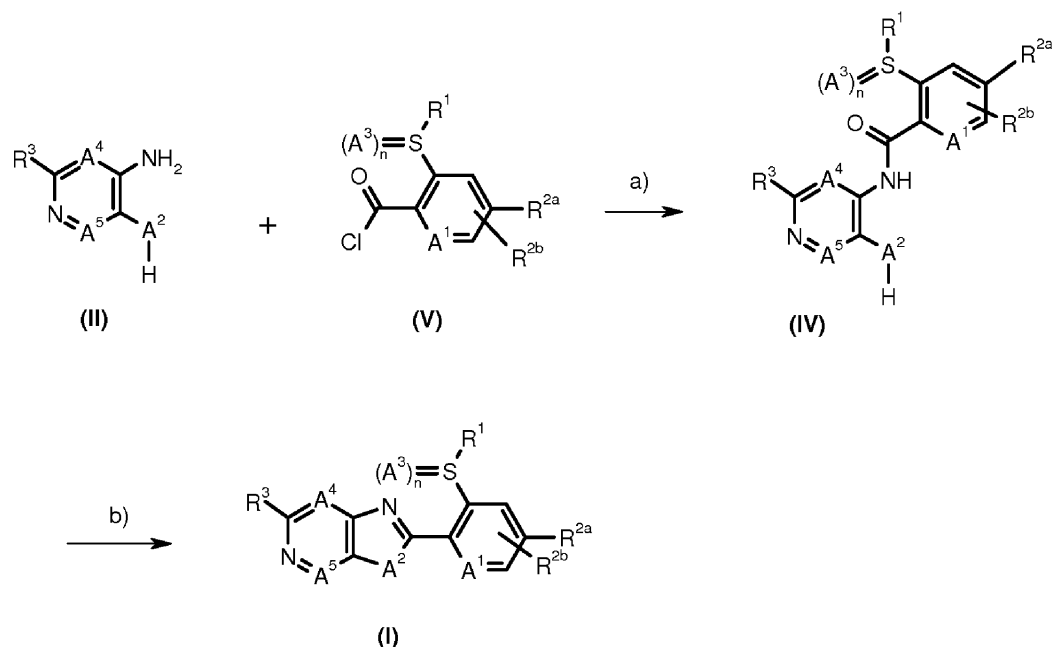
【 0 1 1 5 】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 0 ~ 2 0 0 の温度で実施することが可能である。

【 0 1 1 6 】

調製方法 B

【化36】



10

【0117】

R¹、R^{2a}、R^{2b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

20

【0118】

段階(a)

本発明のさらなる実施形態では、式(IV)で表される化合物は、式(II)で表される化合物を、縮合剤の存在下で、式(V)で表される塩化カルボニルと反応させることによって調製することができる。

【0119】

式(V)で表される塩化カルボニルは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2010/234603若しくはUS2010/234604に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

30

【0120】

式(II)で表される化合物と式(V)で表される塩化カルボニルの反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；脂肪族炭化水素、例えば、ヘキサン、ヘプタン又はオクタン；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

40

【0121】

該反応は、好ましくは、塩基の存在下で実施する。適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。適しているさらなる塩基は、第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN,N-ジイソプロピルエチルアミン、並びに、窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、

50

2, 6 - ルチジン、4 - ジメチルアミノピリジン及び 1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン (D B U) である。

【 0 1 2 2 】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 - 2 0 ~ 1 0 0 の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、 0 ~ 8 0 の温度で実施する。

【 0 1 2 3 】

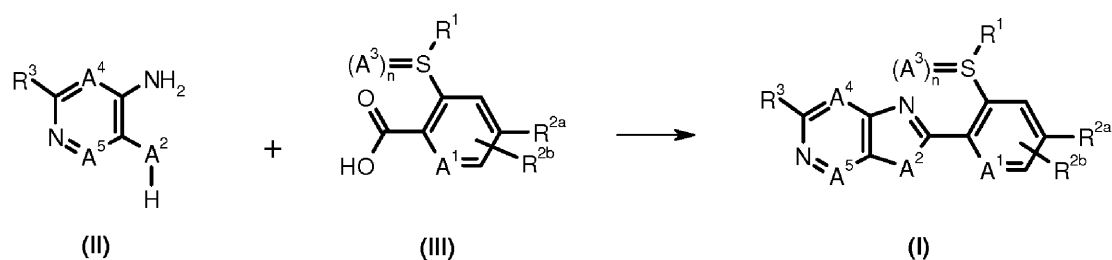
段階 (b)

式 (I V) で表される化合物の式 (I) で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法 A の段階 (b) におけるのと同様に実施する。

【 0 1 2 4 】

調製方法 C

【 化 3 7 】



10

20

【 0 1 2 5 】

R¹、R^{2 a}、R^{2 b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵ 及び n ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

【 0 1 2 6 】

本発明のさらなる実施形態では、式 (I) で表される化合物は、縮合剤の存在下で、式 (I I) 及び式 (I I I) で表される中間体化合物から、1 段階法で調製することができる。

【 0 1 2 7 】

式 (I) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン、tert - ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド又は N - メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

30

40

【 0 1 2 8 】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (E D C I) 又は 1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル (例えば、アゾジカルボン酸ジエチル) の混合物。

【 0 1 2 9 】

該反応は、酸又は塩基の存在下で実施することができる。

【 0 1 3 0 】

記載されている反応において使用することが可能な酸の例は、以下のものである：スル

50

ホン酸、例えば、メタンスルホン酸又はパラ - トルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

【 0 1 3 1 】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2, 6 - ルチジン、1, 8 - ジアザピシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン (D B U)；第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN, N - ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

【 0 1 3 2 】

該反応は、適切な触媒（例えば、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール）の存在下で実施することができる。

10

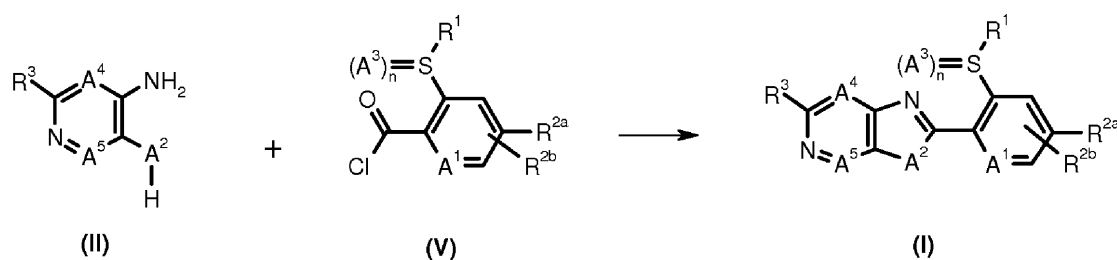
【 0 1 3 3 】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0 ~ 200 の温度で実施することが可能である。

【 0 1 3 4 】

調製方法 D

【 化 3 8 】



20

【 0 1 3 5 】

R¹、R^{2 a}、R^{2 b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

【 0 1 3 6 】

本発明のさらなる実施形態では、式 (I) で表される化合物は、式 (I I) 及び式 (V) で表される中間体化合物から、1段階法で調製することができる。

30

【 0 1 3 7 】

式 (I) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン、tert - ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド又はN - メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

40

【 0 1 3 8 】

該反応は、好ましくは、塩基の存在下で実施する。適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、水酸化物、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムである。適しているさらなる塩基は、第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN, N - ジイソプロピルエチルアミン、窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2, 6 - ルチジン、4 - ジメチルアミノピリジン及び1, 8

50

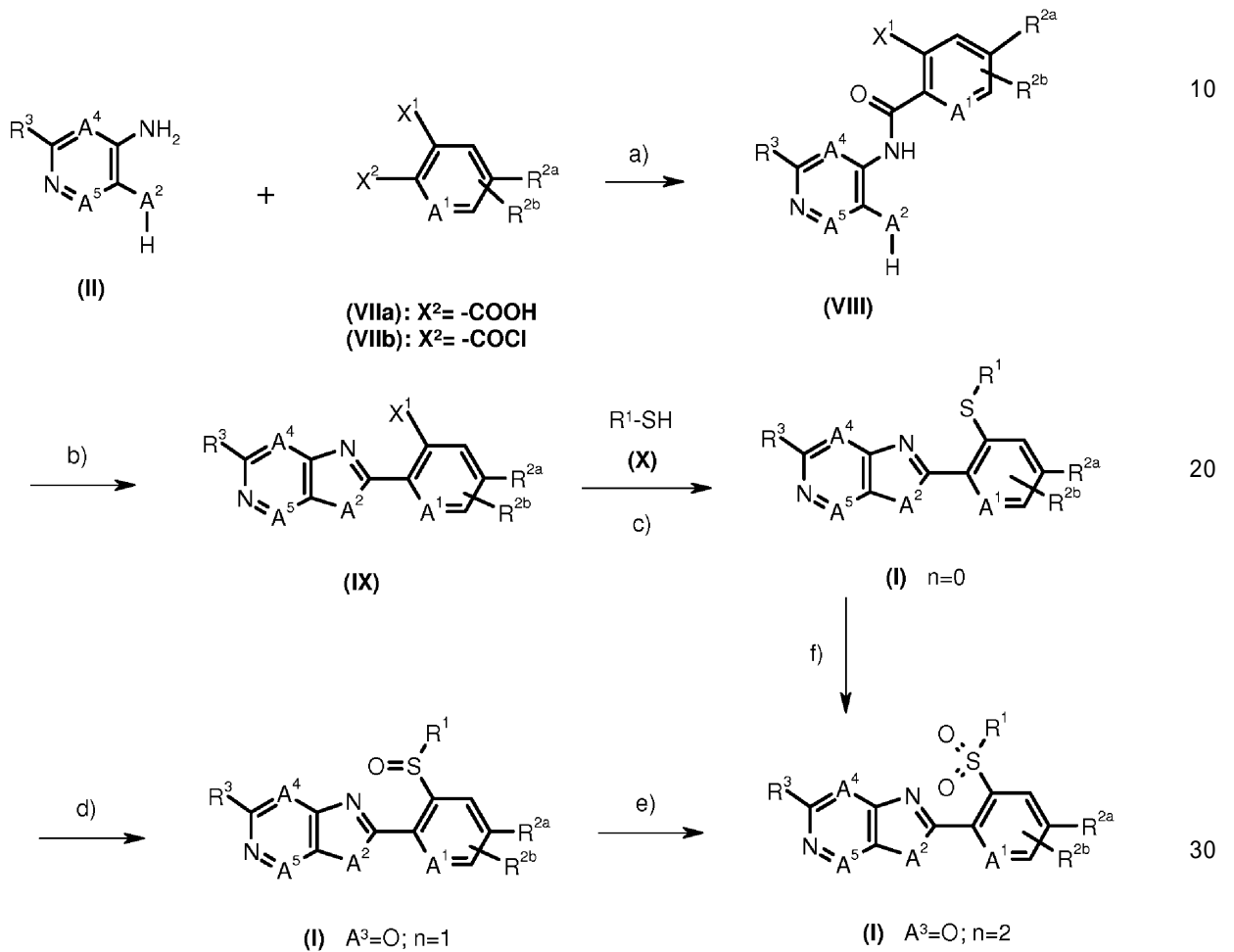
【0148】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0～200 の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、20～150 の温度で実施する。

【0149】

調製方法 F

【化40】



【0150】

R¹、R^{2a}、R^{2b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、並びに、X¹はハロゲンである。

【0151】

段階 (a)

式(VIII)で表される化合物は、US5576335に記載されている調製方法と同様にして、式(II)で表される化合物を、縮合剤又は塩基の存在下で、式(VIIa)で表されるカルボン酸又は式(VIIb)で表される塩化カルボニルと反応させることによって、調製することができる。

【0152】

式(I)で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2003/69257若しくはWO2006/65703に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0153】

式(VIIa)で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2010/234604、WO2012/61926若しくは「Bioorga

40

50

nic and Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0154】

式(VIIb)で表される塩化カルボニルは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2010/234603若しくはUS2010/234604に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0155】

式(II)で表される化合物と式(VIIa)で表されるカルボン酸又は式(VIIb)で表される塩化カルボニルの反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

10

【0156】

適切な縮合剤は、例えば、カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)又は1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミドである。

20

【0157】

適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。

【0158】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0~180の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、20~140の温度で実施する。

30

【0159】

段階(b)

式(IX)で表される化合物は、例えば、WO2012/86848に記載されている調製方法と同様にして、式(VIII)で表される化合物中間体化合物を縮合させることによって調製することができる。

【0160】

式(IX)で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

40

【0161】

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

【0162】

50

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (E D C I) 又は 1 , 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル (例えば、アゾジカルボン酸ジエチル) の混合物。

【 0 1 6 3 】

記載されている反応において使用することが可能な適切な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、パラ - トルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

【 0 1 6 4 】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2 , 6 - ルチジン、1 , 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン (D B U) ；第 3 級アミン、例えば、トリエチルアミン及び N , N - ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

【 0 1 6 5 】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

【 0 1 6 6 】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0 ~ 200 の温度で実施することが可能である。

【 0 1 6 7 】

段階 (c)

式 (I) [式中、n は 0 である] で表される化合物は、塩基の存在下で、式 (I X) で表される中間体化合物を式 (X) で表される中間体化合物と反応させることによって調製することができる。

【 0 1 6 8 】

式 (X) で表されるメルカプタン誘導体 (例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン) は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2006 / 25633、US 2006 / 111591、US 2820062、「Chemical Communications, 13 (2000), 1163 - 1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【 0 1 6 9 】

式 (I) [式中、n は 0 である] で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1 , 2 - ジメトキシエタン、tert - ブチルメチルエーテル；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N , N - ジメチルホルムアミド、N - メチルピロリドン又はジメチルスルホキシド。

【 0 1 7 0 】

適切な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩及び炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムである。適しているさらなる塩基は、アルカリ金属水素化物、例えば、水素化ナトリウムである。

【 0 1 7 1 】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0 ~ 200 の温度で実施することが可能である。

【 0 1 7 2 】

10

20

30

40

50

上記反応において、 X^1 は、好ましくは、フッ素原子又は塩素原子である。

【0173】

段階(d)

式(I)〔式中、 A^3 は酸素であり、及び、 n は1である〕で表される化合物は、式(I)〔式中、 n は0である〕で表される化合物を酸化することによって調製することができる。この酸化は、一般に、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

10

【0174】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素、メタ - クロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウムである。

【0175】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 $-20 \sim 120$ の温度で実施することが可能である。

【0176】

段階(e)

式(I)〔式中、 A^3 は酸素であり、及び、 n は2である〕で表される化合物は、式(I)〔式中、 A^3 は酸素であり、及び、 n は1である〕で表される化合物を酸化することによって調製することができる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

20

【0177】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【0178】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 $-20 \sim 120$ の温度で実施することが可能である。

【0179】

段階(f)

式(I)〔式中、 A^3 は酸素であり、及び、 n は2である〕で表される化合物は、式(I)〔式中、 n は0である〕で表される化合物を酸化することによって1段階法で調製することもできる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

30

【0180】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ - クロロ過安息香酸である。

【0181】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 $-20 \sim 120$ の温度で実施することが可能である。

40

【0182】

調製方法G

式(I)〔式中、 $R^3 =$ ハロゲン〕で表される化合物は、式(I)〔式中、 R^3 は、当該定義に従う別のラジカルである〕で表される別の化合物に変換することができる。

【0183】

式(I)〔式中、 R^3 は、当該定義に従うアリール又はヘテロリールからなる群から選択されるC - 結合ラジカルである〕で表される化合物は、例えば、式(I)〔式中、 R^3 は、好ましくは、塩素又は臭素の群から選択されるハロゲンである〕で表される化合物か

50

ら、一般的に知られている方法によって調製することができる (cf. Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483; Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695; Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004)。

【0184】

例えば、 R^3 が好ましくは塩素又は臭素である化合物を、遷移金属塩の群から選択される適切な触媒の存在下で、既知方法 (cf. WO2010071819) によって適切なアリールボロン酸又はそのエステルと反応させて、式 (I) [式中、 R^3 は、アリールの群から選択されるラジカルである] で表される化合物を生成させることができる。好ましいカップリング触媒の例としては、パラジウム触媒、例えば、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム (II) 又はテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムなどがある。該調製方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウム又はカリウムの炭酸塩である。

10

【0185】

必要とされる(ヘテロ)アリールボロン酸又は(ヘテロ)アリールボロン酸エステルの一部は、知られており、及び/又は、市販されており、そして、例えば、一般的に知られている方法によって調製される (cf. Boronic Acids (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011)。

20

【0186】

式 (I) [式中、 R^3 は、N-結合ヘタリール(例えば、イミダゾール-1-イル及びピラゾール-1-イル)である] で表される化合物の調製は、文献から知られている方法(例えば、「Journal of Organic Chemistry (2010), 69, 5578」を参照されたい)によって、好ましくは、ヨウ化銅 (I) 及び塩基性反応助剤(例えば、トランス-N, N'-ジメチルシクロヘキサン-1, 2-ジアミン及び炭酸カリウム)の存在下、適切な溶媒又は希釈剤の中で、実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒(例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素)が包含される。好ましくは、トルエンを使用する。

30

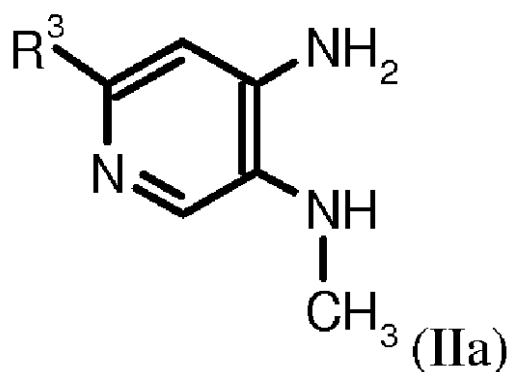
【0187】

式 (II) で表される化合物の一部は、新規である。

【0188】

新規な化合物は、式 (IIa)

【化41】



40

【0189】

[式中、 R^3 は上記で定義されているとおりであるが、 R^3 は塩素、臭素又はCHOであることはできない]

50

で表される化合物である。

【0190】

本発明は、式 (I I a) [式中、 R^3 は、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル又は ($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルホニルであるが、ここで、 R^3 は CF_3 又は CHF_2 ではない] で表される化合物も提供する。

【0191】

好ましくは、 R^3 は、 CH_2F 、 C_2H_4F 、 $C_2H_3F_2$ 、 $C_2H_2F_3$ 、 C_2HF_4 、 C_2F_5 、 $n-C_3F_7$ 、 $i-C_3F_7$ 、 OCH_2F 、 SCH_2F 、 $SOCH_2F$ 、 SO_2CH_2F 、 $OCHF_2$ 、 $SCHF_2$ 、 $SOCHF_2$ 、 SO_2CHF_2 、 OCF_3 、 OCF_2Cl 、 $OCFCl_2$ 、 SCF_3 、 $SOCF_3$ 、 SO_2CF_3 、 OC_2H_4F 、 SC_2H_4F 、 SOC_2H_4F 、 $SO_2C_2H_4F$ 、 $OC_2H_3F_2$ 、 $SC_2H_3F_2$ 、 $SOC_2H_3F_2$ 、 $SO_2C_2H_3F_2$ 、 $OC_2H_2F_3$ 、 $SC_2H_2F_3$ 、 $SOC_2H_2F_3$ 、 $SO_2C_2H_2F_3$ 、 OC_2HF_4 、 SC_2HF_4 、 SOC_2HF_4 、 $SO_2C_2HF_4$ 、 OC_2F_5 、 SC_2F_5 、 SOC_2F_5 、 $SO_2C_2F_5$ 、 $n-OC_3F_7$ 、 $n-SC_3F_7$ 、 $n-SOC_3F_7$ 、 $n-SO_2C_3F_7$ 、 $i-OC_3F_7$ 、 $i-SC_3F_7$ 、 $i-SOC_3F_7$ 又は $i-SO_2C_3F_7$ である。

【0192】

さらに好ましくは、 R^3 は、 CH_2F 、 OCF_3 、 C_2H_4F 、 $C_2H_3F_2$ 、 $C_2H_2F_3$ 、 C_2HF_4 、 C_2F_5 、 SCF_3 、 $SOCF_3$ 又は SO_2CF_3 である。

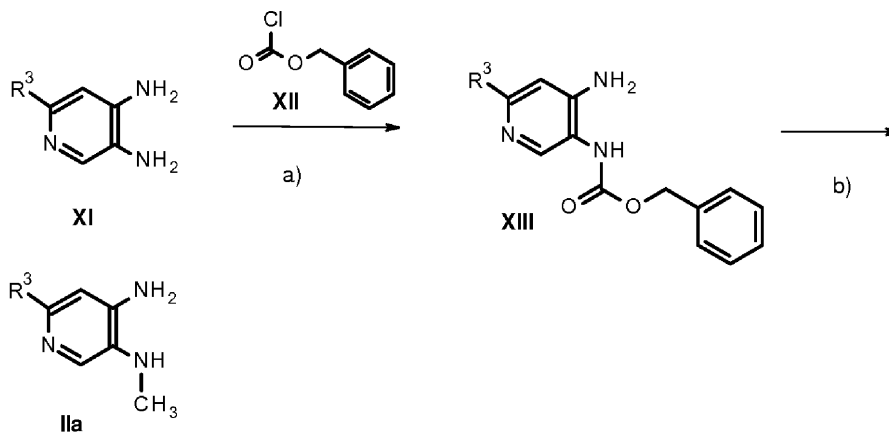
【0193】

最も好ましくは、 R^3 は、 C_2F_5 である。

【0194】

調製方法 H

【化 4 2】



【0195】

R^3 ラジカルは、上記で定義されているとおりである。

【0196】

段階 (a)

式 (X I I I) で表される化合物は、WO2005/55928 又は「Journal of Medicinal Chemistry, 48 (2005), p. 6128 - 6139」に記載されている調製方法と同様にして、式 (X I) で表される化合物を、例えば塩基の存在下で、式 (X I I) で表されるクロロ炭酸ベンジル (クロロギ酸ベンジル) と反応させることによって調製することができる。

【0197】

式 (X I) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、WO2012/3576、WO2007/47793 若しくは WO2006/65703 に記

10

20

30

40

50

載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0198】

式(XII I)で表される化合物への該変換は、実質的に実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；又は、芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン。

【0199】

適切な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩及び炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムである。

【0200】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0 ~ 120 の温度で実施することが可能である。

【0201】

段階(b)

式(II a)で表される化合物は、例えば、「Journal of Heterocyclic Chemistry, 22(1985), p.313-318」に記載されている調製方法と同様にして、式(XII I)で表される化合物を還元することによって調製することができる。

【0202】

適切な還元剤の例は、水素化アルミニウムリチウムである。

【0203】

式(II a)で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン又はtert-ブチルメチルエーテルである。

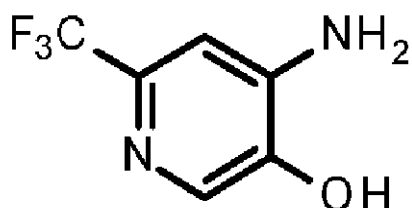
【0204】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0 ~ 100 の温度で実施することが可能である。

【0205】

式(II-02)

【化43】



【0206】

で表される化合物も、新規である。

【0207】

方法及び使用

本発明は、さらに、害虫を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、式(I)で表される化合物を害虫及び/又はそれらの生息環境に作用させる。害虫の該防除は、好ましくは、農業及び林業において、並びに、材料物質(material)の保護において、実施される。好ましくは、該方法から、ヒト又は動物の身体の外科的な又は治療的な処置方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法は、除外される。

【0208】

本発明は、さらに、殺有害生物剤としての、特に、作物保護剤としての、式(I)で表される化合物の使用にも関する。

【0209】

本出願に関連して、用語「殺有害生物剤(pesticide)」は、いずれの場合にも、常に、用語「作物保護剤」も包含する。

【0210】

式(I)で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、温血動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、生物的ストレス因子及び非生物的ストレス因子に対して植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、殺有害生物剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して活性を示す。上記害虫としては、以下のものを挙げる事ができる：

節足動物門の害虫、特に、クモ綱(Arachnida)の、例えば、アカルス属種(Acarus spp.)、例えば、アカルス・シロ(Acarus siro)、アケリア・クコ(Aceria kuko)、アケリア・シェルドニ(Aceria sheldoni)、アクロプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Aculus spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ(Aculus fockeui)、アクルス・シュレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス(Amphitetranychus viennensis)、アルガス属種(Argas spp.)、ボオフィルス属種(Boophilus spp.)、ブレビバルプス属種(Brevipalpus spp.)、例えば、ブレビバルプス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis)、ブリオビア・グラミナム(Bryobia graminum)、ブリオビア・プラエチオサ(Bryobia praetiosa)、セントルロイデス属種(Centruroides spp.)、コリオプテス属種(Chorioptes spp.)、デルマニクス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス(Dermatophagoides pteronyssinus)、デルマトファゴイデス・ファリナエ(Dermatophagoides farinae)、デルマセントル属種(Dermacentor spp.)、エオテトラニクス属種(Eotetranychus spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ(Eotetranychus hicoriae)、エピトリメルス・ピリ(Epitrimerus pyri)、エウテトラニクス属種(Eutetranychus spp.)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ(Eutetranychus banksi)、エリオフィエス属種(Eriophyes spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ(Eriophyes pyri)、グリシファグス・ドメスティクス(Glycyphagus domesticus)、ハロチデウス・デストルクトル(Halotydeus destructor)、ヘミタロソネムス属種(Hemitarsonemus spp.)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス(Hemitarsonemus latus)(=ポリファゴタルソネムス・ラツス(Polyphagotarsonemus latus))

10

20

30

40

50

)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、イキソデス属種 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクツス属種 (*Latrodectus* spp.)、ロキソスケレス属種 (*Loxosceles* spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yotherysi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニクス属種 (*Panonychus* spp.)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピッキ (*Steneotarsonemus spinki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコベルシシ (*Vasates lycopersici*) ;

ムカデ綱 (*Chilopoda*) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus* spp.)、スクチゲラ属種 (*Scutigera* spp.) ;

トビムシ目 (*Collembola*) 又はトビムシ綱の、例えば、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*) ; スミンツルス・ビリジス (*Sminthurus viridis*) ;

ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*) ;

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

ustralasiae)、スペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*);

コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種 (*Adoretus* spp.)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリオテス属種 (*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・リンネアツス (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィットビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属種 (*Anoplophora* spp.)、アントノムス属種 (*Anthonomus* spp.)、例えば、アントノムス・グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus* spp.)、アピオン属種 (*Apion* spp.)、アポゴニア属種 (*Apogonia* spp.)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus* spp.)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulescens*)、ブルキジウス・オブテクツス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種 (*Bruchus* spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフイマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorrhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites* spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera* spp.)、クルクリオ属種 (*Curculio* spp.)、例えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adpersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*Dermostes* spp.)、ジアブロチカ属種 (*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrot*

10

20

30

40

50

ica undecimpunctata undecimpunctata)、ジアプロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアプロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zea*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis spp.*)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロポデルス属種 (*Diloboderus spp.*)、エピラクナ属種 (*Epilachna spp.*)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilachna borealis*)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna varivestis*)、エピトリキス属種 (*Epitrix spp.*)、例えば、エピトリキス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エピトリキス・フスクラ (*Epitrix fuscula*)、エピトリキス・ヒルチペンニス (*Epitrix hirtipennis*)、エピトリキス・スブクリニタ (*Epitrix subcrinita*)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faustinus spp.*)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx spp.*)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus spp.*)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・プベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサンガイネア (*Lachnosterma consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricornis*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius spp.*)、レマ属種 (*Lema spp.*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera spp.*)、例えば、レウコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リキス属種 (*Lixus spp.*)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luperomorpha xanthodera*)、ルペロデス属種 (*Luperodes spp.*)、リクツス属種 (*Lycetus spp.*)、メガセルス属種 (*Megascelis spp.*)、メラノツス属種 (*Melanotus spp.*)、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属種 (*Melolontha spp.*)、例えば、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus spp.*)、モノカムス属種 (*Monochamus spp.*)、ナウパクツス・キサントグラフィス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属種 (*Necrobia spp.*)、ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Otiorthynchus spp.*)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiorthynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorthynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiorthynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiorthynchus rugosostriarius*)

