

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5926253号
(P5926253)

(45) 発行日 平成28年5月25日(2016.5.25)

(24) 登録日 平成28年4月28日(2016.4.28)

(51) Int.Cl.		F I	
CO7D 401/14	(2006.01)	CO7D 401/14	CSP
CO7D 403/06	(2006.01)	CO7D 403/06	
CO7D 405/14	(2006.01)	CO7D 405/14	
AO1N 43/713	(2006.01)	AO1N 43/713	
AO1P 7/02	(2006.01)	AO1P 7/02	

請求項の数 9 (全 69 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2013-517326 (P2013-517326)	(73) 特許権者	512137348
(86) (22) 出願日	平成23年7月4日(2011.7.4)		バイエル・インテレクチュアル・プロパティ・ゲゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング
(65) 公表番号	特表2013-530197 (P2013-530197A)		Bayer Intellectual Property GmbH
(43) 公表日	平成25年7月25日(2013.7.25)		ドイツ40789モンハイム・アム・ライン、アルフレート・ノーベル・シュトラッセ10番
(86) 国際出願番号	PCT/EP2011/061171	(74) 代理人	100146318
(87) 国際公開番号	W02012/004208		弁理士 岩瀬 吉和
(87) 国際公開日	平成24年1月12日(2012.1.12)	(74) 代理人	100114188
審査請求日	平成26年7月1日(2014.7.1)		弁理士 小野 誠
(31) 優先権主張番号	61/362, 727	(74) 代理人	100119253
(32) 優先日	平成22年7月9日(2010.7.9)		弁理士 金山 賢教
(33) 優先権主張国	米国 (US)		
(31) 優先権主張番号	10168991.7		
(32) 優先日	平成22年7月9日(2010.7.9)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		

最終頁に続く

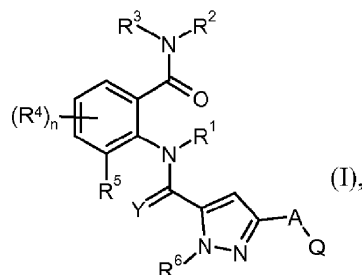
(54) 【発明の名称】 有害生物駆除剤としてのアントラニルアミド誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)のアントラニルアミド誘導体

【化1】



(式中、

R^1 は、水素、メチル、シクロプロピル、シアノメチル、メトキシメチル、メチルチオメチル、メチルスルフィニルメチルまたはメチルスルホニルメチルであり、

R^2 は、水素またはメチルであり、

R^3 は、水素であるか、各場合、単回または多回、同様にもしくは別様に置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、

$C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (alkylsulphimino)、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (alkylsulphimino) - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (alkylsulphimino) - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_3 - C_6$ - トリアルキルシリルから選択することができる、

R^3 はさらにまた、単回または多回、同様にもしくは別様に置換されていてもよい $C_3 - C_6$ - シクロアルキルであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (alkylsulphimino)、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (alkylsulphimino) - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (alkylsulphimino) - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_3 - C_6$ - トリアルキルシリルから選択することができる、

Y は、 O または S であり、

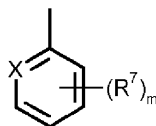
R^4 は、カルボキシル、メトキシメチル、メチルスルホニルオキシ、メトキシカルボニル、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、アセチル、トリフルオロアセチル、ヒドロキシエチル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニル、シクロプロピルメチルオキシカルボニル、シクロブチルメチルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、1, 3 - ジオキサソラン、ジメチル - 1, 3 - ジオキサソラン、1, 3 - ジオキサソラン、トリフルオロメチルピラゾールまたはトリアゾールであり、

n は、1 であり、

R^5 は、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロまたは $C_3 - C_6$ - トリアルキルシリル であり、

R^6 は、メチル または

【化 2】



であり、

R^7 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ - ハロアルキルであり、

m は、1 または 2 であり、

X は、 N 、 CH 、 CF 、 CCl または CBr であり、

A は、 $-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ または $-CH_2CH_2-$ であり、

Q は、 $Q - 36$ から $Q - 40$ の群からの一置換または多置換されていてもよい 5 員もしくは 6 員芳香族複素環または芳香族 9 員縮合二環式複素環系 $Q - 54$ から $Q - 56$ であり

10

20

30

40

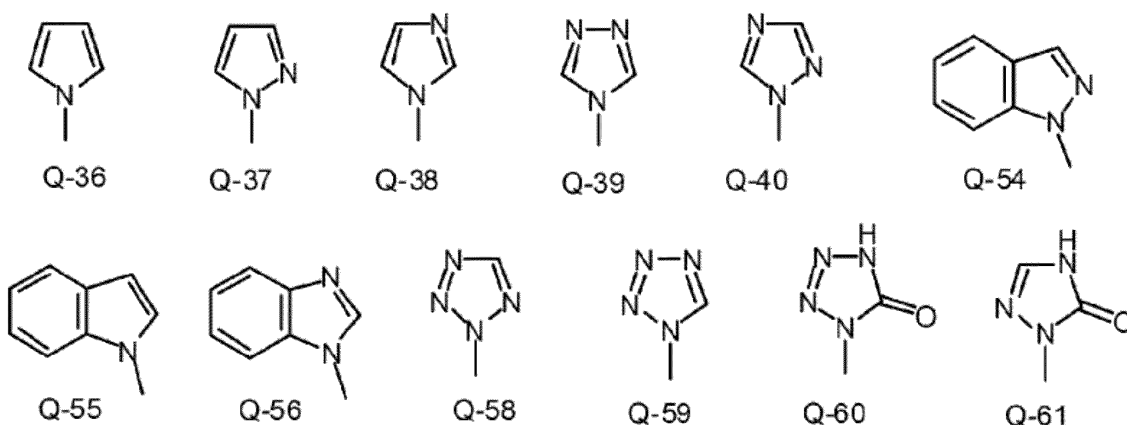
50

、この場合、前記置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 - C_3$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、OH、 $C_1 - C_2$ -アルコキシ、 $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシから選択することができる、

Qはまた、Q-36からQ-40、Q-58およびQ-59の群からの一置換または多置換されていてもよい5員もしくは6員芳香族複素環、芳香族9員縮合二環式複素環系Q-54からQ-56、および、5員芳香族複素環Q-60~Q-61であり、この場合、前記置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 - C_3$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ -アルコキシ、ハロゲン、CN、 NO_2 、OHおよび $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシから選択することができる、

または前記置換基は、それぞれ独立して、フェニルおよび5員もしくは6員芳香族複素環から選択することができる、この場合のフェニルまたは環は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよい)

【化3】



であって、N-オキシドおよび塩も含む一般式(I)の化合物。

【請求項2】

R^1 が、水素であり、

R^2 が、水素であり、

R^3 が、メチル、イソプロピルまたはシアノメチルであり、

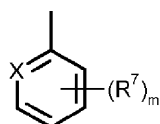
Yが、OまたはSであり、

R^4 が、カルボキシル、メトキシメチル、メチルスルホニルオキシ、メトキシカルボニル、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、アセチル、トリフルオロアセチル、ヒドロキシエチル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニル、シクロプロピルメチルオキシカルボニル、シクロブチルメチルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、1,3-ジオキサソラン、ジメチル-1,3-ジオキサソラン、1,3-ジオキサソラン、トリフルオロメチルピラゾールまたはトリアゾールであり、

R^5 が、メチルまたは塩素であり、

R^6 が、メチルまたは

【化4】



10

20

30

40

50

であり、

R⁷が、塩素であり、

mが、1であり、

Xが、N、CHまたはCCIであり、

Aが、-CH₂-であり、

Qが、Q-37、Q-40、Q-58およびQ-59の群からの、炭素原子において一、二もしくは三置換されていてもよい芳香族複素環、ならびに5員複素環Q-60であり、この場合、置換基は、それぞれ独立して、塩素、フッ素、ヨウ素、臭素、シアノ、トリフルオロメチルおよびペンタフルオロエチルから選択することができ、

10

または前記置換基は、それぞれ独立して、フェニルから選択することができ、この場合のフェニル環は、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-ハロアルコキシにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよく、

Qはまた、Q-37、Q-40、Q-58およびQ-59の群からの一置換または多置換されていてもよい芳香族複素環、ならびに5員複素環Q-60であり、この場合、前記置換基は、それぞれ独立して、塩素、フッ素、ヨウ素、CN、トリフルオロメチルおよびペンタフルオロエチルから選択することができ、

20

または前記置換基は、それぞれ独立して、フェニルから選択することができ、この場合のフェニル環は、塩素、フッ素、ヨウ素、臭素、CN、トリフルオロメチルおよびペンタフルオロエチルにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよい

ことを特徴とする、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項3】

Qが、Q58およびQ59であり、QがQ58である式(I)の化合物の、QがQ59である式(I)の化合物に対する比が、60:40から99:1である、請求項1または2に記載の一般式(I)の化合物の混合物。

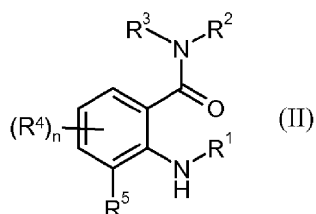
【請求項4】

請求項1または2に記載の一般式(I)の化合物(式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Qおよびnは、それぞれ、請求項1において定義したとおりであり、Yは、Oである)の調製方法であって、

30

(A)式(II)のアニリン

【化7】

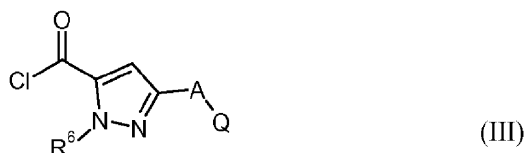


40

(この式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵およびnは、それぞれ、上で定義したとおりである)

と式(III)の塩化カルボニル

【化8】

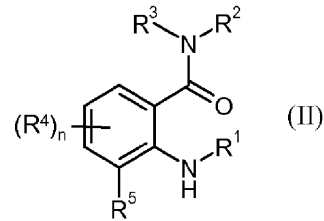


50

(この式中、 R^6 、AおよびQは、それぞれ、上で定義したとおりである)とを、酸結合剤の存在下で反応させること、

(B)式(II)のアニリン

【化9】

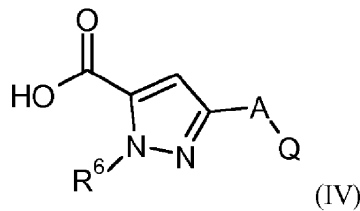


10

(この式中、A、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 およびnは、それぞれ、上で定義したとおりである)

と式(IV)のカルボン酸

【化10】



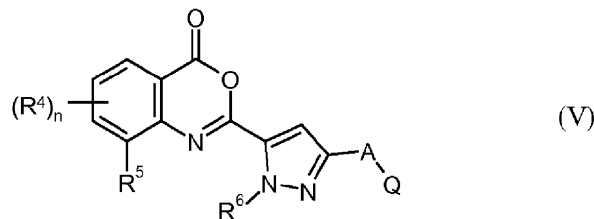
20

(この式中、 R^6 、AおよびQは、それぞれ、上で定義したとおりである)

とを、縮合剤の存在下で反応させること、または

(C)式(V)のベンゾオキサジノン

【化11】



30

(この式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 、A、Qおよびnは、それぞれ、上で定義したとおりである)

と式(XV)のアミン

【化12】



40

(この式中、 R^2 および R^3 は、それぞれ、上で定義したとおりである)

とを、希釈剤の存在下で反応させることにより、 R^1 が水素である式(I)のアントラニルアミドを合成すること、

を特徴とする方法。

【請求項5】

請求項1から3のいずれかに記載の式(I)の少なくとも1つの化合物と、または請求項1から3のいずれかに記載の式(I)の化合物の混合物と、少なくとも1つのさらなる

50

殺虫剤、殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤および/もしくは植物成長調節剤とを含む組成物。

【請求項 6】

請求項 1 から 3 のいずれかに記載の式 (I) の少なくとも 1 つの化合物と、または請求項 1 から 3 のいずれかに記載の式 (I) の化合物の混合物と、または請求項 5 に記載の組成物と、増量剤および/または界面活性剤とを含む、農薬組成物。

【請求項 7】

請求項 1 から 3 のいずれかに記載の一般式 (I) の少なくとも 1 つの化合物、または請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物の混合物、または請求項 5 または 6 に記載の組成物を、増量剤および/または界面活性剤と混合することを特徴とする、農薬組成物の製造方法。

10

【請求項 8】

動物有害生物を防除するための、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の一般式 (I) の化合物の、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の化合物の混合物の、または請求項 5 または 6 に記載の組成物の使用であって、人体の治療のための使用を除く使用。

【請求項 9】

請求項 1 から 3 のいずれかに記載の一般式 (I) の化合物、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の一般式 (I) の化合物の混合物、または請求項 5 または 6 に記載の組成物を、動物有害生物および/もしくはそれらの生息地ならびに/または種子に対して作用させることを特徴とする、動物有害生物の防除方法であって、人体の治療方法を除く方法。

20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規アントラニルアミド誘導体に、動物有害生物 (animal pests) を防除するための殺虫剤および殺ダニ剤としてのそれらの使用に、ならびにそれらの幾つかの調製方法に関する。

【背景技術】

【0002】

殺虫特性を有するアントラニル酸誘導体は、既に、例えば国際公開第 01 / 70671 号パンフレット、国際公開第 03 / 015519 号パンフレット、国際公開第 03 / 016284 号パンフレット、国際公開第 03 / 015518 号パンフレット、国際公開第 03 / 024222 号パンフレット、国際公開第 03 / 016282 号パンフレット、国際公開第 03 / 016283 号パンフレット、国際公開第 03 / 062226 号パンフレット、国際公開第 03 / 027099 号パンフレット、国際公開第 04 / 027042 号パンフレット、国際公開第 04 / 033468 号パンフレット、国際公開第 2004 / 046129 号パンフレット、国際公開第 2004 / 067528 号パンフレット、国際公開第 2005 / 118552 号パンフレット、国際公開第 2005 / 077934 号パンフレット、国際公開第 2005 / 085234 号パンフレット、国際公開第 2006 / 023783 号パンフレット、国際公開第 2006 / 000336 号パンフレット、国際公開第 2006 / 040113 号パンフレット、国際公開第 2006 / 111341 号パンフレット、国際公開第 2007 / 006670 号パンフレット、国際公開第 2007 / 024833 号パンフレット、国際公開第 2007 / 020877 号パンフレット、国際公開第 2007 / 144100 号パンフレット、国際公開第 2007 / 043677 号パンフレット、国際公開第 2008 / 126889 号パンフレット、国際公開第 2008 / 126890 号パンフレット、国際公開第 2008 / 126933 号パンフレットのような文献に記載されている。

30

40

【0003】

しかし、上に列挙した文献によって既知の活性成分は、狭い適用範囲しか示さないためであるにせよ、満足のいく殺虫もしくは殺ダニ活性を有さないためであるにせよ、施用上、多少の欠点を有する。

50

【 0 0 0 4 】

より良好な生物学的特性または環境特性、より広範な施用法、より良好な殺虫または殺ダニ活性、およびまた作物植物との良好な適合性を例とする、既知の化合物にまさる利点を有する新規アントラニル酸誘導体を、今般、見出した。本アントラニル酸誘導体は、効力、特に、防除が難しい昆虫に対する効力を強化するために、さらなる薬剤と併用することができる。

【 先行技術文献 】

【 特許文献 】

【 0 0 0 5 】

- 【 特許文献 1 】 国際公開第 0 1 / 7 0 6 7 1 号パンフレット 10
- 【 特許文献 2 】 国際公開第 0 3 / 0 1 5 5 1 9 号パンフレット
- 【 特許文献 3 】 国際公開第 0 3 / 0 1 6 2 8 4 号パンフレット
- 【 特許文献 4 】 国際公開第 0 3 / 0 1 5 5 1 8 号パンフレット
- 【 特許文献 5 】 国際公開第 0 3 / 0 2 4 2 2 2 号パンフレット
- 【 特許文献 6 】 国際公開第 0 3 / 0 1 6 2 8 2 号パンフレット
- 【 特許文献 7 】 国際公開第 0 3 / 0 1 6 2 8 3 号パンフレット
- 【 特許文献 8 】 国際公開第 0 3 / 0 6 2 2 2 6 号パンフレット
- 【 特許文献 9 】 国際公開第 0 3 / 0 2 7 0 9 9 号パンフレット
- 【 特許文献 1 0 】 国際公開第 0 4 / 0 2 7 0 4 2 号パンフレット
- 【 特許文献 1 1 】 国際公開第 0 4 / 0 3 3 4 6 8 号パンフレット 20
- 【 特許文献 1 2 】 国際公開第 2 0 0 4 / 0 4 6 1 2 9 号パンフレット
- 【 特許文献 1 3 】 国際公開第 2 0 0 4 / 0 6 7 5 2 8 号パンフレット
- 【 特許文献 1 4 】 国際公開第 2 0 0 5 / 1 1 8 5 5 2 号パンフレット
- 【 特許文献 1 5 】 国際公開第 2 0 0 5 / 0 7 7 9 3 4 号パンフレット
- 【 特許文献 1 6 】 国際公開第 2 0 0 5 / 0 8 5 2 3 4 号パンフレット
- 【 特許文献 1 7 】 国際公開第 2 0 0 6 / 0 2 3 7 8 3 号パンフレット
- 【 特許文献 1 8 】 国際公開第 2 0 0 6 / 0 0 0 3 3 6 号パンフレット
- 【 特許文献 1 9 】 国際公開第 2 0 0 6 / 0 4 0 1 1 3 号パンフレット
- 【 特許文献 2 0 】 国際公開第 2 0 0 6 / 1 1 1 3 4 1 号パンフレット
- 【 特許文献 2 1 】 国際公開第 2 0 0 7 / 0 0 6 6 7 0 号パンフレット 30
- 【 特許文献 2 2 】 国際公開第 2 0 0 7 / 0 2 4 8 3 3 号パンフレット
- 【 特許文献 2 3 】 国際公開第 2 0 0 7 / 0 2 0 8 7 7 号パンフレット
- 【 特許文献 2 4 】 国際公開第 2 0 0 7 / 1 4 4 1 0 0 号パンフレット
- 【 特許文献 2 5 】 国際公開第 2 0 0 7 / 0 4 3 6 7 7 号パンフレット
- 【 特許文献 2 6 】 国際公開第 2 0 0 8 / 1 2 6 8 8 9 号パンフレット
- 【 特許文献 2 7 】 国際公開第 2 0 0 8 / 1 2 6 8 9 0 号パンフレット
- 【 特許文献 2 8 】 国際公開第 2 0 0 8 / 1 2 6 9 3 3 号パンフレット

【 発明の概要 】

【 課題を解決するための手段 】

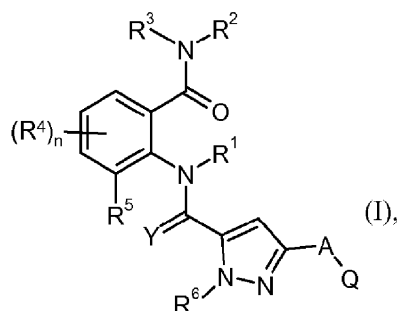
【 0 0 0 6 】

したがって、本発明は、式 (I) の新規アントラニルアミド誘導体

【 0 0 0 7 】

40

【化1】



10

(式中、

R^1 は、水素、アミノ、ヒドロキシルであるか、各場合、単回または多回、同様にもしくは別様に置換されていてもよい $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニルもしくは $C_3 - C_6$ -シクロアルキルであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$ -アルコキシ)カルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルアミノ、ジ-($C_1 - C_4$ -アルキル)アミノ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルアミノおよび($C_1 - C_4$ -アルキル) $C_3 - C_6$ -シクロアルキルアミノから選択することができ、

20

R^2 は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルアミノ、ジ-($C_1 - C_4$ -アルキル)アミノ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルアミノ、 $C_2 - C_6$ -アルコキシカルボニルまたは $C_2 - C_6$ -アルキルカルボニルであり、

R^3 は、水素であるか、各場合、単回または多回、同様にもしくは別様に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、 $C_2 - C_6$ -アルキニルであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホイミノ(alkyl sulphimino)、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホイミノ(alkyl sulphimino)- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホイミノ(alkyl sulphimino)- $C_2 - C_5$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホキシミノ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホキシミノ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホキシミノ- $C_2 - C_5$ -アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ -アルキルカルボニルおよび $C_3 - C_6$ -トリアルキルシリルから選択することができ、

30

R^3 はまた、各場合、単回または多回、同様にもしくは別様に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、 $C_2 - C_6$ -アルキニルであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、アミノ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルアミノまたは5員もしくは6員芳香族複素環から選択することができ、

40

R^3 はさらにまた、 $C_3 - C_{12}$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_{12}$ -シクロアルキル- $C_1 - C_6$ -アルキルおよび $C_4 - C_{12}$ -ビスシクロアルキルであり、この場合の置換基は、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、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホイミノ(alkyl sulphimino)、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホイミノ(alkyl sulphimino)- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホイミノ(alkyl sulphimino)- $C_2 - C_5$ -アルキルカルボニル、 $C_1 -$

50

C₄-アルキルスルホキシミノ、C₁-C₄-アルキルスルホキシミノ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルホキシミノ-C₂-C₅-アルキルカルボニル、C₂-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルキルカルボニル、C₃-C₆-トリアルキルシリルまたは5員もしくは6員芳香族複素環から選択することができ、

R²およびR³は、2から6個の炭素原子によって互いに連結されて環を形成することがあり、この環は、加えて、さらなる窒素、硫黄または酸素原子を含有していてもよく、およびC₁-C₂-アルキル、ハロゲン、シアノ、アミノまたはC₁-C₂-アルコキシによって一から四置換されていてもよく、

R²、R³は一緒に、=S(C₁-C₄-アルキル)₂、=S(O)(C₁-C₄-アルキル)₂にもなり、

Yは、OまたはSであり、

R⁴は、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、OCN、SCN、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₄-アルキルカルボニルアミノ、N-メトキシ-N-メチルアミノ、ヒドロキシイミノ、(C₁-C₄-アルキル)ヒドロキシイミノ、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルカルボニル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキルカルボニル、C₁-C₄-アルキルカルボニルオキシ、アミノカルボニル、C₁-C₄-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁-C₄-アルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₄-アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル、C₁-C₄-アルキルアミノスルホニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノスルホニル、C₁-C₄-アルキルスルホキシミノまたは3員から6員飽和、部分飽和もしくは芳香族環であり、前記芳香族環は、O、SおよびNの群からの1から3個のヘテロ原子を含有していてもよく、ならびにハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-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-アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、C₁-C₄-アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-アルキルカルボニル、C₁-C₄-アルキルカルボニルオキシ、アミノカルボニル、C₁-C₄-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁-C₄-アルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノチオカルボニル、C₃-C₆-シクロアルキルアミノ、C₁-C₄-アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル、C₁-C₄-アルキルアミノスルホニルまたはC₁-C₄-ジアルキルアミノスルホニルによって一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよく、

R⁴は、加えて、YがSである場合には以下の定義を有し：

R⁴は、加えて、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、SF₅、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、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)イミノもしくはC₃-C₆-トリアルキルシリルであること、または

10

20

30

40

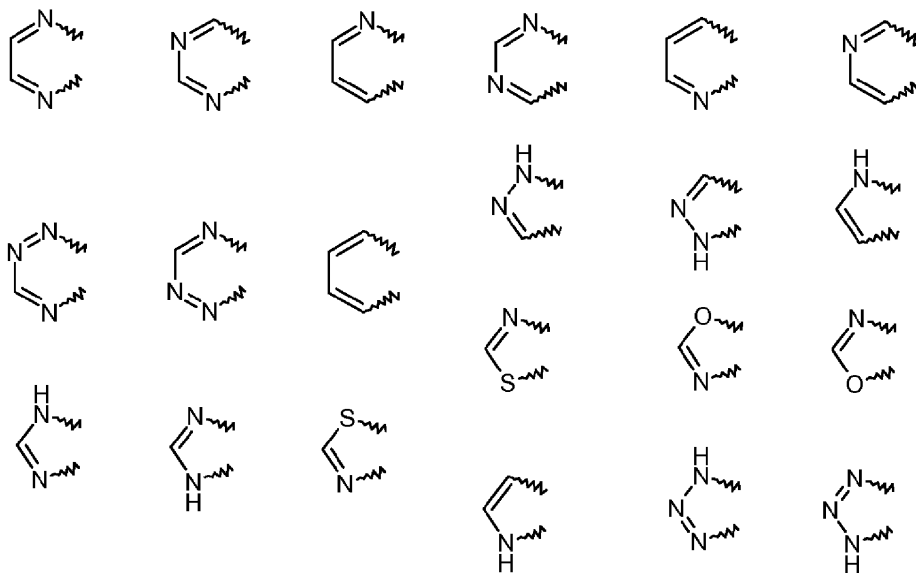
50

2つのR⁴は、加えて、隣接する炭素原子によって環を形成し、この環は、-(CH₂)₃-、-(CH₂)₄-、-(CH₂)₅-、-(CH=CH-)₂-、-OCH₂O-、-O(CH₂)₂O-、-OCF₂O-、-(CF₂)₂O-、-O(CF₂)₂O-、-(CH=CH-CH=N)-もしくは-(CH=CH-N=CH)-であること、

2つのR⁴はまた、加えて、隣接する炭素原子によって下記縮合環を形成し、これらの環は、一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよく、この場合の置換基は、それぞれ独立して、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、ハロゲン、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ(C₁-C₆-アルキル)、C₁-C₄-アルキルスルフィニル(C₁-C₆-アルキル)、C₁-C₄-アルキルスルホニル(C₁-C₆-アルキル)、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノおよびC₃-C₆-シクロアルキルアミノから選択することができること

【0008】

【化2】



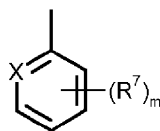
nは、0から3であり、

R⁵は、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、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、ハロゲン、シアノ、ニトロまたはC₃-C₆-トリアルキルシリルであり、

