

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号

特許第7098630号

(P7098630)

(45)発行日 令和4年7月11日(2022.7.11)

(24)登録日 令和4年7月1日(2022.7.1)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04

C S P

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04

1 0 6 H

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04

1 0 6 Z

A 0 1 N 43/56 (2006.01)

C 0 7 D 471/04

1 0 7 K

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

C 0 7 D 487/04

1 4 4

請求項の数 6 (全135頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2019-537177(P2019-537177)

(86)(22)出願日 平成30年1月3日(2018.1.3)

(65)公表番号 特表2020-504149(P2020-504149
A)

(43)公表日 令和2年2月6日(2020.2.6)

(86)国際出願番号 PCT/EP2018/050117

(87)国際公開番号 WO2018/130443

(87)国際公開日 平成30年7月19日(2018.7.19)

審査請求日 令和2年12月25日(2020.12.25)

(31)優先権主張番号 17150794.0

(32)優先日 平成29年1月10日(2017.1.10)

(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 313006625

バイエル・アクチエンゲゼルシャフト
ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフ
エルクーゼン、カイザー - ヴイルヘルム
- アレー・1

(73)特許権者 507203353

バイエル・クロップサイエンス・アクチ
エンゲゼルシャフト
ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム・ア
ム・ライン、アルフレート - ノベル - シ
ユトラッセ・5 0

(74)代理人 100114188

弁理士 小野 誠

(74)代理人 100119253

弁理士 金山 賢教

最終頁に続く

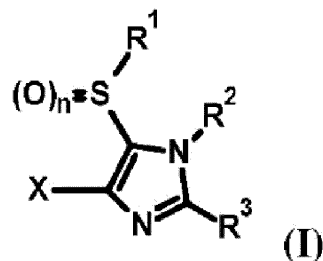
(54)【発明の名称】 有害生物防除剤としてのヘテロサイクレン誘導体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



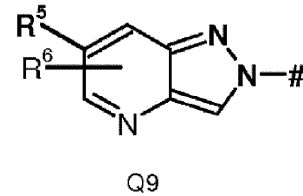
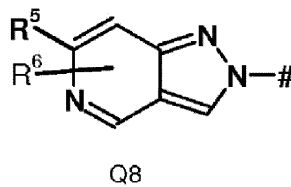
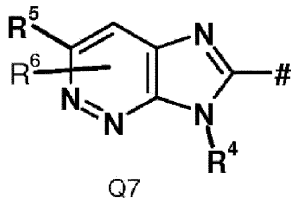
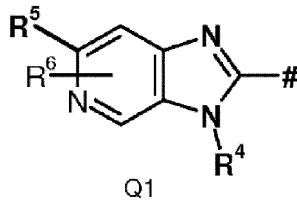
〔式中、

R¹は、エチル又はイソプロピルであり；R²は、メチル、エチル又はイソプロピルであり；R³は、水素、臭素、シアノ、エテニル、シクロプロピルエテニル、イソプロペニル、シ
クロプロピルエチニル、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルエチル、メトキ
シカルボニル、トリフルオロエチルアミノカルボニル、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、エチルアミノカルボニル、アミノチオカルボニ

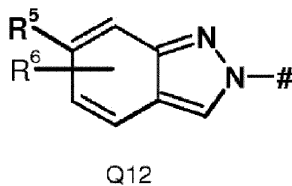
ル、メチルアミノチオカルボニル、ジメチルアミノチオカルボニルであるか、又は、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフェニル（チエニル）、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリル若しくはシクロヘキセニル〔ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換、2置換又は3置換されていてもよく、炭素原子を介して、当該分子の残部に架橋しており、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、フッ素、塩素、メチル、シクロプロピル、シアノメチル、シアノイソプロピル、シアノシクロプロピル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、アミノカルボニル〕であるか、又は、ピラゾリル若しくはイミダゾリル〔ここで、これらは、それぞれ、塩素で1置換されていてもよく、窒素原子を介して、当該分子の残部に架橋している〕であり；
Xは、Q 1、Q 7、Q 8、Q 9又はQ 1 2；

10

【化 2】



20



30

であり；

R 4 は、メチルであり；R 5 は、トリフルオロメチルであり；R 6 は、水素であり；n は、0又は2である〕

で表される化合物。

【請求項 2】

実施例 I - 0 0 1 ~ 実施例 I - 0 9 8 に記載の構造を有している、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

40

【請求項 3】

農薬製剤であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物を含み、並びに、増量剤及び / 又は界面活性剤も含んでいる、前記農薬製剤。

【請求項 4】

さらなる農薬活性成分を付加的に含んでいる、請求項 3 に記載の農薬製剤。

【請求項 5】

害虫を防除する方法であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 3 若しくは 4 に記載の農薬製剤を該害虫及び / 又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とし、但し、ヒトの身体の外科的な又は治療的な処置方法及びヒトの身体に対して実施

50

される診断方法は除外される、前記方法。

【請求項 6】

害虫を防除するための、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 3 若しくは 4 に記載の農薬製剤の使用であって、但し、ヒトの身体の外科的な又は治療的な処置のための使用及びヒトの身体に対して実施される診断的使用は除外される、使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式 (I) で表されるヘテロ環誘導体、害虫 (animal pest) を防除するための、特に、節足動物 (とりわけ、昆虫類及びクモ形類動物) を防除するための、殺ダニ剤及び / 又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを調製するための方法及び中間体に関する。

10

【0002】

殺虫特性を有しているヘテロ環誘導体は、文献中に、例えば、WO 2010 / 125985、WO 2012 / 074135、WO 2012 / 086848、WO 2013 / 018928、WO 2013 / 180193、WO 2013 / 191113、WO 2014 / 142292、WO 2014 / 148451、WO 2015 / 000715、WO 2016 / 124563、WO 2016 / 124557、WO 2015 / 121136、WO 2015 / 133603、WO 2015 / 198859、WO 2015 / 002211、WO 2015 / 071180、WO 2015 / 091945、WO 2016 / 005263、WO 2016 / 039441、WO 2015 / 198817、WO 2016 / 041819、WO 2016 / 039441、WO 2016 / 039444、WO 2016 / 026848、WO 2016 / 023954、WO 2016 / 020286、WO 2016 / 046071、WO 2016 / 058928、WO 2016 / 059145、WO 2016 / 071214、WO 2016 / 091731、WO 2016 / 096584、WO 2016 / 107742、WO 2016 / 107831、WO 2016 / 113155、WO 2016 / 116338、WO 2016 / 121997、WO 2016 / 125621、WO 2016 / 125622、WO 2016 / 129684、WO 2016 / 142326、WO 2016 / 142327、WO 2016 / 169882 及び WO 2016 / 169886 などの中に、既に記載されている。

20

30

【0003】

現代の作物保護組成物は、例えば、作用の程度、作用の持続性及び作用の範囲並びに可能性のある用途などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。毒性に関する問題、有益種及び花粉媒介者の保護に関する問題、環境特性に関する問題、施用量に関する問題、別の活性成分又は製剤助剤との組合せ可能性に関する問題は、活性成分の合成に伴う複雑さの問題と同様に、ある種の役割を果たす。ほんの僅かな要因を挙げれば、さらに、抵抗性も生じ得る。これら全ての理由により、新規作物保護組成物の探求は、完結したものとは考えられ得ず、既知化合物と比較して、少なくとも個々の態様に関して改善された特性を有する新規化合物が絶えず求められている。

【先行技術文献】

40

【特許文献】

【0004】

【文献】国際特許出願公開第 2010 / 125985 号

国際特許出願公開第 2012 / 074135 号

国際特許出願公開第 2012 / 086848 号

国際特許出願公開第 2013 / 018928 号

国際特許出願公開第 2013 / 180193 号

国際特許出願公開第 2013 / 191113 号

国際特許出願公開第 2014 / 142292 号

国際特許出願公開第 2014 / 148451 号

50

国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 2 4 5 6 3 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 2 4 5 5 7 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 1 2 1 1 3 6 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 1 3 3 6 0 3 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 1 9 8 8 5 9 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 0 0 2 2 1 1 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 0 7 1 1 8 0 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 0 9 1 9 4 5 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 0 5 2 6 3 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 3 9 4 4 1 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 5 / 1 9 8 8 1 7 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 4 1 8 1 9 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 3 9 4 4 1 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 3 9 4 4 4 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 2 6 8 4 8 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 2 3 9 5 4 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 2 0 2 8 6 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 4 6 0 7 1 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 5 8 9 2 8 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 5 9 1 4 5 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 7 1 2 1 4 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 9 1 7 3 1 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 0 9 6 5 8 4 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 0 7 7 4 2 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 0 7 8 3 1 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 1 3 1 5 5 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 1 6 3 3 8 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 2 1 9 9 7 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 2 5 6 2 1 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 2 5 6 2 2 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 2 9 6 8 4 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 4 2 3 2 6 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 4 2 3 2 7 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 6 9 8 8 2 号
 国際特許出願公開第 2 0 1 6 / 1 6 9 8 8 6 号

10

20

30

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

本発明の目的は、さまざまな局面下において殺有害生物剤 (p e s t i c i d e) のスペクトルを拡大させる及び/又はその活性を向上させる化合物を提供することであった。

40

【課題を解決するための手段】

【0006】

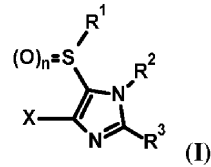
新規ヘテロ環誘導体が見いだされ、これらは、既に知られている化合物よりも有利点を有している。そのような有利点の例は、より良好な生物学的特性又は環境に関する特性、より広い範囲の施用方法、向上した殺虫作用又は殺ダニ作用、及び、作物植物との良好な適合性である。該ヘテロ環誘導体は、効力（特に、防除が困難な昆虫類に対する効力）を向上させるための別の作用薬と組合せて使用することが可能である。

【0007】

従って、本発明の対象は、式 (I)

50

【化 1】



【 0 0 0 8 】

〔式中（構成 1 - 1）〕、

R¹ は、（C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）シアノアルキル、（C₁ - C₆）ヒドロキシアルキル、（C₁ - C₆）アルコキシ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルキル、（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）ハロアルキニル又は（C₃ - C₈）シクロアルキルであり；

R² は、水素、（C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルキル、（C₁ - C₆）シアノアルキル、（C₁ - C₆）ヒドロキシアルキル、（C₁ - C₆）アルコキシ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルコキシ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₂ - C₆）アルケニル、（C₂ - C₆）アルケニルオキシ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₂ - C₆）ハロアルケニルオキシ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₂ - C₆）ハロアルケニル、（C₂ - C₆）シアノアルケニル、（C₂ - C₆）アルキニル、（C₂ - C₆）アルキニルオキシ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₂ - C₆）ハロアルキニルオキシ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₂ - C₆）ハロアルキニル、（C₂ - C₆）シアノアルキニル、（C₃ - C₈）シクロアルキル、（C₃ - C₈）シクロアルキル - （C₃ - C₈）シクロアルキル、（C₁ - C₆）アルキル - （C₃ - C₈）シクロアルキル、ハロ（C₃ - C₈）シクロアルキル、シアノ（C₃ - C₈）シクロアルキル、（C₁ - C₆）アルキルチオ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルキルチオ - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）アルキルスルフィニル - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルキルスルフィニル - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）アルキルスルホニル - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルキルスルホニル - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）アルキルカルボニル - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルキルカルボニル - （C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）アルコキシカルボニル - （C₁ - C₆）アルキル又は（C₁ - C₆）ハロアルコキシカルボニル - （C₁ - C₆）アルキルであり；

R³ は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、（C₁ - C₆）アルキル、（C₁ - C₆）ハロアルキル、（C₁ - C₆）アルコキシ、（C₁ - C₆）ハロアルコキシ、（C₁ - C₆）アルキルチオ、（C₁ - C₆）ハロアルキルチオ、（C₁ - C₆）アルキルスルフィニル、（C₁ - C₆）ハロアルキルスルフィニル、（C₁ - C₆）アルキルスルホニル、（C₁ - C₆）ハロアルキルスルホニル、SCN、（C₁ - C₆）アルキルカルボニル、（C₁ - C₆）ハロアルキルカルボニル、（C₁ - C₆）アルコキシカルボニル、（C₁ - C₆）ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、（C₁ - C₆）アルキルアミノカルボニル、ジ（C₁ - C₆）アルキルアミノカルボニル、（C₁ - C₆）ハロアルキルアミノカルボニル、（C₃ - C₈）シクロアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、（C₁ - C₆）アルキルアミノチオカルボニル、ジ（C₁ - C₆）アルキルアミノチオカルボニル、（C₁ - C₆）ハロアルキルアミノチオカルボニル、（C₃ - C₈）シクロアルキルアミノチオカルボニル、アミノ、（C₁ - C₆）アルキルアミノ、（C₁ - C₆）ハロアルキルアミノ、ジ（C₁ - C₆）アルキルアミノ、（C₃ - C₈）シクロアルキルアミノ、（C₁ - C₆）アルキルスルホニルアミノ、（C₁ - C₆）アルキルカルボニルアミノ、（C₁ - C₆）ハロアルキルカルボニルアミノ、（C₁ - C₆）アルキルカルボニル - （C₁ - C₆）アルキルアミノ、（C₁ - C₆）ハロアルキルカルボニル - （

10

20

30

40

50

C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) ハロアルケニル、(C₂ - C₆) シアノアルケニル、(C₃ - C₈) シクロアルキル - (C₂) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル若しくは(C₂ - C₆) ハロアルキニルであるか、又は、
 アリール若しくはヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、SF₅、トリ(C₁ - C₆) アルキルシリル、(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₃ - C₈) シクロアルキル - (C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) アルキル - (C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル - (C₃ - C₈) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₈) シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル、(C₁ - C₆) シアノアルキル、(C₁ - C₆) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) ハロアルケニル、(C₂ - C₆) シアノアルケニル、(C₃ - C₈) シクロアルキル - (C₂) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) ハロアルキニル、(C₂ - C₆) シアノアルキニル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) シアノアルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシイミノ、(C₁ - C₆) ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₁ - C₆) アルキルチオ - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキルスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₆) アルケニルアミノカルボニル、ジ(C₂ - C₆) アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(

10

20

30

40

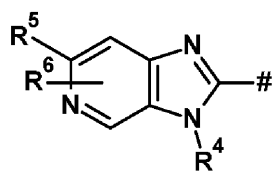
50

(C₃ - C₈)シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、ヘタリール、オキソヘタリール、ハロヘタリール、ハロオキソヘタリール、シアノヘタリール、シアノオキソヘタリール、(C₁ - C₆)ハロアルキルヘタリール又は(C₁ - C₆)ハロアルキルオキソヘタリール]であり；

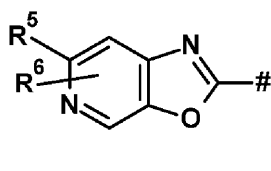
Xは、Q1 ~ Q12

10

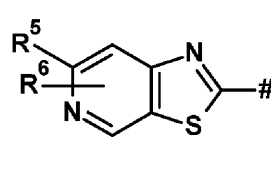
【化2】



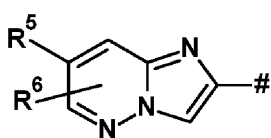
Q1



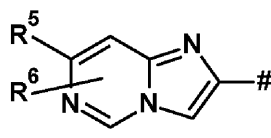
Q2



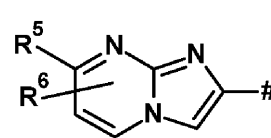
Q3



Q4

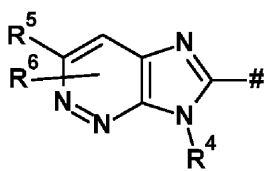


Q5

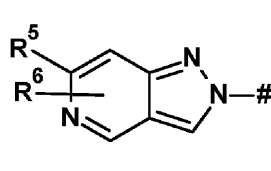


Q6

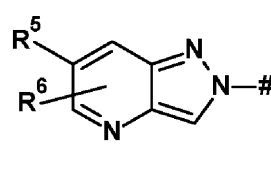
20



Q7

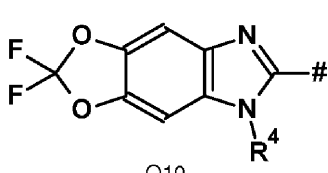


Q8

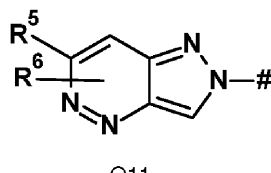


Q9

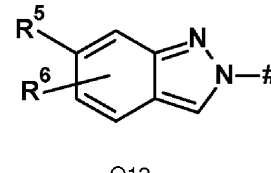
30



Q10



Q11



Q12

【0009】

の群から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系であり；

R⁴は、水素、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)シアノアルキル、(C₁ - C₆)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルケニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルケニル、(C₂ - C₆)シアノアルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₂ - C₆)ハロアルキニル又は(C₃ - C₈)シクロアルキルであり；

40

R⁵、R⁶は、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)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、(C₂ - C₆)ハロアルキニル、(C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₃ - C₈)シクロアルキル - (C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₁ - C₆)アル

50

キル - (C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル - (C₃ - C₈)シクロアルキル、シアノ - (C₃ - C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシイミノ、(C₁ - C₆)ハロアルコキシイミノ (C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル又はジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルであり；
nは、0、1又は2である]

10

で表される新規化合物である。

【0010】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成1-1において特定されている意味を有し、ここで、XがQ7である場合、R³は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル又は(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニルではない〕で表される化合物に関する。

20

【0011】

構成1-2

R¹は、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)シアノアルキル、(C₁ - C₆)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(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)ハロアルキニル又は(C₃ - C₈)シクロアルキルであり；

R²は、水素、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)シアノアルキル、(C₁ - C₆)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルケニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルケニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルケニル、(C₂ - C₆)シアノアルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₂ - C₆)アルキニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルキニルオキシ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)ハロアルキニル、(C₂ - C₆)シアノアルキニル、(C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₃ - C₈)シクロアルキル - (C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキル - (C₃ - C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₈)シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₈)シクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルキル又は(C₁ - C₆)ハロアルコキシカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルであり；

30

R³は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)ハロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)ハロアルコキシ、(C₁ - C₆

40

50

) アルキルチオ、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニ
 ル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル、(C
 C₁ - C₆) ハロアルキルスルホニル、SCN、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル、(C
 C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、(C₁ -
 C₆) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノカ
 ルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルア
 ミノカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニ
 ル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノチ
 オカルボニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) シク
 ロアルキルアミノチオカルボニル、アミノ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C
 C₆) ハロアルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアル
 キルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボ
 ニルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカ
 ルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル - (C
 C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃
 - C₈) シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) ア
 ルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C
 C₁ - C₆) アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) ハ
 ロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアル
 キルチオカルボニルアミノ、(C₃ - C₈) シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C
 C₆) アルキルアミノ、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) ハロアルケニル、(C
 C₂ - C₆) シアノアルケニル、(C₃ - C₈) シクロアルキル - (C₂) アルケニル、(C
 C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) ハロアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアル
 キル - (C₂) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₁ - C₆) アルキル、
 (C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカル
 ボニルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)
 ハロアルキルアミノカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル - (C
 C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル - (C₁ - C₆)
) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノカルボニル - (C₁ - C₆) ア
 ルキルアミノ若しくは(C₁ - C₆) ハロアルキルアミノカルボニル - (C₁ - C₆) ア
 ルキルアミノであるか、又は、
 アリール、ヘタリール、シクロペンテニル若しくはシクロヘキセニル[ここで、これらは
 、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく
 、ここで、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく
 、及び、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、カ
 ルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、SF₅、トリ
 (C₁ - C₆) アルキルシリル、(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₃ - C₈) シク
 ロアルキル - (C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) アルキル - (C₃ - C₈)
 シクロアルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル - (C₃ - C₈) シクロアルキル、ハロ(C
 C₃ - C₈) シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) ア
 ルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル、(C₁ - C₆) シアノアルキル、(C₁ - C₆)
 ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆)
) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁
 - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) ハロアルケニル、(C₂
 - C₆) シアノアルケニル、(C₃ - C₈) シクロアルキル - (C₂) アルケニル、(C
 C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) ハロアルキニル、(C₂ - C₆) シアノアルキニ
 ル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) シアノ
 アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁
 - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシイミノ、(C
 C₁ - C₆) ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₁ - C₆) ハロ

10

20

30

40

50

アルキルチオ、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルチオ - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルコキシ - (C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル - (C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルアミノカルボニル、(C₂ - C₆)アルケニルアミノカルボニル、ジ(C₂ - C₆)アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)ハロアルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈)シクロアルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₃ - C₈)シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₆)アルキルアミノ、ヘタリール、オキソヘタリール、ハロヘタリール、ハロオキソヘタリール、シアノヘタリール、シアノオキソヘタリール、(C₁ - C₆)ハロアルキルヘタリール又は(C₁ - C₆)ハロアルキルオキソヘタリール]であり；

Xは、Q₁ ~ Q₁₂

10

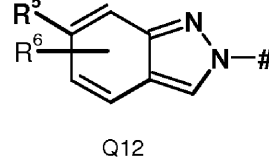
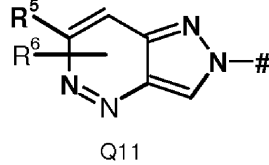
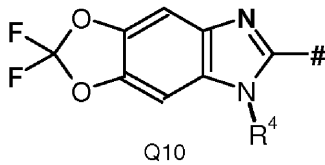
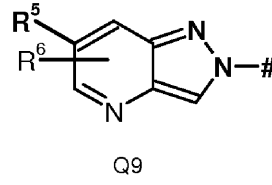
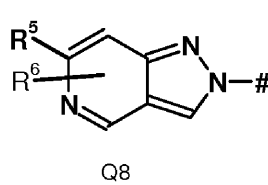
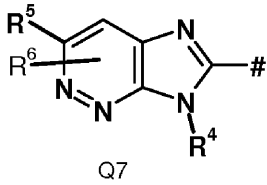
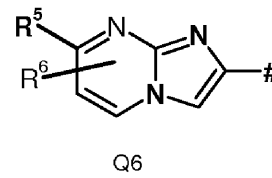
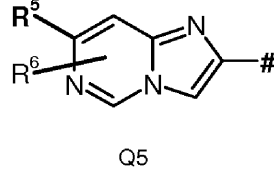
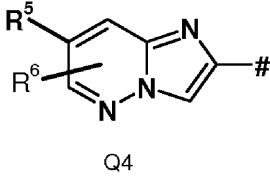
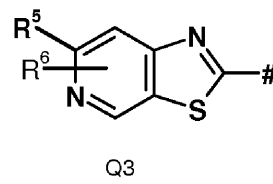
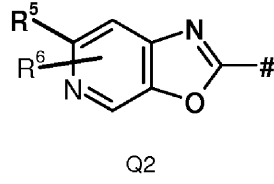
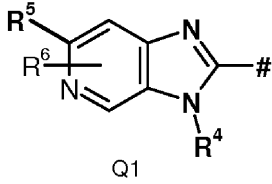
20

30

40

50

【化3】



【0012】

の群から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系であり；

R⁴は、水素、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)ハロアルキル、(C₁-C₆)シアノアルキル、(C₁-C₆)ヒドロキシアルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)ハロアルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルケニルオキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)ハロアルケニルオキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)ハロアルケニル、(C₂-C₆)シアノアルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₂-C₆)ハロアルキニル又は(C₃-C₈)シクロアルキルであり；

R⁵、R⁶は、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)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、(C₂-C₆)ハロアルキニル、(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₃-C₈)シクロアルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)ハロアルキル-(C₃-C₈)シクロアルキル、シアノ-(C₃-C₈)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₈)シクロアルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)ハロアルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシイミノ、(C₁-C₆)ハロアルコキシイミノ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₁-C₆)ハロアルキルチオ、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₁-C₆)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₆)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₆)アルキルカルボニル、(C₁-C₆)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-

10

20

30

40

50

C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル又はジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニルであり；
nは、0、1又は2である。

【0013】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成1-2において特定されている意味を有し、ここで、XがQ⁷である場合、R³は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) ハロアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル又は(C₁ - C₆) ハロアルキルスルホニルではない〕で表される化合物に関する。

10

【0014】

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

【発明を実施するための形態】

【0015】

本発明による化合物は、概して、式(I)によって定義される。上記及び下記に記載されている式の中で与えられているラジカルの好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。

20

【0016】

構成2-1

R¹は、好ましくは、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル又は(C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

R²は、好ましくは、水素、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキル又は(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキルであり；

30

R³は、好ましくは、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、(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) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、SCN、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₄) アルコキシカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) シクロ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、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₄) ハロ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チオカルボニル、アミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ

40

50

、(C₁ - C₄)ハロアルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₂)アルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル若しくは(C₂ - C₄)ハロアルキニルであるか、又は、

好ましくは、アリーール若しくはヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてよく、ここで、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在しているてもよく、及び、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、SF₅、トリ(C₁ - C₄)アルキルシリル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₂)アルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₂ - C₄)シアノアルキニル、(C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)シアノアルコキシ、(C₁ - C₄)アルコキシカルボニル - (C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (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)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₄)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)ハロ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、(C₂ - C₄)アルケニルアミノカルボニル、ジ(C₂ - C₄)アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボ

10

20

30

40

50

ニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₄)ハロ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チオカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、ヘタリール、オキソヘタリール、ハロヘタリール、ハロオキソヘタリール、シアノヘタリール、シアノオキソヘタリール、(C₁ - C₄)ハロアルキルヘタリール又は(C₁ - C₄)ハロアルキルオキソヘタリール]であり；

10

Xは、好ましくは、系列Q₁ ~ Q₁₂から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系であり；

R⁴は、好ましくは、水素、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル又は(C₃ - C₆)シクロアルキルであり；

20

R⁵、R⁶は、好ましくは、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(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)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニルであり；

30

nは、好ましくは、0、1又は2である。

【0017】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成2-1において特定されている意味を有し、ここで、Xが、好ましくは、Q₇である場合、R³は、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、(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)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニルではない〕で表される化合物に関する。

40

【0018】

構成2-2

R¹は、好ましくは、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル又は(C₃ - C₆)シクロアルキルであり；

50

R² は、好ましくは、水素、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)シアノアルキル、(C₁ - C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)アルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル - (C₁ - C₄)アルキルであり；

10

R³ は、好ましくは、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、(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)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、SCN、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₄)アルコキシカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルアミノカルボニル、(C₃ - C₆)シクロ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、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₄)ハロ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チオカルボニル、アミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)シアノアルケニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₂)アルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₂)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル - (C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルアミノカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノ若しくは(C₁ - C₄)ハロアルキルアミノカルボニル - (C₁ - C₄)アルキルアミノであるか、又は、

20

30

40

好ましくは、アリール、ヘタリール、シクロペンテニル若しくはシクロヘキセニル[ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、SF₅、トリ(C₁ - C₄)アルキルシリル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₃

50

- C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₂) アルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) シアノアルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシカルボニル - (C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルカルボニルオキシ、(C₁ - C₄) アルコキシカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) ハロ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、(C₂ - C₄) アルケニルアミノカルボニル、ジ(C₂ - C₄) アルケニルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホキシイミノ、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、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₄) ハロ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チオカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₄) アルキルアミノ、ヘタリール、オキソヘタリール、ハロヘタリール、ハロオキソヘタリール、シアノヘタリール、シアノオキソヘタリール、(C₁ - C₄) ハロアルキルヘタリール又は(C₁ - C₄) ハロアルキルオキソヘタリール] であり；

10

20

30

40

Xは、好ましくは、系列Q₁ ~ Q₁₂から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系であり；

R⁴は、好ましくは、水素、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ - (C₁ - C₄) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(

50

C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル又は(C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

R⁵、R⁶は、好ましくは、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(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) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル又は(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニルであり；

nは、好ましくは、0、1又は2である。

【0019】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成2-2において特定されている意味を有し、ここで、Xが、好ましくは、Q₇である場合、R³は、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、(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) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル又は(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニルではない〕で表される化合物に関する。

【0020】

構成3-1

R¹は、さらに好ましくは、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル又は(C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

R²は、さらに好ましくは、水素、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル又はハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

R³は、さらに好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノカルボニル、アミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル若しくは(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₂) アルケニルであるか、又は、

さらに好ましくは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフエニル、フラニル、ピラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル若しくはイミダゾリル〔ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、(ヘタリーールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、

ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SF₅、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)シアノアルキル、(C₁-C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₂)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₃-C₆)シクロアルキル-(C₂)アルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)シアノアルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₂)アルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルチオ-(C₁-C₂)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)ハロ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、(C₃-C₆)シクロ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、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノチオカルボニル、(C₁-C₄)ハロ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チオカルボニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ、(C₁-C₄)ハロアルキルアミノ、(C₃-C₆)シクロアルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノ、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル-(C₁-C₂)アルキルアミノ、(C₁-C₂)ハロアルキルカルボニル-(C₁-C₂)アルキルアミノ、(C₃-C₆)シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃-C₆)シクロアルキルカルボニル-(C₁-C₂)アルキルアミノ、(C₁-C₄)アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルチオカルボニル-(C₁-C₂)アルキルアミノ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオカルボニル-(C₁-C₂)アルキルアミノ、(C₃-C₆)シクロアルキルチオカルボニルアミノ又は(C₃-C₆)シクロアルキルチオカルボニル-(C₁-C₂)アルキルアミノ]であり；

10

20

30

Xは、さらに好ましくは、Q₁、Q₂、Q₄、Q₅、Q₆、Q₇、Q₈、Q₉、Q₁₀、Q₁₁又はQ₁₂の群から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系であり；

R⁴は、さらに好ましくは、水素、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル又は(C₃-C₆)シクロアルキルであり；

R⁵は、さらに好ましくは、ハロゲン、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、シアノ-(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(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)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル又は(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニルであり；

40

50

R⁶ は、さらに好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル又は(C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

n は、さらに好ましくは、0、1又は2である。

【0021】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成に3-1において特定されている意味を有し、ここで、Xが、好ましくは、Q⁷である場合、R³は、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ又は(C₁ - C₄) ハロアルコキシではない〕で表される化合物に関する。

【0022】

構成3-2

R¹ は、さらに好ましくは、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル又は(C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

R² は、さらに好ましくは、水素、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル又はハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

R³ は、さらに好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノカルボニル、アミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₂) アルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₂) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシカルボニル、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、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノチオカルボニルであるか、又は、

さらに好ましくは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフェニル、フラニル、ピラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、ピロリル、シクロペンテニル若しくはシクロヘキセニル〔ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、ここで、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SF₅、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、シアノ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₂) アルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₂) アルケニル、(C₂ - C₄) アルキニル、(C₂ - C₄) ハロアルキニル、(C₂ - C₄) シアノアルキニル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) シアノアルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₂) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルチオ - (C₁ - C₂)

10

20

30

40

50

アルキル、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄)ハロ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、(C₃ - C₆)シクロ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、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノチオカルボニル、(C₁ - C₄)ハロ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チオカルボニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₄)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₂)アルキルアミノ、(C₁ - C₂)ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニルアミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオカルボニル - (C₁ - C₂)アルキルアミノ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₂)アルキルアミノ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオカルボニルアミノ又は(C₃ - C₆)シクロアルキルチオカルボニル - (C₁ - C₂)アルキルアミノ]であり；

10

Xは、さらに好ましくは、Q₁、Q₂、Q₄、Q₅、Q₆、Q₇、Q₈、Q₉、Q₁₀、Q₁₁又はQ₁₂の群から選択されるヘテロ芳香族の9員又は12員の縮合二環式又は縮合三環式の環系であり；

R⁴は、さらに好ましくは、水素、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₁ - C₄)アルコキシ - (C₁ - C₄)アルキル又は(C₃ - C₆)シクロアルキルであり；

R⁵は、さらに好ましくは、ハロゲン、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₂ - C₄)アルケニル、(C₂ - C₄)ハロアルケニル、(C₂ - C₄)アルキニル、(C₂ - C₄)ハロアルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル - (C₃ - C₆)シクロアルキル、シアノ - (C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(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)アルコキシイミノ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシイミノ、(C₁ - C₄)アルキルチオ、(C₁ - C₄)ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニルオキシ、(C₁ - C₄)アルキルカルボニル又は(C₁ - C₄)ハロアルキルカルボニルであり；

30

R⁶は、さらに好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル又は(C₃ - C₆)シクロアルキルであり；

nは、さらに好ましくは、0、1又は2である。

【0023】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成3-2において特定されている意味を有し、ここで、Xが、好ましくは、Q₇である場合、R³は、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ又は(C₁ - C₄)ハロアルコキシではない〕で表される化合物に関する。

40

【0024】

50

構成 4 - 1

R¹ は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルであり；

R² は、一層さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n - ブチル、イソブチル、tert - ブチル、シクロブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルであり；

R³ は、一層さらに好ましくは、水素、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₂ - C₄) アルケニル、(C₂ - C₄) ハロアルケニル、(C₂ - C₄) シアノアルケニル若しくは(C₃ - C₆) シクロアルキル - (C₂) アルケニルであるか、又は、

一層さらに好ましくは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフェニル、チアゾリル、オキサゾリル若しくはイミダゾリル [ここで、これらは、それぞれ、同一

であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、炭素原子を介して、当該分子の残部に架橋しており、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル - (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ

(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁ - C₄) シアノアルキル、(C₁ - C₄) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₂) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシ - (C₁ - C₂) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルコキシイミノ、(C₁ - C₄) アルキルチオ、(C₁ - C₄) ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄) アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、ジ

(C₁ - C₄) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノカルボニル、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₄) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₄) アルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₁ - C₄) ハロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニルアミノ、(C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニル - (C₁ - C₂) アルキルアミノ] であり；

X は、一層さらに好ましくは、Q₁、Q₄、Q₅、Q₇、Q₈、Q₉ 又は Q₁₁ であり；

R⁴ は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、tert - ブチル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

R⁵ は、一層さらに好ましくは、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルフィニルであり；

R⁶ は、一層さらに好ましくは、水素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、フッ素又は塩素であり；

n は、一層さらに好ましくは、0、1 又は 2 である。

【0025】

さらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 及び n は、構成 4 - 1 において特定されている意味を有し、ここで、X が、一層さらに好ましくは、Q₇ である場合、R³ は、水素、(C₁ - C₄) アルキル又は (C₁ -

10

20

30

40

50

C 4) ハロアルキルではない) で表される化合物に関する。

【 0 0 2 6 】

構成 4 - 2

R¹ は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルであり；

R² は、一層さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n - ブチル、イソブチル、tert - ブチル、シクロブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルであり；

R³ は、一層さらに好ましくは、水素、(C 1 - C 4) アルキル、(C 1 - C 4) ハロアルキル、(C 2 - C 4) アルケニル、(C 2 - C 4) ハロアルケニル、(C 2 - C 4) シアノアルケニル、(C 3 - C 6) シクロアルキル - (C 2) アルケニル、ハロゲン、シアノ、(C 2 - C 4) アルキニル、(C 3 - C 6) シクロアルキル - (C 2) アルキニル、(C 3 - C 6) シクロアルキル - (C 1 - C 4) アルキル、(C 1 - C 4) アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C 1 - C 4) アルキルアミノカルボニル、ジ(C 1 - C 4) アルキルアミノカルボニル、(C 1 - C 4) ハロアルキルアミノカルボニル、アミノチオカルボニル、(C 1 - C 4) アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C 1 - C 4) アルキルアミノチオカルボニル、(C 1 - C 4) ハロアルキルアミノチオカルボニルであるか、又は、

一層さらに好ましくは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフェニル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリル、シクロペンテニル若しくはシクロヘキセニル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で 1 置換又は多置換されていてよく、炭素原子を介して、当該分子の残部に架橋しており、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、(C 3 - C 6) シクロアルキル、(C 1 - C 4) アルキル - (C 3 - C 6) シクロアルキル、ハロ(C 3 - C 6) シクロアルキル、シアノ(C 3 - C 6) シクロアルキル、(C 1 - C 4) アルキル、(C 1 - C 4) ハロアルキル、(C 1 - C 4) シアノアルキル、(C 1 - C 4) ヒドロキシアルキル、(C 1 - C 4) アルコキシ - (C 1 - C 2) 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) アルコキシ - (C 1 - C 2) アルコキシ、(C 1 - C 4) アルコキシイミノ、(C 1 - C 4) アルキルチオ、(C 1 - C 4) ハロアルキルチオ、(C 1 - C 4) アルキルスルフィニル、(C 1 - C 4) ハロアルキルスルフィニル、(C 1 - C 4) アルキルスルホニル、(C 1 - C 4) ハロアルキルスルホニル、(C 1 - C 4) アルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C 1 - C 4) アルキルアミノカルボニル、ジ(C 1 - C 4) アルキルアミノカルボニル、(C 1 - C 4) ハロアルキルアミノカルボニル、(C 3 - C 6) シクロアルキルアミノカルボニル、(C 1 - C 4) アルキルスルホニルアミノ、(C 1 - C 4) アルキルアミノ、ジ(C 1 - C 4) アルキルアミノ、(C 1 - C 4) ハロアルキルアミノ、(C 3 - C 6) シクロアルキルアミノ、(C 1 - C 4) アルキルカルボニルアミノ、(C 1 - C 4) ハロアルキルカルボニルアミノ、(C 1 - C 4) アルキルカルボニル - (C 1 - C 2) アルキルアミノ、(C 1 - C 4) ハロアルキルカルボニル - (C 1 - C 2) アルキルアミノ、(C 3 - C 6) シクロアルキルカルボニルアミノ、(C 3 - C 6) シクロアルキルカルボニル - (C 1 - C 2) アルキルアミノ] であるか、又は、

一層さらに好ましくは、ピラゾリル若しくはイミダゾリル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で 1 置換又は多置換されていてよく、窒素原子を介して、当該分子の残部に架橋しており、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、(C 3 - C 6) シクロアルキル、(C 1 - C 4) アルキル、(C 1 - C 4) ハロアルキル、(C 1 -

10

20

30

40

50

C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) ハロアルコキシ、アミノカルボニル] であり；
X は、一層さらに好ましくは、Q₁、Q₄、Q₅、Q₇、Q₈、Q₉、Q₁₁ 又は Q₁₂ であり；

R₄ は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、tert - ブチル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

R₅ は、一層さらに好ましくは、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルフィニルであり；

R₆ は、一層さらに好ましくは、水素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、フッ素又は塩素であり；

n は、一層さらに好ましくは、0、1 又は 2 である。

【0027】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I) [式中、X、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆ 及び n は、構成 4 - 2 において特定されている意味を有し、ここで、X が、一層さらに好ましくは、Q₇ である場合、R₃ は、水素、(C₁ - C₄) アルキル、ハロゲン、シアノ又は (C₁ - C₄) ハロアルキルではない] で表される化合物に関する。

【0028】

構成 4 - 3

R₁、R₂、R₄、R₅、R₆ 及び n は、構成 4 - 2 において特定されている意味を有し；並びに、

X は、一層さらに好ましくは、Q₁、Q₇、Q₈、Q₉ 又は Q₁₂ であり；及び、

R₃ は、特に、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、エテニル、イソプロペニル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルエテニル、シクロプロピルエチニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、トリフルオロメチルアミノカルボニル、トリフルオロエチルアミノカルボニル、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、エ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、エチルアミノチオカルボニルであるか、又は、

フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリル若しくはシクロヘキセニル [ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で 1 置換、2 置換又は 3 置換されていてもよく、炭素原子を介して、当該分子の残部に架橋しており、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、フッ素、塩素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、シアノメチル、シアノエチル、シアノイソプロピル、シアノシクロプロピル (cyanocyclopropyl)、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、アミノカルボニル] であるか、又は、

ピラゾリル若しくはイミダゾリル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で 1 置換されていてもよく、窒素原子を介して、当該分子の残部に架橋している] である。

【0029】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I) [式中、X、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆ 及び n は、構成 4 - 3 において特定されている意味を有し、ここで、X が、一層さらに好ましくは、Q₇ である場合、R₃ は、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル又はイソプロピルではない] で表される化合物に関する。

【0030】

構成 5 - 1

R₁ は、強調すべきには、エチル又はイソプロピルであり；

R₂ は、強調すべきには、メチル、エチル又はイソプロピルであり；

R₃ は、強調すべきには、水素、臭素、シアノ、エテニル、シクロプロピルエテニル、イ

10

20

30

40

50

ソプロペニル、シクロプロピルエチニル、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルエチル、メトキシカルボニル、トリフルオロエチルアミノカルボニル、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、エ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であるか、又は、

強調すべきには、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフェニル（チエニル）、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリル若しくはシクロヘキセニル〔ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換、2置換又は3置換されていてもよく、炭素原子を介して、当該分子の残部に架橋しており、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、フッ素、塩素、メチル、シクロプロピル、シアノメチル、シアノイソプロピル、シアノシクロプロピル（*cyanocyclopropyl*）、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、アミノカルボニル〕であるか、又は、