10

20

30

40

50

、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、オキシセトニア・ジュンクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllophaga spp.*)、フィロファガ・ヘレリ (*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属種 (*Phyllotreta spp.*)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllotreta armoraciae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrypes spp.*)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus truncatus*)、プシリオデス属種 (*Psylliodes spp.*)、例えば、プシリオデス・アフィニス (*Psylliodes affinis*)、プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、プシリオデス・プンクツラタ (*Psylliodes punctulata*)、プチヌス属種 (*Ptinus spp.*)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus spp.*)、例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種 (*Sphenophorus spp.*)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属種 (*Sternechus spp.*)、例えば、ステルネクス・パルダツス (*Sternechus paludatus*)、シムフィレテス属種 (*Symphyletes spp.*)、タニメクス属種 (*Tanymecus spp.*)、例えば、タニメクス・ジラチコリス (*Tanymecus dilat icollis*)、タニメクス・インジクス (*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パリアツス (*Tanymecus palliatus*)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebriooides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium spp.*)、例えば、トリボリウム・アウダキス (*Tribolium aud ax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム (*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma spp.*)、チキウス属種 (*Tychius spp.*)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus spp.*)、ザブルス属種 (*Zabrus spp.*)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrio ides*) ;

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes spp.*)、例えば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種 (*Agromyza spp.*)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha spp.*)、アノフェレス属種 (*Anopheles spp.*)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属種 (*Asphondylia spp.*)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera spp.*)、例えば、バクトロセラ・ククルビタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセ

ラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレアエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus* spp.)、クリソミア属種 (*Chrysomya* spp.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysosona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya* spp.)、コンタリニア属種 (*Contarinia* spp.)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロピア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex* spp.)、例えば、クレキス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリセタ属種 (*Culiseta* spp.)、クテレブラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura* spp.)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デリア属種 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アントクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロリレガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia platyura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトピア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種 (*Glossina* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属種 (*Hylemya* spp.)、ヒッポドスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブレンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミア属種 (*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属種 (*Mansonia* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルス属種 (*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スプシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミア属種 (*Pegomya* spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒオシヤミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* sp

10

20

30

40

50

p.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophila casei*)、プロジプロシス属種 (*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラタ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、
 10 例例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種 (*Tetanops* spp.)、チプラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チプラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チプラ・シムプレキス (*Tipula simplex*) ;

カメムシ目 (*Hemiptera*) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシルトシポン属種 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシポン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonosцена* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletera*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、
 20 (*Aonidiella aurantii*)、(*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフィス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフィス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス (*Aphis glycines*)、アフィス・ゴシピイ (*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフィス・イリノイセンシス (*Aphis illinoisensis*)、アフィス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフィス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフィス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリダ・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (
 30
 40
 50

Boreioglycaspis melaleucae)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコブシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneosephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccomytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジラスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムポアスカ属種 (*Empoasca* spp.)、例えば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ (*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エムポアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属種 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム (*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura* spp.)、エウセルリス・ピロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・ブルカシ (*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種 (*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium c*

10

20

30

40

50

orni) (=パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス属種 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、マクロシフム属種 (*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンズ (*Macrostoteles fascifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・プルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオプシス・ペカニス (*Monelliopsis pecan*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ベルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotianae*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネホテッチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ニラバルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivenae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、プロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトプルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriiformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロングスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus*

10

20

30

40

50

viburni)、プシロブシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランスレギアエ (*Quadraspidiotus juglansregiae*)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Quadraspidiotus ostreaeformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidiotus perniciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシフム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxycanthae*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクタ (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミナム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspis articulatus*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属種 (*Sogatata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (*Stictocephala festina*)、シホニヌス・フィリレアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴノセフェラ属種 (*Tetragonocephala* spp.)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種 (*Tomaspis* spp.)、トキソプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、例えば、トキソプテラ・アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキソプテラ・シトリシズス (*Toxoptera citricidus*)、トリアレウロデス・バボラリオルム (*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオザ属種 (*Trioza* spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza diospyri*)、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ウナスピス属種 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種 (*Zygina* spp.) ;

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属種 (*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)、ブリスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp.)、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、例えば、シメキス・アドジュンクツス (*Cimex adjunctus*)、シメキス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、シメキス・ピロセルス (*Cimex pilosellus*)、コラリア属種 (*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウエッチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデルクス属種 (*Dysdercus* spp.)

.)、エウスキスツス属種 (*Euschistus* spp.)、例えば、エウスキスツス・ヘロス (*Euschistus heros*)、エウスキスツス・セルプス (*Euschistus servus*)、エウスキスツス・トリスチグムス (*Euschistus tristigma*)、エウスキスツス・バリオラリウス (*Euschistus variolarius*)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ハリオモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオパルチス属種 (*Heliopeletis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリサ属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトコリサ・バリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、レプトグロスス・オッシデンタリス (*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リゴコリス属種 (*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリスス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonia atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、例えば、ネザラ・ビリスラ (*Nezara viridula*)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・ゲイルジニイ (*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatomas* spp.);

ハチ目 (Hymenoptera) の、例えば、アクロミルメキス属種 (*Acromyrmex* spp.)、アタリア属種 (*Athalia* spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ属種 (*Atta* spp.)、ジプリオン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジプリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカムパ・ココケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカムパ・テスツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、リネピテマ・フミレ (*Linepithema humile*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、シレキス属種 (*Sirex* spp.)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属種 (*Tapinoma* spp.)、ウロセルス属種 (*Urocerus* spp.)、ベスパ属種 (*Vespa* spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (*Vespa crabro*)、キセリス属種 (*Xeris* spp.);

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

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、コプトテルメス属種 (*Coptotermes* spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)、コルニテルメス・クムランズ (*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属種 (*Cryptotermes* spp.)、インシシテルメス属種 (*Incisitermes* spp.)、マイクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、オドントテルメス属種 (*Odontoter*

10

20

30

40

50

mes spp.)、レチクリテルメス属種 (Reticulitermes spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (Reticulitermes flavipes)、レチクリテルメス・ヘスペルス (Reticulitermes hesperus) ;

チョウ目 (Lepidoptera) の、例えば、アクロイア・グリセラ (Achromia grisella)、アクロニクタ・マジヨル (Acroneicta major)、アドキソフィエス属種 (Adoxophyes spp.)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (Adoxophyes orana)、アエジア・レウコメラス (Aedia leucomelas)、アグロチス属種 (Agrotis spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (Agrotis segetum)、アグロチス・イプシロン (Agrotis ipsilon)、アラバマ属種 (Alabama spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (Alabama argillacea)、アミエロイス・トランシテラ (Amyelois transitella)、アナルシア属種 (Anarsia spp.)、アンチカルシア属種 (Anticarsia spp.)、例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (Anticarsia gemmatalis)、アルギロプロロセ属種 (Argyroproctis spp.)、バラトラ・ブラシカエ (Barathra brassicae)、ボルボ・シンナラ (Borbo cinnara)、ブクラトリキス・ツルベリエラ (Bucculatrix thurberielia)、ブパルス・ピニアリウス (Bupalus piniarius)、ブッセオラ属種 (Busseola spp.)、カコエシア属種 (Cacoecia spp.)、カロプチリア・テイボラ (Caloptilia theivora)、カプア・レチクラナ (Capua reticulana)、カルポカプサ・ポモネラ (Carpocapsa pomonella)、カルポシナ・ニポネンシス (Carpocapsa nipponensis)、ケイマトビア・ブルマタ (Cheimatomia burmata)、キロ属種 (Chilo spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス (Chilo plejadellus)、キロ・スプレッサリス (Chilo suppressalis)、コリストネウラ属種 (Choristoneura spp.)、クリシア・アムビグエラ (Clysia ambiguella)、クナファロセルス属種 (Cnaphalocerus spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (Cnaphalocrocis medinalis)、クネファシア属種 (Cnephasia spp.)、コノボモルファ属種 (Conopomorpha spp.)、コノトラケルス属種 (Conotrachelus spp.)、コピタルシア属種 (Copitarsia spp.)、シジア属種 (Cydia spp.)、例えば、シジア・ニグリカナ (Cydia nigricana)、シジア・ポモネラ (Cydia pomonella)、ダラカ・ノクツイデス (Dalaca noctuides)、ジアファニア属種 (Diaphania spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (Diatraea saccharalis)、エアリアス属種 (Earias spp.)、エクジトロファ・アウランチュム (Ecdytolopha aurantium)、エラスモパルプス・リグノセルス (Elasmopalpus lignosellus)、エルダナ・サッカリナ (Eldana saccharina)、エフェスチア属種 (Ephestia spp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (Ephestia elutella)、エフェスチア・クエーニエラ (Ephestia kuehniella)、エピノチア属種 (Epinotia spp.)、エピフィアス・ポストビタナ (Epiphyas postvittana)、エチエラ属種 (Etiella spp.)、エウリア属種 (Eulia spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ (Eupoecilia ambiguella)、エウプロクチス属種 (Euproctis spp.)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (Euproctis chrysorrhoea)、エウキソア属種 (Euxoa spp.)、フェルチア属種 (Feltia spp.)、ガレリア・メロネラ (Galleria mellonella)、グラシラリア属種 (Gracillaria spp.)、グラホリタ属種 (G

10

20

30

40

50

rapholitha spp.)、例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholitha molesta*)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholitha prunivora*)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルピコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テストラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketeticus* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonorycter crataegella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Platynota stultana*)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia interpunctella*)、プルシア属種 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (= プルテラ・マクリペンニス (*Plutella maculipennis*))、プライス属種 (*Prays* spp.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プロトパルセ属種 (*Protoparce* spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseudaletia* spp.)、例えば、

10

20

30

40

50

プセウダレチア・ウニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、プセ
 ウドプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピ
 ラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキプルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobius spp.*)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (*Schoenobius bipunctifer*)、シルポファガ属種 (*Scirpophaga spp.*)、例えば、シルポファガ・インノタタ (*Scirpophaga innotata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Sesamia spp.*)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スパ
 ルガノチス属種 (*Sparganothis spp.*)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera spp.*)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*)、
 スポドプテラ・プラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポ
 ダ属種 (*Stathmopoda spp.*)、ストモプテリキス・スブセシベラ (*Stomopteryx subsecivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthedon spp.*)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、テ
 ルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロ
 アセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pel
 lionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliell
 la*)、トルトリキス属種 (*Tortrix spp.*)、トリコファガ・タペツセラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia spp.*)、例えば、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、
 ャタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属種 (*Virachola
 spp.*) ;

10

20

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ
 ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、ジクロプルス属種 (*Dichroplus spp.*)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa spp.*)、
 例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalp
 a*)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus spp.*)、ロクスタ属種 (*Locusta spp.*)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (*Locusta mig
 ratoria*)、メラノプルス属種 (*Melanoplus spp.*)、例えば、メ
 ラノプルス・デバスタトル (*Melanoplus devastator*)、パラトラン
 チクス・ウスリエンシス (*Paratlanticus ussuriensis*)、
 スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) ;

30

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalinia spp.*)、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus spp.*)、リノ
 グナツス属種 (*Linognathus spp.*)、ペジクルス属種 (*Pediculus spp.*)、フィロキセラ・バスタトリキス (*Phylloxera vasta
 atrix*)、フチルス。プビス (*Phthirus pubis*)、トリコデクテス属種
 (*Trichodectes spp.*) ;

40

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) の、例えば、レピノツス属種 (*Lepinotus spp.*)、リポセリス属種 (*Liposcelis spp.*) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus spp.*)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalide
 s spp.*)、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalide
 s canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalide
 s felis*)、プレキス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネ
 トランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenops
 spp.*) ;

50

ylla cheopis);

アザミウマ目(Thysanoptera)の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス(Anaphothrips obscurus)、バリオトリプス・ビホルミス(Baliothrips biformis)、ドレパノトリプス・レウテリ(Drepnothrips reuteri)、エンネオトリプス・フラベンス(Enneothrips flavens)、フランクリニエラ属種(Frankliniella spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ(Frankliniella fuscata)、フランクリニエラ・オッシデンタリス(Frankliniella occidentalis)、フランクリニエラ・スクルトゼイ(Frankliniella schultzei)、フランクリニエラ・トリチシ(Frankliniella tritici)、フランクリニエラ・バシニイ(Frankliniella vaccini)、フランクリニエラ・ウィリアムシ(Frankliniella williamsi)、ヘリオトリプス属種(Heliothrips spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス(Hercinothrips femoralis)、リピホトリプス・クルエンタツス(Rhipiphorothrips cruentatus)、シルトトリプス属種(Scirtothrips spp.)、タエニトリプス・カルダモミ(Taeniothrips cardamomi)、トリプス属種(Thrips spp.)、例えば、トリプス・パルミ(Thrips palmi)、トリプスタバシ(Thrips tabaci);

10

シミ目(Zygentoma (=Thysanura))の、例えば、クテノレピスマ属種(Ctenolepisma spp.)、レピスマ・サッカリナ(Lepisma saccharina)、レスピモデス・インクイリヌス(Lepismodes inquilinus)、テルモビア・ドメスチカ(Thermobia domestica);

20

コムカデ綱(Symphyla)の、例えば、スクチゲレラ属種(Scutigerebella spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ(Scutigerebella immaculata);

軟体動物門(Mollusca)の害虫、例えば、ニマイガイ綱(Bivalvia)の、例えば、ドレイセナ属種(Dreissena spp.);及び、さらに、

マキガイ綱(Gastropoda)の、例えば、アリオン属種(Arion spp.)、例えば、アリオン・アテル・ルフス(Arion ater rufus)、ピオムファラリア属種(Biomphalaria spp.)、ブリヌス属種(Bulinus spp.)、デロセラス属種(Deroceras spp.)、例えば、デロセラス・ラエベ(Deroceras laeve)、ガルバ属種(Galba spp.)、リムナエア属種(Lymnaea spp.)、オンコメラニア属種(Oncomevania spp.)、ポマセア属種(Pomacea spp.)、スクシネア属種(Succinea spp.);

30

扁形動物門(Platyhelminthes)及び線形動物門(Nematoda)の、動物及びヒトの寄生生物、例えば、アエルロストロンギルス属種(Aelurostrongylus spp.)、アミドストムム属種(Amidostomum spp.)、アンシロストマ属種(Ancylostoma spp.)、アンギオストロンギルス属種(Angiostrongylus spp.)、アニサキス属種(Anisakis spp.)、アノプロセファラ属種(Anoplocephala spp.)、アスカリス属種(Ascaris spp.)、アスカリジア属種(Ascaridia spp.)、バイリサスカリス属種(Baylisascaris spp.)、ブルギア属種(Brugia spp.)、ブノストムム属種(Bunostomum spp.)、カピラリア属種(Capillaria spp.)、カベルチア属種(Chabertia spp.)、クロノルキス属種(Clonorchis spp.)、コオペリア属種(Cooperia spp.)、クレノソマ属種(Crenosoma spp.)、シアトストマ属種(Cyathostoma spp.)、ジクロコエリウ

40

50

ム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、ジフィリジウム属種 (*Dipylidium* spp.)、ジロフィラリア (*Dirofilaria* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、エキノコックス属種 (*Echinococcus* spp.)、エキノストマ属種 (*Echinostoma* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス属種 (*Fascioloides* spp.)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongyilonema* spp.)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ハブロンエマ属種 (*Habronema* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostrogylus* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、メトルキス属種 (*Metorchis* spp.)、メソセストイデス属種 (*Mesocestoides* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* spp.)、ムエレリウス属種 (*Muellerius* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パスサルルス属種 (*Passalurus* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スキストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.)、トリコビルハルジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.) ;

線形動物門 (*Nematoda*) の植物害虫 (即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレンクス属種 (*Aglenchus* spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ属種 (*Anguina* spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイ

10

20

30

40

50

デス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライムス属種 (*Belonolaimus* spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウザツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンク・スキシロ
 10
 フィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属種 (*Cacopaurus* spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノプラキス (*Criconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノプラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Criconemoides* spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemoides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoides ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、
 20
 例え、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコドルス属種 (*Dolichodorus* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystera*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoides* spp.)、ヘミ
 30
 シクリオホラ属種 (*Hemicycliophora* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycines*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longidorus* spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、例え
 40
 ば、メロイドギネ・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコップス属種 (*Nacobbus* spp.)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus* spp.)、パラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus* spp.)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus* spp.)、
 例え、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus* spp.)、プシレンクス属種 (*Psilenchus* spp.)、プンクトデラ属種 (*Punctodera* spp.)、クイ
 50
 ニスルシウス属種 (*Quinisulcius* spp.)、ラドホルス属種 (*Rado*

pholus spp.)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス(Radopholus citrophilus)、ラドホルス・シミリス(Radopholus similis)、口チレンクルス属種(Rotylenchulus spp.)、口チレンクス属種(Rotylenchus spp.)、スクテロネマ属種(Scutellonema spp.)、スバングイナ属種(Subanguina spp.)、トリコドルス属種(Trichodorus spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス(Trichodorus obtusus)、トリコドルス・プリミチブス(Trichodorus primitivus)、チレンコリンクス属種(Tylenchorhynchus spp.)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス(Tylenchorhynchus annulatus)、チレンクルス属種(Tylenchulus spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス(Tylenchulus semipenetrans)、キシフィネマ属種(Xiphinema spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス(Xiphinema index)。

10

【0211】

さらにまた、原生動物亜界(Protozoa)の、コクシジウム目(Coccidia)、例えば、エイメリア属種(Eimeria spp.)なども防除することができる。

【0212】

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

20

【0213】

製剤

本発明は、さらに、式(I)で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいる、殺有害生物剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態〔例えば、灌注液、滴下液及び散布液〕にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる殺有害生物剤、及び/又は、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油(例えば、ナタネ油、ヒマワリ油)、鉱油(例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル(例えば、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル)、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び/又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び/又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩(例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素二アンモニウム)、及び/又は、保持促進剤(retention promoter)(例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアールポリマー)、及び/又は、湿潤剤(例えば、グリセロール)、及び/又は、肥料(例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料)を含有する。

30

40

【0214】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである： 水溶性液剤(SL)、乳剤(EC)、水中油型エマルジョン剤(EW)、懸濁製剤(SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤(WG)、顆粒剤(GR)、カプセル製剤(capsule concentrates)(CS)； これらの製剤型及び別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている： Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production a

50

nd Protection Papers - 173 (作製元: the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576)。該製剤は、式(I)で表される1種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性成分を含有する。

【0215】

これらは、好ましくは、補助剤〔例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤 (spontaneity promoter)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤 (frost protectant)、殺生物剤、増粘剤及び/又は他の補助剤 (例えば、アジュバント) など〕を含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的活性を向上させる成分であって、その成分自体が生物学的活性を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡張 (spreading) 特性、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

10

【0216】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式(I)で表される化合物を補助剤 (例えば、増量剤、溶媒及び/若しくは固体担体、並びに/又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤) と混合させることにより調製する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

【0217】

使用する補助剤は、式(I)で表される化合物の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態 (例えば、即時使用可能な (ready-to-use) 殺有害生物剤、例えば、散布液又は種子粉衣製品) に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び/又生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

20

【0218】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである: 芳香族及び非芳香族の炭化水素類 (例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類)、アルコール類及びポリオール類 (これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び/又は、エステル化されていてもよい)、ケトン類 (例えば、アセトン、シクロヘキサノン)、エステル類 (これは、脂肪類及び油類を包含する) 及び (ポリ) エーテル類、置換されていない及び置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類 (例えば、N-アルキルピロリドン類)、及び、ラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類 (例えば、ジメチルスルホキシド)。

30

【0219】

使用する増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒としては、本質的に以下のものなどがある: 芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、鉱油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、又は、水。

40

【0220】

原則として、適切な任意の溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジ

50

メチルスルホキシド、及び、さらに、水である。

【0221】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる： 例えば、アンモニウム塩、及び、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及び/又は、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粗びき粉からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

10

【0222】

液化ガスの増量剤又は溶媒を使用することも可能である。特に適しているのは、標準温度及び標準圧力下では気体である増量剤又は担体、例えば、エアゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化水素類、又は、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0223】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び/若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである： ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式（I）で表される化合物のうちの1種類及び/又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

20

30

【0224】

該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に存在させ得るさらなる補助剤は、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などである。

【0225】

さらに、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び/若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤も存在させることができる。さらに、泡形成剤又は消泡剤も存在させることができる。

40

【0226】

さらにまた、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる可能な補助剤は、鉱油及び植物油である。

【0227】

50

場合により、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式(Ⅰ)で表される化合物は、製剤を目的として通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

【0228】

有用な保持促進剤には、動的表面張力を低減させる全ての物質(例えば、スルホコハク酸ジオクチル)又は粘弾性を増大させる全ての物質(例えば、ヒドロキシプロピルグアールポリマー)が包含される。

【0229】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬活性成分の浸透を向上させるために典型的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、(一般には、水性の)施用液から、及び/又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性成分のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献(Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152)に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナツ脂肪エトキシレート(cocconut fatty ethoxylate)(10)若しくはイソトリデシルエトキシレート(12)、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート(15)、又は、アンモニウム塩及び/若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げる
10
20
30
40
50

【0230】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量%~98重量%の式(Ⅰ)で表される化合物を含んでおり、特に好ましくは、0.01重量%~95重量%の式(Ⅰ)で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.5重量%~90重量%の式(Ⅰ)で表される化合物を含んでいる。

【0231】

該製剤(特に、殺有害生物剤)から調製された使用形態の中の式(Ⅰ)で表される化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態中の式(Ⅰ)で表される化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.00000001重量%~95重量%の式(Ⅰ)で表される化合物、好ましくは、0.00001重量%~1重量%の式(Ⅰ)で表される化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。
30
40
50

【0232】

混合物

式(Ⅰ)で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、又は、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤(microbiological agent)、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤(phytonic)、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質及び/又は植物成長調節剤との混合物において使用することも可能である。さらに、この種の活性成分組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、及び/又は、非生物的要因(例えば、高温又は低温)に対する耐性、湯水に対する耐性又は水中若しくは土壌中の塩分の含有量の上昇に対する耐性を向上させることが可能である。さらにまた、開花性能及び結果性能を改善することも可能であり、発芽能力及び根の発達を最適化することも可能であり、収穫を容易にすることも可能であり、収穫高を向上させることも可能であり、成熟に影響を及ぼすことも可能であり、収穫された生産物の品質及び/若しくは栄養価を向上させることも可能であり、収穫された生産物の貯蔵寿命
40
50

を長くすることも可能であり、並びに / 又は、収穫された生産物の加工性を改善することも可能である。

【0233】

さらに、式 (I) で表される化合物は、別の活性成分又は情報化学物質 (例えば、誘引剤、及び / 又は、鳥忌避剤、及び / 又は、植物活性化剤、及び / 又は、成長調節剤、及び / 又は、肥料) との混合物の中に存在させることもできる。同様に、式 (I) で表される化合物は、植物の特性 (例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質) を向上させるための作用剤と混合して使用することも可能である。

【0234】

本発明の特定の実施形態では、式 (I) で表される化合物は、製剤の形態又はそのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物 (好ましくは、以下に記載されている化合物) と混合された状態で存在している。

【0235】

以下に記載されている化合物のうちの 1 種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。

【0236】

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤

本明細書中において「一般名」で特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「The Pesticide Manual, 16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる (例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」) 。

【0237】

(1) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害薬、例えば、

カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、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、エチオフェンカルブ、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、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、及び、キシリルカルブ；又は、

有機リン酸エステル系、例えば、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、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス - メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロルボス / DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、O - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、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、オキシジメトン - 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、プロペタムホス、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、テブピリムホス、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、及び、パミドチオン；

(2) GABA 制御塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、

シクロジエン有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系 (フィプロール系)、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル；

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

10

20

30

40

50

薬、例えば、

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン s - シクロペンテニル異性体、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、シベルメトリン、アルファ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベルメトリン、シフェノトリン [(1 R) - トランス異性体]、デルタメトリン、エムペントリン [(E Z) - (1 R) 異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、ベルメトリン、フェノトリン [(1 R) - トランス異性体]、プラレトリン、ピレトリン類 (除虫菊 (pyrethrum))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [(1 R) 異性体]、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

DDT；又は、メトキシクロル；

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (n A C h R) 作動薬、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；又は、

スルホキサフロル；

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体 (n A C h R) のアロステリック活性化薬、例えば、

スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；

(6) 塩化物チャネル活性化薬、例えば、

アベルメクチン系 / ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン；

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、

幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレレン、キノプレレン、及び、メトプレレン；又は、

フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン；

(8) 作用機序が知られていないか又は特定されていない活性成分、例えば、ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル；又は、クロロピクリン；又は、フッ化スルフルル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石；

(9) 選択的摂食阻害薬、例えば、

ピメトロジン；又は、フロニカミド；

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、

クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロビダジン；又は、

エトキサゾール；

(11) 昆虫腸管膜の微生物ディスラプター、例えば、

バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バシルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*)、及び、BT植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1；

(12) 酸化的リン酸化阻害薬、ATPディスラプター、例えば、

10

20

30

40

50

- ジアフェンチウロン；又は、
有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、
プロパルギット；又は、テトラジホン；
(13) Hプロトン勾配を遮断する酸化的リン酸化デカップラー、例えば、クオルフェナピル、DNOC、及び、スルフルラミド；
(14) ニコチン作動性アセチルコリン受容体拮抗薬、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップ - ナトリウム；
(15) キチン生合成阻害薬（タイプ0）、例えば、
ピストリフルロン、クオルフルアズロン、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、及び、トリフルムロン；
(16) キチン生合成阻害薬（タイプ1）、例えば、
ブプロフェジン；
(17) 脱皮阻害薬（特に、双翅目（即ち、双翅類）に関する）、例えば、シロマジン；
(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、
クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド；
(19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、
アミトラズ；
(20) 複合体III電子伝達阻害薬、例えば、
ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム；
(21) 複合体I電子伝達阻害薬、例えば、
METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、
ロテノン（Derris）；
(22) 電位制御ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、
インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン；
(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、
テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト；
(24) 複合体IV電子伝達阻害薬、例えば、
ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛；又は、
シアン化物；
(25) 複合体II電子伝達阻害薬、例えば、
シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン；
(28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、
ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、及び、フルベンジアミド；
さらなる活性成分、例えば、アフィドピロベン、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石（cryolite）、ジコホル、ジフロビダジン、フルエンシルホン、フロメトキン、フルフェネリム、フルフェノキシストロピン、フルフィプロール、フルオピラム、フルピラジフロン、フフェノジド（fufenozide）、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、メベルフルトリン、パイコングディング（paichongding）、ピフルブミド、ピリフルキナゾン、ピリミノストロピン、テトラメチルフルトリン、及び、ヨードメタン；並びに、さらに、バシルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）に基づく調製物（I-1582, BioNeem, Votivo）、及び、さ