R⁶は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニルまたは

【0009】

【化3】



であり、

R⁶はまた、C₃-C₆-シクロアルコキシであり、

10

20

30

40

50

R⁷ は、独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオまたはC₁ - C₄ - ハロアルキルチオであり、

m は、0 から 4 であり、

X は、N、CH、CF、CCl、CBr または Cl であり、

A は、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂OCH₂-、-CH₂S-、-CH₂SC
H₂-、-CH₂N(C₁ - C₆ - アルキル)-、-CH₂N(C₁ - C₆ - アルキル)
CH₂-、-CH[CO₂(C₁ - C₆ - アルキル)]-、-CH(CN)-、-CH(C
C₁ - C₆ - アルキル)-、-C(ジ-C₁ - C₆ - アルキル)-、-CH₂CH₂-、
-C=NO(C₁ - C₆ - アルキル)- であり、

Q は、5 員もしくは 6 員芳香族複素環または芳香族 8 員、9 員もしくは 10 員縮合二環式複素環系であり、この場合、前記環または環構造は、一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよく、および前記置換基は、それぞれ独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、CO₂H、CO₂NH₂、NO₂、OH、C₁ - C₄ - アルコキシ、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、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 - C₆ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₆ - アルコキシ)カルボニル、(C₁ - C₆ - アルキル)アミノカルボニル、ジ-(C₁ - C₄ - アルキル)アミノカルボニル、トリ-(C₁ - C₂)アルキルシリル、(C₁ - C₄ - アルキル)(C₁ - C₄ - アルコキシ)イミノから選択することができ、

Q はまた、5 員もしくは 6 員芳香族複素環もしくは複素環または芳香族 8 員、9 員もしくは 10 員縮合二環式複素環系であり、この場合、前記環または環構造は、一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよく、および前記置換基は、それぞれ独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、CO₂H、CO₂NH₂、NO₂、OH、C₁ - C₄ - アルコキシ、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、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 - C₆ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₆ - アルコキシ)カルボニル、(C₁ - C₆ - アルキル)アミノカルボニル、ジ-(C₁ - C₄ - アルキル)アミノカルボニル、トリ-(C₁ - C₂)アルキルシリル、(C₁ - C₄ - アルキル)(C₁ - C₄ - アルコキシ)イミノから選択することができ、

または前記置換基は、それぞれ独立して、フェニルおよび 5 員もしくは 6 員芳香族複素環から選択することができ、この場合のフェニルまたは環は、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、OH、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよい)

であって、N - オキシドおよび塩も含む該一般式 (I) の化合物を提供する。

【0010】

最後に、式 (I) の本発明の化合物は、非常に良好な殺虫特性を有すること、および昆

10

20

30

40

50

虫などの望ましくない有害生物を防除するため作物保護にも材料の保護にも使用できることを見出した。

【0011】

本発明の化合物は、種々の可能な異性体形態の混合物として、特に、立体異体の混合物、例えばEおよびZ異性体、トレオおよびエリトロ異性体、ならび光学異性体の混合物、しかしまた、適宜、互変異性体の混合物として存在してもよい。前記E異性体とZ異性体の両方を特許請求し、前記トレオおよびエリトロ異性体、ならびにまた光学異性体、これらの異性体の任意の混合物、ならびにまた可能な互変異性体形態も特許請求する。

【発明を実施するための形態】

【0012】

本発明のアントラニルアミドは、概括的に言うと、式(I)によって定義される。上に明記したおよび下で明記する式についての好ましいラジカルを定義を下に示す。これらの定義は、式(I)の最終生成物に当てはまり、同じくすべての中間体にも当てはまる。

【0013】

R¹は、好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、シアノ(C₁-C₆-アルキル)、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-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-アルキルまたはC₁-C₄-アルキルスルホニル-C₁-C₄-アルキルである。

【0014】

R¹は、さらに好ましくは、水素、メチル、シクロプロピル、シアノメチル、メトキシメチル、メチルチオメチル、メチルスルフィニルメチルまたはメチルスルホニルメチルである。

【0015】

R¹は、さらにいっそう好ましくは、水素である。

【0016】

R²は、好ましくは、水素またはC₁-C₆-アルキルである。

【0017】

R²は、さらに好ましくは、水素またはメチルである。

【0018】

R²は、さらにいっそう好ましくは、水素である。

【0019】

R³は、好ましくは、水素であるか、各場合、単回または多回、同様にもしくは別様に置換されていてもよいC₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C₁-C₆-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-アルキルスルホイミノ(alkylsulphimino)、C₁-C₄-アルキルスルホイミノ(alkylsulphimino)-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルホイミノ(alkylsulphimino)-C₂-C₅-アルキルカルボニル、C₁-C₄-アルキルスルホキシミノ、C₁-C₄-アルキルスルホキシミノ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルホキシミノ-C₂-C₅-アルキルカルボニル、C₂-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルキルカルボニルおよびC₃-C₆-トリアルキルシリルから選択することができる。

【0020】

R³はまた、好ましくは、C₃-C₁₂-シクロアルキルおよびC₄-C₁₀-ビスシクロアルキルであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₄-ア

10

20

30

40

50

ルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*)、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*) - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*) - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_3 - C_6$ - トリアルキルシリルから選択することができる。

【0021】

R^3 は、さらに好ましくは、水素であるか、各場合、単回または多回、同様にもしくは別様に置換されていてもよい $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*)、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*) - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*) - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_3 - C_6$ - トリアルキルシリルから選択することができる。

【0022】

R^3 はまた、さらに好ましくは、単回または多回、同様にもしくは別様に置換されていてもよい $C_3 - C_6$ - シクロアルキルであり、この場合の置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*)、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*) - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホイミノ (*alkyl sulphimino*) - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホキシミノ - $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_3 - C_6$ - トリアルキルシリルから選択することができる。

【0023】

R^3 は、さらにいっそう好ましくは、 $C_1 - C_4$ - アルキル (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*-ブチルもしくは *tert*-ブチル) またはシアノ - $C_1 - C_3$ - アルキル (シアノメチル、1-シアノエチル、2-シアノエチル、1-シアノ-*n*-プロピル、2-シアノ-*n*-プロピル、3-シアノ-*n*-プロピル、1-シアノイソプロピル、2-シアノイソプロピル) である。

【0024】

R^3 は、特に好ましくは、メチル、イソプロピルまたはシアノメチルである。

【0025】

Y は、好ましくは、およびさらに好ましくは、O または S である。

【0026】

Y は、さらにいっそう好ましくは、O である。

【0027】

Y は、同じくさらにいっそう好ましくは、S である。

10

20

30

40

50

【0028】

R⁴は、好ましくは、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、OCN、SCN、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₄-アルキルカルボニルアミノ、N-メトキシ-N-メチルアミノ、ヒドロキシイミノ、(C₁-C₄-アルキル)ヒドロキシイミノ、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルカルボニル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキルカルボニル、C₁-C₄-アルキルカルボニルオキシ、アミノカルボニル、C₁-C₄-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁-C₄-アルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₄-アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル、C₁-C₄-アルキルアミノスルホニル、C₁-C₄-ジアルキルアミノスルホニル、C₁-C₄-アルキルスルホキシミノまたは3員から6員飽和、部分飽和もしくは芳香族環であり、前記環は、O、SおよびNの群からの1から3個のヘテロ原子を含有していてもよく、ならびにハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₂-アルコキシ、C₁-C₂-ハロアルコキシ、C₁-C₂-アルキルチオ、C₁-C₂-アルキルスルフィニル、C₁-C₂-アルキルスルホニル、C₁-C₂-アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₂-ハロアルキルチオ、C₁-C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₂-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₂-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₂-アルキル)アミノ、C₁-C₂-アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₂-アルコキシカルボニル、C₁-C₂-アルキルカルボニル、C₁-C₂-アルキルカルボニルオキシ、アミノカルボニル、C₁-C₂-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₂-ジアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁-C₂-アルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₂-ジアルキルアミノチオカルボニル、C₃-C₆-シクロアルキルアミノ、C₁-C₄-アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル、C₁-C₄-アルキルアミノスルホニルまたはC₁-C₄-ジアルキルアミノスルホニルによって一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよい。

10

20

【0029】

R⁴は、さらに好ましくは、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、C₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-アルキルチオ-C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₂-アルキルカルボニルアミノ、ヒドロキシイミノ、(C₁-C₃-アルキル)ヒドロキシイミノ、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₂-アルキルカルボニル、ヒドロキシ-C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、C₁-C₂-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₂-ジアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、C₁-C₂-アルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₂-ジアルキルアミノチオカルボニル、C₁-C₂-アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル、C₁-C₂-アルキルアミノスルホニル、C₁-C₂-ジアルキルアミノスルホニル、C₁-C₂-アルキルスルホキシミノまたは3員から6員飽和、部分飽和もしくは芳香族環であり、前記環は、O、SおよびNの群からの1から3個のヘテロ原子を含有していてもよく、ならびにハロゲン、シアノ、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₂-アルコキシ、C₁-C₂-ハロアルコキシ、C₁-C₂-アルキルチオ、C₁-C₂-アルキルスルフィニル、C₁-C₂-アルキルスルホニル、C₁-C₂-ハロアルキルチオ、C₁-C₂-ハロアルキルスルフィニルまたはC₁-C₂-ハロアルキルスルホニルによって一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよい。

30

40

【0030】

R⁴は、さらにいっそう好ましくは、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、メトキシメチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルオキシ、メチルカルボニルアミノ、ヒドロ

50

キシイミノ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、アセチル、トリフルオロアセチル、ヒドロキシエチル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニル、メチルスルホニルアミノ、アミノスルホニル、メチルアミノスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、メチルスルホキシミノ、シクロプロピルメチルオキシカルボニル、シクロブチルメチルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、1,3-ジオキサン、ジメチル-1,3-ジオキサン、1,3-ジオキソラン、トリフルオロメチルピラゾール、トリアゾールであるか、またはフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシもしくはトリフルオロメトキシにより置換されていてもよい、シクロプロピル、シクロブチル、フェニル、フラン、チオフエン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、ピリジン、ピリミジン、アゼチジン、オキセタン、チエタン、ピロリジン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ピロリドン、イミダゾリドン、トリアゾリノン、テトラゾリノン、チアゾロンもしくはオキサゾロンである。

10

【0031】

R⁴は、特に好ましくは、カルボキシル、メトキシメチル、メチルスルホニルオキシ、メトキシカルボニル、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、アセチル、トリフルオロアセチル、ヒドロキシエチル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニル、シクロプロピルメチルオキシカルボニル、シクロブチルメチルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、1,3-ジオキサン、ジメチル-1,3-ジオキサン、1,3-ジオキソラン、トリフルオロメチルピラゾールまたはトリアゾールである。

20

【0032】

R⁴は、加えて、YがSである場合には以下の好ましい、さらに好ましい、さらにいっそう好ましいおよび特に好ましい定義を有する：

R⁴は、加えて、好ましくは、水素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオまたはC₁-C₄-ハロアルキルチオである。

30

【0033】

好ましくは、2つの隣接するR⁴ラジカルが、加えて、-(CH₂)₃-、-(CH₂)₄-、-(CH₂)₅-、-(CH=CH-)₂-、-OCH₂O-、-O(CH₂)₂O-、-OCF₂O-、-(CF₂)₂O-、-O(CF₂)₂O-、-(CH=CH-CH=N)-もしくは-(CH=CH-N=CH)-にもなる。

【0034】

R⁴は、加えてさらに好ましくは、水素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、ハロゲン、シアノまたはC₁-C₂-ハロアルコキシである。

【0035】

さらに好ましくは、2つの隣接するR⁴ラジカルが、加えて、-(CH₂)₄-、-(CH=CH-)₂-、-O(CH₂)₂O-、-O(CF₂)₂O-、-(CH=CH-CH=N)-または-(CH=CH-N=CH)-にもなる。

40

【0036】

R⁴は、加えてさらに好ましくは、水素、メチル、トリフルオロメチル、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素またはトリフルオロメトキシである。さらにいっそう好ましくは、2つの隣接するR⁴ラジカルが、加えて、-(CH₂)₄-または-(CH=CH-)₂-にもなる。

【0037】

R⁴は、加えて特に好ましくは、塩素または臭素であり、

R⁴はまた、加えて、特に好ましくは、ヨウ素またはシアノである。特に好ましくは、2つの隣接するR⁴ラジカルが、加えて、-(CH=CH)₂-にもなる。

50

【0038】

R⁵は、好ましくは、C₁-C₄-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-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、C₁-C₄-アルコキシ、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、ハロゲン、シアノ、ニトロまたはC₃-C₆-トリアルキルシリルである。

【0039】

R⁵は、さらに好ましくは、C₁-C₄-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-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、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロまたはC₃-C₆-トリアルキルシリルである。

10

【0040】

R⁵は、さらにいっそう好ましくは、メチル、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。

【0041】

R⁵は、特に好ましくは、メチルまたは塩素である。

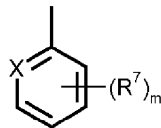
【0042】

R⁶は、好ましくは、C₁-C₆-アルキルまたは

20

【0043】

【化4】



であり、

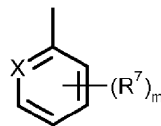
R⁶はまた、好ましくは、C₃-C₆-シクロアルコキシであり、

30

R⁶は、さらに好ましくは、メチルまたは

【0044】

【化5】



である。

【0045】

R⁷は、独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₄-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-ハロアルキルスルホニルまたは(C₁-C₄-アルキル)C₁-C₄-アルコキシミノであり、

40

R⁷は、独立して、さらに好ましくは、水素、ハロゲンまたはC₁-C₄-ハロアルキルであり、

R⁷は、さらにいっそう好ましくは、フッ素、塩素または臭素であり、

R⁷は、特に好ましくは、塩素である。

【0046】

mは、好ましくは、1、2または3であり、

50

mは、さらに好ましくは、1または2であり、
mは、さらにいっそう好ましくは、1である。

【0047】

Xは、好ましくは、N、CH、CF、CCl、CBrまたはClであり、
Xは、さらに好ましくは、N、CH、CF、CClまたはCBrであり、
Xは、さらにいっそう好ましくは、N、CClまたはCHである。

【0048】

Aは、好ましくは、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2S-$ 、
 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2N(C_1-C_6-アルキル)-$ 、 $-CH_2N(C_1-C_6$
 $-アルキル)CH_2-$ 、 $-CH(CN)-$ 、 $-CH(C_1-C_6-アルキル)-$ 、 $-C($
ジ- $C_1-C_6-アルキル)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-C=NO(C_1-C_6-アルキル$
 $)-$ であり、

Aは、さらに好ましくは、 $-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)$ 、 $C(CH_3)_2$ または CH_2
 CH_2 であり、

Aはまた、さらに好ましくは、 $-CH(CN)-$ であり、

Aは、さらにいっそう好ましくは、 CH_2 または $CH(CH_3)$ であり、

Aは、特に好ましくは、 CH_2 である。

【0049】

Qは、好ましくは、Q-1からQ-53の群からの一もしくは多置換されていてもよい
5員もしくは6員芳香族複素環、または芳香族9員縮合二環式複素環系Q-54からQ-
56であり、この場合、置換基は、それぞれ独立して、 $C_1-C_3-アルキル$ 、 C_1-C_3
 $-ハロアルキル$ 、 $C_1-C_2-アルコキシ$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ
および $C_1-C_2-ハロアルコキシ$ から選択することができ、

Qはまた、好ましくは、Q-1からQ-53およびQ-58からQ-59の群からの一
もしくは多置換されていてもよい5員もしくは6員芳香族複素環、芳香族9員縮合二環式
複素環系Q-54からQ-56、および5員複素環Q-60からQ-61であり、この場
合、置換基は、それぞれ独立して、 $C_1-C_3-アルキル$ 、 $C_1-C_3-ハロアルキル$ 、
 $C_1-C_2-アルコキシ$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロおよび C_1-C_2-
ハロアルコキシから選択することができ、

または置換基は、それぞれ独立して、フェニルおよび5員もしくは6員芳香族複素環か
ら選択することができ、この場合のフェニルまたは環は、 $C_1-C_6-アルキル$ 、 C_2-
 $C_6-アルケニル$ 、 $C_2-C_6-アルキニル$ 、 $C_3-C_6-シクロアルキル$ 、 C_1-C_6
 $-ハロアルキル$ 、 $C_2-C_6-ハロアルケニル$ 、 $C_2-C_6-ハロアルキニル$ 、 C_3-C
 $6-ハロシクロアルキル$ 、ハロゲン、CN、 NO_2 、OH、 $C_1-C_4-アルコキシ$ 、 C
 $1-C_4-ハロアルコキシ$ により一置換または同様にもしくは別様に多置換されていても
よい。

【0050】

Qは、さらに好ましくは、Q-36からQ-40の群からの一もしくは多置換されてい
てもよい5員もしくは6員芳香族複素環、または芳香族9員縮合二環式複素環系Q-54
からQ-56であり、この場合、置換基は、それぞれ独立して、 $C_1-C_3-アルキル$ 、
 $C_1-C_3-ハロアルキル$ 、 $C_1-C_2-アルコキシ$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル
、ニトロおよび $C_1-C_2-ハロアルコキシ$ から選択することができる。

【0051】

Qはまた、さらに好ましくは、Q-36からQ-40およびQ-58からQ-59の群
からの一もしくは多置換されていてもよい5員もしくは6員芳香族複素環、芳香族9員縮
合二環式複素環系Q-54からQ-56、および5員複素環Q-60からQ-61であり
、この場合、置換基は、それぞれ独立して、 $C_1-C_3-アルキル$ 、 $C_1-C_3-ハロアル$
 $キル$ 、 $C_1-C_2-アルコキシ$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロおよび C_1
 $-C_2-ハロアルコキシ$ から選択することができ、

または置換基は、それぞれ独立して、フェニルおよび5員もしくは6員芳香族複素環か

10

20

30

40

50

ら選択することができ、この場合のフェニルまたは環は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよい。

【0052】

Qは、さらにいっそう好ましくは、Q - 37、Q - 38、Q - 39、Q - 40、Q - 58およびQ - 59の群からの一または多置換されていてもよい芳香族複素環、および5員複素環Q - 60であり、この場合、置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ

10

ル、ニトロおよび $C_1 - C_2$ - ハロアルコキシから選択することができ、
または置換基は、それぞれ独立して、フェニルおよび5員もしくは6員芳香族複素環から選択することができ、この場合のフェニルまたは環は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよい。

【0053】

Qはまた、さらにいっそう好ましくは、Q - 37、Q - 38、Q - 39、Q - 40、Q - 58およびQ - 59の群からの一または多置換されていてもよい芳香族複素環、および5員複素環Q - 60であり、この場合、置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、ニトロまたは $C_1 - C_2$ - ハロアルコキシから選択することができ、

20

または置換基は、それぞれ独立して、フェニルおよび5員もしくは6員芳香族複素環から選択することができ、この場合のフェニルまたは環は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよく、

Qは、特に好ましくは、炭素原子が一、二または三置換されていてもよい芳香族複素環Q - 37、Q - 40、Q - 58およびQ - 59、ならびに5員複素環Q - 60であり、この場合、置換基は、それぞれ独立して、塩素、フッ素、ヨウ素、臭素、シアノ、トリフルオロメチルおよびペンタフルオロエチルから選択することができ、

30

または置換基は、それぞれ独立して、フェニルから選択することができ、この場合のフェニル環は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシにより一置換または同様にもしくは別様に多置換されていてもよく、

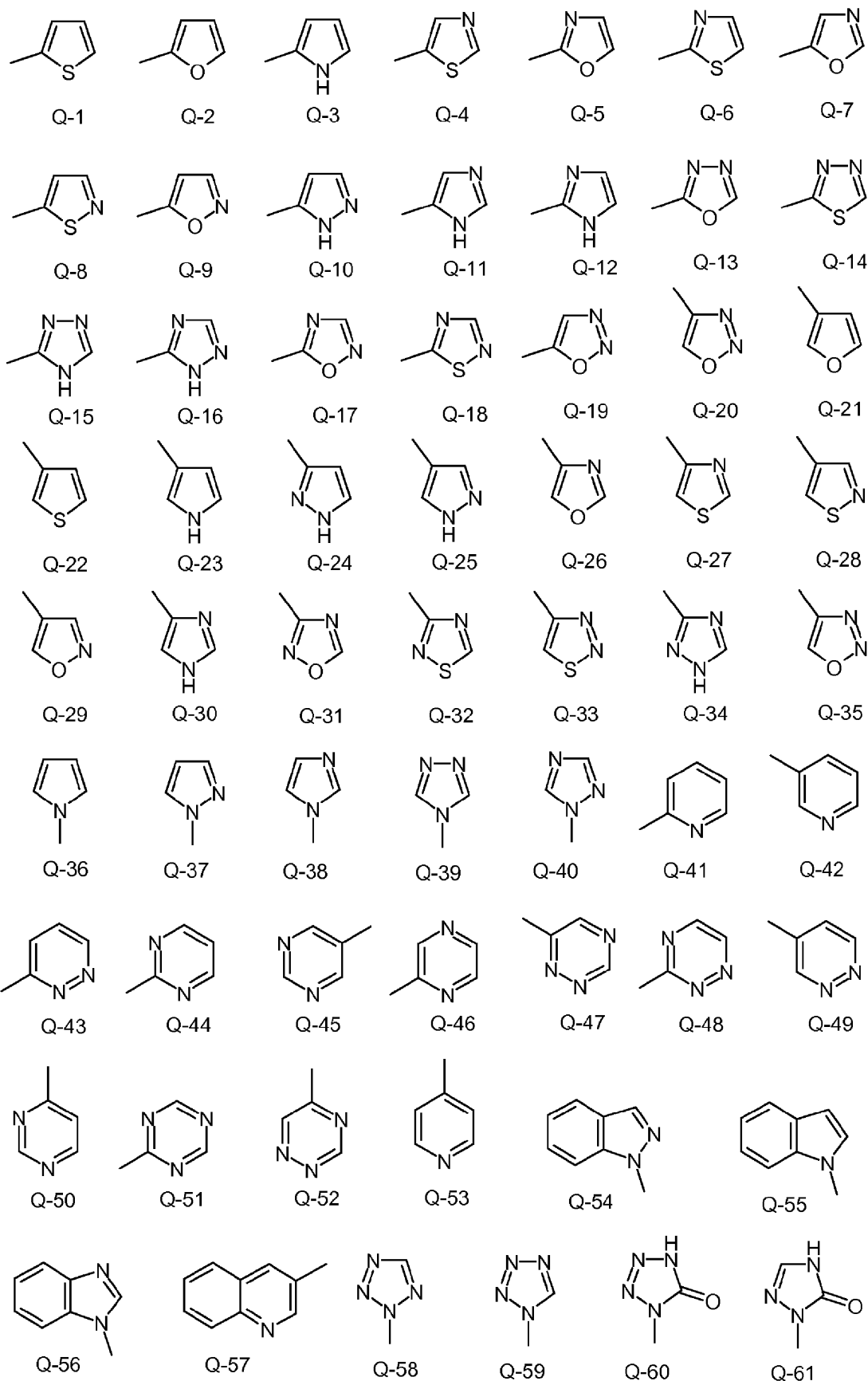
Qはまた、特に好ましくは、Q - 37、Q - 40、Q - 58およびQ - 59の群からの一または多置換されていてもよい芳香族複素環、および5員複素環Q - 60であり、この場合、置換基は、それぞれ独立して、塩素、フッ素、ヨウ素、シアノ、トリフルオロメチルおよびペンタフルオロエチルから選択することができ、

40

または置換基は、それぞれ独立して、フェニルから選択することができ、この場合のフェニル環は、塩素、フッ素、ヨウ素、臭素、シアノ、トリフルオロメチルおよびペンタフルオロエチルにより一置換または同様もしくは別様に多置換されていてもよい。

【0054】

【化6】



10

20

30

40

上に列挙した環または環系は、独立して、加えてオキソ、チオ、(=O)=NH、(=O)=N-CN、(=O)₂により置換されていてもよい。例としては、テトラヒドロチオフェンジオキソド、イミダゾリドンが挙げられる。前記環または環系Qは、好ましくは、加えて(=O)または(=O)₂により置換されている。

50

【 0 0 5 5 】

このとき、環炭素原子上の置換基としてのオキシ基は、例えば、複素環内のカルボニル基である。結果として、ラクトンおよびラクタムも好ましくは含まれる。前記オキシ基は、環ヘテロ原子に見出されることもあり、前記環ヘテロ原子は、例えばNおよびSの場合、異なる酸化状態で存在することがあり、その場合、前記オキシ基は、例えば該複素環内の二価 - N (O) - 、 - S (O) - (同じく、簡単に S O) および - S (O) ₂ - (同じく、簡単に S O ₂) 基を構成することがある。 - N (O) - および - S (O) - 基の場合には、それぞれの場合、両方のエナンチオマーを含む。

【 0 0 5 6 】

オキシ基以外の置換基が、複素環上のヘテロ原子に、例えば、基本骨格の窒素原子上の水素原子が置換されているときにはその窒素原子に、結合されていることもある。窒素原子の場合、およびまた他のヘテロ原子の、例えば硫黄原子の場合、第四級アンモニウム化合物またはスルホニウム化合物を形成するさらなる置換もあり得る。

10

【 0 0 5 7 】

上述の一般的または好ましいラジカルの定義または実例は、必要に応じて互いに組み合わせることができる、すなわち、それぞれの範囲および好ましい範囲間の組み合わせを含む。それらは、最終生成物にも、相応じて前駆体および中間体にも当てはまる。

