

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2021-514949

(P2021-514949A)

(43) 公表日 令和3年6月17日(2021.6.17)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>CO7D 471/04 (2006.01)</b>	CO7D 471/04 106A	2B121
<b>CO7D 519/00 (2006.01)</b>	CO7D 519/00 311	4C065
<b>AO1P 7/04 (2006.01)</b>	CO7D 519/00 CSP	4C072
<b>AO1P 7/02 (2006.01)</b>	AO1P 7/04	4H011
<b>AO1N 43/90 (2006.01)</b>	AO1P 7/02	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 137 頁) 最終頁に続く

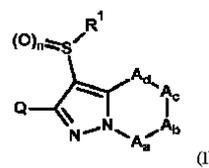
(21) 出願番号 特願2020-544040 (P2020-544040)	(71) 出願人 313006625 バイエル・アクチエンゲゼルシャフト
(86) (22) 出願日 平成31年2月14日 (2019.2.14)	ドイツ連邦共和国、51373・レーフェルターゼン、カイザー・ヴィルヘルム・アレー・1
(85) 翻訳文提出日 令和2年10月15日 (2020.10.15)	
(86) 国際出願番号 PCT/EP2019/053631	(74) 代理人 100114188 弁理士 小野 誠
(87) 国際公開番号 W02019/162174	(74) 代理人 100119253 弁理士 金山 賢教
(87) 国際公開日 令和1年8月29日 (2019.8.29)	(74) 代理人 100124855 弁理士 坪倉 道明
(31) 優先権主張番号 18157886.5	(74) 代理人 100129713 弁理士 重森 一輝
(32) 優先日 平成30年2月21日 (2018.2.21)	(74) 代理人 100137213 弁理士 安藤 健司
(33) 優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁 (EP)	

最終頁に続く

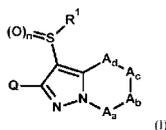
(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての縮合二環式ヘテロ環誘導体

(57) 【要約】

本発明は、式(I)〔式中、Aa、Ab、Ac、Ad、Q、R<sup>1</sup>及びnは、本明細書中で定義されているように定義される〕で表される新規化合物、害虫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、それらを製造するための方法及び中間体生成物に関する。



【化1】

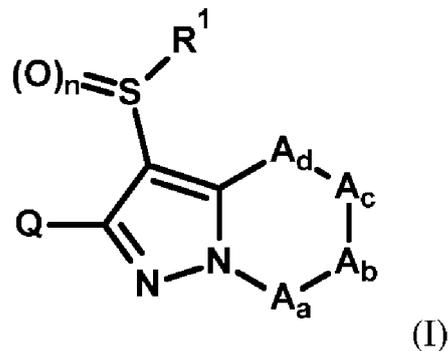


## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 (I)

## 【化 1】



10

〔式中、

A a は、 $-C(R^8)(R^9)-$  であり；A b は、 $-C(R^{10})(R^{11})-$  であり；A c は、 $-C(R^{12})(R^{13})-$  であり；A d は、 $-C(R^{14})(R^{15})-$  であり；

20

R<sup>1</sup> は、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-シアノアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-シアノアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルキニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアル  
 キニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-シアノアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキ  
 ル-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、ハロ-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、アミノ  
 、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-アミノ、(C<sub>3</sub>-  
 C<sub>8</sub>)-シクロアルキルアミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)-アルキルチオ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルチオ  
 -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハ  
 ロアルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ-(C  
 1-C<sub>6</sub>)-アルキルチオ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>  
 -C<sub>6</sub>)-アルキルカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアル  
 キルカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシカルボニル-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
 )-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル-(C<sub>1</sub>  
 -C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルアミノスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ア  
 ルキル、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルアミノスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルで  
 あり；

30

40

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup> は、独立して、水素、  
 シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C<sub>1</sub>-