10

20

30

40

50

らに、以下の化合物：3 - ブロモ - N - { 2 - ブロモ - 4 - クロロ - 6 - [(1 - シクロ
 プロピルエチル) カルバモイル] フェニル } - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) -
 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2 0 0 5 / 0 7 7 9 3 4 から既知)、及び
 、 1 - { 2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルフ
 ィニル] フェニル } - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール -
 5 - アミン (WO 2 0 0 6 / 0 4 3 6 3 5 から既知)、 { 1 ' - [(2 E) - 3 - (4 -
 クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - フルオロスピロ [インドール - 3
 , 4 ' - ピペリジン] - 1 (2 H) - イル } (2 - クロロピリジン - 4 - イル) メタノン
 (WO 2 0 0 3 / 1 0 6 4 5 7 から既知)、 2 - クロロ - N - [2 - { 1 - [(2 E) -
 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - 4
 - (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO 2 0 0 6 / 0 0 3 4 9 4
 から既知)、 3 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1 ,
 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (WO 2 0 0 9 / 0 4 9 8 5 1 から
 既知)、 3 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 2 - オキソ - 1 , 8 - ジ
 アザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 4 - イル - エチルカルボネート (WO 2 0 0 9 /
 0 4 9 8 5 1 から既知)、 4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 , 5 - ジ
 メチルピペリジン - 1 - イル) - 5 - フルオロピリミジン (WO 2 0 0 4 / 0 9 9 1 6 0
 から既知)、 4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 - クロロフェニル) ピ
 リミジン (WO 2 0 0 3 / 0 7 6 4 1 5 から既知)、 P F 1 3 6 4 (C A S - R e g . N
 o . 1 2 0 4 7 7 6 - 6 0 - 2)、 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (ト
 リフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチ
 ル - N - { 2 - オキソ - 2 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) アミノ] エチル } ベ
 ンズアミド (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、 4 - { 5 - [3 - クロロ - 5 - (ト
 リフルオロメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1
 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - N - { 2 - オキソ - 2 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオ
 ロエチル) アミノ] エチル } - 1 - ナフタミド (WO 2 0 0 9 / 0 0 2 8 0 9 から既知)
 、 2 - [2 - ({ [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾ
 ール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メ
 チルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、 2 - [2 -
 ({ [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イ
 ル] カルボニル } アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジ
 ンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、 2 - [2 - ({ [3 - ブ
 ロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボ
 ニル } アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸
 メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、 2 - [3 , 5 - ジブロモ - 2 - ({ [3 -
 ブロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カ
 ルボニル } アミノ) ベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0
 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - N - [4 - シア
 ノ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル) フェニル] - 3 - { [5 - (トリフルオ
 ロメチル) - 2 H - テトラゾール - 2 - イル] メチル } - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキ
 サミド (WO 2 0 1 0 / 0 6 9 5 0 2 から既知)、 N - [2 - (5 - アミノ - 1 , 3 , 4
 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 3 - ブロモ - 1 -
 (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (C N 1 0
 2 0 5 7 9 2 5 から既知)、 3 - クロロ - N - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N -
 [4 - (1 , 1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘプタフルオロプロパン - 2 - イル) - 2 - メチ
 ルフェニル] フタルアミド (WO 2 0 1 2 / 0 3 4 4 7 2 から既知)、 8 - クロロ - N -
 [(2 - クロロ - 5 - メトキシフェニル) スルホニル] - 6 - (トリフルオロメチル) イ
 ミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2 0 1 0 / 1 2 9 5 0 0 から
 既知)、 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 ,
 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチ

10

20

30

40

50

エタン - 3 - イル) ベンズアミド (WO 2009 / 080250 から既知)、4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチエタン - 3 - イル) ベンズアミド (WO 2012 / 029672 から既知)、1 - [(2 - クロロ - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H - ピリド [1 , 2 - a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2009 / 099929 から既知)、1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] - 4 - オキソ - 3 - フェニル - 4 H - ピリド [1 , 2 - a] ピリミジン - 1 - イウム - 2 - オレート (WO 2009 / 099929 から既知)、(5 S , 8 R) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] - 9 - ニトロ - 2 , 3 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - 1 H - 5 , 8 - エポキシイミダゾ [1 , 2 - a] アゼピン (WO 2010 / 069266 から既知)、(2 E) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] - N ' - ニトロ - 2 - ペンチリデンヒドラジンカルボキシイミドアミド (WO 2010 / 060231 から既知)、4 - (3 - { 2 , 6 - ジクロロ - 4 - [(3 , 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル) オキシ] フェノキシ } プロボキシ) - 2 - メトキシ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリミジン (CN 101337940 から既知)、N - [2 - (tert - ブチルカルバモイル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 3 - (フルオロメトキシ) - 1 H - プラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2008 / 134969 から既知)。

10

【 0 2 3 8 】

20

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」に記載されているか、又は、インターネット上に記載されている（例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」）。

【 0 2 3 9 】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1 . 1) アルジモルフ、(1 . 2) アザコナゾール、(1 . 3) ビテルタノール、(1 . 4) プロムコナゾール、(1 . 5) シプロコナゾール、(1 . 6) ジクロブトラゾール、(1 . 7) ジフェノコナゾール、(1 . 8) ジニコナゾール、(1 . 9) ジニコナゾール - M、(1 . 10) ドデモルフ、(1 . 11) 酢酸ドデモルフ、(1 . 12) エポキシコナゾール、(1 . 13) エタコナゾール、(1 . 14) フェナリモール、(1 . 15) フェンブコナゾール、(1 . 16) フェンヘキサミド、(1 . 17) フェンプロピジン、(1 . 18) フェンプロピモルフ、(1 . 19) フルキンコナゾール、(1 . 20) フルルプリミドール、(1 . 21) フルシラゾール、(1 . 22) フルトリアホール、(1 . 23) フルコナゾール、(1 . 24) フルコナゾール - シス、(1 . 25) ヘキサコナゾール、(1 . 26) イマザリル、(1 . 27) 硫酸イマザリル、(1 . 28) イミベンコナゾール、(1 . 29) イブコナゾール、(1 . 30) メトコナゾール、(1 . 31) ミクロブタニル、(1 . 32) ナフチフィン、(1 . 33) ヌアリモール、(1 . 34) オキシポコナゾール、(1 . 35) パクロブトラゾール、(1 . 36) ペフラゾエート、(1 . 37) ペンコナゾール、(1 . 38) ピペラリン、(1 . 39) プロクロラズ、(1 . 40) プロピコナゾール、(1 . 41) プロチオコナゾール、(1 . 42) ピリプチカルブ、(1 . 43) ピリフェノックス、(1 . 44) キンコナゾール、(1 . 45) シメコナゾール、(1 . 46) スピロキサミン、(1 . 47) テブコナゾール、(1 . 48) テルピナフィン、(1 . 49) テトラコナゾール、(1 . 50) トリアジメホン、(1 . 51) トリアジメノール、(1 . 52) トリデモルフ、(1 . 53) トリフルミゾール、(1 . 54) トリホリン、(1 . 55) トリチコナゾール、(1 . 56) ウニコナゾール、(1 . 57) ウニコナゾール - P、(1 . 58) ビニコナゾール、(1 . 59) ボリコナゾール、(1 . 60) 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) シクロヘプタノール、(1 . 61) 1 - (2 , 2 - ジメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1

30

40

50

-イル) - 1H - イミダゾール - 5 - カルボン酸メチル、(1.62) N' - { 5 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロボキシ] フェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.63) N - エチル - N - メチル - N' - { 2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロボキシ] フェニル } イミドホルムアミド、及び、(1.64) O - [1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 3, 3 - ジメチルブタン - 2 - イル] 1H - イミダゾール - 1 - カルボチオエート、(1.65) ピリソキサゾール；

(2) 呼吸阻害薬(呼吸鎖阻害薬)、例えば、(2.1) ビキサフェン、(2.2) ボスカリド、(2.3) カルボキシソ、(2.4) ジフルメトリム、(2.5) フェンフラム、(2.6) フルオピラム、(2.7) フルトラニル、(2.8) フルキサピロキサド、(2.9) フラメトピル、(2.10) フルメシクロックス、(2.11) イソピラザム(シン - エピマー性ラセミ化合物(1RS, 4SR, 9RS)とアンチ - エピマー性ラセミ化合物(1RS, 4SR, 9SR)の混合物)、(2.12) イソピラザム(アンチ - エピマー性ラセミ化合物)、(2.13) イソピラザム(アンチ - エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9S)、(2.14) イソピラザム(アンチ - エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9R)、(2.15) イソピラザム(シン - エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9RS)、(2.16) イソピラザム(シン - エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9R)、(2.17) イソピラザム(シン - エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9S)、(2.18) メプロニル、(2.19) オキシカルボキシソ、(2.20) ペンフルフェン、(2.21) ペンチオピラド、(2.22) セダキサソ、(2.23) チフルザミド、(2.24) 1 - メチル - N - [2 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ)フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.25) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [2 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ)フェニル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.26) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロボキシ)フェニル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.27) N - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.28) 5, 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] オキシ } フェニル)エチル] キナゾリン - 4 - アミン、(2.29) ベンゾペンジフルピル、(2.30) N - [(1S, 4R) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、及び、(2.31) N - [(1R, 4S) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.32) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.33) 1, 3, 5 - トリメチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.34) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.35) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.36) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.37) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.38) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1

10

20

30

40

50

H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 9) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 4 0) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 4 1) ベノダニル、 (2 . 4 2) 2 - クロロ - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド、 (2 . 4 3) イソフェタミド ;

(3) 呼吸鎖の複合体 I I I に対して作用する呼吸阻害薬 (呼吸鎖阻害薬)、例えば、 (3 . 1) アメトクトラジン、 (3 . 2) アミスルブロム、 (3 . 3) アゾキシストロピン、 (3 . 4) シアゾファミド、 (3 . 5) クメトキシストロピン (c o u m e t h o x y s t r o b i n)、 (3 . 6) クモキシストロピン、 (3 . 5) ジモキシストロピン、 (3 . 8) ネンストロブリン、 (3 . 9) ファモキサドン、 (3 . 1 0) フェンアミドン、 (3 . 1 1) フルフェノキシストロピン (f l u f e n o x y s t r o b i n)、 (3 . 1 2) フルオキサストロピン、 (3 . 1 3) クレソキシム - メチル、 (3 . 1 4) メトミノストロピン、 (3 . 1 5) オリサストロピン、 (3 . 1 6) ピコキシストロピン、 (3 . 1 7) ピラクロストロピン、 (3 . 1 8) ピラメトストロピン、 (3 . 1 9) ピラオキシストロピン、 (3 . 2 0) ピリベンカルブ、 (3 . 2 1) トリクロピリカルブ、 (3 . 2 2) トリフロキシストロピン、 (3 . 2 3) (2 E) - 2 - (2 - { [6 - (3 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ) - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル] オキシ } フェニル) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルエタンアミド、 (3 . 2 4) (2 E) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - (2 - { [({ (1 E) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン } アミノ) オキシ] メチル } フェニル) エタンアミド、 (3 . 2 5) (2 E) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - { 2 - [(E) - ({ 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エトキシ } イミノ) メチル] フェニル } エタンアミド、 (3 . 2 6) (2 E) - 2 - { 2 - [({ [(1 E) - 1 - (3 - { [(E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルエテニル] オキシ } フェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) メチル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルエタンアミド、 (3 . 2 7) (2 E) - 2 - { 2 - [({ [(2 E , 3 E) - 4 - (2 , 6 - ジクロロフェニル) ブタ - 3 - エン - 2 - イリデン] アミノ } オキシ) メチル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルエタンアミド、 (3 . 2 8) 2 - クロロ - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド、 (3 . 2 9) 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2 - { [({ (1 E) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチルデン } アミノ) オキシ] メチル } フェニル) - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - オン、 (3 . 3 0) (2 E) - 2 - { 2 - [({ シクロプロピル [(4 - メトキシフェニル) イミノ] メチル } スルファニル) メチル] フェニル } - 3 - メトキシプロパ - 2 - エン酸メチル、 (3 . 3 1) N - (3 - エチル - 3 , 5 , 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - (ホルミルアミノ) - 2 - ヒドロキシベンズアミド、 (3 . 3 2) 2 - { 2 - [(2 , 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド ;

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、 (4 . 1) ベノミル、 (4 . 2) カルベンダジム、 (4 . 3) クロルフェナゾール、 (4 . 4) ジエトフェンカルブ、 (4 . 5) エタボキサム、 (4 . 6) フルオピコリド、 (4 . 7) フベリダゾール、 (4 . 8) ペンシクロン、 (4 . 9) チアベンダゾール、 (4 . 1 0) チオファネート - メチル、 (4 . 1 1) チオファネート、 (4 . 1 2) ゴキサミド、 (4 . 1 3) 5 - クロロ - 7 - (4 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 6 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、及び、 (4 . 1 4) 3 - クロロ - 5 - (6 - クロロピリジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン ;

(5) 多部位に活性を示す化合物、例えば、 (5 . 1) ボルドー液、 (5 . 2) カブ

10

20

30

40

50

タホール、(5.3)キャプタン、(5.4)クロロタロニル、(5.5)銅剤(例えば、水酸化銅)、(5.6)ナフテン酸銅、(5.7)酸化銅、(5.8)塩基性塩化銅、(5.9)硫酸銅、(5.10)ジクロフルアニド、(5.11)ジチアノン、(5.12)ドジン、(5.13)ドジン遊離塩基、(5.14)ファーバム、(5.15)フルオロホルベット、(5.16)ホルベット、(5.17)グアザチン、(5.18)酢酸グアザチン、(5.19)イミノクタジン、(5.20)イミノクタジンアルベシル酸塩、(5.21)イミノクタジン三酢酸塩、(5.22)マンカップー、(5.23)マンゼブ、(5.24)マンネブ、(5.25)メチラム、(5.26)メチラム亜鉛(zinc metiram)、(5.27)オキシ銅(copper-oxine)、(5.28)プロパミジン(propamidine)、(5.29)プロピネブ、(5.30)硫黄及び硫黄剤(例えば、多硫化カルシウム)、(5.31)チウラム、(5.32)トリルフルアニド、(5.33)ジネブ、(5.34)ジラム、及び、(5.35)アニラジン；

10

(6) 抵抗性誘導物質、例えば、(6.1)アシベンゾラル-S-メチル、(6.2)イソチアニル、(6.3)プロベナゾール、(6.4)チアジニル、及び、(6.5)ラミナリン(laminarin)；

(7) アミノ酸及びタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7.1)アンドプリム(andoprim)、(7.2)プラストサイジン-S、(7.3)シプロジニル、(7.4)カスガマイシン、(7.5)カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.6)メパニプリム、(7.7)ピリメタニル、(7.8)3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、及び、(7.9)オキシテトラサイクリン、及び、(7.10)ストレプトマイシン；

20

(8) ATP産生阻害薬、例えば、(8.1)酢酸トリフェニルスズ、(8.2)塩化トリフェニルスズ、(8.3)水酸化トリフェニルスズ、及び、(8.4)シルチオフアム；

(9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9.1)ベンチアバリカルブ、(9.2)ジメトモルフ、(9.3)フルモルフ、(9.4)イプロバリカルブ、(9.5)マンジプロパミド、(9.6)ポリオキシソリン、(9.7)ポリオキソリム、(9.8)バリダマイシン、(9.9)バリフェナレート、及び、(9.10)ポリオキシソリンB；

30

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10.1)ピフェニル、(10.2)クロロネブ(chlorneb)、(10.3)ジクロラン、(10.4)エジフェンホス、(10.5)エトリジアゾール、(10.6)ヨードカルブ(iodocarb)、(10.7)イプロベンホス、(10.8)イソプロチオラン、(10.9)プロパモカルブ、(10.10)プロパモカルブ塩酸塩、(10.11)プロチオカルブ、(10.12)ピラゾホス、(10.13)キントゼン、(10.14)テクナゼン、及び、(10.15)トルクロホス-メチル；

(11) メラニン生合成阻害薬、例えば、(11.1)カルプロパミド、(11.2)ジクロシメット、(11.3)フェノキサニル、(11.4)フタリド、(11.5)ピロキロン、(11.6)トリシクラゾール、及び、(11.7){3-メチル-1-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]ブタン-2-イル}カルバミン酸2,2,2-トリフルオロエチル；

40

(12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12.1)ベナラキシル、(12.2)ベナラキシル-M(キララキシル(kiralaxy1))、(12.3)ブピリメート、(12.4)クロジラコン、(12.5)ジメチリモール、(12.6)エチリモール、(12.7)フララキシル、(12.8)ヒメキサゾール、(12.9)メタラキシル、(12.10)メタラキシル-M(メフェノキサム)、(12.11)オフラセ、(12.12)オキサジキシル、(12.13)オキソリン酸、及び、(12.14)オクチリノン；

(13) シグナル伝達阻害薬、例えば、(13.1)クロゾリネート、(13.2)フェンピクロニル、(13.3)フルジオキソニル、(13.4)イプロジオン、(13

50

． 5) プロシミドン、 (13 . 6) キノキシフェン、 (13 . 7) ピンクロゾリン、 及び、 (13 . 8) プロキナジド；

(14) デカップラー、 例えば、 (14 . 1) ビナバクリル、 (14 . 2) ジノカップ、 (14 . 3) フェリムゾン、 (14 . 4) フルアジナム、 及び、 (14 . 5) メプチルジノカップ；

(15) さらなる化合物、 例えば、 (15 . 1) ベンチアゾール、 (15 . 2) ベトキサジン、 (15 . 3) カプシマイシン (capsimycin)、 (15 . 4) カルボン、 (15 . 5) キノメチオネート、 (15 . 6) ピリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、 (15 . 7) クフラネブ、 (15 . 8) シフルフェナミド、 (15 . 9) シモキサニル、 (15 . 10) シプロスルファミド、 (15 . 11) ダゾメット、 (15 . 12) デバカルブ、 (15 . 13) ジクロロフェン、 (15 . 14) ジクロメジン、 (15 . 15) ジフェンゾコート、 (15 . 16) ジフェンゾコートメチル硫酸塩、 (15 . 17) ジフェニルアミン、 (15 . 18) エコメイト、 (15 . 19) フェンピラザミン、 (15 . 20) フルメトベル、 (15 . 21) フルオルイミド、 (15 . 22) フルスルファミド、 (15 . 23) フルチアニル、 (15 . 24) ホセチル - アルミニウム、 (15 . 25) ホセチル - カルシウム、 (15 . 26) ホセチル - ナトリウム、 (15 . 27) ヘキサクロロベンゼン、 (15 . 28) イルママイシン、 (15 . 29) メタスルホカルブ、 (15 . 30) イソチオシアン酸メチル、 (15 . 31) メトラフェノン、 (15 . 32) ミルディオマイシン、 (15 . 33) ナタマイシン、 (15 . 34) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、 (15 . 35) ニトロタル - イソプロピル、 (15 . 36) オクチリノン、 (15 . 37) オキサモカルブ (oxamocarb)、 (15 . 38) オキシフェンチイン (oxyfenthin)、 (15 . 39) ペンタクロロフェノール及びその塩、 (15 . 40) フェノトリン、 (15 . 41) リン酸及びその塩、 (15 . 42) プロパモカルブ - ホセチレート (propamocarb - foseetyl ate)、 (15 . 43) プロパノシン - ナトリウム (propanosine - sodium)、 (15 . 44) ピリモルフ、 (15 . 45) (2 E) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、 (15 . 46) (2 Z) - 3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、 (15 . 47) ピロールニトリン、 (15 . 48) テブフロキン、 (15 . 49) テクロフタラム、 (15 . 50) トルニファニド、 (15 . 51) トリアゾキシド、 (15 . 52) トリクラミド、 (15 . 53) ザリラミド、 (15 . 54) (3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [({ 3 - [(イソブチリルオキシ) メトキシ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル) アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート、 (15 . 55) 1 - (4 - { 4 - [(5 R) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、 (15 . 56) 1 - (4 - { 4 - [(5 S) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、 (15 . 57) 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、 (15 . 58) 1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - イル 1 H - イミダゾール - 1 - カルボキシレート、 (15 . 59) 2 , 3 , 5 , 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル) ピリジン、 (15 . 60) 2 , 3 - ジブチル - 6 - クロロチエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン、 (15 . 61) 2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジチイノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c '] ジピロール

10

20

30

40

50

- 1, 3, 5, 7 (2H, 6H) - テトロン、(15.62) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - {4 - [(5R) - 5 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル) エタノン、(15.63) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - {4 - [(5S) - 5 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル) エタノン、(15.64) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - {4 - [4 - (5 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル} エタノン、(15.65) 2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル - 4H - クロメン - 4 - オン、(15.66) 2 - クロロ - 5 - [2 - クロロ - 1 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル] ピリジン、(15.67) 2 - フェニルフェノール及び塩、(15.68) 3 - (4, 4, 5 - トリフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、(15.69) 3, 4, 5 - トリクロロピリジン - 2, 6 - ジカルボニトリル、(15.70) 3 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、(15.71) 4 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 3, 6 - ジメチルピリダジン、(15.72) 5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、(15.73) 5 - クロロ - N' - フェニル - N' - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル) チオフェン - 2 - スルホノヒドラジド、(15.74) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.75) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.76) 5 - メチル - 6 - オクチル [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、(15.77) (2Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリル酸エチル、(15.78) N' - (4 - { [3 - (4 - クロロベンジル) - 1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル] オキシ} - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.79) N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15.80) N - [(4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15.81) N - [(5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2, 4 - ジクロロニコチンアミド、(15.82) N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2, 4 - ジクロロニコチンアミド、(15.83) N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードニコチンアミド、(15.84) N - {(E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] メチル} - 2 - フェニルアセトアミド、(15.85) N - {(Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] メチル} - 2 - フェニルアセトアミド、(15.86) N' - {4 - [(3 - tert - ブチル - 4 - シアノ - 1, 2 - チアゾール - 5 - イル) オキシ] - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.87) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - N - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.88) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.89) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1S) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミ

ド、(15.90){6-[({[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸ペンチル、(15.91)フェナジン-1-カルボン酸、(15.92)キノリン-8-オール、(15.93)キノリン-8-オールスルフェート(2:1)、(15.94){6-[({[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸 tert-ブチル、(15.95)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2'-(トリフルオロメチル)ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.96)N-(4'-クロロピフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.97)N-(2',4'-ジクロロピフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.98)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4'-(トリフルオロメチル)ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.99)N-(2',5'-ジフルオロピフェニル-2-イル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.100)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4'-(プロパ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.101)5-フルオロ-1,3-ジメチル-N-[4'-(プロパ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.102)2-クロロ-N-[4'-(プロパ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(15.103)3-(ジフルオロメチル)-N-[4'-(3,3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.104)N-[4'-(3,3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.105)3-(ジフルオロメチル)-N-(4'-エチルピフェニル-2-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.106)N-(4'-エチルピフェニル-2-イル)-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.107)2-クロロ-N-(4'-エチルピフェニル-2-イル)ニコチンアミド、(15.108)2-クロロ-N-[4'-(3,3-ジメチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(15.109)4-(ジフルオロメチル)-2-メチル-N-[4'-(トリフルオロメチル)ピフェニル-2-イル]-1,3-チアゾール-5-カルボキサミド、(15.110)5-フルオロ-N-[4'-(3-ヒドロキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.111)2-クロロ-N-[4'-(3-ヒドロキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(15.112)3-(ジフルオロメチル)-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.113)5-フルオロ-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.114)2-クロロ-N-[4'-(3-メトキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル)ピフェニル-2-イル]ニコチンアミド、(15.115)(5-ブロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル)(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルフェニル)メタノン、(15.116)N-[2-(4-{[3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-イン-1-イル]オキシ}-3-メトキシフェニル)エチル]-N₂-(メチルスルホニル)バリンアミド、(15.117)4-オキソ-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15.118)ブタ-3-イン-1-イル{6-[({[(Z)-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバメート、

(1 5 . 1 1 9) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール (互変異性体形態 :
 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 (1 H) - オン)、 (1 5 . 1 2 0) 3 , 4 ,
 5 - トリヒドロキシ安息香酸プロピル、 (1 5 . 1 2 1) 1 , 3 - ジメチル - N - (1 ,
 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 2 2) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 R) - 1 , 1
 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール
 - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 2 3) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 ,
 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール -
 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 2 4) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) -
 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 10
 3 - イル) メタノール、 (1 5 . 1 2 5) (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェ
 ニル) - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピ
 リジン - 3 - イル) メタノール、 (1 5 . 1 2 6) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 -
 フルオロフェニル) - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 4
 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、 (1 5 . 1 2 7) 2 - { [3 - (2 - クロ
 ロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } -
 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 2 8) 1
 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン -
 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、 (1
 5 . 1 2 9) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - 20
 (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 -
 トリアゾール、 (1 5 . 1 3 0) 2 - [1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロ
 キシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2
 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 3 1) 2 - { [r e l (2 R , 3 S) - 3
 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル
] メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5
 . 1 3 2) 2 - { [r e l (2 R , 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4
 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1
 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 3 3) 1 - { [r e l (2 R , 3 S)
 - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - 30
 イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、 (1 5 .
 1 3 4) 1 - { [r e l (2 R , 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 -
 ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾ
 ール - 5 - イルチオシアネート、 (1 5 . 1 3 5) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r
 e l (2 R , 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニ
 ル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 (1 5 . 1 3
 6) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r e l (2 R , 3 R) - 3 - (2 - クロロフェ
 ニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1 H
 - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 (1 5 . 1 3 7) 2 - [(2 S , 4 S , 5 S) - 1 - (2
 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イ
 ル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 3
 8) 2 - [(2 R , 4 S , 5 S) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ
 - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4
 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 3 9) 2 - [(2 R , 4 R , 5 R) - 1 - (2
 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イ
 ル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4
 0) 2 - [(2 S , 4 R , 5 R) - 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ
 - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4
 - トリアゾール - 3 - チオン、 (1 5 . 1 4 1) 2 - [(2 S , 4 S , 5 R) - 1 - (2
 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イ 50

ル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(15.142) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(15.143) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(15.144) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(15.145) 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ベンズアミド、(15.146) 2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル) キナゾリン、(15.147) 2 - [6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル] キナゾリン、(15.148) 3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、(15.149) アブシジン酸、(15.150) 3 - (ジフルオロメチル) - N - メトキシ - 1 - メチル - N - [1 - (2, 4, 6 - トリクロロフェニル) プロパン - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.151) N' - [5 - ブロモ - 6 - (2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イルオキシ) - 2 - メチルピリジン - 3 - イル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.152) N' - {5 - ブロモ - 6 - [1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.153) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(1R) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.154) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(1S) - 1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.155) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(シス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.156) N' - {5 - ブロモ - 6 - [(トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(15.157) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.158) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.159) N - (2 - tert - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.160) N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.161) N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.162) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.163) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.164) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.165) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(15.166) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド

10

20

30

40

50

、(15.167) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-メチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.168) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.169) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピル-5-メチルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.170) N-(2-tert-ブチル-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.171) N-[5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.172) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-N-[5-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.173) N-[2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.174) N-[3-クロロ-2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.175) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-4,5-ジメチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.176) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオアミド、(15.177) 3-(ジフルオロメチル)-N-(7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.178) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.179) 3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15.180) N'-(2,5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15.181) N'-{4-[(4,5-ジクロロ-1,3-チアゾール-2-イル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15.182) N-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン。

【0240】

クラス(1)~(15)に記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成し得る。

【0241】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

式(I)で表される化合物は、生物学的殺有害生物剤と組み合わせることができる。

【0242】

生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(例えば、タンパク質又は二次代謝産物)などがある。

【0243】

生物学的殺有害生物剤としては、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌及び生物学的殺虫剤、殺菌剤又は殺線虫剤として作用する細菌などがある。

【0244】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な上記細菌類の

10

20

30

40

50

例は、以下のものである：

バシルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) 株 FZB42 (DSM 231179)、又は、バシルス・セレウス (*Bacillus cereus*)、特に、バシルス・セレウス (*B. cereus*) 株 CN CM I - 1562、又は、バシルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) 株 I - 1582 (受託番号 CNCM I - 1582)、又は、バシルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、株 GB34 (受託番号 ATCC 700814) 及び株 QST2808 (受託番号 NRRL B - 30087)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*)、特に、株 GB03 (受託番号 ATCC SD - 1397)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*) 株 QST713 (受託番号 NRRL B - 21661)、又は、バシルス・スプチリス (*Bacillus subtilis*) 株 OST 30002 (受託番号 NRRL B - 50421)、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス (*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (抗原型 H - 14) 株 AM65 - 52 (受託番号 ATCC 1276)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ (*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株 ABTS - 1857 (SD - 1372)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ (*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 株 HD - 1、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス (*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*) 株 NB 176 (SD - 5428)、パステウリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種 (*Pasteuria spp.*) (口チレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*) 線虫) - PR3 (受託番号 ATCC SD - 5834)、ストレプトミセス・マイクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) 株 AQ6121 (= QRD 31.013、NRRL B - 50550)、ストレプトミセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) 株 AQ 6047 (受託番号 NRRL 30232)。

【0245】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な菌類及び酵母類の例は、以下のものである：

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に、株 CON/M/91 - 8 (受託番号 DSM - 9660)、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium spp.*)、特に、株 HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*)) として知られていた)、特に、株 KV01、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 / ATCC 90448)、メトスクニコウィア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に、株 NRRL Y - 30752、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (現在：イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に、株 IFPC 200613 又は株 Apopka 97 (受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス (*P. lilacinus*) 株 251 (AGAL 89/030550)、タラロミセス・フラブス (*Talaromyces flavus*)、特に、株 V117b、トリコデルマ・アトロピリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に、株 SC1 (受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Tricho*