【 0 0 5 8 】

本発明によると、上に好ましいものとして (好ましく) 列挙した定義の組み合わせが存在する式 (I) の化合物が好ましい。

20

【 0 0 5 9 】

本発明によると、上にさらに好ましいものとして列挙した定義の組み合わせが存在する式 (I) の化合物は、特に好ましい。

【 0 0 6 0 】

本発明によると、上にさらにいっそう好ましいものとして列挙した定義の組み合わせが存在する式 (I) の化合物は、非常に特に好ましい。

【 0 0 6 1 】

式 (I) の化合物は、特に、異なる位置異性体の形態で、例えば、定義 Q 6 2 もしくは Q 6 3 を有する化合物の混合物の形態で、または Q 5 8 と Q 5 9 の混合物の形態で、存在し得る。したがって、Q が、Q 6 2 および Q 6 3、でなければ Q 5 8 および Q 5 9 として定義される式 (I) の化合物の混合物もまた本発明に含まれ、それらの化合物は、異なる混合比で存在し得る。6 0 : 4 0 から 9 9 : 1 である、Q ラジカルが Q 6 2 または Q 5 8 である式 (I) の化合物の、Q ラジカルが Q 6 3 または Q 5 9 である式 (I) の化合物に対する混合比が好ましく、7 0 : 3 0 から 9 7 : 3 がさらに好ましく、8 0 : 2 0 から 9 5 : 5 がさらにいっそう好ましい。Q が Q 6 2 または Q 5 8 である式 (I) の化合物の、Q が Q 6 3 または Q 5 9 である式 (I) の化合物に対する以下の混合比が特に好ましい：8 0 : 2 0 ; 8 1 : 1 9 ; 8 2 : 1 8 ; 8 3 : 1 7 ; 8 4 : 1 6 ; 8 5 : 1 5、8 6 : 1 4 ; 8 7 : 1 3 ; 8 8 : 1 2 ; 8 9 : 1 1 ; 9 0 : 1 0、9 1 : 9 ; 9 2 : 8 ; 9 3 : 7 ; 9 6 : 6 ; 9 5 : 5。

30

【 0 0 6 2 】

調製方法

加えて、式 (I) のアントラニルアミドは下記の方法のうちの 1 つによって得られることを見出した。

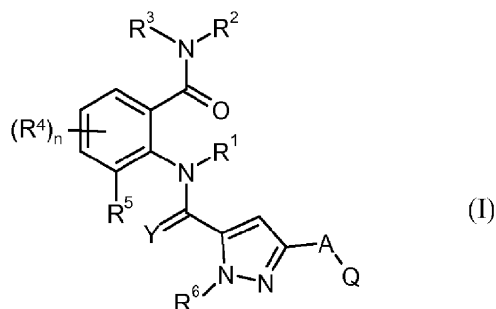
40

【 0 0 6 3 】

式 (I) のアントラニルアミド

【 0 0 6 4 】

【化7】



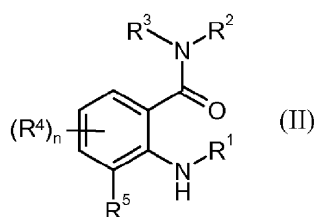
10

(式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Qおよびnは、それぞれ、上で定義したとおりであり、ならびにYは、Oである)は、

(A)式(II)のアニリン

【0065】

【化8】

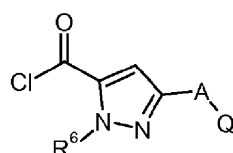


20

(この式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵およびnは、それぞれ、上で定義したとおりである)と式(III)の塩化カルボニル

【0066】

【化9】



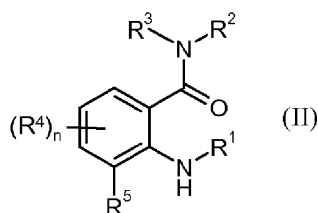
30

(この式中、R⁶、AおよびQは、それぞれ、上で定義したとおりである)とを、酸結合剤の存在下で反応させることによって得られ、

(B)式(II)のアニリン

【0067】

【化10】



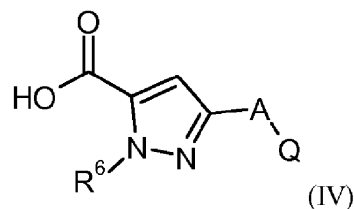
40

(この式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵およびnは、それぞれ、上で定義したとおりである)

と式(IV)のカルボン酸

【0068】

【化 1 1】

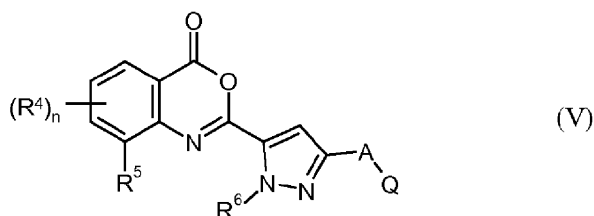


(この式中、 R^6 、AおよびQは、それぞれ、上で定義したとおりである)
 とを、縮合剤の存在下で反応させることによって得られ、または
 (C)式(V)のベンゾオキサジノン

10

【0069】

【化 1 2】



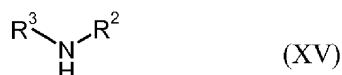
(この式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 、A、Qおよびnは、それぞれ、上で定義したとおりで
 ある)

20

と式(XV)のアミン

【0070】

【化 1 3】



(この式中、 R^2 および R^3 は、それぞれ、上で定義したとおりである)

とを、希釈剤の存在下で反応させることにより、 R^1 が水素である式(I)のアントラ
 ニルアミドを合成することによって得られる。

30

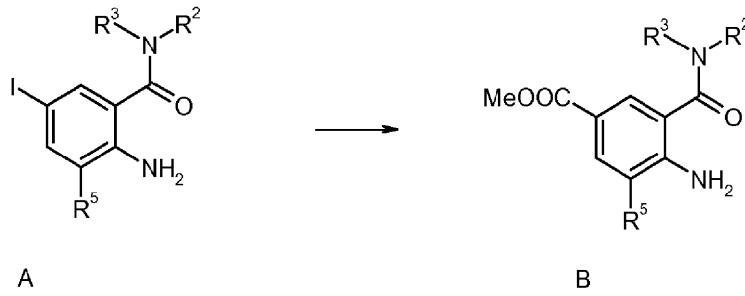
【0071】

式Bのアニリンは、新規である。それらは、下記の反応スキーム(このスキームにおけ
 る R^2 、 R^3 および R^5 は、それぞれ、上で定義したとおりである)に従って、式Aの化
 合物から得ることができる。式Aの化合物は公知である(例えば、国際公開第2009/
 061991号パンフレット)。AからBへの転化は、公知の方法によって、オートクレ
 ープの中で、適する触媒、例えばメタノール中のピス(トリフェニルホスフィン)パラジ
 ウムジクロリド、の存在下で一酸化炭素を用いて行うことができる(例えば、Bioor
 ganic & Medicinal Chemistry Letters、16(1
)、44-48; 2006)。

40

【0072】

【化14】



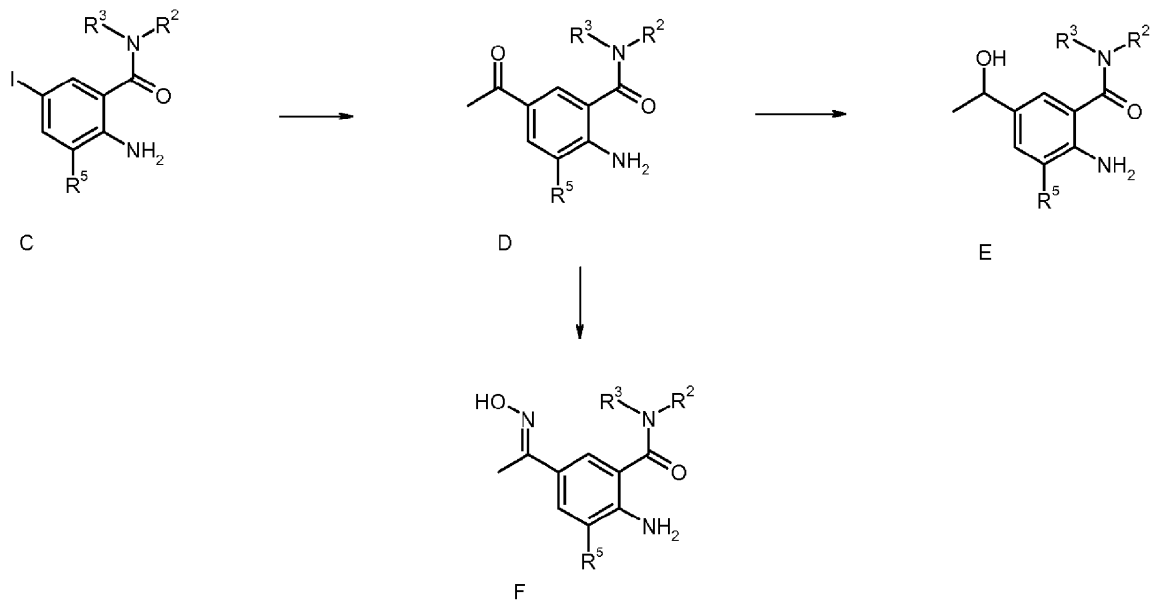
10

式D、EおよびFのアニリンは、新規である。それらは、下記の反応スキーム（このスキームにおける R^2 、 R^3 および R^5 は、それぞれ、上で定義したとおりである）に従って、式Cの化合物から得ることができる。式Cの化合物は公知である（例えば、国際公開第2009/061991号パンフレット）。CからDへの転化は、公知の方法によって、例えばパラジウム触媒下で（1-エトキシビニル）トリブチルスタンタンを用いて行うことができる（例えば、*J. Med. Chem.* 41, 1998, 3736）。Eへのさらなる転化は、適する還元剤、例えば水素化ホウ素ナトリウム、を用いて果たされる（例えば、国際公開第2006/108591号パンフレット）。DからFへの転化は、塩酸ヒドロキシルアミンおよび酢酸ナトリウムを用いる公知の方法によって果たされる（例えば、*Tetrahedron Letters*, 51(7), 1030-1033; 2010）。

20

【0073】

【化15】



30

良好な植物抵抗性、好適な恒温動物毒性および良好な環境適合性をもたらす本発明の活性成分は、植物および植物器官の保護に、収穫量の増加に、収穫材料の品質の向上に、ならびに農業において、園芸において、畜産において、森林において、庭およびレジャー施設において、貯蔵品および材料の保護において、および衛生セクターにおいて遭遇する動物有害生物、特に昆虫、クモ形動物、蠕虫、線虫および軟体動物、の防除に適する。本活性成分を、好ましくは、作物保護組成物として使用することができる。本活性成分からは、正常感受性および耐性種に対して、ならびにすべてのまたは一部の発育段階に対して活性である。上述の有害生物としては、以下のものが挙げられる：

40

節足動物門 (*Arthropoda*) からの有害生物、特に、蜘蛛形類 (*Arachnida*) から、例えば、コナダニ属 (*Acarus* spp.) 種、アセリア・シェルドニ (*Aceria sheldoni*)、アクロプス属種 (*Aculops* spp.)、

50

アキュルス属種 (*Aculus* spp.)、キララマダニ属種 (*Amblyomma* spp.)、オウトウハダニ (*Amphitetranychus viennensis*)、ナガヒメダニ属種 (*Argas* spp.)、ウシマダニ属種 (*Boophilus* spp.)、ブレビパルプス属種 (*Brevipalpus* spp.)、クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*)、セントルロイデス属種 (*Centruroides* spp.)、シヨクヒヒゼンダニ属種 (*Chorioptes* spp.)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、ヤケヒョウヒダニ (*Dermatophagoides pteronyssius*)、コナヒョウヒダニ (*Dermatophagoides farinae*)、カクマダニ属種 (*Dermacentor* spp.)、エオテトラニクス属種 (*Eotetranychus* spp.)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)、エウテトラニクス属種 (*Eutetranychus* spp.)、エリオフィエス属種 (*Eriophyes* spp.)、ハロチデウス・デストルクトル (*Halotydeus destructor*)、ヘミタルソネムス属種 (*Hemitarsonemus* spp.)、イボマダニ属種 (*Hyalomma* spp.)、マダニ属種 (*Ixodes* spp.)、ゴケグモ属種 (*Latrodectus* spp.)、ロクススセレス属種 (*Loxosceles* spp.)、メタテトラニクス属種 (*Metatetranychus* spp.)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、カズキダニ属種 (*Ornithodoros* spp.)、イエダニ属種 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニカス属種 (*Panonychus* spp.)、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)、キウセンヒゼンダニ属種 (*Psoroptes* spp.)、コイタマダニ属種 (*Rhipicephalus* spp.)、ネダニ属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステノタルソネムス属種 (*Stenotarsonemus* spp.)、ホコリダニ属種 (*Tarsonemus* spp.)、テトラニカス属種 (*Tetranychus* spp.)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコペルシシ (*Vasates lycopersici*)。

10

20

30

【0074】

シラミ目 (*Anoplura*) (シラミ類 (*Phthiraptera*)) から、例えば、デマリニア属種 (*Damalinia* spp.)、ブタジラミ属種 (*Haematopinus* spp.)、ケモノホソジラミ属種 (*Linognathus* spp.)、シラミ属種 (*Pediculus* spp.)、ケジラミ (*Ptirus pubis*)、ケモノハジラミ属種 (*Trichodectes* spp.)。

【0075】

唇脚目 (*Chilopoda*) から、例えば、ジムカデ属種 (*Geophilus* spp.)、スクティゲラ属種 (*Scutigera* spp.)。

【0076】

鞘翅目 (*Coleoptera*) から、例えば、アカリマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、インゲンマメゾウムシ (*Acanthoscelides obtectus*)、スジコガネ属種 (*Adoretus* spp.)、アゲラスティカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリオテス属種 (*Agriotes* spp.)、ガイマイゴミムシダマシ (*Alphitobius diaperinus*)、アマフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、ゴマダラカミキリ属種 (*Anoplophora* spp.)、アントノムス属種 (*Anthonomus* spp.)、マルカツオブシムシ属種 (*Anthrenus* spp.)、マメホソクチゾウムシ属種 (*Apion* spp.)、アポゴニア属種 (*Apogonia*

40

50

spp.)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、ヒメカツオブシムシ属種 (*Attagenus* spp.)、ブルキディウス・オブテクトゥス (*Bruchidius obtectus*)、ブルカス属種 (*Bruchus* spp.)、カメノコハムシ属種 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、サルゾウリムシ属種 (*Ceutorrhynchus* spp.)、ヒサゴゴビハムシ属種 (*Chaetocnema* spp.)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、オサゾウリムシ属種 (*Cosmopolites* spp.)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニケラ属種 (*Ctenicera* spp.)、シギゾウムシ属種 (*Curculio* spp.) 10

、ヤナギシリジロゾウリムシ (*Cryptorhynchus lapathi*)、シリンドロコブツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、カツオブシムシ属種 (*Dermestes* spp.)、ジアブロティカ属種 (*Diabrotica* spp.)、ディコクロキス属種 (*Dichocrocis* spp.)、ディロポデルス属種 (*Diloboderus* spp.)、エピラクナ属種 (*Epilachna* spp.)、エピトリクス属種 (*Epitrix* spp.)、ファウスティヌス属種 (*Faustinus* spp.)、ニセセマルヒヨウホンムシ (*Gibbium psylloides*)、ハイマダラノメイガ (*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*)、ヨーロッパイエカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、ラクノステルナ・コンサンゲイネア (*Lachnosterma consanguinea*)、クビボソハムシ属種 (*Lema* spp.)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、イネミズゾウムシ (*Lissorhopterus oryzophilus*)、カツオゾウムシ属種 (*Lixus* spp.)、ルペロデス属種 (*Luperodes* spp.)、キクイムシ属種 (*Lyctus* spp.)、メガスセリス属種 (*Megascelis* spp.)、クシコメツキ属種 (*Melanotus* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、コフキコガネ属種 (*Melolontha* spp.)、ミグドルス属種 (*Migdolus* spp.)、ヒゲナガカミキリ属種 (*Monochamus* spp.)、ナウパクツス・キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、ニプツス・ホルレウクス (*Niptus hololeucus*)、サイカブト (*Oryctes rhinoceros*)、ノコギリヒラタムシ (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Otiorrhynchus* spp.)、コアオハナムグリ (*Oxycetonia jucunda*)、ダイコンハムシ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllorhaga* spp.)、キスジノミハムシ属種 (*Phyllotreta* spp.)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrypes* spp.)、オオコナガシンクイ (*Prostephanus truncatus*)、ナガスネトビハムシ属種 (*Psylliodes* spp.)、プチヌス属種 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、コナガシンクイムシ (*Rhizopertha dominica*)、コクゾウ属種 (*Sitophilus* spp.)、スフェノフォルス属種 (*Sphenophorus* spp.)、ジンサンシバンムシ (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属種 (*Sternechus* spp.)、シンフィレテス属種 (*Symphyletes* spp.)、タニメクス属種 (*Tanymericus* spp.)、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コクヌ 40 50

ストモドキ属種 (*Tribolium* spp.)、マダラカツオブシムシ属種 (*Trogoderma* spp.)、ティキウス属種 (*Tychius* spp.)、トラカミキシ属種 (*Xylotrechus* spp.)、ザブルス属種 (*Zabrus* spp.)。

【0077】

粘管目 (*Collembola*) から、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)。

【0078】

倍脚綱 (*Diplopoda*) の目から、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)。

10

【0079】

双翅目 (*Diptera*) から、例えば、ヤブカ属種 (*Aedes* spp.)、アグロミザ属種 (*Agromyza* spp.)、アナストレファ属種 (*Anastrepha* spp.)、ハマダラカ属種 (*Anopheles* spp.)、ダイズサヤタマバエ属種 (*Asphondylia* spp.)、バクトロケラ属種 (*Bactrocera* spp.)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリツロケファラ (*Calliphora erythrocephala*)、チチウカイミバエ (*Ceratitis capitata*)、ユスリカ属種 (*Chironomus* spp.)、オビキンバエ属種 (*Chrysomyia* spp.)、メクラアブ属種 (*Chrysops* spp.)、コクリオミヤ属種 (*Cochliomyia* spp.)、コンタリニア属種 (*Contarinia* spp.)、食人バエ (*Cordylobia anthropophaga*)、イエカ属種 (*Culex* spp.)、サシバエ属種 (*Culicoides* spp.)、ハボシカ属種 (*Culiseta* spp.)、ウサギヒフバエ属種 (*Cuterebra* spp.)、オリーブミバエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasyneura* spp.)、デリア属種 (*Delia* spp.)、ヒトヒフバエ (*Dermatobia hominis*)、ショウジョウバエ属種 (*Drosophila* spp.)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、ヒメイエバエ属種 (*Fannia* spp.)、ウマバエ属種 (*Gasterophilus* spp.)、ツエツエバエ属種 (*Glossina* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒレミア属種 (*Hylemyia* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hypobosca* spp.)、ヒフバエ属種 (*Hypoderma* spp.)、モグリバエ属種 (*Liriomyza* spp.)、キンバエ属種 (*Lucilia* spp.)、ルツオミア属種 (*Lutzomia* spp.)、マンソニア属種 (*Mansonina* spp.)、イエバエ属種 (*Musca* spp.)、アオカメ属種 (*Nezara* spp.)、ヒツジバエ属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリット (*Oscinella frit*)、ペゴミア属種 (*Pegomyia* spp.)、サンチョウバエ属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、プロジプロシス属種 (*Prodiplosis* spp.)、ニンジンサビバエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、ニクバエ属種 (*Sarcophaga* spp.)、ブユ属種 (*Simulium* spp.)、サシバエ属種 (*Stomoxys* spp.)、アブ属種 (*Tabanus* spp.)、タニア属種 (*Tannia* spp.)、テタノプス属種 (*Tetanops* spp.)、ガガンボ属種 (*Tipula* spp.)。

20

30

40

【0080】

異翅目 (*Heteroptera*) から、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.)、ブリッスス属種 (*Blissus* spp.)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Cam*

50

pylomma livida)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp.)、トコジラミ属種 (*Cimex* spp.)、エリホコリ属種 (*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・ヘウエチ (*Diconocoris hewetti*)、アカホシカメムシ属種 (*Dysdercus* spp.)、エウスキスツス属種 (*Euschistus* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ヘリオペルチス属種 (*Heliopeltis* spp.)、ホルシアス・ノピレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリス属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトグロツサス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、マギバカスミカメ属種 (*Lygus* spp.)、マクロペス・エクスカバツス (*Macropes excavatus*)、メクラカメムシ科 (*Miridae*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonia atratum*)、アオカメ属種 (*Nezara* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、プサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウドアシスタ・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.)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、サシガメ属種 (*Triatoma* spp.)。

【0081】

同翅目 (*Homoptera*) から、例えば、アシルトシポン属種 (*Acyrthosipon* spp.)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、エネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノスセナ属種 (*Agonosceana* spp.)、アレウロデス属種 (*Aleurodes* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス属種 (*Aleurothrixus* spp.)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、アナラフィス・カルヅイ (*Anuraphis cardui*)、アカマルカイガラムシ属種 (*Aonidiella* spp.)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、ワタアブラムシ属種 (*Aphis* spp.)、フタテンヒメヨバイ (*Arboridia apicalis*)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、ウスイロマルカイガラムシ属種 (*Aspidiotus* spp.)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア属種 (*Bemisia* spp.)、ブラキカウヅス・ヘリクリシイ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneoccephala fulgida*)、カンシャワタムシ (*Ceratovacuna lanigera*)、コガシラアワフキムシ科 (*Cercopidae*)、ロウムシ属種 (*Ceroplastes* spp.)、イチゴケナガアブラムシ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、アカホシマルカイガラムシ (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccomytilus halli*)、カイガラムシ属種 (*Coccus* spp.)、クリストミ

ズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、ダレブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス属種 (*Dialeurodes* spp.)、ジアホリナ属種 (*Diaphorina* spp.)、ジアスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ワラジカイガラムシ属種 (*Drosicha* spp.)、ディサピス属種 (*Dysaphis* spp.)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、ミドリヒメヨコバイ属種 (*Empoasca* spp.)、ワタアブラ属種 (*Eriosoma* spp.)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウセリス・ピロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、ゲオコックス・コフエア (*Geococcus coffeae*)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus* spp.)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus arundinis*)、ワタフキカイガラムシ属種 (*Icerya* spp.)、ズキンヨコバイ属種 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種 (*Lecanium* spp.)、カキカイガラムシ属種 (*Lepidosaphes* spp.)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ヒゲナガアブラムシ属種 (*Macrosiphum* spp.)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、ヒエノアブラムシ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカニス (*Monelliopsis pecanisi*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.)、レタスヒゲナガアブラムシ (*Nasonovia ribisnigri*)、ツماغロヨコバイ属種 (*Nephotettix* spp.)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・ブラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp.)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、ワタカイガラモドキ属種 (*Phenacoccus* spp.)、フロエオミズス・パセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、ネアブラムシ属種 (*Phylloxera* spp.)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコッカス属種 (*Planococcus* spp.)、プロトプルピナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、クワコナカイガラムシ属種 (*Pseudococcus* spp.)、キジラミ属種 (*Psylla* spp.)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、カドラスピディオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシウム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、ハンエンカタカイガラムシ属種 (*Saissetia* spp.)、スカホイデス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspis articulatus*)、ソガタ属種 (*Sogata* spp.)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スティクトセファラ・フェスチカ (*Stictoccephala festina*)、テナラファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、チノカリス・カリリアエホリア (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種

10

20

30

40

50

(*Tomaspis* spp.)、ミカンアブラムシ属(*Toxoptera* spp.)、トリアレウロデス属種(*Trialeurodes* spp.)、トガリキジラミ属種(*Triozia* spp.)、ヒメヨコバイ属種(*Typhlocyba* spp.)、ヤノネカイガラムシ属種(*Unaspis* spp.)、ブドウネアブラムシ(*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種(*Zygina* spp.)。

【0082】

膜翅目(*Hymenoptera*)から、例えば、トガリハキリアリ属種(*Acromyrmex* spp.)、カブラハバチ属種(*Athalia* spp.)、ハキリアリ属種(*Atta* spp.)、ジプリオン属種(*Diprion* spp.)、ホプロカンパ属種(*Hoplocampa* spp.)、ケアリ属種(*Lasius* spp.)、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、ヒアリ(*Solenopsis invicta*)、コヌカアリ属種(*Tapinoma* spp.)、スズメバチ属種(*Vespa* spp.)。

10

【0083】

等脚目(*Isopoda*)から、例えば、オカダンゴムシ(*Armadillidium vulgare*)、ホンワラジムシ(*Oniscus asellus*)およびワラジムシ(*Porcellio scaber*)。

【0084】

等翅目(*Isoptera*)から、例えば、イエシロアリ属(*Coptotermes* spp.)、コルニテルメス・クムランス(*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.)、ミクロテルメス・オベシ(*Microtermes obesi*)、タイワンシロアリ属種(*Odontotermes* spp.)、ヤマトシロアリ属(*Reticulitermes* spp.)。

20

【0085】

鱗翅目(*Lepidoptera*)から、例えば、オオケンモン(*Acronicta major*)、コカクモンハマキ属種(*Adoxophyes* spp.)、ナカジロシタバ(*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種(*Agrotis* spp.)、アラバマ属種(*Alabama* spp.)、クルミマダラメイガ(*Amyelois transitella*)、アナルシア属種(*Anarsia* spp.)、アンチカルシア属種(*Anticarsia* spp.)、アルギロプロセ属種(*Argyroproce* spp.)、ヨトウムシ(*Barathra brassicae*)、ユレイセセリ(*Borbo cinnara*)、ブックラトリクス・ツルベリエラ(*Bucculatrix thurberiella*)、ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、ブッセオラ属種(*Busseola* spp.)、カコエキア属種(*Cacoecia* spp.)、チャノハマキホソガ(*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ(*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ(*Carpocapsa pomonella*)、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)、ケイマトビア・ブルマタ(*Cheimatobia brumata*)、メイチュウ属種(*Chilo* spp.)、コリストネウラ属種(*Choristoneura* spp.)、クリシア・アンビグエラ(*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属種(*Cnaphalocerus* spp.)、クネファシア属種(*Cnephasia* spp.)、コノモボルファ属種(*Conopomorpha* spp.)、コノトラケルス属種(*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属種(*Copitarsia* spp.)、キジヤ属種(*Cydia* spp.)、ダラカ・ノクツイデス(*Dalaca noctuides*)、ジアファニア属種(*Diaphania* spp.)、サトウキビメイガ(*Diatraea saccharalis*)、エアリアス属種(*Earias* spp.)、エクジトロファ・アウランチュウム(*Ecdytolopha aurantium*)、モロコシマダラメイガ(*Elasmopalpus lignosellus*)、エ