強調すべきには、ピラゾリル若しくはイミダゾリル〔ここで、これらは、それぞれ、塩素で1置換されていてもよく、窒素原子を介して、当該分子の残部に架橋している〕であり；
Xは、強調すべきには、Q1、Q7、Q8、Q9又はQ12であり；

R4は、強調すべきには、メチルであり；

R5は、強調すべきには、トリフルオロメチルであり；

R6は、強調すべきには、水素であり；

nは、強調すべきには、0又は2である。

【0031】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R1、R2、R3、R4、R5、R6及びnは、構成5-1において特定されている意味を有し、ここで、XがQ7である場合、R3は、水素、臭素、シアノ、メチル、エチル又はイソプロピルではない〕で表される化合物に関する。

【0032】

構成5-2

R1、R2、X、R4、R5、R6、nは、構成5-1において特定されている意味を有し、及び、

R3は、強調すべきには、水素、臭素、シアノ、エテニル、シクロプロピルエテニル、イソプロペニル、シクロプロピルエチニル、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルエチル、メトキシカルボニル、トリフルオロエチルアミノカルボニル、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、エ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であるか、又は、

フェニル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピリダジン-4-イル、チエン-2-イル、チエン-3-イル、1,3-チアゾール-5-イル、1H-イミダゾール-1-イル、1H-イミダゾール-2-イル、1H-イミダゾール-5-イル、1H-ピラゾール-1-イル、1H-ピラゾール-3-イル、1H-ピラゾール-4-イル、1H-ピラゾール-5-イル、1H-ピロール-2-イル若しくは1-シクロヘキセニル〔ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換、2置換又は3置換されていてもよく、ここで、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のとおりである：シアノ、フッ素、塩素、メチル、シクロプロピル、シアノメチル、シアノイソプロピル、シアノシクロプロピル（*cyanocyclopropyl*）、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、アミノカルボニル〕である。

【0033】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、X、R1、R2、R3、R4、R5、R6及びnは、構成5-2において特定されている意味を有し、ここで、XがQ7である場合、R3は、水素、臭素、シアノ、メチル、エチル又はイソプロピルではない〕で表

される化合物に関する。

【0034】

構成5-3

R¹、R²、X、R⁴、R⁵、R⁶、nは、構成5-1において特定されている意味を有し、及び、

R³は、強調すべきには、水素、臭素、シアノ、エテニル、シクロプロピルエテニル、イソプロペニル、シクロプロピルエチニル、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルエチル、メトキシカルボニル、トリフルオロエチルアミノカルボニル、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、エ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、
フェニル[ここで、これは、いずれの場合にも、シアノ、フッ素、塩素、メチル、シアノメチル、シアノイソプロピル、シアノシクロプロピル(cyanocyclopropyl)、トリフルオロメチル又はアミノカルボニルで、同じように又は異なるように、1置換、2置換又は3置換されていてもよい]、

ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル若しくはピリジン-4-イル[ここで、これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で1置換されていてもよい]、

ピリミジン-5-イル、

ピリダジン-4-イル、

チエン-2-イル若しくはチエン-3-イル[ここで、これらは、それぞれ、塩素で1置換又は2置換されていてもよい]、

1,3-チアゾール-5-イル[ここで、これは、メチルで1置換されていてもよい]、
1H-イミダゾール-1-イル、1H-イミダゾール-2-イル若しくは1H-イミダゾール-5-イル[ここで、これらは、それぞれ、塩素又はメチルで1置換又は2置換されていてもよい]、

1H-ピラゾール-1-イル、1H-ピラゾール-3-イル、1H-ピラゾール-4-イル若しくは1H-ピラゾール-5-イル[ここで、これらは、それぞれ、塩素、メチル、シクロプロピル、トリフルオロメチル又はトリフルオロエチルで、同じように又は異なるように、1置換、2置換又は3置換されていてもよい]、

1H-ピロール-2-イル[ここで、これは、いずれの場合にも、メチル又はシアノで、同じように又は異なるように、1置換又は2置換されていてもよい]、

1-シクロヘキセニル[ここで、これは、いずれの場合にも、メチル又はトリフルオロメチルで、同じように又は異なるように、1置換又は2置換されていてもよい]である。

【0035】

さらなる実施形態では、本発明は、式(I)[式中、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成5-3において特定されている意味を有し、ここで、XがQ⁷である場合、R³は、水素、臭素、シアノ、メチル、エチル又はイソプロピルではない]で表される化合物に関する。

【0036】

R³が置換されているヘタリールである場合、該ヘタリール基における当該置換は、炭素原子及び/又は窒素原子における水素の置換であり得る。

【0037】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)[式中、Xは、Q¹であり、並びに、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する]で表される化合物に関する。

【0038】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)[式中、Xは、Q¹であり、R⁴は、メチルであり、R⁵は、トリフルオロメチルであり、R⁶は、水素であり、並びに、R¹、R²、R³及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-

10

20

30

40

50

2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0039】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q7であり、並びに、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0040】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q7であり、R⁴は、メチルであり、R⁵は、トリフルオロメチルであり、R⁶は、水素であり、並びに、R¹、R²、R³及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0041】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q8であり、並びに、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0042】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q8であり、R⁵は、トリフルオロメチルであり、R⁶は、水素であり、並びに、R¹、R²、R³及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0043】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q9であり、並びに、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0044】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q9であり、R⁵は、トリフルオロメチルであり、R⁶は、水素であり、並びに、R¹、R²、R³及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0045】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q12であり、並びに、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0046】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q12であり、R⁵は、トリ

10

20

30

40

50

フルオロメチルであり、R⁶は、水素であり、並びに、R¹、R²、R³及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0047】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q¹、Q⁷、Q⁸、Q⁹又はQ¹²であり、並びに、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

10

【0048】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Xは、Q¹、Q⁸、Q⁹又はQ¹²であり、並びに、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0049】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R²、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R³は、構成(5-1)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

20

【0050】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R²、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R³は、構成(5-2)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

30

【0051】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R²、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R³は、構成(5-3)において特定されている意味を有する)で表される化合物に関する。

40

【0052】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R²、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R³は、水素、臭素、シアノ、エチニル、シクロプロピルエチニル、イソプロペニル、シクロプロピルエチニル、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピルエチル、メトキシカルボニル、トリフルオロエチルアミノカルボニル、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、エ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又はジメチルアミノチオカル

50

ボニルである〕で表される化合物に関する。

【0053】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R²、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R³は、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、チオフェニル(チエニル)、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリル又はシクロヘキセニル〔ここで、これらは、それぞれ、同一であるか又は異なっている置換基で1置換、2置換又は3置換されていてもよく、炭素原子を介して、当該分子の残部に架橋して

10

【0054】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R¹、R²、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R³は、ピラゾリル又はイミダゾリル〔ここで、これらは、それぞれ、塩素で1置換されていてもよく、窒素原子を介して、当該分子の残部に架橋している〕である〕で表される化合物に関する。

20

【0055】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R²、R³、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R¹は、エチルである〕で表される化合物に関する。

【0056】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R²、R³、X、R⁴、R⁵、R⁶及びnは、構成(1-1)又は構成(1-2)又は構成(2-1)又は構成(2-2)又は構成(3-1)又は構成(3-2)又は構成(4-1)又は構成(4-2)又は構成(4-3)又は構成(5-1)又は構成(5-2)又は構成(5-3)において特定されている意味を有し、並びに、R¹は、イソプロピルである〕で表される化合物に関する。

30

【0057】

概して又は好ましい範囲内において記載されている定義において、別途示されていない限り、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素の群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素の群から選択される。

【0058】

アリール(これは、より大きな単位(例えば、アリールアルキル)の一部としてのアリールを包含する)は、他の場所で異なるように定義されていない限り、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの系列から選択され、そして、好ましくは、フェニルである。

40

【0059】

本発明に関連して、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わされて(例えば、ハロアルキル)、1~12個の炭素原子を有する飽和脂肪族炭化水素基のラジカルを意味するものと理解され、そして、分枝鎖又は非分枝鎖であることができる。C₁-C₁₂-アルキルラジカルの例は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル

50

、 1 - メチルブチル、 2 - メチルブチル、 1 - エチルプロピル、 1, 2 - ジメチルプロピル、ヘキシル、n - ヘプチル、n - オクチル、n - ノニル、n - デシル、n - ウンデシル及びn - ドデシルである。これらのアルキルラジカルの中で、特に好ましいのは、C₁ - C₆ - アルキルラジカルである。特別に好ましいのは、C₁ - C₄ - アルキルラジカルである。

【0060】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルケニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の二重結合を有している直鎖又は分枝鎖のC₂ - C₁₂ - アルケニルラジカル、例えば、ビニル、アリル、1 - プロペニル、イソプロペニル、1 - ブテニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1, 3 - ブタジエニル、1 - ペンテニル、2 - ペンテニル、3 - ペンテニル、4 - ペンテニル、1, 3 - ペンタジエニル、1 - ヘキセニル、2 - ヘキセニル、3 - ヘキセニル、4 - ヘキセニル、5 - ヘキセニル及び1, 4 - ヘキサジエニルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、C₂ - C₆ - アルケニルラジカルであり、特に好ましいのは、C₂ - C₄ - アルケニルラジカルである。

10

【0061】

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

20

【0062】

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

【0063】

用語「アルコキシ」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロアルコキシ）、この場合、O - アルキルラジカルを意味するものと理解され、ここで、用語「アルキル」は、上記で定義されているとおりである。

30

【0064】

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

【0065】

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

40

【0066】

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

【0067】

本発明に従って好ましいのは、好ましいものとして上記で挙げられている意味の組合せを含んでいる式(I)で表される化合物の使用である。

【0068】

50

本発明に従って特に好ましいのは、特に好ましいものとして上記で挙げられている意味の組合せを含んでいる式 (I) で表される化合物の使用である。

【0069】

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

【0070】

本発明に従って最も好ましいのは、最も好ましいものとして挙げられている意味の組合せを含んでいる式 (I) で表される化合物の使用である。

【0071】

式 (I) で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態、及び/若しくは、光学活性異性体の形態、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態をとることができる。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の望ましい混合物の両方を包含する。

10

【0072】

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

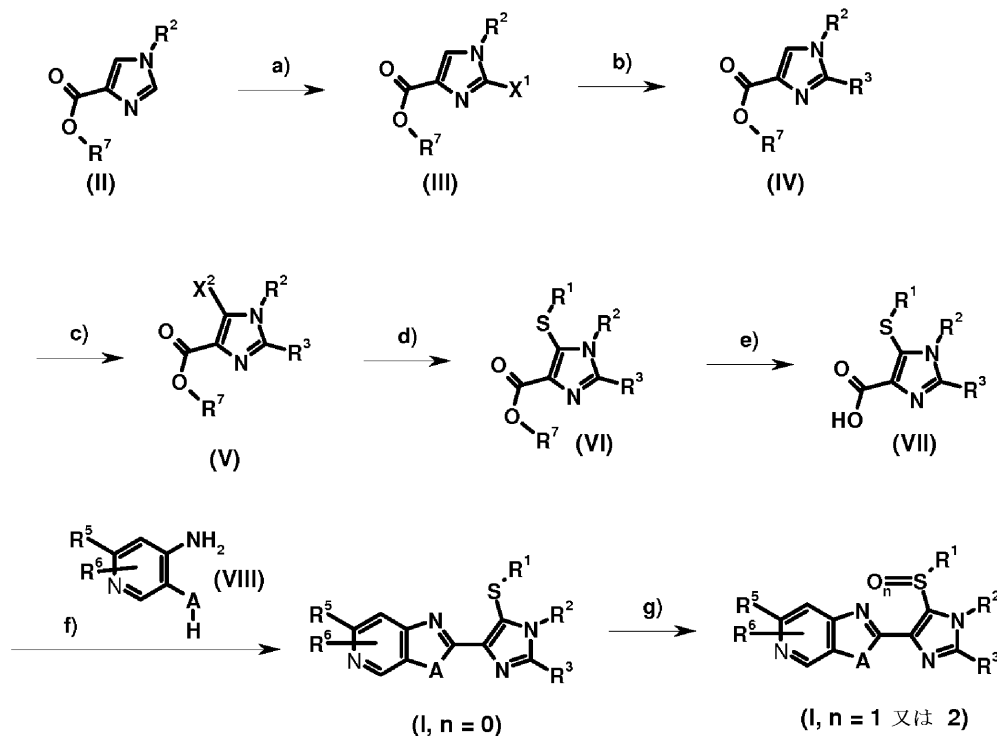
【0073】

方法 A

式 (I) (式中、 R^3 は、アリール、ヘタリール、シクロペンテニル又はシクロヘキセニル (これらは、上記で記載されているように置換されていてもよい) であり、及び、 X は、 Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_7 又は Q_{10} である) で表される化合物を調製するための一般的な方法を、式 (I) (式中、 X は、 Q_1 、 Q_2 又は Q_3 である) で表される化合物を用いて、例として、以下に記載する。

20

【化 4】



【0074】

ラジカル R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 及び R^6 は、上記で記載されている意味を有する。 A は、 $-N-R^4$ 、 O 又は S であり、ここで、 R^4 は、上記で記載されている意味を有する。 X^1 及び X^2 は、ハロゲンである。 R^7 は、(C₁ - C₄) アルキルである。

50

【0075】

段階 (a)

式 (III) で表される化合物は、例えば、WO 2013/149997、WO 2014/115077 又は WO 2011/123609 に記載されている方法と同様にして、式 (II) で表されるイミダゾール誘導体から、例えば、溶媒 (例えば、テトラヒドロフラン) の中でのハロゲン化試薬 (例えば、N-プロモスクシンイミド (NBS)) との反応によって、又は、式 (I) で表される化合物をテトラクロロメタン若しくはクロロホルムの中でアゾビス (イソブチロニトリル) (AIBN) と組み合わせられた NBS と反応させることによって、調製することができる。

【0076】

式 (II) で表されるイミダゾール誘導体は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、WO 2014/191894、US 2003/229079 若しくは WO 2013/156608 に記載されている方法と同様にして、調製することができる。

【0077】

段階 (b)

式 (III) [式中、X¹ は、好ましくは、塩素又は臭素の系列から選択されるハロゲンである] で表される化合物は、例えば、遷移金属が介在するクロスカップリング [cf. 「Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483」、「Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695」、「Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004」] によって、又は、求核芳香族置換 (cf. 「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2007, 17, 5825-5830」又は US 4125726 に記載されている方法) によって、式 (IV) で表される化合物に変換させることができる。

【0078】

例えば、式 (III) [式中、X¹ は、好ましくは、塩素又は臭素である] で表される化合物を、既知方法 (cf. WO 2012/143599、US 2014/94474、US 2014/243316、US 2015/284358 又は 「Journal of Organic Chemistry 2004, 69, 8829-8835」) に従って、遷移金属塩の系列から選択される適切な触媒の存在下、適切なボロン酸 [R³-B(OH)₂] 又はボロン酸エステルと反応させて、式 (IV) で表される化合物を生成させることができる。好ましいカップリング触媒の例としては、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィン)フェロセン]ジクロロパラジウム (II)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (II) ジクロリド又はテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムなどのパラジウム触媒などがある。該方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウム、カリウム又はセシウムの炭酸塩である。必要とされるボロン酸誘導体 [R³-B(OH)₂] 又はボロン酸エステル誘導体の一部は、既知であり及び/若しくは市販されており、又は、それらは、一般的に知られている方法で調製することができる (cf. Boronic Acids (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011)。この場合、該反応は、好ましくは、水と一般的な反応条件下で不活性である慣習的な有機溶媒から選択される有機溶媒との混合物の中で実施する。多くの場合、エーテル類、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン又は 1,2-ジメトキシエタンなどを使用する。

【0079】

あるいは、カップリングパートナーとして、スタンナン誘導体 [R³-Sn(Et)₄] を使用することができる (cf. US 2013/281433、WO 2004/99177 又は WO 2016/71214)。必要とされるスタンナン誘導体 [R³-Sn(Et)₄] の一部は、既知であり及び/若しくは市販されており、又は、それらは、一般的に知られている方法で調製することができる (cf. WO 2016/71214 又は W

10

20

30

40

50

02007/148093)。

【0080】

式(IV)で表される化合物を生成させるための式(III)で表されるハロゲン化イミダゾール誘導体とNH-含有ヘテロ芳香族化合物(例えば、イミダゾール類又はピラゾール類(これらは、上記で記載したように置換されていてもよい))のカップリングは、塩基性条件下での反応(例えば、ジメチルホルムアミドの中の水素化ナトリウムを用いて)によって実施することが可能である(c f 例え、WO2005/58898)。あるいは、該反応は、不活性ガス雰囲気下、適切な溶媒(例えば、1,4-ジオキサン又はトルエン)の中で、適切なリガンド(例えば、(トランス)-N,N'-ジメチルシクロヘキサ-1,2-ジアミン又はR-(+)-プロリン)及び適切な塩基(例えば、炭酸カリウム又はリン酸カリウム)の存在下での、例えば、銅(I)塩、ヨウ化銅(I)の触媒作用によって、実施することができる(c f . 例え、WO2016/109559)。これらの反応条件下では、式(IV)〔式中、R³=H〕で表される化合物も形成され得る。

10

【0081】

段階(c)

式(V)〔式中、X²は、好ましくは、臭素又はヨウ素の系列から選択されるハロゲンである〕で表されるイミダゾール誘導体は、標準的な方法を用いて、式(IV)で表される化合物から、例えば、臭素若しくはN-プロモスクシンイミド(NBS)との反応によって(c f . WO2009/115572又はWO2010/91411)、又は、場合により酢酸若しくはトリフルオロ酢酸の存在下における、N-ヨードスクシンイミド(NIS)との反応によって(c f . WO2008/63287、WO2007/87548又はWO2009/152025)、調製することができる。

20

【0082】

段階(d)

式(V)〔式中、X²は、好ましくは、臭素又はヨウ素の系列から選択されるハロゲンである〕で表される化合物は、例えば、塩基性条件下、メルカプタン誘導体(R¹-SH)及び銅(I)塩との反応によって(c f . EP257918又はWO2009/152025)、又は、求核芳香族置換によって(c f . Australian Journal of Chemistry 1987, 40, 1415-1425)、式(VI)で表される化合物に変換させることができる。

30

【0083】

あるいは、式(V)〔式中、X²は、好ましくは、臭素又はヨウ素の系列から選択されるハロゲンである〕で表される化合物とメルカプタン誘導体(R¹-SH)の反応は、パラジウム触媒、例えば、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム[Pd₂(dba)₃]の存在下で、実施することができる。この場合、高い頻度で、アミン塩基[例えば、トリエチルアミン又はN,N-ジイソプロピルエチルアミン(DIPEA)]及びホスフィンリガンド[例えば、Xantphos]が使用される(c f . WO2013/25958、WO2013/66869、US2009/27039、WO2011/58149、WO2011/143466又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2016, 26, 2984-2987」)。この場合、該反応は、好ましくは、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な有機溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、エーテル類、例えば、ジオキサン又は1,2-ジメトキシエタンである。

40

【0084】

メルカプタン誘導体(例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン)は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2006/25633、US2006/111591、US2820062、「Chemical Communications, 13(2000), 1163-1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 4

50

4 (1 9 2 2) , p p . 1 3 2 3 - 1 3 3 3 」に記載されている方法と同様にして、調製することができる。

【 0 0 8 5 】

段階 (e)

式 (V I) で表されるエステルは、標準的な方法 (c f . 、例えば、W O 2 0 1 4 / 1 9 1 8 9 4 、 U S 2 0 0 6 / 1 9 4 7 7 9 、 W O 2 0 1 4 / 8 6 6 6 3 又は「European Journal of Organic Chemistry 2009, 213 - 222」) を用いて、例えば、溶媒としてのアルコール (例えば、メタノール又はエタノール) の中で塩基としてアルカリ金属水酸化物 (例えば、水酸化ナトリウム又は水酸化リチウム) を使用して、式 (V I I) で表されるカルボン酸に変換させることができる。

10

【 0 0 8 6 】

段階 (f)

式 (I 、 n = 0) 表される化合物は、縮合剤の存在下で式 (V I I I) で表される化合物を用いて、式 (V I I) で表される化合物から調製することができる。

【 0 0 8 7 】

式 (V I I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、W O 2 0 1 0 / 1 2 5 9 8 5 、 W O 2 0 1 2 / 0 7 4 1 3 5 、 W O 2 0 1 2 / 0 8 6 8 4 8 、 W O 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8 、 W O 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 、 W O 2 0 1 5 / 1 2 1 1 3 6 、 W O 2 0 1 6 / 0 3 9 4 4 1 、 W O 2 0 1 6 / 0 5 9 1 4 5 、 W O 2 0 1 6 / 0 7 1 2 1 4 、 W O 2 0 1 6 / 1 6 9 8 8 2 、 W O 2 0 1 6 / 1 6 9 8 8 6 若しくは W O 2 0 1 6 / 1 2 4 5 5 7 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

20

【 0 0 8 8 】

式 (I 、 n = 0) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン、tert - ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2 - ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N - ジメチルホルムアミド又はN - メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

30

【 0 0 8 9 】

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

【 0 0 9 0 】

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

40

【 0 0 9 1 】

該反応は、酸又は塩基の存在下で存在下で実施することができる。

【 0 0 9 2 】

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

【 0 0 9 3 】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素含有ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2, 6 - ルチジン、1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン (D B U

50

); 第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN,N-ジイソプロピルエチルアミン; 無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

【0094】

段階 (g)

式 (I、n = 1 又は 2) で表される化合物は、例えば、WO 2016 / 169882 又は WO 2016 / 124557 に記載されている方法と同様にして、式 (I、n = 0) で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。該酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである: ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン; アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール; 酸、酢酸、プロピオン酸、又は、水。

10

【0095】

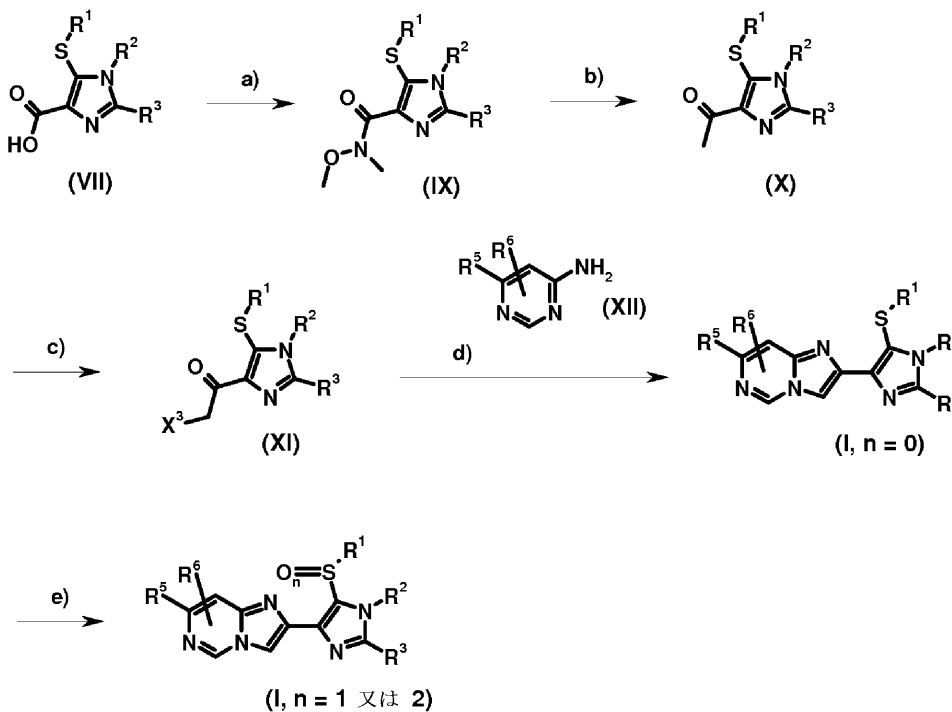
適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタ-クロロ過安息香酸である。

【0096】

方法 B

式 (I) [式中、X は、Q4、Q5 又は Q6 である] で表される化合物を調製するための一般的な方法を、式 (I) [式中、X は、Q5 である] で表される化合物を参照して、例として、以下に記載する。

【化5】



20

30

40

【0097】

ラジカル R¹、R²、R³、R⁵ 及び R⁶ は、上記で記載されている意味を有する。X³ は、ハロゲンである。

【0098】

段階 (a)

式 (VII) で表されるカルボン酸は、US 9108905 又は「Organic Letters 2009, 11, 1023-1026」に記載されている方法と同様にして、縮合剤の存在下、N,N-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩の存在下で、式 (IX) で表されるワインレブアミドに変換させることができる。

【0099】

50

式 (IX) で表される化合物への前記変換は、好ましくは、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、ニトリル類 (例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル) 又は非プロトン性極性溶媒 (例えば、N, N - ジメチルホルムアミド又はN - メチルピロリドン) である。

【0100】

適切な縮合剤の例は、カルボジイミド類 (例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) 及び1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド)、無水物 (例えば、無水酢酸及び無水トリフルオロ酢酸) 又はクロロギ酸イソブチルである。

【0101】

該反応は、塩基 (例えば、トリエチルアミン又はN - メチルモルホリン) の存在下で実施することができる。

【0102】

段階 (b)

式 (IX) で表されるワインレブアミドは、「Journal of Medicinal Chemistry 1995, 38, 4972 - 4975」又は「Organic Letters 2012, 14, 6158 - 6161」に記載されている方法と同様にして、メチルリチウム又はハロゲン化メチルマグネシウム (例えば、臭化メチルマグネシウム) の存在下で、式 (X) で表されるケトンに変換させることができる。

【0103】

式 (X) で表される化合物への前記変換は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、エーテル類 (例えば、テトラヒドロフラン又はジエチルエーテル) である。

【0104】

段階 (c)

式 (X) で表されるケトンは、「Chemistry - A European Journal 2011, 17, 4839 - 4848」に記載されている方法と同様にして、テトラヒドロフランの中でリチウムジイソプロピルアミド (LDA) を用いて脱プロトン化することによって、エノラートに変換させることができる。形成されたエノラートは、次いで、例えば、トリメチルシリルクロリド (TMSCl) を用いて、シリルエノールエーテルに変換させることが可能であり、このシリルエノールエーテルを、次に、例えば、N - ブロモスクシンイミド (NBS) を用いて、 α - ハロゲン化によって、式 (XI) で表される化合物に変換させる。

【0105】

あるいは、式 (X) で表されるケトンから出発して、例えば、US 2006 / 52378、WO 2005 / 7631、US 2012 / 214791 又は US 4544664 に記載されている方法と同様にして、 α - ハロゲン化に関して文献から知られている別の方法を使用することも可能である。

【0106】

段階 (d)

式 (I, n = 0) で表される化合物は、式 (XI) で表される化合物を式 (XII) で表されるアミンを用いて環化させることによって、調製することができる。該環化は、既知方法で、例えば、WO 2005 / 66177、WO 2012 / 88411、WO 2013 / 3298、US 2009 / 203705、US 2012 / 258951、WO 2012 / 168733、WO 2014 / 187762 又は「J. Med. Chem. 1988, 31, 1590 - 1595」に記載されている調製方法と同様にして、例えば、エタノール、アセトニトリル又はN, N - ジメチルホルムアミドの中で、実施する。

【0107】

式 (XII) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2009 / 170849、WO 2016 / 51193、WO 2016 / 107742 若し

10

20

30

40

50

くはWO2016/71214に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0108】

段階(e)

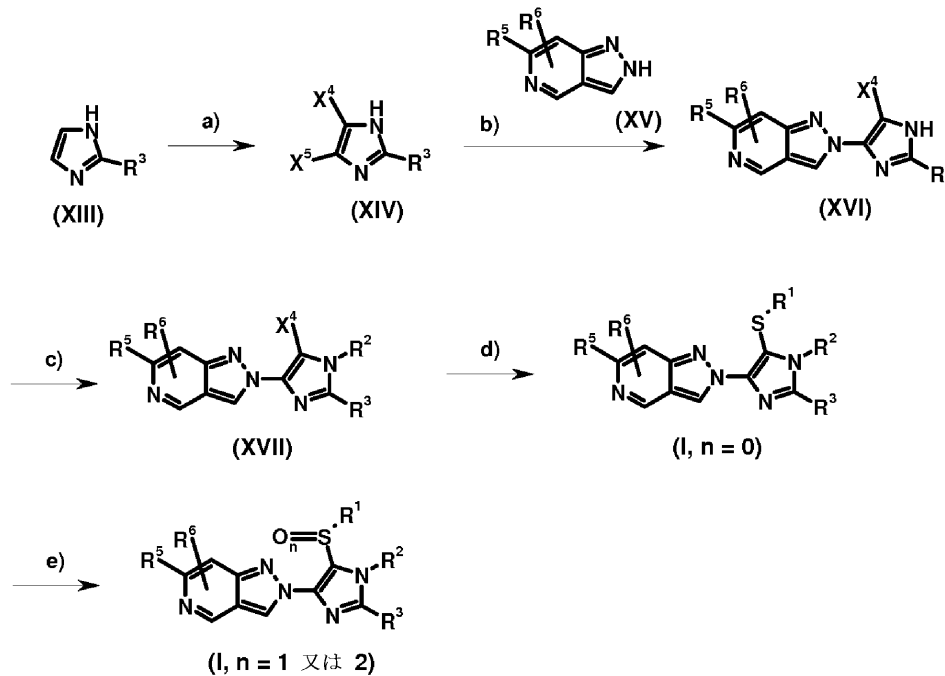
式(I, n = 0)で表される化合物は、方法Aの段階(g)と同様にして、式(I, n = 1又は2)で表される化合物に変換させる。

【0109】

方法C

式(I)〔式中、Xは、Q8、Q9、Q11又はQ12である〕で表される化合物を調製するための一般的な方法を、式(I)〔式中、Xは、Q8である〕で表される化合物を参照して、例として、以下に記載する。

【化6】



【0110】

ラジカルR¹、R²、R³、R⁵及びR⁶は、上記で記載されている意味を有する。X⁴及びX⁵は、ハロゲンである。

【0111】

段階(b)～段階(e)の順序は、互いに換えることができる。

【0112】

段階(a)

式(XIII)で表されるイミダゾール誘導体を、方法Aの段階(a)及び段階(c)と同様にして、ハロゲン化試薬(例えば、NBS、臭素又はヨウ素)と反応させて、式(XIV)〔式中、X⁴及びX⁵は、好ましくは、臭素及びヨウ素の系列から選択されるハロゲンである〕で表される化合物を生成させることができる(c.f. WO2011/85269、WO2004/80998又はWO2016/87487)。

【0113】

式(XIII)で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「Advanced Synthesis and Catalysis 2009, 351, 2912-2920」、「Synthetic Communications 1989, 19, 2551-2566」若しくはWO2009/27746に記載されている方法と同様にして、調製することができる。

【0114】

10

20

30

40

50

段階 (b)

式 (X V I) で表される化合物は、式 (X I V) で表される化合物から、式 (X V) で表される化合物との反応によって、例えば、「Bioorganic and Medicinal Chemistry 2008, 16, 9524-9535」、「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 1997, 7, 2723-2728」又は WO2016/20286 に記載されている方法と同様にして、非プロトン性極性溶媒 (例えば、N, N - ジメチルホルムアミド) の中で、塩基性条件下 (例えば、炭酸ナトリウム又は炭酸リチウムなどの炭酸塩塩基を使用して) における反応によって、合成することができる。

【 0 1 1 5 】

あるいは、該反応は、例えば、WO2016/20286 又は KR2015/66012 に記載されている方法と同様にして、銅又はヨウ化銅 (I) 及び塩基性反応助剤 (例えば、トランス - N, N' - ジメチルシクロヘキサン - 1, 2 - ジアミン、炭酸カリウム又はリン酸カリウム) の存在下、適切な溶媒又は希釈剤の中で、実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には、全ての不活性有機溶媒、例えば、脂肪族炭化水素類又は芳香族炭化水素類などが包含される。好ましくは、トルエンを使用する。

【 0 1 1 6 】

式 (X V) で表される化合物は、は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、「Organic Letters 2011, 13, 3542-3545」に記載されている方法と同様にして、調製することができる。

【 0 1 1 7 】

段階 (c)

式 (X V I) で表されるイミダゾール誘導体は、標準的な方法 (c f . 、例えば、「Heterocycles 1999, 50, 1081-1090」、WO2009/70045 又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2007, 17, 1369-1375」) を使用し、溶媒としてのアルコール (例えば、エタノール) の中で、例えば、塩基としてのアルカリ金属水酸化物 (例えば、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム) を用いて、求電子化合物、脱離基 (R² - L G ; L G = 塩素、臭素、ヨウ素、O - トリフラート、O - メシル) を含んでいる化合物と反応させることによって、式 (X V I I) で表される N - 置換イミダゾール誘導体に変換させることができる。

【 0 1 1 8 】

段階 (d)

式 (X V I I) で表される化合物は、方法 A の段階 (d) と同様にして、式 (I 、 n = 0) で表される化合物に変換させる。

【 0 1 1 9 】

段階 (e)

式 (I 、 n = 0) で表される化合物は、方法 A の段階 (g) と同様にして、式 (I 、 n = 1 又は 2) で表される化合物に変換させる。

【 0 1 2 0 】

方法 D

式 (I) [式中、X は、Q 8、Q 9、Q 1 1 又は Q 1 2 である] で表される化合物を調製するための一般的な方法を、式 (I) [式中、X は、Q 8 である] で表される化合物を参照して、例として、以下に記載する。

10

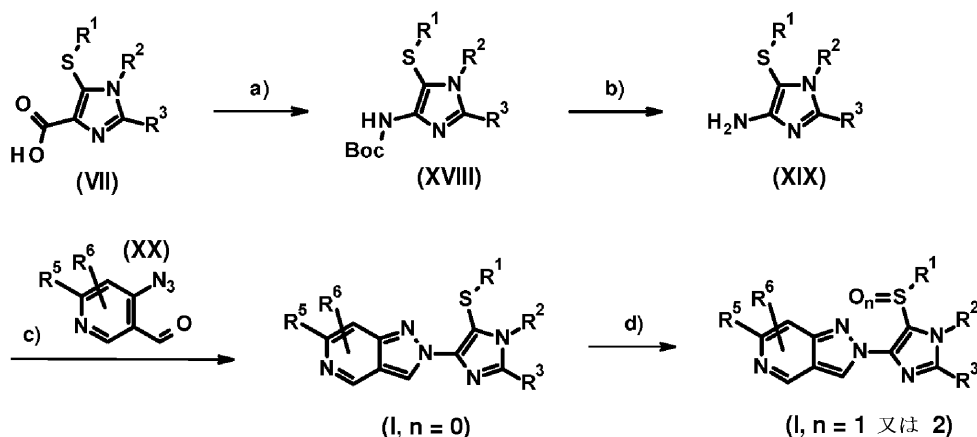
20

30

40

50

【化 7】



10

【0121】

ラジカル R¹、R²、R³、R⁵ 及び R⁶ は、上記で記載されている意味を有する。Boc = tert - ブチルオキシカルボニル。

【0122】

段階 (a)

式 (XVII) で表されるイミダゾール誘導体は、既知方法で、例えば、US 2012 / 149699、WO 2011 / 112766 又は WO 2009 / 23179 に記載されている方法と同様にして、式 (VII) で表される化合物から、アミン塩基 (例えば、トリエチルアミン) の存在下、tert - ブタノールの中で、アジドリン酸ジフェニル (DPPA) との反応によって調製することができる。

20

【0123】

段階 (b)

式 (XVIII) で表される N - Boc - 保護イミダゾール誘導体は、標準的な方法 (cf.、例えば、WO 2015 / 166289、US 2008 / 9497 又は WO 2006 / 77424) を使用し、溶媒 (例えば、1,4 - ジオキサン又はメタノール) の中で、酸 (例えば、塩酸又はトリフルオロ酢酸) を用いて、式 (XIX) で表されるイミダゾール誘導体に変換させることができる。

30

【0124】

段階 (c)

式 (XIX) で表されるイミダゾール誘導体は、例えば、WO 2012 / 66061 又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2017, 27, 1593 - 1597」に記載されている方法と同様にして、イミン形成を介して式 (XX) で表される化合物と反応させ (例えば、トルエン又はジクロロメタンの中で)、その後、場合により酸 (例えば、四塩化チタン又はチタンイソプロポキシド) を用いて、環化させることによって、式 (I, n = 0) で表される化合物に変換させることができる。

40

【0125】

式 (XX) で表される化合物は、文献中で知られている方法と同様にして、調製することができる (例えば、WO 2015 / 116882、WO 2017 / 75694、「Angewandte Chemie International Edition 2011, 50, 1702 - 1706」又は「Organic Letters 2010, 12, 2884 - 2887」を参照されたい)。

【0126】

段階 (d)

式 (I, n = 0) で表される化合物は、方法 A の段階 (g) と同様にして、式 (I, n = 1 又は 2) で表される化合物に変換させる。

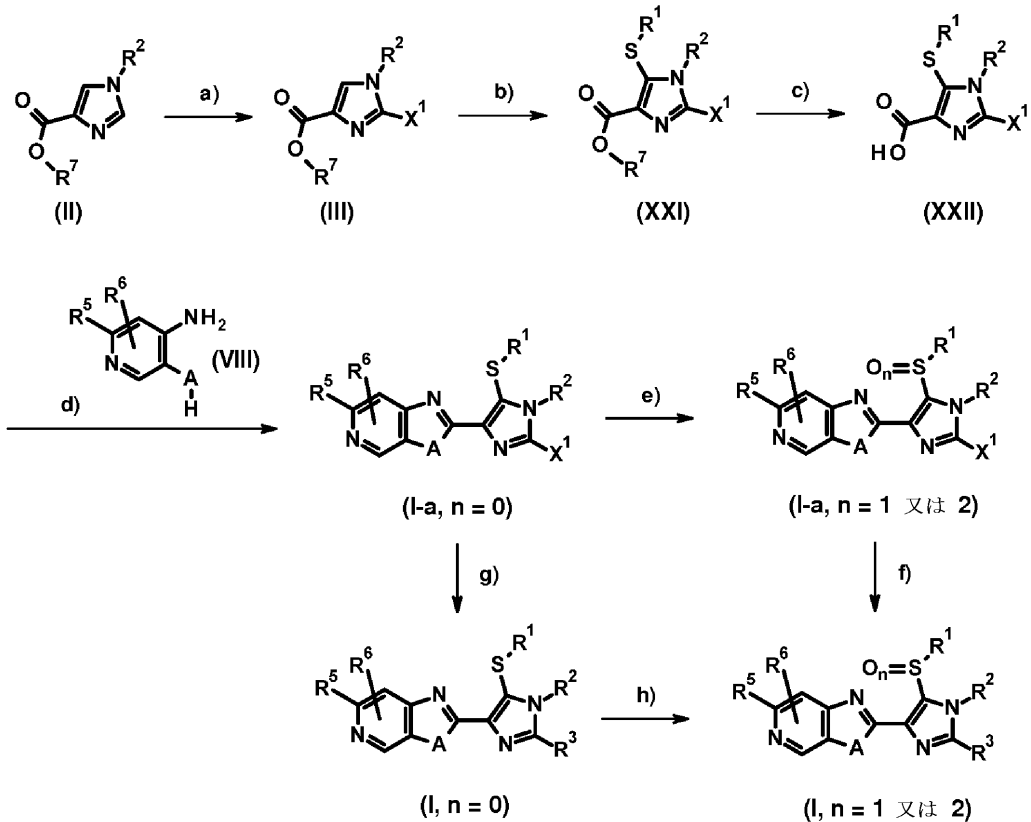
50

【 0 1 2 7 】

調製方法 E

式 (I) [式中、 X は、 Q 1、 Q 2、 Q 3、 Q 7 又は Q 1 0 である] で表される化合物を調製するための一般的な方法を、式 (I) [式中、 X は、 Q 1、 Q 2 又は Q 3 である] で表される化合物を参照して、例として、以下に記載する。

【 化 8 】



10

20

【 0 1 2 8 】

ラジカル R 1、 R 2、 R 3、 R 5 及び R 6 は、上記に記載されている意味を有する。 A は、 - N - R 4、 O 又は S であり、ここで、 R 4 は、上記に記載されている意味を有する。 X 1 は、ハロゲンである。 R 7 は、 (C 1 - C 4) アルキルである。

【 0 1 2 9 】

段階 (a)

式 (I I I) で表される化合物は、例えば、 WO 2 0 1 3 / 1 4 9 9 9 7、 WO 2 0 1 4 / 1 1 5 0 7 7 又は WO 2 0 1 1 / 1 2 3 6 0 9 に記載されている方法と同様にして、式 (I I) で表されるイミダゾール誘導体から、例えば、溶媒 (例えば、テトラヒドロフラン) の中でのハロゲン化試薬 (例えば、 N - プロモスクシンイミド (N B S)) との反応によって、又は、式 (I I) で表される化合物をテトラクロロメタン若しくはクロロホルムの中でアゾビス (イソブチロニトリル) (A I B N) と組み合わせられた N B S と反応させることによって、調製することができる。