10

20

30

40

50

derma harzianum)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ(T. harzianum rifai) T39(受託番号 CNCM I-952)。

【0246】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能なウイルス類の例は、以下のものである：

リンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana)顆粒病ウイルス(GV)、コドリンガ(Cydia pomonella)顆粒病ウイルス(GV)、オオタバコガ(Helicoverpa armigera)核多角体病ウイルス(NPV)、シロイチモジヨトウ(Spodoptera exigua)mNPV、ツマジロクサヨトウ(Spodoptera frugiperda)mNPV、エジプトヨトウ(African cotton leafworm)(Spodoptera littoralis)NPV。

10

【0247】

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定に特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び菌類も、同様に包含される。例としては、以下のものを挙げることができる：

アグロバクテリウム属種(Agrobacterium spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス(Azorhizobium caulinodans)、アゾスピリillum属種(Azospirillum spp.)、アゾトバクテル属種(Azotobacter spp.)、ブラジリゾビウム属種(Bradyrhizobium spp.)、ブルクホルデリア属種(Burkholderia spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア(Burkholderia cepacia)(以前は、Pseudomonas cepacia)として知られていた)、ギガスポラ属種(Gigaspora spp.)又はギガスポラ・モノスポルム(Gigaspora monosporum)、グロムス属種(Glomus spp.)、ラッカリア属種(Laccaria spp.)、ラクトバシルス・ブクネリ(Lactobacillus buchneri)、パラグロムス属種(Paraglomus spp.)、ピソリトゥス・チンクトルス(Pisolithus tinctorius)、Pseudomonas属種(Pseudomonas spp.)、リゾビウム属種(Rhizobium spp.)、特に、リゾビウム・トリホリイ(Rhizobium trifolii)、リゾポゴン属種(Rhizopogon spp.)、スクレロデルマ属種(Sclerotinia spp.)、スイルス属種(Suillus spp.)、ストレプトミセス(Streptomyces spp.)。

20

30

【0248】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(これは、タンパク質及び二次代謝産物を包含する)の例は、以下のものである：

ニンニク(Allium sativum)、ニガヨモギ(Artemisia absinthium)、アザジラクチン(azadirachtin)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス(Cassia nigricans)、セラストルス・アングラツス(Celastrus angulatus)、アメリカアリタソウ(Chenopodium anthelminticum)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ(Dryopteris filix-mas)、スギナ(Equisetum arvense)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up(キノア(Chenopodium quinoa)サポニン抽出物)、除虫菊(pyrethrum/pyrethrins)、スリナムニガキ(Quassia amara)、コナラ属(Quercus)、キラヤ属(Quillaja)、Regalia、「Requiem^{T M} Insecticide」、ロテノン、リアニア/リアノジン、ヒレハリソウ(Symphytum officinale)、ヨモギギク(Tanacetum vulgare)、チモール、Triact 70、TriCon、

40

50

キンレンカ (*Tropaeolum majus*)、セイヨウイラクサ (*Urtica dioica*)、*Veratrin*、セイヨウヤドリギ (*Viscum album*)、アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。

【0249】

混合成分としての薬害軽減剤

式 (I) で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセツト (-メキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール (-エチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン (-エチル)、メフェンピル (-ジエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N-({ 4 - [(メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド (CAS 129531-12-0)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン (CAS 71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン (CAS 52836-31-4)。

10

【0250】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の全ての部分を処理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物 (天然に発生している作物植物を包含する) のような全ての植物及び植物個体群、例えば、穀類 (コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物 (果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実を有するもの及びブドウの木) などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、塊茎、根及び根茎などである。収穫物、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) 及び生殖繁殖器官 (generative propagation material)、例えば、挿穂 (cutting)、塊茎、根茎、かき苗 (slip) 及び種子なども、植物の部分に包含される。

20

30

【0251】

式 (I) で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、煙霧 (fogging)、ばらまき、塗布、注入などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官 (propagation material) の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

40

【0252】

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

50

それぞれ市販されている慣習的な品種又は使用されている慣習的な品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた、新しい特性(「形質」)を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

【0253】

トランスジェニック植物、種子処理、及び、統合イベント(integration events)

特に有利で有益な特性(「形質」)を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種(遺伝子工学により得られたもの)に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、湯水又は水中若しくは土壌中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び/又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵寿命及び/又は改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物に対する(例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する)植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する遺伝物質(例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIF並びにそれらの組合せ)によって植物体内で形成された毒素による、害虫及び有害微生物に対する(例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する)植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び/又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性(SAR)、システムイン(systemin)、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び/又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の除草活性成分(例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート類又はホスフィントリシン)に対する植物の向上した耐性である(例えば、「PAT」遺伝子)。望まれる当該特性(「形質」)を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類(コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの)などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性(「形質」)は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

【0254】

作物保護 - 処理の種類

式(I)で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の処理は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散(spreading-on)、注入、灌水(灌漑(drenching))、点滴灌漑などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官(propagation material)の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理用の粉末として、液体種子処理用の溶液として、スラリー処理用の水溶性粉末として、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても行う。さらに、式(I)で表される化合物を微量散布法(ultra-low volume method)によって施用することも可能であり、又は、該施用形態若しくは式(I)で表される化合物自体を土壌中に注

10

20

30

40

50

入することも可能である。

【0255】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用である。即ち、式(I)で表される化合物を茎葉部に施用し、その際、処理頻度及び施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

【0256】

浸透移行性活性化合物の場合、式(I)で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。従って、植物は、その植物の生息環境に対して式(I)で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注(drenching)によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させる〔即ち、植物の成育場所(例えば、土壌、又は、水耕系)に式(I)で表される化合物の液体形態を含浸させる〕ことによって、又は、土壌施用〔即ち、式(I)で表される化合物を固体形態で(例えば、顆粒形態で)植物の成育場所に導入する〕ことによって、達成することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式(I)で表される化合物(例えば、粒剤として)を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

【0257】

種子の処理

植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。それにもかかわらず、種子の処理においては、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が生じる。かくして、植物の貯蔵中、播種後又は出芽後に殺有害生物剤を追加で施用することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性成分によって植物自体に損傷を引き起こすことなく、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する活性成分の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の殺有害生物剤を使用して種子及び発芽中の植物の最適な保護を達成するために、害虫抵抗性トランスジェニック植物又は害虫耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性又は殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

【0258】

従って、本発明は、特に、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を式(I)で表される化合物のうちの1種類で処理することによる。種子及び発芽中の植物を害虫による攻撃から保護するための本発明の方法は、さらに、該種子を、式(I)で表される化合物と混合成分によって、1回の操作で同時に又は順次に処理するような方法も包含する。それは、さらにまた、該種子を、式(I)で表される化合物と混合成分によって、異なった時点で処理するような方法も包含する。

【0259】

本発明は、さらに、種子及びその種子から生じた植物を害虫に対して保護するために種子を処理するための、式(I)で表される化合物の使用にも関する。

【0260】

さらに、本発明は、害虫に対して保護されるように、式(I)で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式(I)で表される化合物と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式(I)で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式(I)で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式(I)で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式(I)で表される化合物と混合成分が被膜の一部として又は被膜に加えられたさらなる1つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

【0261】

本発明は、さらに、式(I)で表される化合物で処理された後で、埃による種子の摩耗を防止するために、フィルムコーティングプロセスに付される種子にも関する。

【0262】

式(I)で表される化合物のうちの1種類が浸透移行的に作用する場合に生じる有利な点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなくに作物を直接処理する手間を省くことができる。

【0263】

別の有利な点は、式(I)で表される化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽及び出芽が増進され得るということである。

【0264】

式(I)で表される化合物を、特に、トランスジェニック種子に対しても使用することが可能であるということも、有利であると考えられる。

【0265】

さらに、式(I)で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、その結果として、共生生物(例えば、根粒菌、菌根菌及び/又は内部寄生性の細菌若しくは菌類)によるコロニー形成が良好になり、及び/又は、窒素固定が最適化される。

【0266】

式(I)で表される化合物は、農業において、温室内で、森林で又は園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワ及びエンバク)、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、カノラ、ナタネ、ビート(例えば、テンサイ及び飼料用ビート)、ラッカセイ、野菜(例えば、トマト、キュウリ、インゲンマメ、アブラナ科野菜、タマネギ及びレタス)、果実植物、芝生及び観賞植物の種子を包含する。穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネ及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

【0267】

既に上記で記載したように、式(I)で表される化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、ポリペプチド(特に、殺虫特性及び/又は殺線虫特性を有するポリペプチド)の発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子を包含する。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は、バシルス(*Bacillus*)種、リゾビウム(*Rhizobium*)種、プセウドモナス(*Pseudomonas*)種、セラチア(*Serratia*)種、トリコデルマ(*Trichoderma*)種、クラビバクテル(*Clavibacter*)種、グロムス(*Glomus*)種又はグリオクラジウム(*Gliocladium*)種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種(*Bacillus* sp.)に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する。

【0268】

本発明に関連して、式(I)で表される化合物は、種子に対して施用する。該種子は、好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子(例えば、プライミング)を使用することもできる。イネの種子の場合、例えば、特定の段階(鳩胸段階)に達するまで水中で予め膨潤させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が良好になり、及び、出芽がより均一になる。

10

20

30

40

50

【0269】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、種子から生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式（I）で表される化合物の量及び／又はさらなる添加剤の量を選択することに、概して注意しなければならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性成分の場合に、確実に実施しなければならない。

【0270】

一般に、式（I）で表される化合物は、適切な製剤の形態で種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤及びプロセスは、当業者には知られている。

【0271】

式（I）で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換することが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換することも可能である。

【0272】

これらの製剤は、既知方法で、式（I）で表される化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることによって、製造する。

【0273】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中であまり溶解しない顔料又は水中で溶解する染料を使用することができる。その例としては、「Rhodamin B」、「C.I. Pigment Red 112」及び「C.I. Solvent Red 1」の名称で知られている着色剤などを挙げるができる。

【0274】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な湿潤剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネート又はジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用する。

【0275】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる適切な分散剤及び／又は乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用する。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体又は硫酸化誘導体などがある。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類及びアリアルスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

【0276】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的に使用される全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用する。

【0277】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げるができる。

【0278】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。

10

20

30

40

50

好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレー及び微粉化シリカなどを挙げることができる。

【0279】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤の中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣剤中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げることができる。

【0280】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤の中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくは、ジベレリンA1、ジベレリンA3(=ジベレリン酸)、ジベレリンA4及びジベレリンA7である。特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている(c f . R . Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

10

【0281】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚剤剤(concentrate)又は水で希釈することによって濃厚剤剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク及びライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することが可能であり、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズ及びビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、又は、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することが可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤又はそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。

20

【0282】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤又はその種子粉衣剤から調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機(これは、バッチ式又は連続的に作動される)の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣剤を、そのまま添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

30

【0283】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該剤剤中の式(I)で表される化合物の特定の含有量及び当該種子に左右される。式(I)で表される化合物の施用量は、一般に、種子1kg当たり0.001~50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01~15gである。

【0284】

動物衛生

動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式(I)で表される化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物又は内部寄生生物に対して、活性を示す。用語「内部寄生生物」は、特に、蠕虫類及び原生動物(例えば、コクシジウム)を包含する。外部寄生生物は、典型的には、及び、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類及びダニ類である。

40

【0285】

獣医学の分野において、恒温動物に対する毒性が好ましい程度である式(I)で表される化合物は、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物(domestic animal)において発生す

50

る寄生生物を防除するのに適している。

【0286】

農業用家畜としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、並びに、特に、ウシ及びブタ；家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、及び、特に、ニワトリ；魚類及び甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類及び甲殻類の動物；及び、さらに、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0287】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ハムスター、テンジクネズミ、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、及び、特に、イヌ、ネコ、籠の鳥、爬虫類、両生類、又は、水槽の魚。

10

【0288】

好ましい実施形態では、式(I)で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0289】

好ましい別の実施形態では、式(I)で表される化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、及び、特に、家禽類に対して、投与される。

【0290】

動物寄生生物を防除するために式(I)で表される化合物を使用することは、上記動物の病気、死亡事例を低減又は予防すること、及び、生産性(performance)(肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合)の低下を低減又は予防することが意図され、その結果、より経済で且つより容易な動物飼育が可能となり、及び、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

20

【0291】

動物衛生の分野に関連して、用語「防除する(control)」又は「防除する(controlling)」は、式(I)で表される化合物が、寄生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がない程度にまで低減させることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明に関連して、式(I)で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すことが可能であること、その成長を阻害することが可能であること、又は、その増殖を阻害することが可能であることを意味する。

【0292】

節足動物としては、以下のものを挙げることができる：

アノプurlid目(Anoplurida)の、例えば、ハエマトピヌス属種(Haematopinus spp.)、リノグナツス属種(Linognathus spp.)、ペジクルス属種(Pediculus spp.)、プチルス属種(Phthirus spp.)、ソレノポテス属種(Solenopotes spp.)；マロファギダ目(Mallophagida)並びにアムブリセリナ亜目(Amblycerina)及びイスクノセリナ亜目(Ichnocerina)の、例えば、トリメノポン属種(Trimenopon spp.)、メノポン属種(Menopon spp.)、トリノトン属種(Trinoton spp.)、ボビコラ属種(Bovicola spp.)、ウェルネキエラ属種(Werneckiella spp.)、レピケントロン属種(Lepikentron spp.)、ダマリナ属種(Damalina spp.)、トリコデクテス属種(Trichodectes spp.)、フェリコラ属種(Felicola spp.)；双翅目(Diptera)並びにネマトセリナ亜目(Nematocera)及びブラキセリナ亜目(Brachycerina)の、例えば、アエデス属種(Aedes spp.)、アノフェレス属種(Anopheles spp.)、クレキス属種(Culex spp.)、シムリウム属種(Simulium spp.)、エウシムリウム属種(Eusimulium spp.)、フレボトムス属種(Phlebotomus spp.)、ルトゾミイヤ属種(Lutzomyia spp.)、クリコイデス属種(Culicoides spp.)、クリソプス属種(Chrysops spp.)、オダグミア属種(Odagmia spp.)、ウ

30

40

50

イルヘルミア属種 (*Wilhelmia* spp.)、ヒボミトラ属種 (*Hybomitra* spp.)、アチロツス属種 (*Atylotus* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、フィリポミア属種 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属種 (*Braula* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア属種 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、ハエマトピア属種 (*Haematobia* spp.)、モレリア属種 (*Morellia* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、グロシナ属種 (*Glossina* spp.)、カリホラ属種 (*Calliphora* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、クリソミア属種 (*Chrysomyia* spp.)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ属種 (*Lipoptena* spp.)、メロファグス属種 (*Melophagus* spp.)、リノエストルス属種 (*Rhinoestrus* spp.)、チプラ属種 (*Tipula* spp.)；ノミ目 (*Siphonapterida*) の、例えば、ブレキス属種 (*Pulex* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、ツンガ属種 (*Tunga* spp.)、キセノプシラ属種 (*Xenopsylla* spp.)、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)；
 ヘテロプテリダ目 (*Heteropterida*) の、例えば、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、パンストロンギルス属種 (*Panstrongylus* spp.)；並びに、さらに、ゴキブリ目 (*Blattarida*) の有害害虫及び衛生害虫。

【0293】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げる事ができる：

ダニ亜綱 (*Acarari* (*Acarina*)) 及びメタスティグマ目 (*Metastigmata*) の、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*) の、例えば、アルガス属種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ科 (*Ixodidae*) の、例えば、イキシデス属種 (*Ixodes* spp.)、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、デルマセントル属種 (*Dermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種 (*Haemaphysalis* spp.)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.) (多宿主ダニの原属)；メソスティグマ目 (*Mesostigmata*) の、例えば、デルマニسس属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニسس属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニسس属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Raillietia* spp.)、プネウモニسس属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属種 (*Sternostoma* spp.)、バロア属種 (*Varroa* spp.)、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.)；アクチネジダ目 (*Actinedida* (*Prostigmata*)) の、例えば、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属種 (*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア属種 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオピア属種 (*Myobia* spp.)、プソレルガテス属種 (*Psorergates* spp.)、デモデキス属種 (*Demodex* spp.)、トロムビクラ属種 (*Trombicula* spp.)、ネオトロムビクラ属種 (*Neotrombiculla* spp.)、リストロホル

ス属種 (*Listrophorus* spp.) ; 及び、アカリジダ目 (*Acaridida* (*Astigmata*)) の、例えば、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、チロファグス属種 (*Tyrophagus* spp.)、カログリフス属種 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属種 (*Pterolichus* spp.)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属種 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属種 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属種 (*Cytodites* spp.)、ラミノシオプテス属種 (*Laminosioptes* spp.)。

10

【0294】

寄生性原生動物としては、以下のものを挙げる事ができる：

鞭毛虫亜門 (*Mastigophora*) (鞭毛虫類 (*Flagellata*))、例えば、トリパノソーマ科 (*Trypanosomatidae*)、例えば、トリパノソーマ・b・ブルセイ (*Trypanosoma b. brucei*)、トリパノソーマ・b・ガムビエンセ (*T. b. gambiense*)、トリパノソーマ・b・ロデシエンセ (*T. b. rhodesiense*)、トリパノソーマ・コンゴレンセ (*T. congolense*)、トリパノソーマ・クルジ (*T. cruzi*)、トリパノソーマ・エバンシ (*T. evansi*)、トリパノソーマ・エクイヌム (*T. equinum*)、トリパノソーマ・レウイシ (*T. lewisi*)、トリパノソーマ・ペルカエ (*T. percae*)、トリパノソーマ・シミアエ (*T. simiae*)、トリパノソーマ・ビバキス (*T. vivax*)、レイスマニア・ブラシリエンシス (*Leishmania brasiliensis*)、レイスマニア・ドノバニ (*L. donovani*)、レイスマニア・トロピカ (*L. tropica*) ; 例えば、トリコモナス科 (*Trichomonadidae*)、例えば、ギアルジア・ラムブリア (*Giardia lamblia*)、ギアルジア・カニス (*G. canis*) ;

20

有毛根足虫亜門 (*Sarcomastigophora*) (根足虫類 (*Rhizopoda*)) ; 例えば、エントアメーバ科 (*Entamoebidae*)、例えば、エントモエバ・ヒストリチカ (*Entamoeba histolytica*) ; ハルトマネリダエ科 (*Hartmannellidae*)、例えば、アcantamoeba属種 (*Acanthamoeba* sp.)、ハルマレラ属種 (*Harmanella* sp.) ;

30

アピコンプレックス門 (*Apicomplexa*) (孢子虫類 (*Sporozoa*))、例えば、エイメリア科 (*Eimeriidae*)、例えば、エイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、エイメリア・アデノイデス (*E. adenoides*)、エイメリア・アラバメンシス (*E. alabamensis*)、エイメリア・アナチス (*E. anatis*)、エイメリア・アンセリナ (*E. anserina*)、エイメリア・アルロインギ (*E. arloingi*)、エイメリア・アシャタ (*E. ashata*)、エイメリア・アウブルネンシス (*E. auburnensis*)、エイメリア・ボビス (*E. bovis*)、エイメリア・ブルネッチ (*E. brunetti*)、エイメリア・カニス (*E. canis*)、エイメリア・キンキラエ (*E. chinchillae*)、エイメリア・クルペアルム (*E. clupearum*)、エイメリア・コルムバエ (*E. columbae*)、エイメリア・コントルタ (*E. contorta*)、エイメリア・克蘭ダリス (*E. crandalis*)、エイメリア・デブリエッキ (*E. debliccki*)、エイメリア・ジスペルサ (*E. dispersa*)、エイメリア・エリプソイダレス (*E. ellipsoidales*)、エイメリア・ファルシホルミス (*E. falciformis*)、エイメリア・ファウレイ (*E. faurei*)、エイメリア・フラベセンス (*E. flavescens*)、エイメリア・ガロパボニス (*E. gallopavonis*)、エイメリア・ハガニ (*E. hagai*)、エイメリア・インテスチナリス (*E. intestinalis*)、エイメリア・イロクオイナ (*E. iroquoina*)、エイメ

40

50

リア・イレシズア (*E. irresidua*)、エイメリア・ラベアナ (*E. labbeana*)、エイメリア・レウカルチ (*E. leucarti*)、エイメリア・マグナ (*E. magna*)、エイメリア・マキシマ (*E. maxima*)、エイメリア・メジア (*E. media*)、エイメリア・メレアグリジス (*E. meleagridis*)、エイメリア・メレアグリミチス (*E. meleagrimitis*)、エイメリア・ミチス (*E. mitis*)、エイメリア・ネカトリキス (*E. necatrix*)、エイメリア・ニナコーリアキモバエ (*E. ninakohlyakimovae*)、エイメリア・オビス (*E. ovis*)、エイメリア・パルバ (*E. parva*)、エイメリア・パボニス (*E. pavonis*)、エイメリア・ペルホランス (*E. perforans*)、エイメリア・ファサニ (*E. phasani*)、エイメリア・ピリホルミス (*E. piriformis*)、エイメリア・プラエコキス (*E. praecox*)、エイメリア・レシズア (*E. residua*)、エイメリア・スカブラ (*E. scabra*)、エイメリア属種 (*E. spec.*)、エイメリア・ステダ (*E. stiedai*)、エイメリア・スイス (*E. suis*)、エイメリア・テナラ (*E. tenella*)、エイメリア・ツルンカタ (*E. truncata*)、エイメリア・ツルッタエ (*E. truttae*)、エイメリア・ズエルニイ (*E. zuernii*)、グロビジウム属種 (*Globidium spec.*)、イソスポラ・ベリ (*Isospora belli*)、イソスポラ・カニス (*I. canis*)、イソスポラ・フェリス (*I. felis*)、イソスポラ・オヒオエンシス (*I. ohioensis*)、イソスポラ・リボルタ (*I. rivolta*)、イソスポラ属種 (*I. spec.*)、イソスポラ・スイス (*I. suis*)、シスチスポラ属種 (*Cystispora spec.*)、クリプトスポリジウム属種 (*Cryptosporidium spec.*)、特に、クリプトスポリジウム・パルブム (*C. parvum*)；例えば、トキソプラズマ科 (*Toxoplasmodidae*)、例えば、トキソプラズマ・ゴンジイ (*Toxoplasma gondii*)、ハモンジア・ヘイドルニイ (*Hammondia heydorni*)、ネオスポラ・カニヌム (*Neospora caninum*)、ベスノイチア・ベスノイチイ (*Besnoitia besnoitii*)；例えば、肉胞子虫科 (*Sarcocystidae*)、例えば、サルコシスチス・ボビカニス (*Sarcocystis bovicanis*)、サルコシスチス・ボビホルミス (*S. bovihominis*)、サルコシスチス・オビカニス (*S. ovicanis*)、サルコシスチス・オビフェリス (*S. ovifelis*)、サルコシスチス・ネウロナ (*S. neuronae*)、サルコシスチス属種 (*S. spec.*)、サルコシスチス・スイホミニス (*S. sui hominis*)；例えば、レウコゾイダエ科 (*Leucozooidae*)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ (*Leucozytozoon simondi*)；例えば、プラスモジウム科 (*Plasmodiidae*)、例えば、プラスモジウム・ベルゲイ (*Plasmodium berghei*)、プラスモジウム・ファルシパルム (*P. falciparum*)、プラスモジウム・マラリアエ (*P. malariae*)、プラスモジウム・オバレ (*P. ovale*)、プラスモジウム・ビバキス (*P. vivax*)、プラスモジウム属種 (*P. spec.*)；例えば、ピロプラズマ亜目 (*Piroplasmea*)、例えば、バベシア・アルゲンチナ (*Babesia argentina*)、バベシア・ボビス (*B. bovis*)、バベシア・カニス (*B. canis*)、バベシア属種 (*B. spec.*)、テイレリア・パルバ (*Theileria parva*)、テイレリア属種 (*Theileria spec.*)；例えば、アデレア亜目 (*Adeleina*)、例えば、ヘパトゾオン・カニス (*Hepatozoon canis*)、ヘパトゾオン属種 (*H. spec.*)。

【0295】

病原性内部寄生物 (これは、蠕虫類である) としては、扁形動物門 (*Platyhelmintha*) [例えば、単生類 (*Monogenea*)、糸虫類 (*cestodes*) 及び吸虫類 (*trematodes*)]、線形動物 (*roundworms*)、鉤頭動

物門 (*Acanthocephala*) 及び舌形動物門 (*Pentastoma*) などがある。これらのものとしては、以下のものを挙げる事ができる：

単生綱 (*Monogenea*)：例えば：ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ダクチロギルス属種 (*Dactylogyrus* spp.)、ポリストマ属種 (*Polystoma* spp.)；

条虫類 (*Cestodes*)：ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllidea*) の、例えば：ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、スピロメトラ属種 (*Spirometra* spp.)、シストセファルス属種 (*Schistocephalus* spp.)、リグラ属種 (*Ligula* spp.)、ボトリジウム属種 (*Bothridium* spp.)、ジフロゴノボルス属種 (*Diphlogonoporus* spp.)；

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophylloidea*) の、例えば：メソセストイデス属種 (*Mesocestoides* spp.)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* spp.)、チサノソマ属種 (*Thysanosoma* spp.)、チサニエジア属種 (*Thysaniezia* spp.)、アビテリナ属種 (*Avitellina* spp.)、スチレシア属種 (*Stilesia* spp.)、シトタエニア属種 (*Cittotaenia* spp.)、アンジラ属種 (*Andyra* spp.)、ベルチエラ属種 (*Bertiella* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、エキノコックス属種 (*Echinococcus* spp.)、ヒダチグラ属種 (*Hydatigera* spp.)、ダバイネア属種 (*Davainea* spp.)、ライリエチナ属種 (*Raillietina* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、エキノレピス属種 (*Echinolepis* spp.)、エキノコチレ属種 (*Echinocotyle* spp.)、ジオルキス属種 (*Diorchis* spp.)、ジピリジウム属種 (*Dipylidium* spp.)、ジョイエウキシエラ属種 (*Joyeuxiella* spp.)、ジプロピリジウム属種 (*Diplopylidium* spp.)；

吸虫類 (*Trematodes*)：二生亜綱 (*Digenea*) の、例えば：ジプロストムム属種 (*Diplostomum* spp.)、ポストジプロストムム属種 (*Posthodiplostomum* spp.)、シストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、オルニトビルハルジア属種 (*Ornithobilharzia* spp.)、アウストロビルハルジア属種 (*Austrobilharzia* spp.)、ギガントビルハルジア属種 (*Gigantobilharzia* spp.)、レウコクロリジウム属種 (*Leucochloridium* spp.)、ブラキライマ属種 (*Brachylaïma* spp.)、エキノストマ属種 (*Echinostoma* spp.)、エキノパリフィウム属種 (*Echinoparyphium* spp.)、エキノカスムス属種 (*Echinochasmus* spp.)、ヒポデラエウム属種 (*Hypoderaeum* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオリデス属種 (*Fasciolides* spp.)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、シクロコエルム属種 (*Cyclocoelum* spp.)、チフロコエルム属種 (*Typhlocoelum* spp.)、パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、カリコホロン属種 (*Calicophoron* spp.)、コチロホロン属種 (*Cotylophoron* spp.)、ギガントコチレ属種 (*Gigantocotyle* spp.)、フィスコエデリウス属種 (*Fischoederius* spp.)、ガストロチラクス属種 (*Gastrothylacus* spp.)、ノトコチルス属種 (*Notocotylus* spp.)、カタトロピス属種 (*Catatropis* spp.)、プラギオルキス属種 (*Plagiorchis* spp.)、プロストゴニムス属種 (*Prosthogonimus* spp.)