50

$C_6$ ) - アルキルシリル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキル - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、ハロ - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、シアノ - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - シアノアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_2 - C_6$ ) - アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) - ハロアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) - シアノアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) - アルキニル、( $C_2 - C_6$ ) - ハロアルキニル、( $C_2 - C_6$ ) - シアノアルキニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - シアノアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルヒドロキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルフィニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルカルボニルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、( $C_2 - C_6$ ) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - ( $C_2 - C_6$ ) - アルケニルアミノカルボニル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノ、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノスルホニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキルアミノ、 $NHCO$  - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルカルボニルアミノ) であり、  
 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  は、いずれの場合にも、1回又は複数回、同じように又は異なるように置換されていてもよいアリール又はヘタリール [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/又は、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、 $SCN$ 、トリ - ( $C_1 - C_6$ ) アルキルシリル、( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキル - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) ハロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) シアノアルキル、( $C_1 - C_6$ ) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) ハロアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) シアノアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、( $C_2 - C_6$ ) ハロアルキニル、( $C_2 - C_6$ ) シアノアルキニル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) ハロアルコキ

10

20

30

40

50

シ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルアミノカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>)シクロアルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノチオカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>)シクロアルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ]であり；

Qは、部分的飽和又は飽和のヘテロ環式又はヘテロ芳香族の8員、9員、10員、11員又は12員の縮合二環式又は三環式の環系[ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、該環系は、同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよく、及び、ここで、該置換基は、独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルシリル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、シアノ - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、ハロ - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルキニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アル

キル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - アミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルアミノカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキルアミノ、NHCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル((C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニルアミノ)から選択されることができ、

10

又は、ここで、該置換基は、独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環(ここで、フェニル又は該環は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてよい)から選択されることができ]であり；

20

nは、0、1又は2である]

で表される化合物。

【請求項2】

Aaは、-C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>)-であり；

Abは、-C(R<sup>10</sup>)(R<sup>11</sup>)-であり；

Acは、-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-であり；

Adは、-C(R<sup>14</sup>)(R<sup>15</sup>)-であり；

R<sup>1</sup>は、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル - アミノ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル - アミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルアミノであり；

30

40

50

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  は、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキルシリル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル- ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキル- ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、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- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_2 - C_4$ ) アルケニル、( $C_2 - C_4$ ) ハロアルケニル、( $C_2 - C_4$ ) シアノアルケニル、( $C_2 - C_4$ ) アルキニル、( $C_2 - C_4$ ) ハロアルキニル、( $C_2 - C_4$ ) シアノアルキニル、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) シアノアルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシ- ( $C_1 - C_4$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルヒドロキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルキル- ( $C_1 - C_4$ ) アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキル- ( $C_1 - C_4$ ) アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルチオ、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルチオ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルチオ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルスルフィニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルフィニル- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニル- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニルオキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノカルボニル、ジ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノ、ジ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノ、アミノスルホニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノスルホニル、ジ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、 $NHCO - (C_1 - C_4)$  アルキル ( $(C_1 - C_4)$  アルキルカルボニルアミノ) であり、及び、さらに、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  は、それぞれが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フェニル又はヘタリール[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/又は、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、アミノ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル- ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキル- ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキル、( $C_1 - C_4$ ) シアノアルキル、( $C_1 - C_4$ ) ヒドロキシアルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_2 - C_4$ ) アルケニル、( $C_2 - C_4$ ) ハロアルケニル、( $C_2 - C_4$ ) シアノアルケニル、( $C_2 - C_4$ ) アルキニル、( $C_2 - C_4$ ) ハロアルキニル、( $C_2 - C_4$ ) シアノアルキニル、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) シアノアルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシ- ( $C_1 - C_4$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルヒドロキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルキル- ( $C_1 - C_4$ ) アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキル- ( $C_1 - C_4$ ) アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルチオ、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルチオ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルチオ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルスルフィニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルフィニル- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニル- ( $C_1 - C_4$ ) アルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニルオキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノカルボニル、ジ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノ、ジ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノ、アミノスルホニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノスルホニル、ジ- ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノ

10

20

30

40

50

スルホニル、 $\text{NHCO} - (\text{C}_1 - \text{C}_4)$ アルキル ( $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ アルキルカルボニルアミノ)]であり；