40

【 0 1 3 0 】

式 (I I) で表されるイミダゾール誘導体は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、 WO 2 0 1 4 / 1 9 1 8 9 4、 U S 2 0 0 3 / 2 2 9 0 7 9 若しくは WO 2 0 1 3 / 1 5 6 6 0 8 に記載されている方法と同様にして、調製することができる。

【 0 1 3 1 】

段階 (b)

式 (X X I) で表されるイミダゾール誘導体は、標準的な方法を使用して、式 (I I I) で表される化合物から、テトラヒドロフランの中でのジスルフィド (R 1 - S - S - R 1

50

)及び、例えば、強塩基(好ましくは、リチウムジイソプロピルアミド(LDA))との反応によって(c f . Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2010, 20, 1084-108)、又は、例えば、エタノールの中での過酸化水素及びヨウ素との反応によって(c f . Synthesis 2015, 47, 659-671)、調製することができる。

【0132】

段階(c)

式(XXI)で表される化合物は、方法Aの段階(e)と同様にして、式(XXII)で表される化合物に変換させる。

【0133】

段階(d)

式(XXII)で表される化合物を、方法Aの段階(f)と同様に、式(VIII)で表される化合物と反応させて、式(Ia、 $X^1 = R^3 =$ ハロゲン、 $n = 0$)で表される化合物を生成させる。

【0134】

段階(e)、段階(h)

式(I-a、 $n = 0$)で表される化合物の式(I-a、 $n = 1$ 又は 2)で表される化合物への変換、及び、式(I、 $n = 0$)で表される化合物の式(I、 $n = 1$ 又は 2)で表される化合物への変換は、方法Aの段階(g)と同様にして実施する。

【0135】

段階(f)、段階(g)

式(I-a、 $n = 0$)で表される化合物の式(I、 $n = 0$)で表される化合物への変換、及び、式(I-a、 $n = 1$ 又は 2)で表される化合物の式(I、 $n = 1$ 又は 2)で表される化合物への変換は、方法Aの段階(b)と同様にして実施する。

【0136】

式(XXII)で表される化合物から出発して、方法Bと同様にして、その後、方法Eの段階(e) 段階(f)又は段階(g) 段階(h)を実施して、式(I)〔式中、Xは、Q4、Q5又はQ6である〕で表される化合物を調製することも可能である。

【0137】

方法F

式(I)〔式中、 R^3 は、例えば、上記で記載されている官能基である〕で表される化合物を調製するための一般的な方法を、式(I)〔式中、Xは、Q1、Q2又はQ3である〕で表される化合物を参照して、例として、以下に記載する。

10

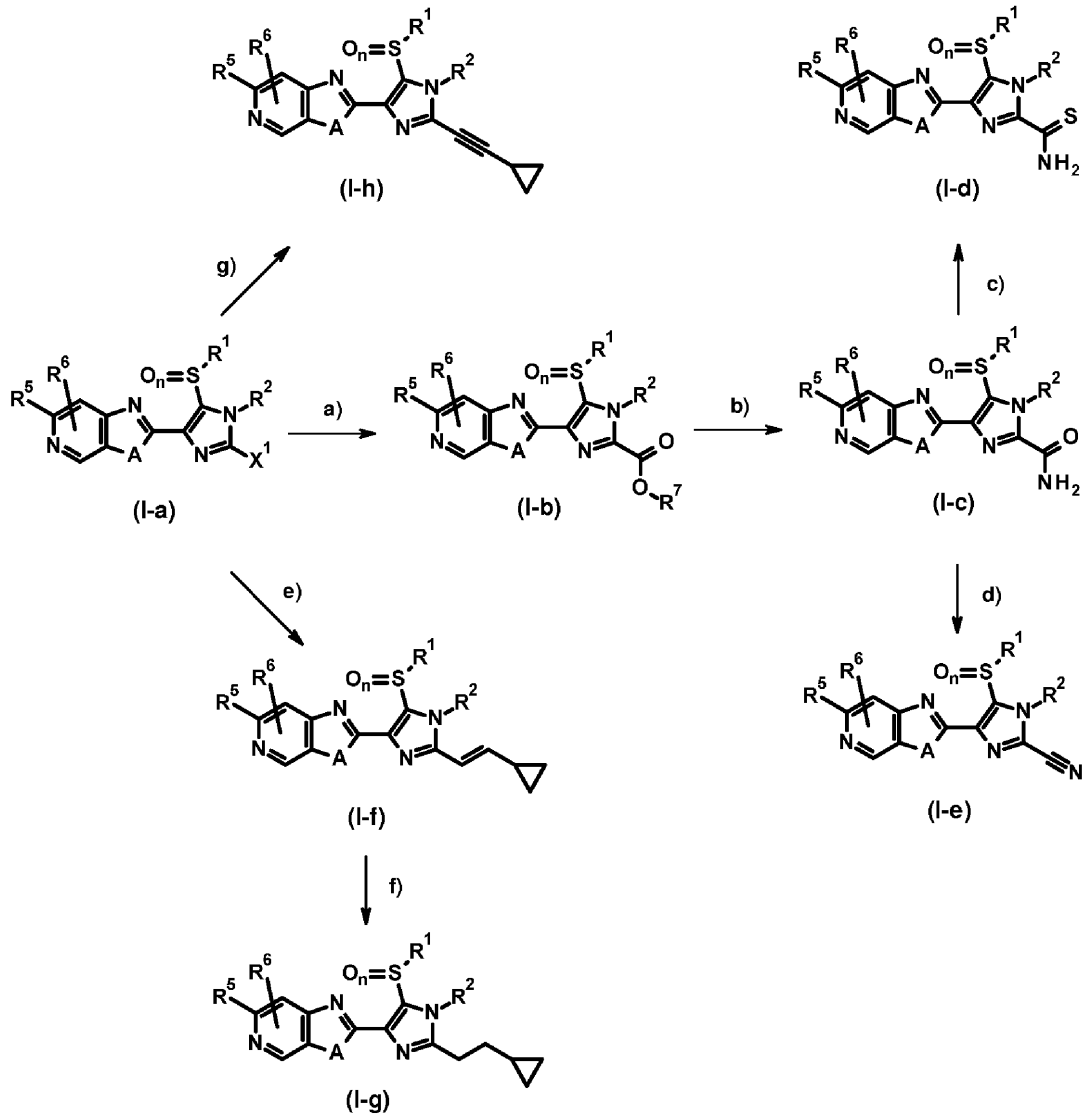
20

30

40

50

【化9】



10

20

30

【0138】

ラジカル R¹、R²、R⁵ 及び R⁶ は、上記で記載されている意味を有する。A は、-N-R⁴、O 又は S であり、ここで、R⁴ は、上記で記載されている意味を有する。X¹ は、ハロゲンである。R⁷ は、(C₁-C₄) アルキルである。n は、0、1 又は 2 である。

【0139】

段階 (a)

式 (I-b) で表される化合物は、式 (I-a) で表される化合物から、文献から知られている方法に従う酸化炭素との反応によって、例えば、ホスフィンリガンド〔例えば、トリフェニルホスフィン、Xantphos〔(4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9,9-ジメチルキサテン)〕又は BINAP〔2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフタレン〕〕の存在下、及び、場合により、適切な塩基(例えば、トリエチルアミン)の存在下における、適切なアルコール(例えば、メタノール又はエタノール)の中での反応及びパラジウム触媒(例えば、パラジウム(II)ジクロリド、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム又はビス(アセトニトリル)パラジウム(II)ジクロリド)を使用する触媒作用によって、調製することができる〔cf. 例えば、US 2014/46072、WO 2004/106293 又は「Journal of Medicinal Chemistry 2009, 52, 2880-2898〕。

40

【0140】

段階 (b)

50

得られた式 (I - b) で表されるエステルは、例えば、方法 A の段階 (e) と同様の鹼化と、それに続く、カップリング試薬 [例えば、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI)] による当該カルボン酸の活性化によって [方法 A の段階 (f) も参照されたい]、又は、塩化アシルへの変換及びアミンとの反応によって [cf 例 えば、WO 2 0 1 2 / 1 4 6 6 6 6、US 2 0 1 4 / 3 1 5 9 2 4 又は WO 2 0 0 5 / 4 8 6 3]、式 (I - c) で表される対応するアミドに変換させることができる。

【 0 1 4 1 】

該アミド形成は、式 (I - b) で表されるエステルから、アミンとの反応によって、例えば、メタノールの中で [cf . 例 えば、WO 2 0 1 4 / 7 2 2 6 1 又は US 2 0 1 3 / 3 3 8 1 3 7]、場合により、塩基 (例 えば、リチウムビス (トリメチルシリル) アミド (LHMDs)) の存在下で [cf . 例 えば、WO 2 0 1 6 / 8 7 4 8 7]、直接実施することができる。

10

【 0 1 4 2 】

段階 (c)

式 (I - d) で表されるチオアミドは、式 (I - c) で表されるアミドから、適切な溶媒 (例 えば、トルエン又はキシレン) の中での適切なチオン化試薬 (thionating reagent) [例 えば、ローソン試薬 (cf .、例 えば、WO 2 0 0 5 / 9 4 3 5 と同様) 又は P 4 S 1 0 (cf .、例 えば、「European Journal of Medicinal Chemistry 1995 30, 915 - 924」と同様)] との反応によって、調製することができる。

20

【 0 1 4 3 】

段階 (d)

式 (I - e) で表される化合物は、式 [I - c、 $R^3 = -C(O)NH_2$] で表される 1 級アミドから、場合により適切な溶媒 (例 えば、ジメチルホルムアミド又はトルエン) の中での適切な縮合剤 (例 えば、オキシ塩化リン (POCl₃) 又は五塩化リン (PCl₅)) との反応によって (cf . 例 えば、US 2 0 1 3 / 3 3 8 1 3 7、WO 2 0 0 5 / 7 7 9 5 0、WO 2 0 0 7 / 1 2 3 5 1 6 と同様)、又は、場合により塩基 (例 えば、トリエチルアミン) の存在下における、適切な溶媒 (例 えば、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン又はピリジン) の中での無水トリフルオロ酢酸との反応によって (cf . 例 えば、WO 2 0 1 4 / 1 9 8 8 5 3 又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2011, 21, 6515 - 6518」と同様)、調製することができる。

30

【 0 1 4 4 】

段階 (e)

式 (I - a) で表される化合物は、方法 A の段階 (b) と同様にして、式 (I - f) で表される化合物に変換させる。

【 0 1 4 5 】

段階 (f)

式 (I - g) で表される化合物は、標準的な方法を使用して、溶媒 (例 えば、酢酸エチル又はメタノール) の中の式 (I - f) で表される化合物から、水素化触媒 (例 えば、炭素担持パラジウム又は二酸化白金) を用いて水素と反応させることによって、調製することができる (cf . US 2 0 0 8 / 3 1 8 9 3 5、US 2 0 1 1 / 2 7 5 8 0 1 又は WO 2 0 1 5 / 9 1 5 8 4)。

40

【 0 1 4 6 】

段階 (g)

式 (I - a) で表される化合物は、方法 A の段階 (b) と同様にして、式 (I - f) で表される化合物に変換させることができる。

【 0 1 4 7 】

あるいは、該反応は、適切な溶媒 (例 えば、ジメチルホルムアミド) の中で、末端アルキ

50

ン誘導体、パラジウム触媒 [例えば、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド又はテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム]、ヨウ化銅及びアミン塩基(例えば、トリエチルアミン)を使用して実施することも可能である(c f . 例えば、WO 2002046166又は「Organic & Biomolecular Chemistry 2011, 9, 450-462」と同様)。

【0148】

方法及び使用

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

10

【0149】

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

【0150】

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

【0151】

式(I)で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、内温動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、生物的ストレス因子及び非生物的ストレス因子に対して植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、特に、線虫類、及び、軟体動物を防除するのに適している。

20

【0152】

本特許出願に関連して、用語「衛生学(hygiene)」は、疾患(特に、感染症)を予防することを目的とする任意の全ての手段、準備及び方法、並びに、ヒト及び動物の健康を保護するのに及び/又は環境を保護するのに及び/又は清潔を維持するのに役立つ任意の全ての手段、準備及び方法を意味するものと理解されるべきである。本発明によれば、これには、特に、きれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、例えば、繊維又は硬質表面(特に、ガラス製、木製、コンクリート製、磁器製、セラミック製、プラスチック製の表面、又は、金属(類)製の表面)を衛生害虫及び/又はその分泌物が存在していない状態に維持するための、それらをきれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段が包含される。これに関連して、ヒト又は動物の身体に対して施される外科的又は治療的な処置方法、及び、ヒト又は動物の身体に対してなされる診断方法は、好ましくは、本発明による保護の範囲から除外される。

30

【0153】

用語「衛生学の分野」には、そのような衛生学的手段、準備及び方法が重要である全ての領域、技術分野及び産業上の利用、例えば、調理場、パン屋、空港、浴室、スイミングプール、デパート、ホテル、病院、家畜小屋、動物飼育などにおける衛生に関する全ての領域、技術分野及び産業上の利用が包含される。

40

【0154】

従って、用語「衛生害虫(hygiene pest)」は、衛生学の分野においてその存在が問題である、特に、健康上の理由に関して問題である、1種類以上の害虫を意味するものと理解されるべきである。従って、主な目的は、衛生害虫の存在を回避するか若しくは最小限度に抑制すること、及び/又は、衛生学の分野において衛生害虫との接触を回避するか若しくは最小限度に抑制することである。このことは、特に、発生を予防するため及び既に発生している害虫を阻止するための両方に使用することが可能な殺害虫剤を使

50

用することによって達成することが可能である。害虫との接触を防止するか又は低減させる製剤を使用することも可能である。衛生害虫としては、例えば、以下に記載されている生物などを挙げることができる。

【0155】

かくして、用語「衛生学的な保護」には、そのような衛生学的な手段、準備及び方法を維持及び/又は改善する全ての行為が包含される。

【0156】

式(I)で表される化合物は、好ましくは、殺有害生物剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、さらに、全ての発育段階又は特定の発育段階に対して活性を示す。上記害虫としては、以下のものを挙げることができる：

節足動物門の害虫、特に、クモ綱 (*Arachnida*) の、例えば、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、例えば、アカルス・シロ (*Acarus siro*)、アケリア・クコ (*Aceria kuko*)、アケリア・シェルドニ (*Aceria sheldoni*)、アクトプス属種 (*Aculops* spp.)、アクルス属種 (*Aculus* spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ (*Aculus fockeui*)、アクルス・シュレクテンダリ (*Aculus schlechtendali*)、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス (*Ampitetranychus viennensis*)、アルガス属種 (*Argas* spp.)、ボオフィルス属種 (*Boophilus* spp.)、ブレビパルプス属種 (*Brevipalpus* spp.)、例えば、ブレビパルプス・ホエニシス (*Brevipalpus phoenicis*)、ブリオビア・グラミヌム (*Bryobia graminum*)、ブリオビア・プラエチオサ (*Bryobia praetiosa*)、セントルロイデス属種 (*Centruroides* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、デルマニسس・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、デルマトファゴイデス・ファリナエ (*Dermatophagoides farinae*)、デルマセントル属種 (*Dermacentor* spp.)、エオテトラニクス属種 (*Eotetranychus* spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ (*Eotetranychus hicoriae*)、エピトリメルス・ピリ (*Epitrimerus pyri*)、エウテトラニクス属種 (*Eutetranychus* spp.)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ (*Eutetranychus banksi*)、エリオフィエス属種 (*Eriophyes* spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ (*Eriophyes pyri*)、グリシファグス・ドメスティクス (*Glycyphagus domesticus*)、ハロチデウス・デストルクトル (*Halotydeus destructor*)、ヘミタロソネムス属種 (*Hemitarsonemus* spp.)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス (*Hemitarsonemus latus*) (=ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*))、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、イクソデス属種 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクツス属種 (*Latrodectus* spp.)、ロキソスケレス属種 (*Loxosceles* spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コフェアエ (*Oligonychus coffeae*)、オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス

10

20

30

40

50

・イオテルシ (*Oligonychus yotherysi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros spp.*)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus spp.*)、パノニクス属種 (*Panonychus spp.*)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes spp.*)、
 リピセファルス属種 (*Rhipicephalus spp.*)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus spp.*)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes spp.*)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus spp.*)、ステネオタルソネムス・スピッキ (*Steneotarsonemus spinki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus spp.*)、例えば、タルソネムス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus spp.*)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis spp.*)、バサテス・リコベルシシ (*Vasates lycopersici*)；
 ムカデ綱 (*Chilopoda*) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus spp.*)、スクチゲラ属種 (*Scutigera spp.*)；
 トビムシ目 (*Collembola*) 又はトビムシ綱の、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)； スミンツルス・ビリジス (*Smintulus viridis*)；
 ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)；
 昆虫綱 (*Insecta*) の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*) の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、ロボプテラ・デシピエンス (*Loboptera decipiens*)、ネオスチロピガ・ロムビフォルリア (*Neostylopyga rhombifolia*)、パンクロラ属種 (*Panchlora spp.*)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta spp.*)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta spp.*)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・オーストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus surinamensis*)、スペラ・ロンギバルパ (*Supella longipalpa*)；
 コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種 (*Adoretus spp.*)、アエチナ・ツミダ (*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリルス属種 (*Agriilus spp.*)、例えば、アグリルス・プラニペンニス (*Agriilus planipennis*)、アグリルス・コキサリス (*Agriilus coxalis*)、アグリルス・ビリネアツス (*Agriilus*

bilineatus)、アグリルス・アンキシウス (*Agriilus anxius*)
 、アグリオテス属種 (*Agriotes spp.*)、例えば、アグリオテス・リンネア
 ツス (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアベリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・ブククタム (*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属種 (*Anoplophora spp.*)、例えば、アノプロホラ・グラブリペンニス (*Anoplophora glabripennis*)、アントノムス属種 (*Anthonomus spp.*)、例えば、アントノムス・グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus spp.*)、アピオン属種 (*Apion spp.*)、アポゴニア属種 (*Apogonia spp.*)、アトマリア属種 (*Atomaria spp.*)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus spp.*)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulescens*)、ブルキジウス・オブテクトス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種 (*Bruchus spp.*)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフィマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida spp.*)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorrhynchus spp.*)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema spp.*)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus spp.*)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites spp.*)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera spp.*)、クルクリオ属種 (*Curculio spp.*)、例えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus spp.*)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adpersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デンドロクトヌス属種 (*Dendroctonus spp.*)、例えば、デンドロクトヌス・ポンデロサエ (*Dendroctonus ponderosae*)、デルメステス属種 (*Dermetes spp.*)、ジアブロチカ属種 (*Diabrotica spp.*)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシムブククタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムブククタタ・ウンデシムブククタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera v*

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

10

20

30

40

50

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

ハサミムシ目 (*Dermaptera*) の、例えば、アニソラビス・マリチメ (*Anisotabis maritime*)、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)、ラビズラ・リパリア (*Labidura riparia*) ;

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes* spp.)、例えば

、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピク투스 (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sticticus*)、アエデス・ベキサンス (*Aedes vexans*)、アグロミザ属種 (*Agromyza* spp.)、例えば、アグロミザ・フロンテラ (*Agromyza frontella*)、アグロミザ・パルビコルニス (*Agromyza parvicornis*)、アナストレファ属種 (*Anastrepha* spp.)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス (*Anopheles quadrimaculatus*)、アノフェレス・ガムビアエ (*Anopheles gambiae*)、アスホンジリア属種 (*Asphondylia* spp.)、バクトロセラ属種 (*Bactrocera* spp.)、例えば、バクトロセラ・ククルピタエ (*Bactrocera cucurbitae*)、バクトロセラ・ドルサリス (*Bactrocera dorsalis*)、バクトロセラ・オレアエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリホラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus* spp.)、クリソミア属種 (*Chrysomya* spp.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysozona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya* spp.)、コンタリニア属種 (*Contarinia* spp.)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロビア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex* spp.)、例えば、クレキス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリセタ属種 (*Culiseta* spp.)、クテレブラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura* spp.)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デリア属種 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アントクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロリレガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia platura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、エウレイア・ヘラクレイ (*Euleia heraclei*)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種 (*Glossina* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属種 (*Hylemya* spp.)、ヒツポドスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブレンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ルシリ

ア属種 (*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミア属種 (*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属種 (*Mansonia* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルスス属種 (*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミア又はペゴミア属種 (*Pegomya* oder *Pegomyia* spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒオシヤミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophilica casei*)、プラチパレア・ポエシロプテラ (*Platyparea poeciloptera*)、プロジプロシス属種 (*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラタ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダクス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種 (*Tetanops* spp.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チブラ・シムプレキス (*Tipula simplex*)、トキシトリパナ・クルビカウダ (*Toxotrypana curvicauda*) ;

カメムシ目 (Hemiptera) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシルトシポン属種 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシホン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocanthus* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、ジギナ属種 (*Zygina* spp.) ; アオニジエラ・アウランチイ (*Aonidiella aurantii*)、アオニジエラ・シトリナ (*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフイス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフイス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフイス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフ

イス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス (*Aphis glycyines*)、アフィス・ゴシパイ (*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフィス・イリノイセンシス (*Aphis illinoisensis*)、アフィス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフィス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ (*Aphis spiraecola*)、アフィス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capulinia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*Chrysomphalus aonidum*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムピラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Cocco mytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus viridis*)、クリプトミズス・リピス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・キテンデニ (*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Diaphorina citri*)、ジラスピス属種 (*Diaspis* spp.)、ジウラフィス属種 (*Diuraphis* spp.)、ドラリス属種 (*Doralis* spp.)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dysmicoccus* spp.)、エムポアスカ属種 (*Empoasca* spp.)、例えば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ (*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)、エムポ

10

20

30

40

50

アスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属種 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム (*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Eucalyptolyta* spp.)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura* spp.)、エウセリス・ピロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種 (*Ferrisia* spp.)、フィオリニア属種 (*Fiorinia* spp.)、フルカスピス・オセアニカ (*Furcaspis oceanica*)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジンニス (*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・ブルカシ (*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種 (*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium corni*) (= パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス属種 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、ロホレウカスピス・ジャポニカ (*Lopholeucaspis japonica*)、リコルマ・デリカツラ (*Lycorma delicatula*)、マクロシフム属種 (*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンス (*Macrosteles facifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・プルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカニス (*Monelliopsis pecan*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotianae*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネオマスケリア属種 (*Neomaskellia* spp.)、ネホテッチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ネチゴニセラ・スペクトラ (*Nettigonictlla spectra*)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・ブラエロンガ (*Orthezia praelong*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachyopsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myrica*)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラ

トリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivenae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、ペルクンシエラ属種 (*Perkinsiella* spp.)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、プロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flavata*)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriiformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calculariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロングスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、プルビナリア属種 (*Pulvinaria* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランスレギアエ (*Quadraspidiotus juglansregiae*)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Quadraspidiotus ostraeaeformis*)、クアドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidiotus perniciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ロパロシフム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxyacanthae*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシフム・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia miranda*)、サイセチア・ネグレクト (*Saissetia neglecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミヌム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus articulatus*)、シファ・フラバ (*Siphia flavata*)、シトピオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属種 (*Sogatata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furcifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ (*Stictoccephala festina*)、シホニヌス・フィリアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴノセフェ

10

20

30

40

50

ラ属種 (*Tetragonocephela* spp.)、チノカリス・カリアエホリア
 エ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種 (*Tomas
 pis* spp.)、トキシプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、例えば、トキ
 ソプテラ・アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキシプテラ・シ
 トリシズス (*Toxoptera citricidus*)、トリアレウロデス・バボラ
 リオルム (*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオザ属種 (*T
 rioza* spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza diospyr
 i*)、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ウナスピス属種 (*Unas
 pis* spp.)、ピテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)、ジギ
 ナ属種 (*Zygina* spp.) ;

10

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アエリア属種 (*Aelia* sp
 p.)、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属種
 (*Antestiopsis* spp.)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)、ブ
 リスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp
 .)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属
 種 (*Cavelerius* spp.)、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、例えば
 、シメキス・アドジュンクツス (*Cimex adjunctus*)、シメキス・ヘミプ
 テルス (*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex
 lectularius*)、シメキス・ピロセルス (*Cimex pilosellus*)、

20

コラリア属種 (*Collaria* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Cr
 eontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus pipe
 ris*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノ
 コリス・ヘウエッチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデルクス属種 (
Dysdercus spp.)、エウスキスツス属種 (*Euschistus* spp.
)、例えば、エウスキスツス・ヘロス (*Euschistus heros*)、エウスキ
 スツス・セルプス (*Euschistus servus*)、エウスキスツス・トリスチ
 グムス (*Euschistus tristigma*)、エウスキスツス・バリオラリ
 ウス (*Euschistus variolarius*)、エウリデマ属種 (*Euryd
 ema* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ハリオモ
 ルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオパルチス属種 (*Hel
 iopeltis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobile
 llus*)、レプトコリサ属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトコリサ・

30

バリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、レプトグロスス・オ
 ッシデンタリス (*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロ
 スス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リゴコリス属種
 (*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (*Lygocor
 is pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エ
 リスス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperu
 s*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エキ
 スカバツス (*Macropes excavatus*)、メガコプタ・クリブラリア (*M
 egacopta cribraria*)、ミリダエ (*Miridae*)、モナロニオン
 ・アトラツム (*Monalonia atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara* s
 pp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (*Nezara viridula*)、ニシウス属
 種 (*Nysius* 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 quadrat
 a*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・

40

グイルジニイ (*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種 (*Psall
 lus* spp.)、プセウダシスタ・ベルセア (*Pseudacysta perse
 a*)、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 (*S*

50

captocoris castanea)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.) ;
 ハチ目 (*Hymenoptera*) の、例えば、アクロミルメキス属種 (*Acromyrmex* spp.)、アタリア属種 (*Athalia* spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ属種 (*Atta* spp.)、カムボノツス属種 (*Camponotus* spp.)、ドリコベスブラ属種 (*Dolichovespula* spp.)、ジブリオン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジブリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカムパ・ココケイ (*Hoplocampa cooki*)、ホプロカムパ・テスツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、リネピテマ (イリジオミルメキス) ・フミレ (*Linepithema (Iridiomyrmex) humile*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラトレキナ属種 (*Paratrechina* spp.)、パラベスブラ属種 (*Paravespula* spp.)、ブラギオレピス属種 (*Plagiolepis* spp.)、シレキス属種 (*Sirex* spp.)、例えば、シレキス・ノクチリオ (*Sirex noctilio*)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属種 (*Tapinoma* spp.)、テクノミルメキス・アルビペス (*Technomyrmex albipes*)、ウロセルス属種 (*Urocerus* spp.)、ベスパ属種 (*Vespa* spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (*Vespa crabro*)、ワスマンニア・アウロプンクタタ (*Wasmannia auropunctata*)、キセリス属種 (*Xeris* spp.) ;
 ウラジムシ目 (*Isopoda*) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*) ;
 シロアリ目 (*Isoptera*) の、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*) ;
 チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アドキソフィエス属種 (*Adoxophyes* spp.)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属種 (*Alabama* spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナルシア属種 (*Anarsia* spp.)、アンチカルシア属種 (*Anticarsia* spp.)、例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルギロプロセ属種 (*Argyroproce* spp.)、アウトグラファ属種 (*Autographa* spp.)、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブラストデクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブクラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus pinarius*)、ブッセオラ属種 (*Busseola* spp.)、カコエシア属種 (*Cacoecia* spp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルポシナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトビア・ブルマタ (*Cheim*

10

20

30

40

50

atobia brumata)、キロ属種 (*Chilo spp.*)、例えば、キロ・ブレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプレッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Choreutis pariana*)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura spp.*)、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcites*)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属種 (*Cnaphalocerus spp.*)、クナファロクロシス・メジナリス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cnephasia spp.*)、コノポモルフア属種 (*Conopomorpha spp.*)、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus spp.*)、コピタルシア属種 (*Copitarsia spp.*)、シジア属種 (*Cydia spp.*)、例えば、シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*)、ジアファニア属種 (*Diaphania spp.*)、ジパロプシス属種 (*Diparopsis spp.*)、ジアトラエア・サッカリス (*Diatraea saccharalis*)、ジオリクトリア属種 (*Dioryctria spp.*)、例えば、ジオリクトリア・ジメルマニ (*Dioryctria zimmermani*)、エアリアス属種 (*Earias spp.*)、エクジトロファ・アウランチュム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモバルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*Ephestia spp.*)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア属種 (*Epinotia spp.*)、エピフィアス・ポストピッタナ (*Epiphyas postvittana*)、エランニス属種 (*Erannis spp.*)、エルスコビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana*)、エチエラ属種 (*Etiella spp.*)、エウドシマ属種 (*Eudocima spp.*)、エウリア属種 (*Eulia spp.*)、エウポエシリア・アムビグエラ (*Eupoecilia ambiguella*)、エウプロクチス属種 (*Euproctis spp.*)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、エウキソア属種 (*Euxoa spp.*)、フェルチア属種 (*Feltia spp.*)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラシラリア属種 (*Gracillaria spp.*)、グラホリタ属種 (*Grapholitha spp.*)、例えば、グラホリタ・モレスト (*Grapholitha molesta*)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholitha prunivora*)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta spp.*)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa spp.*)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス属種 (*Heliothis spp.*)、例えば、ヘリオチス・ビレセン (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma spp.*)、ホモナ属種 (*Homona spp.*)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ランピデス属種 (*Lampides spp.*)、ラフィグマ属種 (*Laphygma spp.*)、ラスペイレシア・モレスト (*Laspeyresia molesta*)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera spp.*)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis spp.*)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、口

ベシア属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セバラタ (*Mythimna separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketeticus* spp.)、オンフィサ属種 (*Omphisa* spp.)、オペロフテラ属種 (*Operophtera* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonorycter crataegella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、ブラチノタ・スツルタナ (*Platynota stultana*)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia interpunctella*)、プルシア属種 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (=プルテラ・マクリペンニス (*Plutella maculipennis*))、ポデシア属種 (*Podesia* spp.)、例えば、ポデシア・シリंगाエ (*Podesia syringae*)、プライス属種 (*Prays* spp.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プロトパルセ属種 (*Protoparce* spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseudaletia* spp.)、例えば、プセウダレチア・ウニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、プセウドプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキブルシア・ヌ (*Rachipplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobius* spp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (*Schoenobius bipunctifer*)、シルポファガ属種 (*Scirpophaga* spp.)、例えば、シルポファガ・インノタタ (*Scirpophaga innotata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Sesamia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スパルガノチス属種 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・ブラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ステノマ属種 (*Stenoma* spp.)、ストモプテリキス・サブセシベラ (*Stomopteryx subseciv*

ella)、シナンテドン属種(*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ(*Tecia solanivora*)、タウメトポエア属種(*Thaumetopoea* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス(*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ(*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ(*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビッセリエラ(*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種(*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ(*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属種(*Trichoplusia* spp.)、例えば、トリコプルシア・ニ(*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス(*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ(*Tuta absoluta*)、ピラコラ属種(*Virachola* spp.) ; 10

バッタ目(*Orthoptera*)又は(*Saltatoria*)の、例えば、アケタ・ドメスチクス(*Acheta domesticus*)、ジクロプルス属種(*Dichroplus* spp.)、グリロタルパ属種(*Gryllotalpa* spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ(*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ヒエログリフス属種(*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属種(*Locusta* spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア(*Locusta migratoria*)、メラノプルス属種(*Melanoplus* spp.)、例えば、メラノプルス・デバスタトル(*Melanoplus devastator*)、パラトランクス・ウスリエンシス(*Paratlanticus ussuriensis*)、スキストセルカ・グレガリア(*Schistocerca gregaria*) ; 20

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

チャタテムシ目(*Psocoptera*)の、例えば、レピノツス属種(*Lepinotus* spp.)、リボセリス属種(*Liposcelis* spp.) ; 30

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

アザミウマ目(*Thysanoptera*)の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス(*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス(*Baliothrips biformis*)、カエタナホトリプス・レエウエニ(*Chaetanaphothrips leeuweni*)、ドレパノトリプス・レウテリ(*Drepanothrips reuteri*)、エンネオトリプス・フラベンス(*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種(*Frankliniella* spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ(*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オッシデンタリス(*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・スクルトゼイ(*Frankliniella schultzei*)、フランクリニエラ・トリチシ(*Frankliniella tritici*)、フランクリニエラ・バシニイ(*Frankliniella vaccinii*)、フランクリニエラ・ウィリアムシ(*Frankliniella williamsi*)、ハプロトリプス属種(*Haplothrips* spp.)、ヘリオト 50

リプス属種 (*Heliothrips* spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス (*Hercinothrips femoralis*)、カコトリプス属種 (*Kakothrips* spp.)、リピホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp.)、タエニトリプス・カルダモミ (*Taeniothrips cardamomi*)、トリプス属種 (*Thrips* spp.)、例えば、トリプス・パルミ (*Thrips palmi*)、トリプス・タバシ (*Thrips tabaci*) ;

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

10

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

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

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

20

線形動物門 (*Nematoda*) の植物害虫 (即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレンクス属種 (*Aglenchus* spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ属種 (*Anguina* spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライムス属種 (*Belonolaimus* spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノルトニ (*Belonolaimus nortoni*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus* spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bursaphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属種 (*Cacopaurus* spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノブラキス (*Criconemella xenoplax*) (= メソクリコネマ・キセノブラキス (*Mesocriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Criconemoides* spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemoides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoid*

30

40

50

es onoense)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoides ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus spp.*)、例えば、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコドルス属種 (*Dolichodorus spp.*)、グロボデラ属種 (*Globodera spp.*)、例えば、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis*)、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus spp.*)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystrera*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoides spp.*)、ヘミシクリオホラ属種 (*Hemicycliophora spp.*)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera spp.*)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycines*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ヒルスクマニエラ属種 (*Hirschmaniella spp.*)、ホプロライムス属種 (*Hoplolaimus spp.*)、ロンギドルス属種 (*Longidorus spp.*)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanus*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne spp.*)、例えば、メロイドギネ・キトウオオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema spp.*)、ナコップス属種 (*Nacobus spp.*)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus spp.*)、パラロンギドルス属種 (*Paralongidorus spp.*)、パラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus spp.*)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus spp.*)、例えば、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラチレンクス属種 (*Paratylenchus spp.*)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus spp.*)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus spp.*)、プシレンクス属種 (*Psilenchus spp.*)、プンクトデラ属種 (*Punctodera spp.*)、クイニスルシウス属種 (*Quinisulcius spp.*)、ラドホルス属種 (*Radopholus spp.*)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus spp.*)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus spp.*)、スクテロネマ属種 (*Scutellonema spp.*)、スバングイナ属種 (*Subanguina spp.*)、トリコドルス属種 (*Trichodorus spp.*)、例えば、トリコドルス・オブツス (*Trichodorus obtusus*)、トリコドルス・プリミチプス (*Trichodorus primitivus*)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus spp.*)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス (*Tylenchorhynchus annulatus*)、チレンクルス属種 (*Tylenchulus spp.*)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema spp.*)、例えば、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)。

【0157】

式 (I) で表される化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、葉害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (*microbicide*) 若しくは除雄剤 (*gametocide*) として、例えば、殺菌剤 (*fungicide*)、抗真菌剤 (*antimycotic*)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤 (これは、ウイロイドに対する作用薬も包含する) と

10

20

30

40

50

しても使用し得るか、又は、M L O (マイコプラズマ様生物) 及び R L O (リケッチア様生物) に対する作用薬としても使用し得る。それらは、適切な場合には、別の活性成分を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【 0 1 5 8 】

製剤

本発明は、さらに、式 (I) で表される少なくとも 1 種類の化合物を含んでいる、殺有害生物剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態〔例えば、灌注液、滴下液及び散布液〕にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる殺有害生物剤、及び/又は、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油 (例えば、ナタネ油、ヒマワリ油)、鉱油 (例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル (例えば、
10
、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル)、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び/又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び/又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩 (例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素二アンモニウム)、及び/又は、保持促進剤 (r e t e n t i o n p r o m o t e r) (例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアーポリマー)、及び/又は、湿潤剤 (例えば、グリセロール)、及び/又は、肥料 (例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料) を含有する。

【 0 1 5 9 】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである： 水溶性液剤 (S L)、乳剤 (E C)、水中油型エマルジョン剤 (E W)、懸濁製剤 (S C、S E、F S、O D)、顆粒水和剤 (W
20
G)、顆粒剤 (G R)、及び、カプセル製剤 (c a p s u l e c o n c e n t r a t e s) (C S) ; これらの製剤型及び別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている： C r o p L i f e I n t e r n a t i o n a l a n d i n P e s t i c i d e S p e c i f i c a t i o n s , M a n u a l o n d e v e l o p m e n t a n d u s e o f F A O a n d W H O s p e c i f i c a t i o n s f o r p e s t i c i d e s , F A O P l a n t P r o d u c t i o n a n d P r o t e c t i o n P a p e r s - 1 7 3 (作製元：t h e F A O / W H O J o i n t M e e t i n g o n P e s t i c i d e S p e c i f i c a t i o n s , 2 0 0 4 , I S B N : 9 2 5 1 0 4 8 5 7 6) 。該製剤は、式 (I) で表される 1 種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性成分を含有する。
30

【 0 1 6 0 】

好ましいのは、補助剤〔例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤 (s p o n t a n e i t y p r o m o t e r)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤 (f r o s t p r o t e c t i o n c o m p o s i t i o n)、殺生物剤、増粘剤及び/又は他の補助剤 (例えば、アジュバント) など) を含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的効果を高める成分であって、その成分自体は生物学的効果を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡張 (s p r e a d i n g)、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

【 0 1 6 1 】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式 (I) で表される化合物を補助剤 (例えば、増
40
量剤、溶媒及び/若しくは固体担体、並びに/又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤) と混合させることにより製造する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

【 0 1 6 2 】

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

【 0 1 6 3 】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下
50

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

【0164】

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

【0165】

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

【0166】

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

【0167】

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

【0168】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び/若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである：ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導體（好ましくは、アルキルタウレ

10

20

30

40

50

ート)、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリアルスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式(I)で表される化合物のうちの1種類及び/又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

【0169】

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

10

【0170】

存在させ得るさらなる成分は、安定剤(例えば、低温安定剤)、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び/若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤である。さらに、泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

【0171】

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

20

【0172】

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

30

【0173】

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

【0174】

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

40

【0175】

50

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

【0176】

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

10

【0177】

混合物

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

20

【0178】

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

30

【0179】

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

【0180】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。

40

【0181】

殺虫剤/殺ダニ剤/殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「The Pesticide Manual」, 16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「http://www.alanwood.net/pesticides」)。その分類は、本特許出願の出願時点において適用できる「IRAC Mode of Action Classi

50

f i c a t i o n S c h e m e」に基づいている。

【 0 1 8 2 】

(1) アセチルコリンエステラーゼ (A C h E) 阻害薬、例えば、
カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、
プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、
エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、
メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、
チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、X M C、及び、
キシリルカルブ；又は、

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、
カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、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、ジメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロルボス / D D V P、ジクロトホス、
ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、E P N、エチオン、エトプロホス、
ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、
イミシアホス、イソフェンホス、O - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチル酸イソプロピル、
イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、
モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン - メチル、パラチオン - 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、プロベタムホス、プロチオホス、
ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、
テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、
チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン。

【 0 1 8 3 】

(2) G A B A 制御塩化物チャンネル遮断薬、例えば、
シクロジエン - 有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、
フェニルピラゾール系 (フィプロール系)、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル。

【 0 1 8 4 】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター、例えば、
ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、
d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル異性体、
ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、
シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シペルメトリン、
アルファ - シペルメトリン、ベータ - シペルメトリン、シータ - シペルメトリン、
ゼータ - シペルメトリン、シフェノトリン [(1 R) - トランス異性体]、
デルタメトリン、エムペントリン [(E Z) - (1 R) 異性体]、
エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、
フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、
タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、
モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1 R) - トランス異性体]、
プラレトリン、ピレトリン類 (除虫菊 (p y r e t h r u m))、
レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、
テトラメトリン、テトラメトリン [(1 R) 異性体]、
トラロメトリン、及び、
トランスフルトリン；又は、
D D T；又は、
メトキシクロル。

【 0 1 8 5 】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体 (n A C h R) 競合的モジュレーター、
例えば、
ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、
ジノテフラン、イミダクロプリド、
ニテンピラム、チアクロプリド、及び、
チアメトキサム；又は、
ニコチン；又は、
スルホキサフロル、又は、フルピラジフロル。

【 0 1 8 6 】

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体 (n A C h R) アロステリックモジュレーター

、例えば、

スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド。

【0187】

(6) グルタミン酸制御塩化物チャンネル (GluCl) アロステリックモジュレーター、例えば、

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

【0188】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、

幼若ホルモン類似体、例えば、ヒドロプレレン、キノプレレン、及び、メトプレレン；又は、フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン。