10

20

30

40

50

.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、エウリトレマ属種 (*Eurytrema* spp.)、トログロトレマ属種 (*Troglostrema* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、コリリクルム属種 (*Collyriclum* spp.)、ナノフィエツス属種 (*Nanophyetus* spp.)、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、クロノルキス属種 (*Clonorchis* spp.)、メトルキス属種 (*Metorchis* spp.)、ヘテロフィエス属種 (*Heterophyes* spp.)、メタゴニムス属種 (*Metagonimus* spp.) ;

線虫類：ベンチュウ目 (*Trichinellida*) の、例えば：トリクリス属種 (*Trichuris* spp.)、カピラリア属種 (*Capillaria* spp.)、パラカピラリア属種 (*Paracapillaria* spp.)、エウコレウス属種 (*Eucoleus* spp.)、トリコモソイデス属種 (*Trichomosoides* spp.)、トリキネラ属種 (*Trichinella* spp.) ;

クキセンチュウ目 (*Tylenchida*) の、例えば：ミクロネマ属種 (*Micronema* spp.)、ストロンギロイデス属種 (*Strongyloides* spp.) ;

カンセンチュウ目 (*Rhabditida*) の、例えば：ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、オエソファゴドンツス属種 (*Oesophagodontus* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema* spp.)、ギアロセファルス属種 (*Gyalocephalus* spp.)、シンドロファリンキス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum* spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cyclococercus* spp.)、シリコステファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、アンシロスタマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、グロボセファルス属種 (*Globocephalus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、シアトスタマ属種 (*Cyathostoma* spp.)、メタストロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* spp.)、ムエレリウス属種 (*Muellerius* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、ネオストロンギルス属種 (*Neoststrongylus* spp.)、シストカウルス属種 (*Cystocaulus* spp.)、プネウモストロンギルス属種 (*Pneumoststrongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、エラホストロンギルス属種 (*Elaphoststrongylus* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Paraelaphoststrongylus* spp.)、クレノソマ属種 (*Crenosoma* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、アンギオストロンギルス属種 (*Angiostrongylus* spp.)、アエルロストロンギルス属種 (*Aelurostrongylus* spp.)、フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marshallagia* spp.)、クーペリア属種 (*Cooperia* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrongylus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligmosomoides* spp.)、ネマトジルス属種

10

20

30

40

50

(*Nematodirus* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostrogylus* spp.)、オベリスコイデス属種 (*Obeliscoides* spp.)、アミドストムム属種 (*Amidostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.) ;

センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、パスサルルス属種 (*Passalurus* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキソカラ属種 (*Toxocara* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属種、(*Ascaridia* spp.)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハブロネマ属種 (*Habronema* spp.)、パラブロネマ属種 (*Parabronema* spp.)、ドラスキア属種 (*Draschia* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.) ;

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) : ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば：マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorchis* spp.) ; ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば：フィリコリス属種 (*Filicollis* spp.) ; サジョウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば：モニリホルミス属種 (*Moniliformis* spp.) ;

コウトウチュウ目 (*Echinorhynchida*) の、例えば：アcantセファルス属種 (*Acanthocephalus* spp.)、エキノリンクス属種 (*Echinorhynchus* spp.)、レプトリンコイデス属種 (*Leptorhynchoides* spp.) ;

舌形動物門 (*Pentastoma*) : ポロケファルス目 (*Porocephalida*) の、例えば：リングアツラ属種 (*Linguatula* spp.)。

【0296】

獣医学の分野において、及び、動物飼育において、式 (I) で表される化合物は、当技術分野において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸経路、非経口的経路、経皮的経路又は経鼻的経路を介して投与する。投与は、予防的又は治療的であり得る。

【0297】

かくして、本発明の一実施形態は、薬物としての式 (I) で表される化合物の使用である。

【0298】

さらなる態様は、坑内部寄生生物剤としての、特に、殺蠕虫剤 (*helminthidal agent*) 又は坑原生動物剤 (*antiprotozoic agent*) としての、式 (I) で表される化合物の使用である。式 (I) で表される化合物は、例え

ば、畜産業において、動物育種において、家畜用の建物の中で、及び、衛生学の分野において、坑内部寄生生物剤として使用するのに、特に、殺蠕虫剤又は坑原生動物剤として使用するのに、適している。

【0299】

さらなる態様は、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式(I)で表される化合物の使用に関する。さらなる態様は、例えば、畜産業における、動物育種における、家畜用の建物の中における、又は、衛生学の分野における、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式(I)で表される化合物の使用に関する。

【0300】

媒介動物の防除

式(I)で表される化合物は、媒介動物(vector)の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体(例えば、ウイルス類、蠕虫類(worms)、単細胞生物及び細菌類)を病原体保有宿主(植物、動物、ヒトなど)から宿主まで運ぶことが可能な節足動物(特に、昆虫又はクモ形類動物)である。該病原体は、宿主に機械的に運ばれ得る(例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ)、又は、宿主体内への注入後に運ばれ得る(例えば、蚊によるマラリア原虫)。

【0301】

媒介動物の例及び媒介動物によって運ばれる疾患又は病原体は、以下のとおりである：

(1) 蚊類

- ・ ハマダラカ(*Anopheles*)： マラリア、フィラリア症；
- ・ アカイエカ(*Culex*)： 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、蠕虫類の運搬；

- ・ ヤブカ(*Aedes*)： 黄熱病、デング熱、フィラリア症、別のウイルス性疾患；

- ・ ブユ(*Simuliidae*)： 蠕虫類(特に、回旋糸状虫(*Onchocerca volvulus*))の運搬；

(2) シラミ類： 皮膚感染、流行性発疹チフス；

(3) ノミ類： 伝染病、発疹熱；

(4) ハエ類： 睡眠病(トリパノソーマ病)；コレラ、別の細菌性疾患；

(5) ダニ類： ダニ症(acariosis)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎(TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症(borreliosis)；

(6) マダニ類： ボレリア症(borrelioses)、例えば、ダットン回帰熱ボレリア(*Borrelia duttoni*)、ダニ媒介脳炎、Q熱(*Coxiella burnetii*)、バベシア症(*Babesia canis canis*)。

【0302】

本発明に関連して、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類又はアザミウマ類などである。植物ウイルスを運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類及び線虫類である。

【0303】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物及び/又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、例えば、蚊類〔特に、ヤブカ属(*Aedes*)の蚊、ハマダラカ属(*Anopheles*)の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ(*A. gambiæ*)、アノフェレス・アラビエンシス(*A. arabiensis*)、アノフェレス・フネストゥス(*A. funestus*)、アノフェレス・ジルス(*A. dirus*) (マラリア)、及び、アカイエカ属(*Culex*)の蚊〕、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。

【0304】

式(I)で表される化合物が抵抗性を打破する(resistance-breaking)

10

20

30

40

50

ng)場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【0305】

式(I)で表される化合物は、疾患の予防及び/又は媒介動物によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。かくして、本発明のさらなる態様は、例えば、農業において、園芸において、林業において、庭園やレジャー施設において、及び、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式(I)で表される化合物の使用である。

【0306】

工業材料の保護

式(I)で表される化合物は、昆虫類〔例えば、コウチュウ目(Coleoptera)、ハチ目(Hymenoptera)、シロアリ目(Isoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)及びシミ目(Zygentoma)の昆虫類〕による攻撃又は破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

10

【0307】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材、加工木材製品及び塗料などを意味するものと理解される。本発明は、木材を保護するために使用するのが特に好ましい。

【0308】

さらなる実施形態では、式(I)で表される化合物は、少なくとも1種類のさらなる殺虫剤及び/又は少なくとも1種類の殺菌剤と一緒に使用する。

20

【0309】

さらなる実施形態では、式(I)で表される化合物は、即時使用可能な(ready-to-use)殺有害生物剤として存在している。即ち、それは、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能である。適切なさらなる殺虫剤又は殺菌剤は、特に、上記で挙げたものである。

【0310】

驚くべきことに、式(I)で表される化合物は、海水又は淡水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及び信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、式(I)で表される化合物は、単独で、又は、別の活性成分と組合せて、防汚剤として使用することができる。

30

【0311】

衛生分野における害虫の防除

式(I)で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内の分野において、衛生の分野において、及び、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間(例えば、住居、工場の通路、オフィス及び車両の客室)において遭遇する昆虫類、クモ形類動物及びダニ類を防除する為に、使用することができる。害虫を防除するために、式(I)で表される化合物は、単独で使用するか、又は、別の活性成分及び/又は補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。式(I)で表される化合物は、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

40

【0312】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱(Arachnida)のサソリ目(Scorpiones)、クモ目(Araneae)及びザトウムシ目(Opiliones)の害虫、ムカデ綱(Chilopoda)及びヤスデ綱(Diplopoda)の害虫、昆虫綱(Insecta)のゴキブリ目(Blattodea)、コウチュウ目(Coleoptera)、ハサミムシ目(Dermaptera)、ハエ目(Diptera)、カメムシ亜目(Heteroptera)、ハチ目(Hymenoptera)、シロアリ目(Isoptera)、チョウ目(Lepidoptera)、シラミ目(Phthiraptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)、バッタ目(Salta

50

toria 又は Orthoptera)、ノミ目(Siphonaptera)及びシミ目(Zygentoma)の害虫、並びに、軟甲綱(Malacostraca)のワラジムシ目(Isopoda)の害虫などをあげることができる。

【0313】

施用は、例えば、エアロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム(automatic fogging system)、噴霧器(fogger)、泡、ゲル、セルロース製又はプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙(moth papers)、防虫バッグ(moth bags)及び防虫ゲル(moth gels)において実施するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、又は、ベイトステーションで実施する。

10

【実施例】

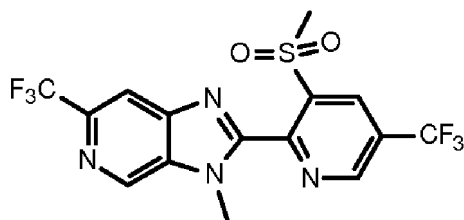
【0314】

調製実施例：

調製実施例1：3 - メチル - 2 - [3 - (メチルスルホニル) - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c]ピリジン (I - 36)

【化44】

20



【0315】

41 mg (0.10 mmol) の 3 - メチル - 2 - [3 - (メチルスルファニル) - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c]ピリジンを 4 mL のジクロロメタンに溶解させ、86.5 mg (0.36 mmol) のメタ - クロロ過安息香酸を 0 で添加し、次いで、その混合物を室温で 20 時間攪拌する。その混合物を重亜硫酸ナトリウム溶液と混合させ、10 分間攪拌し、30 mL の水で稀釈し、45 % 水酸化ナトリウム溶液を用いて pH 9 - 10 に調節する。その混合物をジクロロメタンで 3 回抽出し、次いで、その有機相を合して溶媒を減圧下で除去する。

30

【0316】

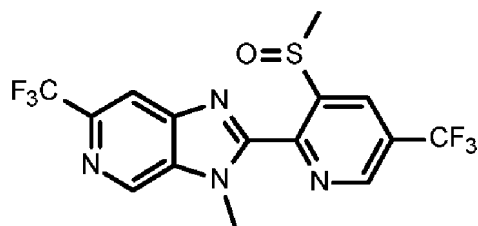
(log P (中性) : 2.64 ; MH⁺ : 425 ; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm : 3.70 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 8.35 (s, 1H), 8.83 (s, 1H), 9.32 (s, 1H), 9.58 (s, 1H)。

40

【0317】

3 - メチル - 2 - [3 - (メチルスルフィニル) - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c]ピリジン (I - 26) の調製

【化45】



10

【0318】

41 mg (0.10 mmol) の 3 - メチル - 2 - [3 - (メチルスルファニル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン を 4 mL の ジクロロメタン に 溶解 させ 、 1.92 mg (0.04 mmol) の ギ酸 及び 28.44 mg の 35 % 過酸化水素 溶液 を 室温 で 添加 する 。 その 混合物 を 室温 で 5 時間 攪拌 し 、 重亜硫酸ナトリウム 溶液 を 添加 し 、 その 混合物 を さらに 3 時間 攪拌 する 。 次いで 、 その 混合物 を 10 % 炭酸水素ナトリウム 溶液 と 一緒に 攪拌 し 、 その 有機相 を 除去 し 、 その 水相 を ジクロロメタン で 2 回 抽出 し 、 その 有機相 を 合し 、 次いで 、 溶媒 を 減圧 下 で 除去 する 。

【0319】

(log P (中性) : 2.76 ; MH⁺ : 409 ; ¹H NMR (400 MHz , D₆-DMSO) ppm : 3.15 (s , 3H) , 4.35 (s , 3H) , 8.37 (s , 1H) , 8.85 (s , 1H) , 9.37 (s , 1H) , 9.39 (s , 1H) 。

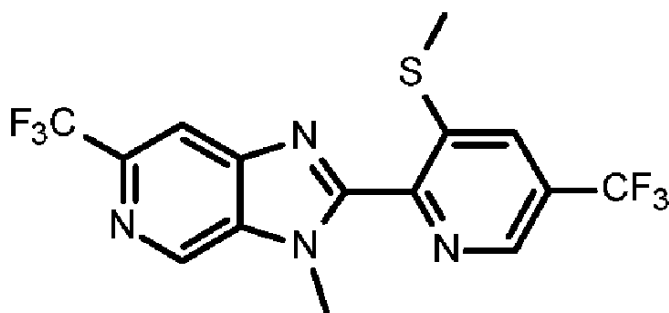
20

【0320】

3 - メチル - 2 - [3 - (メチルスルファニル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 3) の 調製

【化46】

30



40

【0321】

150 mg (0.39 mmol) の 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン と 83 mg (1.18 mmol) の ナトリウムメタンチオラートを DMF の 中 で 室温 で 6 時間 攪拌 する 。 その 混合物 を 水 と 混合 させ 、 酢酸エチル で 3 回 抽出 する 。 その 有機相 を 合して 塩化ナトリウム 溶液 で 洗浄 し 、 除去 し 、 硫酸ナトリウム で 脱水 し 、 溶媒 を 減圧 下 で 除去 する 。

【0322】

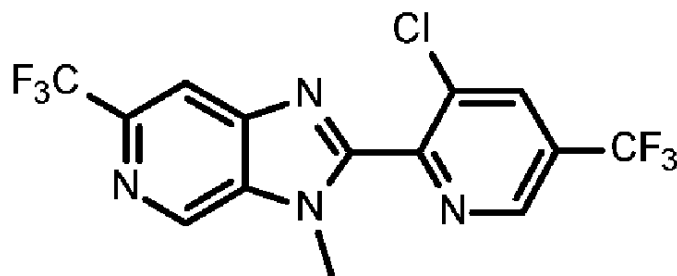
(log P (中性) : 3.16 ; MH⁺ : 393 ; ¹H NMR (400 MHz , D₆-

50

DMSO) ppm: 2.58 (s, 3H), 4.06 (s, 3H), 8.27 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 9.29 (s, 1H)。

【0323】

2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (IX - 01) の調製
【化47】



10

【0324】

950 mg (4.97 mmol) の N³ - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3,4 - ジアミン (II - 01)、1.12 g (4.97 mmol) の 3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - カルボン酸及び 953 mg (4.97 mmol) の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) を 10 mL のピリジンの中で 115 で 7 時間攪拌する。その反応混合物から溶媒を減圧下で除去し、次いで、水を添加し、その混合物を酢酸エチルで 3 回抽出する。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、再度濃縮し、溶離液として水 / アセトニトリルの勾配を使用する分取 HPLC を用いて、カラムクロマトグラフィー精製によって精製する。

20

【0325】

(log P (中性): 2.96; MH⁺: 381; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 4.00 (s, 3H), 8.35 (s, 1H), 8.86 (s, 1H), 9.22 (s, 1H), 9.30 (s, 1H)。

30

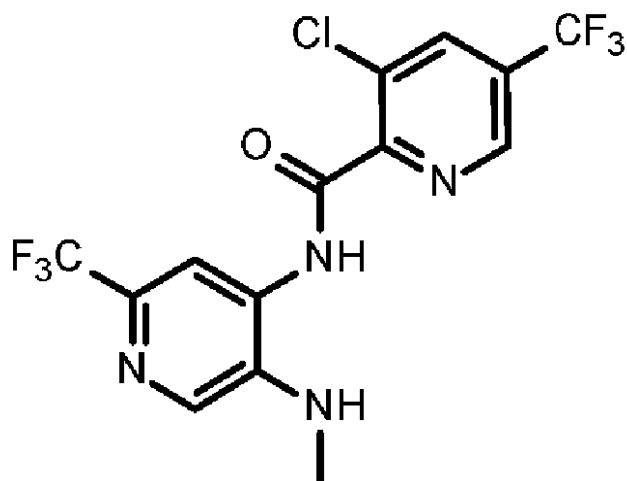
【0326】

3 - クロロ - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル] - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - カルボキサミド (VII I - 01) の調製

N³ - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3,4 - ジアミン (II - 01) と 3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - カルボン酸から 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (IX - 01) を調製するための上記方法によって、化合物 (IX - 01) に関する中間体としての化合物 3 - クロロ - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル] - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - カルボキサミド (VII I - 01) も同様に調製することができる。

40

【化48】



10

【0327】

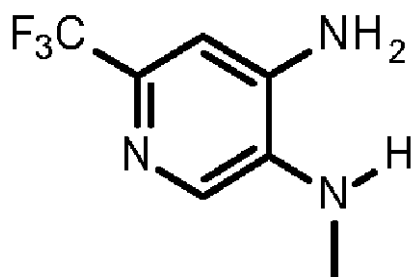
(log P (中性)) : 3.09 ; MH⁺ : 399 ; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm : 2.87 (d, 3H), 5.97 (q, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 9.09 (s, 1H), 10.40 (br. s, 1H)。

20

【0328】

N³-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3,4-ジアミン (II-01) の調製

【化49】



30

【0329】

0.93 g (3.0 mmol) の [4-アミノ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]カルバミン酸ベンジルを 85 mL のテトラヒドロフランに溶解させた溶液を 0 °C まで冷却し、0.65 g (17 mmol) の水素化アルミニウムリチウムと混合させる。その混合物を、アルゴン下、0 °C で 15 分間攪拌し、次いで、室温で 4 時間攪拌する。酢酸エチルを添加することによって、過剰の水素化アルミニウムリチウムを破壊し、その混合物を濾過し、その濾液を、毎回 50 mL の 2 N 塩酸で 2 回抽出する。その塩酸抽出物を合し、冷却しながら、炭酸ナトリウムを用いて pH = 8 に調節する。次いで、その混合物を、毎回 100 mL の酢酸エチルで 2 回抽出し、その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去する。その生成物を、ヘキサン/イソプロパノールの混合物から再結晶させることによってさらに精製する。

40

50

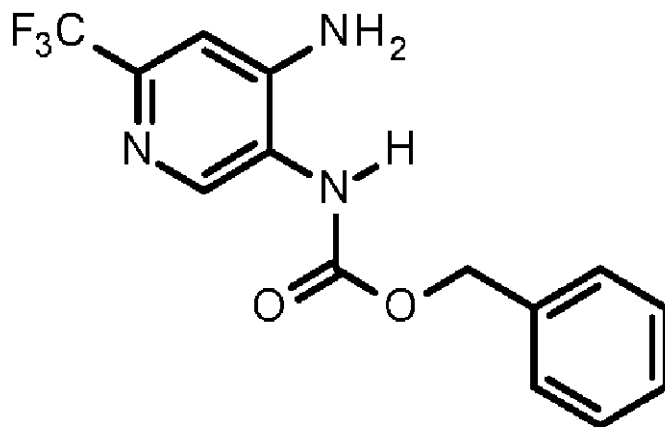
【0330】

(MH^+ : 192; 1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) ppm: 2.81 (d, 3H), 5.22 (q, 1H), 5.82 (br. s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.57 (s, 1H)。

【0331】

[4-アミノ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]カルバミン酸ベンジルの調製

【化50】



10

20

【0332】

0.91 g of 6-(trifluoromethyl)pyridin-3,4-diamine in 20 mL of tetrahydrofuran and 2 mL of pyridine is dissolved. While stirring, 1.07 g (6.3 mmol) of benzyl chloroformate (benzyl chloroformate) is dissolved in 2 mL of tetrahydrofuran and the solution is added dropwise. Next, the reaction mixture is stirred overnight, diluted with 100 mL of water, and extracted twice with 100 mL of ethyl acetate. The organic phase is combined and washed with 50 mL of water, dried with sodium sulfate, and concentrated. The residue is washed with 50 mL of hexane, and the product is obtained as a white solid.

30

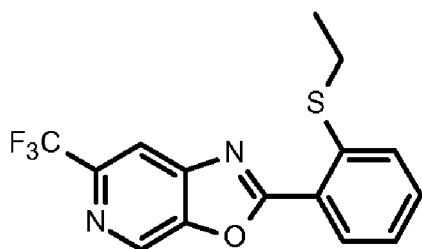
【0333】

(1H NMR (500 MHz, D_6 -DMSO) ppm: 5.15 (s, 2H), 6.40 (br. s, 2H), 7.05 (s, 1H), 7.30-7.45 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 9.00 (br. s, 1H)。

【0334】

調製実施例2: 2-[2-(エチルスルファニル)フェニル]-6-(トリフルオロメチル)[1,3]オキサゾロ[5,4-c]ピリジン(I-35)

【化51】



40

【0335】

400 mg (1.16 mmol) of 2-(ethylsulfanyl)-N-[5-hydroxy

50

シ - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル]ベンズアミド及び398 mg (1.51 mmol)のトリフェニルホスフィンを12 mLのTHFに溶解させ、トルエン中の40%アゾジカルボン酸ジエチル(DEAD)661 mg (1.51 mmol)を室温で滴下して加える。その混合物を室温で3時間攪拌する。次いで、溶媒を減圧下で留去し、その残渣を、溶離液として水/アセトニトリルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製によって精製する。

【0336】

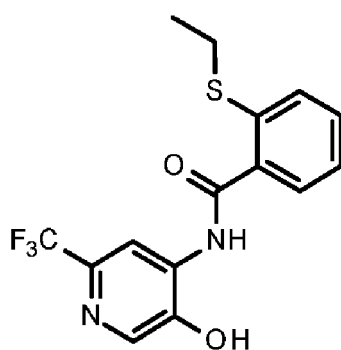
(log P (中性) : 4.07 ; MH⁺ : 325 ; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm : 1.32 (t, 3H), 3.10 (q, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.60 - 7.69 (m, 2H), 8.21 (d, 1H), 8.54 (s, 1H), 9.33 (s, 1H)。

10

【0337】

2 - (エチルスルファニル) - N - [5 - ヒドロキシ - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル]ベンズアミド (VII I - 02) の調製

【化52】



20

【0338】

206 mg (1.12 mmol)の2-(エチルスルファニル)安息香酸及び201 mg (1.12 mmol)の4-アミノ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-オールを5 mLのピリジンに溶解させ、325 mg (1.69 mmol)の1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)を添加し、その混合物を、50 で2時間攪拌し及び80 で3時間攪拌する。溶媒を減圧下で留去し、その残渣を取って水の中に入れ、酢酸エチルで抽出する。その有機相を塩化ナトリウム溶液で洗浄し、除去し、硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮する。その残渣を、溶離液として水/アセトニトリルの勾配を使用する分取HPLCを用いて、カラムクロマトグラフィー精製によって精製する。

30

【0339】

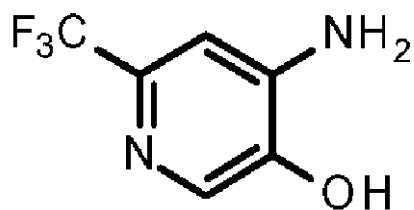
(log P (中性) : 1.59 ; MH⁺ : 343 ; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm : 1.21 (t, 3H), 2.98 (q, 2H), 7.29 - 7.34 (m, 1H), 7.48 - 7.53 (m, 2H), 7.61 (d, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 9.99 (s, 1H), 11.31 (br. S, 1H)。

40

【0340】

4 - アミノ - 6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - オール (II - 02) の調製

【化53】



10

【0341】

12.3 g (42.1 mmol) の [5-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]カルバミン酸 tert-ブチル を 300 mL のジクロロメタンに溶解させ、-78 °C まで冷却し、150 mL のジクロロメタンの中の 42.2 g (168 mmol) の三臭化ホウ素をその温度で滴下して加える。その混合物を一晩室温とし、次いで、400 mL の炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、その混合物を、毎回 100 mL のジクロロメタンで 3 回抽出する。溶媒を留去し、その残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製する。

【0342】

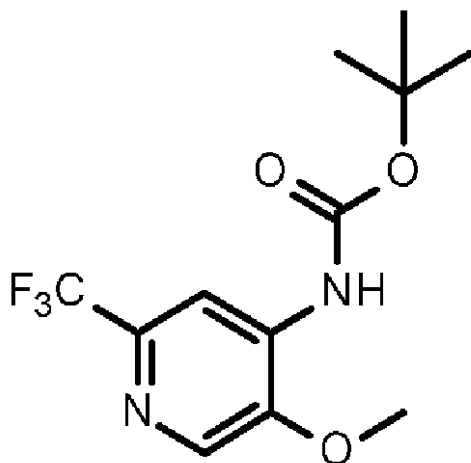
(¹H NMR (90 MHz, D₆-DMSO) ppm: 7.00 (s, 1H), 7.9 (s, 1H)。

20

【0343】

[5-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]カルバミン酸 tert-ブチルの調製

【化54】



30

【0344】

9.80 g (44.3 mmol) の 5-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)イソニコチン酸を 980 mL の tert-ブタノールに溶解させた溶液に、室温で、65 g の 4-モレキュラーシーブ、14.6 g (53.1 mmol) のジフェニルホスホリルアジド (DPPA) 及び 5.37 g (53.1 mmol) のトリエチルアミンを添加する。その反応混合物を 81 °C で 23 時間攪拌し、次いで、4-モレキュラーシーブを濾過する。tert-ブタノールを減圧下で留去した後、その残渣を 500 mL の酢酸エチルと混合させ、250 mL の 2 N 塩酸、250 mL の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、250 mL の

40

50

水及び250 mLの塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水する。溶媒を減圧下で除去し、その残渣を、毎回15 mLの酢酸エチルで3回洗浄し、減圧下で乾燥させる。その酢酸エチル相をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン/EtOAc 4:1 2:1）で精製する。

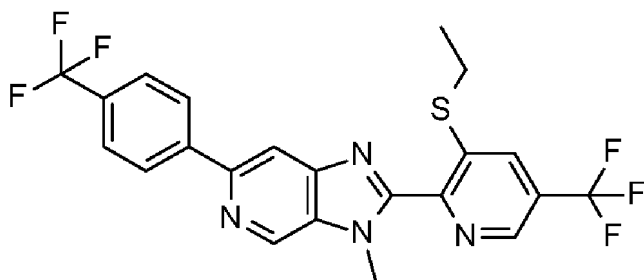
【0345】

(¹H NMR (90 MHz, CDCl₃)) ppm: 1.5 (s, 9H), 4.0 (s, 3H), 8.2 (s, 1H), 8.5 (s, 1H)。

【0346】

2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - [4 - (トリフルオロメチル) - フェニル] イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 64) の調製

【化55】



【0347】

62 mg (0.58 mmol)の炭酸ナトリウムを1, 2 - ジメトキシエタンと水の(4:1)混合物2 mLに溶解させた溶液を、超音波浴の中で脱ガスし、73 mg (0.19 mmol)の6 - クロロ - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチルイミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン及び67 mg (0.35 mmol)の[4 - (トリフルオロメチル)フェニル] ボロン酸を添加する。その容器にアルゴンを満たし、次いで、23 mg (20 μmol)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムを添加する。その混合物を、CEM Discoverマイクロ波オーブンの中で2時間10分間140 °Cに加熱し、次いで、追加の68 mg (59 μmol)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムと混合させ、4時間140 °Cに加熱する。その反応混合物をセライト層で濾過し、酢酸エチルですすぎ洗う。溶媒を減圧下で除去した後、その残渣をシリカゲル上でのMPLC(勾配: 酢酸エチル/シクロヘキサン)によってクロマトグラフ的に分離させる。その後、分取HPLC(勾配: H₂O/アセトニトリル)を用いた別のクロマトグラフ的分離を行う。このようにして、14 mg(純度99%、収率15%)の2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジンが得られる。

【0348】

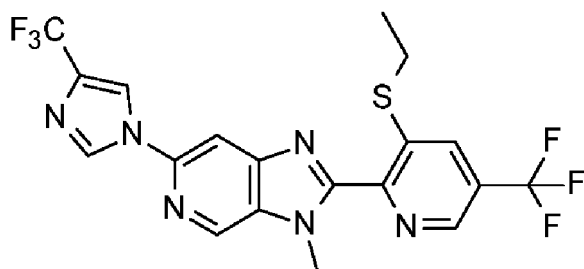
(log P (中性)): 3.95; MH⁺: 483; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 9.275 (2.6); 9.271 (2.5); 8.943 (4.3); 8.584 (2.6); 8.580 (2.6); 8.318 (0.5); 7.701 (3.0); 7.680 (3.9); 7.548 (3.8); 7.527 (3.0); 7.410 (4.6); 3.890 (16.0); 3.329 (75.4); 3.140 (1.3); 3.122 (4.2); 3.104 (4.3); 3.086 (1.4); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.507 (140.3); 2.502 (179.9); 2.498 (134.5); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.281 (4.6); 1.263 (9.7); 1.245 (4.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6);