30

40

50

ルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*Ephestia* spp.)、エピノチア属種 (*Epinotia* spp.)、リンゴウルチャイロハマキ (*Epiphyas postvittana*)、エチエラ属種 (*Etiella* spp.)、エウリア属種 (*Eulia* spp.)、ブドウホソハマキ (*Eupoecilia ambiguella*)、ドクガ属種 (*Euproctis* spp.)、エウクソア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*Feltia* spp.)、ハチノスツツリガ (*Galleria mellonella*)、グラシリリア属種 (*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属種 (*Grapholitha* spp.)、ヘディレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、キンウワバ属種 (*Heliothis* spp.)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホメオソマ属種 (*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・フラボファスシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、ラスペイレシア・モレスト (*Laspeyresia molesta*)、ナスノメイガ (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、キンモンホソガ属種 (*Lithocolletis* spp.)、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア属種 (*Lobesia* spp.)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、マイマイガ属種 (*Lymantria* spp.)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、オビカレハ (*Malacosoma neustria*)、マメノメイガ (*Maruca testulalis*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、アウヨトウ (*Mythimna separata*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチカス属種 (*Oiketeticus* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、アワノメイガ属種 (*Ostrinia* spp.)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、イチモンジセセリ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、ミカンハナモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、モンシロチヨウ属種 (*Pieris* spp.)、プラチノタ・スタルタナ (*Platynota stultana*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、ウワバガ属種 (*Plusia* spp.)、コナガ (*Plutella xylostella*)、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.)、ミトヒムナ属種 (*Pseudaletia* spp.)、ダイズシャクトリムシ (*Pseudoplusia includens*)、アワノメイガ (*Pyrausta nubilalis*)、サンフラワールーパー (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobius* spp.)、スキルポファガ属種 (*Scirpophaga* spp.)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Sesamia* spp.)、テングハマキ属種 (*Sparganothis* spp.)、スポロプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、スタスモボダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ストモプテリクス・スプセシベラ (*Stomopteryx subscevella*)、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*)、イガ (*Tinea pellionella*)、コイガ (*Tineola bisselliella*)、ウスアミメキハマキ属種 (

10

20

30

40

50

Tortrix spp.)、ジウタンガ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)、トマトガ (*Tuta absoluta*)、ツヤモントラフシジミ属種 (*Virachola* spp.)。

【0086】

直翅目 (*Orthoptera*) から、例えば、ヨーロッパイエコオロギ (*Achetia domesticus*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、ジクロプルス属種 (*Dichroplus* spp.)、ケラ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属種 (*Locusta* spp.)、メラノプルス属種 (*Melanoplus* spp.)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta* spp.)、プレクス・イリタンス (*Pulex irritans*)、サバクトビバッタ (*Schistocerca gregaria*)、チャオピゴキブリ (*Supella longipalpa*)。

10

【0087】

ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、ナガノミ属種 (*Ceratophyllus* spp.)、イヌノミ属種 (*Ctenocephalides* spp.)、スナノミ属 (*Tunga penetrans*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)。

【0088】

結合目 (*Symphyla*) から、例えば、ミゾコムカデ属種 (*Scutigerebella* spp.)。

20

【0089】

総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えば、クサキイロアザミウマ (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、ドレパノトリス・レウテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella* spp.)、ヘリオトリプス属種 (*Heliothrips* spp.)、クリバネアザミウマ (*Hercinothrips femoralis*)、リピフォロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、スキルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニオトリプス・カルダモニ (*Taeniothrips cardamoni*)、トリプス属種 (*Thrips* spp.)。

30

【0090】

総尾目 (*Zygentoma*) (=シミ目 (*Thysanura*)) から、例えば、セイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)、マダラシミ (*Thermobia domestica*)。

【0091】

軟体動物門 (*Mollusca*) からの有害生物、特に、双殻類 (*Bivalvia*) から、例えば、カワホトトギスガイ属種 (*Dreissena* spp.)。

40

【0092】

複足類 (*Gastropoda*) から、例えば、アリオン属種 (*Arion* spp.)、ピオンファラリア属種 (*Biomphalaria* spp.)、ブリヌス属種 (*Bulinus* spp.)、デロセラス属種 (*Deroceras* spp.)、ガルバ属種 (*Galba* spp.)、モノアラガイ属種 (*Lymnaea* spp.)、カタヤマガイ属種 (*Oncomelania* spp.)、リンゴガイ属種 (*Pomacea* spp.)、オカモノアラガイ属種 (*Succinea* spp.)。

【0093】

扁形動物 (*Plathelminthes*) および線形動物 (*Nematoda*) 門からの動物寄生虫、特に、蠕虫 (*helminth*) 類から、例えば、ジウニシチョウチ

50

ュウ (*Ancylostoma duodenale*)、セイロンコウチュウ (*Ancylostoma ceylanicum*)、ブラジルコウチュウ (*Ancylostoma braziliensis*)、鉤虫属種 (*Ancylostoma* spp.)、回虫属種 (*Ascaris* spp.)、マレー糸状虫 (*Brugia malayi*)、チモール糸状虫 (*Brugia timori*)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、クロノルチス属種 (*Clonorchis* spp.)、クーベリア属種 (*Cooperia* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオカウルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、広節裂頭条虫 (*Diphyllobothrium latum*)、メジナ虫 (*Dracunculus medinensis*)、単包条虫 (*Echinococcus granulosus*)、多包条虫 (*Echinococcus multilocularis*)、ギョウチュウ (*Enterobius vermicularis*)、ファシオラ属種 (*Faciola* spp.)、捻転胃虫属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、小形条虫 (*Hymenolepis nana*)、ヒオストロングルス属種 (*Hyostrongylus* spp.)、ロア糸条虫 (*Loa loa*)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、腸結節虫属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、回旋糸状虫 (*Onchocerca volvulus*)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、スキストソメン属種 (*Schistosomen* spp.)、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、糞線虫属種 (*Strongyloides* spp.)、無鉤条虫 (*Taenia saginata*)、有鉤条虫 (*Taenia solium*)、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・プセルドプシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコストロングルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria*)、バンクロフト糸条虫 (*Wuchereria bancrofti*)。

【0094】

線形動物 (*Nematoda*) 門からの植物有害生物、すなわち、植物寄生線虫、特に、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、マツノザイセンチュウ属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、チジレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、グロボデラ属種 (*Globodera* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longidorus* spp.)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*)、トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、オオハリセンチュウ属種 (*Xiphinema* spp.)。

【0095】

亜門：原生動物

エイメリア属 (*Eimeria*) などの原生動物を防除することも可能である。

【0096】

場合によっては、本発明の化合物は、特定の濃度または施用量で、除草剤、毒性緩和剤、成長調節剤もしくは植物の特性を向上させるための薬剤としても、または殺微生物剤、例えば殺真菌剤、抗かび剤、殺菌剤、殺ウイルス剤 (ウイロイドに対する組成物を含む)

としても、またはMLO（マイコプラズマ様微生物）およびRLO（リケッチア様微生物）に対する組成物としても使用することができる。適宜、本発明の化合物を他の活性成分の合成のための中間体または前駆体としても使用することができる。

【0097】

本発明は、本発明の活性成分の少なくとも1つを含む、製剤にならびにそれらから調製される使用形態、例えば、作物保護用組成物および/または有害生物駆除剤、例えば灌注液、滴下液および噴霧液にさらに関する。場合によっては、前記使用形態は、さらに、作物保護用組成物および/または有害生物駆除剤および/また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、鉱物油、例えばパラフィン油、植物脂肪酸のアルキルエステル、例えばナタネ油メチルエステルもしくはダイズ油メチルエステルまたはアルカノールアルコキシラート；および/または展着剤、例えば、アルキルシロキサン；および/または塩、例えば有機もしくは無機アンモニウムもしくはホスホニウム塩、例えば硫酸アンモニウムもしくはリン酸水素二アンモニウム；および/または保持向上剤、例えば、スルホコハク酸ジオクチルもしくはヒドロキシプロピルグアーポリマー；および/または保湿剤、例えば、グリセロール；および/または肥料、例えば、アンモニウム含有、カリウム含有もしくはリン含有肥料）を含む。

10

【0098】

通例の製剤は、例えば、水溶性液剤（SL）、エマルジョン濃縮製剤（EC）、水中エマルジョン製剤（EW）、懸濁濃縮製剤（SC、SE、FS、OD）、顆粒水和剤（WG）、粒剤（GR）およびカプセル濃縮製剤（CS）である；これらおよびさらなる可能な製剤タイプは、例えば、世界農薬工業会（Corp Life International）によって、およびFAO/WHO合同農薬使用会議（FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications）により作製されたManual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173、2004年、ISBN: 9251048576、Pesticide Specificationsに記載されている。前記製剤は、1つ以上の本発明の活性成分に加えて、さらなる活性農薬成分を含んでもよい。

20

【0099】

これらは、好ましくは、助剤、例えば増量剤、溶剤、自発性促進剤、担体、乳化剤、分散剤、防霜剤、殺生剤、増粘剤および/またはさらなる助剤、例えばアジュバント、を含む、製剤または使用形態である。この文脈でのアジュバントは、製剤の生物学的効果を強化する成分であって、それ自体は生物学的効果を有さない成分である。アジュバントの例は、保持、展着、葉表面への付着、または浸透を促進する薬剤である。

30

【0100】

これらの製剤は、公知の方法で、例えば、活性成分と助剤、例えば増量剤、溶剤および/もしくは固体担体ならびに/またはさらなる助剤、例えば界面活性剤、とを混合することにより、生産される。前記製剤は、適する生産プラントで生産されるか、でなければ施用前または中に生成される。

40

【0101】

使用される助剤は、活性成分の製剤に、またはこれらの製剤から調製される使用形態（例えば、使用準備済みの作物保護用組成物、例えば噴霧液または種子粉衣製品）に、特別な特性、例えば一定の物理的、技術的および/または生物学的特性、を付与することに適した物質であり得る。

【0102】

適する増量剤は、例えば、水、極性および非極性有機化学液、例えば、芳香族および非芳香族炭化水素（例えば、パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼン）、アルコールおよびポリオール（これらは、適宜、置換、エーテル化および/またはエステル化されていることもある）、ケトン（例えば、アセトン、シクロヘキサノ

50

ン)、エステル(脂肪および油を含む)および(ポリ)エーテル、非置換および置換アミン、アミド、ラクタム(例えば、N-アルキルピロリドン)およびラクトン、スルホンおよびスルホキシド(例えば、ジメチルスルホキシド)のクラスからのものである。

【0103】

用いる増量剤が水である場合、例えば有機溶剤を補助溶剤として使用することもできる。有用な液体溶剤は、本質的には：芳香族、例えばキシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン、塩素化芳香族および塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサンまたはパラフィン、例えば鉱油留分、鉱油および植物油、アルコール、例えばブタノールまたはグリコールならびにそれらにエーテルおよびエステル、ケトン、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またはシクロヘキサノン、強極性溶剤、例えばジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシド、ならびにまた水である。

10

【0104】

原則的に、あらゆる適する溶剤を使用することができる。適する溶剤の例は、芳香族炭化水素、例えばキシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン、塩素化芳香族または脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサン、パラフィン、石油留分、鉱油および植物油、アルコール、例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノールまたはグリコールならびにそれらのエーテルおよびエステル、ケトン、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またはシクロヘキサノン、強極性溶剤、例えばジメチルスルホキシド、ならびにまた水である。

20

【0105】

原則的に、あらゆる適する担体を使用することができる。有用な担体としては、特に、例えば、アンモニウム塩、ならびに粉碎天然鉱物、例えばカオリン、クレー、タルク、チャーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土、ならびに粉碎合成材料、例えば微粉碎シリカ、アルミナ、ならびに天然または合成ケイ酸塩、樹脂、ろう、ならびにノまたは固形肥料が挙げられる。そのような担体の混合物もまた使用することができる。粒剤のための有用な担体としては、例えば、粉碎および分別天然石、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石、ドロマイト、ならびに無機および有機金属(meals)の合成顆粒、ならびにまた有機材料、例えばおがくず、紙、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎、の顆粒が挙げられる。

30

【0106】

液化ガス増量剤または溶剤を使用することもできる。特に適する増量剤または担体は、周囲温度、大気圧下で気体であるもの、例えば、エアゾル噴射ガス、例えば八口炭化水素、ならびにまたブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素である。

【0107】

イオン特性もしくは非イオン特性を有する乳化剤およびノもしくは泡形成剤、分散剤もしくは湿潤剤、またはこれらの界面活性剤の混合物の例は、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また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とのまたは脂肪酸とのまたは脂肪アミンとの重縮合物、置換フェノール(好ましくは、アルキルフェノールまたはアリールフェノール)と、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導體(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またはフェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪エステル、ならびにスルフェート、スルホネートおよびホスフェートを含有する化合物の誘導體、例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリールスルホネート、タンパク質加水分解物、リグノサルファイト廃液およびメチルセルロースである。界面活性剤の存在は、活性生物の1つおよびノまたは不活性担体の1つが水不溶性であるとき、ならびに水で施用を行うとき、有利である。

40

【0108】

前記製剤およびそれらから誘導される使用形態中に存在し得るさらなる助剤としては、染

50

料、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアン・ブルー、ならびに有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料、栄養素および微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩、が挙げられる。

【0109】

追加の成分は、安定剤、例えば低温安定剤、保存剤、酸化防止剤、光安定剤、または化学的および/もしくは物理的安定性を向上させる他の薬剤、であり得る。泡形成剤または消泡剤が存在することもある。

【0110】

粘着性付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、ならびに粉末、顆粒またはラテックス形態の天然および合成ポリマー、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリビニルアセテート、または他には天然リン脂質、例えばセファリンおよびレシチン、ならびに合成リン脂質も、前記製剤およびそれらから誘導される使用形態中に追加の助剤として存在することがある。さらなる助剤は、鉱油および植物油であり得る。

10

【0111】

適宜、前記製剤およびそれらから誘導される使用形態は、さらなる助剤も含むことがある。そのような添加剤の例としては、芳香剤、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロップ剤、浸透剤、保持向上剤、安定剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、保湿剤、展着剤が挙げられる。一般に、前記活性成分は、製剤のために一般に使用される任意の固体または液体添加剤と併用することができる。

20

【0112】

有用な保持向上剤としては、動的表面張力を低下させるあらゆる物質、例えばスルホコハク酸ジオクチル、または粘弾性を増加させあらゆる物質、例えばヒドロキシプロピルガーポリマー、が挙げられる。

【0113】

これに関連して有用な浸透剤は、活性農薬成分の植物への浸透を向上させるために典型的に使用されるあらゆる物質である。これに関連して、浸透剤は、(一般に水性の)施用液からおよび/または噴霧塗料から植物の上皮に浸透する、およびそれによって該上皮内への活性成分の移動性を増加させるそれらの能力によって定義される。文献(Baurら、1997、Pesticide Science 51、131-152)に記載されている方法を用いて、この特性を判定することができる。例としては、アルコールアルコキシレート、例えばココナッツ脂肪エトキシレート(10)も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も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)、またはアンモニウムおよび/もしくはホスホニウム塩、例えばリン酸アンモニウムもしくはリン酸水素二アンモニウムが挙げられる。

30

【0114】

前記製剤は、一般に、0.01重量%と98重量%の間、好ましくは0.5重量%と90重量%の間の活性成分を含有する。

【0115】

本発明の活性成分を、そのまま使用することができ、または1つ以上の適する殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺虫剤、殺微生物剤、肥料、誘引剤、植物賦活剤(phytonics)、滅菌剤、相乗剤、毒性緩和剤、信号化学物質および/もしくは植物成長調節剤との混合物の状態を含めて、本活性成分の製剤の状態で使用して、したがって例えば、作用スペクトルを広げること、作用持続期間を延長すること、作用率を増加させること、反発を防止するまたは耐性発生を防止することができる。加えて、非生物要因、例えば高温もしくは低温、に対する、早魃に対する、または高い含水率もしくは土壌塩分に対する抵抗性を強化する組み合わせによって、植物成長を向上させることができる。開花および結実性能を向上させること、発芽率および根の発達を最適化すること、収穫を助長して収率を向上させること、成熟に影響を及ぼすこと、収穫物の品質および/もしくは

40

50

は栄養価を向上させること、貯蔵寿命を延長すること、ならびに／または収穫物の加工性を向上させることもできる。一般に、本発明の活性成分と混合パートナーの組み合わせは、相乗効果を生じさせる結果となり、この相乗効果は、当該混合物の効力が個々の成分の効力より大きいことを意味する。一般に、前記組み合わせをプレミックス、タンクミックスまたはレディミックスに、およびまた種子塗布に使用することができる。

【 0 1 1 6 】

混合パートナーの特に好適な例は、以下の化合物である：

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤

(1) アセチルコリンエステラーゼ (A C h E) 阻害剤、例えば、カルバメート、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、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタナート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メトミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、X M C およびキシリルカルブ；または有機ホスフェート、例えばアセフェート、アザメチオホス、アジンホス (- メチル、 - エチル)、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 (- メチル)、クマホス、シアノホス、デメトン - S - メチル、ジアジノン、ジクロルボス / D D V P、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ジスルホトン、E P N、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イソフェンホス、イソプロピル O - (メトキシアミノチオホスホルル) サリチレート、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、メピノホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン - メチル、パラチオン (- 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、テムホス、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、トリクロルホンおよびバミドチオン。

【 0 1 1 7 】

(2) G A B A 作動性塩素チャネルアンタゴニスト、例えば、有機塩素、例えばクロルダンおよびエンドスルファン (アルファ -)；またはフィプロール (フェニルピラゾール)、例えばエチオプロール、フィプロニル、ピラフルプロールおよびピリプロール。

【 0 1 1 8 】

(3) ナトリウムチャネルモジュレーター / 電位依存性ナトリウムチャネルブロッカー、例えば、ピレトロイド、例えばアクリナトリン、アレトリン (d - c i s - t r a n s、d - t r a n s)、ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン - S - シクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン (ベータ -)、シハロトリン (ガンマ -、ラムダ -)、シペルメトリン (アルファ -、ベータ -、シータ -、ゼータ -)、シフェノトリン [(1 R) - t r a n s - 異性体]、デルタメトリン、ジメフルトリン、エンペントリン [(E Z) - (1 R) - 異性体]、エスフェンバレラート、エトフェンブロックス、フェノプロパトリン、フェンバレラート、フルシトリナート、フルメトリン、フルバリネート (タウ -)、ハルフェンブロックス、イミプロトリン、メトフルトリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1 R) - t r a n s - 異性体]、プラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン (除虫菊)、レスメトリン、R U 1 5 5 2 5、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン [(1 R) - 異性体]、トラロメトリン、トランスフルトリンおよび Z X I 8 9 0 1；または D D T；またはメトキシクロール。

【 0 1 1 9 】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト、例えば、ネオニコチノイド、例えばアセトアミプリド、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、チアメトキサム；またはニコチン。

【 0 1 2 0 】

10

20

30

40

50

(5) アロステリックアセチルコリン受容体モジュレーター(アゴニスト)、例えば、スピノシン、例えばスピネトラムおよびスピノサド。

【0121】

(6) 塩素チャネルアクチベーター、例えば、アベルメクチン/ミルベマイシン、例えばアバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、リビメクチンおよびミルベメクチン。

【0122】

(7) 幼若ホルモン類似体、例えば、ヒドロブレン、キノブレン、メトブレン;またはフェノキシカルブ;ピリプロキシフェン。

【0123】

(8) 未知または非特異的作用機序を有する活性成分、例えば、燻蒸剤、例えば臭化メチルおよび他のハロゲン化アルキル;またはクロロピクリン;フッ化スルフルル;ボラックス;吐酒石。

【0124】

(9) 選択的摂取阻害物質、例えば、ピメトロジン;またはフロニカミド。

【0125】

(10) ダニ成長阻害剤、例えば、クロフェンテジン、ジフロビダジン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール。

【0126】

(11) 昆虫腸膜の微生物破壊剤、例えば、バチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*) 亜種イスラエレンシス(*israelensis*)、バチルス・スファエリクス(*Bacillus sphaericus*)、バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ(*aizawai*)、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキ(*kurstaki*)、バチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス(*tenebrionis*)、およびBT植物タンパク質、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34/35Ab1。

【0127】

(12) 酸化的リン酸化阻害剤、ATP破壊剤、例えば、ジアフェンチウロン;または有機錫化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、フェンブタチンオキシド;またはプロパルギット;テトラジホン。

【0128】

(13) Hプロトン勾配を遮断することにより作用する酸化的リン酸化脱共役剤、例えば、クロルフェナピルおよびDNOC。

【0129】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体アンタゴニスト、例えば、ベンスルタップ、カルタップ(塩酸塩)、チオシクラム(*thiocyclam*)、およびチオスルタップ(ナトリウム)。

【0130】

(15) キチン生合成阻害剤、0型、例えば、ベンゾイル尿素、例えばビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロンおよびトリフルムロン。

【0131】

(16) キチン生合成阻害剤、1型、例えば、プロプロフェジン。

【0132】

(17) 脱皮かく乱剤、例えば、シロマジン。

【0133】

(18) エクジソンアゴニスト/破壊剤、例えば、ジアシルヒドラジン、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およびテプフェノジド。

【0134】

10

20

30

40

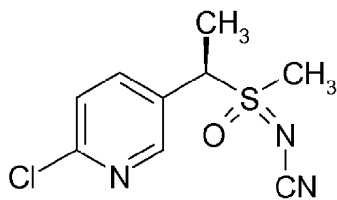
50

- (19) オクトパミン作動性アゴニスト、例えば、アミトラズ。
【0135】
- (20) 複合体 I I I 電子伝達阻害剤、例えば、ヒドラメチルノン；アセキノシル；フルアクリプリム。
【0136】
- (21) 複合体 I 電子伝達阻害剤、例えば、METI 殺ダニ剤群からのもの、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、テブフェンブラド、トルフェンブラド；またはロテノン（ドクフジ属（Derris））。
【0137】
- (22) 電位依存性ナトリウムチャンネルブロッカー、例えば、インドキサカルブ；メタフルミゾン。 10
【0138】
- (23) アセチル - CoA カルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロン酸誘導体、例えばスピロジクロフェンおよびスピロメシフェン；またはテトラム酸誘導体、例えばスピロテトラマト。
【0139】
- (24) 複合体 I V 電子伝達阻害剤、例えば、ホスフィン、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、リン化亜鉛；またはシアニド。
【0140】
- (25) 複合体 I I 電子伝達阻害剤、例えば、シエノピラフェン。 20
【0141】
- (28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、ジアミド、例えばフルベンジアミド、クロラントラニプロール（Rynaxypyr）、シアントラニプロール（Cyzapypyr）およびまた 3 - プロモ - N - { 2 - プロモ - 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（国際公開第 2005 / 077934 号パンフレットから公知）または 2 - [3 , 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 - プロモ - 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] - 1 , 2 - ジメチルヒドラジンカルボン酸メチル（国際公開第 2007 / 043677 号パンフレットから公知）。 30
【0142】
- 未知作用機序を有するさらなる活性成分、例えば、アザジラクチン、アミドフルメト、ベンゾキシマート、ピフェナゼート、キノメチオネート、クリオライト、シフルメトフェン、ジコホール、フルエンシルホン（5 - クロロ - 2 - [(3 , 4 , 4 - トリフルオロプロタ - 3 - エン - 1 - イル) スルホニル] - 1 , 3 - チアゾール）、フルフェネリム、ピリダリルおよびピリフルキナゾン；およびまた、バチルス・フィルムス（Bacillus firmus）（I - 1582、BioNeem、Votivo）に基づく製品、ならびに以下の公知活性化化合物：
- 4 - { [(6 - プロモピリド - 3 - イル) メチル] (2 - フルオロエチル) アミノ } フラン - 2 (5 H) - オン（国際公開第 2007 / 115644 号パンフレットから公知） 40
、 4 - { [(6 - フルオロピリド - 3 - イル) メチル] (2 , 2 - ジフルオロエチル) アミノ } フラン - 2 (5 H) - オン（国際公開第 2007 / 115644 号パンフレットから公知）、 4 - { [(2 - クロロ - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) メチル] (2 - フルオロエチル) アミノ } フラン - 2 (5 H) - オン（国際公開第 2007 / 115644 号パンフレットから公知）、 4 - { [(6 - クロロピリド - 3 - イル) メチル] (2 - フルオロエチル) アミノ } フラン - 2 (5 H) - オン（国際公開第 2007 / 115644 号パンフレットから公知）、 4 - { [(6 - クロロピリド - 3 - イル) メチル] (2 , 2 - ジフルオロエチル) アミノ } フラン - 2 (5 H) - オン（国際公開第 2007 / 115644 号パンフレットから公知）、 4 - { [(6 - クロロ - 5 - フルオロピリド - 3 - イル) メチル] (メチル) アミノ } フラン - 2 (5 H) - オン（国際公開第 2007 / 115 50

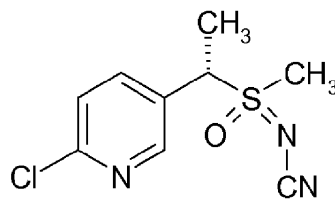
643号パンフレット)、4- {[(5, 6-ジクロロピリド-3-イル)メチル] (2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(国際公開第2007/115646号パンフレットから公知)、4- {[(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル)メチル] (クロロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(国際公開第2007/115643号パンフレットから公知)、4- {[(6-クロロピリド-3-イル)メチル] (シクロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(欧州特許出願公開第0539588号明細書から公知)、4- {[(6-クロロピリド-3-イル)メチル] (メチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(欧州特許出願公開第0539588号明細書から公知)、[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル] (メチル)オキシド-⁴-スルファニリデンシアナミド(国際公開第2007/149134号パンフレットから公知)、[1-(6-クロロピリジン-3-イル)エチル] (メチル)オキシド-⁴-スルファニリデンシアナミド(国際公開第2007/149134号パンフレットから公知)ならびにそのジアステレオマー(A)および(B)