10

【0189】

(8) 種々の特定されていない(多部位)阻害薬、例えば、

ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル；又は、クロロピクリン；又は、フッ化スルフリル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石、又は、イソシアン酸メチル生成物質、例えば、ダゾメット (diazomet) 及びメタム。

【0190】

(9) 弦音器官モジュレーター、例えば、

ピメトロジン；又は、フロニカミド。

【0191】

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、

クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロビダジン；又は、エトキサゾール。

20

【0192】

(11) 昆虫腸膜の微生物ディスラプター、例えば、

バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バシルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*)、及び、Bt植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、VIP3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

30

【0193】

(12) ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター、例えば、

ジアフェンチウロン；又は、

有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタズ；又は、

プロバルギット；又は、テトラジホン。

40

【0194】

(13) プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、

クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルラミド。

【0195】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬、例えば、

ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップ-ナトリウム。

【0196】

(15) キチン生合成の阻害薬(タイプ0)、例えば、

50

ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン。

【0197】

(16) キチン生合成の阻害薬(タイプ1)、例えば、
ブプロフェジン。

【0198】

(17) 脱皮ディスラプター(特に、双翅目の場合)、例えば、
シロマジン。

【0199】

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、
クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド。

【0200】

(19) オクトパミン受容体作動薬、例えば、
アミトラズ。

【0201】

(20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、例えば、
ヒドラメチルノン;又は、アセキノシル;又は、フルアクリピリム。

【0202】

(21) ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬、例えば、
METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド;又は、
ロテノン(Derris)。

【0203】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、
インドキサカルブ;又は、メタフルミゾン。

【0204】

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、
テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト。

【0205】

(24) ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害薬、例えば、
ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛;又は、
シアン化物、シアン化カルシウム、シアン化カリウム、及び、シアン化ナトリウム。

【0206】

(25) ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬、例えば、
-ケトニトリル誘導体、例えば、シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン、及び、
カルボキシアニリド、例えば、ピフルブミド。

【0207】

(28) リアノジン受容体モジュレーター、例えば、
ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、及び、フルベンジアミド。

【0208】

さらなる活性成分、例えば、アフィドピロベン、アフォキシレイナー、アザジラクチン、
ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロフラニリド(broflanilide)、
プロモプロピレート、キノメチオナート、クロロプラレトリン(chloroprallethrin)、
氷晶石(cryolite)、シクラニリプロール、シクロキサプリド(cycloxaprid)、
シハロジアミド(cyhalodiamide)、ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)、
ジコホル、-メト

10

20

30

40

50

フルトリン (epsilon metofluthrin)、 - モムフルトリン (epsilon momfluthrin)、フロメトキン、フルアザインドリジン (fluaazaindolizine)、フルエンスルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロピン、フルフィプロール、フルヘキサホン (fluhexafon)、フルオピラム、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノジド (fufenozide)、グアジピル (guadipyr)、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、 - ビフェントリン、 - テフルトリン、ロチラネル (lotilaner)、メベルフルトリン、パイコングディング (paichongding)、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロピン、スピロブジクロフェン (spirobudiclofen)、テトラメチルフルトリン、テトラニリプロール (tetraniliprole)、テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、チオキサザフェン、チオフルオキシメート (thiofluoximate)、トリフルメゾピリム、及び、ヨードメタン；さらに、バシルス・フィルムス (Bacillus firmus) に基づく調製物 (I - 1582, BioNeem, Votivo)、及び、以下の化合物： 1 - { 2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル } - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - アミン (WO 2006 / 043635 から既知) (CAS 885026 - 50 - 6)、 { 1 ' - [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - フルオロスピロ [インドール - 3 , 4 ' - ピペリジン] - 1 (2 H) - イル } (2 - クロロピリジン - 4 - イル) メタノン (WO 2003 / 106457 から既知) (CAS 637360 - 23 - 7)、 2 - クロロ - N - [2 - { 1 - [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO 2006 / 003494 から既知) (CAS 872999 - 66 - 1)、 3 - (4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (WO 2010052161 から既知) (CAS 1225292 - 17 - 0)、 3 - (4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 2 - オキソ - 1 , 8 - ジアザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 4 - イル エチルカルボネート (EP 2647626 から既知) (CAS - 1440516 - 42 - 6)、 4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) - 5 - フルオロピリミジン (WO 2004 / 099160 から既知) (CAS 792914 - 58 - 0)、 PF 1364 (JP 2010 / 018586 から既知) (CAS Reg . No . 1204776 - 60 - 2)、 N - [(2 E) - 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] ピリジン - 2 (1 H) - イリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトアミド (WO 2012 / 029672 から既知) (CAS 1363400 - 41 - 2)、 (3 E) - 3 - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - オン (WO 2013 / 144213 から既知) (CAS 1461743 - 15 - 6)、 N - [3 - (ベンジルカルバモイル) - 4 - クロロフェニル] - 1 - メチル - 3 - (ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2010 / 051926 から既知) (CAS 1226889 - 14 - 0)、 5 - プロモ - 4 - クロロ - N - [4 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル) フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド (CN 103232431 から既知) (CAS 1449220 - 44 - 3)、 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - メチル - N - (シス - 1 - オキシド - 3 - チェタニル) ベンズアミド、 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - メチル - N - (トランス - 1 - オキシド - 3 - チェタニル) ベンズアミド及び 4 - [(5 S) - 5 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - メチル - N - (シス - 1 - オキシド - 3 - チェタニル) ベンズ

アミド (WO 2013/050317 A1 から既知) (CAS 1332628-83-7)、N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド、(+)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド及び(-)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド (WO 2013/162715 A2、WO 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1 から既知) (CAS 1477923-37-7)、5-[[(2E)-3-クロロ-2-プロペン-1-イル]アミノ]-1-[2,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]-1H-ピラゾール-3-カルボニトリル (CN 101337937 A から既知) (CAS 1105672-77-2)、3-ブromo-N-[4-クロロ-2-メチル-6-[(メチルアミノ)チオキソメチル]フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、(Liudaibenjiaxuanan、CN 103109816 A から既知) (CAS 1232543-85-9); N-[4-クロロ-2-[[(1,1-ジメチルエチル)アミノ]カルボニル]-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (WO 2012/034403 A1 から既知) (CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (WO 2011/085575 A1 から既知) (CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-ジクロロ-4-[(3,3-ジクロロ-2-プロペン-1-イル)オキシ]フェノキシ]プロボキシ]-2-メトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン (CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6 から既知); (2E)-及び2(Z)-2-[2-(4-シアノフェニル)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]-N-[4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]ヒドラジンカルボキサミド (CN 101715774 A から既知) (CAS 1232543-85-9); シクロプロパンカルボン酸 3-(2,2-ジクロロエテニル)-2,2-ジメチル-4-(1H-ベンズイミダゾール-2-イル)フェニルエステル (CN 103524422 A から既知) (CAS 1542271-46-4); (4aS)-7-クロロ-2,5-ジヒドロ-2-[[(メトキシカルボニル)[4-[(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]アミノ]カルボニル]インデノ[1,2-e][1,3,4]オキサジアジン-4a(3H)-カルボン酸メチルエステル (CN 102391261 A から既知) (CAS 1370358-69-2); 6-デオキシ-3-O-エチル-2,4-ジ-O-メチル-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエトキシ)フェニル]-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル]フェニル]カルバメート]-L-マンノピラノース (US 2014/0275503 A1 から既知) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチルピリダジン-3-イル)-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (CAS 1253850-56-4)、(8-アンチ)-8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチルピリダジン-3-イル)-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (CAS 933798-27-7)、(8-シン)-8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチルピリダジン-3-イル)-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン (WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1 から既知) (CAS 934001-66-8)、N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)チオ]プロパンアミド (WO 2015/058021 A1、WO 2

10

20

30

40

50

015/058028A1から既知)(CAS 1477919-27-9)、及び、N-[4-(アミノチオキソメチル)-2-メチル-6-[(メチルアミノ)カルボニル]フェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(CN103265527Aから既知)(CAS 1452877-50-7)。

【0209】

殺菌剤

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

【0210】

クラス(1)~(15)に記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することができる。クラス(1)~(15)に記載されている全ての殺菌剤混合成分は、場合により、互変異性体形態を包含し得る。

【0211】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.001)シプロコナゾール、(1.002)ジフェノコナゾール、(1.003)エポキシコナゾール、(1.004)フェンヘキサミド、(1.005)フェンプロピジン、(1.006)フェンプロピモルフ、(1.007)フェンピラザミン、(1.008)フルキンコナゾール、(1.009)フルトリアホル、(1.010)イマザリル、(1.011)硫酸イマザリル、(1.012)イブコナゾール、(1.013)メトコナゾール、(1.014)ミクロブタニル、(1.015)パクロブトラゾール、(1.016)プロクロラズ、(1.017)プロピコナゾール、(1.018)プロチオコナゾール、(1.019)ピリソキサゾール、(1.020)スピロキサミン、(1.021)テブコナゾール、(1.022)テトラコナゾール、(1.023)トリアジメノール、(1.024)トリデモルフ、(1.025)トリチコナゾール、(1.026)(1R, 2S, 5S)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.027)(1S, 2R, 5R)-5-(4-クロロベンジル)-2-(クロロメチル)-2-メチル-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール、(1.028)(2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(1.029)(2R)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1S)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.030)(2R)-2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.031)(2S)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1R)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.032)(2S)-2-(1-クロロシクロプロピル)-4-[(1S)-2, 2-ジクロロシクロプロピル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール、(1.033)(2S)-2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(1.034)(R)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(1.035)(S)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル](ピリジン-3-イル)メタノール、(1.0

10

20

30

40

50

36) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.037) 1 - ({ (2R, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル } メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.038) 1 - ({ (2S, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル } メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.039) 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.040) 1 - { [rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.041) 1 - { [rel(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.045) 2 - [(2R, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.046) 2 - [(2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.047) 2 - [(2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.048) 2 - [(2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.049) 2 - [(2S, 4S, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.050) 2 - [1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.051) 2 - [2 - クロロ - 4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.052) 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.053) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.054) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ペンタン - 2 - オール、(1.055) 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.056) 2 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.057) 2 - { [rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル] メチル } - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.058) 2 - { [re

1 (2 R , 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル)
 オキシラン - 2 - イル } メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール
 - 3 - チオン、 (1 . 0 5 9) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2
 - メチル - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノー
 ル、 (1 . 0 6 0) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [3 - (2 - クロロフェニル)
 - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル } メチル } - 1 H - 1 , 2
 , 4 - トリアゾール、 (1 . 0 6 1) 5 - (アリルスルファニル) - 1 - { [r e l (2
 R , 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシ
 ラン - 2 - イル } メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 (1 . 0 6 2) 5 - (ア
 リルスルファニル) - 1 - { [r e l (2 R , 3 S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2
 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル } メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4
 - トリアゾール、 (1 . 0 6 3) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (1 , 1 , 2 ,
 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) - N - エチル - N -
 メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 6 4) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { [3 - (2
 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) - N - エチル -
 N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 6 5) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - { [3 -
 (2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロボキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) -
 N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 6 6) N ' - (2 , 5 - ジメチル -
 4 - { [3 - (ペンタフルオロエトキシ) フェニル] スルファニル } フェニル) - N - エ
 チル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 6 7) N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - {
 3 - [(1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ } フェニル
) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 6 8) N ' - (2 , 5 - ジメチ
 ル - 4 - { 3 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ } フェ
 ニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 6 9) N ' - (2 , 5 - ジ
 メチル - 4 - { 3 - [(2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロピル) スルファニル] フェ
 ノキシ } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 7 0) N ' -
 (2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [(ペンタフルオロエチル) スルファニル] フェノキシ
 } フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 7 1) N ' - (2 ,
 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド
 、 (1 . 0 7 2) N ' - (4 - { [3 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] スルファニル }
 - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0
 7 3) N ' - (4 - { 3 - [(ジフルオロメチル) スルファニル] フェノキシ } - 2 , 5 -
 ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 7 4) N ' -
 [5 - プロモ - 6 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イルオキシ) - 2 - メチ
 ルピリジン - 3 - イル] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 7 5)
 N ' - { 4 - [(4 , 5 - ジクロロ - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) オキシ] - 2 , 5 -
 ジメチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 7 6) N ' -
 { 5 - プロモ - 6 - [(1 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 -
 メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 7
 7) N ' - { 5 - プロモ - 6 - [(1 S) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ
] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 7 8) N ' - { 5 - プロモ - 6 - [(シス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル) オキ
 シ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、
 (1 . 0 7 9) N ' - { 5 - プロモ - 6 - [(トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル)
 オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムア
 ミド、 (1 . 0 8 0) N ' - { 5 - プロモ - 6 - [
 1 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N
 - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 0 8 1) メフェントリフルコナゾール
 (m e f e n t r i f l u c o n a z o l e)、 (1 . 0 8 2) イプフェントリフルコナ
 ザール (i p f e n t r i f l u c o n a z o l e)。

10

20

30

40

50

【 0 2 1 2 】

(2) 複合体 I 又は複合体 I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2 . 0 0 1) ベンゾピンジフルビル、(2 . 0 0 2) ビキサフェン、(2 . 0 0 3) ボスカリド、(2 . 0 0 4) カルボキシシン、(2 . 0 0 5) フルオピラム、(2 . 0 0 6) フルトラニル、(2 . 0 0 7) フルキサピロキサド、(2 . 0 0 8) フラメトピル、(2 . 0 0 9) イソフェタミド、(2 . 0 1 0) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 S)、(2 . 0 1 1) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 R)、(2 . 0 1 2) イソピラザム (アンチ - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 S R)、(2 . 0 1 3) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 (1 R S , 4 S R , 9 R S) とアンチ - エピマー性ラセミ化合物 (1 R S , 4 S R , 9 S R) の混合物)、(2 . 0 1 4) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 R)、(2 . 0 1 5) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 S)、(2 . 0 1 6) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 R S)、(2 . 0 1 7) ペンフルフェン、(2 . 0 1 8) ペンチオピラド、(2 . 0 1 9) ピジフルメトフェン (py d i f l u m e t o f e n)、(2 . 0 2 0) ピラジフルミド、(2 . 0 2 1) セダキサソ、(2 . 0 2 2) 1 , 3 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 2 3) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 2 4) 1 , 3 - ジメチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 2 5) 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 - カルボキサミド、(2 . 0 2 6) 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) ベンズアミド、(2 . 0 2 7) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 2 8) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 2 9) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 S) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 0) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 1) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 2) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 3) 5 , 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] オキシ } フェニル) エチル] キナゾリン - 4 - アミン、(2 . 0 3 4) N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 5) N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 6) N - (2 - tert - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 7) N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 8) N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメ

10

20

30

40

50

チル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 3 9) N - [(1 R , 4 S) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 0) N - [(1 S , 4 R) - 9 - (ジクロロメチレン) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 1) 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、(2 . 0 4 2) N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 3) N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 4) N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 5) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 6) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 7) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 8) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 4 9) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 5 0) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 5 1) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 5 2) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 5 3) N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 5 4) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 5 5) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 0 5 6) N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド。

【 0 2 1 3 】

(3) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3 . 0 0 1) アメトクトラジン、(3 . 0 0 2) アミスルプロム、(3 . 0 0 3) アゾキシストロピン、(3 . 0 0 4) クメトキシストロピン (coumethoxytrobilin)、(3 . 0 0 5) クモキシストロピン、(3 . 0 0 6) シアゾファミド、(3 . 0 0 7) ジモキシストロピン、(3 . 0 0 8) エノキサストロピン、(3 . 0 0 9) ファモキサドン、(3 . 0 1 0) フェンアミドン、(3 . 0 1 1) フルフェノキシストロピン (flufenoxystrobilin)、(3 . 0 1 2) フルオキサストロピン、(3 . 0 1 3) クレソキシム - メチル、(3 . 0 1 4) メトミノストロピン、(3 . 0 1 5) オリサストロピン、(3 . 0 1 6

)ピコキシストロピン、(3.017)ピラクロストロピン、(3.018)ピラメストロピン、(3.019)ピラオキシストロピン、(3.020)トリフロキシストロピン、(3.021)(2E)-2-{2-[({[(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルビニル]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-メチルアセトアミド、(3.022)(2E,3Z)-5-{[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N,3-ジメチルペンタ-3-エンアミド、(3.023)(2R)-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、(3.024)(2S)-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、(3.025)(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[({3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル}カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル 2-メチルプロパノエート、(3.026)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、(3.027)N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルムアミド-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.028)(2E,3Z)-5-{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N,3-ジメチルペンタ-3-エンアミド、(3.029){5-[3-(2,4-ジメチルフェニル)-1H-ピラゾール-1-イル]-2-メチルベンジル}カルバミン酸メチル。

10

20

【0214】

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.001)カルベンダジム、(4.002)ジエトフェンカルブ、(4.003)エタボキサム、(4.004)フルオピコリド、(4.005)ペンシクロン、(4.006)チアベンダゾール、(4.007)チオファネート-メチル、(4.008)ゾキサミド、(4.009)3-クロロ-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-5-フェニルピリダジン、(4.010)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、(4.011)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、(4.012)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.013)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-プロモ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.014)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-プロモフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.015)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.016)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.017)4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.018)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.019)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.020)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-クロロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.021)4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.022)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、(4.023)N-(2-プロモ-6-フルオロフェニル)-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン、(4.024)N-(2-プロモフェニル)-4-(2-クロ

30

40

50

ロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン、(4 . 0 2 5) N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - アミン。

【 0 2 1 5 】

(5) 多部位に活性を示し得る化合物、例えば、(5 . 0 0 1) ボルドー液、(5 . 0 0 2) カプタホール、(5 . 0 0 3) キャプタン、(5 . 0 0 4) クロロタロニル (c h l o r t h a l o n i l)、(5 . 0 0 5) 水酸化銅、(5 . 0 0 6) ナフテン酸銅、(5 . 0 0 7) 酸化銅、(5 . 0 0 8) 塩基性塩化銅、(5 . 0 0 9) 硫酸銅 (2 +)、(5 . 0 1 0) ジチアノン、(5 . 0 1 1) ドジン、(5 . 0 1 2) ホルベット、(5 . 0 1 3) マンゼブ、(5 . 0 1 4) マンネブ、(5 . 0 1 5) メチラム、(5 . 0 1 6) メチラム亜鉛 (z i n c m e t i r a m)、(5 . 0 1 7) オキシ銅 (c o p p e r o x i n e)、(5 . 0 1 8) プロピネブ、(5 . 0 1 9) 硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、(5 . 0 2 0) チウラム、(5 . 0 2 1) ジネブ、(5 . 0 2 2) ジラム、(5 . 0 2 3) 6 - エチル - 5, 7 - ジオキソ - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - ピロロ [3', 4' : 5, 6] [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c] [1, 2] チアゾール - 3 - カルボニトリル。

10

【 0 2 1 6 】

(6) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、(6 . 0 0 1) アシベンゾラル - S - メチル、(6 . 0 0 2) イソチアニル、(6 . 0 0 3) プロベナゾール、(6 . 0 0 4) チアジニル。

20

【 0 2 1 7 】

(7) アミノ酸及び/又はタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7 . 0 0 1) シプロロジニル、(7 . 0 0 2) カスガマイシン、(7 . 0 0 3) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7 . 0 0 4) オキシテトラサイクリン、(7 . 0 0 5) ピリメタニル、(7 . 0 0 6) 3 - (5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン。

【 0 2 1 8 】

(8) A T P 産生阻害薬、例えば、(8 . 0 0 1) シルチオファム。

【 0 2 1 9 】

(9) 細胞壁合成阻害薬、例えば、(9 . 0 0 1) ベンチアバリカルブ、(9 . 0 0 2) ジメトモルフ、(9 . 0 0 3) フルモルフ、(9 . 0 0 4) イプロバリカルブ、(9 . 0 0 5) マンジプロパミド、(9 . 0 0 6) ピリモルフ (p y r i m o r p h)、(9 . 0 0 7) バリフェナレート、(9 . 0 0 8) (2 E) - 3 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、(9 . 0 0 9) (2 Z) - 3 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン。

30

【 0 2 2 0 】

(1 0) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(1 0 . 0 0 1) プロバモカルブ、(1 0 . 0 0 2) プロバモカルブ塩酸塩、(1 0 . 0 0 3) トルクロホス - メチル。

40

【 0 2 2 1 】

(1 1) メラニン生合成阻害薬、例えば、(1 1 . 0 0 1) トリシクラゾール、(1 1 . 0 0 2) 2, 2, 2 - トリフルオロエチル { 3 - メチル - 1 - [(4 - メチルベンゾイル) アミノ] ブタン - 2 - イル } カルバメート。

【 0 2 2 2 】

(1 2) 核酸合成阻害薬、例えば、(1 2 . 0 0 1) ベナラキシル、(1 2 . 0 0 2) ベナラキシル - M (キララキシル)、(1 2 . 0 0 3) メタラキシル、(1 2 . 0 0 4) メタラキシル - M (メフェノキサム)。

【 0 2 2 3 】

(1 3) シグナル伝達阻害薬、例えば、(1 3 . 0 0 1) フルジオキソニル、(1 3 .

50

002) イブロジオン、(13.003) プロシミドン、(13.004) プロキナジド、(13.005) キノキシフェン、(13.006) ピンクロゾリン。

【0224】

(14) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.001) フルアジナム、(14.002) メプチルジノカップ。

【0225】

(15) さらなる化合物、例えば、(15.001) アブシジン酸、(15.002) ベンチアゾール、(15.003) ベトキサジン、(15.004) カプシマイシン (capsimycin)、(15.005) カルボン、(15.006) キノメチオネート、(15.007) クフラネブ、(15.008) シフルフェナミド、(15.009) シモキサニル、(15.010) シプロスルファミド、(15.011) フルチアニル、(15.012) ホセチル-アルミニウム、(15.013) ホセチル-カルシウム、(15.014) ホセチル-ナトリウム、(15.015) イソチオシアン酸メチル、(15.016) メトラフェノン、(15.017) ミルディオマイシン、(15.018) ナタマイシン、(15.019) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.020) ニトロタル-イソプロピル、(15.021) オキサモカルブ (oxamocarb)、(15.022) オキサチアピプロリン、(15.023) オキシフェンチン (oxyfenthin)、(15.024) ペンタクロロフェノール及び塩、(15.025) ホスホン酸及びその塩、(15.026) プロパモカルブ-ホセチレート (propamocarb-fosetylato)、(15.027) ビリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、(15.028) テブフロキン、(15.029) テクロフタラム、(15.030) トルニファニド、(15.031) 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、(15.032) 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、(15.033) 2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、(15.034) 2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトロン、(15.035) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.036) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.037) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(15.038) 2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾリン、(15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート、(15.041

10

20

30

40

50

) 2 - { 2 - [(7 , 8 - ジフルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] - 6 - フルオロフェニル } プロパン - 2 - オール、 (15 . 042) 2 - { 2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] フェニル } プロパン - 2 - オール、 (15 . 043) 2 - { 3 - [2 - (1 - { [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - クロロフェニル メタンスルホネート、 (15 . 044) 2 - { 3 - [2 - (1 - { [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } フェニル メタンスルホネート、 (15 . 045) 2 - フェニルフェノール及びその塩、 (15 . 046) 3 - (4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、 (15 . 047) 3 - (4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、 (15 . 048) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール (互変異性形態 : 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 (1 H) - オン)、 (15 . 049) 4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] 酪酸、 (15 . 050) 5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、 (15 . 051) 5 - クロロ - N ' - フェニル - N ' - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル) チオフェン 2 - スルホノヒドラジド、 (15 . 052) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、 (15 . 053) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、 (15 . 054) 9 - フルオロ - 2 , 2 - ジメチル - 5 - (キノリン - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾオキサゼピン、 (15 . 055) ブタ - 3 - イン - 1 - イル { 6 - [({ [(Z) - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、 (15 . 056) (2 Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリル酸エチル、 (15 . 057) フェナジン - 1 - カルボン酸、 (15 . 058) 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ安息香酸プロピル、 (15 . 059) キノリン - 8 - オール、 (15 . 060) キノリン - 8 - オールスルフェート (2 : 1)、 (15 . 061) { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバミン酸 tert - ブチル、 (15 . 062) 5 - フルオロ - 4 - イミノ - 3 - メチル - 1 - [(4 - メチルフェニル) スルホニル] - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 2 (1 H) - オン。

【 0 2 2 6 】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

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

【 0 2 2 7 】

生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物 (例えば、タンパク質及び二次代謝産物) などがある。

【 0 2 2 8 】

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

【 0 2 2 9 】

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

バシルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) 株 F Z B 4 2 (D S M 2 3 1 1 7 9)、又は、バシルス・セレウス (*Bacillus cereus*)、特に、バシルス・セレウス (*B. cereus*) 株 C N C M I - 1 5 6 2、又は、バシルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) 株 I - 1 5 8 2 (受託番号 C N C M I - 1 5 8 2)、又は、バシルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、株 G B 3 4 (受託番号 A T C C 7 0 0 8 1 4) 及

10

20

30

40

50

び株QST2808(受託番号 NRRL B-30087)、又は、バシルス・スプチリス(*Bacillus subtilis*)、特に、株GB03(受託番号 ATCC SD-1397)、又は、バシルス・スプチリス(*Bacillus subtilis*)株QST713(受託番号 NRRL B-21661)、又は、バシルス・スプチリス(*Bacillus subtilis*)株OST 30002(受託番号 NRRL B-50421)、バシルス・ツリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 イスラエレンシス(*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (抗原型 H-14)株AM65-52(受託番号 ATCC 1276)、又は、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 アイザワイ(*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株ABTS-1857(SD-1372)、又は、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 クルスタキ(*B. thuringiensis subsp. kurstaki*)株HD-1、又は、バシルス・ツリンギエンシス 亜種 テネブリオニス(*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*)株NB 176(SD-5428)、パステウリア・ペネトランス(*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種(*Pasteuria spp.*) (ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)線虫) - PR3(受託番号 ATCC SD-5834)、ストレプトミセス・マイクロフラブス(*Streptomyces microflavus*)株AQ6121(= QRD 31.013、NRRL B-50550)、ストレプトミセス・ガルブス(*Streptomyces galbus*)株AQ 6047(受託番号 NRRL 30232)。

10

20

【0230】

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

ベアウベリア・バシアナ(*Beauveria bassiana*)、特に、株ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス(*Coniothyrium minitans*)、特に、株CON/M/91-8(受託番号 DSM-9660)、レカニシリウム属種(*Lecanicillium spp.*)、特に、株HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ(*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ(*Verticillium lecanii*)として知られていた)、特に、株KV01、メタリジウム・アニソプリアエ(*Metarhizium anisopliae*)、特に、株F52(DSM3884/ ATCC 90448)、メトスクニコウシア・フルクチコラ(*Metschnikowia fructicola*)、特に、株NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*) (新規：イサリア・フモソロセア(*Isaria fumosorosea*))、特に、株IFPC 200613又は株Apopka 97(受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス(*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス(*P. lilacinus*)株251(AGAL 89/030550)、タラロミセス・フラブス(*Talaromyces flavus*)、特に、株V117b、トリコデルマ・アトロビリデ(*Trichoderma atroviride*)、特に、株SC1(受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム(*Trichoderma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ(*T. harzianum rifai*) T39(受託番号 CNCM I-952)。

30

40

【0231】

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

リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)顆粒病ウイルス(GV)、コドリングア(*Cydia pomonella*)顆粒病ウイルス(GV)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)核多角体病ウイルス(NPV)、シロ

50

イチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV。

【0232】

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

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

【0233】

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

ニンニク (*Allium sativum*)、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン (*azadirachtin*)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*)、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*)、アメリカアリタソウ (*Chenopodium anthelminticum*)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*)、スギナ (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (キノア (*Chenopodium quinoa*) サボニン抽出物)、除虫菊 (*pyrethrum/pyrethrins*)、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、Regalia、(「*Requiem™ Insecticide*」)、ロテノン、リアニア/リアノジン、ヒレハリソウ (*Symphytum officinale*)、ヨモギギク (*Tanacetum vulgare*)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ (*Tropaeolum majus*)、セイヨウイラクサ (*Urtica dioica*)、Veratrin、セイヨウヤドリギ (*Viscum album*)、アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。

【0234】

混合成分としての薬害軽減剤

式 (I) で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセット (-メキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミド、フェンクロラゾール (-エチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、

10

20

30

40

50

イソキサジフェン(-エチル)、メフェンピル(-ジエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N-({ 4-[(メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド (CAS 129531-12-0)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン (CAS 71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン (CAS 52836-31-4) などと組み合わせることができる。

【0235】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の部分进行处理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物(天然に発生している作物植物を包含する)のような全ての植物及び植物個体群、例えば、穀類(コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、ピーマン、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、ホウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物(Brassicaceae)(例えば、キャベツ)及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(ここで、果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウである)などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物は、全ての成育段階、例えば、種子、実生、及び、幼植物(未成熟植物)から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などである。収穫された植物又は収穫された植物の部分、並びに、栄養繁殖器官(vegetative propagation material)及び生殖繁殖器官(generative propagation material)、例えば、挿穂(cutting)、塊茎、根茎、かき苗(slip)及び種子なども、植物の部分に包含される。

【0236】

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

【0237】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分进行处理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種及び植物品種、並びに、それらの部分进行处理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的な方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種(遺伝子組換え生物)及びそれらの部分进行处理する。用語「部分(parts)」又は「植物の部分(parts of plants)」又は「植物の部分(plant parts)」については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な植物品種又は使用されている慣習的な植物品種の植物进行处理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた、新しい特性(「形質」)を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

【0238】

トランスジェニック植物、種子処理、及び、統合イベント (i n t e g r a t i o n e v e n t s)

特に有利で有益な特性(「形質」)を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種(遺伝子工学により得られたもの)に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、湯水又は水中若しくは土壤中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開花能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び/又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵性及び/又は改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物(例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類)に対する植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する遺伝物質[例えば、遺伝子 *CryIA(a)*、*CryIA(b)*、*CryIA(c)*、*CryIIA*、*CryIII A*、*CryIII B2*、*Cry9c*、*Cry2Ab*、*Cry3Bb*及び*CryIF*並びにそれらの組合せ]によって植物体内で形成された毒素による、害虫及び有害微生物(例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類)に対する植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び/又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性(*SAR*)、システミン(*systemin*)、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び/又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の除草活性成分(例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシン)に対する植物の向上した耐性である(例えば、「*PAT*」遺伝子)。望まれる当該特性(「形質」)を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。上記トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類(コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(ここで、該果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウである)などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性(「形質」)は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

10

20

30

【0239】

作物保護 - 処理の種類

植物及び植物の部分は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散(*spreading-on*)、注入、灌水(灌漑(*drenching*))、点滴灌漑などによって、式(I)で表される化合物で直接処理するか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることによって処理し、また、繁殖器官(*propagation material*)の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理、液体種子処理、スラリー処理、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても処理する。さらに、式(I)で表される化合物を微量散布法(*ultra-low volume method*)によって施用することも可能であり、又は、該施用形態又は式(I)で表される化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

40

【0240】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用であり、このことは、式(I)で表される化合物を茎葉部に施用することを意味し、その場合、その処理頻度及び施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

50

【0241】

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

10

【0242】

種子処理

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

20

【0243】

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

30

【0244】

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

【0245】

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

40

【0246】

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

【0247】

式（I）で表される化合物が浸透移行的に作用する場合に生じる有利な点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その

50

種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなくに作物を直接処理する手間を省くことができる。

【0248】

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

【0249】

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

【0250】

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

10

【0251】

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

20

【0252】

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

30

【0253】

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

40

【0254】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式(I)で表される化合物の量及び/又はさらなる添加剤の量を選択することに対して、一般的に注意しなくてはならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性成分の場合に、確実に実施しなければなら

50

い。

【0255】

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

【0256】

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

【0257】

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

10

【0258】

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

【0259】

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

20

【0260】

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

30

【0261】

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

【0262】

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

40

【0263】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレー及び微粉化シリカなどを挙げるすることができる。

【0264】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例として

50

は、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げることができる。

【0265】

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

【0266】

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

【0267】

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

【0268】

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

【0269】

動物衛生

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

【0270】

獣医学の分野において、内温動物に対する毒性が好ましい程度である式(I)で表される化合物は、畜産業及び動物飼育において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物(domestic animal)において発生する寄生生物を防除するのに適している。それらは、該寄生生物の全ての発育段階又は特定の発育段階に対して活性を示す。

【0271】

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

10

20

30

40

50

しくは甲殻類の動物；又は、場合により、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0272】

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

【0273】

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

【0274】

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

10

【0275】

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

【0276】

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

20

【0277】

節足動物としては、限定するものではないが、例えば、以下のものを挙げることができる：アノプルス目(Anoplurida)の、例えば、ハエマトピヌス属種(Haematopinus spp.)、リノグナツス属種(Linognathus spp.)、ペジクルス属種(Pediculus spp.)、プチルス属種(Phtirus spp.)、及び、ソレノポテス属種(Solenopotes spp.)；

マロファギダ目(Mallophagida)並びにアムブリセリナ亜目(Amblycerina)及びイスクノセリナ亜目(Ischnocerina)の、例えば、ボビコラ属種(Bovicola spp.)、ダマリナ属種(Damalina spp.)、フェリコラ属種(Felicola spp.)；レピケントロン属種(Lepikentron spp.)、メノポン属種(Menopon spp.)、トリコデクテス属種(Trichodectes spp.)、トリメノポン属種(Trimenopon spp.)、トリノトン属種(Trinoton spp.)、ウエルネキエラ属種(Werneckiella spp.)、ウエルネキエラ属種(Werneckiella spp.)；

30

双翅目(Diptera)並びにネマトセリナ亜目(Nematocerina)及びブラキセリナ亜目(Brachycerina)の、例えば、アエデス属種(Aedes spp.)、アノフェレス属種(Anopheles spp.)、アチロツス属種(Atylotus spp.)、ブラウラ属種(Braula spp.)、カリホラ属種(Calliphora spp.)、クリソミア属種(Chrysomyia spp.)、クリソプス属種(Chrysops spp.)、クレキス属種(Culex spp.)、クリコイデス属種(Culicoides spp.)、エウシムリウム属種(Eusimulium spp.)、ファンニア属種(Fannia spp.)、ガステロフィルス属種(Gasterophilus spp.)、グロシナ属種(Glossina spp.)、ハエマトピア属種(Haematobia spp.)、ハエマトポタ属種(Haematopota spp.)、ヒポボスカ属種(Hippobosca spp.)、ヒボミトラ属種(Hybomitra spp.)、ヒドロタエア属種(Hy

40

50

drotaea spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リポプテナ属種 (*Lipoptena* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、ルトゾミヤ属種 (*Lutzomyia* spp.)、メロファグス属種 (*Melophagus* spp.)、モレリア属種 (*Morellia* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、オダグミア属種 (*Odagmia* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、フィリポミア属種 (*Philipomyia* spp.)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、リノエストルス属種 (*Rhinoestrus* spp.)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.)、ウィルヘルミア属種 (*Wilhelmia* spp.)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.) ;

ノミ目 (*Siphonapterida*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、プレキス属種 (*Pulex* spp.)、ツンガ属種 (*Tunga* spp.)、キセノプシラ属種 (*Xenopsylla* spp.) ;

ヘテロプテリダ目 (*heteropterida*) の、例えば、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、パンストロンギルス属種 (*Panstrongylus* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.) ; 及び、さらに、ゴキブリ目 (*Blattarida*) の有害害虫及び衛生害虫。

【0278】

さらに、節足動物の場合、限定するものではないが、例として以下のダニ類も挙げるべきである :

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarina*)) 及びメタスティグマ目 (*Metastigmata*) の、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*) の、例えば、アルガス属種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ科 (*Ixodidae*) の、例えば、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、デルマセントル属種 (*Demacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種 (*Haemaphysalis* spp.)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、イキシデス属種 (*Ixodes* spp.)、リピセファルス (ポオフィルス) 属種 (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp. (多宿主ダニの原属)) ;

メソスティグマ目 (*Mesostigmata*) の、例えば、デルマニسس属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニسس属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニسس属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Raillietia* spp.)、ステルノストマ属種 (*Sternostoma* spp.)、トロピラエラプス属種 (*Tropilaelaps* spp.)、バロア属種 (*Varroa* spp.) ;

アクチネジダ目 (*Actinedida* (*Prostigmata*)) の、例えば、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属種 (*Cheyletiella* spp.)、デモデキス属種 (*Demodex* spp.)、リストロホルス属種 (*Listrophorus* spp.)、ミオピア属種 (*Myobia* spp.)、ネオトロムビクラ属種 (*Neotrombicula* spp.)、オルニトケイレチア属種 (*Ornithocheyletia* spp.)、プソレルガテス属種 (*Psorergates* spp.)、トロムビクラ属種 (*Trombicula* spp.) ; 及び、アカリジダ目 (*Acaridida* (*Astigmata*)) の、例えば、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、カログリフス属種 (*Caloglyphus* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、シトジテス属種 (*Cytodites* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、クネミドコプテス属種 (*Knemidocoptes* spp.)、ラミノシオプテス属種 (*Laminosiop*

10

20

30

40

50

tes spp.）、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、トリキサカルス属種 (Trixacarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)。

【0279】

寄生性原生動物の例としては、限定するものではないが、以下のものを挙げる事ができる：

鞭毛虫亜門 (Mastigophora) (鞭毛虫類 (Flagellata))、例えば：

メタモナーダ (Metamonada)： ヒゲハラムシ目 (Diplomonadida) の、例えば、ギアルジア属種 (Giardia spp.)、スピロヌクレウス属種 (Spiroucleus spp.)；

パラバサラ (Parabasala)： トリコモナス目 (Trichomonadida) の、例えば、ヒストモナス属種 (Histomonas spp.)、ペンタトリコモナス属種 (Pentatrachomonas spp.)、テトラトリコモナス属種 (Tetratrachomonas spp.)、トリコモナス属種 (Trichomonas spp.)、トリトリコモナス属種 (Tritrachimonas spp.)；

ユーグレノゾア (Euglenozoa)： トリパノソーマ目 (Trypanosomatida) の、例えば、レイスマニア属種 (Leishmania spp.)、トリパノソーマ属種 (Trypanosoma spp.)；

有毛根足虫亜門 (Sarcomastigophora) (根足虫類 (Rhizopoda))、例えば、エントアメーバ科 (Entamoebidae)、例えば、エンタモエバ属種 (Entamoeba spp.)、セントロアメーバ科 (Centramoebidae)、例えば、アカンタモエバ属種 (Acanthamoeba sp.)、ユーアメーバ科 (Euamoebidae)、例えば、ハルトマネラ属種 (Hartmannella sp.)；

アルベオラータ (Alveolata)、例えば、アピコンプレックス門 (Apicomplexa) (孢子虫類 (Sporozoa))、例えば、クリプトスポリジウム属種 (Cryptosporidium spp.)； エイメリア目 (Eimeriida) の、例えば、ベスノイチア属種 (Besnoitia spp.)、シストイソスポラ属種 (Cystoisospora spp.)、エイメリア属種 (Eimeria spp.)、ハモンジア属種 (Hammondia spp.)、イソスポラ属種 (Isospora spp.)、ネオスポラ属種 (Neospora spp.)、サルコシスチス属種 (Sarcocystis spp.)、トキシプラズマ属種 (Toxoplasma spp.)； アデレイダ目 (Adeleida) の、例えば、ヘパトゾオン属種 (Hepatozoon spp.)、クロシエラ属不 (Klossiella spp.)； ハエモスポリダ目 (Haemosporida) の、例えば、レウコシトゾオン属種 (Leucocytozoon spp.)、プラスモジウム属種 (Plasmodium spp.)；

ピロプラスミダ目 (Piroplasmida) の、例えば、バベシア属種 (Babesia spp.)、シリオホラ属種 (Ciliophora spp.)、エキノゾオン属種 (Echinozoon spp.)、テイレリア属種 (Theileria spp.)； ベシプリフェリダ目 (Vesibuliferida) の、例えば、バランチジウム属種 (Balantidium spp.)、ブキストネラ属種 (Buxtonella spp.)；

微孢子虫亜門 (Microspora)、例えば、エンセファリトゾオン属種 (Encephalitozoon spp.)、エンテロシトゾオン属種 (Enterocytozoon spp.)、グロビジウム属種 (Globidium spp.)、ノセマ属種 (Nosema spp.)、及び、さらに、例えば、ミキソゾア属種 (Myxozoa spp.)。

10

20

30

40

50

【0280】

ヒト又は動物に対して病原性を示す蠕虫類としては、例えば、鉤頭動物門 (*Acanthocephala*)、線形動物 (*nematodes*)、舌形動物門 (*Pentastoma*) 及び扁形動物門 (*Platyhelminthes*) [例えば、単生類 (*Monogenea*)、条虫類 (*cestodes*) 及び吸虫類 (*trematodes*)] などがある。