0.000 (84.0); -0.150 (0.4)。

【0349】

2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 -
メチル - 6 - [4 - (トリフルオロメチル) - イミダゾール - 1 - イル] イミダゾ [4 ,
5 - c] ピリジン (I - 74) の調製

【化56】



10

【0350】

アルゴン下、99 mg (0.27 mmol) の 6 - クロロ - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチルイミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン、23 μ L (0.15 mmol) のトランス - N , N ' - ジメチルシクロヘキサン - 1 , 2 - ジアミン、6.8 mg (36 μ mol) のヨウ化銅 (I)、30 mg (0.22 mmol) の 4 - (トリフルオロメチル) - 1 H - イミダゾール及び 64 mg (0.46 mmol) の炭酸カリウムを、脱ガスした 1 mL のトルエンに添加する。その容器を密閉し、そして、その反応混合物を、CEM Discover マイクロ波反応器の中で 4 時間 110 $^{\circ}$ C に加熱する。室温まで冷却した後、酢酸エチルを添加し、その混合物をセライト層で濾過し、次いで、酢酸エチルですすぎ洗う。溶媒を減圧下で除去し、その残渣を、シリカゲル上での MPLC (勾配 : 酢酸エチル / シクロヘキサン) によってクロマトグラフ的に分離させる。このようにして、22 mg (純度 100 %、収率 18 %) の 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - [4 - (トリフルオロメチル) イミダゾール - 1 - イル] イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジンが得られる。

20

30

【0351】

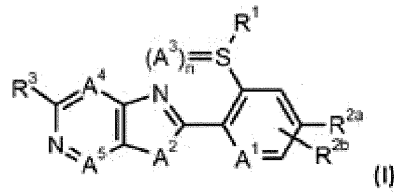
(log P (中性)) : 3.36 ; MH⁺ : 473 ; ¹H NMR (600 MHz, CD₃CN) ppm : 8.905 (3.0) ; 8.903 (3.0) ; 8.852 (1.6) ; 8.850 (1.6) ; 8.500 (1.9) ; 8.313 (1.5) ; 8.311 (2.1) ; 8.309 (1.4) ; 8.183 (1.7) ; 8.181 (1.7) ; 7.962 (3.4) ; 7.961 (3.4) ; 4.001 (16.0) ; 3.940 (0.4) ; 3.124 (1.1) ; 3.111 (3.4) ; 3.099 (3.5) ; 3.087 (1.2) ; 2.639 (0.7) ; 2.184 (55.7) ; 2.109 (1.2) ; 2.005 (2.2) ; 1.998 (195.7) ; 1.989 (2.7) ; 1.985 (1.8) ; 1.981 (10.0) ; 1.977 (18.2) ; 1.973 (26.5) ; 1.969 (18.0) ; 1.965 (9.0) ; 1.882 (1.2) ; 1.419 (0.4) ; 1.404 (0.7) ; 1.373 (0.6) ; 1.330 (4.1) ; 1.318 (9.0) ; 1.309 (1.6) ; 1.305 (5.2) ; 1.301 (3.4) ; 0.914 (0.6)。

40

【0352】

上記実施例と同様にして、及び、上記で記載した調製方法に準じて、式 (I) で表される下記化合物を得ることができる。

【表 1】



式中、A³は酸素であり、及び、その他の置換基は、それぞれ、下記表の中で定義されているとおりである：

実施例	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-2	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-3	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	F	H
I-5	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	CF ₃	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ - C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-10	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-11	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-14	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	CF ₃	H
I-15	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-17	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-18	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	F	H
I-21	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-22	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-23	-(CH ₂) ₂ -S- C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-24	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-25	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-26	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-27	オキセタン-3-イル	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-30	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	CF ₃	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-33	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H

10

20

30

40

実施例	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-36	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-37	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-39	n-C ₇ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-40	オキセタン-3-イル	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-42									
	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-43									
	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-44									
	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-45									
	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-46									
	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-47									
	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	CF ₃	H
I-48									
	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-49									
	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-NHCOMe*
I-50									
	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-NHCOMe*
I-51									
	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-52									
	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-メチル	N	CF ₃	H
I-53									
	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-54									
	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-55									
	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-メチル	N	CF ₃	H
I-56									
	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CONH ₂	H
I-57									
	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-58									
	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-59									
	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-60									
	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CONH ₂	H
I-61									
	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-62									
	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	3-Cl*
I-63									
	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	CF ₃	H

10

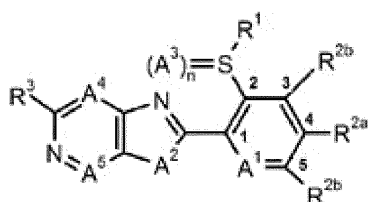
20

30

40

実施例	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-メチル	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃) ₂ ラ γ-ル-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃) ₂ ラ γ-ル-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃) ₂ イミダ γ-ル-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃) ₂ イミダ γ-ル-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃) ₂ ラ γ-ル-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃) ₂ ラ γ-ル-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H

* これらの実施例において、R^{2b}は、3位又は5位で結合している。



【0353】

log P値は、「EEC Directive 79/831 Annex V.A8」に従い、逆相カラム(C18)でのHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)によって測定する。温度: 55。

【0354】

酸性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.1%水性ギ酸及びアセトニトリル(0.1%ギ酸含有)を使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH 2.7で実施する。表中では、log P(HCOOH)と称されている。

【0355】

中性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.001モル炭酸水素アンモニウム水溶液及びアセトニトリルを使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH 7.8で実施する。表中では、log P(中性)と称されている。

【0356】

較正は、log P値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン(3個~16個の炭素原子を有している)を用いて実施する(log P値は、連続する2種類のアルカノンの間

10

20

30

40

50

の線形補間によって、保持時間に基づいて測定する)。

【0357】

選択された実施例に関するNMRデータは、慣習的な形態(値、多重項分裂、水素原子の数)で記載されているか、又は、NMRピークリストとして記載されている。

【0358】

その中でNMRスペクトルを記録した溶媒は、いずれの場合にも記載されている。

【0359】

NMRピークリスト法

選択された実施例の ^1H NMRデータは、 ^1H NMRピークリストの形態で記載されている。各シグナルピークに対して、最初に値(ppm)が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関する値-シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

10

【0360】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

ν_1 (強度 ν_1) ; ν_2 (強度 ν_2) ; . . . ; ν_i (強度 ν_i) ; . . . ; ν_n (強度 ν_n) 。

【0361】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ(cm)と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

20

【0362】

^1H NMRスペクトルの化学シフトを較正するために、テトラメチルシランを使用するか、及び/又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0363】

^1H NMRピークのリストは、従来の ^1H NMRのプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【0364】

さらに、それらは、従来の ^1H NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体(これも、同様に、本発明の対象の一部を形成する)のシグナル及び/又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

30

【0365】

溶媒及び/又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 ^1H NMRピークの本発明者らによるリストは、通常、溶媒のピーク、例えば、DMSO-D₆中のDMSOのピーク及び水のピーク(これらは、通常、平均して高い強度を有している)を示している。

【0366】

目標化合物の立体異性体のピーク及び/又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物(例えば、90%を超える純度を有する目標化合物)のピークよりも低い強度を有している。

40

【0367】

そのような立体異性体及び/又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、この場合、「副産物の指紋(by-product fingerprint)」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立つ。

【0368】

目標化合物のピークを既知方法(MestrelC、ACDシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用)で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離

50

は、 ^1H NMRの慣習的な解釈における関連するピークのピックアップに類似しているであろう。

【0369】

^1H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」の中に見いだすことができる。

【表 2】

Ex.	LOGP_ 中性	LOGP_ HCOOH		
I-1	3.77	3.86	実施例 1: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.544 (6.4); 8.335 (3.9); 8.314 (4.1); 7.568 (2.9); 7.563 (3.5); 7.534 (2.5); 7.529 (1.9); 7.513 (2.3); 7.508 (1.9); 3.323 (17.6); 2.671 (0.3); 2.631 (16.0); 2.524 (1.1); 2.511 (19.3); 2.507 (38.0); 2.502 (49.6); 2.498 (35.5); 2.493 (16.9); 2.075 (0.5); 0.008 (0.9); 0.000 (21.7); -0.008 (0.7)	
I-2	3.48	3.52	実施例 2: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.283 (3.7); 8.960 (2.3); 8.958 (2.3); 8.334 (2.7); 8.328 (4.1); 4.030 (16.0); 3.323 (69.7); 3.181 (1.1); 3.162 (3.6); 3.144 (3.6); 3.126 (1.1); 2.891 (1.2); 2.731 (1.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.506 (64.4); 2.502 (83.6); 2.498 (61.3); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 1.234 (4.1); 1.215 (8.1); 1.197 (3.8); 0.008 (0.6); 0.000 (17.0); -0.008 (0.7)	10
I-3	3.16	3.22	実施例 3: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.290 (4.0); 8.947 (2.7); 8.316 (4.5); 8.267 (2.9); 7.953 (0.4); 4.059 (16.0); 4.019 (0.7); 3.327 (63.2); 3.036 (0.3); 2.965 (0.4); 2.892 (2.5); 2.882 (0.5); 2.870 (0.5); 2.732 (2.2); 2.673 (0.5); 2.580 (15.1); 2.507 (59.9); 2.503 (71.6); 2.499 (52.5); 2.330 (0.5); 2.078 (0.4); 1.234 (0.4); 0.000 (0.4)	
I-4	2.65	2.70	実施例 4: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.833 (0.3); 9.210 (3.9); 8.226 (4.1); 8.082 (0.6); 7.993 (0.5); 7.608 (1.3); 7.593 (1.5); 7.587 (1.6); 7.572 (1.4); 7.411 (1.3); 7.405 (1.4); 7.386 (1.4); 7.380 (1.4); 7.244 (1.0); 7.238 (0.9); 7.222 (1.6); 7.216 (1.5); 7.201 (0.8); 7.195 (0.7); 3.785 (16.0); 3.325 (80.3); 2.875 (1.0); 2.863 (1.0); 2.671 (0.7); 2.667 (0.6); 2.506 (76.1); 2.502 (99.5); 2.498 (78.2); 2.464 (2.7); 2.329 (0.6); 2.075 (0.3); 0.000 (2.6)	20
I-5	3.26	3.30	実施例 5: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.249 (3.5); 8.267 (3.7); 7.787 (1.2); 7.778 (2.7); 7.768 (2.9); 7.749 (2.1); 7.729 (0.7); 3.807 (16.0); 3.324 (21.7); 2.671 (0.4); 2.557 (15.5); 2.524 (1.1); 2.511 (22.7); 2.507 (44.4); 2.502 (57.4); 2.498 (41.7); 2.493 (20.4); 2.329 (0.4); 0.008 (2.1); 0.000 (52.3); -0.009 (2.1)	
I-6	2.74	2.75	実施例 6: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.182 (3.5); 7.526 (1.9); 7.523 (2.0); 7.459 (1.7); 7.445 (2.7); 7.403 (1.7); 7.400 (1.6); 7.390 (1.1); 7.386 (1.0); 3.927 (0.3); 3.770 (16.0); 2.978 (0.3); 2.494 (14.5); 2.222 (0.5); 2.152 (1.6); 1.966 (0.6); 1.958 (1.5); 1.954 (1.8); 1.950 (9.9); 1.946 (17.5); 1.942 (25.9); 1.938 (17.6); 1.934 (8.7); 1.387 (5.1); 1.269 (0.3); 1.212 (0.4); 0.005 (0.3); 0.000 (11.9); -0.006 (0.4)	30
I-7	2.67	2.72	実施例 7: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.411 (2.3); 9.408 (2.3); 9.379 (3.9); 9.333 (0.4); 8.751 (2.4); 8.746 (2.5); 8.460 (4.1); 8.316 (0.5); 7.903 (0.3); 4.391 (16.0); 4.199 (1.2); 4.147 (0.5); 4.138 (0.4); 4.121 (0.8); 4.114 (0.6); 4.107 (0.7); 4.100 (0.7); 4.088 (0.7); 4.068 (0.4); 3.976 (0.7); 3.854 (0.6); 3.843 (0.6); 3.833 (0.7); 3.829 (0.7); 3.819 (0.8); 3.803 (0.5); 3.795 (0.6); 3.556 (0.6); 3.543 (0.8); 3.531 (0.5); 3.523 (0.6); 3.518 (0.8); 3.510 (0.9); 3.494 (1.8); 3.477 (0.8); 3.468 (0.8); 3.464 (0.6); 3.455 (0.5); 3.443 (0.6); 3.429 (0.4); 3.325 (63.6); 3.260 (0.8); 3.257 (0.8); 3.241 (2.2); 3.238 (2.3); 3.223 (2.3); 3.219 (2.3); 3.201 (0.9); 2.676 (0.5); 2.671 (0.7); 2.667 (0.6); 2.524 (1.8); 2.511 (41.0); 2.506 (84.3); 2.502 (113.7); 2.498 (86.8); 2.493 (45.8); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.6); 1.252 (4.4); 1.233 (9.5); 1.214 (4.3); 0.146 (0.4); 0.008 (2.7); 0.000 (79.8); -0.008 (4.6); -0.150 (0.4)	40
I-8	3.46	3.54	実施例 8: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.390 (2.1); 9.387 (2.1); 9.377 (3.6); 8.577 (2.1); 8.572 (2.2); 8.379 (3.7); 8.316 (0.6); 4.384 (16.0); 4.362 (0.4); 3.802 (0.3); 3.785 (0.9); 3.767 (1.3); 3.750 (0.9); 3.733 (0.4); 3.322 (86.4); 2.675 (1.0); 2.671 (1.4); 2.666 (1.0); 2.524 (3.7); 2.511 (79.1); 2.506 (160.9); 2.502 (213.1); 2.497 (155.9); 2.493 (76.9); 2.333 (1.0); 2.329 (1.4); 2.324 (1.0); 1.569 (6.3); 1.551 (6.2); 0.906 (6.4); 0.889 (6.3);	

			0.146 (1.3); 0.008 (10.0); 0.000 (280.2); -0.008 (11.2); -0.150 (1.3)	
I-9	3.64	3.66	<p>实施例 9: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.544 (9.2); 8.314 (2.7); 8.311 (2.8); 8.294 (2.9); 8.291 (2.8); 7.739 (1.1); 7.735 (1.2); 7.719 (2.5); 7.715 (2.1); 7.701 (2.2); 7.697 (2.1); 7.646 (3.6); 7.627 (2.2); 7.464 (1.9); 7.462 (1.8); 7.444 (3.0); 7.426 (1.6); 7.424 (1.5); 3.322 (31.6); 3.155 (1.9); 3.136 (6.3); 3.118 (6.4); 3.100 (2.0); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.666 (0.6); 2.541 (0.6); 2.524 (2.7); 2.511 (49.3); 2.507 (97.6); 2.502 (126.8); 2.497 (89.7); 2.493 (42.1); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.324 (0.6); 2.075 (0.3); 1.360 (7.3); 1.341 (16.0); 1.323 (7.0); 0.146 (0.3); 0.008 (3.4); 0.000 (84.9); -0.009 (2.9); -0.150 (0.3)</p>	
I-10	2.08	2.15	<p>实施例 10: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.271 (3.7); 8.267 (3.9); 8.137 (2.9); 8.132 (3.0); 7.975 (2.1); 7.954 (3.6); 7.900 (2.2); 7.895 (2.1); 7.880 (1.3); 7.874 (1.3); 6.870 (0.3); 3.977 (15.9); 3.748 (0.9); 3.444 (0.8); 3.327 (95.2); 2.967 (16.0); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.525 (1.4); 2.507 (54.5); 2.502 (70.2); 2.498 (50.6); 2.494 (24.6); 2.333 (0.3); 2.329 (0.4); 2.184 (0.5); 1.355 (3.8); 1.298 (0.9); 1.259 (1.2); 1.234 (0.6); 0.008 (2.1); 0.000 (54.1); -0.009 (2.3)</p>	10
I-11	2.34	2.39	<p>实施例 11: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.279 (0.6); 9.262 (3.9); 8.380 (0.5); 8.317 (0.5); 8.260 (4.2); 8.164 (2.8); 8.159 (3.4); 8.152 (0.5); 8.115 (1.7); 8.110 (1.5); 8.095 (2.1); 8.089 (1.9); 7.937 (3.4); 7.917 (3.0); 7.902 (0.8); 7.897 (0.9); 7.885 (0.5); 7.565 (0.4); 7.545 (0.6); 5.757 (1.6); 3.770 (0.5); 3.747 (16.0); 3.621 (0.4); 3.592 (1.6); 3.445 (15.1); 3.436 (2.1); 3.327 (141.8); 2.675 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.524 (4.2); 2.506 (141.2); 2.502 (182.5); 2.498 (131.5); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.324 (0.8); 1.298 (0.8); 1.259 (1.1); 1.235 (0.5); 1.166 (0.3); 0.008 (2.3); 0.000 (56.4); -0.008 (2.3)</p>	20
I-12	1.83	1.88	<p>实施例 12: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.272 (4.2); 8.266 (4.5); 8.036 (1.3); 8.023 (1.4); 8.015 (1.6); 8.002 (1.5); 7.966 (1.4); 7.959 (1.6); 7.944 (1.5); 7.937 (1.5); 7.706 (0.8); 7.699 (0.8); 7.685 (1.5); 7.678 (1.5); 7.664 (0.8); 7.657 (0.7); 3.973 (16.0); 3.336 (80.5); 2.958 (16.0); 2.678 (0.4); 2.549 (0.3); 2.509 (67.3); 2.337 (0.4)</p>	20
I-13	2.34	2.44	<p>实施例 13: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.285 (3.9); 8.280 (4.2); 8.088 (2.3); 8.066 (4.9); 8.060 (3.8); 8.009 (2.3); 8.004 (2.0); 7.988 (1.4); 7.983 (1.3); 3.973 (16.0); 3.327 (56.5); 3.313 (1.6); 3.294 (1.2); 3.279 (1.2); 3.261 (1.1); 3.242 (0.3); 2.905 (1.1); 2.886 (1.2); 2.871 (1.0); 2.853 (1.0); 2.671 (0.4); 2.507 (41.3); 2.502 (56.0); 2.498 (43.9); 2.329 (0.4); 1.150 (3.8); 1.132 (8.2); 1.113 (3.7); 0.000 (2.5)</p>	
I-14	2.63	2.67	<p>实施例 14: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.289 (3.7); 8.430 (1.3); 8.412 (5.2); 8.288 (3.9); 8.287 (3.9); 8.180 (1.6); 8.159 (1.4); 3.772 (16.0); 3.493 (14.4); 3.324 (34.4); 2.524 (0.9); 2.511 (17.9); 2.506 (36.4); 2.502 (48.8); 2.497 (36.6); 2.493 (18.8); 0.008 (1.9); 0.000 (52.6); -0.008 (2.6)</p>	30
I-15	1.92	1.95	<p>实施例 15: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.295 (3.5); 9.139 (1.7); 9.135 (1.9); 9.127 (1.9); 9.123 (1.8); 8.579 (1.7); 8.575 (1.8); 8.559 (1.9); 8.555 (1.8); 8.300 (3.6); 8.298 (3.7); 8.021 (1.9); 8.009 (1.8); 8.001 (1.7); 7.989 (1.7); 3.867 (16.0); 3.794 (1.0); 3.775 (3.5); 3.757 (3.5); 3.738 (1.0); 3.327 (10.2); 2.526 (0.5); 2.521 (0.7); 2.512 (10.8); 2.508 (22.2); 2.503 (29.5); 2.499 (21.4); 2.494 (10.4); 1.209 (3.6); 1.191 (7.9); 1.172 (3.5); 0.008 (1.8); 0.000 (50.2); -0.009 (1.9)</p>	
I-16	3.21	3.26	<p>实施例 16: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.588 (2.0); 9.585 (2.1); 9.314 (3.5); 8.780 (2.2); 8.776 (2.2); 8.331 (3.7); 8.316 (0.4); 4.409 (0.3); 4.392 (1.0); 4.375 (1.4); 4.357 (1.0); 4.340 (0.3); 3.914 (16.0); 3.322 (36.9); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.524 (2.0); 2.520 (3.2); 2.511 (42.6); 2.507 (88.2); 2.502 (118.2); 2.497 (86.9); 2.493 (42.9); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.6); 1.260 (13.3); 1.243 (13.2); 0.146 (0.8); 0.008 (6.7); 0.000 (191.2); -0.009 (7.6); -0.150 (0.8)</p>	40

I-17	2.87	2.94	<p>实施例 17: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.204 (3.8); 8.228 (4.1); 7.627 (3.7); 7.618 (4.2); 7.536 (1.5); 7.517 (2.1); 7.433 (0.9); 7.422 (1.2); 7.413 (1.2); 7.403 (1.1); 7.392 (0.6); 3.768 (16.0); 3.327 (67.1); 2.986 (1.3); 2.968 (4.1); 2.950 (4.1); 2.931 (1.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.507 (57.2); 2.503 (74.4); 2.498 (54.2); 2.334 (0.3); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 1.180 (4.3); 1.161 (8.7); 1.143 (4.1); 0.146 (0.5); 0.008 (3.9); 0.000 (88.8); -0.007 (3.9); -0.150 (0.5)</p>	
I-18	2.11	2.13	<p>实施例 18: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.255 (3.5); 8.253 (3.7); 8.251 (3.6); 8.156 (1.3); 8.153 (1.3); 8.138 (1.8); 8.134 (1.6); 8.020 (0.4); 8.017 (0.5); 8.002 (1.4); 7.998 (1.4); 7.984 (1.6); 7.979 (1.5); 7.976 (1.4); 7.971 (1.6); 7.957 (1.5); 7.953 (1.5); 7.938 (0.6); 7.934 (0.5); 7.878 (1.7); 7.875 (1.8); 7.860 (1.2); 7.857 (1.2); 3.728 (16.0); 3.526 (0.5); 3.509 (1.3); 3.490 (1.3); 3.473 (0.5); 3.330 (61.8); 2.671 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (25.5); 2.507 (50.6); 2.502 (65.3); 2.498 (46.3); 2.493 (21.9); 2.329 (0.4); 1.119 (3.5); 1.101 (7.8); 1.082 (3.4); 0.008 (0.6); 0.000 (15.4); -0.009 (0.6)</p>	10
I-19	3.38	3.43	<p>实施例 19: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.226 (3.9); 8.243 (4.1); 7.705 (0.9); 7.699 (1.3); 7.684 (1.6); 7.678 (2.9); 7.667 (3.6); 7.662 (2.3); 7.640 (3.4); 7.619 (1.8); 3.788 (16.0); 3.323 (25.4); 2.999 (1.2); 2.981 (4.0); 2.963 (4.1); 2.944 (1.3); 2.671 (0.4); 2.626 (0.3); 2.507 (47.1); 2.502 (61.4); 2.498 (45.8); 2.329 (0.4); 2.300 (0.5); 1.177 (4.3); 1.159 (8.9); 1.140 (4.1); 0.008 (1.9); 0.000 (45.5)</p>	
I-20	2.05	2.08	<p>实施例 20: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.258 (4.1); 8.253 (4.3); 7.997 (1.5); 7.990 (2.5); 7.976 (2.4); 7.969 (3.3); 7.956 (1.7); 7.918 (1.1); 7.911 (0.9); 7.897 (1.6); 7.890 (1.4); 7.876 (0.7); 7.869 (0.6); 3.739 (16.0); 3.430 (15.0); 3.326 (81.6); 2.671 (0.7); 2.666 (0.6); 2.506 (84.7); 2.502 (108.3); 2.498 (84.4); 2.328 (0.7); 2.325 (0.5); 0.146 (0.6); 0.000 (128.1); -0.150 (0.6)</p>	20
I-21	2.93	2.98	<p>实施例 21: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.586 (2.4); 9.583 (2.5); 9.317 (4.1); 8.798 (2.5); 8.794 (2.6); 8.341 (4.3); 3.925 (16.0); 3.912 (1.3); 3.893 (3.6); 3.874 (3.7); 3.856 (1.1); 3.324 (30.3); 2.671 (0.5); 2.506 (56.1); 2.502 (72.8); 2.498 (55.3); 2.329 (0.5); 1.258 (3.8); 1.239 (8.2); 1.221 (3.7); 0.146 (0.4); 0.007 (3.2); 0.000 (79.6); -0.150 (0.4)</p>	
I-22	1.87	1.90	<p>实施例 22: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.261 (3.9); 8.261 (4.1); 8.107 (1.6); 8.087 (2.0); 7.942 (0.8); 7.940 (1.0); 7.921 (1.7); 7.904 (2.1); 7.901 (2.4); 7.885 (2.2); 7.820 (1.2); 7.818 (1.3); 7.801 (1.6); 7.799 (1.6); 7.783 (0.6); 7.780 (0.7); 5.757 (1.1); 3.946 (16.0); 3.728 (0.5); 3.328 (59.2); 3.305 (1.0); 3.286 (1.1); 3.272 (1.1); 3.253 (1.1); 2.885 (1.1); 2.867 (1.2); 2.852 (1.0); 2.833 (1.0); 2.672 (0.3); 2.507 (37.2); 2.502 (48.9); 2.498 (35.7); 1.149 (3.9); 1.130 (8.2); 1.112 (3.7); 1.102 (0.4); 0.007 (1.5); 0.000 (35.2); -0.008 (1.5)</p>	30
I-23	3.96	4.02	<p>实施例 23: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.288 (4.1); 8.977 (2.7); 8.456 (2.7); 8.327 (4.3); 8.317 (0.4); 4.033 (16.0); 3.395 (2.0); 3.377 (2.7); 3.357 (2.4); 3.327 (77.5); 2.720 (2.3); 2.701 (2.8); 2.682 (2.2); 2.672 (0.7); 2.579 (1.5); 2.560 (4.6); 2.542 (4.9); 2.523 (3.2); 2.507 (65.1); 2.502 (87.7); 2.498 (70.2); 2.329 (0.6); 2.075 (0.9); 1.233 (0.6); 1.152 (4.7); 1.133 (9.3); 1.115 (4.4); 0.000 (3.7)</p>	
I-24	2.32	2.39	<p>实施例 24: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.241 (3.7); 8.588 (1.6); 8.585 (1.8); 8.577 (1.7); 8.574 (1.8); 8.279 (3.8); 8.090 (1.5); 8.087 (1.6); 8.069 (1.7); 8.066 (1.8); 7.638 (1.6); 7.627 (1.6); 7.618 (1.5); 7.606 (1.5); 3.975 (16.0); 3.324 (34.0); 3.041 (1.1); 3.022 (3.7); 3.004 (3.8); 2.986 (1.2); 2.672 (0.3); 2.525 (0.8); 2.507 (40.5); 2.503 (55.3); 2.498 (43.4); 2.329 (0.4); 1.218 (4.0); 1.199 (8.3); 1.181 (3.9); 0.008 (1.5); 0.000 (45.1)</p>	40
I-25	2.97	3.08	<p>实施例 25: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9.217 (3.6); 8.235 (3.9); 7.564 (2.9); 7.560 (3.0); 7.555 (3.0); 7.544 (3.5); 7.460 (2.0); 7.455 (1.8); 7.440 (1.4); 7.435 (1.3); 3.791 (16.0); 3.323 (28.6); 2.671</p>	