【0143】

【化16】



(A)



(B)

(同じく国際公開第2007/149134号パンフレットから公知)、[(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)メチル] (メチル)オキシド-⁴-スルファニリデンシアナミド(国際公開第2007/095229号パンフレットから公知)、スルホクサフロール(同じく国際公開第WO2007/149134から公知)、11-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-12-ヒドロキシ-1,4-ジオキサ-9-アザジスピロ[4.2.4.2]テトラデカ-11-エン-10-オン(国際公開第2006/089633号パンフレットから公知)、3-(4'-フルオロ-2,4-ジメチルピフェニル-3-イル)-4-ヒドロキシ-8-オキサ-1-アザスピロ[4.5]デカ-3-エン-2-オン(国際公開第2008/067911号パンフレットから公知)、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)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-アミン(国際公開第2006/043635号パンフレットから公知)、[(3S, 4aR, 12R, 12aS, 12bS)-3-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]-6,12-ジヒドロキシ-4,12b-ジメチル-11-オキソ-9-(ピリジン-3-イル)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-デカヒドロ-2H,11H-ベンゾ[f]ピラノ[4,3-b]クロメン-4-イル]メチルシクロプロパンカルボキシレート(国際公開第2006/129714号パンフレットから公知)、2-シアノ-3-(ジフルオロメトキシ)-N,N-ジメチルベンゼンスルホンアミド(国際公開第2006/056433号パンフレットから公知)、2-シアノ-3-(ジフルオロメトキシ)-N-メチルベンゼンスルホンアミド(国際公開第2006/100288号パンフレットから公知)、2-シアノ-3-(ジフルオロメトキシ)-N-エチルベンゼンスルホンアミド(国際公開第2005/035486号パンフレットから公知)、4-(ジフルオロメトキシ)-N-エチル-N-メチル-1,2-ベンゾチアゾール-3-アミン1,1-ジオキシド(国際公開第2007/057407号パンフレットから公知)およびN-[1-(2,3-ジメチルフェニル)-2-(3,5-ジメチルフェニル)エチル]-4,5-ジヒドロ-1,3-チアゾール-2-アミン(国際公開第2008/104503号パンフレットから公知)。

10

20

30

40

50

【 0 1 4 4 】

殺真菌剤：

(1) エルゴステロール生合成阻害剤、例えば、アルジモルフ、アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジクロブトラゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ドデモルフ、ドデモルフ酢酸塩、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェナリモルフ、フェンブコナゾール、フェンヘキサミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フルキンコナゾール、フルルプリミドール、フルシラゾール、フルトリアホル、フルコナゾール、フルコナゾール - c i s、ヘキサコナゾール、イマザリル、イマザリル硫酸塩、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ナフチフィン (n a f t i f i n)、ヌアリモルフ、オキシポコナゾール、パクロブトラゾール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ピペラリン、プロクロラズ、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、ピリブチカルブ、ピリフェノックス、キンコナゾール、シメコナゾール、スピロキサミン、テブコナゾール、テルピナフィン、テトラコナゾール、トリジメホン、トリジメノール、トリデモルフ、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウニコナゾール - p、ビニコナゾール、ポリコナゾール、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、メチル 1 - (2 , 2 - ジメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキシレート、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 - メチルイモドホルムアミド、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および O - [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、

10

20

(2) 呼吸阻害剤 (呼吸鎖阻害剤)、例えば、ピキサフェン、ボスカリド、カルボキシン、ジフルメトリム、フェンフラム、フルオピラム、フルトラニル、フルキサピロキサド、フラメトピル、フルメシクロックス、syn - エピマーのラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 R S のおよび anti - エピマーのラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 S R のイソピラザム混合物、イソピラザム (anti - エピマーのラセミ体)、イソピラザム (anti - エピマーのエナンチオマー 1 R , 4 S , 9 S)、イソピラザム (anti - エピマーのエナンチオマー 1 S , 4 R , 9 R)、イソピラザム (syn - エピマーのラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 R S)、イソピラザム (syn - エピマーのエナンチオマー 1 R , 4 S , 9 R)、イソピラザム (syn - エピマーのエナンチオマー 1 S , 4 R , 9 S)、メプロニル、オキシカルボキシン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン、チフルザミド、1 - メチル 1 - 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) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、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] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドおよび 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、

30

40

(3) 呼吸鎖複合体 I I I に対して作用する呼吸阻害剤 (呼吸鎖阻害剤)、例えば、アメクトラジン、アミスルプロム、アゾキシストロピン、シアゾファミド、ジモキシストロピン、エネストロピン、ファモキサドン、フェナミドン、フルオキサストロピン、クレソキシム - メチル、メトミノストロピン、オリサストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、ピラメトストロピン、ピラノキシストロピン、ピリベンカルブ、トリフロキシストロピン、(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、(2 E) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - (2

50

- { [({ (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 1) エタンアミド、 (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、 (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、 (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、 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、 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] エチリデン } 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、メチル (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 - エノエート、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、 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および (2 R) - 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、

10

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

20

(5) マルチサイト活性を有する化合物、例えば、ボルドー混合物、カプタホール、カプタン、クロロタロニル、銅製剤、例えば水酸化銅、ナフテン酸銅、酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、ジクロフルアニド、ジチアノン、ドジン、ドジン遊離塩基、ファーバム、フルオロホルペット、ホルペット、グアザチン、グアザチン酢酸塩、イミノクタジン、イミノクタジンアルベシル酸塩、イミノクタジン三酢酸塩、マンコッパー、マンコゼブ、マネブ、メチラム、メチラム亜鉛、オキシニ - 銅、プロパミジン、プロピネブ、硫黄および硫黄製剤、例えば多硫化カルシウム、チラム、トリルフルアニド、ジネブおよびジラム、

30

(6) 耐性誘導剤、例えば、アシベンゾラル - S - メチル、イソチアニル、プロベナゾールおよびチアジニル、

(7) アミノ酸およびタンパク質生合成阻害剤、例えば、アンドプリム、プラスチックジン - S、シプロジニル、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、メパニプリムおよびピリメタニル、

(8) ATP 生産阻害剤、例えば、フェンチン酢酸塩、フェンチンクロリド、フェンチンヒドロキシドおよびシルチオファム、

40

(9) 細胞壁合成阻害剤、例えば、ベンチアバリカルブ、ジメトモルフ、フルモルフ、イプロバリカルブ、マンジプロパミド、ポリオキシニ、ポリオキシソリム、バリダマイシン A およびバリフェナレート、

(10) 脂質および膜合成阻害剤、例えば、ピフェニル、クロロネブ、ジクロラン、エジフェンホス、エトリジアゾール、ヨードカルブ、イプロベンホス、イソプロチオラン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、プロチオカルブ、ピラゾホス、キントゼン、テクナゼンおよびトルクロホス - メチル、

(11) メラニン生合成阻害剤、例えば、カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル、フタリド、ピロキロンおよびトリシクラゾール、

(12) 核酸合成阻害剤、例えば、ベナラキシル、ベナラキシル - M (キララキシル)

50

、ブプリメート、クロジラコン、ジメチリモール、エチリモール、フララキシル、ヒメキサゾール、メタラキシル、メタラキシル - M (メフェノキサム)、オフラセ、オキサジキシル、オキシリン酸、

(13) シグナル伝達阻害剤、例えば、クロゾリネート、フェンピクロニル、フルジオキソニル、イプロジオン、プロシミドン、キノキシフェンおよびピンクロゾリン、

(14) 脱共役剤、例えば、ピナパクリル、ジノカップ、フェリムゾン、フルアジナムおよびメブチルジノカップ、

(15) さらなる化合物例えば、ベンチアゾール、ベトキサジン、カプシマイシン、カルボン、キノメチオネート、クラザフェノン、クフラネブ、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロフルファミド、ダゾメット、デバカルブ、ジクロロフェン、ジクロメジン、ジフェンゾクワット、ジフェンゾクワット・メチル硫酸塩、ジフェニルアミン、エコマツト、フェンピラザミン、フルメトベル、フルオロミド、フルスルファミド、フルタニル、ホセチル - アルミニウム、ホセチル - カルシウム、ホセチル - ナトリウム、ヘキサクロロベンゼン、イルママイシン、メタスルホカルブ、イソチオシアン酸メチル、メトラフェノン、ミルジオマイシン、ナタマイシン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロタール - イソプロピル、オクチリノン、オキサモカルブ、オキシフェンチン、ペンタクロロフェノールおよびその塩、フェノトリン、リン酸およびその塩、プロパモカルブ - ホセチレート、プロパノシン - ナトリウム、プロキナジド、ピロールニトリン、テブフロキン、テクロフタラム、トルニファニド、トリアゾキシド、トリクラミド、ザリルアミド、1 - (4 - {4 - [(5R) - 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) - 1H - ピラゾール - 1 - イル]エタノン、1 - (4 - {4 - [(5S) - 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) - 1H - ピラゾール - 1 - イル]エタノン、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) - 1H - ピラゾール - 1 - イル]エタノン、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 - カルボキシレート、2, 3, 5, 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル)ピリジン、2, 3 - ジブチル - 6 - クロロチエノ[2, 3 - d]ピリミジン - 4(3H) - オン、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、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、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、2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル - 4H - クロメン - 4 - オン、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、2 - フェニルフェノールおよびその塩、3, 4, 5 - トリクロロピリジン - 2, 6 - ジカルボニトリル、3 - [5 - (4 - クロロフェニル) - 2, 3 - ジメチル - 1, 2 - オキサゾリジン - 3 - イル]ピリジン、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、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、5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、5 - クロロ - N' - フェニル - N' - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル)チオフエン - 2 - スルホノヒドラジン、5 - メチル - 6 - オクチル[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]

10

20

30

40

50

ピリミジン - 7 - アミン、エチル (2 Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルプロ
 パ - 2 - エノエート、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、N - [(4 - クロロフェニル
 1) (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、N - [(5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル)
 メチル] - 2 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサミド、N - [1 - (5 - ブロモ -
 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサ
 ミド、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 - ヨードピリジン - 3 - カルボキサミド、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、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、N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1
 H - 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、N
 - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール
 - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 R) - 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、N - メ
 チル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1
 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 S) - 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、ベンチル {
 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチリデン]
 アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、フェナジン - 1 - カルボ
 ン酸、キノリン - 8 - オールおよびキノリン - 8 - オール硫酸塩 (2 : 1)、

10

20

(16) さらなる化合物、例えば、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) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボ
 キキサミド、N - (4 ' - クロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1
 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - (2 ' , 4 ' - ジクロロビフェ
 ニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カ
 ルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメ
 チル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - (2 ' ,
 5 ' - ジフルオロビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) -
 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N -
 [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール -
 4 - カルボキサミド、5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン
 - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、2 -
 クロロ - N - [4 ' - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ピリジン
 - 3 - カルボキサミド、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) ビフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4
 - カルボキサミド、N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェ
 ニル - 2 - イル] - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキ
 サミド、3 - (ジフルオロメチル) - N - (4 ' - エチニルビフェニル - 2 - イル) - 1
 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - (4 ' - エチニルビフェニル -
 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサ
 ミド、2 - クロロ - N - (4 ' - エチニルビフェニル - 2 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサ
 ミド、2 - クロロ - N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェ
 ニル - 2 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド、4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチ
 ル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - チアゾール
 - 5 - カルボキサミド、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) ビフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール

30

40

50

- 4 - カルボキサミド、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] ピリジン - 3 - カルボキサミド、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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、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] ピリジン - 3 - カルボキサミド、(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) メタノンおよび 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] - N 2 - (メチルスルホニル) バリンアミド。

10

【 0 1 4 5 】

クラス (1) から (1 6) 内に名を挙げたすべての混合パートナーは、それらの官能基に基づき可能ならば、適する塩基または酸と塩を形成していてもよい。

【 0 1 4 6 】

本明細書においてそれらの一般名で識別される活性成分は公知であり、例えば、有害生物駆除剤ハンドブック (「 The Pesticide Manual 」 、第 1 4 版、British Crop Protection Council 2006) に記載されており、またはインターネット (例えば、<http://www.alanwood.net/pesticides>) で見つけることができる。

20

【 0 1 4 7 】

他の公知活性成分、例えば除草剤、肥料、成長調節剤、毒性緩和剤、信号化学物質との混合物、または他には植物の特性を向上させるための薬剤との混合物も可能である。

【 0 1 4 8 】

殺虫剤として使用される場合、本発明の活性成分は、それらの市販製剤中におよびこれらの製剤から調製される使用形態中に、相乗剤との混合物として存在することもある。相乗剤は、本活性成分の作用を強化する化合物であるが、本活性成分自体が活性になるために相乗剤を添加する必要は一切ない。

【 0 1 4 9 】

殺虫剤として使用される場合、本発明の活性成分は、それらの市販製剤中におよびこれらの製剤から調製される使用形態中に、本活性成分の植物の環境、植物の部分の表面、または植物組織への使用後の分解を低減する阻害剤との混合物として存在することもある。

30

【 0 1 5 0 】

前記市販製剤から調製される使用形態の活性成分含有率は、広い範囲内で変動し得る。前記使用形態の活性成分濃度は、0 . 0 0 0 0 0 0 0 1 から 9 5 重量 % 、好ましくは 0 . 0 0 0 0 1 重量 % と 1 重量 % の間の活性成分であり得る。

【 0 1 5 1 】

前記化合物は、前記使用形態に適する通例の方法で利用される。

【 0 1 5 2 】

あらゆる植物および植物部分を本発明に従って処理することができる。植物は、あらゆる植物および植物集団、例えば望ましいおよび望ましくない野生植物または作物植物 (天然に存在する作物植物を含む) を意味すると本明細書では解される。作物植物は、従来の育種および最適化法によってまたはバイオテクノロジー的および遺伝子工学的的手法またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であり得、トランスジェニック植物を包含し、ならびに植物育種家の権利により保護され得るおよび保護され得ない植物栽培品種を包含する。植物の部分は、植物の地上および地下のあらゆる部分および器官、例えば苗条、葉、花および根、を意味すると解するものとし、例としては、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実および種子、ならびにまた根、塊茎および根茎が挙げられる。植物部分としては、収穫材料ならびに栄養繁殖材料および生殖繁殖材料、例えば、挿し木、塊茎、根茎、かき苗および種子も挙げられる。

40

50

【 0 1 5 3 】

本活性成分での植物および植物部分の本発明の処理は、通例の処理方法により、例えば浸漬、噴霧、蒸発、燻煙、拡散、塗布、注入により、直接的に、または該植物および該植物部分の周囲、生育地もしくは貯蔵場所に作用させることによって行い、ならびに繁殖素材の場合、特に種子の場合は、1層以上のコーティングを施すことによっても行う。

【 0 1 5 4 】

上で既に述べたように、あらゆる植物およびそれらの部分を本発明に従って処理することができる。好ましい実施形態では、野生植物種および植物栽培品種、または従来の生物学的育種法、例えば交配もしくはプロトプラスト融合、によって得られたもの、およびまたそれらの部分を処理する。さらなる好ましい実施形態では、適宜、従来の方法と併用で、遺伝子工学的手法によって得られたトランスジェニック植物および植物栽培品種（遺伝子修飾生物）、ならびにそれらの部分を処理する。用語「部分」または「植物の部分」または「植物部分」は、上で説明した。

10

【 0 1 5 5 】

さらに好ましくは、市販されているまたは使用されている植物栽培品種の植物を本発明に従って処理する。植物栽培品種は、新たな特性（「形質」）を有する植物であって、従来育種法によって、突然変異誘発によって、または組換えDNA技術によって得られた植物を意味すると解される。それらは、栽培品種、生物型および遺伝子型である。

【 0 1 5 6 】

植物種または植物栽培品種、およびそれらの位置および成長条件（土壌、気候、生育期、摂取物（diet））に依存して、本発明の処理は、超相加（「相乗」）効果をもたらすこともできる。例えば、可能性としては、通常予想される効果を超える、本発明に従って使用できる化合物および組成物の施用量低減および/または活性スペクトルの拡大および/または活性の増加、より良好な植物成長、高温または低温に対する抵抗性増加、早魃または水もしくは土壌中の塩分レベルに対する抵抗性増加、開花性能の強化、より容易な収穫、成熟加速、より高い収量、収穫物のより高い品質および/またはより高い栄養価、収穫物の貯蔵寿命増加および/または加工性が挙げられる。

20

【 0 1 5 7 】

本発明に従って好ましく処理することができるトランスジェニック植物または植物栽培品種（遺伝子工学によって得られたもの）としては、遺伝子修飾により、これらの植物に特に有利で有用な特性（「形質」）を付与する遺伝物質を受け取ったあらゆる植物が挙げられる。そのような特性の例は、より良好な植物成長、高温または低温に対する抵抗性増加、早魃に対するまたは水もしくは土壌中の塩分レベルに対する抵抗性増加、開花性能強化、より容易な収穫、成熟加速、より高い収率、収穫物のより高い品質および/またはより高い栄養価、収穫物のより長い貯蔵安定性および/または加工性である。そのような特性のさらなるおよび特に強調される例は、動物および微生物有害生物に対する、例えば昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌および/またはウイルスに対する、植物の防御力向上、ならびにまた一定の除草剤活性成分に対する植物の抵抗性増加である。トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば穀物（コムギ、イネ）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、トマト、エンドウおよび他の植物タイプ、ワタ、タバコ、アブラナ、ならびにまた果実植物（リンゴ、ナシ、柑橘類およびブドウの果実を伴うもの）が挙げられ、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコおよびアブラナが特に強調される。特に強調される形質は、植物体内で形成される毒素、特に、バチルス・チューリンゲンシスからの遺伝物質により（例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3BbおよびCryIF、ならびにまたこれらの組み合わせにより）植物体内で形成される毒素による、昆虫、クモ形動物、線虫、ナメクジおよびカタツムリに対する植物の防御力向上である（本明細書では以後「Bt植物」と呼ぶ）。そしてまた特に強調される形質は、全身獲得耐性（SAR）、システミン、フィトアレキシン、エリシター、およびまた耐性遺伝子ならびにそれに応じて発現されるタンパク質および

30

40

50

毒素による、真菌、細菌およびウイルスに対する植物の防御力向上である。加えて特に強調される形質は、一定の活性除草剤成分、例えばイミダゾリノン、スルホニル尿素、グリホサートまたはホスフィノトリシン、に対する植物の抵抗性増加である（例えば、「PAT」遺伝子）。当該望ましい形質を付与する遺伝子は、互いに組み合わせさせてトランスジェニック植物中に存在することもある。「Bt植物」の例としては、商品名YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、KnockOut（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、StarLink（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、Nucotn（登録商標）（ワタ）およびNewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）で販売されている、トウモロコシ品種、ワタ品種、ダイズ品種およびジャガイモ品種が挙げられる。除草抵抗性植物の例としては、商品名Roundup Ready（登録商標）（グリホサートに対して抵抗性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシンに対して抵抗性、例えば、アブラナ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノンに対して抵抗性）およびSTS（登録商標）（スルホニル尿素に対して抵抗性、例えば、トウモロコシ）で販売されている、トウモロコシ品種、ワタ品種およびダイズ品種が挙げられる。除草剤耐性植物（除草剤抵抗性のための従来の方法で育種された植物）としては、Clearfield（登録商標）の名で販売されている品種（例えば、トウモロコシ）も挙げられる。勿論、これらの言明は、これらの遺伝形質またはまだ開発されていない、将来開発されるおよび/もしくは販売される遺伝形質を有する植物栽培品種にも当てはまる。

10

20

【0158】

列挙した植物を、本発明に従って、本発明による一般式Iの化合物および/または活性成分の混合物を用いる特に有利な方法で処理することができる。活性成分または混合物について上で述べた好ましい範囲は、これらの植物の処理にも当てはまる。本文において具体的に記載される化合物または混合物での植物の処理が特に強調される。

【0159】

加えて、本発明の活性成分は、例えば、植物に寄生する有害な吸汁性昆虫、刺咬昆虫および他の有害生物、貯蔵材料有害生物、工業材料を破壊する有害生物、および動物衛生セクター内の寄生虫を含む衛生有害生物をはじめとする数多くの異なる有害生物を防除するために使用することができ、それらの防除、例えばそれらの排除および根絶のために使用することができる。したがって、本発明は、有害生物の防除方法も含む。

30

【0160】

動物衛生セクターにおいて、すなわち、獣医学分野において、本発明による活性成分は、動物寄生虫、特に外部寄生虫または内部寄生虫、に対して作用する。用語「内部寄生虫」は、特に、蠕虫、例えば条虫、線虫または吸虫、および原生動物、例えば球虫を含む。外部寄生虫は、典型的にはおよび好ましくは節足動物、特に、昆虫、例えばハエ（刺すおよび舐めるハエ）、寄生バエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ、ノミおよびこれらに類するもの；または殺ダニ剤（acaricide）、例えば、マダニ、例えばカタダニもしくはヒメダニ、またはダニ、例えばカイセンダニ、ツツガムシ、トリダニおよびこれらに類するものである。

40

【0161】

これらの寄生虫としては、

シラミ目（Anoplurida）からは、例えば、ブタジラミ属種（Haematopinus spp.）、ケモノホソジラミ属種（Linognathus spp.）、シラミ属種（Pediculus spp.）、フィチルス属種（Phtirus spp.）およびソレノポテス属種（Solenopotes spp.）が挙げられ；具体的な例は、イヌジラミ（Linognathus setosus）、ウシホソジラミ（Linognathus vituli）、ヒツジホソジラミ（Linognathus ovis）、リノグナツス・オビホルミス（Linognathus oviformis）、リノグナツス・ペダリス（Linognathus pedalis）

50

、ヤギホソジラミ (*Linognathus stenopsis*)、ハエマトピヌス・アシニ・マクロセファルス (*Haematopinus asini macrocephalus*)、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ペディクルス・フマヌス・カピティス (*Pediculus humanus capitis*)、ペディクルス・フマヌス・コルポリス (*Pediculus humanus corporis*)、フィロエラ・バスタトリクス (*Phylloera vastatrix*)、フチルス・プビス (*Phtirus pubis*)、ケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) であり；

ハジラミ目 (*Mallophagida*) およびマルツノハジラミ亜目 (*Amblycerina*) およびホソツノハジラミ亜目 (*Ischnocerina*) からは、例えば、トリメノボン属種 (*Trimenopon spp.*)、タンカクハジラミ属種 (*Menopon spp.*)、トリノトン属種 (*Trinoton spp.*)、ボビコーラ属種 (*Bovicola spp.*)、ウエルネッキエラ属種 (*Werneckiella spp.*)、レピケントロン属種 (*Lepikentron spp.*)、ダマリナ属種 (*Damalina spp.*)、ケモノハジラミ属種 (*Trichodectes spp.*)、フェリコーラ属種 (*Felicola spp.*) が挙げられ；具体的な例は、ウシハジラミ (*Bovicola bovis*)、ヒツジハジラミ (*Bovicola ovis*)、ボビコーラ・リンバタ (*Bovicola limbata*)、ダマリナ・ボビス (*Damalina bovis*)、イヌハジラミ (*Trichodectes canis*)、ネコハジラミ (*Felicola subrostratus*)、ヤギハジラミ (*Bovicola caprae*)、レピケントロン・オビス (*Lepikentron ovis*)、ウエルネッキエラ・エクイ (*Werneckiella equi*) であり；

双翅目 (*Diptera*) およびカ亜目 (*Nematocera*) とハエ亜目 (*Brachycera*) からは、例えば、ヤブカ属種 (*Aedes spp.*)、ハマダラカ属種 (*Anopheles spp.*)、イエカ属種 (*Culex spp.*)、ブユ属種 (*Simulium spp.*)、ツノマユブユ属種 (*Eusimulium spp.*)、サンショウバエ属種 (*Phlebotomus spp.*)、ルツオミヤ属種 (*Lutzomyia spp.*)、サシバエ属種 (*Culicoides spp.*)、メクラアブ属種 (*Chrysops spp.*)、オダグミア属種 (*Odagmia spp.*)、ウィルヘルミア属種 (*Wilhelmia spp.*)、キボシアブ属種 (*Hybomitra spp.*)、アチロツス属種 (*Atylotus spp.*)、アブ属種 (*Tabanus spp.*)、ゴマフアブ属種 (*Haematopota spp.*)、フィリポミア属種 (*Philipomyia spp.*)、ブラウラ属種 (*Braula spp.*)、イエバエ属種 (*Musca spp.*)、トゲアシメマトイ属種 (*Hydrotaea spp.*)、サシバエ属種 (*Stomoxys spp.*)、ノサシバエ属種 (*Haematobia spp.*)、セジロイエバエ属種 (*Morellia spp.*)、ヒメイバエ属種 (*Fannia spp.*)、ツエツエバエ属種 (*Glossina spp.*)、オオクロバエ属種 (*Calliphora spp.*)、キンバエ属種 (*Lucilia spp.*)、オビキンバエ属種 (*Chrysomyia spp.*)、ウォールファールトニクバエ属種 (*Wohlfahrtia spp.*)、ニクバエ属種 (*Sarcophaga spp.*)、ヒツジバエ属種 (*Oestrus spp.*)、ヒフバエ属種 (*Hypoderma spp.*)、ウマバエ属種 (*Gasterophilus spp.*)、シラミバエ属種 (*Hippobosca spp.*)、シカシラミバエ属種 (*Lipoptena spp.*)、メロファグス属種 (*Melophagus spp.*)、リノエストルス属種 (*Rhinoestrus spp.*)、ガガンボ属種 (*Tipula spp.*) が挙げられ；具体的な例は、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、アエデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)