【0281】

例示的な蠕虫類としては、限定するものではないが、以下のものを挙げるができる：

単生綱 (*Monogenea*)：例えば：ダクチロギルス属種 (*Dactylogyrus spp.*)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus spp.*)、ミクロボトリウム属種 (*Microbothrium spp.*)、ポリストマ属種 (*Polystoma spp.*)、トログレセファルス属種 (*Troglecephalus spp.*)；

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

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

吸虫類 (*Trematodes*)：二生亜綱 (*Digenea*) の、例えば：アウストロビルハルジア属種 (*Austrobilharzia spp.*)、ブラキライマ属種 (*Brachylaima spp.*)、カリコホロン属種 (*Calicophoron spp.*)、カタトロピス属種 (*Catantropis spp.*)、クロノルキス属種 (*Clonorchis spp.*)、コリリクルム属種 (*Collyriclum spp.*)、コチロホロン属種 (*Cotylphoron spp.*)、シクロコエルム属種 (*Cyclocoelum spp.*)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium spp.*)、ジプロストムム属種 (*Diplostomum spp.*)、エキノカスムス属種 (*Echinochasmus spp.*)、エキノパリフィウム属種 (*Echinoparyphium spp.*)、エキノストマ属種 (*Echinostoma spp.*)、エウリトレマ属種 (*Eurytrema spp.*)、ファシオラ属種 (*Fasciola spp.*)、ファシオロイデス属種 (*Fasciolides spp.*)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis spp.*)、フィスコエデリウス属種 (*Fischoederius spp.*)、ガストロチラクス属種 (*Gastr*

10

20

30

40

50

othylacus spp.)、ギガントビルハルジア属種 (Gigantobilharzia spp.)、ギガントコチレ属種 (Gigantocotyle spp.)、ヘテロフィエス属種 (Heterophyes spp.)、ヒポデラエウム属種 (Hypoderaeum spp.)、レウコクロリジウム属種 (Leucochloridium spp.)、メタゴニムス属種 (Metagonimus spp.)、メトルキス属種 (Metorchis spp.)、ナノフィエツス属種 (Nanophyetus spp.)、ノトコチルス属種 (Notocotylus spp.)、オピストルキス属種 (Opisthorchis spp.)、オルニトビルハルジア属種 (Ornithobilharzia spp.)、パラゴニムス属種 (Paragonimus spp.)、パラムフィストムム属種 (Paramphistomum spp.)、ブラギオルキス属種 (Plagiorchis spp.)、ポストジプロストムム属種 (Posthodiplostomum spp.)、プロストゴニムス属種 (Prosthogonimus spp.)、シストソマ属種 (Schistosoma spp.)、トリコビルハルジア属種 (Trichobilharzia spp.)、トログロトレマ属種 (Troglotrema spp.)、チフロコエルム属種 (Typhlocoelum spp.) ;

線虫類 (Nematodes) : ベンチュウ目 (Trichinellida) の、例えば： カピラリア属種 (Capillaria spp.)、トリキネラ属種 (Trichinella spp.)、トリコモソイデス属種 (Trichomosoides spp.)、トリクリス属種 (Trichuris spp.) ;

クキセンチュウ目 (Tylenchida) の、例えば： ミクロネマ属種 (Micronema spp.)、パラストラングロイデス属種 (Parastrangyloides spp.)、ストロンギロイデス属種 (Strongyloides spp.) ;
 カンセンチュウ目 (Rhabditina) の、例えば： アエルロストロンギルス属種 (Aelurostrongylus spp.)、アミドストムム属種 (Amidostomum spp.)、アンシロストマ属種 (Ancylostoma spp.)、アンギオストロンギルス属種 (Angiostrongylus spp.)、ブロンコネマ属種 (Bronchonema spp.)、ブノストムム属種 (Bunostomum spp.)、カベルチア属種 (Chabertia spp.)、コオペリア属種 (Cooperia spp.)、コオペリオイデス属種 (Cooperioides spp.)、クレノソマ属種 (Crenosoma spp.)、シアトストムム属種 (Cyathostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cyclococercus spp.)、シクロドントストムム属種 (Cyclodontostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cylicocyclus spp.)、シリコステファヌス属種 (Cylicostephanus spp.)、シリンドロファリンクス属種 (Cylindropharynx spp.)、シストカウルス属種 (Cystocaulus spp.)、ジクチオカウルス属種 (Dictyocaulus spp.)、エラホストロンギルス属種 (Elaphostrongylus spp.)、フィラロイデス属種 (Filaroides spp.)、グロボセファルス属種 (Globocephalus spp.)、グラフィジウム属種 (Graphidium spp.)、ギアロセファルス属種 (Gyalocephalus spp.)、ハエモンクス属種 (Haemonchus spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (Heligmosomoides spp.)、ヒオストロンギルス属種 (Hyostromylus spp.)、マルシャラギア属種 (Marshallagia spp.)、メタストロンギルス属種 (Metastrongylus spp.)、ムエレリウス属種 (Muellerius spp.)、ネカトル属種 (Necator spp.)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、ネオストロンギルス属種 (Neostromylus spp.)、ニッポストロンギルス属種 (Nippostrongylus spp.)、オベリスコイデス属種 (Obeliscooides spp.)、オエソファゴドンツス属種 (Oesophagodontus spp.)、オエソファゴストムム属種 (Oe

10

20

30

40

50

sophagostomum spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.) ; オルニトストロンギルス属種 (*Ornithostromylylus* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、パラコオペリア属種 (*Paracooperia* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、パレラホストロンギルス属種 (*Parelaphostromylylus* spp.)、プネウモカウルス属種 (*Pneumocaulus* spp.)、プネウモストロンギルス属種 (*Pneumostromylylus* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poteriostomum* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus* spp.)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、ステファヌルス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギルス属種 (*Strongylus* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、テラドルサギア属種 (*Teladorsagia* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema* spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostromylylus* spp.)、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、トログロストロンギルス属種 (*Troglostromylylus* spp.)、ウンシナリア属種 (*Uncinaria* spp.) ; センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば： アカントケイロネマ属種 (*Acanthocheilonema* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属種 (*Ascaridia* spp.) ; アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、アスカロプス属種 (*Ascarops* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、セルコピチフィラリア属種 (*Cercopithifilaria* spp.)、クラシカウダ属種 (*Crassicauda* spp.)、ジペタロネマ属種 (*Dipetalonema* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.) ; ドラスキア属種 (*Draschia* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、フィラリア属種 (*Filaria* spp.)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハブロンネマ属種 (*Habronema* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.) ; リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、パラブロンネマ属種 (*Parabronema* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パスアルルス属種 (*Passalurus* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、プロブストマイリア属種 (*Probstmayria* spp.)、プセウドフィラリア属種 (*Pseudofilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、スクジュラビネマ属種 (*Skjrabinema* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、ストロンギルリス (*Strongyluris* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.) ;

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*) : ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば： マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorchis* spp.) ; サジヨウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば： モニリホルミス属種 (*Moniliformis* spp.) ;

ポリモルフス目 (Polymorphida) の、例えば： フィリコリス属種 (Filicollis spp.) ; コウトウチュウ目 (Echinorhynchida) の、例えば、アカントセファルス属種 (Acanthocephalus spp.)、エキノリンクス属種 (Echinorhynchus spp.)、レプトリンコイデス属種 (Leptorhynchoides spp.) ;

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

【0282】

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

10

【0283】

かくして、本発明の1実施形態は、薬物として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

【0284】

さらなる態様は、抗内部寄生生物剤として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

【0285】

本発明のさらなる特定の態様は、抗蠕虫剤 (antihelminthic agent) として使用するための、特に、殺線虫剤、殺扁形動物剤 (platyhelminthicide)、殺鉤頭動物剤 (acanthocephalicide) 又は殺舌形動物剤 (pentastomicide) として使用するための、式 (I) で表される化合物に関する。

20

【0286】

本発明のさらなる特定の態様は、抗原生動物剤 (antiprotozoic agent) として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

【0287】

さらなる態様は、抗外部寄生生物剤として使用するための、特に、殺節足動物剤 (arthropodicide) として使用するための、極めて特定のには、殺虫剤又は殺ダニ剤として使用するための、式 (I) で表される化合物に関する。

30

【0288】

本発明のさらなる態様は、有効量の式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物及び以下のもののうちの少なくとも1種類を含んでいる獣医薬製剤である： 薬学的に許容され得る賦形剤 (例えば、固体希釈剤又は液体希釈剤)、薬学的に許容され得る補助剤 (例えば、界面活性剤)、特に、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、及び/又は、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤。

【0289】

本発明の関連する態様は、本明細書中に記載されている獣医薬製剤を製造する方法であって、ここで、該方法は、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物を、薬学的に許容され得る賦形剤及び/又は補助剤 (特に、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、及び/又は、獣医薬製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤) と混合させる段階を含んでいる。

40

【0290】

本発明の別の特定の態様は、上記態様による殺外部寄生生物薬製剤 (ectoparasitocidal formulations) 及び殺内部寄生生物薬製剤 (endoparasitocidal formulations) の群から選択される獣医薬製剤、特に、駆虫薬製剤、抗原生動物薬製剤 (antiprotozoic formulations) 及び殺節足動物薬製剤 (arthropodocidal formula

50

tions)の群から選択される獣医薬製剤、極めて特に、殺線虫薬製剤(nematocidal formulations)、殺扁形動物薬製剤(platyhelminthocidal formulations)、殺鉤頭動物薬製剤(acanthocephalicidal formulations)、殺舌形動物薬製剤(pentastomicidal formulations)、殺虫薬製剤(insecticidal formulations)及び殺ダニ薬製剤(acaricidal formulations)の群から選択される獣医薬製剤、並びに、それらを製造する方法である。

【0291】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物(特に、非ヒト動物)において有効量の式(I)で表される化合物を使用することによる。

10

【0292】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物(特に、非ヒト動物)において本明細書中で定義されている獣医薬製剤を使用することによる。

【0293】

別の態様は、動物(特に、非ヒト動物)における寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物に起因する感染症の治療における、式(I)で表される化合物の使用に関する。

20

【0294】

動物衛生又は獣医学に関連して、用語「処置(treatment)」は、予防的処置、感染後防御的処置又は治療的処置を包含する。

【0295】

特定の実施形態においては、このようにして、獣医学の分野に対して、式(I)で表される少なくとも1種類の化合物と別の活性成分(特に、殺内部寄生生物薬及び殺外部寄生生物薬)の混合物が提供される。

【0296】

動物衛生の分野においては、「混合物」は、2種類の(又は、それより多い)異なる活性成分が共有の製剤に製剤され、それによって一緒に使用されることを意味するのみではなく、それぞれの活性成分に対して独立した製剤を含んでいる製品にも関する。従って、3種類以上の活性成分を使用する場合、全ての活性成分を共有の製剤に製剤することができるか、又は、全ての活性成分を別々の製剤に製剤することが可能である;同様に、活性成分のうちの一部と一緒に製剤し且つ活性成分のうちの一部を別々に製剤するという混合形態も考えることができる。別々の製剤では、当該複数の活性成分を別々に施用することが可能であるか、又は、連続して施用することが可能である。

30

【0297】

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」(上記を参照されたい)に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」)。

40

【0298】

混合成分として該殺外部寄生生物薬の群から選択される例示的な活性成分としては、決して限定することを意図するものではないが、上記において詳細に記載されている殺虫剤及び殺ダニ剤などを挙げるができる。使用することが可能なさらなる活性成分について、現在の「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいた上記分類に従って、以下に記載する:(1)アセチルコリンエステラーゼ(ACHE)阻害薬;(2)GABA制御塩化物チャンネル遮断薬;(3)ナト

50

リウムチャンネルモジュレーター；(4)ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)競合的モジュレーター；(5)ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)アロステリックモジュレーター；(6)グルタミン酸制御塩化物チャンネル(GluCl)アロステリックモジュレーター；(7)幼若ホルモン模倣物質；(8)種々の特定されていない(多部位)阻害薬；(9)弦音器官モジュレーター；(10)ダニ成長阻害薬；(12)ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター；(13)プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤；(14)ニコチン作動性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬；(15)キチン生合成の阻害薬(タイプ0)；(16)キチン生合成の阻害薬(タイプ1)；(17)脱皮ディスラプター(特に、双翅目の場合)；(18)エクジソン受容体作動薬；(19)オクトパミン受容体作動薬；(21)ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬；(25)mミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬；(20)ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬；(22)電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬；(23)アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬；(28)リアノジン受容体モジュレーター；

作用機序が知られていないか又は特定されていない活性成分、例えば、フェントリファニル、フェノキサクリム、シクロブレン、クロロベンジレート、クロルジメホルム、フルベンジミン、ジシクラニル、アミドフルメト、キノメチオネート、トリアラテン、クロチアゾベン、テトラスル、オレイン酸カリウム、石油、メトキサジアゾン、ゴシブルレ、フルテンジン、プロモプロピレート、氷晶石(cryolite)；

別のクラスの化合物、例えば、ブタカルブ、ジメチラン、クロエトカルブ、ホスホカルブ、ピリミホス(-エチル)、パラチオン(-エチル)、メタクリホス、o-サリチル酸イソプロピル、トリクロルホン、スルプロホス、プロパホス、セブホス、ピリダチオン、プロトエート、ジクロフェンチオン、ジメトン-S-メチルスルホン、イサゾホス、シアノフェンホス、ジアリホス、カルボフェノチオン、アウタチオホス、アロムフェンピンホス(-メチル)、アジンホス(-エチル)、クロルピリホス(-エチル)、ホスメチラン、ヨードフェンホス、ジオキサベンゾホス、ホルモチオン、ホノホス、フルピラゾホス、フェンスルホチオン、エトリムホス；

有機塩素化合物、例えば、カンフェクロル、リンダン、ヘプタクロル；又は、フェニルピラゾール系、例えば、アセトプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、パニリプロール、シサプロニル；又は、イソオキサゾリン系、例えば、サロラネル、アフォキシラネル、ロチラネル、フルララネル；

ピレスロイド系、例えば、(シス-、トランス-)メトフルトリン、プロフルトリン、フルフェンプロックス、フルプロシトリネート、フブフェンプロックス、フェンフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、RU15525、テラレトリン、シス-レスメトリン、ヘプタフルトリン、ピオエタノメトリン、ピオペルメトリン、フェンピリトリン、シス-シベルメトリン、シス-ペルメトリン、クロシトリン、シハロトリン(ラムダ-)、クロバポルトリン、又は、ハロゲン化炭化水素化合物(HCHs)；

ネオニコチノイド系、例えば、ニチアジン；

ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)、トリフルメゾピリム；

大環状ラクトン系、例えば、ネマデクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、モキシデクチン、セラメクチン、エプリノメクチン、ドラメクチン、エマメクチン安息香酸塩；ミルベマイシンオキシム；

トリプレン、エポフェノナン、ジオフェノラン；

生物学的薬剤、ホルモン類、又は、フェロモン類、例えば、天然産物類、例えば、ツリンギエンシン(thuringiensin)、コドレモン、又は、ニーム成分；

ジニトロフェノール系、例えば、ジノカップ、ジノブトン、ピナバクリル；

ベンゾイル尿素系、例えば、フルアズロン、ペンフルロン；

アミジン誘導体、例えば、クロロメブホルム(chloromebulfom)、シミアゾール、デミジトラズ；

蜜蜂巣箱ミツバチヘギイタダニ殺ダニ剤(beehive varroa acarici)

10

20

30

40

50

d e s)、例えば、有機酸、例えば、ギ酸、シュウ酸。

【0299】

混合成分として該殺内部寄生生物薬の群から選択される例示的な活性成分としては、限定するものではないが、駆虫活性成分及び抗原生動物活性成分などを挙げるができる。

【0300】

該駆虫活性成分としては、限定するものではないが、以下の殺線虫活性成分、殺吸虫活性成分及び/又は殺条虫活性成分などを挙げるができる：

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：エプリノメクチン、アバメクチン、ネマデクチン、モキシデクチン、ドラメクチン、セラメクチン、レピメクチン、ラチデクチン、ミルベメクチン、イベルメクチン、エマメクチン、ミルベマイシン；

ベンゾイミダゾール類及びプロベンゾイミダゾール類のクラスの、例えば：オキシベンダゾール (o x i b e n d a z o l e)、メベンダゾール、トリクラベンダゾール (t r i c l a b e n d a z o l e)、チオファネート (t h i o p h a n a t e)、バルベンダゾール (p a r b e n d a z o l e)、オキシフェンダゾール (o x f e n d a z o l e)、ネトビミン (n e t o b i m i n)、フェンベンダゾール、フェバンテル、チアベンダゾール (t h i a b e n d a z o l e)、シクロベンダゾール、カムベンダゾール、アルベンダゾールスルホキシド、アルベンダゾール、フルベンダゾール；

デブシペプチド類のクラスの、好ましくは、環状デブシペプチド類のクラスの、特に、24員の環状デブシペプチド類のクラスの、例えば：エモデプシド (e m o d e p s i d e)、P F 1 0 2 2 A ；

テトラヒドロピリミジン類のクラスの、例えば：モランテル、ピランテル、オキサテル；イミダゾチアゾール類のクラスの、例えば：ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

アミノフェニルアミジン類のクラスの、例えば：アミダンテル、デアシル化アミダンテル (d A M D)、トリベンジミジン；

アミノアセトニトリル類のクラスの、例えば：モネパンテル (m o n e p a n t e l) ；

パラヘルクアミド類のクラスの、例えば：パラヘルクアミド、デルクアンテル；

サリチルアニリド類のクラスの、例えば：トリプロムサラン、プロモキサニド、プロチアニド、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、ラフォキサニド；

置換フェノール類のクラスの、例えば：ニトロキシニル、ピチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン (m e n i c l o p h o l a n) ；

有機リン酸エステル類のクラスの、例えば：トリクロロホン、ナフタロホス (n a p h t h a l o f o s)、ジクロロボス / D D V P、クルホメート、クマホス、ハロキソン；

ピペラジノン類 / キノリン類のクラスの、例えば：プラジクアンテル (p r a z i q u a n t e l)、エブシプランテル；

ピペラジン類のクラスの、例えば：ピペラジン、ヒドロキシジン；

テトラサイクリン類のクラスの、例えば：テトラサイクリン、クロロテトラサイクリン、ドキシサイクリン、オキシテトラサイクリン、ロリテトラサイクリン；

さまざまな別のクラスの、例えば：ブナミジン、ニリダゾール、レソランテル、オムファロチン、オルチプラズ、ニトロスカネート、ニトロキシニル、オキサムニキン、ミラサン (m i r a s a n)、ミラシル (m i r a c i l)、ルカントン、ヒカントン、ヘトリン (h e t o l i n)、エメチン、ジエチルカルバマジン、ジクロロフェン、ジアンフェネチド、クロナゼパム、ベフェニウム、アモスカネート (a m o s c a n a t e)、クロルスロン。

【0301】

抗原生動物活性成分としては、限定するものではないが、以下の活性成分を挙げるができる：

トリアジン類のクラスの、例えば：ジクラズリル、ボナズリル、レトラズリル、トルトラズリル；

10

20

30

40

50

ポリエーテルイオノホア類のクラスの、例えば：モネンシン、サリノマイシン、マデュラマイシン、ナラシン；

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：ミルベマイシン、エリスロマイシン；

キノロン類のクラスの、例えば：エンロフロキサシン、プラドフロキサシン；

キノニン類のクラスの、例えば：クロロキン；

ピリミジン類のクラスの、例えば：ピリメタミン；

スルホンアミド類のクラスの、例えば：スルファキノキサリン、トリメトプリム、スルファクロジン；

チアミン類のクラスの、例えば：アンプロリウム；

リンコサミド類のクラスの、例えば：クリンダマイシン；

カルバニリド類のクラスの、例えば：イミドカルブ；

ニトロフラン類のクラスの、例えば：ニフルチモクス；

キナゾリノンアルカロイド類のクラスの、例えば：ハロフギノン；

さまざまな別のクラスの、例えば：オキサムニキン、パロモマイシン；

ワクチン又は微生物の抗原のクラスの、例えば：バベシア・カニス・ロッシ (*Babesia canis rossii*)、エイメリア・テネラ (*Eimeria tenella*)、エイメリア・プラエコキス (*Eimeria praecox*)、エイメリア・ネカトリキス (*Eimeria necatrix*)、エイメリア・ミチス (*Eimeria mitis*)、エイメリア・マキシマ (*Eimeria maxima*)、エイメリア・ブルネッチ (*Eimeria brunetti*)、エイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、バベシア・カニス・ボゲリ (*Babesia canis vogeli*)、レイシュマニア・インファンツム (*Leishmania infantum*)、バベシア・カニス・カニス (*Babesia canis canis*)、ジクチオカウルス・ピピパルス (*Dictyocaulus viviparus*)。 20

【0302】

記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。

【0303】

媒介動物の防除

式 (I) で表される化合物は、媒介動物 (vector) の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体 (例えば、ウイルス類、蠕虫類 (worms)、単細胞生物及び細菌類) を病原体保有宿主 (植物、動物、ヒトなど) から宿主まで運ぶことが可能な節足動物 (特に、昆虫又はクモ形類動物) である。該病原体は、宿主まで機械的に運ばれ得る (例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ)、又は、宿主体内への注入後に運ばれ得る (例えば、蚊によるマラリア原虫)。 30

【0304】

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

(1) 蚊類

・ ハマダラカ (*Anopheles*)： マラリア、フィラリア症；

・ アカイエカ (*Culex*)： 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、別の蠕虫類の運搬； 40

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

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

・ チョウバエ (*Psychodidae*)： リーシュマニア症の伝染；

(2) シラミ類： 皮膚感染、流行性発疹チフス；

(3) ノミ類： 伝染病、発疹熱、糸虫；

(4) ハエ類： 睡眠病 (トリパノソーマ病)；コレラ、別の細菌性疾患；

(5) ダニ類： ダニ症 (*acariosis*)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリ 50

ア症 (borreliosis) ;

(6) マダニ類: ボレリア症 (borelliosis)、例えば、ライム病ボレリア (Borrelia burgdorferi sensu lato.)、ダットン回帰熱ボレリア (Borrelia duttoni)、ダニ媒介脳炎、Q熱 (Coxiella burnetii)、バベシア症 (Babesia canis canis)、エーリキア症 (ehrlichiosis)。

【0305】

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

10

【0306】

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

【0307】

式 (I) で表される化合物が抵抗性を打破する (resistance-breaking) 場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

20

【0308】

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

【0309】

工業材料の保護

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

30

【0310】

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

【0311】

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

40

【0312】

さらなる実施形態では、式 (I) で表される化合物は、即時使用可能な (ready-to-use) 殺有害生物剤の形態にある。このことは、それらが、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能であるということの意味する。有用なさらなる殺虫剤又は殺菌剤としては、特に、上記で挙げたものなどがある。

【0313】

驚くべきことに、式 (I) で表される化合物は、海水又は淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及び信号システムなどを、付着物から保護する

50

ために使用することができるということも分かった。同様に、式 (I) で表される化合物は、単独で、又は、別の活性成分と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【 0 3 1 4 】

衛生分野における害虫の防除

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

10

【 0 3 1 5 】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱 (Arachnida) のサソリ目 (Scorpiones)、クモ目 (Araneae) 及びザトウムシ目 (Opiliones) の害虫、ムカデ綱 (Chilopoda) 及びヤスデ綱 (Diplopoda) の害虫、昆虫綱 (Insecta) のゴキブリ目 (Blattodea)、コウチュウ目 (Coleoptera)、ハサミムシ目 (Dermaptera)、ハエ目 (Diptera)、カメムシ亜目 (Heteroptera)、ハチ目 (Hymenoptera)、シロアリ目 (Isoptera)、チョウ目 (Lepidoptera)、シラミ目 (Phthiraptera)、チャタテムシ目 (Psocoptera)、バッタ目 (Saltatoria 又は Orthoptera)、ノミ目 (Siphonaptera) 及びシミ目 (Zygentoma) の害虫、並びに、軟甲綱 (Malacostraca) のワラジムシ目 (Isopoda) の害虫などをあげることができる。

20

【 0 3 1 6 】

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

30

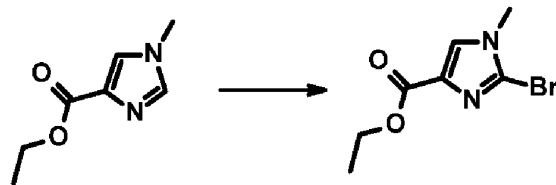
【 実施例 】

【 0 3 1 7 】

調製実施例

2 - プロモ - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチル

【 化 1 0 】



40

【 0 3 1 8 】

30 g (193.5 mmol) の 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチルを 500 mL のテトラヒドロフランに溶解させ、0 まで冷却した。この溶液に、34.5 g (193.5 mmol) の NBS を少量ずつ添加し、その反応混合物を室温で一晩

50

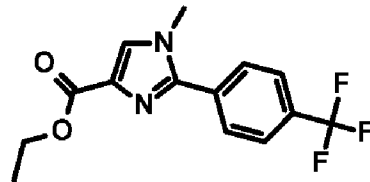
撈拌した。その反応を、飽和チオ硫酸ナトリウム溶液 (Na₂S₂O₃) を添加することによって終了させ、800 mL の酢酸エチルを添加した。相を分離し、その水相を毎回 800 mL の酢酸エチルで 3 回抽出した。その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過した。その溶媒を減圧下で留去し、その残渣を移動相として石油エーテル / 酢酸エチルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

【0319】

¹H-NMR(300 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.26 (t, 3H), 3.64 (s, 3H), 4.22 (q, 2H), 8.07 (s, 1H).

1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチル

【化11】



【0320】

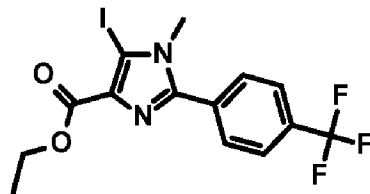
10 g (43.1 mmol) の 2 - ブロモ - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチルを 1, 2 - ジメトキシエタン (30 mL) と水 (10 mL) に溶解させた溶液に、窒素雰囲気下、3.2 g (4.4 mmol) のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、9.1 g (85.8 mmol) の炭酸ナトリウム及び 16.4 g (86.3 mmol) の (4 - トリフルオロメチル) フェニルボロン酸を添加した。その反応混合物を 80 °C で一晩撈拌した。次いで、その混合物を室温まで冷却し、毎回 100 mL の酢酸エチルで 2 回抽出した。その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過した。その溶媒を減圧下で留去し、その残渣を移動相として石油エーテル / 酢酸エチルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

【0321】

¹H-NMR(300 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.28 (t, 3H), 3.85 (s, 3H), 4.25 (q, 2H), 7.86-7.89 (m, 2H), 7.97-8.00 (m, 2H), 8.09 (s, 1H).

5 - ヨード - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチル

【化12】



【0322】

5.2 g (17.4 mmol) の 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチルを酢酸 (20 mL) に溶解させた溶液に、7.9 g (35.1 mmol) の N - ヨードスクシンイミド (NIS) を添加した。その反応混合物を室温で一晩撈拌した。次いで、その混合物を減圧下で濃縮し、飽和チオ硫酸ナトリウム溶液を添加することによって稀釈した。その pH を、飽和炭酸ナトリウム溶液を添加することによって、pH = 7 - 8 に調節した。次いで、その混合物を酢酸エチルで抽出した。その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過した。その溶媒を減圧

10

20

30

40

50

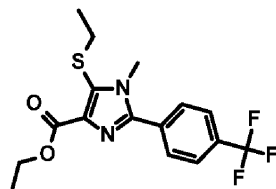
下で留去し、その残渣を移動相として石油エーテル/酢酸エチルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

【0323】

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.31 (t, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.27 (q, 2H), 7.85-7.95 (m, 4H).

5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチル

【化13】



10

【0324】

4.1 g (9.7 mmol) の 5 - ヨード - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチルを 1, 4 - ジオキサン (150 mL) に溶解させた溶液に、6.0 g (96.7 mmol) のエタンチオール、2.9 g (29.0 mmol) の N, N - ジイソプロピルエチルアミン (DIPEA)、1.5 g (1.5 mmol) の トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) - クロロホルム付加体 [$\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$] 及び 1.7 g (2.9 mmol) の Xantphos を添加した。その混合物を 80 で一晩攪拌した。次いで、その反応混合物を室温まで冷却し、その混合物に水を添加した。次いで、その混合物を酢酸エチルで 2 回抽出した。その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過した。その溶媒を減圧下で留去し、その残渣を移動相として石油エーテル/酢酸エチルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

20

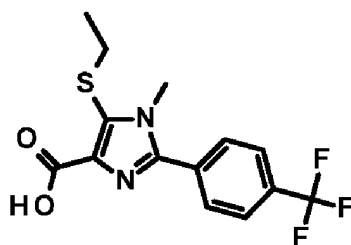
【0325】

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.15 (t, 3H), 1.31 (t, 3H), 2.92 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.28 (q, 2H), 7.88-7.99 (m, 4H).

30

5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸

【化14】



40

【0326】

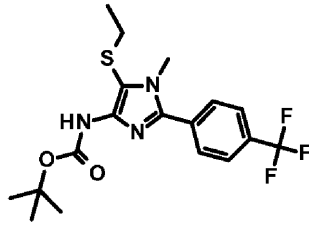
3.1 g (8.7 mmol) の 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチルをメタノール (60 mL) と水 (60 mL) に溶解させた溶液に、0.69 g (17.3 mmol) の水酸化ナトリウムを添加した。その混合物を室温で一晩攪拌した。その溶液を、濃水性塩酸を添加することによって、 $\text{pH} = 3 - 4$ に調節した。次いで、その反応混合物をクロロホルム / i - プロパノール (3 : 1) の混合物で抽出した。その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過した。その溶媒を減圧下で留去した。その残渣は、それ以上精製することなく、次の合成段階に使用した。

50

【0327】

{ 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } カルバミン酸 tert - ブチル

【化15】



10

【0328】

3.6 g (10.9 mmol) の 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸を tert - ブタノール (60 mL) に溶解させた溶液に、4.5 g (16.4 mmol) のアジドリン酸ジフェニル (DPPA) 及び 3.9 g (38.2 mmol) のトリエチルアミンを添加した。その混合物を 80 で一晩攪拌し、冷却し、減圧下で濃縮した。次いで、100 mL の水を添加し、その混合物を酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その粗製生成物を、溶離液として酢酸エチル / 石油エーテルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

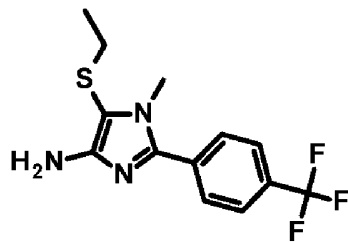
20

【0329】

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.15 (t, 3H), 1.44 (s, 9H), 2.72 (q, 2H), 3.79 (s, 3H), 7.85-7.96 (m, 4H), 8.65 (s, 1H).

5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - アミン

【化16】



30

【0330】

2.4 g (6.0 mmol) の { 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } カルバミン酸 tert - ブチルをジオキサン (40 mL) に溶解させた溶液に、40 mL の濃塩酸を添加した。その混合物を室温で一晩攪拌し、次いで、減圧下で濃縮乾燥させた。その粗製生成物は、それ以上精製することなく使用した。

40

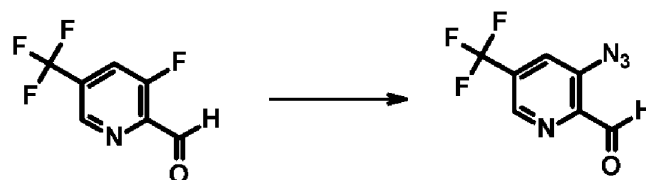
【0331】

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.15 (t, 3H), 2.58 (q, 2H), 3.68 (s, 3H), 4.81 (s, breit, 2H), 7.80-7.92 (m, 4H).

3 - アジド - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルバルデヒド

50

【化17】



【0332】

10 mLのジメチルホルムアミド（DMF）の中に1 g（5.2 mmol）の3-フルオロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-カルバルデヒドを最初に装入し、0℃まで冷却した。次いで、0.34 g（5.2 mmol、10 mLのDMFに溶解させたもの）のアジ化ナトリウムを添加し、その混合物を室温で4時間撹拌した。その反応を、100 mLの水を添加することによって、終了させた。その混合物を毎回100 mLの酢酸エチルで2回抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その粗製生成物は、それ以上精製することなく使用した。

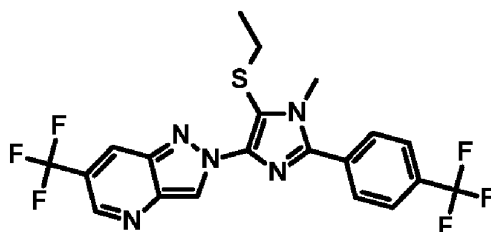
10

【0333】

2-（5-（エチルスルファニル）-1-メチル-2-〔4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-1H-イミダゾール-4-イル）-6-（トリフルオロメチル）-2H-ピラゾロ〔4,3-b〕ピリジン

20

【化18】



30

【0334】

200 mg（0.66 mmol）の5-（エチルスルファニル）-1-メチル-2-〔4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-1H-イミダゾール-4-アミンをトルエン（15 mL）に溶解させた溶液に、290 mg（1.3 mmol）の3-アジド-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-カルバルデヒド及び850 mg（2.99 mmol）のチタンイソプロポキシドを添加した。その混合物を、最初、50℃で4時間撹拌し、次いで、100℃で1時間撹拌した。室温まで冷却した後、100 mLの水を添加し、その混合物を酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その粗製生成物を、溶離液として酢酸エチル/石油エーテルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

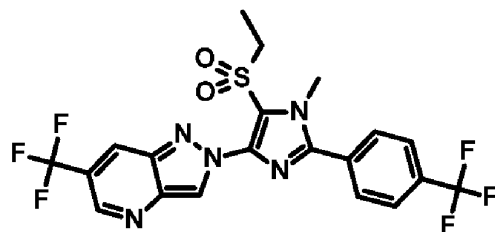
40

【0335】

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.10 (t, 3H), 2.90 (q, 2H), 3.93 (s, 3H), 7.94-7.96 (m, 2H), 8.08-8.11 (m, 2H), 8.82 (s, 1H), 8.91 (s, 1H), 9.34 (s, 1H).
2-（5-（エチルスルホニル）-1-メチル-2-〔4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-1H-イミダゾール-4-イル）-6-（トリフルオロメチル）-2H-ピラゾロ〔4,3-b〕ピリジン（I-098）

50

【化19】



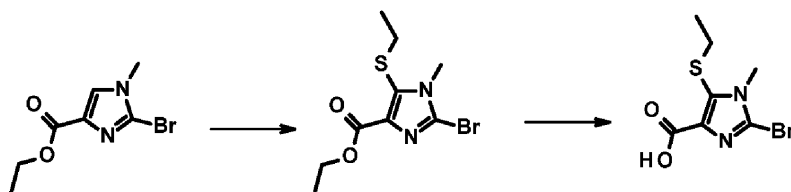
【0336】

130 mg (0.28 mmol) の 2 - { 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } - 6 - (トリフルオロメチル) - 2 H - ピラゾロ [4 , 3 - b] ピリジン をジクロロメタン (20 mL) に溶解させた溶液を 0 °C まで冷却し、100 mg (1.2 mmol、水中 35%) の過酸化水素及び 100 mg (2.9 mmol) のギ酸を添加した。その混合物を室温で 5 時間攪拌し、50 mL のジクロロメタンを添加することによって希釈し、次いで、飽和チオ硫酸ナトリウム溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄した。その有機相を分離し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その粗製生成物を、溶離液として水 / アセトニトリルの勾配を使用する分取 HPLC で精製した。

【0337】

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.33 (t, 3H), 3.79 (q, 2H), 4.00 (s, 3H), 7.98-8.00 (m, 2H), 8.06-8.09 (m, 2H), 8.84 (s, 1H), 8.93 (s, 1H), 9.36 (s, 1H).
2 - ブロモ - 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸

【化20】



【0338】

31 g (134 mmol) の 2 - ブロモ - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチル及び 24.4 g (200 mmol) のジエチルジスルフィドを 620 mL のテトラヒドロフランに溶解させ、-78 °C まで冷却した。この溶液に 100 mL (THF 中 2 M、200 mmol) のリチウムジイソプロピルアミド (LDA) を滴下して加え、その反応混合物を -78 °C で 30 分間攪拌した。その反応を、飽和塩化アンモニウム溶液を添加することによって、終了させた。相を分離し、その水相を、毎回 300 mL の酢酸エチルで 3 回抽出した。その有機相を合し、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過した。その溶媒を減圧下で留去し、その残渣を移動相として石油エーテル / 酢酸エチルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。これによって、28.5 g (97.3 mmol) の 2 - ブロモ - 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチルが得られた。これを、300 mL のメタノールに溶解させ、その溶液を 0 °C まで冷却した。次いで、300 mL (水中 2 N、600 mmol) の水酸化ナトリウムを添加し、その混合物を室温で 1 時間攪拌した。その混合物をロータリーエバポレーターで濃縮し、1 N HCl を添加することによって中和した。その混合物を酢酸エチルで抽出した。その溶媒を減圧下で留去して、目標化合物が得られた。

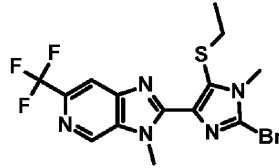
【0339】

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.09 (t, 3H), 2.86 (q, 2H), 3.64 (s, 3H),

12.60 (s, 1H).

2 - [2 - プロモ - 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 1 0)

【化 2 1】



10

【 0 3 4 0 】

9.02 g (34.0 mmol) の 2 - プロモ - 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸をピリジン (5 0 m L) に溶解させた溶液に、5.00 g (26.1 mmol) の N³ - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 , 4 - ジアミン及び 5.01 g (26.1 mmol) の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (E D C I) を添加した。その混合物を室温で 3 日間攪拌した。次いで、溶媒を減圧下で留去し、その残渣を取って酢酸エチル (5 0 m L) の中に入れた。その混合物を 1 0 0 で 6 時間攪拌し、室温まで冷却し、水を用いて懸濁させ、次いで、Nutsche フィルターで濾過し、乾燥させて、目標化合物が得られた。

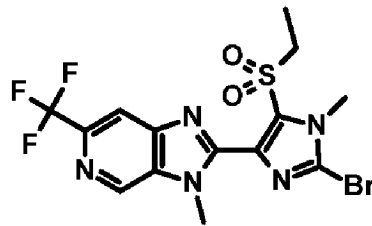
20

【 0 3 4 1 】

¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.11 (t, 3H), 3.00 (q, 2H), 3.76 (s, 3H), 4.15 (s, 3H), 8.19 (s, 1H), 9.15 (s, 1H).

2 - [2 - プロモ - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 0 4)

【化 2 2】



30

【 0 3 4 2 】

10.3 g (24.5 mmol) の 2 - [2 - プロモ - 5 - (エチルスルファニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジンをジクロロメタン (1 0 0 m L) に溶解させた溶液に、4.64 mL (122 mmol) のギ酸及び 15.1 mL (172 mmol、水中 35%) の過酸化水素を添加した。その混合物を室温で一晩攪拌し、そして、その反応を、飽和チオ硫酸ナトリウム溶液を添加することによって終了させた。その有機相を分離し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過して、目標化合物が得られた。

40

【 0 3 4 3 】

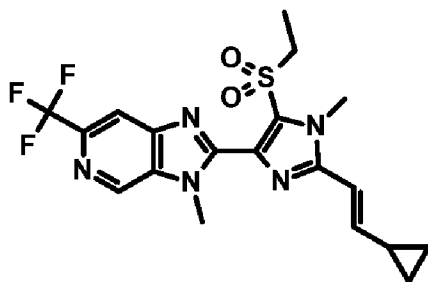
¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.27 (t, 3H), 3.74 (q, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 8.24 (s, 1H), 9.22 (s, 1H).

2 - { 2 - [(E) - 2 - シクロプロピルビニル] - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メ

50

チル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 0 7)

【化 2 3】



10

【 0 3 4 4 】

保護ガス雰囲気下、150 mg (0.33 mmol) の 2 - [2 - ブロモ - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 0 4)、64.4 mg (0.33 mmol) の 2 - [(E) - 2 - シクロプロピルビニル] - 4 , 4 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 , 3 , 2 - ジオキサボロラン及び 11.5 mg (0.01 mmol) のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムを最初に装入した。次いで、2.6 mL の脱ガスしたジオキサソラン及び 1.3 mL の脱ガスした炭酸ナトリウム水溶液 (1 M) を添加した。その混合物を 92 で一晩攪拌した。冷却後、溶媒を減圧下で留去した。その残渣を取ってジクロロメタンの中に入れ、水で洗浄した。その有機相を分離し、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で留去した。その粗製生成物を、溶離液としてシクロヘキサン/アセトンの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

20

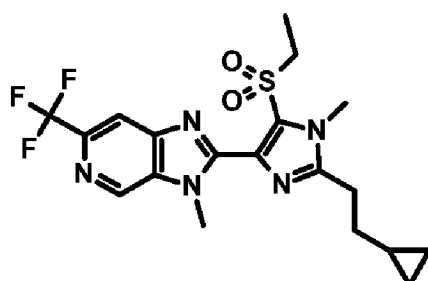
【 0 3 4 5 】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 0.64-0.68 (m, 2H), 0.90-0.95 (m, 2H), 1.24 (t, 3H), 1.73-1.77 (m, 1H), 3.65 (q, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 6.38-6.44 (m, 1H), 6.75 (d, 1H), 8.22 (s, 1H), 9.20 (s, 1H).