			(0.3); 2.506 (48.4); 2.502 (56.6); 2.498 (37.8); 2.329 (0.4); 1.398 (0.8); 0.008 (2.5); 0.000 (64.5); -0.008 (2.5)	
I-26	2.76	2.81	実施例 26: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.389 (2.0); 9.386 (2.0); 9.366 (3.5); 8.849 (2.2); 8.845 (2.1); 8.370 (3.7); 6.870 (0.5); 5.756 (0.4); 4.452 (0.5); 4.347 (15.7); 4.018 (0.6); 3.995 (0.4); 3.326 (80.4); 3.151 (16.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.524 (1.2); 2.511 (28.7); 2.507 (56.3); 2.502 (72.6); 2.498 (52.3); 2.494 (25.3); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.3); 2.183 (0.8); 1.355 (5.8); 1.233 (0.6); 0.008 (1.2); 0.000 (33.6); -0.009 (1.3)	
I-27	1.84	1.87	実施例 27: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.253 (3.5); 8.275 (3.8); 8.273 (3.7); 8.257 (1.5); 8.254 (1.4); 8.237 (1.8); 8.234 (1.7); 8.038 (0.5); 8.035 (0.6); 8.020 (1.5); 8.016 (1.6); 8.001 (1.5); 7.998 (1.3); 7.984 (1.2); 7.980 (1.4); 7.965 (1.6); 7.961 (1.7); 7.946 (0.7); 7.942 (0.6); 7.903 (0.9); 7.895 (2.1); 7.892 (2.0); 7.877 (1.4); 7.873 (1.3); 7.567 (0.4); 7.547 (0.6); 5.756 (8.2); 5.231 (0.7); 5.226 (0.6); 5.216 (0.5); 5.211 (1.3); 5.205 (0.5); 5.196 (0.7); 5.190 (0.8); 5.175 (0.4); 4.802 (2.1); 4.783 (4.1); 4.763 (2.6); 4.673 (2.9); 4.657 (3.1); 4.639 (2.0); 3.746 (16.0); 3.732 (0.5); 3.602 (0.5); 3.594 (0.5); 3.325 (51.0); 2.676 (0.3); 2.671 (0.4); 2.524 (1.2); 2.511 (26.7); 2.507 (53.3); 2.502 (69.4); 2.498 (49.5); 2.493 (23.4); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 1.760 (0.5); 1.236 (0.7); 1.190 (0.3); 0.000 (2.3)	10
I-28	3.22	3.29	実施例 28: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.561 (4.9); 8.983 (2.2); 8.362 (2.2); 8.359 (2.2); 4.075 (16.0); 4.032 (0.3); 4.022 (0.4); 3.323 (56.4); 3.202 (1.1); 3.184 (3.5); 3.165 (3.5); 3.147 (1.1); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.511 (33.1); 2.507 (65.1); 2.502 (84.7); 2.498 (61.6); 2.494 (30.1); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 1.355 (0.7); 1.252 (4.0); 1.233 (8.3); 1.215 (3.7); 0.008 (2.6); 0.000 (63.4); -0.008 (2.5)	20
I-29	2.93	3.04	実施例 29: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.302 (3.5); 8.962 (1.6); 8.959 (1.8); 8.951 (1.8); 8.947 (1.8); 8.457 (1.3); 8.437 (1.4); 8.334 (3.7); 7.856 (1.7); 7.845 (1.7); 7.836 (1.6); 7.824 (1.6); 4.092 (16.0); 3.329 (37.7); 2.526 (0.6); 2.512 (14.7); 2.508 (30.1); 2.504 (40.6); 2.499 (31.1); 2.495 (16.5); 0.000 (1.9)	20
I-30	2.36	2.41	実施例 30: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.307 (3.8); 8.443 (2.9); 8.305 (4.0); 8.190 (6.5); 4.008 (15.9); 3.327 (62.6); 2.995 (16.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.511 (28.7); 2.507 (57.0); 2.502 (75.3); 2.498 (56.9); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 0.000 (3.6)	
I-31	3.86	3.94	実施例 31: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.283 (3.4); 8.955 (2.1); 8.952 (2.1); 8.347 (2.1); 8.343 (2.2); 8.334 (3.8); 4.021 (16.0); 3.324 (17.5); 3.137 (2.1); 3.119 (3.6); 3.101 (2.2); 2.892 (1.6); 2.732 (1.3); 2.672 (0.4); 2.525 (0.7); 2.512 (20.3); 2.507 (42.4); 2.503 (57.6); 2.498 (43.7); 2.494 (22.9); 2.329 (0.4); 1.607 (1.2); 1.588 (2.4); 1.570 (2.5); 1.552 (1.4); 0.961 (4.2); 0.943 (8.6); 0.924 (3.8); 0.008 (1.3); 0.000 (42.0); -0.009 (2.2)	30
I-32	3.32	3.37	実施例 32: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.580 (2.3); 9.577 (2.3); 9.316 (3.9); 8.796 (2.4); 8.792 (2.4); 8.350 (4.1); 7.903 (0.5); 7.898 (0.5); 7.547 (0.5); 5.756 (2.2); 3.923 (16.0); 3.898 (2.3); 3.883 (1.8); 3.878 (2.4); 3.873 (1.8); 3.859 (2.3); 3.775 (0.8); 3.323 (27.3); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.524 (1.0); 2.511 (25.7); 2.507 (52.2); 2.502 (69.6); 2.498 (51.6); 2.493 (26.0); 2.329 (0.4); 2.324 (0.3); 1.737 (1.1); 1.718 (1.9); 1.699 (2.0); 1.680 (1.2); 1.013 (4.1); 1.002 (0.9); 0.995 (8.4); 0.976 (3.8); 0.000 (9.4); -0.008 (0.4)	
I-33	2.11	2.12	実施例 33: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.315 (3.7); 8.969 (1.6); 8.966 (1.8); 8.958 (1.8); 8.954 (1.7); 8.556 (1.6); 8.552 (1.7); 8.536 (1.8); 8.532 (1.7); 8.319 (4.0); 7.938 (1.7); 7.926 (1.6); 7.918 (1.6); 7.906 (1.5); 4.318 (16.0); 3.552 (0.9); 3.533 (1.0); 3.519 (1.1); 3.500 (1.1); 3.481 (0.3); 3.324 (25.2); 3.031 (1.1); 3.012 (1.2); 2.998 (1.0); 2.979 (1.0); 2.507 (37.9); 2.503 (49.7); 2.499 (37.5); 1.303 (3.8); 1.285 (8.0); 1.266 (3.7); 0.000	40

			(5.3)	
I-34	4.41	4.38	实施例 34: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.332 (3.7); 8.517 (4.3); 8.515 (4.4); 8.272 (3.7); 8.251 (3.9); 7.627 (0.5); 7.623 (0.6); 7.614 (0.4); 7.597 (0.5); 7.575 (0.4); 7.566 (0.4); 7.556 (0.4); 7.542 (2.9); 7.538 (3.4); 7.509 (2.4); 7.504 (1.7); 7.488 (2.1); 7.483 (1.8); 3.321 (35.3); 2.680 (0.4); 2.675 (0.9); 2.671 (1.2); 2.666 (0.8); 2.662 (0.4); 2.610 (16.0); 2.524 (3.5); 2.511 (65.6); 2.506 (129.9); 2.502 (168.9); 2.497 (120.0); 2.493 (56.5); 2.337 (0.4); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.324 (0.8); 2.320 (0.4); 1.355 (1.2); 1.328 (0.4); 1.207 (0.3); 1.189 (0.7); 1.168 (2.5); 1.160 (2.3); 1.145 (0.4); 1.058 (0.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6); 0.000 (97.2); -0.009 (3.2); -0.150 (0.4)	
I-35	4.07	4.03	实施例 35: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.334 (5.6); 8.540 (6.8); 8.538 (6.7); 8.234 (2.7); 8.231 (2.8); 8.214 (3.0); 8.211 (2.8); 7.693 (1.0); 7.690 (1.0); 7.673 (2.6); 7.669 (2.1); 7.655 (2.3); 7.651 (2.2); 7.621 (3.9); 7.602 (2.0); 7.440 (1.8); 7.437 (1.8); 7.420 (3.0); 7.402 (1.5); 7.399 (1.4); 3.323 (126.5); 3.130 (2.0); 3.112 (6.6); 3.093 (6.7); 3.075 (2.1); 2.680 (0.5); 2.675 (1.1); 2.671 (1.5); 2.666 (1.1); 2.662 (0.5); 2.524 (4.8); 2.511 (84.8); 2.506 (166.1); 2.502 (215.2); 2.497 (153.7); 2.493 (72.9); 2.333 (1.0); 2.329 (1.4); 2.324 (1.0); 1.333 (7.5); 1.315 (16.0); 1.297 (7.2); 0.008 (1.0); 0.000 (28.0); - 0.009 (0.9)	10
I-36	2.64	2.67	实施例 36: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.577 (2.7); 9.575 (2.7); 9.320 (4.2); 8.825 (2.8); 8.822 (2.8); 8.347 (4.5); 7.902 (0.7); 7.897 (0.7); 7.886 (0.4); 7.566 (0.3); 7.546 (0.5); 5.757 (1.3); 4.018 (1.1); 3.934 (16.0); 3.700 (15.4); 3.325 (73.6); 2.671 (0.7); 2.506 (74.4); 2.502 (95.9); 2.498 (76.5); 2.328 (0.6); 1.258 (0.3); 1.236 (1.0); 1.169 (0.8); 0.000 (2.4)	
I-37	3.10	3.17	实施例 37: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.392 (2.2); 9.388 (2.3); 9.369 (3.8); 8.726 (2.3); 8.721 (2.4); 8.385 (3.9); 8.316 (0.5); 4.362 (16.0); 3.627 (0.9); 3.608 (1.1); 3.594 (1.1); 3.575 (1.0); 3.324 (136.2); 3.117 (1.0); 3.098 (1.2); 3.084 (1.0); 3.065 (0.9); 2.676 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.9); 2.507 (127.4); 2.502 (169.6); 2.498 (129.7); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.9); 1.330 (3.8); 1.312 (8.1); 1.293 (3.6); 0.146 (0.9); 0.008 (7.7); 0.000 (196.4); -0.150 (0.9)	20
I-38	2.63	2.68	实施例 38: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.273 (3.9); 8.266 (4.2); 8.141 (2.4); 8.120 (3.8); 8.105 (2.9); 8.100 (3.4); 8.055 (2.4); 8.049 (2.0); 8.033 (1.5); 8.028 (1.3); 7.904 (0.8); 7.899 (0.7); 7.894 (0.5); 7.887 (0.5); 7.697 (0.3); 7.568 (0.5); 7.548 (0.8); 7.528 (0.3); 3.763 (16.0); 3.530 (0.6); 3.513 (1.3); 3.495 (1.4); 3.476 (0.6); 3.357 (0.5); 3.328 (61.7); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.3); 2.507 (57.0); 2.502 (75.7); 2.498 (56.3); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 2.325 (0.3); 1.125 (3.8); 1.107 (8.1); 1.088 (3.6); 0.000 (0.6)	
I-39	3.45	3.52	实施例 39: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.386 (2.2); 9.383 (2.3); 9.374 (3.8); 8.774 (2.3); 8.769 (2.3); 8.316 (0.4); 8.302 (3.8); 5.756 (0.4); 4.362 (16.0); 3.637 (0.5); 3.616 (0.9); 3.605 (0.6); 3.596 (0.6); 3.585 (1.0); 3.564 (0.6); 3.322 (68.3); 2.993 (0.6); 2.981 (0.7); 2.973 (0.7); 2.961 (1.1); 2.949 (0.7); 2.941 (0.7); 2.928 (0.6); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.666 (0.6); 2.511 (49.6); 2.506 (97.4); 2.502 (127.7); 2.497 (95.5); 2.493 (49.9); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.324 (0.6); 2.029 (0.5); 2.010 (0.7); 1.994 (0.6); 1.975 (0.7); 1.956 (0.4); 1.804 (0.4); 1.789 (0.6); 1.783 (0.5); 1.770 (0.6); 1.757 (0.4); 1.754 (0.4); 1.146 (3.8); 1.128 (8.0); 1.109 (3.6); 0.146 (0.8); 0.008 (8.1); 0.000 (174.8); -0.008 (10.0); -0.150 (0.8)	30
I-40	3.10	3.15	实施例 40: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.347 (4.8); 8.561 (5.7); 8.293 (2.2); 8.291 (2.3); 8.274 (2.4); 8.271 (2.3); 7.668 (1.0); 7.665 (1.1); 7.647 (2.2); 7.630 (1.4); 7.627 (1.3); 7.480 (1.7); 7.460 (2.8); 7.442 (1.3); 7.179 (2.9); 7.159 (2.6); 6.870 (1.5); 6.647 (0.8); 5.165 (3.3); 5.147 (6.3); 5.130 (3.6); 4.804 (0.5); 4.788 (1.2); 4.771 (1.9); 4.755 (1.2); 4.738 (0.4); 4.512 (3.8); 4.496 (6.3); 4.480 (3.3); 3.328 (53.8); 2.672 (0.6); 2.507 (73.4);	40

			2.503 (93.5); 2.499 (70.8); 2.330 (0.6); 2.183 (2.4); 1.355 (16.0); 1.233 (0.9); 1.182 (0.6); 0.008 (3.2); 0.000 (57.9)	
I-41	3.73	3.80	実施例 41: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.277 (3.9); 8.989 (2.5); 8.456 (2.5); 8.453 (2.5); 8.345 (0.3); 8.333 (4.2); 7.954 (0.5); 4.021 (0.4); 4.003 (1.1); 3.988 (16.0); 3.949 (0.4); 3.932 (1.0); 3.916 (1.4); 3.899 (1.1); 3.883 (0.4); 3.325 (35.1); 2.892 (3.7); 2.732 (3.3); 2.672 (0.3); 2.507 (40.5); 2.503 (53.7); 2.499 (41.6); 2.330 (0.4); 1.235 (14.8); 1.219 (14.7); 0.008 (1.4); 0.000 (30.8)	
I-42	3.39	3.46	実施例 I-42: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.881 (0.4); 9.213 (3.4); 8.238 (3.6); 8.236 (3.6); 8.136 (0.4); 8.085 (0.7); 7.683 (0.3); 7.639 (2.8); 7.634 (2.9); 7.572 (2.4); 7.552 (3.7); 7.504 (0.5); 7.499 (0.5); 7.483 (2.1); 7.478 (2.0); 7.462 (1.4); 7.457 (1.3); 6.870 (0.4); 3.779 (16.0); 3.618 (0.4); 3.608 (0.3); 3.602 (1.0); 3.585 (0.4); 3.325 (20.2); 3.098 (0.6); 3.067 (1.2); 3.048 (3.9); 3.030 (4.0); 3.016 (0.9); 3.012 (1.3); 2.877 (1.1); 2.865 (1.1); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.4); 2.520 (2.1); 2.511 (30.1); 2.507 (61.5); 2.502 (81.2); 2.498 (58.8); 2.493 (28.4); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.183 (0.7); 1.776 (0.4); 1.769 (0.4); 1.760 (1.2); 1.752 (0.4); 1.744 (0.4); 1.355 (5.3); 1.245 (0.8); 1.236 (0.4); 1.226 (1.7); 1.218 (0.5); 1.208 (0.8); 1.193 (4.1); 1.175 (8.7); 1.156 (3.9); 0.146 (0.4); 0.008 (2.9); 0.000 (88.8); -0.009 (3.1); -0.150 (0.4)	10
I-43	2.61	2.69	実施例 I-43: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.259 (3.8); 8.259 (4.0); 8.123 (6.1); 8.118 (3.1); 8.107 (2.5); 8.102 (1.5); 7.945 (2.9); 7.939 (0.8); 7.929 (0.7); 7.923 (2.3); 5.757 (11.4); 3.742 (16.0); 3.600 (0.7); 3.581 (2.2); 3.563 (2.2); 3.545 (0.7); 3.329 (38.9); 2.671 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (23.7); 2.507 (48.0); 2.502 (63.6); 2.498 (47.5); 2.494 (24.1); 2.329 (0.4); 1.146 (3.7); 1.128 (8.2); 1.109 (3.6); 0.008 (0.3); 0.000 (9.3); -0.008 (0.4)	20
I-44	2.36	2.45	実施例 I-44: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.270 (3.8); 8.317 (0.5); 8.273 (4.1); 8.022 (2.9); 8.016 (3.1); 7.986 (2.2); 7.966 (3.6); 7.905 (2.1); 7.899 (1.9); 7.884 (1.3); 7.879 (1.2); 3.969 (16.0); 3.377 (1.0); 3.359 (1.3); 3.344 (1.9); 3.329 (150.3); 3.307 (0.6); 2.945 (1.1); 2.927 (1.2); 2.912 (1.0); 2.893 (0.9); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.524 (3.1); 2.507 (141.2); 2.502 (185.0); 2.498 (135.5); 2.333 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.179 (3.8); 1.160 (8.2); 1.142 (3.7); 0.008 (2.3); 0.000 (70.9); -0.009 (2.6); -0.150 (0.3)	
I-45		2.53	実施例 I-45: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.295 (3.9); 8.364 (3.2); 8.342 (3.4); 8.292 (4.1); 7.347 (3.4); 7.325 (3.3); 4.015 (1.0); 3.987 (16.0); 3.922 (15.6); 3.910 (1.3); 3.733 (1.0); 3.714 (3.4); 3.695 (3.4); 3.677 (1.0); 3.506 (0.3); 3.331 (66.6); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (58.9); 2.503 (75.4); 2.498 (56.9); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 2.087 (2.0); 1.234 (0.8); 1.203 (3.6); 1.185 (7.9); 1.166 (3.5); 0.008 (2.1); 0.000 (43.3)	30
I-46	2.92	2.98	実施例 I-46: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.269 (4.1); 8.592 (1.8); 8.590 (1.9); 8.581 (1.9); 8.578 (1.8); 8.306 (4.3); 8.094 (1.7); 8.092 (1.7); 8.074 (1.9); 8.071 (1.8); 7.955 (0.8); 7.642 (1.6); 7.631 (1.6); 7.622 (1.5); 7.610 (1.5); 3.979 (16.0); 3.334 (9.6); 3.046 (1.2); 3.027 (3.8); 3.009 (3.9); 2.991 (1.3); 2.893 (4.9); 2.734 (4.4); 2.509 (22.7); 2.505 (28.6); 2.501 (21.4); 1.220 (4.2); 1.202 (8.6); 1.184 (4.1); 0.000 (4.6)	
I-47	4.02	4.10	実施例 I-47: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.308 (3.5); 8.964 (2.1); 8.961 (2.1); 8.355 (3.9); 8.353 (3.9); 8.341 (2.2); 8.338 (2.2); 8.317 (0.3); 4.030 (16.0); 3.328 (183.2); 3.184 (1.1); 3.165 (3.5); 3.147 (3.6); 3.129 (1.1); 2.676 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.8); 2.525 (2.5); 2.520 (3.8); 2.511 (53.3); 2.507 (109.8); 2.502 (147.2); 2.498 (110.1); 2.494 (55.4); 2.334 (0.7); 2.329 (1.0); 2.325 (0.7); 1.235 (4.2); 1.217 (8.3); 1.198 (3.8); 0.146 (1.1); 0.008 (8.0); 0.000 (229.8); -0.009 (9.5); -0.150 (1.1)	
I-48	2.64	2.70	実施例 I-48: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.337 (2.2); 9.324 (2.3); 9.295 (4.0); 8.366 (2.9); 8.353 (2.8); 8.273 (4.3); 5.757 (0.8); 3.919 (16.0); 3.894 (0.7); 3.879 (1.3); 3.862 (1.3); 3.327 (92.4); 2.676	40

			(0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.507 (88.5); 2.502 (113.9); 2.498 (86.6); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.325 (0.6); 1.243 (3.6); 1.224 (7.4); 1.206 (3.4); 0.146 (0.6); 0.008 (6.3); 0.000 (128.4); -0.150 (0.6)	
I-49	1.99	2.05	实施例 I-49: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11.328 (3.1); 9.295 (4.3); 8.532 (1.7); 8.509 (4.8); 8.487 (4.4); 8.465 (1.5); 8.318 (0.6); 8.304 (4.7); 3.876 (16.0); 3.847 (0.7); 3.658 (1.1); 3.639 (3.5); 3.621 (3.5); 3.602 (1.1); 3.331 (78.4); 2.892 (0.3); 2.676 (1.0); 2.672 (1.3); 2.668 (1.0); 2.565 (0.4); 2.507 (157.3); 2.503 (200.0); 2.498 (150.8); 2.344 (0.8); 2.334 (1.0); 2.329 (1.4); 2.169 (15.8); 1.989 (1.1); 1.234 (0.5); 1.184 (3.8); 1.175 (1.3); 1.166 (8.3); 1.148 (3.7); 0.008 (0.9); 0.000 (19.7)	
I-50	2.27	2.39	实施例 I-50: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.770 (2.6); 9.256 (3.9); 8.290 (1.9); 8.277 (4.3); 8.268 (2.5); 8.242 (0.7); 8.115 (3.0); 8.093 (2.4); 8.063 (0.4); 4.456 (1.9); 4.038 (0.6); 4.020 (0.7); 3.979 (16.0); 3.332 (83.1); 2.966 (1.2); 2.948 (4.0); 2.929 (4.1); 2.911 (1.3); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (62.3); 2.503 (81.2); 2.498 (61.4); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 2.184 (1.9); 2.119 (15.2); 1.989 (2.6); 1.193 (0.7); 1.172 (4.5); 1.154 (9.1); 1.135 (4.2); 0.008 (2.6); 0.000 (55.6); -0.008 (3.1)	10
I-51		2.48	实施例 I-51: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.259 (4.5); 9.210 (2.4); 9.198 (2.5); 8.278 (4.7); 8.276 (4.8); 8.226 (3.2); 8.214 (3.1); 5.757 (2.5); 3.965 (0.7); 3.946 (0.8); 3.932 (0.8); 3.920 (0.7); 3.914 (0.8); 3.795 (16.0); 3.375 (0.6); 3.356 (0.8); 3.328 (59.8); 3.305 (0.3); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (27.2); 2.507 (56.1); 2.502 (75.0); 2.498 (55.5); 2.494 (27.5); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 1.264 (3.7); 1.245 (7.9); 1.227 (3.8); 0.008 (1.2); 0.000 (39.0); -0.008 (1.4)	
I-52	2.51	2.61	实施例 I-52: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.321 (2.5); 8.780 (3.9); 8.736 (2.6); 7.746 (3.8); 3.824 (1.3); 3.809 (16.0); 3.799 (3.9); 3.787 (1.3); 2.141 (2.3); 1.965 (10.4); 1.957 (0.4); 1.944 (3.9); 1.940 (5.2); 1.937 (3.8); 1.933 (2.0); 1.297 (3.8); 1.285 (7.6); 1.273 (3.7); 0.000 (3.3)	20
I-53		3.12	实施例 I-53: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.242 (3.5); 8.270 (3.7); 8.119 (0.4); 8.064 (2.9); 8.042 (3.1); 7.123 (3.3); 7.101 (3.1); 4.012 (16.0); 3.959 (0.4); 3.909 (1.6); 3.899 (16.0); 3.332 (95.1); 2.942 (1.2); 2.923 (3.9); 2.905 (3.9); 2.887 (1.3); 2.677 (0.4); 2.672 (0.6); 2.668 (0.4); 2.525 (1.6); 2.511 (32.5); 2.507 (64.4); 2.503 (84.3); 2.499 (63.2); 2.334 (0.4); 2.330 (0.6); 2.325 (0.4); 1.990 (0.8); 1.175 (0.5); 1.144 (4.1); 1.126 (8.6); 1.107 (4.0); 0.008 (2.3); 0.000 (60.3); -0.008 (3.0)	
I-54	3.07	3.16	实施例 I-54: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.293 (3.9); 8.987 (2.7); 8.490 (2.7); 8.335 (4.1); 5.757 (0.6); 4.713 (1.2); 4.699 (2.4); 4.685 (1.2); 4.595 (1.1); 4.581 (2.3); 4.567 (1.3); 4.041 (16.0); 3.581 (1.1); 3.567 (2.2); 3.553 (1.1); 3.521 (1.2); 3.507 (2.2); 3.493 (1.1); 3.327 (105.4); 2.671 (0.8); 2.506 (88.1); 2.502 (120.1); 2.498 (96.8); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 1.234 (0.4); 0.146 (0.4); 0.008 (2.7); 0.000 (84.4); -0.150 (0.4)	30
I-55	3.01	3.12	实施例 I-55: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.956 (3.9); 8.953 (4.0); 8.942 (2.0); 8.940 (2.0); 8.317 (2.1); 7.904 (3.7); 7.902 (3.7); 3.950 (16.0); 3.332 (109.0); 3.172 (1.0); 3.154 (3.3); 3.135 (3.4); 3.117 (1.0); 2.676 (0.3); 2.672 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.2); 2.520 (1.8); 2.512 (26.2); 2.507 (53.9); 2.503 (71.3); 2.498 (52.0); 2.494 (25.3); 2.334 (0.3); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.251 (0.5); 1.232 (5.1); 1.214 (7.9); 1.195 (3.5); 1.103 (0.3); 0.000 (6.1)	
I-56	1.56	1.61	实施例 I-56: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.502 (3.9); 9.497 (3.4); 9.306 (4.1); 8.900 (4.0); 8.895 (3.4); 8.645 (1.9); 8.322 (4.5); 8.057 (1.9); 3.892 (16.0); 3.843 (1.3); 3.825 (3.8); 3.806 (3.7); 3.788 (1.1); 3.332 (180.7); 2.676 (0.9); 2.672 (1.1); 2.667 (0.8); 2.507 (135.9); 2.503 (156.6); 2.498 (111.5); 2.334 (0.9); 2.330 (1.0); 2.325 (0.7); 1.298 (0.5); 1.259 (1.0); 1.235 (5.5); 1.217 (8.5); 1.198 (3.8); 0.000 (14.4); -0.062 (0.6)	40
I-57	2.82	2.89	实施例 I-57: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO):	