10

20

30

40

50

)、ガンビアハマダラカ (*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・マクリペンニス (*Anopheles maculipennis*)、カリホラ・エリツロケファラ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・ブルビアリス (*Chrysozona pluvialis*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレクス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、ヒメイエバエ (*Fannia canicularis*)、サルコファガ・カルナリア (*Sarcophaga carnaria*)、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*)、ヒロズキンバエ (*Lucilia sericata*)、シムリウム・レプタンス (*Simulium reptans*)、フレボトムス・パパタシ (*Phlebotomus papatasi*)、フレボトムス・ロンギバルピス (*Phlebotomus longipalpis*)、オダグミア・オルナタ (*Odagmia ornata*)、ウィルヘルミア・エキナ (*Wilhelmia equina*)、ブーフトラ・エリトロセファラ (*Boopthora erythrocephala*)、タバヌス・ブロミウス (*Tabanus bromius*)、タバヌス・スポドプテルス (*Tabanus spodopterus*)、タバヌス・アトラツス (*Tabanus atratus*)、タバヌス・スデチクス (*Tabanus sudeticus*)、ヒボミトラ・シウレア (*Hybomitra ciurea*)、クリソプス・カエクチエンス (*Chrysops caecutiens*)、クリソプス・レリクツス (*Chrysops relictus*)、ハエマトポタ・ブルビアリス (*Haematopota pluvialis*)、ハエマトポタ・イタリカ (*Haematopota italica*)、ムスカ・アウツムナリス (*Musca autumnalis*)、イエバエ (*Musca domestica*)、ハエマトビア・イリタンス・イリタンス (*Haematobia irritans irritans*)、ハエマトビア・イリタンス・エクシグア (*Haematobia irritans exigua*)、ハエマトビア・stimulans (*Haematobia stimulans*)、ヒドロタエア・イリタンス (*Hydrotaea irritans*)、ヒドロタエア・アルビプンクタ (*Hydrotaea albipuncta*)、クリソミア・クロロピガ (*Chrysomya chloropyga*)、クリソミア・ベツツィアナ (*Chrysomya bezzia*)、ヒツジバエ (*Oestrus ovis*)、ウシバエ (*Hypoderma bovis*)、キスジウシバエ (*Hypoderma lineatum*)、プルズヘバルスキアナ・シレヌス (*Przhevalskiana silenus*)、ヒトヒフバエ (*Dermatobia hominis*)、シラミバエ (*Melophagus ovinus*)、リポプテナ・カブレオリ (*Lipoptena capreoli*)、リポプテナ・セルビ (*Lipoptena cervi*)、ヒッポボスカ・バリエガタ (*Hippobosca variegata*)、ヒッポボスカ・エキナ (*Hippobosca equina*)、ウマバエ (*Gasterophilus intestinalis*)、アトアカウマバエ (*Gasterophilus haemorrhoidalis*)、ガステロフィルス・イネルミス (*Gasterophilus inermis*)、ムネアカウマバエ (*Gasterophilus nasalis*)、ガステロフィルス・ニグリコルニス (*Gasterophilus nigricornis*)、アカウマバエ (*Gasterophilus pecorum*)、ブラウラ・コエカ (*Braula coeca*) であり；

ノミ目 (*Siphonapterida*) から、例えば、ヒトノミ属種 (*Pulex* spp.)、イヌノミ属種 (*Ctenocephalides* spp.)、スナノミ属種 (*Tunga* spp.)、ネズミノミ属種 (*Xenopsylla* spp.)、ナガノミ属種 (*Ceratophyllus* spp.) が挙げられ；具体的な例は、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、スナノミ (

10

20

30

40

50

Tunga penetrans）、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) であり；

異翅目 (*Heteroptera*) からは、例えばトコジラミ属種 (*Cimex* spp.)、サシガメ属種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、パンストロンギルス属種 (*Panstrongylus* spp.) が挙げられ；

ゴキブリ目 (*Blattaria*) からは、例えば、トウヨウゴキブリ (*Blattella orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) およびチャオビゴキブリ属種 (*Supella* spp.) (例えば、チャオビゴキブリ (*Supella longipalpa*)) が挙げられ；

ダニ目 (*Acarina*) ならびにマダニ亜目 (*Metastigmata*) およびドゲダニ亜目 (*Mesostigmata*) からは、例えば、ナガヒメダニ属種 (*Argas* spp.)、カズキダニ属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ属種 (*Ixodes* spp.)、キララマダニ属種 (*Amblyomma* spp.)、コイタマダニ属 (ウシマダニ属) 種 (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、カクマダニ属種 (*Dermacentor* spp.)、ハエモフィサリス属種 (*Haemaphysalis* spp.)、イボマダニ属種 (*Hyalomma* spp.)、ワクモ属種 (*Dermanyssus* spp.)、コイタマダニ属種 (*Rhipicephalus* spp. (多宿主ダニの原属))、イエダニ属種 (*Ornithonyssus* spp.)、ニューモニスス属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Raillietia* spp.)、ニューモニスス属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属種 (*Sternostoma* spp.)、ハチダニ属種 (*Varroa* spp.)、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.) が

挙げられ；具体的な例は、ナガヒメダニ (*Argas persicus*)、アルガス・レフレクス (*Argas reflexus*)、オルニトドルス・モウバタ (*Ornithodoros moubata*)、オトビウス・メグニニ (*Otobius megnini*)、オウシマダニ (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*)、リピセファルス (ブーフイルス)・デコロラツス (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*)、リピセファルス (ブーフイルス)・アンヌラツス (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*)、リピセファルス (ブーフイルス)・カルセラツス (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*)、ヒアロンマ・アナトリクム (*Hyalomma anatolicum*)、ヒアロンマ・アエジプチックム (*Hyalomma aegypticum*)、ヒアロンマ・マルギナツム (*Hyalomma marginatum*)、ヒアロンマ・トランシエンス (*Hyalomma transiens*)、リピセファルス・エベルチ (*Rhipicephalus evertsi*)、マダニ (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ヘキサゴヌス (*Ixodes hexagonus*)、イクソデス・カニスガ (*Ixodes canisuga*)、イクソデス・ピロス (*Ixodes pilosus*)、イクソデス・ルビクンズ (*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカプラリス (*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス (*Ixodes holocyclus*)、ハエマフィサリス・コンシンナ (*Haemaphysalis concinna*)、ハエマフィサリス・プンクタタ (*Haemaphysalis punctata*)、ハエマフィサリス・シンナバリナ (*Haemaphysalis cinnabarina*)、ハエマフィサリス・オトフィラ (*Haemaphysalis otophila*)、ハエマフィサリス・リーチ (*Haemaphysalis leachi*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、デルマセントル・マルギナツス (*Dermacentor marginatus*)、デルマセントル・レチク

10

20

30

40

50

ラツス (*Dermacentor reticulatus*)、デルマセントル・ピクツス (*Dermacentor pictus*)、デルマセントル・アルビピクツス (*Dermacentor albipictus*)、デルマセントル・アンデルソニ (*Dermacentor andersoni*)、デルマセントル・バリアピリス (*Dermacentor variabilis*)、ヒアロンマ・マウリタニクム (*Hyalomma mauritanicum*)、リピセファルス・サンガイネウス (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファルス・ブルサ (*Rhipicephalus bursa*)、リピセファルス・アッペンジクラツス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファルス・カペンシス (*Rhipicephalus capensis*)、リピセファルス・ツラニクス (*Rhipicephalus turanicus*)、リピセファルス・ザンベジエンシス (*Rhipicephalus zambeziensis*)、アンブリオンマ・アメリカヌム (*Amblyomma americanum*)、アンブリオンマ・バリエガツム (*Amblyomma variegatum*)、アンブリオンマ・マクラツム (*Amblyomma maculatum*)、アンブリオンマ・ヘブラエウム (*Amblyomma hebraeum*)、アンブリオンマ・カジェネンシス (*Amblyomma cajennense*)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、ネッタイトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、パロア・ジャコブスコニ (*Varroa jacobsoni*) であり;

ケダニ類 (*Actiniedida*) の目 (前気門目 (*Prostigmata*)) およびコナダニ類 (*Acaridida*) の目 (無気門目 (*Astigmata*)) からは、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.)、ヒツジツメダニ属種 (*Psorergates* spp.)、ニキビダニ属種 (*Demodex* spp.)、ツツガムシ属種 (*Trombicula* spp.)、リストロホルス属種 (*Listrophorus* spp.)、コナダニ属種 (*Acarus* spp.)、チロファグス属種 (*Tyrophagus* spp.)、ゴミコナダニ属種 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属種 (*Pterolichus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属種 (*Psoroptes* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属種 (*Chorioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ属種 (*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.) が挙げられ、具体的な例は、ケイレチエラ・ヤスグリ (*Cheyletiella yasguri*)、ケイレチエラ・ブラケイ (*Cheyletiella blakei*)、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、ウシニキビダニ (*Demodex bovis*)、ヒツジニキビダニ (*Demodex ovis*)、ヤギニキビダニ (*Demodex caprae*)、ウマニキビダニ (*Demodex equi*)、デモデクス・カバリ (*Demodex caballi*)、ブタニキビダニ (*Demodex suis*)、アキダニ (*Neotrombicula autumnalis*)、ネオトロンビクラ・デサレリ (*Neotrombicula desaleri*)、ネオシエンガスタア・キセロテルモピア (*Neoschonegastia xerothermobia*)、トロンビクラ・アカムシ (*Trombicula akamushi*)、ミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ネコショウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*)、サルコプテス・カニス (*Sarcoptis canis*)、ウシセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes bovis*)、ヒツジセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes ovis*)、サルコプテス・ルピカブラエ (*Sarcopte*

10

20

30

40

50

s r u p i c a p r a e (= S . カ プ ラ エ (c a p r a e))、ウマセンコウヒゼンダニ (S a r c o p t e s e q u i)、ブタセンコウヒゼンダニ (S a r c o p t e s s u i s)、ヒツジキュウセンヒゼンダニ (P s o r o p t e s o v i s)、ウサギキュウセンヒゼンダニ (P s o r o p t e s c u n i c u l i)、ウマキュウセンヒゼンダニ (P s o r o p t e s e q u i)、ウシシヨクヒゼンダニ (C h o r i o p t e s b o v i s)、プソエルガテス・オビス (P s o e r g a t e s o v i s)、ニューモニソイディック・マンゲ (P n e u m o n y s s o i d i c m a n g e)、ニューモニソイデス・カニヌム (P n e u m o n y s s o i d e s c a n i n u m)、アカリンドニ (A c a r a p i s w o o d i) である。

【 0 1 6 2 】

本発明の活性成分は、動物を攻撃する節足動物、蠕虫および原生動物の防除にも適している。攻撃される動物としては、農業の家畜 (l i v e s t o c k)、例えば、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、バッファロー、ウサギ、ニワトリ、シチメンチヨウ、アヒル、ガチョウ、養殖魚、ミツバチが挙げられる。前記動物には、伴侶動物とも呼ばれる家畜 (d o m e s t i c a n i m a l)、例えば、イヌ、ネコ、かごの鳥、観賞魚、ならびに実験動物として公知のもの、例えばハムスター、モルモット、ラットおよびマウスなど、も挙げられる。

【 0 1 6 3 】

これらの節足動物、蠕虫および / または原生動物の防除は、宿主動物の死亡事例を低減させるはずであり、宿主動物の生産力 (肉、乳、羊毛、皮、卵、蜂蜜などについて) および健康を向上させるはずであり、そのため本発明の活性成分の使用によって、より経済的に採算が合う、より容易な畜産が可能になる。

【 0 1 6 4 】

例えば、寄生虫による宿主からの血液摂取を (必要に応じて) 防止または阻止することが望ましい。寄生虫の防除は、感染性物質の伝達の防止にも貢献し得る。

【 0 1 6 5 】

動物衛生の分野に関して本明細書において用いる場合の用語「防除する」は、本活性成分が、そのような寄生虫に寄生された動物における当該寄生虫の発生を無害なレベルに低下させることにより、作用することを意味する。より具体的には、「防除する」は、本明細書において用いる場合、本活性成分が、当該寄生虫を死滅させる、その成長を遅らせる、またはその増殖を阻害することを意味する。

【 0 1 6 6 】

一般に、本発明の活性成分を動物の処置に用いるときには、直接使用することができる。好ましくは、先行技術分野において公知の医薬的に許容される賦形剤および / または助剤を含み得る医薬組成物の形態で、本活性成分を使用する。

【 0 1 6 7 】

動物衛生セクターでは、および畜産では、本活性成分を公知の方法で、例えば錠剤、カプセル、頓服水剤、水薬、顆粒、ペースト、ボラス、経餌法 (f e e d - t h r o u g h p r o c e s s) および坐剤の形態での経腸投与によって、非経口投与によって、例えば注射 (なかなく筋肉内注射、皮下注射、静脈内注射、腹腔内注射) によって、インプラント、鼻投与によって、例えば浸し掛けもしくは沐浴の形態、噴霧形態、浴びせる (p o u r i n g o n) および特定のスポットに適用する (s p o t t i n g o n) 形態、洗浄およびパウダリング形態で皮膚投与によって、ならびにまた、本活性成分を含有する成形品、例えば首輪、耳標、尾標、肢バンド (l i m b b a n d)、端綱、マーキング装置などを用いて使用する (投与する)。本活性成分をシャンプーとして調合することができ、またはエーロゾルもしくは非加圧スプレー、例えばポンプスプレーおよびアトマイズスプレー、で利用できる適する製剤として調合することができる。

【 0 1 6 8 】

家畜、家禽、家庭のペットなどに使用する場合、本発明の活性成分は、1 から 80 重量 % の量の本活性成分を直接含有するまたは希釈 (例えば、100 から 10000 倍希釈)

10

20

30

40

50

後に含有する製剤（例えば、粉剤、水和剤〔「WP」〕、エマルジョン、乳剤〔「EC」〕、易流動性組成物、均質溶液および懸濁濃縮製剤〔「SC」〕）として使用することができる。または薬浴として使用することができる。

【0169】

本発明の化合物が、工業材料を破壊する昆虫に対して強力な殺虫作用を有することも判明した。

【0170】

好ましい、しかし非限定的な例としては、以下の昆虫が挙げられる：

甲虫類、例えば、ヨーロッパイカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム (*Xestobium rufovillosum*)、プチリヌス・ペクチコルニス (*Ptilinus pecticornis*)、デンドロビウム・ペルチネクス (*Dendrobium pertinex*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Priobium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセンヌ (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテス・ルギコリス (*Minthes rugicollis*)、キシレボルス属種 (*Xyleborus spec.*)、トリポトデンドロン属種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシンス (*Bostrychus capucinus*)、ヘテロボストリクス・ブルネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、フタトゲナガシンクイ属種 (*Sinoxylon spec.*)、チビタケナガシンクイ (*Dinoderus minutus*)；

ハサミムシ類、例えば、コルリキバチ (*Sirex juvencus*)、ウロセルス・ギガス (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas taignus*)、ウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*)；

シロアリ類、例えば、カロテルメス・フラビコリス (*Kaloterмес flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ (*Cryptotermes brevis*)、ヘテロテルメス・インジコラ (*Heterotermes indicola*)、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・サントネンシス (*Reticulitermes santone nsis*)、レチクリテルメス・ルシフグス (*Reticulitermes lucifugus*)、マストテルメス・ダルウィニエンシス (*Mastotermes darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)；

シミ類、例えば、セイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)。

【0171】

これに関連して、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、サイズ剤、紙および厚紙、皮革、木材、木工製品ならびに塗料組成物、を意味するものと解される。

【0172】

使用準備済みの組成物は、他の殺虫剤を含んでいてもよく、1つ以上の殺真菌剤を含んでいてもよい。

【0173】

可能な追加の混合パートナーに関しては、上に名を挙げた殺虫剤および殺真菌剤を参照する。

10

20

30

40

50

【0174】

同時に、本発明の化合物は、塩水または淡塩水に接触する物体、特に船体、スクリーン、ネット、建築物、係留設備および信号システム、を汚損から保護するために使用することができる。

【0175】

加えて、本発明の化合物は、単独でまたは他の活性成分と併用で、防汚組成物として使用することができる。

【0176】

本活性成分は、家庭セクターにおける、衛生セクターにおけるおよび貯蔵品の保護における動物有害生物、特に、密閉空間、例えば家庭、工場ホール、オフィス、車室内およびこれらに類するもの、において見出される昆虫、クモ形動物およびダニ、の防除にも適している。本活性成分を単独で使用して、または家庭用殺虫剤製品中の他の活性成分および助剤と併用して、これらの有害生物を防除することができる。本活性成分は、感受性および耐性種に対して、ならびにすべての発育段階に対して、有効である。これらの有害生物としては、以下のものが挙げられる：

サソリ目 (*Scorpionidea*) から、例えば、セスジサソリ (*Buthus occitanus*)。

【0177】

ダニ目 (*Acarina*) から、例えば、アルガス・ペルシクス (*Argas persicus*)、アルガス・レフレクス (*Argas reflexus*)、ブリオピア属種 (*Bryobia spp.*)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、グリシファグス・ドメスチクス (*Glyciphagus domesticus*)、オルニトドルス・モウバト (*Ornithodoros moubat*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、アメリカツツガムシ (*Trombicula alfreddugesi*)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、デルマトファゴイデス・プテロニシムス (*Dermatophagoides pteronissimus*)、デルマトファゴイデス・ホリナエ (*Dermatophagoides forinae*)。

【0178】

クモ目 (*Araneae*) から、例えば、オオツチグモ科 (*Aviculariidae*)、コガネクモ科 (*Araneidae*)。

【0179】

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

【0180】

等脚目 (*Isopoda*) から、例えば、ホンワラジムシ (*Oniscus asellus*)、ワラジムシ (*Porcellio scaber*)。

【0181】

倍脚網 (*Diplopoda*) の目から、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)、モトオビヤスデ属種 (*Polydesmus spp.*)。

【0182】

唇脚目 (*Chilopoda*) から、例えば、ジムカデ属種 (*Geophilus spp.*)。

【0183】

総尾目 (*Zygentoma*) から、例えば、ヤマトシミ属種 (*Ctenolepisma spp.*)、セイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)、レピスモ

10

20

30

40

50

デス・インキリヌス (*Lepismodes inquilinus*)。

【0184】

ゴキブリ目 (*Blattaria*) から、例えば、ブラッタ・オリエンタリエス (*Blatta orientalis*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、アジアゴキブリ (*Blattella asahinai*)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ属種 (*Panchlora* spp.)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta* spp.)、オーストラリアゴキブリ (*Periplaneta australasiae*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、チャオビゴキブリ (*Supella longipalpa*)。

10

跳躍目 (*Saltatoria*) から、例えば、ヨーロッパイエコオロギ (*Achet a domesticus*)。

【0185】

等翅目 (*Isoptera*) から、例えば、カロテルメス属種 (*Kaloterme s* spp.)、ヤマトシロアリ属 (*Reticuliterme s* spp.)。

【0186】

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

鞘翅目 (*Coleoptera*) から、例えば、マルカツオブシムシ属種 (*Anthre nus* spp.)、ヒメカツオブシムシ属種 (*Attagenus* spp.)、カツオブシムシ属種 (*Dermestes* spp.)、コゴメゴミダマシムシ (*Latheticus oryzae*)、ネクロビア属種 (*Necrobia* spp.)、プチヌス属種 (*Ptinus* spp.)、コナガシンクイムシ (*Rhizopertha dominica*)、グラナリアコクゾウムシ (*Sitophilus granarius*)、ココクゾウムシ (*Sitophilus oryzae*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ジンサンシバンムシ (*Stegobium paniceum*)。

20

【0187】

双翅目 (*Diptera*) から、例えば、ネツタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、アエデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、ハマダラカ属種 (*Anopheles* spp.)、カリホラ・エリツロケファラ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysozona pluvialis*)、ネツタイイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレクス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、ショウジョウバエ属種 (*Drosophila* spp.)、ヒメイエバエ (*Fannia canicularis*)、イエバエ (*Musca domestica*)、サンチョウバエ属種 (*Phlebotomus* spp.)、サルコファガ・カルナリア (*Sarcophaga carnaria*)、ブユ属種 (*Simulium* spp.)、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)。

30

40

【0188】

鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えば、コハチノスツヅリガ (*Achroia grisella*)、ハチノスツヅリガ (*Galleria mellonella*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、イガ (*Tinea pellionella*)、コイガ (*Tineola bisselliella*)。

【0189】

ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、イヌノミ (*Ctenocephala*

50

lides canis)、ネコノミ(Ctenocephalides felis)、ヒトノミ(Pulex irritans)、スナノミ(Tunga penetrans)、ケオプスネズミノミ(Xenopsylla cheopis)。

【0190】

膜翅目(Hymenoptera)から、例えば、カンポノツス・ヘルクレアヌス(Camponotus herculeanus)、クロクサアリ(Lasius fuliginosus)、トビイロケアリ(Lasius niger)、アメイロケアリ(Lasius umbratus)、イエヒメアリ(Monomorium pharaonis)、パラベスプラ属種(Paravespula spp.)、トビイロシワアリ(Tetramorium caespitum)。

10

【0191】

シラミ目(Anoplura)から、例えば、ペディクルス・フマヌス・カピティス(Pediculus humanus capitis)、コロモジラミ(Pediculus humanus corporis)、ペムフィグス属種(Pemphigus spp.)、フィロエラ・バスタトリクス(Phylloera vastatrix)、フチルス・プビス(Phthirus pubis)。

異翅目(Heteroptera)から、例えば、タイワントコジラミ(Cimex hemipterus)、トコジラミ(Cimex lectularius)、ベネズエラサシガメ(Rhodinus prolixus)、ブラジルサシガメ(Triatoma infestans)。

20

【0192】

家庭用殺虫剤の分野では、本活性化合物を単独で使用するか、または他の適した活性成分、例えばリン酸エステル、カルバメート、ピレトロイド、ネオニコチノイド、成長調節剤、もしくは他の公知の殺虫剤類からの活性成分、と併用する。

【0193】

それらを、エーロゾル、非加圧スプレー製品、例えばポンプおよびアトマイザーズプレー、自動燻煙システム、燻煙剤、フォーム、ゲル、(セルロースもしくはプラスチック製の蒸発器用錠剤を備えた)蒸発器製品、液体蒸発器、ゲルおよび膜蒸発器、プロペラ駆動蒸発器、エネルギー・フリーもしくは受動的蒸発システム、防虫紙(moth paper)、防虫バッグ(moth bag)および防虫ゲル(moth gel)に、粒剤もしくは粉剤として、ばらまくための餌に、または餌ステーションに使用する。

30

【0194】

調製方法および中間体の説明

調製例

実施例番号B:

4 - アミノ - 3 - (tert - ブチルカルバモイル) - 5 - メチル安息香酸メチルの合成

3.0 g (8.04 mmol) の 2 - アミノ - N - tert - ブチル - 5 - ヨード - 3 - メチルベンズアミド、1.78 g (17.68 mmol) のトリエチルアミンおよび 0.56 g (0.80 mmol) のビス(トリフェニルホスフィン)パラジウムジクロリドを 40 mL のメタノールに添加し、その混合物をオートクレーブにおいて 110 °C で、115 bar の一酸化炭素下で、9 時間攪拌する。混合物を濾過し、固体をメタノールで洗浄し、有機相を濃縮する。クロマトグラフィー精製により、所望の生成物を得る。

40

【0195】

(log P : 2.48 ; MH⁺ : 265 ; ¹H NMR (400 MHz, DMSO、ppm) : 1.38 (s, 9H)、2.11 (s, 3H)、3.77 (s, 3H)、6.63 (br. s, 2H)、7.63 (s, 1H)、7.84 (s, 1H)、7.88 (s, 1H)

調製例

上で説明した調製方法を用いて、式(I)の化合物を得ることができ、それらの式(I)

50

)の化合物の一部は、位置異性体として存在し得る。下記の表において、NMRデータに関連して、化学シフトおよび対応するシグナル強度をケースごとに、例えば化合物1について、報告する：

シグナル1

10.310 ; 0.82 ; 10.310 ppm (化学シフト) 0.82 (シグナル強度) について；

シグナル2

8.477 ; 0.62 ; 8.477 ppm (化学シフト) 0.62 (シグナル強度) について；

【0196】

【表1】

番号	構造	LOGP (HCOOH)	MH+	NMR(DMSO-d6)
1		3,26	604	(10.310;0.82),(8.477;0.62),(8.474;0.66),(8.466;0.67),(8.462;0.65),(8.156;0.60),(8.152;0.61),(8.135;0.68),(8.132;0.64),(7.891;0.74),(7.887;0.77),(7.753;0.84),(7.748;0.78),(7.606;0.69),(7.594;1.39),(7.586;0.77),(7.574;0.61),(7.344;1.10),(6.324;2.53),(3.289;48.00),(2.574;5.25),(2.538;0.40),(2.521;0.32),(2.508;4.90),(2.503;9.61),(2.499;12.79),(2.494;9.10),(2.490;4.30),(2.222;3.51),(1.225;15.00),(-0.000;1.27)
2		2,77	578	(10.469;2.41),(8.483;1.92),(8.480;2.04),(8.472;2.17),(8.468;2.27),(8.457;0.47),(8.453;0.42),(8.326;1.11),(8.315;1.10),(8.160;1.81),(8.156;1.82),(8.140;2.17),(8.136;2.06),(8.118;0.41),(8.114;0.37),(7.923;2.36),(7.920;2.57),(7.866;2.74),(7.862;2.43),(7.606;1.89),(7.594;1.89),(7.591;0.77),(7.586;1.82),(7.579;0.63),(7.574;1.82),(7.570;0.57),(7.559;0.37),(7.380;2.39),(7.330;0.42),(6.318;7.13),(6.100;1.16),(3.940;0.32),(3.858;16.00),(3.313;473.05),(3.290;6.23),(2.677;7.60),(2.665;7.72),(2.540;0.73),(2.523;2.22),(2.510;26.00),(2.505;47.75),(2.501;62.03),(2.496;43.35),(2.492;21.02),(2.405;0.79),(2.332;0.35),(2.327;0.45),(2.217;10.00),(1.987;0.78),(1.175;0.42),(-0.000;0.93)
3		3,21	606	(10.377;2.77),(8.471;1.97),(8.467;2.08),(8.459;2.16),(8.455;2.19),(8.444;0.40),(8.441;0.38),(8.147;2.06),(8.143;2.12),(8.132;1.77),(8.127;2.89),(8.123;2.55),(8.113;1.56),(8.105;0.68),(8.101;0.49),(7.914;2.53),(7.911;2.68),(7.819;2.77),(7.815;2.62),(7.602;1.95),(7.590;1.97),(7.586;0.79),(7.581;1.88),(7.574;0.63),(7.569;1.85),(7.381;2.98),(7.332;0.46),(6.321;7.37),(6.102;1.07),(3.943;0.72),(3.939;0.67),(3.927;1.06),(3.908;1.00)