2 - [2 - (2 - シクロプロピルエチル) - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 8 5)

30

【化 2 4】



40

【 0 3 4 6 】

オートクレーブの中に、10 mL のメタノールの中の 179 mg (0.40 mmol) の 2 - { 2 - [(E) - 2 - シクロプロピルビニル] - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 0 7) を最初に装入した。次いで、50 mg (0.04 mmol, 10%) の炭素担持パラジウムを添加し、その混合物を、5 bar の水素雰囲気下で、16 時間攪拌した。圧力を一様にして水素雰囲気を除去した後、そ

50

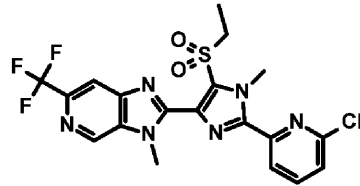
の混合物をセライトで濾過し、溶媒を減圧下で留去した。その粗製生成物を、溶離液としてシクロヘキサン/アセトンの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

【0347】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 0.04-0.08 (m, 2H), 0.40-0.44 (m, 2H), 0.80-0.85 (m, 1H), 1.26 (t, 3H), 1.64-1.70 (m, 2H), 2.94 (t, 2H), 3.69 (q, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 8.21 (s, 1H), 9.19 (s, 1H).

2 - [2 - (6 - クロロピリジン - 2 - イル) - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 1 4)

【化25】



10

【0348】

保護ガス雰囲気下、脱ガスしたジオキサン (4 mL) の中に、200 mg (0.44 mmol) の 2 - [2 - プロモ - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 0 4)、267 mg (0.66 mmol) の 2 - クロロ - 6 - (トリブチルスタンニル) ピリジン、56 mg (1.32 mmol) の塩化リチウム、8 mg (0.04 mmol) のヨウ化銅 (I) 及び 102 mg (0.08 mmol) のテトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウムを最初に装入した。その混合物を 96 で一晩攪拌した。冷却後、その混合物をジクロロメタンで稀釈し、水で洗浄した。その有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で留去した。その粗製生成物を、溶離液として水/アセトニトリルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

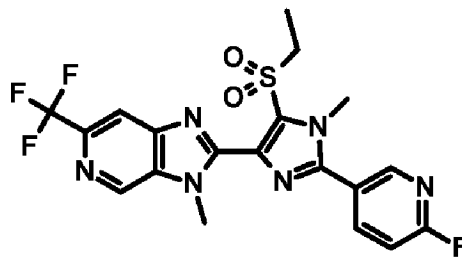
20

【0349】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.30 (t, 3H), 3.78 (q, 2H), 4.00 (s, 3H), 4.32 (s, 3H), 7.74 (d, 1H), 8.09-8.13 (m, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.26 (s, 1H), 9.23 (s, 1H).

2 - [5 - (エチルスルホニル) - 2 - (6 - フルオロピリジン - 3 - イル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (I - 0 1 9)

【化26】



40

【0350】

保護ガス雰囲気下、脱ガスしたジオキサン (4 mL) と脱ガスした炭酸ナトリウム水溶液 (1 M、1.8 mL) の混合物の中に、200 mg (0.44 mmol) の 2 - [2 - プ

50

口モ - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン (I - 004)、62 mg (0.44 mmol) の (6 - フルオロピリジン - 3 - イル) ボロン酸及び 15 mg (0.01 mmol) のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムを最初に装入した。その混合物を 96 で一晩攪拌した。冷却後、その混合物をジクロロメタンで稀釈し、水で洗浄した。その有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で留去した。その粗製生成物を、溶離液としてシクロヘキサン / アセトンの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

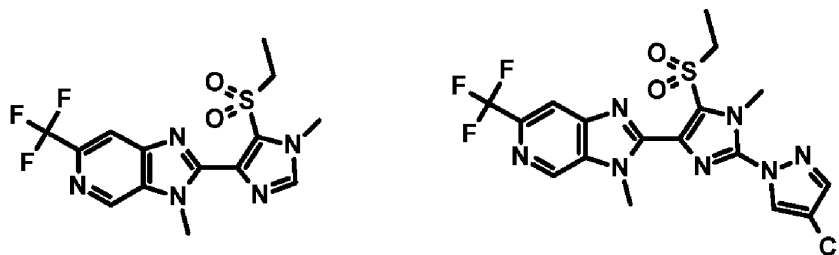
【0351】

¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.33 (t, 3H), 3.82 (q, 2H), 3.98 (s, 3H), 4.02 (s, 3H), 7.45-7.48 (m, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.44-8.48 (m, 1H), 8.71-8.72 (m, 1H), 9.23 (s, 1H).

10

2 - [5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン (I - 029)、及び、2 - [2 - (4 - クロロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン (I - 027)

【化27】



20

【0352】

保護ガス雰囲気下、脱ガスしたジオキサン (2 mL) の中に、200 mg (0.44 mmol) の 2 - [2 - ブロモ - 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン (I - 004)、45 mg (0.44 mmol) の 4 - クロロ - 1 H - ピラゾール、4 mg (0.02 mmol) のヨウ化銅 (I)、128 mg (0.92 mmol) の炭酸カリウム及び 13 mg (0.08 mmol) のトランス - N, N' - ジメチルシクロヘキサン - 1, 2 - ジアミン (ラセミ化合物) を最初に装入した。その混合物を 96 で一晩攪拌した。冷却後、その混合物をジクロロメタンで稀釈し、水で洗浄した。その有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で留去した。その粗製生成物を分離し、溶離液として水 / アセトニトリルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

30

【0353】

I-029: ¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.27 (t, 3H), 3.80 (q, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.99 (s, 3H), 8.23 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 9.21 (s, 1H).

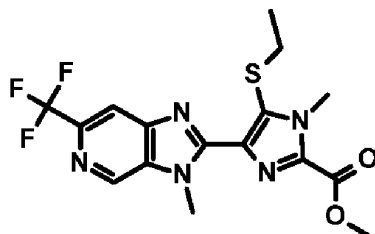
I-027: ¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.32 (t, 3H), 3.83 (q, 2H), 3.99 (s, 3H), 4.01 (s, 3H), 8.17 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 9.24 (s, 1H).

5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリジン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸メチル (I - 035)

40

50

【化28】



【0354】

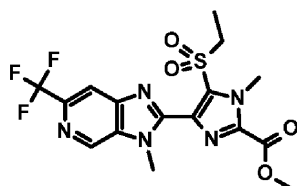
600 mL容オートクレーブ容器の中に、メタノール(458 mL)の中の4.58 g (10.8 mmol)の2-[2-ブromo-5-(エチルスルファニル)-1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル]-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン(I-010)を最初に装入した。次いで、1.67 g (20.3 mmol)の酢酸ナトリウム及び861 mg (1.09 mmol)のジクロロ[(ピスジフェニルホスフィノ)フェロセニル]パラジウム(II)-アセトン錯体を添加した。その反応混合物を、5 barの一酸化炭素雰囲気下、50℃で24時間カルボニル化した。室温まで冷却し、圧力を一様にして一酸化炭素雰囲気を除去した後、その混合物をセライトで濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その粗製生成物を、溶離液としてシクロヘキサン/アセトンの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

【0355】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.10 (t, 3H), 3.04 (q, 2H), 3.92 (s, 3H), 4.08 (s, 3H), 4.18 (s, 3H), 8.22 (s, 1H), 9.17 (s, 1H).

5-(エチルスルホニル)-1-メチル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-1H-イミダゾール-2-カルボン酸メチル(I-036)

【化29】



【0356】

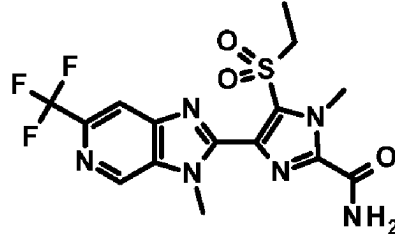
1.60 g (3.44 mmol)の5-(エチルスルファニル)-1-メチル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-1H-イミダゾール-2-カルボン酸メチル(I-035)をジクロロメタン(80 mL)に溶解させた溶液に、0.7 mL (17.2 mmol)のギ酸及び2.1 mL (24.1 mmol、水中35%)の過酸化水素を添加した。その混合物を室温で一晩攪拌し、その反応を、飽和チオ硫酸ナトリウム溶液を添加することによって終了させた。その有機相を分離し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。その粗製生成物を、溶離液としてシクロヘキサン/アセトンの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

【0357】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.27 (t, 3H), 3.76 (q, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 4.24 (s, 3H), 8.26 (s, 1H), 9.23 (s, 1H).

5-(エチルスルホニル)-1-メチル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-1H-イミダゾール-2-カルボキサミド(I-038)

【化30】



【0358】

300 mg (0.69 mmol) の 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸メチル (I - 036) をメタノール (15 mL) とテトラヒドロフラン (15 mL) に溶解させた溶液に、474 mg (6.95 mmol、25%) のアンモニアを添加した。その混合物を室温で一晩攪拌し、そして、その混合物を減圧下で濃縮乾燥させることによって、当該生成物が得られた。

10

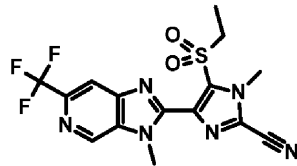
【0359】

¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.27 (t, 3H), 3.75 (q, 2H), 3.98 (s, 3H), 4.28 (s, 3H), 8.02 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 9.24 (s, 1H).

5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボニトリル (I - 045)

20

【化31】



【0360】

100 mg (0.24 mmol) の 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド (I - 038) を塩化ホスホリル (2 mL) に溶解させた溶液を室温で3日間攪拌し、次いで、濃縮乾燥させた。その粗製生成物を、溶離液として水/アセトニトリルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

30

【0361】

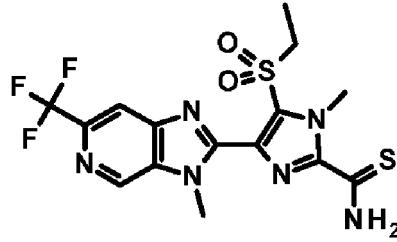
¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) ppm: 1.30 (t, 3H), 3.86 (q, 2H), 4.00 (s, 3H), 4.09 (s, 3H), 8.28 (s, 1H), 9.25 (s, 1H).

5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボチオアミド (I - 046)

40

50

【化 3 2】



【0362】

保護ガス雰囲気下、100 mg (0.24 mmol) の 5 - (エチルスルホニル) - 1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド (I - 038) をトルエン (1 mL) に溶解させた溶液に、107 mg (0.26 mmol) の 2 , 4 - ビス (4 - メトキシフェニル) - 1 , 3 , 2 , 4 - ジチアジホスフェタン 2 , 4 - ジスルフィド (ローソン 試薬) を添加した。その混合物を沸点まで 4 時間加熱し、室温まで冷却し、減圧下で濃縮した。その残渣を取ってジクロロメタンの中に入れ、水で洗浄した。その有機相を分離し、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で留去した。その粗製生成物を、溶離液として水 / アセトニトリルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製で、精製した。

【0363】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) ppm: 1.29 (t, 3H), 3.81 (q, 2H), 3.99 (s, 3H), 4.14 (s, 3H), 8.25 (s, 1H), 9.23 (s, 1H), 10.10 (s, 1H), 10.60 (s, 1H).

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

【表 1】

選択された実施例の NMR データ

実施例	構造	NMR-データ
I-001		I-001: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.2252 (4.0); 8.2462 (4.2); 4.3983 (0.7); 4.3809 (2.5); 4.3630 (2.5); 4.3454 (0.7); 3.9902 (1.0); 3.9806 (16.0); 3.8342 (1.0); 3.8155 (3.4); 3.7971 (3.5); 3.7785 (1.0); 3.3207 (58.6); 2.6751 (0.6); 2.6710 (0.8); 2.6666 (0.6); 2.5239 (1.8); 2.5062 (103.1); 2.5018 (132.5); 2.4974 (94.1); 2.3328 (0.6); 2.3285 (0.8); 2.3241 (0.6); 2.0859 (1.6); 1.4434 (2.8); 1.4256 (6.4); 1.4079 (2.8); 1.3981 (0.6); 1.2976 (3.6); 1.2791 (8.0); 1.2606 (3.6); -0.0002 (2.5)

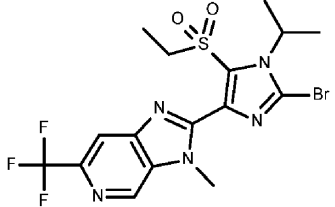
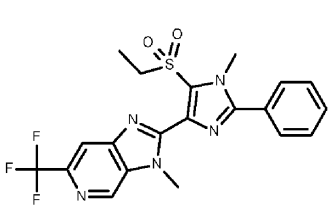
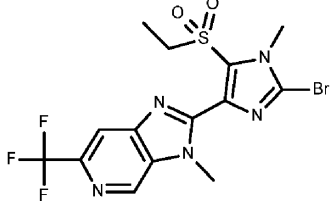
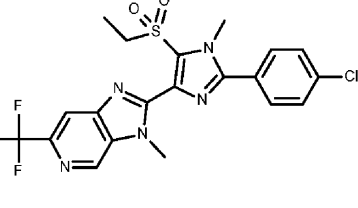
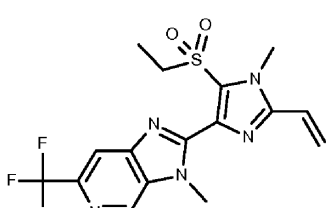
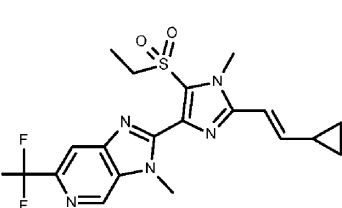
10

20

30

40

50

I-002		I-002: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2149 (4.0); 8.2339 (4.1); 5.7577 (3.7); 5.3553 (0.4); 5.3391 (0.5); 5.3230 (0.4); 3.9373 (0.8); 3.9233 (16.0); 3.7686 (0.9); 3.7018 (0.9); 3.6835 (3.1); 3.6650 (3.1); 3.6466 (1.0); 3.3216 (11.2); 2.6711 (0.4); 2.5241 (0.8); 2.5105 (21.8); 2.5064 (45.3); 2.5019 (60.5); 2.4975 (43.6); 2.4932 (21.0); 2.3284 (0.3); 1.7121 (13.2); 1.6946 (13.1); 1.6838 (1.2); 1.6768 (0.8); 1.6592 (0.7); 1.3113 (0.4); 1.3014 (3.7); 1.2926 (0.8); 1.2831 (8.2); 1.2645 (3.6); 0.0080 (0.4); -0.0002 (10.9); -0.0082 (0.4)
I-003		I-003: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2238 (3.8); 8.2524 (4.0); 7.8336 (1.9); 7.8272 (2.0); 7.8222 (1.8); 7.8185 (2.4); 7.8096 (2.2); 7.6269 (0.6); 7.6176 (4.8); 7.6103 (4.4); 7.6015 (3.5); 4.0147 (16.0); 3.9689 (14.7); 3.8366 (1.0); 3.8183 (3.3); 3.7998 (3.3); 3.7813 (1.0); 3.3211 (76.3); 2.6747 (0.7); 2.6704 (1.0); 2.6660 (0.7); 2.5237 (2.5); 2.5102 (65.5); 2.5059 (131.9); 2.5014 (170.9); 2.4969 (121.6); 2.4926 (57.9); 2.3327 (0.7); 2.3280 (1.0); 2.3239 (0.7); 2.0857 (2.3); 1.3976 (1.1); 1.3433 (3.6); 1.3248 (8.1); 1.3063 (3.5); 0.0079 (0.7); -0.0001 (19.4); -0.0083 (0.7)
I-004		I-004: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2198 (3.9); 8.2438 (4.2); 5.7557 (3.7); 3.9590 (16.0); 3.9230 (15.3); 3.9115 (0.9); 3.8423 (0.7); 3.8249 (0.8); 3.8058 (0.6); 3.7669 (1.1); 3.7484 (3.5); 3.7299 (3.5); 3.7115 (1.1); 3.3226 (12.4); 2.6711 (0.3); 2.5067 (48.0); 2.5023 (61.6); 2.4979 (43.8); 2.3290 (0.4); 1.2911 (3.7); 1.2727 (8.2); 1.2542 (3.7); 1.2065 (0.5); 1.1829 (0.5); 0.0077 (1.0); -0.0002 (22.7); -0.0084 (0.9)
I-005		I-005: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2227 (3.5); 8.2512 (3.8); 7.9251 (1.1); 7.8688 (3.3); 7.8476 (4.1); 7.8155 (0.4); 7.6925 (4.2); 7.6712 (3.3); 7.5936 (0.4); 7.5718 (0.4); 4.0299 (1.6); 4.0200 (1.6); 4.0087 (12.7); 3.9628 (11.9); 3.8289 (1.0); 3.8194 (0.4); 3.8090 (2.9); 3.7904 (2.9); 3.7717 (0.9); 3.3197 (71.6); 2.6748 (1.6); 2.6701 (2.0); 2.5233 (5.1); 2.5056 (272.2); 2.5013 (357.5); 2.4970 (260.8); 2.3281 (2.0); 2.3238 (1.5); 1.3976 (16.0); 1.3557 (0.5); 1.3406 (3.2); 1.3223 (6.7); 1.3039 (2.9); -0.0003 (11.3)
I-006		I-006: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2126 (3.7); 8.2339 (4.0); 7.0471 (1.1); 7.0195 (1.2); 7.0048 (1.4); 6.9770 (1.4); 6.3732 (1.5); 6.3692 (1.5); 6.3309 (1.3); 6.3267 (1.2); 5.7904 (1.5); 5.7862 (1.4); 5.7629 (1.3); 5.7589 (1.4); 3.9705 (14.8); 3.9597 (16.0); 3.7234 (0.9); 3.7047 (3.3); 3.6862 (3.4); 3.6676 (1.0); 3.3193 (83.1); 2.6742 (1.8); 2.6698 (2.4); 2.6652 (1.8); 2.5233 (5.8); 2.5096 (158.0); 2.5054 (323.4); 2.5010 (427.3); 2.4965 (302.6); 2.4921 (142.4); 2.4433 (0.4); 2.4394 (0.4); 2.3323 (1.8); 2.3278 (2.4); 2.3232 (1.8); 2.0855 (0.8); 1.3976 (1.2); 1.2718 (3.6); 1.2535 (7.9); 1.2349 (3.6); 0.0082 (0.5); -0.0002 (15.4)
I-007		I-007: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.1990 (4.0); 8.2199 (4.2); 6.7627 (2.2); 6.7246 (2.8); 6.4410 (1.4); 6.4163 (1.4); 6.4029 (1.1); 6.3782 (1.1); 3.9323 (16.0); 3.9230 (14.4); 3.6798 (1.0); 3.6613 (3.2); 3.6429 (3.3); 3.6246 (1.0); 3.3239 (13.2); 2.5249 (0.4); 2.5111 (12.1); 2.5070 (25.0); 2.5026 (32.9); 2.4982 (23.6); 2.0864 (9.5); 1.7726 (0.4); 1.7628 (0.6); 1.7505 (0.6); 1.7383 (0.6); 1.7285 (0.4); 1.2560 (3.6); 1.2375 (7.9); 1.2191 (3.4); 0.9453 (0.5); 0.9344 (1.7); 0.9284 (1.9); 0.9146 (1.7); 0.9087 (1.8); 0.8988 (0.6); 0.6748 (0.7); 0.6645 (2.2); 0.6594 (2.0); 0.6537 (2.0); 0.6482 (2.2); 0.6375 (0.6); -0.0002 (1.3)

10

20

30

40

50

I-008		I-008: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2074 (3.2); 8.2281 (3.4); 5.7620 (2.0); 5.5708 (2.6); 3.9590 (15.7); 3.9559 (16.0); 3.7603 (0.8); 3.7418 (2.8); 3.7233 (2.9); 3.7048 (0.8); 3.3249 (18.0); 2.5069 (34.0); 2.5025 (44.1); 2.4980 (31.3); 2.1750 (8.0); 1.3973 (2.1); 1.2955 (3.1); 1.2771 (6.8); 1.2586 (3.0); -0.0002 (1.2)
I-009		I-009: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3130 (0.4); 9.2253 (4.0); 8.3170 (0.4); 8.2511 (4.3); 7.8079 (0.4); 7.7986 (1.8); 7.7934 (2.4); 7.7839 (2.4); 7.7743 (2.5); 7.6264 (5.2); 7.6212 (4.8); 7.6128 (2.8); 7.6099 (2.7); 7.6001 (0.8); 7.5848 (0.4); 6.7556 (0.4); 4.4391 (0.8); 4.4217 (2.4); 4.4034 (2.4); 4.3849 (0.8); 4.0574 (0.4); 4.0416 (16.0); 3.9029 (0.9); 3.8841 (3.3); 3.8654 (3.4); 3.8476 (1.1); 3.3224 (556.8); 3.2801 (0.5); 3.2713 (0.3); 2.7960 (0.4); 2.6748 (2.7); 2.6702 (3.6); 2.6662 (2.7); 2.6014 (0.4); 2.5908 (0.4); 2.5234 (9.8); 2.5098 (242.5); 2.5056 (497.9); 2.5012 (660.9); 2.4967 (472.9); 2.4925 (226.2); 2.4320 (0.5); 2.3324 (2.7); 2.3276 (3.7); 2.3232 (2.9); 2.0855 (0.4); 1.3975 (7.6); 1.3462 (3.7); 1.3357 (3.2); 1.3279 (8.6); 1.3183 (6.8); 1.3094 (4.2); 1.3001 (2.8); -0.0003 (9.1)
I-010		I-010: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.1511 (3.2); 8.1914 (3.5); 7.4806 (2.7); 7.4604 (3.0); 7.1198 (2.4); 7.1003 (2.1); 4.1488 (16.0); 4.0780 (2.0); 4.0728 (2.0); 4.0610 (2.0); 3.9789 (0.4); 3.9691 (0.3); 3.7605 (14.4); 3.6389 (1.2); 3.5999 (0.9); 3.0286 (1.2); 3.0102 (3.8); 2.9918 (3.9); 2.9734 (1.2); 2.6757 (0.4); 2.6711 (0.6); 2.6665 (0.5); 2.6620 (0.4); 2.5243 (1.3); 2.5195 (2.1); 2.5108 (40.7); 2.5064 (85.7); 2.5019 (114.5); 2.4973 (81.2); 2.4929 (38.0); 2.3332 (0.5); 2.3286 (0.7); 2.3240 (0.5); 2.2875 (9.0); 1.2350 (0.3); 1.1230 (4.1); 1.1144 (0.6); 1.1046 (8.9); 1.0862 (4.1); 1.0701 (0.4); 0.0080 (0.9); -0.0002 (29.8); -0.0084 (1.0)
I-011		I-011: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.6529 (0.3); 9.2242 (3.9); 8.2496 (4.4); 7.8575 (0.3); 7.8422 (3.5); 7.8211 (4.7); 7.7000 (4.7); 7.6785 (3.5); 7.1755 (0.3); 4.4313 (0.8); 4.4132 (2.3); 4.3953 (2.2); 4.3791 (0.7); 4.0585 (0.5); 4.0366 (14.0); 3.8951 (1.1); 3.8775 (3.1); 3.8591 (3.1); 3.8419 (1.0); 3.3660 (0.4); 3.3210 (247.6); 2.6704 (3.5); 2.5054 (493.7); 2.5013 (632.5); 2.4970 (457.0); 2.4121 (0.5); 2.3279 (3.7); 1.3977 (16.0); 1.3447 (3.8); 1.3380 (3.1); 1.3266 (8.3); 1.3199 (6.5); 1.3080 (4.1); 1.3026 (3.0); 1.2381 (0.4); 1.1623 (0.4); -0.0002 (7.9); -3.5554 (0.4)
I-012		I-012: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2102 (4.5); 8.2355 (5.0); 7.6806 (2.7); 7.6643 (3.6); 7.6604 (3.3); 7.6397 (0.5); 7.6202 (1.7); 7.5980 (4.5); 7.5792 (3.0); 7.5619 (0.8); 5.1080 (0.4); 5.0899 (0.8); 5.0727 (1.1); 5.0541 (0.8); 5.0380 (0.4); 3.9696 (16.0); 3.9373 (0.8); 3.8274 (1.1); 3.8093 (3.5); 3.7906 (3.5); 3.7717 (1.1); 3.3205 (82.5); 2.6707 (2.0); 2.5057 (290.3); 2.5018 (356.2); 2.4980 (261.7); 2.3285 (2.1); 1.6768 (0.6); 1.6599 (0.6); 1.4621 (11.6); 1.4446 (11.3); 1.3984 (2.4); 1.3464 (3.9); 1.3279 (8.0); 1.3093 (3.8); 1.2935 (0.5); 1.2745 (0.4); 0.0001 (3.3)
I-013		I-013: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2380 (5.1); 8.7929 (0.9); 8.2597 (5.5); 8.1737 (0.9); 8.0673 (1.1); 8.0484 (1.9); 8.0295 (0.9); 7.5984 (1.2); 5.7570 (3.6); 4.3529 (16.0); 4.0056 (13.1); 3.8065 (1.3); 3.7881 (4.0); 3.7696 (4.1); 3.7512 (1.3); 3.3210 (15.0); 2.6707 (0.9); 2.5060 (132.9); 2.5022 (163.4); 2.4984 (125.2); 2.3289 (0.9); 1.3200 (4.4); 1.3016 (9.3); 1.2833 (4.3); -0.0002 (32.2)
I-014		I-014: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2382 (3.6); 8.2618 (3.9); 8.1909 (1.6); 8.1716 (2.7); 8.1252 (1.6); 8.1056 (2.6); 8.0860 (1.1); 7.7476 (2.2); 7.7280 (2.0); 4.3197 (12.7); 3.9948 (13.4); 3.8026 (0.9); 3.7843 (2.9); 3.7658 (2.9); 3.7474 (0.9); 3.3218 (11.0); 2.6715 (0.3); 2.5066 (46.0); 2.5024 (59.6); 2.4982 (42.9); 2.3289 (0.3); 2.0862 (16.0); 1.3162 (3.1); 1.2978 (6.9); 1.2794 (3.1); 0.0079 (0.8); -0.0002 (23.2)

10

20

30

40

50

I-015		I-015: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2391 (4.5); 8.8599 (2.2); 8.2600 (4.7); 8.2207 (0.7); 8.1987 (3.4); 8.1908 (3.6); 8.1857 (2.9); 8.1695 (0.8); 8.1637 (0.7); 5.7572 (2.4); 4.3271 (15.7); 4.0021 (16.0); 3.8083 (1.2); 3.7895 (3.7); 3.7710 (3.7); 3.7527 (1.3); 3.3214 (12.0); 2.6712 (0.6); 2.5063 (99.7); 2.5021 (115.7); 2.3289 (0.6); 1.3177 (4.1); 1.2992 (8.8); 1.2809 (4.2); 1.2330 (0.3); 0.8787 (0.5); 0.8599 (0.9); 0.8418 (0.4); -0.0002 (22.9)
I-016		I-016: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2298 (3.8); 9.0179 (2.0); 9.0139 (2.0); 8.7983 (1.3); 8.7946 (1.4); 8.7862 (1.4); 8.7825 (1.4); 8.2796 (0.9); 8.2749 (1.3); 8.2700 (0.9); 8.2560 (5.1); 8.2504 (1.1); 7.6634 (1.1); 7.6511 (1.2); 7.6449 (1.2); 7.6313 (1.2); 4.0238 (16.0); 3.9926 (14.6); 3.8476 (1.0); 3.8292 (3.2); 3.8107 (3.4); 3.7922 (1.0); 3.3393 (38.5); 3.3353 (35.9); 2.5256 (0.6); 2.5121 (14.0); 2.5079 (28.5); 2.5034 (37.6); 2.4989 (26.9); 2.4946 (12.8); 2.0868 (2.1); 1.3539 (3.6); 1.3354 (8.1); 1.3169 (3.5); 0.0079 (0.7); -0.0002 (18.4); -0.0085 (0.6)
I-017		I-017: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2312 (3.7); 9.2143 (0.8); 8.9740 (2.3); 8.9490 (2.2); 8.8890 (1.3); 8.8745 (1.3); 8.8688 (1.3); 8.8547 (1.1); 8.2605 (4.0); 8.2407 (0.8); 8.1279 (0.4); 7.6866 (1.2); 7.6722 (1.2); 7.6614 (1.2); 7.6468 (1.2); 4.0277 (14.2); 4.0130 (2.9); 3.9003 (1.0); 3.8760 (8.3); 3.8732 (8.0); 3.8633 (3.4); 3.8444 (1.0); 3.8117 (0.6); 3.7930 (0.6); 3.7738 (2.8); 3.5678 (0.7); 3.3197 (31.4); 2.6708 (1.2); 2.5538 (0.4); 2.5058 (164.9); 2.5014 (213.3); 2.4971 (152.7); 2.3327 (0.9); 2.3282 (1.2); 2.1171 (0.5); 2.0857 (16.0); 1.3516 (3.4); 1.3332 (7.2); 1.3147 (3.3); 1.3022 (1.5); 1.2838 (0.7); 1.2325 (0.4); 1.1401 (1.1); -0.0002 (6.1)
I-018		I-018: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2336 (3.4); 8.9027 (1.6); 8.8989 (2.7); 8.8954 (1.5); 8.8352 (2.4); 8.8283 (2.5); 8.2784 (0.8); 8.2739 (1.0); 8.2715 (1.0); 8.2671 (0.9); 8.2594 (3.7); 8.2502 (1.1); 8.2477 (1.0); 8.2434 (0.8); 4.0247 (14.1); 4.0095 (13.0); 3.8553 (0.8); 3.8368 (2.8); 3.8183 (2.9); 3.7998 (0.9); 3.3232 (43.6); 2.6709 (0.4); 2.5244 (0.9); 2.5108 (24.0); 2.5064 (49.4); 2.5020 (65.1); 2.4974 (46.3); 2.4931 (22.0); 2.3287 (0.4); 2.0861 (16.0); 1.3563 (3.1); 1.3379 (7.0); 1.3194 (3.0); 0.0080 (1.0); -0.0002 (31.4); -0.0085 (1.2)
I-019		I-019: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2287 (3.9); 8.7155 (2.2); 8.7095 (2.2); 8.4838 (0.8); 8.4775 (0.8); 8.4630 (1.3); 8.4567 (1.2); 8.4430 (0.8); 8.4367 (0.8); 8.2555 (4.2); 7.4791 (1.3); 7.4727 (1.3); 7.4576 (1.4); 7.4509 (1.3); 5.7571 (7.6); 4.0202 (16.0); 3.9776 (15.0); 3.9666 (0.8); 3.8441 (1.1); 3.8257 (3.4); 3.8072 (3.4); 3.7887 (1.0); 3.5682 (0.5); 3.3238 (28.0); 2.5248 (0.8); 2.5112 (19.0); 2.5069 (38.3); 2.5024 (50.1); 2.4979 (35.2); 2.4936 (16.4); 2.0863 (12.6); 1.3970 (4.4); 1.3527 (3.7); 1.3343 (8.3); 1.3158 (3.6); 0.0078 (1.9); -0.0002 (52.1); -0.0085 (1.9)
I-020		I-020: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2286 (4.4); 8.5346 (1.5); 8.5239 (1.5); 8.4136 (0.8); 8.4093 (0.7); 8.3946 (1.0); 8.3901 (1.5); 8.3712 (0.8); 8.3663 (0.7); 8.2586 (4.8); 7.6637 (0.9); 7.6597 (0.9); 7.6464 (1.4); 7.6411 (0.9); 7.6327 (0.9); 7.6287 (0.8); 5.7576 (3.8); 4.0216 (16.0); 3.8934 (1.1); 3.8711 (11.1); 3.8568 (3.8); 3.8383 (1.2); 3.3211 (8.1); 2.6712 (0.3); 2.5063 (46.0); 2.5023 (57.6); 2.4982 (41.5); 1.3500 (3.8); 1.3316 (8.1); 1.3131 (3.6); -0.0002 (3.7)
I-021		I-021: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2324 (3.7); 8.8336 (3.3); 8.8188 (3.2); 8.7363 (0.3); 8.2594 (4.0); 7.8561 (3.7); 7.8525 (2.3); 7.8411 (3.8); 7.8317 (0.3); 7.8269 (0.4); 4.0294 (13.0); 4.0145 (13.8); 3.8476 (1.0); 3.8292 (3.0); 3.8107 (3.0); 3.7922 (0.9); 3.3240 (9.0); 2.5070 (30.7); 2.5027 (39.5); 2.4983 (28.0); 2.0864 (16.0); 1.3492 (3.2); 1.3308 (7.1); 1.3123 (3.2); 0.0077 (0.6); - 0.0002 (17.3); -0.0085 (0.6)

10

20

30

40

50

I-022		I-022: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2357 (4.0); 8.5035 (2.4); 8.4906 (2.5); 8.2620 (4.3); 7.8315 (1.6); 7.8224 (1.1); 7.8187 (1.5); 7.8149 (1.0); 7.6839 (2.9); 4.0455 (14.9); 4.0151 (16.0); 3.8530 (1.0); 3.8345 (3.4); 3.8159 (3.4); 3.7973 (1.2); 3.3245 (76.2); 2.6755 (0.4); 2.6709 (0.5); 2.6666 (0.4); 2.5241 (1.5); 2.5106 (36.4); 2.5064 (73.1); 2.5020 (95.8); 2.4975 (68.1); 2.4933 (32.4); 2.3331 (0.4); 2.3289 (0.6); 1.3511 (3.6); 1.3327 (8.2); 1.3142 (3.6); -0.0002 (9.6); -0.0083 (0.4)
I-023		I-023: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4033 (5.5); 9.2790 (12.1); 9.2360 (3.8); 8.2618 (4.1); 4.0338 (15.2); 4.0290 (16.0); 3.9942 (0.7); 3.9648 (0.4); 3.8588 (0.9); 3.8404 (3.1); 3.8218 (3.1); 3.8035 (1.0); 3.3225 (17.3); 2.5245 (0.8); 2.5066 (43.2); 2.5022 (56.3); 2.4979 (40.0); 2.0861 (12.2); 1.3593 (3.3); 1.3409 (7.4); 1.3225 (3.2); 0.0079 (0.8); -0.0002 (23.5); -0.0083 (0.8)
I-024		I-024: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2120 (4.6); 8.2319 (4.9); 3.9600 (16.0); 3.9415 (15.1); 3.8008 (1.2); 3.7824 (3.8); 3.7639 (3.8); 3.7456 (1.2); 3.3197 (31.4); 2.6706 (0.4); 2.5019 (65.6); 2.3287 (0.4); 2.0859 (1.6); 1.7846 (0.4); 1.7717 (0.7); 1.7637 (0.8); 1.7513 (1.5); 1.7389 (0.9); 1.7309 (0.8); 1.7181 (0.4); 1.2784 (3.9); 1.2600 (8.2); 1.2416 (3.9); 1.0626 (0.8); 1.0514 (2.1); 1.0443 (3.0); 1.0311 (2.3); 1.0240 (2.6); 1.0151 (1.1); 0.9799 (0.3); 0.9445 (1.1); 0.9352 (3.0); 0.9293 (3.0); 0.9237 (3.2); 0.9168 (2.7); 0.9057 (0.8); -0.0002 (37.9)
I-025		I-025: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2070 (4.2); 8.2330 (4.4); 7.7295 (2.8); 7.7082 (5.9); 7.6702 (5.9); 7.6488 (2.8); 5.0806 (0.6); 5.0634 (0.9); 5.0463 (0.6); 3.9660 (16.0); 3.8228 (1.0); 3.8044 (3.2); 3.7859 (3.4); 3.7679 (1.0); 3.3202 (18.7); 2.6745 (0.5); 2.6705 (0.7); 2.6662 (0.5); 2.5236 (1.7); 2.5057 (91.3); 2.5014 (120.6); 2.4970 (87.3); 2.3323 (0.5); 2.3282 (0.7); 1.4632 (10.5); 1.4458 (10.4); 1.3443 (3.6); 1.3258 (8.0); 1.3073 (3.5); 0.0078 (0.4); -0.0003 (11.2)
I-026		I-026: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2363 (4.1); 8.4377 (2.8); 8.4312 (2.9); 8.3161 (0.4); 8.2655 (4.3); 8.0148 (3.1); 8.0112 (3.1); 6.6939 (1.9); 6.6888 (2.6); 6.6834 (1.9); 4.2368 (0.5); 4.0875 (0.7); 4.0182 (15.2); 4.0085 (16.0); 3.9949 (1.2); 3.9721 (0.8); 3.9664 (1.0); 3.9127 (0.8); 3.8297 (1.1); 3.8112 (3.4); 3.7929 (3.4); 3.7742 (1.1); 3.7595 (0.4); 3.7406 (0.4); 3.3200 (16.8); 2.6706 (2.3); 2.5428 (0.4); 2.5236 (5.7); 2.5058 (324.6); 2.5016 (416.9); 2.4972 (303.3); 2.4249 (0.5); 2.3934 (0.4); 2.3284 (2.5); 2.1167 (0.5); 2.0857 (10.0); 1.3505 (0.6); 1.3349 (3.8); 1.3163 (8.0); 1.2979 (4.1); 1.2800 (0.8); 1.2653 (0.6); 1.2487 (0.6); 1.2351 (1.2); 1.1916 (0.3); 1.1403 (0.9); 0.1461 (0.5); 0.0078 (3.7); -0.0002 (98.3); -0.1499 (0.5)
I-027		I-027: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 20.0019 (0.4); 9.2395 (3.8); 8.7231 (5.0); 8.3154 (0.7); 8.2673 (3.9); 8.1817 (0.5); 8.1731 (5.0); 4.0701 (0.4); 4.0120 (15.3); 3.9865 (14.6); 3.9196 (0.5); 3.8513 (1.0); 3.8339 (3.2); 3.8152 (3.2); 3.7968 (1.0); 3.5229 (0.8); 3.3980 (0.5); 3.3770 (0.7); 3.3210 (242.0); 3.2523 (0.6); 3.2310 (0.5); 2.7964 (0.4); 2.6748 (3.9); 2.6703 (5.4); 2.6662 (4.0); 2.6312 (0.5); 2.5949 (0.4); 2.5238 (14.0); 2.5102 (351.9); 2.5060 (728.1); 2.5015 (968.4); 2.4970 (699.6); 2.4928 (339.6); 2.4342 (0.9); 2.3847 (0.6); 2.3328 (4.0); 2.3282 (5.5); 2.3236 (4.0); 2.1174 (0.4); 2.0856 (16.0); 1.7529 (0.5); 1.6998 (0.4); 1.4624 (0.4); 1.4049 (0.5); 1.3513 (0.8); 1.3381 (3.5); 1.3195 (7.8); 1.3004 (3.6); 1.2750 (0.7); 1.2342 (1.9); 1.1921 (0.6); 1.1397 (0.9); 0.1454 (1.1); 0.0079 (9.1); -0.0002 (265.4); -0.0085 (9.6); -0.1498 (1.4)