			δ = 9.596 (2.3); 9.593 (2.2); 9.330 (3.8); 9.320 (0.5); 8.830 (2.3); 8.826 (2.2); 8.353 (4.1); 4.994 (1.0); 4.982 (1.5); 4.969 (1.1); 4.877 (1.0); 4.865 (1.5); 4.852 (1.2); 4.493 (1.1); 4.480 (1.5); 4.468 (1.0); 4.427 (1.2); 4.414 (1.5); 4.402 (1.0); 3.957 (16.0); 3.947 (1.6); 3.919 (0.4); 3.813 (0.3); 3.328 (182.7); 2.676 (0.7); 2.671 (1.0); 2.667 (0.7); 2.663 (0.4); 2.524 (3.6); 2.511 (61.5); 2.507 (120.1); 2.502 (156.5); 2.498 (114.9); 2.493 (57.0); 2.333 (0.7); 2.329 (1.0); 2.325 (0.7); 2.074 (0.5); 1.235 (0.6); 0.008 (2.3); 0.000 (63.1); -0.008 (2.5)	
I-58		2.19	実施例 I-58: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.553 (2.2); 9.550 (2.2); 9.320 (3.9); 8.786 (2.4); 8.781 (2.4); 8.336 (4.1); 5.755 (1.0); 5.119 (1.2); 5.106 (2.9); 5.093 (1.3); 4.066 (1.6); 4.052 (3.3); 4.038 (2.1); 3.919 (16.0); 3.869 (1.1); 3.855 (2.7); 3.842 (2.5); 3.828 (0.9); 3.400 (0.4); 3.393 (0.4); 3.384 (0.5); 3.345 (268.1); 3.309 (0.6); 2.672 (0.4); 2.526 (1.1); 2.512 (22.7); 2.508 (46.1); 2.503 (61.2); 2.499 (45.2); 2.494 (22.6); 2.330 (0.4); 0.000 (0.6)	10
I-59	2.31	2.41	実施例 I-59: ¹ H-NMR (600.1 MHz, CD ₃ CN): δ = 9.085 (2.6); 8.843 (1.4); 8.842 (1.6); 8.840 (1.5); 8.333 (1.7); 8.331 (1.6); 8.165 (2.9); 5.447 (1.4); 3.979 (16.0); 3.725 (0.9); 3.715 (2.8); 3.705 (2.9); 3.695 (1.0); 3.459 (0.9); 3.449 (1.8); 3.439 (0.8); 3.177 (2.4); 3.167 (4.3); 3.157 (2.2); 2.145 (5.7); 1.957 (0.5); 1.953 (0.6); 1.949 (3.0); 1.945 (5.2); 1.941 (7.5); 1.937 (5.0); 1.933 (2.5)	
I-60	1.76	1.77	実施例 I-60: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.262 (4.0); 8.968 (3.2); 8.963 (3.3); 8.415 (1.6); 8.354 (3.0); 8.350 (3.1); 8.303 (4.3); 7.862 (1.6); 4.008 (16.0); 3.331 (33.2); 3.113 (1.1); 3.095 (3.7); 3.076 (3.8); 3.058 (1.2); 2.508 (35.4); 2.504 (46.2); 2.499 (34.8); 1.246 (4.0); 1.228 (8.5); 1.209 (3.9); 0.008 (1.7); 0.000 (46.1); -0.008 (2.2)	20
I-61	2.63	2.71	実施例 I-61: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.343 (3.7); 8.973 (1.6); 8.969 (1.8); 8.961 (1.8); 8.957 (1.8); 8.559 (1.6); 8.555 (1.7); 8.539 (1.8); 8.535 (1.8); 8.347 (4.0); 8.345 (4.0); 7.941 (1.7); 7.929 (1.6); 7.921 (1.6); 7.909 (1.6); 4.320 (16.0); 3.561 (1.0); 3.542 (1.0); 3.528 (1.1); 3.509 (1.1); 3.490 (0.3); 3.330 (33.2); 3.048 (1.1); 3.030 (1.2); 3.015 (1.0); 2.997 (1.0); 2.677 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.525 (1.3); 2.507 (56.6); 2.503 (75.2); 2.499 (56.4); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.301 (3.8); 1.282 (8.2); 1.264 (3.7); 0.146 (0.5); 0.008 (4.0); 0.000 (110.8); -0.008 (5.6); -0.150 (0.5)	
I-62	2.15	2.17	実施例 I-62: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.207 (3.4); 8.318 (0.5); 8.194 (3.7); 8.192 (3.6); 8.062 (1.6); 8.059 (1.7); 8.042 (2.2); 8.039 (2.2); 7.947 (1.8); 7.928 (2.7); 7.908 (1.6); 7.735 (2.0); 7.732 (2.1); 7.716 (1.8); 7.713 (1.7); 3.742 (16.0); 3.593 (1.0); 3.574 (3.5); 3.556 (3.6); 3.537 (1.2); 3.329 (74.8); 2.676 (0.7); 2.671 (0.9); 2.667 (0.7); 2.662 (0.4); 2.525 (2.4); 2.520 (3.6); 2.511 (50.5); 2.507 (105.6); 2.502 (140.5); 2.498 (101.4); 2.493 (48.8); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.324 (0.6); 2.086 (0.7); 1.235 (1.3); 1.184 (4.0); 1.166 (9.0); 1.147 (3.9); 1.140 (0.6); 0.146 (0.7); 0.008 (5.0); 0.000 (161.5); -0.009 (5.9); -0.150 (0.7)	30
I-63	3.62	3.75	実施例 I-63: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.396 (5.6); 8.728 (2.2); 8.723 (2.3); 8.416 (4.1); 8.414 (3.9); 8.318 (0.5); 4.362 (16.0); 3.635 (0.9); 3.617 (1.0); 3.602 (1.1); 3.583 (1.0); 3.332 (165.3); 3.134 (1.0); 3.116 (1.2); 3.101 (1.0); 3.083 (1.0); 2.676 (0.8); 2.672 (1.1); 2.667 (0.8); 2.525 (2.6); 2.511 (62.1); 2.507 (126.3); 2.503 (165.5); 2.498 (121.7); 2.494 (60.8); 2.334 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.8); 1.327 (3.7); 1.308 (8.1); 1.290 (3.6); 0.146 (0.4); 0.008 (3.1); 0.000 (96.0); -0.008 (4.1); -0.150 (0.4)	
I-64	3.95	3.93	実施例 I-64: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.275 (2.6); 9.271 (2.5); 8.943 (4.3); 8.584 (2.6); 8.580 (2.6); 8.318 (0.5); 7.701 (3.0); 7.680 (3.9); 7.548 (3.8); 7.527 (3.0); 7.410 (4.6); 3.890 (16.0); 3.329 (75.4); 3.140 (1.3); 3.122 (4.2); 3.104 (4.3); 3.086 (1.4); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.507 (140.3); 2.502 (179.9); 2.498 (134.5); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.281 (4.6); 1.263 (9.7); 1.245 (4.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6); 0.000	40

			(84.0); -0.150 (0.4)	
I-65	4.31	4.37	<p>实施例 I-65: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.217 (3.1); 9.076 (4.1); 9.074 (4.1); 8.959 (2.3); 8.956 (2.3); 8.334 (2.3); 8.318 (1.7); 8.288 (3.7); 8.211 (4.1); 8.209 (4.1); 5.758 (1.1); 4.005 (16.0); 3.328 (226.4); 3.189 (1.1); 3.171 (3.5); 3.153 (3.6); 3.134 (1.1); 2.676 (2.7); 2.671 (3.8); 2.667 (2.8); 2.525 (9.3); 2.520 (14.6); 2.511 (211.4); 2.507 (434.4); 2.502 (573.8); 2.498 (421.2); 2.493 (209.9); 2.333 (2.7); 2.329 (3.7); 2.324 (2.8); 1.258 (0.3); 1.243 (4.1); 1.225 (8.8); 1.206 (3.9); 1.148 (0.3); 0.146 (1.3); 0.008 (9.7); 0.000 (308.8); -0.008 (13.1); -0.150 (1.4)</p>	
I-66	3.42	3.50	<p>实施例 I-66: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.243 (3.5); 8.317 (0.4); 8.274 (3.7); 8.069 (2.9); 8.047 (3.1); 7.116 (3.3); 7.094 (3.2); 4.017 (0.4); 4.000 (16.0); 3.893 (15.8); 3.329 (74.5); 2.884 (2.3); 2.867 (3.7); 2.848 (2.4); 2.676 (0.7); 2.671 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.3); 2.511 (50.8); 2.507 (105.0); 2.502 (139.6); 2.498 (102.9); 2.494 (51.4); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.325 (0.7); 1.496 (1.2); 1.478 (2.4); 1.460 (2.5); 1.442 (1.4); 0.875 (4.2); 0.857 (8.4); 0.838 (3.7); 0.008 (0.8); 0.000 (28.2); -0.008 (1.2)</p>	10
I-67	2.70	2.75	<p>实施例 I-67: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 10.028 (0.5); 9.850 (0.4); 9.268 (0.7); 9.248 (3.0); 8.317 (1.0); 8.302 (0.7); 8.262 (3.1); 8.236 (0.6); 8.194 (0.5); 8.119 (1.3); 8.097 (0.7); 8.026 (2.6); 8.004 (2.6); 7.996 (0.5); 7.978 (0.6); 7.181 (0.8); 7.159 (0.6); 7.133 (2.8); 7.111 (2.7); 4.442 (2.5); 4.071 (13.8); 4.017 (3.3); 4.014 (3.6); 3.959 (1.9); 3.910 (16.0); 3.329 (346.6); 2.881 (1.4); 2.869 (1.4); 2.676 (1.7); 2.671 (2.3); 2.667 (1.7); 2.525 (5.8); 2.511 (128.4); 2.507 (263.1); 2.502 (348.1); 2.498 (256.2); 2.494 (127.6); 2.422 (14.2); 2.334 (1.7); 2.329 (2.3); 2.325 (1.7); 1.989 (0.9); 1.234 (0.3); 1.175 (0.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.2); 0.000 (99.9); -0.008 (3.8); -0.150 (0.5)</p>	20
I-68	2.46	2.50	<p>实施例 I-68: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.319 (4.1); 9.142 (1.6); 9.139 (1.9); 9.130 (1.8); 9.126 (1.9); 8.582 (1.6); 8.578 (1.8); 8.562 (1.9); 8.558 (1.9); 8.328 (4.3); 8.024 (1.7); 8.012 (1.7); 8.003 (1.6); 7.991 (1.6); 3.870 (16.0); 3.802 (1.0); 3.783 (3.5); 3.765 (3.6); 3.746 (1.1); 3.333 (44.0); 2.676 (0.3); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (56.6); 2.503 (74.8); 2.499 (56.9); 2.330 (0.5); 1.209 (3.7); 1.191 (8.1); 1.172 (3.6); 0.008 (1.1); 0.000 (28.7)</p>	
I-69	4.32	4.37	<p>实施例 I-69: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.080 (4.3); 9.078 (4.2); 8.959 (2.4); 8.956 (2.4); 8.873 (1.8); 8.871 (2.0); 8.867 (2.1); 8.865 (1.8); 8.337 (2.4); 8.334 (2.4); 8.181 (4.2); 8.180 (4.2); 7.062 (2.5); 7.056 (2.5); 4.007 (16.0); 3.330 (22.5); 3.189 (1.1); 3.170 (3.7); 3.152 (3.7); 3.133 (1.2); 2.677 (0.3); 2.672 (0.5); 2.668 (0.3); 2.526 (1.2); 2.512 (26.3); 2.508 (53.3); 2.503 (70.1); 2.499 (51.8); 2.495 (26.3); 2.330 (0.4); 2.326 (0.3); 2.077 (0.6); 1.244 (4.0); 1.225 (8.7); 1.207 (3.9); 0.008 (1.3); 0.000 (37.3); -0.008 (1.8)</p>	30
I-70	3.24	3.29	<p>实施例 I-70: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.272 (4.0); 9.057 (2.0); 9.044 (2.1); 8.309 (4.2); 8.135 (2.8); 8.122 (2.7); 4.021 (0.4); 3.846 (16.0); 3.328 (22.9); 2.736 (1.1); 2.717 (3.4); 2.699 (3.5); 2.680 (1.3); 2.507 (37.7); 2.503 (49.4); 2.499 (37.9); 1.990 (1.3); 1.397 (1.1); 1.193 (0.3); 1.176 (0.7); 1.158 (0.4); 0.985 (4.0); 0.966 (8.1); 0.948 (3.8); 0.008 (1.7); 0.000 (44.7); -0.008 (2.1)</p>	
I-71		2.93	<p>实施例 I-71: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.293 (4.1); 8.368 (3.1); 8.345 (3.3); 8.299 (4.3); 7.342 (3.4); 7.320 (3.2); 5.758 (0.9); 4.017 (0.4); 3.985 (16.0); 3.918 (15.5); 3.716 (2.2); 3.701 (1.9); 3.696 (2.5); 3.692 (1.8); 3.677 (2.2); 3.330 (25.0); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (54.4); 2.503 (69.4); 2.499 (51.7); 2.330 (0.5); 2.326 (0.3); 1.668 (1.1); 1.649 (2.0); 1.630 (2.0); 1.611 (1.2); 1.235 (0.7); 0.993 (4.1); 0.974 (8.2); 0.956 (3.7); 0.000 (2.4)</p>	40
I-72	2.26	2.32	<p>实施例 I-72: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.581 (3.0); 9.576 (3.0); 9.312 (4.1); 9.070 (3.3); 9.065 (3.2); 8.716 (1.0); 8.704 (0.9); 8.335 (4.3); 8.091 (0.4); 7.660 (0.6); 7.645 (0.8); 7.641 (0.7); 7.626</p>	

			(0.6); 3.916 (16.0); 3.872 (1.3); 3.854 (3.8); 3.835 (3.9); 3.817 (1.4); 3.736 (0.6); 3.694 (0.7); 3.626 (0.8); 3.613 (0.8); 2.671 (1.0); 2.506 (105.6); 2.502 (135.4); 2.498 (103.6); 2.333 (0.7); 2.329 (0.9); 1.989 (0.7); 1.298 (0.6); 1.252 (4.0); 1.234 (9.7); 1.215 (3.9); 1.193 (0.3); 1.175 (0.5); 0.000 (3.0)
I-73	2.20	2.25	実施例 I-73: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.297 (3.6); 9.268 (0.9); 9.255 (0.6); 9.208 (0.4); 8.404 (3.2); 8.382 (3.4); 8.317 (0.4); 8.298 (3.9); 8.238 (0.6); 8.119 (0.8); 8.106 (0.4); 8.097 (0.9); 8.084 (0.4); 8.024 (0.5); 8.022 (0.5); 7.996 (0.4); 7.975 (0.4); 7.352 (3.6); 7.330 (3.5); 7.181 (0.8); 7.159 (0.8); 7.087 (0.4); 7.069 (0.4); 7.067 (0.4); 5.758 (2.8); 4.564 (1.5); 4.442 (3.0); 4.115 (0.7); 4.015 (4.7); 3.988 (16.0); 3.931 (15.4); 3.909 (3.9); 3.568 (0.8); 3.544 (14.4); 3.331 (131.8); 2.676 (0.7); 2.672 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.7); 2.511 (52.5); 2.507 (106.0); 2.503 (139.4); 2.498 (102.4); 2.494 (51.6); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.325 (0.7); 1.259 (0.5); 1.234 (1.5); 0.000 (5.6)
I-74	3.36	3.49	実施例 I-74: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.905 (3.0); 8.903 (3.0); 8.852 (1.6); 8.850 (1.6); 8.500 (1.9); 8.313 (1.5); 8.311 (2.1); 8.309 (1.4); 8.183 (1.7); 8.181 (1.7); 7.962 (3.4); 7.961 (3.4); 4.001 (16.0); 3.940 (0.4); 3.124 (1.1); 3.111 (3.4); 3.099 (3.5); 3.087 (1.2); 2.639 (0.7); 2.184 (55.7); 2.109 (1.2); 2.005 (2.2); 1.998 (195.7); 1.989 (2.7); 1.985 (1.8); 1.981 (10.0); 1.977 (18.2); 1.973 (26.5); 1.969 (18.0); 1.965 (9.0); 1.882 (1.2); 1.419 (0.4); 1.404 (0.7); 1.373 (0.6); 1.330 (4.1); 1.318 (9.0); 1.309 (1.6); 1.305 (5.2); 1.301 (3.4); 0.914 (0.6)
I-75	2.84	2.94	実施例 I-75: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.582 (2.6); 9.107 (4.5); 8.797 (2.6); 8.794 (2.8); 8.761 (3.5); 8.668 (2.9); 8.361 (4.6); 8.314 (0.3); 5.754 (2.9); 3.939 (1.0); 3.920 (3.5); 3.897 (16.0); 3.883 (1.4); 3.316 (65.0); 2.675 (0.8); 2.671 (1.1); 2.666 (0.9); 2.506 (121.1); 2.502 (165.0); 2.497 (131.6); 2.333 (0.7); 2.328 (1.1); 2.324 (0.9); 1.988 (0.8); 1.272 (3.7); 1.253 (8.2); 1.235 (4.5); 1.175 (0.4); 0.146 (0.5); 0.008 (3.6); 0.000 (102.8); -0.150 (0.5)
I-76	3.73	3.84	実施例 I-76: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.334 (1.1); 9.333 (1.2); 9.331 (1.2); 9.329 (1.1); 9.015 (1.4); 9.014 (1.7); 8.867 (2.5); 8.865 (2.3); 8.751 (1.2); 8.750 (1.3); 8.747 (1.3); 8.287 (2.6); 8.286 (2.3); 8.036 (1.9); 5.446 (0.6); 3.879 (0.9); 3.867 (16.0); 3.855 (3.0); 3.842 (0.9); 2.129 (16.5); 1.964 (0.3); 1.955 (0.9); 1.951 (1.2); 1.947 (9.5); 1.943 (17.4); 1.939 (24.5); 1.935 (16.4); 1.931 (8.6); 1.313 (3.1); 1.300 (6.6); 1.288 (3.1); 1.270 (0.6); 0.005 (0.6); 0.000 (19.1); -0.006 (0.7)
I-77	3.81	3.90	実施例 I-77: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.333 (1.3); 9.332 (1.5); 9.330 (1.5); 8.871 (3.2); 8.869 (3.1); 8.750 (1.6); 8.748 (1.6); 8.736 (1.3); 8.734 (1.4); 8.731 (1.4); 8.730 (1.2); 8.250 (3.0); 8.249 (3.0); 6.869 (1.7); 6.865 (1.7); 5.446 (0.7); 3.884 (1.1); 3.871 (4.7); 3.869 (16.0); 3.859 (3.6); 3.847 (1.1); 2.133 (5.1); 1.956 (0.3); 1.952 (0.4); 1.948 (3.5); 1.944 (6.3); 1.940 (9.0); 1.936 (6.1); 1.932 (3.2); 1.314 (3.5); 1.302 (7.5); 1.290 (3.6); 1.285 (0.4); 1.267 (0.5); 0.000 (5.6)

10

20

30

【 0 3 7 0 】

使用実施例

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - インビトロ接触試験

試験管にコーティングするために、9 mg の活性成分を、最初に、1 mL のアセトン p . a . に溶解させ、次いで、アセトン p . a . を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び振動させる (揺動回転 3 0 r p m で 2 時間) ことによって 2 5 0 μ L の該溶液を 2 5 m L 容試験管の内壁及び底面に均一に分配させる。9 0 0 p p m の活性成分溶液及び 4 4 . 7 c m ² の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5 μ g / c m ² の面積基準薬量が達成される。

40

【 0 3 7 1 】

溶媒を蒸発させた後、該試験管に 5 ~ 1 0 匹の成体ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室温及び周囲湿度で、水平位でインキュベートする。4 8 時間経過した後、効力を求める。この目的のために、該試験管を垂直に立て、トントンと叩いてネコノミを試験管の底に落とす。試験管の底で動かないままにいるか又は動きがギクシャクとしているネコノミは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

50

【0372】

この試験において、ある物質が、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で少なくとも80%の効力を達成すれば、その物質は、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのネコノミが死んだか又は死にかけていることを意味する。0%の効力は、損傷を受けたネコノミが無かったことを意味する。

【0373】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で、100%の効力を示す： I - 18、I - 21。

【0374】

オウシマダニ (*Boophilus microplus*) - 注入試験 (BOOPMIinj)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLの溶媒と混合させ、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0375】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ (*Boophilus microplus*) の腹部に1 μL の該活性成分溶液を注入する。その動物をシャーレの中に移し、人工気象室 (climate-controlled room) の中で維持する。

【0376】

その効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室 (climate-controlled cabinet) の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが無かったことを意味し；0%は、全ての卵が受精卵であることを意味する。

【0377】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20 μg の施用量で、80%の効力を示す： I - 21。

【0378】

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - 経口試験 (CTECFE)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させる。クエン酸塩を添加したウシ血液で希釈して、所望の濃度とする。

【0379】

頂部と底部がガーゼで閉じられているチャンバーの中に、餌を与えていない約20匹の成体ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を入れる。下端部がパラフィルムで閉じられている金属製円筒を該チャンバーの上に配置する。該円筒は、血液/活性成分調製物を含んでおり、これは、パラフィルム膜を通してネコノミによって摂取され得る。

【0380】

2日間経過した後、殺虫率 (%) を求める。100%は、全てのネコノミが死んだことを意味し；0%は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0381】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%効力を示す： I - 21。

【0382】

ヒツキンバエ (*Lucilia cuprina*) 試験 (LUCICU)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

10

20

30

40

50

【0383】

約20匹のヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) のL1幼虫を、馬肉の挽肉及び所望濃度の活性成分調製物を含んでいる被験容器の中に移す。

【0384】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのヒツジキンバエ幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだヒツジキンバエ幼虫が無かったことを意味する。

【0385】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-18、I-21。

【0386】

イエバエ (*Musca domestica*) 試験 (MUSCDO)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0387】

砂糖溶液と所望濃度の活性成分配合物で処理されたスポンジを含んでいる容器に、10匹の成体イエバエ (*Musca domestica*) を生息させる。

【0388】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのイエバエが死んだことを意味し；0%は、死んだイエバエが無かったことを意味する。

【0389】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、95%の効力を示す： I-21。

【0390】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験 (MYZUPE)

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0391】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

【0392】

6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0393】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： I-10、I-13、I-18、I-22、I-23、I-24、I-43、I-44、I-48、I-52。

【0394】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： I-4、I-12、I-14、I-17、I-18、I-19、I-21、I-38、I-42、I-45、I-46、I-49、I-50、I-51、I-56、I-61、I-68。

【0395】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20g/haの施用量で、9

10

20

30

40

50

0%の効力を示す： I - 39。

【0396】

マスタードビートル (Phaedon cochleariae) - 噴霧試験 (PHAE CO)

溶媒： 78.0重量部のアセトン
1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000 ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

10

【0397】

ハクサイ (Brassica pekinensis) の葉のディスクに所望濃度の活性成分配合物を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (mustard beetle) (Phaedon cochleariae) の幼虫を寄生させる。

【0398】

7日間経過した後、効力 (%) を求める。100%は、全てのマスタードビートル幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだマスタードビートル幼虫が無かったことを意味する。

【0399】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、100%の効力を示す： I - 2、I - 3、I - 4、I - 5、I - 10、I - 12、I - 13、I - 14、I - 18、I - 19、I - 21、I - 22、I - 24、I - 25、I - 26、I - 28、I - 29、I - 31、I - 36、I - 37、I - 38、I - 39、I - 41、I - 42、I - 43、I - 44、I - 45、I - 46、I - 47、I - 48、I - 49、I - 50、I - 51、I - 52、I - 53、I - 54、I - 55、I - 61、I - 68、I - 73。

20

【0400】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、83%の効力を示す： I - 30、I - 63。

30

【0401】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、100%の効力を示す： I - 11。

【0402】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、83%の効力を示す： I - 17。

【0403】

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験 (SPODFR)

溶媒： 78.0重量部のアセトン
1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000 ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

40

【0404】

トウモロコシ (Zea mays) の葉のディスクに所望濃度の活性成分配合物を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (army worm) (Spodoptera frugiperda) の幼虫を寄生させる。

50

【0405】

7日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのツマジロクサヨトウ幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだツマジロクサヨトウ幼虫が無かったことを意味する。

【0406】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 2、I - 21、I - 26、I - 37、I - 39、I - 42、I - 46、I - 47、I - 54、I - 61、I - 63、I - 68。

【0407】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、83%の効力を示す： I - 14、I - 19、I - 48。

10

【0408】

ナミハダニ(Tetranychus urticae) - 噴霧試験；OP抵抗性(ETRUR)

溶媒： 78.0重量部のアセトン
1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

20

【0409】

全ての成育段階のナミハダニ(greenhouse red spider mite)(Tetranychus urticae)が発生しているインゲンマメ(Phaseolus vulgaris)の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

【0410】

6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し；0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0411】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 68。

30

【0412】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： I - 2、I - 13、I - 19、I - 22、I - 28、I - 42、I - 44、I - 53。

【0413】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、90%の効力を示す： I - 48。

【0414】

モモアカアブラムシ(Myzus persicae) - 噴霧試験(MYZUPE)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、1000ppmの濃度で当該配合物溶液に添加する。

40

【0415】

モモアカアブラムシ(Myzus persicae)が重度に発生しているピーマン

50

(*Capsicum annuum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を噴霧することによって処理する。

【0416】

6日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0417】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で97%の効力を示す： I - 11。

【0418】

サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 試験 10

溶媒： 125.0重量部のアセトン

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0419】

容器に、砂、活性成分溶液、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) の卵/幼虫の懸濁液及びレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、植物が成長する。根では、こぶが形成される。

【0420】

14日間経過した後、こぶの形成によって殺線虫効力(%)を求める。100%は、こぶが見られなかったことを意味し；0%は、処理された植物のこぶの数が処理されていない対照のこぶの数に相当することを意味する。 20

【0421】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、100%の効力を示す： I - 68。

【0422】

比較実施例：

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 接触試験 (MYZUPE c

)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 30

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤(ナタネ油メチルエステル)を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

【0423】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が重度に発生している1葉期のピーマン (*Capsicum annuum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の裏面に噴霧することによって処理する。 40

【0424】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0425】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

【0426】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 層透過 (translamina
nar) 試験 (MYZUPE t) 50

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤(ナタネ油メチルエステル)を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

【0427】

モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)が重度に発生している1葉期のピーマン(*Capsicum annuum*)植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の上面に噴霧することによって処理する。

【0428】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0429】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

【0430】

ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*) - 接触試験 (APHIGO c)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤(ナタネ油メチルエステル)を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

【0431】

ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)が重度に発生している1葉期のワタ(*Gossypium hirsutum*)植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の裏面に噴霧することによって処理する。

【0432】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのワタアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだワタアブラムシが無かったことを意味する。

【0433】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

【0434】

ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*) - 層透過 (translamina r) 試験 (APHIGO t)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤(ナタネ油メチルエステル)を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

10

20

30

40

50

【0435】

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) が重度に発生している1葉期のワタ (*Gossypium hirsutum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の上面に噴霧することによって処理する。

【0436】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのワタアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだワタアブラムシが無かったことを意味する。

【0437】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

10

【0438】

ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) 試験 (NEPHCI)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤(ナタネ油メチルエステル)を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

20

【0439】

イネ植物 (*Oryza sativa*, var. *Balilla*) を所望濃度の該活性成分配合物を噴霧することによって処理し、次いで、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) の幼虫を寄生させる。

【0440】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのツマグロヨコバイが死んだことを意味し；0%は、死んだツマグロヨコバイが無かったことを意味する。

【0441】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

30

【0442】

トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) 試験 (NILALU)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤(ナタネ油メチルエステル)を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

40

【0443】

イネ植物 (*Oryza sativa*, var. *Balilla*) を所望濃度の該活性成分配合物を噴霧することによって処理し、次いで、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) のL3幼虫を寄生させる。

【0444】

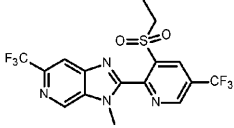
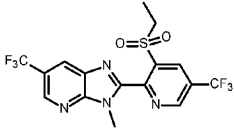
所望の期間が経過した後、食害(%)を求める。100%は、食害が見られないことを意味し；0%は、処理された植物に対する食害が処理されていない対照に対する食害に相当することを意味する。

【0445】

50

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す（表を参照されたい）。

【表3】

物質	構造	動物種	濃度	効力 (%) dat*	
Ex. I-21		MYZUPE c	2.4 g/ha	85	14 dat
		MYZUPE t	12 g/ha	98	14 dat
		MYZUPE t	2.4 g/ha	90	14 dat
		APHIGO c	2.4 g/ha	98	7 dat
		APHIGO t	2.4 g/ha	65	7 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	90	14 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	95	21 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	100	34 dat
		NILALU	4 ppm	90	21 dat
		NILALU	4 ppm	100	28 dat
Ex. 5 WO2013018928 から既知		MYZUPE c	2.4 g/ha	50	14 dat
		MYZUPE t	12 g/ha	0	14 dat
		MYZUPE t	2.4 g/ha	0	14 dat
		APHIGO c	2.4 g/ha	15	7 dat
		APHIGO t	2.4 g/ha	0	7 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	0	14 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	0	21 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	0	34 dat
		NILALU	4 ppm	35	21 dat
		NILALU	4 ppm	20	28 dat

* dat = 処理後日数 (日)

10

20

30

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 5
A 0 1 P	5/00 (2006.01)	A 0 1 P	7/02	
A 6 1 K	31/519 (2006.01)	A 0 1 P	7/04	
A 6 1 K	31/52 (2006.01)	A 0 1 P	5/00	
A 6 1 K	31/437 (2006.01)	A 6 1 K	31/519	
A 6 1 P	33/00 (2006.01)	A 6 1 K	31/52	
C 0 7 D	213/73 (2006.01)	A 6 1 K	31/437	
		A 6 1 P	33/00	
		C 0 7 D	213/73	

- (74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦
- (74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博
- (74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵
- (74)代理人 100196483
弁理士 川崎 洋祐
- (74)代理人 100203035
弁理士 五味淵 琢也
- (74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和
- (74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
- (74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
- (74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩
- (74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
- (74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文
- (72)発明者 フィッシャー, リュディガー
ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツォー・デン・フーフフェレン・2 3
- (72)発明者 アリグ, ベルト
ドイツ国、5 3 6 3 9・ケーニヒスヴィンター、イム・ロートシーフェン・7
- (72)発明者 イルク, ケルスティン
ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、ノイッサー・ヴァル・3 2
- (72)発明者 マルサム, オルガ
ドイツ国、5 1 5 0 3・レスラート、フォア・デム・クロースターホーフ・1 9
- (72)発明者 ジェルゲン, ウルリッヒ
ドイツ国、4 0 8 8 2・ラーティンゲン、フェスター・シュトラッセ・3 7
- (72)発明者 タルベルク, アンドレアス
ドイツ国、4 2 7 8 1・ハーン、ジントーシュトラッセ・8 6
- (72)発明者 リー, ジュン

- ドイツ国、30627・ハノーファー、ノーベルリング・42
(72)発明者 ツェルシュ,セルゲイ
ウクライナ国、07400・プロバルイ、コロレンコ・ストリート・64、アパートメント・118
(72)発明者 アールト,アレクサンドル
ドイツ国、51373・レーバークーゼン、ハウプトシュトラッセ・94

審査官 早乙女 智美

- (56)参考文献 特開2013-136519(JP,A)
特開2014-005263(JP,A)
特開昭58-090586(JP,A)
特表2016-528189(JP,A)

- (58)調査した分野(Int.Cl.,DB名)
C07D
A01N
A61K
CAplus/REGISTRY(STN)