10

20

30

40

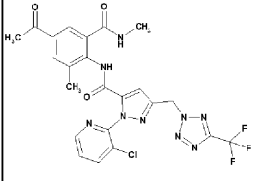
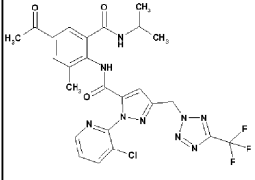
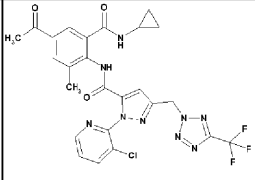
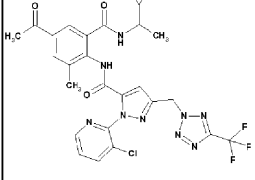
番号	構造	LOGP (HCOOH)	MH+	NMR(DMSO-d6)
), (3.891;0.92), (3.861;16.00), (3.303;208.29), (3.280;1.94), (2.669;0.36), (2.539;0.70), (2.509;21.88), (2.504;40.04), (2.500;51.92), (2.496;36.82), (2.491;18.21), (2.327;0.39), (2.226;10.27), (2.070;0.45), (1.072;0.32), (1.031;4.19), (1.025;14.08), (1.015;4.81), (1.009;14.03), (-0.000;4.52)
4		3,52	620	(10.310;1.08), (8.478;0.71), (8.474;0.73), (8.466;0.80), (8.462;0.77), (8.159;0.68), (8.155;0.65), (8.139;0.81), (8.135;0.74), (7.891;0.94), (7.887;0.99), (7.770;1.00), (7.766;1.00), (7.650;1.09), (7.607;0.69), (7.595;0.70), (7.587;0.67), (7.575;0.66), (7.343;1.30), (6.327;2.65), (6.108;0.40), (3.857;5.71), (3.307;43.52), (2.509;4.45), (2.505;7.99), (2.500;10.19), (2.496;7.14), (2.492;3.45), (2.217;3.80), (2.208;0.91), (1.221;4.21), (1.214;16.00)
5		2,56	564	(10.527;1.78), (8.491;1.97), (8.487;2.10), (8.479;2.23), (8.475;2.25), (8.465;0.46), (8.462;0.41), (8.159;1.68), (8.155;1.68), (8.139;2.10), (8.135;1.99), (8.118;0.38), (8.114;0.35), (7.952;2.10), (7.920;2.35), (7.863;0.75), (7.605;1.73), (7.593;1.82), (7.585;1.74), (7.579;0.68), (7.573;1.69), (7.559;0.40), (7.556;0.35), (7.536;0.52), (7.517;0.41), (7.476;1.19), (7.362;1.25), (7.026;0.68), (7.007;0.63), (6.308;7.01), (6.090;1.15), (5.747;1.88), (4.040;0.38), (4.022;0.36), (3.890;0.41), (3.862;16.00), (3.835;0.44), (3.306;149.57), (2.539;0.65), (2.509;18.46), (2.505;33.45), (2.500;43.01), (2.496;30.51), (2.492;15.15), (2.405;5.46), (2.199;9.30), (2.070;0.47), (1.987;1.54), (1.193;0.42), (1.175;0.84), (1.157;0.43), (-0.000;2.30)
6		2,87	606	(10.083;1.10), (8.474;0.71), (8.470;0.76), (8.462;0.77), (8.458;0.75), (8.153;0.69), (8.150;0.69), (8.133;0.77), (8.130;0.73), (7.604;0.72), (7.592;0.71), (7.583;0.69), (7.572;0.66), (7.311;1.98), (7.250;0.91), (7.190;1.10), (7.182;1.39), (6.319;2.89), (5.746;0.79), (5.171;0.92), (5.160;0.94), (4.686;0.33), (4.682;0.34), (3.312;126.86), (2.509;7.69), (2.505;14.02), (2.500;18.07), (2.496;12.68), (2.492;6.18), (2.128;3.90), (1.305;2.43), (1.289;2.42), (1.195;16.00), (-0.000;1.02)
7		3	619	(11.241;2.57), (10.161;1.13), (8.476;0.72), (8.473;0.75), (8.465;0.77), (8.461;0.74), (8.156;0.70), (8.153;0.68), (8.136;0.78), (8.132;0.72), (7.606;0.72), (7.594;0.72), (7.585;0.69), (7.574;0.69), (7.556;0.85), (7.553;0.92), (7.480;0.97), (7.475;0.87), (7.438;1.15), (7.324;1.87), (6.320;2.76), (3.315;27.1.67), (2.540;0.59), (2.510;14.54), (2.505;26.34), (2.501;33.77), (2.496;23.56), (2.492;11.48), (2.167;3.92), (2.134;5.79), (1.987;0.65), (1.207;16.00), (1.193;0.52), (1.175;0.43)

10

20

30

40

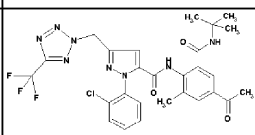
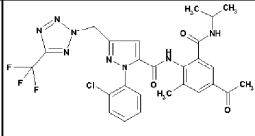
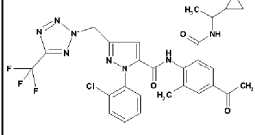
番号	構造	LOGP	MH +	NMR
8		2,53	562	(10.4922;2.63),(8.4851;1.95),(8.4814;2.05),(8.4734;2.09),(8.4696;1.98),(8.3314;1.16),(8.3200;1.13),(8.1605;1.89),(8.1568;1.88),(8.1403;2.10),(8.1366;1.93),(7.9219;2.31),(7.9186;2.51),(7.8666;2.70),(7.8623;2.31),(7.6066;1.96),(7.5948;1.91),(7.5864;1.82),(7.5747;1.78),(7.3828;3.06),(6.3196;7.87),(4.0393;0.85),(4.0215;0.84),(3.3049;223.69),(2.7305;0.48),(2.7191;0.53),(2.6939;6.95),(2.6824;6.88),(2.6693;0.63),(2.6646;0.45),(2.6231;0.99),(2.5789;16.00),(2.5391;0.83),(2.5087;22.53),(2.5044;40.54),(2.5000;52.50),(2.4957;36.63),(2.4915;18.05),(2.3310;0.34),(2.3225;0.85),(2.2212;10.86),(2.1698;0.60),(1.9868;3.67),(1.1927;1.02),(1.1749;2.01),(1.1571;1.00),(-0.0002;0.97)
9		2,94	590	(10.3872;2.90),(8.4727;2.00),(8.4690;1.96),(8.4609;2.08),(8.4573;1.87),(8.1478;1.98),(8.1441;1.83),(8.1275;2.20),(8.1239;1.94),(8.1025;1.58),(8.0833;1.55),(7.9203;2.70),(7.9168;2.71),(7.8023;2.89),(7.7980;2.62),(7.6024;1.90),(7.5907;1.88),(7.5822;1.77),(7.5705;1.67),(7.3829;3.48),(6.3215;8.33),(4.0390;0.36),(4.0217;0.36),(3.9529;0.66),(3.9361;1.02),(3.9178;0.99),(3.9018;0.63),(3.3040;331.95),(2.6735;0.51),(2.6689;0.62),(2.6246;0.64),(2.5797;16.00),(2.5389;1.40),(2.5043;69.68),(2.5000;84.86),(2.4961;59.63),(2.3268;0.96),(2.2324;11.63),(2.1639;0.42),(1.9867;1.49),(1.1927;0.50),(1.1749;0.89),(1.1571;0.43),(1.0887;0.56),(1.0720;0.64),(1.0370;14.81),(1.0205;14.60),(-0.0002;1.85)
10		2,73	588	(10.4009;2.73),(10.1948;0.35),(8.4852;2.02),(8.4814;2.30),(8.4735;2.18),(8.4697;2.27),(8.3532;1.65),(8.3428;1.64),(8.1664;0.40),(8.1577;2.11),(8.1540;2.09),(8.1375;2.14),(8.1338;2.07),(7.9132;2.41),(7.9098;2.48),(7.7917;2.67),(7.7872;2.47),(7.6643;0.33),(7.6078;1.99),(7.5960;1.98),(7.5876;1.94),(7.5826;0.55),(7.5758;1.82),(7.5607;0.35),(7.3903;3.26),(7.3571;0.57),(6.3261;8.07),(4.0392;0.56),(4.0213;0.61),(3.3041;433.90),(2.7272;0.33),(2.7164;0.58),(2.7068;0.79),(2.6984;1.24),(2.6887;1.24),(2.6797;1.01),(2.6696;1.17),(2.6645;0.75),(2.6159;0.83),(2.5706;16.00),(2.5390;1.62),(2.5086;43.35),(2.5043;77.99),(2.4999;99.19),(2.4956;69.88),(2.3263;0.99),(2.3070;1.51),(2.2251;10.94),(2.1720;0.64),(2.1608;1.41),(1.9867;2.53),(1.9078;0.48),(1.1926;0.70),(1.1748;1.35),(1.1571;0.67),(0.7787;0.32),(0.7714;0.36),(0.6284;0.77),(0.6157;2.06),(0.6104;2.66),(0.5982;2.55),(0.5924;2.30),(0.5811;0.96),(0.5752;0.45),(0.4471;0.91),(0.4366;2.61),(0.4303;2.49),(0.4266;2.35),(0.4209;2.20),(0.4086;0.84),(-0.0002;1.84)
11		3,23	616	(10.386;2.96),(8.477;2.05),(8.473;2.08),(8.465;2.16),(8.461;1.99),(8.172;1.63),(8.149;2.80),(8.145;2.18),(8.128;2.20),(8.125;1.94),(7.933;2.64),(7.930;2.66),(7.814;2.87),(7.810;2.63),(7.604;1.96),(7.593;1.90),(7.584;1.81),(7.572;1.74),(7.379;3.54),(6.317;8.40),(3.310;368.48),(3.288;3.46),(2.675;0.36),(2.671;0.47),(2.666;0.35),(2.586;16.00),(2.540;1.01),(2.510;28.26),(2.506;49.14),(2.501;61.32),(2.497;42.84),(2.328;0.49),(2.234;11.52),(1.988;0.82),(1.176;0.46),(1.078;6.85),(1.061;6.75),(0.858;0.40),(0.850;0.54),(0.838;1.00),(0.826;0.73),(0.817;0.98),(0.805;0.59),(0.798;0.39),(0.371;0.47),(0.362;0.98),(0.354;0.82),(0.350;0.88),(0.341;1.05),(0.328;0.53),(0.319;0.41),(0.224;0.59),(0.214;0.82),(0.207;0.94),(0.203;1.02),(0.193;1.25),(0.188;1.09),(0.179;1.03),(0.172;1.05),(0.167;1.40),(0.156;1.17),(0.148;1.00),(0.144;0.96),(0.136;1.11),(0.128;

10

20

30

40

番号	構造	LOGP	MH +	NMR
				1.08),(0.115;0.73),(0.105;0.46),(0.001;0.48)
12		3,76	603	(10.2653;0.87),(7.8981;0.95),(7.7560;0.93),(7.7139;0.81),(7.5783;0.54),(7.5650;0.87),(7.4827;0.84),(7.4709;1.68),(7.4603;0.84),(7.4581;0.83),(7.4487;0.74),(7.3187;1.00),(6.8705;0.55),(6.6603;0.33),(6.3134;1.99),(3.6120;0.85),(3.6105;0.49),(3.6079;0.46),(3.6064;0.38),(3.6051;0.62),(3.6010;2.03),(3.5969;0.64),(3.5941;0.46),(3.5914;0.48),(3.5900;0.87),(3.3557;1.15),(3.3446;421.02),(3.3321;0.84),(3.3209;7.92),(2.6915;1.41),(2.6175;0.47),(2.6144;0.62),(2.6114;0.46),(2.5891;0.94),(2.5784;5.20),(2.5422;0.37),(2.5236;0.99),(2.5219;1.57),(2.5208;1.40),(2.5176;1.13),(2.5088;30.78),(2.5057;69.35),(2.5027;96.24),(2.4996;69.24),(2.4966;31.05),(2.3899;0.41),(2.3869;0.59),(2.3838;0.43),(2.2677;0.69),(2.2178;3.24),(2.1829;0.94),(2.0767;0.75),(1.7707;0.84),(1.7656;0.73),(1.7629;0.45),(1.7596;2.37),(1.7565;0.48),(1.7537;0.73),(1.7486;0.83),(1.5513;0.35),(1.3855;0.32),(1.3544;7.77),(1.2607;0.53),(1.2545;0.34),(1.2494;0.33),(1.2460;0.47),(1.2367;0.47),(1.2111;16.00),(0.0053;1.18),(-0.0002;42.61),(-0.0057;1.09)
13		3,46	589	(10.3449;0.96),(10.1893;0.45),(10.1413;0.72),(8.2680;0.44),(8.2001;0.77),(8.1886;0.78),(7.9886;0.53),(7.9763;0.45),(7.9635;0.48),(7.9243;1.89),(7.8884;0.47),(7.8076;1.61),(7.7473;0.47),(7.7108;0.87),(7.6102;0.85),(7.6075;0.86),(7.5700;0.75),(7.5657;1.98),(7.5572;1.01),(7.5531;2.65),(7.5499;1.97),(7.5339;0.41),(7.4879;2.31),(7.4849;1.56),(7.4748;4.20),(7.4654;2.89),(7.4521;2.42),(7.4499;2.33),(7.4414;1.50),(7.4375;2.18),(7.4271;1.03),(7.4056;0.37),(7.4029;0.34),(7.3475;1.40),(7.3186;1.55),(7.0325;0.34),(6.8708;1.34),(6.6615;0.79),(6.3053;6.58),(6.0878;0.96),(3.9490;0.46),(3.9379;0.98),(3.9268;1.52),(3.9153;1.53),(3.9037;1.06),(3.8931;0.48),(3.8458;0.42),(3.8354;0.57),(3.8251;0.42),(3.6010;0.33),(3.3724;1.01),(3.3510;904.54),(3.3273;5.08),(2.6288;3.42),(2.6179;0.63),(2.6149;0.82),(2.6119;0.61),(2.6088;0.33),(2.5830;14.46),(2.5425;0.37),(2.5242;1.04),(2.5211;1.31),(2.5180;1.31),(2.5091;40.92),(2.5061;89.30),(2.5031;122.81),(2.5001;89.47),(2.4972;40.22),(2.4673;0.35),(2.4051;0.45),(2.3903;0.56),(2.3873;0.77),(2.3843;0.56),(2.3258;2.26),(2.3000;0.73),(2.2715;0.46),(2.2547;0.72),(2.2273;7.19),(2.2075;6.53),(2.1830;2.47),(2.1772;3.88),(2.1698;0.79),(2.1617;2.49),(2.1367;0.33),(2.0766;1.12),(1.7596;0.39),(1.3546;16.00),(1.1768;0.32),(1.1659;0.34),(1.1611;0.37),(1.1582;0.67),(1.1480;0.69),(1.1268;6.11),(1.1165;6.11),(1.0835;3.09),(1.0726;3.10),(1.0667;0.90),(1.0549;1.55),(1.0432;1.33),(1.0269;12.07),(1.0159;12.07),(1.0066;5.18),(1.0006;1.54),(0.9956;4.67),(0.9774;0.36),(0.0052;0.42),(-0.0002;14.01),(-0.0057;0.43)
14		3,74	615	(10.3352;0.96),(8.2806;0.44),(8.2533;0.67),(8.2332;0.67),(7.9317;2.10),(7.8934;0.38),(7.8888;0.34),(7.8218;1.82),(7.5717;0.93),(7.5678;1.16),(7.5642;0.74),(7.5543;1.11),(7.5506;2.45),(7.5470;1.38),(7.5416;0.38),(7.5310;0.34),(7.5011;0.71),(7.4939;0.88),(7.4853;1.12),(7.4783;1.91),(7.4716;1.26),(7.4596;4.72),(7.4538;2.75),(7.4426;1.68),(7.4384;0.58),(7.4332;0.43),(7.4290;0.56),(7.4225;0.35),(7.3408;2.04),(6.8717;0.66),(6.6428;0.34),(6.2962;6.10),(6.0801;0.83),(3.3553;65.57),(3.3507;68.70),(3.3479;66.64),(3.3463;66.86),(3.3400;99.77),(3.3165;2.23),(3.2947;0.61),(2.6323;2.06),(2.5877;16.00),(2.5677;0.33),(2.5254;0.68),(2.5121;14.82),(2.5076;30.85),(2.5

10

20

30

40

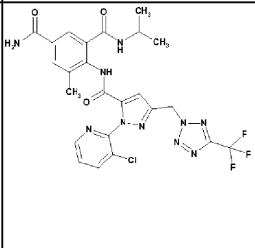
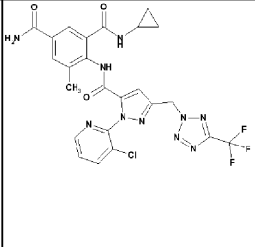
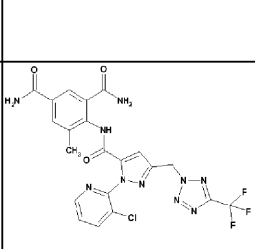

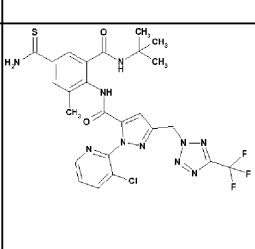
番号	構造	LOGP	MH +	NMR
				030;41.15),(2.4984;29.01),(2.4939;15.04),(2.3264;1.48),(2.2301;9.12),(2.1834;1.38),(2.1611;1.54),(2.0730;0.86),(1.3558;8.10),(1.1336;0.84),(1.1168;0.88),(1.0758;5.18),(1.0591;5.16),(0.8521;0.39),(0.8448;0.44),(0.8320;0.72),(0.8201;0.59),(0.8120;0.70),(0.7997;0.45),(0.3795;0.34),(0.3721;0.53),(0.3677;0.48),(0.3583;0.86),(0.3520;0.73),(0.3465;0.84),(0.3360;0.85),(0.3254;0.49),(0.3166;0.39),(0.2153;0.36),(0.2060;0.64),(0.2006;0.61),(0.1916;1.00),(0.1869;0.92),(0.1789;0.97),(0.1711;1.53),(0.1583;1.38),(0.1440;1.37),(0.1351;1.06),(0.1304;1.00),(0.1230;0.91),(0.1136;0.61),(0.1079;0.52),(-0.0002;5.35)
15		3,05	561	(10.4300;2.91),(8.3885;1.05),(8.3763;1.04),(7.9230;2.43),(7.8698;2.48),(7.5811;1.30),(7.5761;1.39),(7.5610;1.89),(7.5587;1.84),(7.5109;0.98),(7.5037;1.06),(7.4961;1.17),(7.4933;1.47),(7.4882;2.68),(7.4825;2.58),(7.4768;1.13),(7.4643;3.22),(7.4586;2.60),(7.4462;1.15),(7.4413;1.19),(7.4350;0.42),(7.4269;0.52),(7.4232;0.51),(7.3383;2.87),(6.2996;7.29),(6.0827;0.65),(3.3282;475.99),(3.3048;1.56),(2.6841;7.87),(2.6725;8.09),(2.5808;16.00),(2.5407;0.39),(2.5238;0.98),(2.5057;58.66),(2.5017;77.96),(2.3326;0.40),(2.3283;0.53),(2.2228;9.74),(2.0733;3.72),(-0.0002;6.77)
16		3,27	575	(10.3990;2.81),(8.3973;0.62),(8.3830;1.16),(8.3707;0.64),(7.9230;2.21),(7.8491;2.19),(7.8454;2.05),(7.5754;1.30),(7.5711;0.90),(7.5688;0.76),(7.5550;2.25),(7.5512;1.37),(7.5469;0.37),(7.5028;1.08),(7.4950;1.53),(7.4794;4.23),(7.4705;0.41),(7.4626;2.13),(7.4596;2.19),(7.4549;2.11),(7.4465;0.73),(7.4437;0.68),(7.4371;1.27),(7.4227;0.49),(7.4190;0.63),(7.4138;0.33),(7.3390;2.65),(6.3005;6.90),(6.0836;0.72),(3.3254;34.0.98),(3.3021;0.99),(3.1962;0.57),(3.1784;1.96),(3.1643;2.10),(3.1604;2.13),(3.1464;2.02),(3.1283;0.61),(2.6752;0.32),(2.6706;0.46),(2.6657;0.37),(2.5828;16.00),(2.5406;0.37),(2.5238;0.83),(2.5192;1.18),(2.5058;47.11),(2.5015;64.08),(2.4981;41.95),(2.3282;0.42),(2.2251;9.11),(2.0735;3.10),(1.0450;0.40),(1.0297;0.46),(1.0188;4.12),(1.0007;9.02),(0.9827;4.00),(-0.0002;9.17)
17		1,94	563	(10.3958;3.78),(8.4852;2.98),(8.4831;3.14),(8.4775;3.27),(8.4753;3.14),(8.2388;1.85),(8.2318;1.83),(8.1647;2.67),(8.1628;2.68),(8.1512;2.82),(7.9826;2.69),(7.8299;4.10),(7.8131;4.04),(7.6054;2.26),(7.5975;2.39),(7.5920;2.41),(7.5842;2.20),(7.4305;2.55),(7.3781;4.75),(6.3252;10.76),(3.6009;0.47),(3.3487;551.50),(3.3253;3.91),(3.0756;0.33),(2.7065;0.45),(2.6988;0.53),(2.6750;11.14),(2.6674;11.21),(2.6146;0.81),(2.5421;0.54),(2.5056;93.86),(2.5030;119.62),(2.5003;93.38),(2.3873;0.77),(2.2676;0.63),(2.1811;16.00),(2.1388;0.77),(1.7595;0.47),(1.3545;2.74),(1.2355;0.42),(1.1056;1.03),(-0.0002;9.41)
18		2,5	605	(8.4806;0.74),(8.4782;0.79),(8.4728;0.81),(8.4703;0.83),(8.1661;0.73),(8.1636;0.72),(8.1527;0.76),(8.1502;0.75),(8.0132;0.60),(7.8006;0.88),(7.7981;0.94),(7.7350;0.85),(7.7326;0.81),(7.6084;0.80),(7.6006;0.80),(7.5950;0.74),(7.5872;0.75),(7.4146;0.55),(7.3379;1.32),(6.3338;2.89),(6.3009;0.35),(3.6121;0.52),(3.6078;0.37),(3.6051;0.50),(3.6011;1.27),(3.5971;0.50),(3.5943;0.35),(3.5901;0.53),(3.3514;72.68),(3.3278;0.42),(3.0759;0.85),(2.5093;5.36),(2.5064;10.86),(2.5034;14.50),(2.5004;10.52),(2.4975;4.93),(2.1796;4.26),(2.0728;0.42),(-

10

20

30

40

番号	構造	LOGP	MH +	NMR
				1.7704;0.54),(1.7652;0.59),(1.7594;1.60),(1.7550;0.84),(1.7485;0.53),(1.2365;2.26),(1.2170;16.00),(1.1057;2.67),(-0.0002;1.54)
19		2,27	591	(10.3287;1.73),(8.4822;2.57),(8.4752;2.65),(8.1619;2.35),(8.1487;2.44),(8.0273;1.62),(8.0112;3.37),(7.8295;3.78),(7.7773;3.57),(7.6120;1.80),(7.6042;1.94),(7.5988;1.93),(7.5909;1.79),(7.4458;2.38),(7.3874;4.19),(6.3388;9.13),(3.9582;0.35),(3.9472;0.86),(3.9360;1.35),(3.9247;1.36),(3.9135;0.87),(3.9024;0.35),(3.3667;122.03),(3.3434;3.13),(3.0856;0.39),(2.6249;0.42),(2.5744;0.58),(2.5133;44.84),(2.2435;0.40),(2.2002;13.88),(1.1152;1.28),(1.0351;16.00),(1.0242;15.82)
20		2,11	589	(10.3270;4.42),(8.4844;3.18),(8.4780;3.25),(8.2779;2.92),(8.2717;2.83),(8.1629;2.86),(8.1492;2.92),(7.9791;3.18),(7.8200;4.55),(7.7497;4.46),(7.6073;2.16),(7.5996;2.40),(7.5941;2.37),(7.5863;2.09),(7.4289;3.17),(7.3860;5.63),(6.3335;11.16),(3.3451;188.53),(3.3216;5.52),(2.6974;1.39),(2.6918;1.88),(2.6854;1.87),(2.6799;1.43),(2.6148;0.89),(2.5641;0.79),(2.5028;120.76),(2.3871;0.79),(2.2327;0.49),(2.1836;16.00),(2.0864;0.55),(2.0768;0.46),(1.8815;0.49),(1.1057;0.81),(0.6107;1.33),(0.5999;4.54),(0.5911;4.36),(0.4194;4.99),(-0.0002;6.30)
21		1,83	549	(10.4564;3.10),(8.4954;3.09),(8.4929;3.30),(8.4876;3.37),(8.4850;3.32),(8.1681;3.18),(8.1656;3.21),(8.1547;3.38),(8.1522;3.21),(7.9852;2.22),(7.8871;3.37),(7.8841;3.66),(7.8308;3.44),(7.8283;3.27),(7.7370;2.29),(7.6087;3.17),(7.6009;3.13),(7.5953;3.13),(7.5875;3.22),(7.4848;2.29),(7.4418;2.18),(7.3731;5.89),(6.8726;0.37),(6.3199;10.36),(3.6146;0.33),(3.6121;1.41),(3.6106;0.96),(3.6078;0.87),(3.6051;1.22),(3.6010;3.38),(3.5969;1.23),(3.5942;0.87),(3.5913;0.94),(3.5899;1.44),(3.5874;0.33),(3.3794;0.42),(3.3583;198.38),(3.3348;1.17),(3.0759;0.56),(2.5655;0.45),(2.5250;0.55),(2.5220;0.70),(2.5188;0.71),(2.5100;13.67),(2.5070;29.29),(2.5040;40.11),(2.5009;29.16),(2.4980;13.61),(2.2344;0.43),(2.1842;0.78),(2.1703;16.00),(2.0869;0.33),(1.7699;1.42),(1.7648;1.38),(1.7622;0.96),(1.7589;4.20),(1.7558;0.97),(1.7531;1.38),(1.7479;1.41),(1.6996;0.38),(1.3560;4.78),(1.1056;1.82),(-0.0002;1.17)
22		2,89	621	(10.2718;1.25),(9.9252;0.50),(9.5218;0.53),(8.4795;0.73),(8.4771;0.77),(8.4717;0.80),(8.4692;0.79),(8.1657;0.66),(8.1633;0.67),(8.1523;0.72),(8.1498;0.70),(7.8188;0.85),(7.8159;0.93),(7.7020;0.90),(7.6989;0.88),(7.6083;0.67),(7.6005;0.68),(7.5949;0.67),(7.5871;0.66),(7.5253;1.14),(7.3421;1.73),(6.3348;2.79),(3.3492;80.09),(3.3257;1.00),(2.5210;0.33),(2.5179;0.36),(2.5089;7.23),(2.5060;15.19;2.5030;20.65),(2.5000;15.01),(2.4970;7.02),(2.1756;3.99),(2.1659;0.36),(1.9901;1.16),(1.3968;0.47),(1.2219;1.62),(1.2149;16.00),(1.1862;0.35),(1.1744;0.66),(-0.0002;2.17)
23		2,26	579	(10.3697;4.37),(9.8866;1.85),(9.4617;1.97),(8.4844;3.19),(8.4806;3.36),(8.4726;3.48),(8.4689;3.48),(8.4579;0.34),(8.1830;1.77),(8.1713;1.80),(8.1581;3.39),(8.1544;3.12),(8.1379;3.33),(8.1342;3.11),(7.8302;4.46),(7.8152;4.32),(7.6052;2.97),(7.5934;2.95),(7.5849;2.82),(7.5732;2.75),(7.3696;4.69),(7.3188;0.33),(6.3153;11.63),(6.0975;0.78),(4.0572;0.65),(4.0395;1.95),(4.0217;1.97),(4.0039;0.68),(3.3161;559.41),(3.2928;6.09),(3.2623;0.34),(2.6841;11.40),(2.6726;11.48),(2.5398;0.49),(2.5230;1.31),(2.5097;19.61),(2.5053;36.60),(2.5008;4