10

20

30

40

50

I-028		I-028: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2314 (3.8); 8.2621 (4.4); 8.2403 (3.1); 8.2380 (3.6); 7.7810 (3.0); 7.7777 (3.7); 7.7744 (2.0); 7.2371 (3.0); 7.2349 (3.2); 5.7629 (1.7); 5.7554 (6.8); 4.0234 (16.0); 3.9943 (0.4); 3.8640 (1.2); 3.8456 (3.5); 3.8270 (3.8); 3.8063 (5.8); 3.7990 (15.0); 3.3238 (15.2); 2.5068 (39.7); 2.5023 (43.4); 2.4978 (28.1); 2.4933 (12.1); 1.3683 (3.9); 1.3554 (3.0); 1.3498 (8.2); 1.3313 (3.5); 0.0074 (7.2); 0.0052 (6.3); -0.0002 (28.0); -0.0085 (1.0)
I-029		I-029: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2122 (3.9); 8.3152 (3.0); 8.2308 (3.8); 3.9933 (15.9); 3.9653 (14.1); 3.8275 (1.0); 3.8090 (3.5); 3.7905 (3.5); 3.7721 (1.1); 3.3248 (12.4); 2.5077 (36.0); 2.5034 (47.2); 2.4990 (34.2); 2.0865 (16.0); 1.2847 (3.7); 1.2663 (8.2); 1.2478 (3.7); -0.0002 (7.7)
I-030		I-030: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.6875 (0.7); 9.5184 (0.6); 9.2413 (4.2); 9.2199 (0.6); 9.2109 (1.7); 9.0759 (0.4); 8.3127 (1.4); 8.2655 (4.3); 8.2452 (0.6); 8.2283 (1.8); 8.1870 (1.0); 8.1777 (1.0); 7.3929 (0.5); 5.7573 (8.2); 4.0768 (14.4); 4.0251 (16.0); 3.9938 (6.8); 3.9648 (6.0); 3.9589 (2.7); 3.9226 (2.0); 3.8593 (1.0); 3.8408 (3.4); 3.8223 (3.6); 3.8101 (1.8); 3.8041 (1.3); 3.7917 (1.6); 3.7732 (0.5); 3.7483 (0.5); 3.7299 (0.5); 3.3231 (11.2); 2.6716 (0.5); 2.6669 (0.4); 2.5244 (1.2); 2.5067 (66.2); 2.5024 (88.1); 2.4981 (64.6); 2.3335 (0.4); 2.3293 (0.5); 2.3248 (0.4); 1.3563 (3.6); 1.3380 (8.0); 1.3195 (3.6); 1.2849 (1.7); 1.2717 (1.4); 1.2665 (3.6); 1.2480 (1.6); 0.1459 (0.4); 0.0078 (2.9); -0.0002 (89.1); -0.0083 (3.9); -0.1499 (0.4)
I-031		I-031: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2281 (4.1); 8.2491 (4.3); 7.5783 (7.1); 7.5421 (0.4); 7.5276 (0.5); 7.5098 (0.4); 7.4641 (0.4); 7.4443 (0.4); 5.7573 (12.5); 4.0204 (16.0); 3.8913 (15.4); 3.8747 (3.5); 3.8562 (3.5); 3.8378 (1.1); 3.3223 (4.5); 2.5247 (0.6); 2.5068 (34.4); 2.5024 (45.8); 2.4980 (33.3); 2.0863 (1.3); 2.0752 (2.1); 1.3424 (3.6); 1.3240 (8.1); 1.3055 (3.6); 0.0079 (1.8); - 0.0002 (54.3); -0.0084 (2.3)
I-032		I-032: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2254 (3.6); 8.2406 (3.8); 7.0932 (1.5); 7.0883 (2.2); 7.0830 (1.6); 6.6896 (1.7); 6.6855 (1.8); 6.6801 (1.9); 6.6759 (1.8); 6.2483 (1.8); 6.2416 (1.9); 6.2389 (2.0); 6.2321 (1.7); 4.0167 (15.2); 3.9799 (14.2); 3.8292 (1.0); 3.8106 (3.4); 3.8001 (16.0); 3.7924 (3.8); 3.7738 (1.0); 3.3230 (5.2); 2.5245 (0.5); 2.5108 (13.1); 2.5067 (27.3); 2.5023 (36.5); 2.4978 (26.3); 2.4936 (12.6); 1.3348 (3.4); 1.3164 (7.7); 1.2980 (3.4); 0.0079 (1.4); -0.0002 (42.2); -0.0085 (1.5)
I-033		I-033: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2227 (4.0); 8.6379 (0.3); 8.2503 (4.3); 7.9218 (3.6); 7.9184 (3.7); 7.8107 (4.0); 7.8072 (3.8); 7.6455 (0.6); 7.6271 (1.3); 7.6148 (1.0); 7.5972 (1.3); 7.5743 (1.0); 7.5665 (1.2); 7.5568 (0.9); 7.5484 (1.1); 7.5216 (0.9); 7.5068 (0.8); 7.4854 (0.4); 7.4671 (0.5); 7.4488 (0.5); 7.3670 (0.4); 7.3529 (0.8); 7.3446 (0.8); 7.3352 (0.6); 7.1911 (0.4); 5.7567 (0.6); 4.2455 (0.5); 4.1139 (14.7); 4.0577 (0.6); 3.9927 (0.8); 3.9742 (16.0); 3.9221 (0.9); 3.7733 (1.0); 3.7549 (3.4); 3.7364 (3.4); 3.7180 (1.1); 3.5505 (0.8); 3.4237 (0.4); 3.3924 (0.5); 3.3233 (104.7); 2.6751 (0.7); 2.6707 (0.9); 2.6664 (0.6); 2.5240 (2.0); 2.5061 (108.3); 2.5017 (141.4); 2.4973 (100.9); 2.3286 (0.9); 2.3239 (0.7); 1.3258 (0.4); 1.3126 (3.8); 1.2942 (8.3); 1.2757 (3.6); 1.2658 (0.5); 0.8556 (0.5); 0.1461 (0.7); 0.0079 (5.8); -0.0002 (161.5); -0.0085 (6.3); -0.1497 (0.7)

10

20

30

40

50

I-034		I-034: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 13.4858 (0.5); 9.2179 (3.6); 8.2390 (3.8); 4.0307 (12.5); 3.9799 (13.2); 3.7469 (0.8); 3.7284 (2.8); 3.7099 (2.8); 3.6914 (0.9); 3.3235 (8.0); 2.5064 (37.4); 2.5021 (48.4); 2.4978 (35.0); 2.0860 (16.0); 1.3008 (3.1); 1.2824 (6.8); 1.2639 (3.0); 0.0077 (1.8); -0.0002 (48.2); -0.0084 (1.9)
I-035		I-035: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.1664 (3.9); 8.2168 (4.1); 4.1840 (16.0); 4.0749 (14.9); 3.9201 (15.5); 3.7166 (0.3); 3.3536 (0.7); 3.3199 (84.5); 3.2819 (0.4); 3.0673 (1.3); 3.0487 (3.9); 3.0303 (4.0); 3.0118 (1.3); 2.8035 (0.3); 2.6748 (1.5); 2.6704 (2.1); 2.5057 (285.4); 2.5014 (371.4); 2.4971 (270.5); 2.4591 (1.3); 2.4557 (1.3); 2.3282 (2.1); 1.3976 (0.9); 1.3713 (0.6); 1.1151 (4.3); 1.0967 (9.0); 1.0783 (4.1); 0.1463 (1.6); 0.0345 (2.4); 0.0077 (16.0); -0.0003 (351.8); -0.0371 (1.0); -0.1495 (1.7)
I-036		I-036: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2249 (4.0); 8.2560 (4.2); 4.2425 (13.6); 4.1919 (0.7); 4.1422 (0.4); 3.9939 (0.7); 3.9394 (15.9); 3.9336 (16.0); 3.8943 (0.5); 3.8390 (0.3); 3.7836 (1.0); 3.7656 (3.2); 3.7470 (3.3); 3.7270 (1.4); 3.3194 (47.5); 2.6702 (1.4); 2.5012 (244.8); 2.4971 (186.1); 2.3273 (1.4); 2.0857 (1.7); 1.3976 (2.7); 1.3041 (0.5); 1.2883 (3.4); 1.2702 (7.3); 1.2516 (3.4); 0.1459 (0.5); -0.0001 (118.8); -0.1504 (0.5)
I-037		I-037: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.5733 (0.5); 9.5569 (1.1); 9.5409 (0.6); 9.2497 (4.0); 8.2645 (4.2); 5.7564 (10.5); 4.2847 (15.0); 4.1156 (0.3); 4.0934 (1.1); 4.0765 (1.2); 4.0699 (1.2); 4.0533 (1.1); 4.0298 (0.4); 3.9776 (16.0); 3.7524 (1.0); 3.7339 (3.4); 3.7154 (3.4); 3.6971 (1.0); 3.3254 (4.2); 2.5249 (0.4); 2.5111 (10.7); 2.5068 (22.5); 2.5024 (30.2); 2.4979 (21.7); 2.4936 (10.4); 1.2805 (3.7); 1.2621 (8.3); 1.2437 (3.7); 0.0076 (1.2); - 0.0002 (35.2); -0.0084 (1.3)
I-038		I-038: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2407 (4.1); 8.3256 (1.6); 8.2524 (4.5); 8.0175 (1.6); 4.2789 (14.8); 4.1913 (0.3); 4.1155 (0.4); 3.9779 (16.0); 3.9413 (0.6); 3.7748 (1.1); 3.7564 (3.4); 3.7380 (3.5); 3.7194 (1.1); 3.3211 (261.3); 2.6748 (1.8); 2.6707 (2.5); 2.6662 (1.8); 2.5236 (5.8); 2.5059 (331.0); 2.5016 (435.6); 2.4972 (312.5); 2.4367 (0.4); 2.3323 (1.8); 2.3280 (2.4); 1.2831 (3.8); 1.2646 (8.3); 1.2463 (3.8); 0.1464 (1.0); 0.0078 (7.8); - 0.0001 (217.9); -0.0078 (8.1); -0.1494 (1.0)
I-039		I-039: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2441 (4.2); 8.9444 (1.0); 8.9323 (1.0); 8.2560 (4.4); 5.7571 (7.8); 4.2855 (15.1); 4.2116 (0.4); 3.9729 (16.0); 3.7629 (1.0); 3.7445 (3.5); 3.7260 (3.6); 3.7076 (1.1); 3.6176 (0.5); 3.6013 (1.1); 3.5851 (0.5); 3.5093 (0.4); 3.3222 (7.5); 2.8314 (0.4); 2.8227 (0.4); 2.8063 (7.2); 2.7944 (7.1); 2.5936 (0.4); 2.5817 (0.3); 2.5509 (0.5); 2.5393 (0.6); 2.5064 (37.6); 2.5021 (49.7); 2.4978 (36.4); 2.3288 (0.3); 2.1838 (0.4); 2.1488 (0.4); 1.7760 (0.5); 1.7679 (0.5); 1.7597 (1.3); 1.7514 (0.5); 1.7435 (0.4); 1.3560 (2.2); 1.2788 (3.8); 1.2604 (8.4); 1.2419 (4.0); 0.0078 (1.1); -0.0002 (28.4); -0.0080 (1.2)
I-040		I-040: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2261 (4.2); 8.2465 (4.4); 5.7569 (10.2); 4.1935 (0.3); 4.0142 (0.4); 3.9843 (16.0); 3.9720 (15.3); 3.8568 (1.2); 3.8492 (0.9); 3.8385 (3.5); 3.8200 (3.5); 3.8018 (1.2); 3.7273 (0.4); 3.6015 (0.8); 3.5850 (0.3); 3.3209 (6.8); 3.1305 (15.8); 3.0751 (14.6); 3.0327 (0.6); 3.0178 (0.4); 2.6709 (0.5); 2.5365 (1.9); 2.5061 (63.2); 2.5019 (78.1); 2.4977 (59.4); 2.3289 (0.4); 1.7687 (0.4); 1.7600 (0.8); 1.3557 (1.4); 1.3112 (3.8); 1.2928 (8.0); 1.2743 (3.8); 1.2367 (0.5); -0.0002 (45.9)

10

20

30

40

50

I-041		I-041: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2428 (4.4); 9.0191 (0.7); 9.0050 (1.4); 8.9904 (0.7); 8.2570 (4.7); 5.7576 (5.8); 4.2823 (15.2); 4.2189 (0.4); 4.1661 (0.3); 4.0776 (0.3); 3.9645 (16.0); 3.7411 (1.1); 3.7225 (3.6); 3.7040 (3.6); 3.6857 (1.2); 3.6175 (0.7); 3.6013 (1.6); 3.5859 (0.7); 3.3331 (0.8); 3.3212 (9.0); 3.2990 (2.7); 3.2822 (2.1); 3.2648 (0.7); 2.6711 (0.4); 2.5062 (48.1); 2.5021 (62.8); 2.4980 (46.6); 2.3288 (0.4); 1.7761 (0.7); 1.7682 (0.8); 1.7600 (1.8); 1.7517 (0.8); 1.7441 (0.6); 1.3559 (0.6); 1.2718 (3.9); 1.2534 (8.3); 1.2350 (3.9); 1.1410 (4.1); 1.1231 (8.7); 1.1052 (4.1); 0.0075 (1.3); -0.0001 (35.0)
I-042		I-042: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2163 (3.9); 8.4144 (4.4); 8.2368 (4.2); 8.0115 (4.9); 5.7565 (5.5); 4.0199 (14.6); 3.9770 (16.0); 3.9556 (15.4); 3.7510 (0.9); 3.7326 (3.3); 3.7141 (3.3); 3.6957 (1.0); 3.3228 (38.5); 2.6709 (0.4); 2.5242 (1.0); 2.5107 (27.7); 2.5064 (57.6); 2.5019 (76.7); 2.4974 (54.2); 2.4931 (25.3); 2.3286 (0.4); 1.3004 (3.7); 1.2820 (8.2); 1.2635 (3.5); 0.1461 (0.3); 0.0078 (2.6); -0.0002 (75.8); -0.0086 (2.7); -0.1497 (0.3)
I-043		I-043: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2235 (4.2); 8.2469 (4.4); 8.2292 (2.1); 8.2261 (2.3); 8.2221 (2.4); 8.2190 (2.2); 7.8163 (1.8); 7.8090 (1.8); 7.8037 (2.1); 7.7964 (2.0); 7.6257 (2.5); 7.6228 (2.4); 7.6132 (2.2); 7.6101 (2.1); 5.7569 (6.0); 4.0469 (15.1); 3.9943 (16.0); 3.9811 (0.5); 3.7964 (1.0); 3.7779 (3.4); 3.7594 (3.5); 3.7411 (1.1); 3.3241 (17.8); 2.5245 (0.6); 2.5067 (35.8); 2.5024 (46.5); 2.4980 (33.6); 1.3232 (3.7); 1.3047 (8.2); 1.2863 (3.6); 0.0080 (1.5); 0.0000 (41.4); -0.0083 (1.7)
I-044		I-044: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2224 (4.1); 8.2491 (4.3); 7.8941 (2.1); 7.8830 (2.2); 7.7993 (2.0); 7.7975 (2.0); 7.7900 (2.2); 7.3258 (1.8); 7.3163 (1.9); 7.3133 (1.9); 7.3038 (1.7); 5.7568 (14.3); 4.1123 (14.8); 3.9812 (16.0); 3.7713 (1.0); 3.7529 (3.4); 3.7344 (3.5); 3.7160 (1.0); 3.3249 (7.3); 2.5248 (0.6); 2.5071 (28.6); 2.5027 (38.1); 2.4983 (27.5); 1.3148 (3.7); 1.2964 (8.2); 1.2779 (3.6); 0.0077 (1.5); -0.0002 (39.0); -0.0084 (1.5)
I-045		I-045: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10.1998 (0.5); 9.2474 (3.8); 8.2746 (4.0); 5.7566 (1.2); 4.3215 (0.6); 4.2387 (0.6); 4.1254 (0.6); 4.0878 (14.5); 3.9946 (16.0); 3.9634 (0.4); 3.9277 (0.5); 3.8915 (1.0); 3.8728 (3.4); 3.8543 (3.4); 3.8358 (1.0); 3.3196 (32.3); 2.6750 (0.6); 2.6705 (0.8); 2.6659 (0.6); 2.5238 (1.8); 2.5101 (49.3); 2.5059 (104.6); 2.5015 (141.8); 2.4970 (102.3); 2.4927 (49.2); 2.3327 (0.6); 2.3283 (0.8); 2.3238 (0.6); 1.3511 (1.0); 1.3425 (0.4); 1.3228 (3.9); 1.3043 (8.0); 1.2858 (3.6); 1.2652 (0.4); 1.2601 (0.5); 1.2332 (1.4); 0.1457 (0.5); 0.0079 (3.3); -0.0002 (111.7); -0.0084 (4.4); -0.1497 (0.5)
I-046		I-046: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10.6016 (0.9); 10.1030 (0.9); 9.2297 (4.0); 8.3154 (0.4); 8.2500 (4.3); 4.1417 (15.0); 3.9941 (16.0); 3.8340 (1.0); 3.8154 (3.4); 3.7969 (3.5); 3.7780 (1.1); 3.3630 (0.5); 3.3229 (172.6); 2.6750 (2.3); 2.6705 (3.0); 2.6663 (2.2); 2.5235 (7.5); 2.5101 (197.8); 2.5058 (410.0); 2.5014 (548.3); 2.4970 (393.8); 2.4928 (189.2); 2.3326 (2.3); 2.3282 (3.0); 2.3237 (2.2); 1.3047 (3.6); 1.2864 (8.1); 1.2679 (3.5); 0.1464 (1.0); 0.0078 (8.2); -0.0002 (231.4); -0.0083 (9.0); -0.1497 (1.1)
I-047		I-047: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 11.0260 (0.9); 11.0143 (0.8); 9.2316 (4.0); 8.3158 (0.5); 8.2542 (4.4); 4.1062 (14.9); 3.9927 (16.0); 3.8284 (1.0); 3.8099 (3.6); 3.7911 (4.0); 3.7733 (2.0); 3.4128 (0.3); 3.3308 (102.0); 3.2859 (0.6); 3.1744 (7.0); 3.1624 (6.9); 2.6749 (2.7); 2.6704 (3.6); 2.6656 (2.8); 2.5407 (1.4); 2.5363 (1.2); 2.5235 (8.9); 2.5057 (490.1); 2.5013 (643.6); 2.4969 (460.1); 2.4525 (1.0); 2.4437 (0.8); 2.3285 (3.6); 2.3235 (2.7); 1.3032 (3.5); 1.2847 (8.1); 1.2662 (3.6); 0.1459 (1.3); 0.0078 (9.9); - 0.0003 (266.2); -0.0081 (11.0); -0.0379 (0.4); -0.1494 (1.3)

10

20

30

40

50

I-048		I-048: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2235 (4.2); 8.2438 (4.5); 8.1331 (0.3); 5.7553 (6.6); 4.1921 (0.4); 3.9849 (16.0); 3.8890 (15.0); 3.8681 (1.1); 3.8496 (3.4); 3.8312 (3.4); 3.8129 (1.0); 3.7263 (0.4); 3.5463 (14.5); 3.3213 (30.4); 3.2712 (15.2); 2.6704 (0.5); 2.5232 (1.1); 2.5055 (67.5); 2.5012 (90.0); 2.4969 (65.2); 2.3279 (0.5); 2.3242 (0.4); 1.3104 (3.7); 1.2920 (8.1); 1.2736 (3.6); 0.0070 (2.4); -0.0007 (64.8); -0.0085 (2.8)
I-049		I-049: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2258 (3.8); 8.2475 (4.1); 8.1372 (1.0); 7.9785 (3.2); 7.9726 (3.3); 6.8941 (3.7); 6.8883 (3.7); 4.2964 (14.0); 3.9797 (16.0); 3.7548 (1.0); 3.7364 (3.3); 3.7179 (3.4); 3.6994 (1.0); 2.5426 (2.2); 2.5257 (0.6); 2.5208 (0.9); 2.5121 (16.1); 2.5077 (34.6); 2.5033 (47.1); 2.4987 (33.8); 2.4943 (16.0); 2.0865 (7.7); 1.2958 (3.6); 1.2775 (8.1); 1.2590 (3.5); 0.0080 (0.5); -0.0002 (17.2); -0.0084 (0.6)
I-050		I-050: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2107 (4.1); 8.2314 (4.3); 7.6281 (0.4); 7.5991 (0.3); 5.7574 (8.2); 4.0144 (16.0); 3.8650 (1.0); 3.8466 (3.3); 3.8281 (3.4); 3.8097 (1.0); 3.7642 (15.4); 3.7571 (15.0); 3.3251 (16.3); 2.5421 (0.5); 2.5248 (0.4); 2.5113 (11.9); 2.5072 (24.8); 2.5027 (33.2); 2.4983 (24.0); 2.4941 (11.5); 2.2586 (15.4); 2.1401 (15.7); 1.3247 (3.6); 1.3063 (8.1); 1.2878 (3.6); -0.0002 (8.6); -0.0085 (0.3)
I-051		I-051: ¹ H-NMR(601.6 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.3583 (4.9); 9.2205 (3.4); 8.5626 (4.9); 8.2440 (3.6); 5.7506 (2.1); 4.1175 (15.2); 3.9780 (16.0); 3.9571 (1.3); 3.9232 (1.2); 3.7701 (0.9); 3.7579 (3.3); 3.7456 (3.3); 3.7334 (1.1); 3.3050 (49.6); 2.6125 (0.5); 2.5216 (0.8); 2.5186 (1.0); 2.5155 (0.9); 2.5067 (26.9); 2.5036 (59.9); 2.5006 (85.5); 2.4976 (61.4); 2.4945 (28.7); 2.3849 (0.5); 1.3153 (3.5); 1.3030 (7.9); 1.2907 (3.5); 1.2722 (0.7); 1.2598 (0.4); 0.0053 (2.0); -0.0002 (76.1); -0.0057 (2.5)
I-052		I-052: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2296 (3.8); 8.2449 (4.0); 7.9470 (2.5); 7.5840 (2.2); 4.0156 (16.0); 4.0055 (14.7); 3.8302 (15.7); 3.8181 (3.6); 3.7996 (3.4); 3.7812 (1.1); 3.3202 (78.7); 2.6747 (0.5); 2.6705 (0.7); 2.6664 (0.5); 2.5237 (2.0); 2.5102 (42.5); 2.5059 (86.1); 2.5014 (114.9); 2.4970 (86.4); 2.4928 (44.8); 2.3328 (0.5); 2.3282 (0.7); 2.3239 (0.6); 2.0857 (0.4); 1.3390 (3.6); 1.3206 (8.0); 1.3021 (3.5); 1.2338 (0.3); 0.1459 (0.4); 0.0079 (3.0); -0.0002 (90.3); -0.0083 (4.3); -0.1498 (0.4)
I-053		I-053: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2294 (3.6); 8.2442 (3.9); 7.9468 (2.3); 7.5837 (2.1); 4.0290 (1.1); 4.0154 (16.0); 4.0052 (14.6); 3.9835 (0.6); 3.8299 (15.4); 3.8178 (3.5); 3.7993 (3.4); 3.7809 (1.0); 3.4329 (0.3); 3.4189 (0.4); 3.3212 (15.2); 3.1685 (0.4); 2.6748 (0.8); 2.6703 (1.1); 2.6657 (0.8); 2.6613 (0.4); 2.5401 (0.5); 2.5236 (3.0); 2.5101 (61.2); 2.5057 (123.4); 2.5012 (163.4); 2.4967 (119.9); 2.4922 (59.1); 2.3370 (0.4); 2.3325 (0.7); 2.3280 (1.0); 2.3234 (0.8); 2.3064 (0.5); 2.0857 (1.1); 1.3481 (0.4); 1.3388 (3.5); 1.3204 (8.0); 1.3019 (3.4); 1.2340 (0.3); 1.1400 (0.4); 0.1458 (0.7); 0.0079 (5.6); -0.0002 (156.9); -0.0085 (6.1); -0.1499 (0.7)
I-054		I-054: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.2351 (3.6); 8.2493 (3.8); 7.2011 (3.1); 7.1906 (3.3); 7.1038 (0.8); 7.0936 (0.8); 6.8742 (3.3); 6.8636 (3.2); 6.5038 (0.8); 6.4935 (0.8); 5.7551 (7.3); 4.0159 (14.7); 3.9954 (0.4); 3.9713 (13.5); 3.8954 (0.7); 3.8828 (16.0); 3.8481 (1.0); 3.8297 (3.2); 3.8111 (3.3); 3.7927 (1.0); 3.6361 (4.7); 3.3196 (130.2); 3.2395 (0.3); 2.6750 (0.7); 2.6705 (1.0); 2.6659 (0.8); 2.5236 (2.9); 2.5102 (63.3); 2.5059 (125.5); 2.5014 (162.8); 2.4969 (117.8); 2.4926 (57.7); 2.3327 (0.8); 2.3281 (1.0); 2.3236 (0.8); 1.3450 (3.4); 1.3265 (7.6); 1.3080 (3.3); 1.2926 (0.6); 1.2749 (0.3); 0.1460 (0.6); 0.0078 (5.4); - 0.0002 (142.3); -0.0085 (5.8); -0.1497 (0.6)

10

20

30

40

50

I-055		I-055: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2167 (4.3); 8.4783 (5.2); 8.2349 (4.7); 8.0020 (5.1); 5.7551 (11.1); 4.0229 (15.0); 3.9744 (16.0); 3.8973 (0.4); 3.8877 (0.8); 3.8786 (1.1); 3.8695 (1.6); 3.8600 (1.2); 3.8510 (0.8); 3.8414 (0.5); 3.7484 (1.1); 3.7299 (3.6); 3.7115 (3.6); 3.6931 (1.1); 3.3221 (22.9); 2.5069 (21.6); 2.5027 (27.1); 2.4985 (19.5); 1.2986 (3.9); 1.2802 (8.5); 1.2618 (3.8); 1.1703 (0.6); 1.1565 (1.8); 1.1490 (3.0); 1.1407 (2.9); 1.1301 (1.0); 1.1005 (0.5); 1.0618 (1.0); 1.0496 (2.1); 1.0436 (2.5); 1.0311 (2.5); 1.0123 (0.6); 0.0078 (1.5); -0.0002 (28.4)
I-056		I-056: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.7026 (5.5); 4.0569 (16.0); 3.9410 (14.5); 3.7958 (1.0); 3.7773 (3.4); 3.7588 (3.5); 3.7404 (1.0); 3.3226 (25.5); 2.5258 (0.4); 2.5123 (9.1); 2.5080 (18.3); 2.5035 (24.1); 2.4989 (17.4); 2.4945 (8.5); 1.3059 (3.6); 1.2970 (0.4); 1.2875 (8.1); 1.2690 (3.6); 0.0078 (0.8); -0.0002 (22.4); -0.0084 (0.9)
I-057		I-057: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2205 (4.1); 8.2441 (4.5); 7.6744 (3.2); 7.6642 (3.4); 7.3604 (3.4); 7.3502 (3.2); 5.7563 (7.8); 4.1016 (14.6); 4.0341 (0.8); 3.9957 (1.0); 3.9748 (16.0); 3.7732 (1.0); 3.7549 (3.5); 3.7364 (3.5); 3.7179 (1.1); 3.3239 (17.9); 2.5250 (0.4); 2.5115 (9.2); 2.5074 (18.4); 2.5030 (24.3); 2.4985 (17.9); 2.4942 (9.0); 1.3134 (3.8); 1.3061 (1.0); 1.2951 (8.3); 1.2766 (3.7); 0.0077 (1.0); -0.0002 (26.4); -0.0084 (1.2)
I-058		I-058: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2192 (4.1); 8.2804 (6.2); 8.2463 (4.4); 5.7561 (0.5); 4.0957 (15.0); 3.9736 (16.0); 3.7800 (1.0); 3.7615 (3.5); 3.7431 (3.5); 3.7247 (1.1); 3.3221 (24.2); 2.7517 (15.7); 2.5246 (0.6); 2.5068 (28.1); 2.5024 (36.2); 2.4979 (26.1); 1.3170 (3.8); 1.2986 (8.4); 1.2801 (3.7); 1.2342 (1.4); 0.0079 (1.1); -0.0002 (32.8); -0.0083 (1.3)
I-059		I-059: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2335 (3.6); 8.2483 (3.8); 7.5894 (5.8); 5.7559 (4.9); 4.0131 (14.5); 3.9948 (13.4); 3.8403 (0.9); 3.8218 (3.1); 3.8033 (3.2); 3.7848 (1.0); 3.7619 (16.0); 3.3221 (44.8); 2.5064 (38.8); 2.5020 (51.2); 2.4975 (37.6); 1.3404 (3.3); 1.3220 (7.4); 1.3035 (3.2); 0.0079 (2.1); -0.0002 (58.0); -0.0084 (2.8)
I-060		I-060: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2198 (3.2); 9.0638 (0.4); 8.2410 (3.4); 8.1023 (0.4); 7.9300 (2.5); 7.9244 (2.5); 6.8591 (2.8); 6.8535 (2.8); 6.7669 (0.4); 6.7612 (0.3); 5.7557 (16.0); 4.3379 (1.7); 4.2776 (12.0); 4.1363 (1.9); 3.9964 (12.7); 3.9701 (13.0); 3.9458 (1.8); 3.8510 (1.6); 3.7494 (0.8); 3.7309 (2.7); 3.7125 (2.8); 3.6941 (0.8); 3.3196 (55.4); 2.6746 (0.4); 2.6703 (0.5); 2.6660 (0.4); 2.5234 (1.3); 2.5100 (30.5); 2.5058 (61.3); 2.5013 (80.5); 2.4968 (58.2); 2.4924 (28.5); 2.3327 (0.4); 2.3280 (0.5); 2.3235 (0.4); 1.2890 (3.0); 1.2706 (6.7); 1.2521 (2.9); 1.2348 (0.7); 0.1456 (0.4); 0.0075 (2.8); -0.0002 (81.9); -0.0085 (3.3); -0.1501 (0.4)
I-061		I-061: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2196 (4.1); 8.2412 (4.4); 7.9304 (3.0); 7.9247 (3.1); 7.6460 (0.4); 7.6279 (0.8); 7.6160 (0.6); 7.5988 (0.6); 7.5746 (0.4); 7.5669 (0.5); 7.5576 (0.4); 7.5505 (0.5); 6.8646 (3.4); 6.8589 (3.4); 5.7562 (5.6); 4.2717 (14.8); 4.0247 (0.4); 4.0181 (0.3); 4.0077 (1.4); 3.9969 (16.0); 3.9736 (1.4); 3.9468 (15.9); 3.8000 (0.7); 3.3228 (34.1); 2.5249 (0.7); 2.5070 (32.4); 2.5026 (42.0); 2.4982 (30.4); 1.3050 (2.1); 1.2939 (13.8); 1.2768 (13.5); 0.0076 (1.6); -0.0002 (39.5); -0.0085 (1.5)

10

20

30

40

50

I-062		I-062: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2364 (3.6); 8.2523 (3.9); 7.6837 (3.1); 7.6788 (3.2); 6.9157 (3.1); 6.9106 (3.2); 5.7558 (9.5); 4.0287 (14.3); 4.0168 (16.0); 3.9741 (13.1); 3.9587 (0.6); 3.9229 (0.4); 3.8583 (0.9); 3.8398 (3.1); 3.8214 (3.1); 3.8029 (1.0); 3.3208 (25.7); 2.6709 (0.3); 2.5241 (0.9); 2.5063 (43.7); 2.5020 (57.1); 2.4976 (41.8); 2.3289 (0.3); 1.3502 (3.3); 1.3318 (7.2); 1.3133 (3.2); 0.0077 (2.4); -0.0002 (59.3); -0.0082 (2.6)
I-063		I-063: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.7040 (5.7); 7.8826 (4.4); 7.8616 (5.1); 7.7027 (5.4); 7.6817 (4.0); 4.1104 (16.0); 4.0561 (0.7); 4.0384 (2.0); 4.0206 (2.1); 4.0026 (1.3); 3.9801 (14.8); 3.8544 (1.4); 3.8359 (3.8); 3.8174 (3.7); 3.7989 (1.2); 3.3251 (34.7); 3.3214 (59.4); 2.6751 (0.5); 2.6712 (0.6); 2.5063 (88.3); 2.5022 (97.5); 2.3330 (0.5); 2.3291 (0.6); 1.9890 (7.0); 1.3977 (5.8); 1.3566 (4.3); 1.3381 (8.4); 1.3197 (3.8); 1.1928 (2.0); 1.1791 (1.8); 1.1751 (3.8); 1.1572 (1.8); 0.1463 (0.3); 0.0038 (36.1); -0.0002 (73.7); -0.1495 (0.4)
I-064		I-064: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2085 (0.3); 9.1926 (3.9); 8.3148 (0.4); 8.3082 (0.3); 8.2250 (0.4); 8.2111 (4.1); 7.5210 (0.4); 3.9924 (1.1); 3.9635 (1.1); 3.9502 (16.0); 3.8537 (14.3); 3.7152 (1.0); 3.6966 (3.4); 3.6782 (3.5); 3.6597 (1.1); 3.3197 (229.5); 2.6748 (1.4); 2.6704 (2.0); 2.6658 (1.6); 2.5235 (4.6); 2.5057 (258.4); 2.5013 (339.1); 2.4969 (251.2); 2.3324 (1.4); 2.3279 (2.0); 2.3238 (1.6); 1.3978 (12.9); 1.2841 (0.3); 1.2730 (3.7); 1.2654 (1.0); 1.2546 (8.0); 1.2361 (3.7); 1.1399 (0.4); 0.1457 (1.5); 0.0077 (10.8); -0.0004 (318.3); -0.0081 (14.8); -0.1497 (1.5)
I-065		I-065: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2229 (4.0); 8.2479 (4.3); 7.8698 (3.8); 7.8493 (4.5); 7.5941 (3.8); 7.5736 (3.3); 4.1902 (7.9); 4.0118 (16.0); 3.9708 (14.6); 3.8306 (1.1); 3.8121 (3.4); 3.7935 (3.4); 3.7751 (1.0); 3.3236 (123.7); 2.6755 (0.4); 2.6709 (0.5); 2.6662 (0.4); 2.5243 (1.2); 2.5107 (33.2); 2.5064 (69.1); 2.5020 (92.6); 2.4975 (67.5); 2.4932 (33.5); 2.3332 (0.4); 2.3286 (0.6); 2.3244 (0.4); 2.0860 (1.6); 1.3977 (14.8); 1.3427 (3.7); 1.3242 (8.2); 1.3058 (3.6); 0.0078 (0.8); -0.0002 (24.6); -0.0083 (1.2)
I-066		I-066: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2230 (2.3); 8.2483 (2.5); 7.9002 (2.0); 7.8794 (2.8); 7.7640 (2.7); 7.7429 (2.1); 4.0140 (8.9); 3.9759 (8.1); 3.8459 (0.6); 3.8275 (1.9); 3.8090 (2.0); 3.7907 (0.6); 3.3224 (240.3); 2.6747 (0.8); 2.6705 (1.1); 2.6662 (0.8); 2.5059 (137.3); 2.5015 (179.7); 2.4971 (131.4); 2.3326 (0.8); 2.3283 (1.0); 2.3239 (0.8); 1.7628 (16.0); 1.6237 (0.7); 1.3977 (9.7); 1.3472 (2.1); 1.3288 (4.6); 1.3103 (2.0); -0.0002 (42.2); -0.0082 (1.9)
I-067		I-067: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2199 (4.1); 8.5699 (4.8); 8.2407 (4.4); 8.1849 (5.4); 5.7547 (0.6); 5.3234 (0.8); 5.3010 (2.5); 5.2784 (2.6); 5.2558 (0.9); 4.0344 (14.7); 3.9813 (16.0); 3.7511 (1.0); 3.7327 (3.4); 3.7143 (3.4); 3.6959 (1.0); 3.3920 (0.8); 3.3745 (0.8); 3.3568 (0.4); 3.3295 (111.6); 2.5248 (0.7); 2.5110 (18.7); 2.5070 (38.6); 2.5026 (51.7); 2.4982 (37.9); 2.4939 (18.8); 1.3051 (3.7); 1.2868 (8.2); 1.2683 (3.6); 1.1088 (0.8); 1.0913 (1.6); 1.0738 (0.8); 0.0077 (1.2); -0.0002 (35.8); -0.0084 (1.6)
I-068		I-068: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2442 (4.4); 8.2582 (4.8); 7.6273 (0.5); 7.6153 (0.4); 7.5986 (0.4); 7.5664 (0.4); 7.4554 (5.0); 5.7558 (1.6); 4.1092 (14.3); 4.0336 (16.0); 4.0002 (14.9); 3.9656 (0.4); 3.8744 (1.1); 3.8559 (3.6); 3.8375 (3.6); 3.8190 (1.2); 3.3210 (22.8); 2.6712 (0.4); 2.5066 (38.8); 2.5024 (50.9); 2.4986 (38.1); 2.3291 (0.4); 1.3588 (3.8); 1.3403 (8.3); 1.3219 (3.7); 0.0078 (1.4); -0.0002 (37.7)

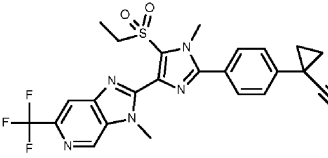
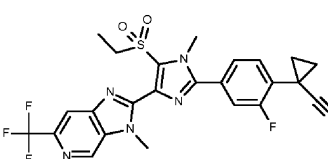
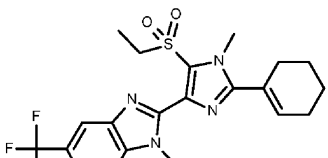
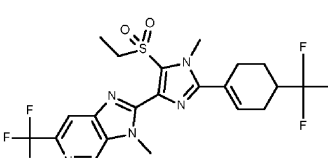
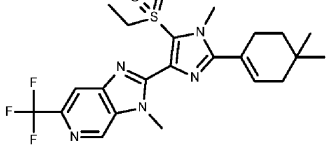
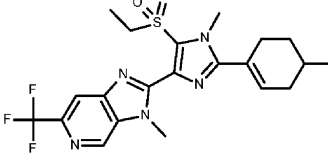
10

20

30

40

50

I-069		<p>I-069: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.2195 (4.1); 8.2458 (4.5); 7.8530 (3.9); 7.8322 (4.8); 7.5543 (4.6); 7.5333 (4.1); 5.7550 (5.1); 4.0061 (16.0); 3.9884 (0.4); 3.9618 (14.6); 3.8306 (1.0); 3.8122 (3.4); 3.7936 (3.5); 3.7752 (1.1); 3.3225 (225.3); 2.6748 (0.8); 2.6707 (1.1); 2.6662 (0.8); 2.5238 (2.5); 2.5101 (64.4); 2.5059 (134.6); 2.5015 (181.6); 2.4971 (132.7); 2.4927 (65.6); 2.3326 (0.7); 2.3284 (1.0); 2.3238 (0.8); 2.0860 (0.9); 1.8790 (1.1); 1.8658 (3.4); 1.8586 (3.7); 1.8472 (1.5); 1.6580 (1.4); 1.6457 (3.4); 1.6386 (3.6); 1.6250 (1.1); 1.3975 (4.8); 1.3406 (3.7); 1.3222 (8.3); 1.3037 (3.6); 0.0076 (1.4); 0.0000 (46.2); -0.0083 (2.1)</p>
I-070		<p>I-070: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.2233 (4.4); 8.3139 (0.7); 8.2472 (4.7); 7.8142 (1.7); 7.7884 (1.9); 7.7140 (0.4); 7.6938 (2.2); 7.6818 (4.8); 5.7543 (0.9); 4.0106 (16.0); 3.9814 (14.8); 3.9577 (2.1); 3.9221 (1.9); 3.8467 (1.0); 3.8282 (3.5); 3.8097 (3.5); 3.7909 (1.1); 3.7469 (0.4); 3.7279 (0.4); 3.3217 (397.6); 2.6751 (1.7); 2.6707 (2.4); 2.6664 (1.8); 2.5238 (5.8); 2.5061 (302.8); 2.5017 (403.0); 2.4973 (301.5); 2.3328 (1.7); 2.3284 (2.3); 2.3240 (1.8); 1.7980 (1.2); 1.7848 (3.2); 1.7780 (3.6); 1.7663 (1.5); 1.5838 (1.5); 1.5715 (3.4); 1.5650 (3.6); 1.5514 (1.2); 1.3980 (1.9); 1.3487 (3.7); 1.3303 (8.2); 1.3118 (3.6); 1.2899 (0.6); 1.2717 (1.0); 1.2528 (0.5); 0.1459 (0.5); 0.0079 (3.5); -0.0001 (102.8); -0.1496 (0.5)</p>
I-071		<p>I-071: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1991 (4.1); 8.2161 (4.4); 6.3045 (1.2); 6.3006 (1.6); 3.9526 (16.0); 3.9078 (14.7); 3.7554 (1.0); 3.7370 (3.4); 3.7185 (3.5); 3.7000 (1.1); 3.3227 (110.2); 2.6748 (0.4); 2.6709 (0.6); 2.5239 (1.3); 2.5062 (68.7); 2.5018 (91.9); 2.4975 (67.5); 2.4079 (1.9); 2.4026 (1.9); 2.3284 (0.6); 2.3241 (0.4); 2.2806 (1.3); 2.2742 (1.7); 2.2661 (1.8); 1.7607 (0.4); 1.7454 (0.9); 1.7333 (1.4); 1.7227 (1.5); 1.7190 (1.4); 1.7083 (0.8); 1.7029 (0.8); 1.6867 (0.8); 1.6769 (1.5); 1.6719 (1.5); 1.6627 (1.4); 1.6581 (1.4); 1.6497 (0.9); 1.3977 (13.8); 1.2873 (3.7); 1.2689 (8.1); 1.2504 (3.6); 1.0690 (0.5); 0.0080 (0.9); -0.0002 (26.5); -0.0083 (1.3)</p>
I-072		<p>I-072: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.2013 (3.9); 8.2207 (4.2); 6.3180 (1.1); 3.9518 (16.0); 3.9274 (14.7); 3.7604 (1.0); 3.7420 (3.3); 3.7235 (3.3); 3.7050 (1.0); 3.3251 (41.4); 2.7032 (0.4); 2.6954 (0.4); 2.6810 (0.4); 2.6715 (0.5); 2.6665 (0.5); 2.6608 (0.5); 2.6537 (0.5); 2.6001 (0.8); 2.5821 (0.5); 2.5488 (0.7); 2.5367 (1.1); 2.5246 (1.2); 2.5111 (14.2); 2.5068 (29.0); 2.5024 (38.4); 2.4979 (27.5); 2.4935 (13.2); 2.3511 (0.4); 2.3447 (0.4); 2.3336 (0.4); 2.3287 (0.5); 2.3246 (0.5); 2.3096 (0.4); 2.0966 (0.5); 2.0862 (0.6); 2.0777 (0.4); 2.0645 (0.6); 1.6519 (0.6); 1.6383 (0.6); 1.6221 (0.6); 1.6079 (0.5); 1.3975 (0.5); 1.2908 (3.7); 1.2724 (8.2); 1.2540 (3.6); 0.0079 (0.8); -0.0002 (25.1); -0.0085 (0.9)</p>
I-073		<p>I-073: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1991 (2.5); 8.2176 (2.6); 6.2364 (1.0); 6.2322 (0.8); 3.9516 (9.8); 3.9061 (8.9); 3.7447 (0.6); 3.7264 (2.1); 3.7079 (2.2); 3.6893 (0.6); 3.3190 (20.2); 2.6706 (0.4); 2.5238 (1.4); 2.5103 (26.7); 2.5061 (54.3); 2.5016 (72.4); 2.4972 (53.6); 2.4931 (27.4); 2.4439 (1.2); 2.4389 (1.2); 2.3286 (0.4); 2.0763 (1.6); 2.0677 (1.6); 1.5123 (1.1); 1.4966 (2.3); 1.4803 (1.1); 1.3979 (2.7); 1.2860 (2.2); 1.2675 (5.0); 1.2491 (2.2); 0.9872 (16.0); 0.0078 (1.3); -0.0002 (32.4)</p>
I-074		<p>I-074: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1987 (4.2); 8.2191 (4.5); 6.2749 (1.8); 3.9481 (16.0); 3.9044 (14.8); 3.7487 (1.2); 3.7301 (3.6); 3.7115 (3.5); 3.6932 (1.1); 3.3291 (47.1); 3.3223 (128.4); 2.6746 (0.7); 2.6706 (0.8); 2.5057 (125.9); 2.5014 (139.4); 2.4971 (96.1); 2.4083 (1.4); 2.3656 (1.1); 2.3328 (0.8); 2.3282 (0.8); 1.9068 (0.6); 1.8843 (0.7); 1.8771 (0.6); 1.8395 (1.2); 1.7976 (1.2); 1.7619 (0.7); 1.3953 (0.4); 1.3683 (0.8); 1.3542 (0.8); 1.3424 (0.7); 1.3376 (0.8); 1.3233 (0.7); 1.3110 (0.6); 1.2835 (4.0); 1.2651 (8.2); 1.2466 (3.6); 1.0215 (6.6); 1.0055 (6.2); -0.0002 (6.4)</p>