10

20

30

40

番号	構造	LOGP	MH +	NMR
				7.75),(2.4964;32.89),(2.4920;15.61),(2.3274;0.34),(2.1782;16.00),(2.0691;0.63),(1.9870;8.58),(1.1928;2.39),(1.1750;4.68),(1.1572;2.32),(-0.0002;2.53)
24		2,65	578	(10.2916;4.32),(9.8819;1.75),(9.4577;1.83),(8.2270;0.63),(8.2165;1.82),(8.2050;1.81),(8.1932;0.62),(7.8305;4.53),(7.8198;4.80),(7.8149;2.79),(7.5770;1.85),(7.5721;1.78),(7.5567;2.81),(7.5531;2.20),(7.5463;0.37),(7.5061;1.47),(7.5003;1.99),(7.4946;1.85),(7.4881;2.06),(7.4837;4.49),(7.4808;5.69),(7.4750;1.69),(7.4627;5.00),(7.4569;3.95),(7.4515;0.92),(7.4450;1.32),(7.4396;1.76),(7.4251;0.67),(7.4212;0.56),(7.3201;5.50),(6.2900;11.94),(3.3147;722.62),(3.2927;5.80),(3.2389;0.33),(2.6763;10.43),(2.6649;10.51),(2.5397;0.88),(2.5228;2.87),(2.5095;38.24),(2.5052;70.82),(2.5007;92.02),(2.4963;63.26),(2.4919;29.94),(2.3368;0.34),(2.3320;0.50),(2.3274;0.60),(2.3227;0.45),(2.1791;16.00),(-0.0002;1.19)
25		2,64	629	(10.4089;3.99),(10.3860;0.41),(9.9370;1.95),(9.5003;2.06),(8.4852;2.60),(8.4828;2.67),(8.4774;2.82),(8.4749;2.88),(8.2327;0.64),(8.2254;1.86),(8.2177;1.85),(8.2102;0.61),(8.1641;2.64),(8.1617;2.56),(8.1507;2.87),(8.1483;2.64),(7.8356;3.07),(7.8328;3.95),(7.8100;3.87),(7.8070;3.29),(7.6050;2.54),(7.5972;2.54),(7.5915;2.65),(7.5837;2.67),(7.3841;6.09),(7.3350;0.55),(6.3543;9.75),(6.3280;0.52),(6.1394;0.81),(5.7617;0.35),(3.3502;147.58),(3.3267;1.79),(2.6758;10.39),(2.6682;10.94),(2.5213;0.35),(2.5181;0.39),(2.5091;10.42),(2.5063;21.88),(2.5033;29.69),(2.5003;21.61),(2.4976;10.07),(2.1794;16.00),(2.1719;1.96),(1.9904;0.58),(-0.0002;3.94)
26		3,26	671	(10.2893;0.88),(9.9271;0.48),(9.5240;0.52),(8.4796;0.81),(8.4771;0.86),(8.4718;0.93),(8.4693;0.94),(8.1634;0.82),(8.1609;0.80),(8.1499;0.90),(8.1474;0.84),(7.8212;0.83),(7.8184;0.97),(7.7046;0.86),(7.7015;0.86),(7.6073;0.80),(7.5994;0.81),(7.5938;0.88),(7.5860;0.88),(7.5194;1.04),(7.3554;1.66),(6.3605;2.67),(5.7616;0.52),(3.3500;39.38),(2.5094;2.44),(2.5064;5.45),(2.5033;7.60),(2.5003;5.51),(2.4973;2.50),(2.1758;4.09),(2.1652;0.45),(1.2184;2.49),(1.2135;16.00),(-0.0002;1.49)
27		3,85	670	(10.3211;0.73),(8.4760;0.71),(8.4722;0.75),(8.4642;0.80),(8.4605;0.76),(8.1550;0.57),(8.1514;0.56),(8.1348;0.67),(8.1313;0.62),(7.8866;0.78),(7.7682;0.71),(7.6398;0.63),(7.6049;0.62),(7.5930;0.65),(7.5847;0.59),(7.5729;0.60),(7.3494;0.74),(6.3482;2.08),(3.8556;5.51),(3.3124;133.11),(3.2890;1.76),(2.5095;5.50),(2.5052;10.34),(2.5007;13.56),(2.4963;9.43),(2.4919;4.52),(2.2135;3.08),(1.9870;0.39),(1.2089;16.00),(1.1932;0.36),(-0.0002;0.75)
28		4,54	710	(10.3478;0.90),(8.4792;0.65),(8.4766;0.68),(8.4713;0.74),(8.4688;0.75),(8.1663;0.62),(8.1638;0.60),(8.1529;0.66),(8.1503;0.62),(7.8934;0.72),(7.8911;0.81),(7.7620;0.79),(7.7589;0.81),(7.6622;0.94),(7.6082;0.61),(7.6004;0.62),(7.5948;0.65),(7.5870;0.65),(7.3602;1.42),(6.3617;2.08),(4.1342;1.61),(4.1221;1.60),(3.3433;215.19),(3.3301;0.39),(3.3197;0.74),(2.6144;0.33),(2.5238;0.48),(2.5207;0.62),(2.5175;0.70),(2.5088;17.53),(2.5057;38.08),(2.5027;52.28),(2.4996;37.49),(2.4966;16.62),(2.3869;0.32),(2.2213;3.35),(2.2101;0.40),(2.0865;16.00),(2.0768;2.02),(1.2273;0.42),(1.2141;0.43),(1.2067;2.17),(1.2011;13.16),(0.8502;0.40),(0.5688;0.82),(0.5659;0.87),(0.5630;0.39),(0.5588;0.39),(0.5554;0.83),(0.5525;0.82),(0.35

10

20

30

40

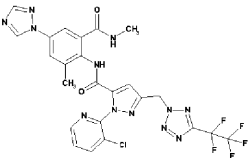
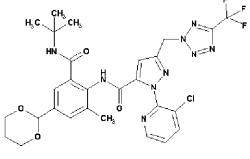
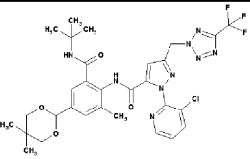
番号	構造	LOGP	MH +	NMR
				974;1.84),(4.0585;0.43),(4.0407;1.44),(4.0366;0.82),(4.0316;0.69),(4.0239;0.77),(3.9503;0.77),(3.9427;0.71),(3.9377;0.80),(3.9334;1.39),(3.9159;0.40),(3.3974;0.50),(3.3853;0.52),(3.3058;215.99),(2.5390;0.40),(2.5219;1.34),(2.5087;18.23),(2.5045;33.57),(2.5000;43.28),(2.4957;30.18),(2.4915;14.68),(2.2431;0.68),(2.1550;3.86),(1.9867;0.74),(1.4054;0.33),(1.2357;0.32),(1.2224;3.01),(1.1949;16.00),(1.1749;0.62),(-0.0002;3.05)
34		3,48	654	(10.3460;0.32),(8.7573;2.51),(8.7545;2.61),(8.4909;2.99),(8.4884;3.24),(8.4831;3.26),(8.4806;3.25),(8.3237;0.58),(8.3164;1.73),(8.3087;1.75),(8.3010;0.56),(8.1699;2.86),(8.1673;2.89),(8.1565;3.14),(8.1539;3.02),(7.8971;2.85),(7.8928;3.17),(7.7908;3.27),(7.7866;3.10),(7.6082;3.00),(7.6004;2.95),(7.5948;2.95),(7.5870;3.03),(7.3876;8.21),(7.0792;3.46),(7.0750;3.50),(7.0604;0.42),(7.0564;0.40),(6.3329;11.32),(3.5032;0.52),(3.3657;0.58),(3.3446;410.60),(3.3211;1.59),(3.3073;2.17),(3.0757;0.75),(2.9438;11.83),(2.7837;8.13),(2.6903;10.22),(2.6826;10.34),(2.6178;0.57),(2.6147;0.80),(2.6117;0.58),(2.5424;0.41),(2.5241;1.16),(2.5210;1.43),(2.5179;1.42),(2.5090;42.45),(2.5060;93.55),(2.5030;128.88),(2.4999;94.09),(2.4970;43.44),(2.4633;1.25),(2.3902;0.56),(2.3872;0.79),(2.3842;0.55),(2.2922;5.52),(2.2432;16.00),(2.0866;9.79),(2.0771;2.96),(1.9578;8.49),(1.1057;2.29),(0.0052;0.48),(-0.0002;16.49),(-0.0058;0.50)
35		3,86	704	(10.3421;4.33),(10.3199;0.63),(8.7455;3.04),(8.7417;3.15),(8.4915;2.98),(8.4877;3.26),(8.4798;3.56),(8.4760;3.51),(8.4688;0.57),(8.4649;0.51),(8.2892;1.84),(8.2776;1.86),(8.1673;2.64),(8.1636;2.73),(8.1470;3.24),(8.1433;3.13),(8.1263;0.39),(8.1225;0.36),(7.8929;3.28),(7.8871;3.61),(7.7899;3.58),(7.7840;3.34),(7.6102;2.92),(7.5984;2.99),(7.5900;2.89),(7.5847;0.73),(7.5782;2.86),(7.5644;0.38),(7.3830;6.70),(7.3348;0.79),(7.0709;3.97),(7.0647;3.97),(6.3539;9.69),(6.3278;0.58),(6.1398;1.06),(4.0384;0.71),(4.0207;0.71),(3.5372;0.40),(3.3559;171.00),(3.3496;164.16),(3.3440;204.61),(3.3397;227.67),(3.2776;0.47),(2.7126;0.43),(2.6947;10.61),(2.6832;10.68),(2.6724;1.12),(2.6677;0.72),(2.5422;0.45),(2.5120;29.91),(2.5075;59.85),(2.5030;79.51),(2.4984;58.13),(2.4939;28.62),(2.3342;0.38),(2.3297;0.50),(2.3251;0.38),(2.2443;16.00),(2.0735;0.59),(1.9889;3.03),(1.3975;1.90),(1.2350;0.39),(1.1927;0.83),(1.1749;1.64),(1.1571;0.80),(0.0079;0.45),(-0.0002;11.05),(-0.0085;0.48)
36		2,25	587	(10.3452;3.05),(9.3096;3.73),(8.4899;2.03),(8.4875;2.16),(8.4821;2.15),(8.4797;2.11),(8.3027;0.98),(8.2954;1.09),(8.2600;4.43),(8.1680;1.50),(8.1659;1.50),(8.1546;1.73),(8.1525;1.56),(7.8775;1.79),(7.7916;1.96),(7.7882;1.82),(7.6071;1.41),(7.5992;1.44),(7.5936;1.39),(7.5858;1.34),(7.3861;2.94),(6.3320;6.53),(3.5339;0.36),(3.3971;0.32),(3.3802;0.80),(3.3521;445.17),(3.3287;2.66),(2.9620;0.47),(2.9439;16.00),(2.7838;12.19),(2.6883;7.25),(2.6807;7.25),(2.6151;0.42),(2.5243;0.96),(2.5213;1.28),(2.5180;1.57),(2.5093;23.60),(2.5064;48.76),(2.5034;66.32),(2.5004;48.08),(2.4975;22.16),(2.3875;0.40),(2.2372;8.80),(2.2237;0.50),(2.0769;0.95),(1.9580;12.79),(1.5157;0.62),(0.0052;0.58),(-0.0002;14.61),(-0.0057;0.45)

10

20

30

40

番号	構造	LOGP	MH+	NMR
37			637	(10.3572;4.65),(10.3346;0.49),(9.3104;7.64),(8.4893;3.42),(8.4869;3.58),(8.4815;3.69),(8.4790;3.88),(8.4706;0.54),(8.4682;0.52),(8.2991;1.67),(8.2917;1.73),(8.2604;9.41),(8.1668;2.70),(8.1645;2.66),(8.1534;2.98),(8.1510;2.79),(8.1457;0.45),(8.1320;0.36),(8.1297;0.34),(7.8778;3.39),(7.7925;3.48),(7.7890;3.48),(7.6063;2.60),(7.5985;2.63),(7.5929;2.86),(7.5850;2.79),(7.5789;0.39),(7.3878;5.10),(7.3393;0.59),(6.3589;1.091),(6.3327;0.66),(6.1434;1.21),(3.5341;0.45),(3.5027;0.46),(3.3823;0.35),(3.3540;712.55),(3.3305;3.86),(3.3050;0.44),(2.9623;0.48),(2.9439;8.48),(2.7840;6.39),(2.6876;13.02),(2.6799;13.19),(2.6302;0.35),(2.6262;0.34),(2.6185;0.44),(2.6154;0.60),(2.6124;0.42),(2.5247;0.63),(2.5216;0.84),(2.5185;0.88),(2.5096;30.76),(2.5067;66.69),(2.5037;92.06),(2.5006;66.71),(2.4977;30.86),(2.3908;0.44),(2.3879;0.56),(2.3849;0.40),(2.2537;0.43),(2.2377;16.00),(2.2303;2.89),(2.0771;1.37),(1.9903;0.69),(1.9582;6.71),(1.5160;0.67),(1.1745;0.36),(0.0052;0.44),(-0.0002;14.26),(-0.0057;0.42)
38		3,37	648	(10.1405;1.10),(8.4721;0.70),(8.4683;0.74),(8.4603;0.77),(8.4565;0.74),(8.1535;0.68),(8.1497;0.70),(8.1333;0.76),(8.1296;0.72),(7.6022;0.71),(7.5904;0.71),(7.5820;0.68),(7.5702;0.65),(7.3329;1.18),(7.3180;1.09),(7.3093;2.00),(7.2395;0.95),(7.2352;0.87),(6.3163;2.82),(5.4831;1.67),(4.2944;0.84),(4.2816;1.72),(4.2688;0.88),(4.1479;0.56),(4.1354;0.54),(4.1214;0.64),(4.1087;0.68),(3.9563;0.47),(3.9500;0.53),(3.9255;0.79),(3.9201;0.77),(3.8955;0.41),(3.8893;0.37),(3.5676;3.31),(3.4724;1.04),(3.4593;1.30),(3.4564;2.08),(3.4435;2.04),(3.4406;1.36),(3.4275;1.10),(3.3098;299.36),(3.2868;2.00),(2.5391;0.39),(2.5089;12.29),(2.5046;22.36),(2.5002;28.79),(2.4958;20.04),(2.4915;9.73),(2.1387;3.85),(1.5796;0.97),(1.5635;1.40),(1.5475;0.93),(1.4535;0.41),(1.4202;0.36),(1.1914;16.00),(-0.0002;1.99)
39		4,07	676	(4.3050;0.48),(4.2918;0.87),(4.2787;0.48),(3.3119;70.85),(3.1496;2.60),(3.1371;2.51),(2.5092;3.11),(2.5049;5.73),(2.5004;7.44),(2.4960;5.18),(2.4916;2.51),(1.1908;1.28),(1.1653;0.36),(0.7485;16.00),(-0.0002;0.34)

10

20

30

分析法

上の表および調製例において報告したlog P値は、逆相カラム(C18)でのHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)により、EEC Directive 79/831 Annex V.A8に従って、以下の方法を用いて判定した。

【0197】

酸性範囲でのLC-MS判定は、溶離剤として0.1%ギ酸水溶液およびアセトニトリル(0.1%ギ酸含有)、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルの線形勾配、を用いてpH2.7で行う。

40

【0198】

較正は、既知log P値(2つの連続するアルカノン間の一次補間により、保持時間に基づいて決定したlog P値)を有する非分岐アルカン-2-オン(3から16個の炭素を有する)を用いて行った。

【0199】

200nmから400nmのUVスペクトルを用いて最大クロマトグラフィーシグナルに関して最大ラムダ値を決定した。

【0200】

MH⁺シグナルは、Agilent MSDシステムを使用してESIならびに陽および陰イオン化を用いて判定した。

50

【0201】

NMRスペクトルは、フロー・プローブ・ヘッド（容積60 μ L）を装着したBruker Avance 400を使用して判定した。使用した溶剤は、 d_6 -DMSOであり、使用したリファレンスは、テトラメチルシラン（0.00 ppm）であった。 d_6 -DMSOを溶剤として使用する場合、測定温度は303 Kである。

【0202】

個々のケースに関して、試料をBruker Avance II 600またはII 600で判定した。

実施例 1

使用例

ミズス (*Myzus*) 属試験 (MYZUPE 噴霧処理)

溶剤：7.8 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：0.5 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

適切な活性成分製剤を生成するために、1 重量部の活性成分を規定量の溶剤および乳化剤と混合し、その濃縮製剤を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

【0203】

あらゆる期のももアカアブラムシ (*green peach aphid*) (ももアカアブラムシ (*Myzus persicae*)) が寄生している白菜 (ハクサイ (*Brassica pekinensis*)) の葉ディスクに所望の濃度の活性成分製剤を噴霧する。

【0204】

6 日後に効力 (%) を判定する。100% は、すべてのアブラムシが死滅したことを意味し；0% は、いずれのアブラムシも死滅しなかったことを意味する。

【0205】

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100 g / ha の施用量で 100% の効力を示す：1、7、17、23、25、26、33、36

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100 g / ha の施用量で 80% の効力を示す：21、37

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100 g / ha の施用量で 90% の効力を示す：2、5、18、22、24、27

実施例 2

ダイコンサルハムシ属 (*Phaedon*) 試験 (PHAECO 噴霧処理)

溶剤：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：0.5 重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

適切な活性成分製剤を生成するために、1 重量部の活性成分を規定量の溶剤および乳化剤と混合し、その濃縮製剤を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

【0206】

白菜 (ハクサイ (*Brassica pekinensis*)) の葉ディスクに所望の濃度の活性成分製剤を噴霧し、乾かした後、マスタードビートル (*mustard beetle*) (ダイコンハムシ (*Phaedon cochleariae*)) の幼虫を棲息させる。

【0207】

7 日後に効力 (%) を判定する。100% は、すべての甲虫 (*beetle*) 幼虫が死滅したことを意味し；0% は、いずれの甲虫幼虫も死滅しなかったことを意味する。

【0208】

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100 g / ha の施用量で 100% の効力を示す：2、3、4、5、11、13、17、18、19、21、22、23、24、25、26、27、34、35、36、37。

10

20

30

40

50

【0209】

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100g/haの施用量で83%の効力を示す：20。

実施例3

ツマヨウジクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) 試験 (SPODFR 噴霧処理)

溶剤：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：0.5重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

適切な活性成分製剤を生成するために、1重量部の活性成分を規定量の溶剤および乳化剤と混合し、その濃縮製剤を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。

10

【0210】

トウモロコシ (maize) (トウモロコシ (*Zea mays*)) の葉ディスクに所望の濃度の活性成分製剤を噴霧し、乾かした後、ヨトウムシ (ツマヨウジクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*)) のイモムシを棲息させる。

【0211】

7日後に効力 (%) を判定する。100%は、すべてのイモムシが死滅したことを意味し；0%は、いずれのイモムシも死滅しなかったことを意味する。

【0212】

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100g/haの施用量で100%の効力を示す：1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、32、33、34、35、36、37、38、39。

20

実施例4

ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) 試験 (LUCICU)

種：ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) 第1幼虫期 (齢：24時間)

溶剤：ジメチルスルホキシド

適切な活性成分製剤を調製するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合し、その濃縮製剤を水で所望の濃度に希釈する。

【0213】

前記活性成分製剤で処理した1cm³の馬肉が入っている容器に約20匹のヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) 第1虫齢幼虫を棲息させる。

30

【0214】

48時間後、死滅 (%) を判定する。100%は、すべての幼虫が死滅したことを意味し；0%は、いずれの幼虫も死滅しなかったことを意味する。

【0215】

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100ppmの施用量で100%の効力を示す：1、2、3、4、5、6、7。

実施例5

イエバエ (*Musca domestica*) 試験 (MUSCDO)

溶剤：ジメチルスルホキシド

適切な活性成分製剤を調製するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合し、その濃縮製剤を水で所望の濃度に希釈する。

40

【0216】

所望の濃度の前記活性成分製剤で処理したスポンジが入っている容器に10匹の成虫イエバエ (*Musca domestica*) を棲息させる。

【0217】

2日後、死滅 (%) を判定する。100%は、すべてのイエバエが死滅したことを意味し；0%は、いずれのイエバエも死滅しなかったことを意味する。

【0218】

50

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100 ppmの施用量で90%の効力を示す：2、6。

【0219】

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、100 ppmの施用量で100%の効力を示す：1、4。

実施例6

ダイコンサルハムシ属 (Phaedon) 試験 (PHAECO噴霧処理)

溶剤：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：0.5重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

適切な活性成分製剤を生成するために、1重量部の活性成分を規定量の溶剤および乳化剤と混合し、その濃縮製剤を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈する。白菜 (ハクサイ (Brassica pekinensis)) の葉ディスクに所望の濃度の活性成分製剤を噴霧し、乾かした後、マスタードビートル (mustard beetle) (ダイコンサルハムシ (Phaedon cochleariae)) の幼虫を棲息させる。

【0220】

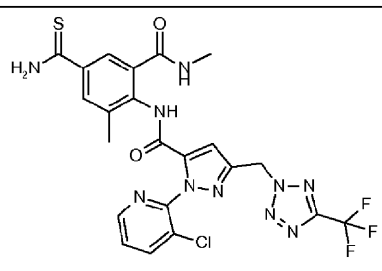
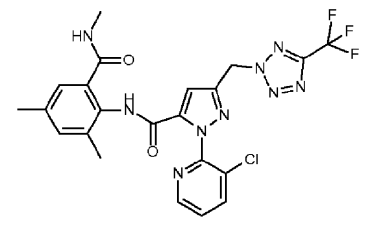
所望の期間の後、効力 (%) を判定する。100%は、すべての甲虫 (beetle) 幼虫が死滅したことを意味し；0%は、いずれの甲虫幼虫も死滅しなかったことを意味する。

【0221】

この試験において、例えば、調製例の以下の化合物は、先行技術より優れた効力を示す：表参照

【0222】

【表2】

物質	構造	対象	濃度	活性%
本発明の実施例番号23		比較例	20 g/ha	100 7d
公知 (国際公開第2007/144100号パンフレット)		比較例	20 g/ha	0 7d

10

20

30

40

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
 A 0 1 P 7/04 (2006.01) A 0 1 P 7/04

- (74)代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
- (74)代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝
- (74)代理人 100137213
 弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 230105223
 弁護士 城山 康文
- (72)発明者 フイツシャー, 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・フスフエーレン・2 3
- (72)発明者 ゲジング, エルンスト・ルドルフ
 ドイツ国、4 0 6 9 9・エルクラート、トリルザー・グラーベン・4
- (72)発明者 グロンダール, クリストフ
 ドイツ国、5 0 9 3 7・ケルン、ゲロルシュタイナー・シュトラッセ・3 8
- (72)発明者 ハイル, マーカス
 ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アム・ヴァイセン・スタイン・4 3アー
- (72)発明者 プロプロフスキー, ハイנטツ・ユルゲン
 ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ファイルネブルクシュトラッセ・7 3
- (72)発明者 フェールステ, アルント
 ドイツ国、5 0 6 7 4・ケルン、モーツアルトシュトラッセ・3 - 5
- (72)発明者 ゲルゲンス, ウルリヒ
 ドイツ国、4 0 8 8 2・ラテインゲン、フェステルシュトラッセ・3 7

審査官 吉田 直裕

- (56)参考文献 特表2009-539902(JP,A)
 特表2005-503384(JP,A)
 特表2006-514632(JP,A)
 国際公開第2010/069502(WO,A1)
 国際公開第2005/077934(WO,A1)
 特表2008-515844(JP,A)

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