10

20

30

40

50

I-075		I-075: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2243 (2.2); 8.2543 (2.4); 7.9308 (1.5); 7.9270 (1.0); 7.8173 (0.8); 7.7979 (1.0); 7.7835 (0.6); 7.7788 (0.5); 7.7615 (0.9); 7.6946 (1.0); 7.6751 (1.3); 7.6556 (0.5); 4.0059 (8.7); 3.9695 (7.8); 3.8263 (0.6); 3.8080 (1.8); 3.7894 (1.8); 3.7710 (0.6); 3.3204 (14.0); 2.5237 (0.7); 2.5102 (16.1); 2.5059 (34.0); 2.5014 (46.0); 2.4970 (33.4); 2.4926 (16.1); 2.0858 (1.7); 1.7651 (16.0); 1.6392 (0.5); 1.3972 (2.2); 1.3474 (2.0); 1.3290 (4.4); 1.3105 (1.9); -0.0002 (9.0)
I-076		I-076: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2151 (2.5); 8.2409 (2.6); 7.5986 (1.5); 7.5786 (1.8); 7.3953 (1.6); 7.3706 (0.9); 7.3658 (0.8); 7.3506 (0.8); 7.3458 (0.7); 4.0136 (10.2); 3.8698 (0.6); 3.8512 (2.0); 3.8327 (2.1); 3.8144 (0.6); 3.7292 (9.4); 3.3193 (45.4); 2.6747 (0.6); 2.6702 (0.8); 2.6656 (0.6); 2.5236 (1.8); 2.5187 (2.8); 2.5101 (50.3); 2.5056 (107.4); 2.5011 (144.8); 2.4966 (103.1); 2.4921 (48.7); 2.3325 (0.6); 2.3278 (0.8); 2.3234 (0.6); 2.2684 (7.4); 2.0855 (0.7); 1.8503 (0.7); 1.8374 (2.0); 1.8301 (2.2); 1.8189 (0.9); 1.6437 (0.8); 1.6314 (2.1); 1.6242 (2.2); 1.6106 (0.7); 1.3975 (16.0); 1.3441 (2.3); 1.3257 (5.2); 1.3072 (2.2); 0.0079 (0.9); -0.0003 (30.0); -0.0086 (1.0)
I-077		I-077: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2241 (3.9); 8.2528 (4.1); 7.8672 (1.9); 7.8630 (3.2); 7.8590 (2.1); 7.7388 (2.0); 7.7349 (3.4); 7.7310 (2.0); 7.6107 (2.0); 7.6061 (3.6); 7.6015 (1.8); 6.7479 (0.4); 6.7437 (0.4); 6.7360 (0.5); 6.7203 (0.4); 4.0202 (0.4); 4.0046 (16.0); 3.9536 (14.2); 3.8202 (0.9); 3.8019 (3.2); 3.7834 (3.2); 3.7649 (1.0); 3.3199 (48.7); 2.6749 (0.6); 2.6705 (0.9); 2.6658 (0.6); 2.5238 (2.0); 2.5189 (3.2); 2.5103 (54.7); 2.5059 (116.3); 2.5014 (156.8); 2.4968 (111.1); 2.4923 (52.2); 2.3326 (0.6); 2.3281 (0.9); 2.3236 (0.6); 2.0857 (1.4); 1.8690 (1.0); 1.8556 (2.9); 1.8481 (3.3); 1.8367 (1.5); 1.7367 (0.6); 1.7295 (0.5); 1.7176 (1.7); 1.7055 (3.2); 1.6982 (3.0); 1.6842 (1.0); 1.5142 (0.5); 1.5071 (0.5); 1.3975 (2.8); 1.3468 (3.5); 1.3284 (8.1); 1.3099 (3.5); 0.0080 (1.0); -0.0001 (33.4); -0.0085 (1.1)
I-078		I-078: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2218 (2.1); 8.2444 (2.3); 7.8668 (1.4); 7.8514 (0.7); 7.8314 (1.3); 7.7912 (0.9); 7.7708 (0.5); 4.0259 (7.9); 3.8836 (0.5); 3.8652 (1.7); 3.8467 (1.8); 3.8283 (0.5); 3.7553 (7.4); 3.3203 (8.8); 2.5065 (20.4); 2.5022 (27.2); 2.4978 (20.1); 2.3586 (6.2); 1.3974 (16.0); 1.3581 (1.9); 1.3397 (4.1); 1.3212 (1.8); 0.0072 (0.9); -0.0002 (23.2); -0.0083 (1.0)
I-079		I-079: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2298 (3.9); 8.4680 (3.1); 8.4627 (3.3); 8.2512 (4.2); 8.1826 (1.6); 8.1772 (1.6); 8.1613 (2.0); 8.1559 (2.0); 8.0072 (3.4); 7.9859 (2.7); 5.7561 (6.5); 4.0208 (16.0); 3.9858 (14.5); 3.9687 (0.5); 3.8405 (1.0); 3.8221 (3.3); 3.8036 (3.4); 3.7851 (1.0); 3.3224 (21.5); 2.5250 (0.5); 2.5115 (13.9); 2.5071 (29.6); 2.5026 (40.3); 2.4981 (29.6); 2.4936 (14.7); 2.0866 (1.5); 1.3527 (3.6); 1.3344 (8.2); 1.3158 (3.5); 0.0079 (0.9); -0.0002 (30.6); -0.0084 (1.4)
I-080		I-080: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2312 (3.5); 8.4459 (1.4); 8.4250 (4.5); 8.3743 (1.7); 8.3705 (1.4); 8.3539 (0.9); 8.3508 (0.9); 8.2557 (3.7); 5.7562 (8.2); 4.3317 (0.5); 4.0394 (0.4); 4.0321 (0.5); 4.0181 (16.0); 4.0135 (14.2); 3.8444 (0.9); 3.8261 (3.0); 3.8076 (3.0); 3.7892 (0.9); 3.7649 (0.4); 3.3287 (16.5); 2.5228 (0.4); 2.5141 (6.7); 2.5097 (14.2); 2.5052 (19.1); 2.5007 (13.8); 2.4962 (6.6); 2.0882 (2.2); 1.3967 (0.5); 1.3623 (3.3); 1.3439 (7.3); 1.3254 (3.1); 0.0079 (0.8); -0.0002 (23.5); -0.0085 (0.9)

10

20

30

40

50

I-081		I-081: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2215 (4.3); 8.2456 (4.4); 8.0725 (4.0); 7.9909 (3.6); 4.0183 (16.0); 3.8687 (1.0); 3.8505 (3.3); 3.8320 (3.4); 3.8135 (1.1); 3.8025 (0.8); 3.7785 (14.4); 3.7538 (0.6); 3.3199 (113.3); 2.6750 (0.8); 2.6705 (1.1); 2.6661 (0.9); 2.5239 (2.8); 2.5191 (4.4); 2.5104 (69.6); 2.5060 (147.5); 2.5016 (199.4); 2.4970 (144.4); 2.4926 (69.9); 2.4616 (0.8); 2.3571 (0.6); 2.3386 (12.2); 2.3286 (1.7); 2.3237 (1.1); 2.1115 (0.5); 1.3977 (1.4); 1.3612 (3.6); 1.3428 (8.0); 1.3243 (3.5); 1.3133 (0.5); 0.1459 (0.4); 0.0078 (3.1); -0.0003 (97.3); -0.0084 (3.9); -0.1497 (0.4)
I-082		I-082: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2301 (3.8); 8.2542 (4.1); 8.2360 (2.9); 8.2278 (3.4); 8.2239 (3.5); 8.2159 (3.4); 8.0167 (2.0); 8.0130 (1.9); 7.9964 (1.6); 7.9926 (1.7); 4.0142 (16.0); 3.9967 (14.3); 3.8421 (0.9); 3.8238 (3.2); 3.8053 (3.3); 3.7869 (1.0); 3.3208 (85.1); 2.6753 (0.6); 2.6708 (0.9); 2.6665 (0.7); 2.5241 (2.3); 2.5193 (3.6); 2.5107 (54.0); 2.5063 (114.0); 2.5018 (153.4); 2.4972 (110.0); 2.4928 (52.5); 2.3330 (0.6); 2.3285 (0.9); 2.3240 (0.6); 2.0742 (1.1); 1.3511 (3.5); 1.3326 (8.0); 1.3141 (3.4); -0.0001 (8.1)
I-083		I-083: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2240 (3.7); 8.2504 (4.0); 8.2486 (4.0); 8.1531 (3.1); 8.1319 (4.4); 8.0292 (4.3); 8.0079 (3.2); 4.0216 (16.0); 3.9029 (0.9); 3.8844 (3.1); 3.8660 (3.2); 3.8475 (0.9); 3.7865 (14.7); 3.3210 (19.9); 2.6756 (0.3); 2.6709 (0.5); 2.6665 (0.4); 2.5244 (1.2); 2.5197 (2.0); 2.5110 (30.0); 2.5065 (64.5); 2.5020 (87.6); 2.4974 (63.4); 2.4929 (30.6); 2.3332 (0.4); 2.3288 (0.5); 2.3243 (0.4); 2.0742 (2.4); 1.3544 (3.4); 1.3360 (8.0); 1.3174 (3.4); -0.0002 (5.1)
I-084		I-084: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.1935 (4.3); 8.3173 (0.4); 8.2096 (4.6); 5.7570 (1.5); 4.3702 (0.5); 4.0246 (0.5); 3.9591 (16.0); 3.8671 (14.5); 3.7565 (0.4); 3.7196 (1.1); 3.7011 (3.8); 3.6828 (3.6); 3.6644 (1.1); 3.3269 (5.2); 2.8875 (1.2); 2.8687 (3.7); 2.8500 (3.8); 2.8313 (1.3); 2.5083 (13.9); 2.5041 (18.3); 2.5000 (13.9); 1.3298 (4.1); 1.3112 (8.6); 1.2924 (4.0); 1.2736 (3.8); 1.2553 (8.1); 1.2368 (3.8); -0.0002 (0.7)
I-085		I-085: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.1902 (4.3); 8.2077 (4.6); 5.7571 (7.5); 3.9466 (16.0); 3.8932 (14.3); 3.7211 (1.1); 3.7027 (3.5); 3.6842 (3.6); 3.6658 (1.1); 3.3292 (4.0); 2.9561 (2.0); 2.9376 (3.6); 2.9189 (2.2); 2.5099 (9.9); 2.5057 (12.8); 2.5014 (9.5); 1.6981 (1.1); 1.6800 (2.8); 1.6616 (2.8); 1.6435 (1.1); 1.2741 (3.7); 1.2558 (8.1); 1.2373 (3.6); 0.8499 (0.6); 0.8435 (0.6); 0.8315 (0.9); 0.8191 (0.6); 0.8130 (0.6); 0.8000 (0.3); 0.4441 (0.8); 0.4335 (2.5); 0.4299 (2.6); 0.4245 (1.3); 0.4199 (1.3); 0.4136 (2.4); 0.4100 (2.4); 0.3999 (0.8); 0.0771 (0.9); 0.0641 (3.2); 0.0523 (3.0); 0.0408 (0.7); 0.0078 (0.6); -0.0002 (13.3)
I-086		I-086: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.1930 (3.7); 8.2050 (3.9); 8.2034 (4.0); 5.7583 (12.4); 4.3773 (0.6); 3.9576 (16.0); 3.9141 (14.3); 3.7341 (1.5); 3.7154 (3.4); 3.6969 (3.4); 3.6785 (1.0); 3.3410 (0.5); 3.3334 (6.4); 3.3243 (1.1); 3.3072 (1.4); 3.2903 (1.1); 3.2733 (0.4); 2.5155 (3.5); 2.5111 (7.4); 2.5066 (9.9); 2.5021 (7.1); 2.4976 (3.4); 1.3244 (14.8); 1.3074 (14.3); 1.2978 (1.1); 1.2776 (3.6); 1.2592 (8.0); 1.2407 (3.5); 0.0079 (0.4); -0.0002 (12.2); -0.0085 (0.5)
I-087		I-087: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2227 (3.9); 8.2490 (4.1); 7.7702 (1.4); 7.7669 (1.0); 7.7551 (1.0); 7.7514 (1.9); 7.7482 (1.3); 7.7286 (1.7); 7.7245 (2.7); 7.6510 (1.0); 7.6315 (2.4); 7.6127 (1.7); 7.5958 (1.4); 7.5921 (2.0); 7.5881 (1.4); 7.5760 (0.7); 7.5721 (0.9); 7.5682 (0.7); 5.7552 (3.7); 4.0078 (16.0); 3.9638 (0.6); 3.9524 (14.2); 3.8280 (1.0); 3.8096 (3.2); 3.7911 (3.3); 3.7726 (1.0); 3.3227 (21.7); 2.5249 (0.6); 2.5115 (15.0); 2.5071 (31.5); 2.5026 (42.2); 2.4981 (30.4); 2.4937 (14.7); 2.0864 (7.2); 1.9892 (0.7); 1.8453 (1.1); 1.8323 (3.4); 1.8251 (3.6); 1.8136 (1.4); 1.6454 (1.5); 1.6331 (3.4); 1.6261 (3.5); 1.6125 (1.1);

10

20

30

40

50

		1.3972 (1.0); 1.3475 (3.6); 1.3290 (8.2); 1.3105 (3.5); 1.1754 (0.4); 0.0079 (0.8); -0.0002 (23.2); -0.0084 (0.9)	
I-088		I-088: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2274 (2.5); 8.2510 (2.7); 8.1010 (1.5); 8.0847 (1.0); 8.0797 (4.1); 8.0508 (4.0); 8.0459 (1.1); 8.0340 (0.7); 8.0294 (1.6); 4.0154 (10.4); 3.9904 (9.5); 3.8461 (0.6); 3.8276 (2.1); 3.8091 (2.2); 3.7907 (0.6); 3.3213 (15.2); 2.5247 (0.7); 2.5199 (1.2); 2.5112 (15.6); 2.5068 (32.7); 2.5023 (43.7); 2.4978 (31.6); 2.4934 (15.4); 1.3975 (16.0); 1.3509 (2.4); 1.3324 (5.3); 1.3139 (2.3); 0.0079 (1.3); -0.0002 (38.0); -0.0085 (1.6)	
I-089		I-089: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2295 (3.7); 8.3312 (1.6); 8.3273 (2.8); 8.3241 (1.8); 8.2507 (3.9); 8.1761 (0.9); 8.1730 (1.4); 8.1691 (1.0); 8.1563 (1.1); 8.1523 (1.5); 8.1493 (1.2); 8.0995 (1.0); 8.0961 (1.5); 8.0929 (1.0); 8.0799 (1.2); 8.0765 (1.7); 8.0733 (1.1); 7.8406 (1.4); 7.8210 (2.5); 7.8012 (1.1); 4.0229 (16.0); 3.9835 (14.6); 3.8442 (1.0); 3.8259 (3.2); 3.8074 (3.2); 3.7889 (1.0); 3.3200 (42.3); 2.6753 (0.5); 2.6709 (0.7); 2.6663 (0.5); 2.5242 (2.2); 2.5195 (3.4); 2.5108 (41.3); 2.5064 (86.2); 2.5018 (115.2); 2.4973 (82.7); 2.4928 (39.8); 2.3331 (0.5); 2.3286 (0.7); 2.3240 (0.5); 2.0860 (6.7); 1.3977 (9.2); 1.3537 (3.5); 1.3353 (8.1); 1.3167 (3.4); 0.1459 (0.4); 0.0079 (3.7); -0.0002 (108.4); -0.0085 (4.3); -0.1497 (0.4)	10
I-090		I-090: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2242 (4.1); 9.2097 (0.4); 8.3091 (0.4); 8.2522 (4.4); 8.2276 (0.4); 8.0485 (1.7); 7.9009 (2.7); 7.8820 (2.7); 7.8556 (2.7); 7.8313 (2.7); 7.7717 (1.6); 5.7558 (6.9); 4.0580 (0.3); 4.0137 (16.0); 3.9927 (1.6); 3.9638 (1.3); 3.9218 (0.6); 3.8725 (1.1); 3.8542 (11.4); 3.8356 (3.6); 3.8171 (1.1); 3.8090 (0.5); 3.7897 (0.4); 3.3198 (85.4); 2.6751 (0.8); 2.6706 (1.2); 2.6661 (0.9); 2.5238 (2.6); 2.5190 (4.0); 2.5103 (70.7); 2.5060 (151.6); 2.5015 (206.4); 2.4970 (149.0); 2.4926 (71.7); 2.3326 (0.8); 2.3282 (1.2); 2.3238 (0.9); 1.3423 (3.7); 1.3238 (8.3); 1.3054 (3.8); 1.2844 (0.6); 1.2657 (1.0); 1.2589 (0.7); 1.2471 (0.7); 1.2350 (1.6); 1.1773 (0.3); 1.1589 (0.5); 1.1400 (0.3); 0.8551 (0.5); 0.1460 (0.4); 0.0080 (2.8); -0.0001 (88.4); -0.0083 (3.3); -0.1496 (0.4)	20
I-091		I-091: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.1979 (1.0); 9.2297 (4.0); 9.2225 (0.5); 9.2077 (0.5); 9.0182 (0.5); 8.5409 (2.7); 8.5229 (2.5); 8.4893 (2.8); 8.3144 (1.9); 8.2545 (4.2); 8.2429 (0.4); 8.2245 (0.4); 8.2012 (2.5); 8.1770 (2.6); 8.1131 (0.7); 7.6740 (0.3); 7.6449 (0.6); 7.6308 (0.7); 7.6262 (0.8); 7.6143 (0.7); 7.6104 (0.7); 7.5962 (0.9); 7.5725 (0.8); 7.5558 (1.4); 7.5213 (3.0); 7.5057 (2.2); 7.4649 (1.7); 7.4437 (1.7); 7.3816 (0.4); 7.3287 (0.6); 7.3097 (0.9); 7.2870 (0.6); 7.2536 (0.7); 7.2413 (0.6); 7.2248 (0.4); 6.7909 (3.6); 5.7546 (2.6); 4.0397 (0.4); 4.0193 (16.0); 3.9929 (1.8); 3.9829 (0.6); 3.9633 (1.4); 3.9578 (1.5); 3.9295 (0.4); 3.9220 (1.5); 3.8910 (1.2); 3.8741 (11.5); 3.8551 (3.3); 3.8373 (1.1); 3.8081 (0.5); 3.7897 (0.5); 3.7470 (0.4); 3.7286 (0.5); 3.5851 (0.4); 3.5759 (0.4); 3.5567 (0.4); 3.5492 (0.4); 3.4381 (0.6); 3.4227 (1.2); 3.4081 (0.7); 3.3927 (1.2); 3.3185 (302.2); 3.2105 (0.4); 3.0637 (0.3); 2.6751 (3.8); 2.6705 (5.3); 2.6660 (4.1); 2.6481 (0.4); 2.6270 (0.3); 2.6210 (0.4); 2.6123 (0.4); 2.5933 (0.4); 2.5748 (0.6); 2.5239 (13.2); 2.5103 (321.8); 2.5060 (681.8); 2.5015 (923.6); 2.4969 (666.6); 2.4925 (320.0); 2.4555 (0.9); 2.3326 (3.8); 2.3282 (5.3); 2.3237 (4.0); 1.3472 (3.6); 1.3287 (8.2); 1.3102 (3.6); 1.2898 (0.5); 1.2839 (0.6); 1.2718 (0.8); 1.2658 (1.1); 1.2548 (0.5); 1.2475 (0.6); 1.2328 (0.9); 1.2137 (0.8); 1.1943 (0.4); 1.0327 (0.4); 1.0205 (0.6); 0.0078 (1.3); -0.0001 (45.6); -0.0083 (1.9)	30
			40

I-092		I-092: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9758 (5.2); 8.1939 (3.2); 8.0633 (2.1); 8.0415 (2.2); 7.8596 (4.4); 7.8384 (5.6); 7.6945 (5.6); 7.6734 (4.4); 7.3719 (2.0); 7.3500 (1.9); 6.5552 (0.6); 3.9526 (16.0); 3.8278 (1.2); 3.8093 (3.9); 3.7910 (3.9); 3.7724 (1.4); 3.3199 (72.8); 2.6699 (1.9); 2.5043 (217.4); 2.5010 (276.8); 2.3279 (1.6); 2.0743 (1.1); 1.3451 (4.1); 1.3266 (8.8); 1.3082 (4.0); 1.2349 (0.4); 0.1459 (0.7); -0.0003 (134.9); -0.1495 (0.6)
I-093		I-093: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.5210 (0.5); 11.5637 (0.4); 9.9892 (0.5); 9.4469 (3.7); 9.3139 (5.1); 8.2806 (3.5); 7.8688 (4.4); 7.8404 (5.9); 7.7026 (6.1); 7.6741 (4.3); 6.5226 (1.0); 3.9658 (16.0); 3.7828 (1.2); 3.7591 (3.7); 3.7342 (3.8); 3.7101 (1.3); 3.3183 (840.6); 3.2498 (0.7); 3.2110 (0.5); 2.9361 (0.5); 2.7328 (2.9); 2.7269 (4.0); 2.7209 (2.8); 2.6131 (0.5); 2.5129 (256.1); 2.5069 (526.6); 2.5009 (718.3); 2.4948 (518.7); 2.4889 (241.9); 2.4235 (0.7); 2.3348 (0.6); 2.3068 (0.6); 2.2768 (2.8); 2.2709 (4.2); 2.2653 (3.0); 1.3326 (3.8); 1.3082 (9.1); 1.2836 (3.8); 1.1485 (0.9); 0.4356 (0.5); 0.1949 (1.5); 0.0107 (17.1); -0.0001 (400.8); -0.0111 (14.1); -0.1988 (1.7)
I-094		I-094: ¹ H-NMR(300.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3498 (4.9); 9.3477 (5.0); 8.9284 (3.1); 8.9217 (3.4); 8.8299 (2.5); 8.8268 (2.7); 7.8726 (4.2); 7.8665 (1.6); 7.8441 (6.0); 7.7033 (6.0); 7.6747 (4.3); 3.9692 (16.0); 3.8081 (1.0); 3.7833 (3.6); 3.7587 (3.8); 3.7339 (1.1); 3.4012 (0.3); 3.3855 (0.4); 3.3694 (0.7); 3.3325 (433.4); 3.3019 (1.2); 3.2914 (0.7); 2.5136 (12.1); 2.5078 (24.3); 2.5019 (32.5); 2.4961 (22.8); 2.0739 (0.4); 1.3465 (4.0); 1.3220 (9.1); 1.2974 (3.9); 1.0095 (0.3); -0.0005 (14.4); -0.0114 (0.6)
I-095		I-095: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4483 (3.7); 9.3168 (5.0); 8.2814 (3.5); 7.8352 (2.0); 7.8273 (2.4); 7.8154 (3.0); 7.8029 (2.7); 7.6280 (6.2); 7.6196 (5.3); 7.6057 (3.5); 3.9724 (16.0); 3.7887 (1.1); 3.7638 (3.7); 3.7390 (3.9); 3.7149 (1.1); 3.3181 (77.2); 2.7261 (0.6); 2.5127 (45.9); 2.5069 (93.4); 2.5009 (127.1); 2.4949 (92.8); 2.4891 (43.8); 2.2709 (0.8); 2.0741 (0.7); 1.3349 (4.0); 1.3104 (9.1); 1.2857 (3.9); 0.1952 (0.4); 0.0421 (0.4); 0.0107 (3.5); -0.0002 (79.7); -0.0110 (2.8); -0.1989 (0.4)
I-096		I-096: ¹ H-NMR(300.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.3515 (4.8); 9.9284 (2.9); 8.9218 (3.5); 8.8261 (2.8); 7.8759 (0.7); 7.8305 (2.6); 7.8177 (3.2); 7.8048 (2.6); 7.7859 (0.8); 7.6525 (1.1); 7.6289 (6.0); 7.6205 (5.7); 7.6099 (3.5); 7.5598 (0.7); 7.0080 (0.7); 6.2686 (0.8); 4.7230 (0.7); 4.0114 (0.9); 3.9749 (16.0); 3.8103 (1.2); 3.7858 (4.0); 3.7621 (3.7); 3.7379 (1.6); 3.7162 (0.8); 3.4318 (1.0); 3.4168 (1.9); 3.3238 (114.8); 3.2267 (3.6); 3.2099 (1.2); 2.7260 (1.2); 2.5068 (138.8); 2.5009 (181.9); 2.4951 (128.0); 2.2715 (1.0); 1.3476 (4.3); 1.3231 (8.8); 1.2991 (3.6); 0.1297 (0.7); 0.0361 (1.0); 0.0103 (5.1); -0.0005 (101.9); -0.0115 (3.1); -3.2022 (0.7)
I-097		I-097: ¹ H-NMR(300.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.4549 (4.0); 9.3257 (5.2); 8.2888 (3.8); 8.0848 (2.4); 8.0574 (4.8); 8.0027 (5.1); 7.9743 (2.6); 4.0001 (16.0); 3.8021 (1.1); 3.7772 (3.8); 3.7527 (3.8); 3.7283 (1.2); 3.3256 (45.6); 2.5075 (34.3); 2.5017 (45.1); 2.4959 (31.4); 1.3445 (4.1); 1.3200 (9.2); 1.2954 (3.9); -0.0004 (2.6)
I-098		I-098: ¹ H-NMR(300.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 13.0683 (0.8); 10.3906 (0.8); 9.3609 (4.8); 8.9336 (3.1); 8.9273 (3.2); 8.8369 (2.8); 8.0875 (2.5); 8.0603 (4.8); 8.0035 (4.8); 7.9751 (3.1); 7.6151 (0.9); 4.0026 (16.0); 3.8258 (1.3); 3.7984 (4.2); 3.7743 (3.6); 3.4524 (1.0); 3.4283 (1.1); 3.4017 (1.3); 3.3289 (2551.4); 3.2812 (3.0); 3.2607 (1.9); 3.2512 (1.9); 3.2207 (0.9); 3.2113 (0.9); 3.2038 (0.8); 3.1769 (0.9); 2.9440 (0.8); 2.7272 (1.7); 2.5130 (86.8); 2.5072 (170.2); 2.5013 (224.9); 2.4954 (155.3); 2.4386 (0.8); 2.4274 (0.8); 2.2716 (1.4); 2.2648 (1.2); 2.0734 (2.1); 1.3570 (4.2); 1.3324 (9.6); 1.3079 (3.8); 0.0295 (0.8); 0.0103 (5.3); -0.0004 (115.2); -0.0115 (3.1)

10

20

30

40

【 0 3 6 4 】

NMRピークリスト法

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

【 0 3 6 5 】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

1 (強度 1) ; 2 (強度 2) ; . . . ; i (強度 i) ; . . . ; n (強度 n)。

50

【0366】

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

【0367】

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

10

【0368】

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

【0369】

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

【0370】

溶媒及び/又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 $1H$ NMRピークの本発明者らによるリストは、通常、溶媒のピーク、例えば、DMSO- D_6 中のDMSOのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

20

【0371】

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

【0372】

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

30

【0373】

目標化合物のピークを既知方法（*Mestrec*、*ACDシミュレーション*、さらに、経験的に評価された期待値の使用）で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、 $1H$ NMRの慣習的な解釈における関連するピークのピックアップに類似しているであろう。

【0374】

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

40

【0375】

使用実施例ネコノミ（*Ctenocephalides felis*） - 成体ネコノミを用いたインビトロ接触試験

試験管にコーティングするために、9mgの活性成分を、最初に、1mLのアセトン*p.a.*に溶解させ、次いで、アセトン*p.a.*を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び振動させる（揺動回転30rpmで2時間）ことによって250µLの該溶液を25mL容ガラス管の内壁及び底面に均一に分配させる。900ppmの活性成分溶液及び44.7cm²の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5µg/cm²の面積基準薬量が達成される。

50

【0376】

溶媒を蒸発させた後、該管に5～10匹の成体ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室温及び周囲湿度で、水平位でインキュベートする。48時間経過した後、効力を求める。この目的のために、該管を垂直に立て、トントンと叩いてネコノミを試験管の底に落とす。試験管の底で動かないままにいるか又は動きがギクシャクとしているネコノミは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

【0377】

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

10

【0378】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ ($= 500 \text{ g}/\text{ha}$) の施用量で、100%の効力を示す： I - 003、I - 005、I - 007、I - 009、I - 011、I - 013、I - 014、I - 015、I - 018、I - 019、I - 020、I - 022、I - 023。

【0379】

オウシマダニ (*Boophilus microplus*) - 注入試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

20

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

【0380】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ (*Boophilus microplus*) の腹部に1 μL の該活性成分溶液を注入する。その動物を皿に移し、人工気象室内で維持する。

【0381】

効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精していることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室の中で保存する。100%の効力は、受精卵を産んだマダニが無かったことを意味し；0%は、全ての卵が受精していることを意味する。

30

【0382】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20 μg の施用量で、100%の効力を示す： I - 041。

【0383】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20 μg の施用量で、90%の効力を示す： I - 016。

【0384】

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - 経口試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

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

40

【0385】

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

【0386】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのネコノミが死んだことを

50

意味し；0%は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0387】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： I - 003、I - 005、I - 011、I - 013、I - 014、I - 015、I - 018、I - 020、I - 023、I - 033、I - 038、I - 039、I - 055。

【0388】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、95%の効力を示す： I - 007、I - 009、I - 019、I - 022、I - 029。

【0389】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%の効力を示す： I - 040。

【0390】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： I - 025、I - 049。

【0391】

ヒツジキンバエ (Lucilia cuprina) 試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

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

【0392】

約20匹のヒツジキンバエ (Australian sheep blowfly) (Lucilia cuprina) のL1幼虫を、馬肉の挽肉及び所望濃度の活性成分配合物を含んでいる試験容器の中に移す。

【0393】

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

【0394】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： I - 001、I - 003、I - 005、I - 007、I - 008、I - 009、I - 011、I - 012、I - 013、I - 014、I - 015、I - 016、I - 018、I - 019、I - 020、I - 022、I - 023、I - 030、I - 033、I - 040、I - 043、I - 049、I - 055、I - 092。

【0395】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、95%の効力を示す： I - 029、I - 046。

【0396】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、80%の効力を示す： I - 021。

【0397】

イエバエ (Musca domestica) 試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

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

【0398】

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

【0399】

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

10

20

30

40

50

【0400】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 ppmの施用量で、100%の効力を示す： I - 005、I - 019。

【0401】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 ppmの施用量で、90%の効力を示す： I - 033。

【0402】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 ppmの施用量で、80%の効力を示す： I - 009、I - 014、I - 018、I - 049。

【0403】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 経口試験

溶媒： 100重量部のアセトン

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、水を用いて調合して所望の濃度とする。

【0404】

50 µLの該活性成分配合物をマイクロタイタープレートの中に移し、150 µLのIPL41昆虫培地(33% + 15%糖)を用いて最終体積200 µLとする。次いで、そのプレートをパラフィルムで密閉し、第2のマイクロタイタープレートの中のモモアカアブラムシ (Myzus persicae) の混合個体群がそのパラフィルムに孔を開け、上記溶液を吸入することができる。

【0405】

5日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0406】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、4 ppmの施用量で、100%の効力を示す： I - 001、I - 002、I - 003、I - 004、I - 005、I - 007、I - 008、I - 009、I - 011、I - 012、I - 013、I - 014、I - 015、I - 016、I - 017、I - 018、I - 019、I - 020、I - 021、I - 022、I - 023、I - 025、I - 026、I - 027、I - 028、I - 029、I - 030、I - 031、I - 032、I - 033、I - 034、I - 036、I - 038、I - 039、I - 040、I - 041、I - 042、I - 043、I - 044、I - 045、I - 046、I - 047、I - 048、I - 049、I - 051、I - 052、I - 053、I - 055、I - 056、I - 057、I - 058、I - 059、I - 060、I - 061、I - 062、I - 063、I - 064、I - 065、I - 066、I - 067、I - 068、I - 069、I - 070、I - 072、I - 075、I - 079、I - 080、I - 081、I - 082、I - 084、I - 085、I - 086、I - 087、I - 092、I - 093、I - 094、I - 095、I - 097、I - 098。

【0407】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、4 ppmの施用量で、90%の効力を示す： I - 024、I - 037、I - 050、I - 054、I - 078、I - 096。

【0408】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 噴霧試験

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合して所望の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈

10

20

30

40

50

する。

【0409】

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

【0410】

5日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0411】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 011、I - 014、I - 016、I - 017、I - 018、I - 019、I - 020、I - 021、I - 022、I - 023、I - 030、I - 036、I - 039、I - 040、I - 047、I - 059、I - 060、I - 061、I - 062、I - 063、I - 064、I - 065、I - 067、I - 070、I - 076。

10

【0412】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、90%の効力を示す： I - 003、I - 005、I - 007、I - 008、I - 009、I - 012、I - 013、I - 015、I - 026、I - 027、I - 028、I - 033、I - 034、I - 038、I - 041、I - 042、I - 043、I - 048、I - 049、I - 050、I - 051、I - 055、I - 057、I - 058、I - 069、I - 071、I - 074、I - 075、I - 077、I - 079、I - 082、I - 084、I - 085、I - 086、I - 095、I - 096。

20

【0413】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、70%の効力を示す： I - 029、I - 066。

【0414】

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

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

30

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

【0415】

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

【0416】

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

40

【0417】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、83%の効力を示す： I - 066。

【0418】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 005、I - 007、I - 011、I - 013、I - 014、I - 015、I - 018、I - 019、I - 020、I - 022、I - 023、I - 024、I - 026、I - 027、I - 028、I - 029、I - 036、I - 038、I - 041、I - 042、I - 046、I - 049、I - 055、I - 057、I - 059

50

、 I - 0 6 0、 I - 0 6 1、 I - 0 6 2、 I - 0 6 3、 I - 0 6 7、 I - 0 6 8、 I - 0 6 9、 I - 0 7 0、 I - 0 7 6、 I - 0 7 7、 I - 0 7 8、 I - 0 8 0、 I - 0 8 1、 I - 0 8 2、 I - 0 8 7、 I - 0 9 3、 I - 0 9 6、 I - 0 9 7、 I - 0 9 8。

【 0 4 1 9 】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、83%の効力を示す： I - 0 3 5、 I - 0 6 4、 I - 0 7 9、 I - 0 9 4。

【 0 4 2 0 】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、67%の効力を示す： I - 0 9 2。

【 0 4 2 1 】

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

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

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

【 0 4 2 2 】

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

【 0 4 2 3 】

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

【 0 4 2 4 】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 0 0 5、 I - 0 0 7、 I - 0 1 1、 I - 0 1 4、 I - 0 1 5、 I - 0 1 9、 I - 0 2 4、 I - 0 2 5、 I - 0 2 7、 I - 0 3 3、 I - 0 6 3、 I - 0 6 9、 I - 0 7 6、 I - 0 7 8、 I - 0 8 1、 I - 0 8 7、 I - 0 9 2、 I - 0 9 3、 I - 0 9 4、 I - 0 9 5、 I - 0 9 7、 I - 0 9 8。

【 0 4 2 5 】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、83%の効力を示す： I - 0 1 8、 I - 0 2 0、 I - 0 6 0、 I - 0 7 0、 I - 0 8 2、 I - 0 9 6。

【 0 4 2 6 】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、67%の効力を示す： I - 0 5 7。

【 0 4 2 7 】

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

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

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

【 0 4 2 8 】

全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が発生しているインゲンマメ (Phase

10

20

30

40

50

olus vulgaris)の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

【0429】

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

【0430】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 054、I - 070、I - 077、I - 082、I - 092。

【0431】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、90%の効力を示す： I - 049、I - 050、I - 055、I - 066、I - 074、I - 075、I - 076、I - 086。

10

【0432】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20g/haの施用量で、100%の効力を示す： I - 082。

【0433】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20g/haの施用量で、90%の効力を示す： I - 042、I - 049、I - 077、I - 087。

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

A 0 1 N 53/14 (2006.01)
 A 0 1 P 7/02 (2006.01)
 A 0 1 P 7/04 (2006.01)

F I

A 0 1 N 43/56 G
 A 0 1 N 43/90 1 0 4
 A 0 1 N 43/90 1 0 5
 A 0 1 N 53/14
 A 0 1 P 7/02
 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 100143823
 弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100151448
 弁理士 青木 孝博

(74)代理人 100183519
 弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483
 弁理士 川崎 洋祐

(74)代理人 100203035
 弁理士 五味淵 琢也

(74)代理人 100185959
 弁理士 今藤 敏和

(74)代理人 100160749
 弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255
 弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100202267
 弁理士 森山 正浩

(74)代理人 100146318
 弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812
 弁理士 城山 康文

(72)発明者 ヴィルケ, デイビッド
 ドイツ国、4 0 2 3 5・デュッセルドルフ、デガーシュトラッセ・4

(72)発明者 ヘイガー, ドミニク
 ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、ロッテンシュトラッセ・1 0

(72)発明者 ホフマイスター, ラウラ
 ドイツ国、4 0 5 9 3・デュッセルドルフ、ウルデンバッハー・アレー・1 9

(72)発明者 カウシュ-ビーズ, ニーナ
 ドイツ国、5 1 4 6 7・ベルギッシュ・グラートバッハ、イルレンフェルダー・ヴェーク・3 8 ア
 ー

(72)発明者 モスリン, マルク
 ドイツ国、5 0 9 3 5・ケルン、バッヘマー・シュトラッセ・3 4 1 アー

(72)発明者 ウィロット, マシュー
 ドイツ国、4 0 2 1 5・デュッセルドルフ、ヤーンシュトラッセ・1 5

(72)発明者 フィッシャー, リュディガー
 ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツォー・デン・フーフフェレン・2 3

-
- (72)発明者 イルグ, ケルスティン
ドイツ国、50670・ケルン、ノイツァー・ヴァール・32
- (72)発明者 ゲルゲンス, ウルリッヒ
ドイツ国、40882・ラーティンゲン、フェスター・シュトラッセ・37
- (72)発明者 タルベルク, アンドレアス
ドイツ国、42781・ハーン、ジンターシュトラッセ・86
- 審査官 神谷 昌克
- (56)参考文献 国際公開第2016/039444(WO, A1)
国際公開第2013/180193(WO, A1)
特表2016-528189(JP, A)
国際公開第2016/169886(WO, A1)
国際公開第2016/129684(WO, A1)
国際公開第2016/162318(WO, A1)
- (58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)
C07D
A01N
CAplus/REGISTRY(STN)