Qは、ヘテロ芳香族の8員、9員、10員、11員又は12員の縮合二環式又は三環式の環系[ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、該環系は、同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよく、及び、ここで、該置換基は、独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、 $\text{SCN}$ 、トリ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルシリル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキル、シアノ- $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキル- $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル- $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキル、ハロ- $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -シアノアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ヒドロキシアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -ハロアルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -シアノアルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -アルキニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -アルキニルオキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -ハロアルキニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルコキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -アルケニルオキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ -ハロアルケニルオキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -シアノアルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルヒドロキシイミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシイミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシイミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルチオ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルキルチオ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルチオ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルチオ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルフィニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルキルスルフィニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルフィニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルフィニル- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルホニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルキルスルホニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルホニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルホニル- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルホニルオキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルカルボニル- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルチオカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルキルカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルカルボニルオキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルコキシカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノチオカルボニル、ジ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノカルボニル、ジ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノチオカルボニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキルアミノカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルホニルアミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノ、ジ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノスルホニル、ジ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノスルホニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノチオカルボニル、ジ- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルアミノチオカルボニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_8)$ -シクロアルキルアミノ、 $\text{NHCO} - (\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキル ( $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ -アルキルカルボニルアミノ)から選択されることができ、

又は、ここで、該置換基は、独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環(ここで、フェニル又は該環は、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロアルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -ハロアルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -ハロアルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -ハロシクロアルキル、ハロゲン、 $\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -ハロアルコキシで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよい)から選択されることができ]であり；

nは、0、1又は2である；

10

20

30

40

50

請求項 1 に記載の式 ( I ) で表される化合物。

【請求項 3】

A a は、 $-C(R^8)(R^9)-$  であり；

A b は、 $-C(R^{10})(R^{11})-$  であり；

A c は、 $-C(R^{12})(R^{13})-$  であり；

A d は、 $-C(R^{14})(R^{15})-$  であり；

$R^1$  は、 $(C_1 - C_4)$  - アルキル、 $(C_1 - C_4)$  - ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$  - 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、 $(C_2 - C_4)$  - アルキニル、 $(C_2 - C_4)$  - ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$  - シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$  - アルキルチオ -  $(C_1 - C_4)$  - アルキル、 $(C_1 - C_4)$  - アルキルスルフィニル -  $(C_1 - C_4)$  - アルキル又は  $(C_1 - C_4)$  - アルキルスルホニル -  $(C_1 - C_4)$  - アルキルであり；

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  は、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ -  $(C_1 - C_4)$  アルキルシリル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル -  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$  アルキル -  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ハロ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、シアノ -  $(C_3 - C_8)$  - 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、 $(C_1 - C_4)$  アルコキシ -  $(C_1 - C_4)$  アルキル、 $(C_2 - C_4)$  アルケニル、 $(C_2 - C_4)$  ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$  シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$  アルキニル、 $(C_2 - C_4)$  ハロアルキニル、 $(C_2 - C_4)$  シアノアルキニル、 $(C_1 - C_4)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$  ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$  シアノアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$  アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$  アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$  アルキル -  $(C_1 - C_4)$  アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$  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、 $(C_1 - C_4)$  アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$  アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$  ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$  アルキルアミノカルボニル、ジ -  $(C_1 - C_4)$  アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$  アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$  アルキルアミノ、ジ -  $(C_1 - C_4)$  アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$  アルキルアミノスルホニル、ジ -  $(C_1 - C_4)$  アルキル - アミノスルホニル、NHCO -  $(C_1 - C_4)$  アルキル  $(C_1 - C_4)$  アルキルカルボニルアミノ) であり、

及び、さらに、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  は、それぞれが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フェニル又はヘタリール [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/又は、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、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル -  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$  アルキル -  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ハロ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$  アルキル、 $(C_1 - C_4)$  ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$  シアノアルキル、 $(C_2 - C_4)$  アルケニル、 $(C_2 - C_4)$  ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$  シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$  アルキニル、 $(C_2 - C_4)$  ハロアルキニル、 $(C_2 - C_4)$  シアノアルキニル、 $(C_1 - C_4)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$  ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$  アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$  アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$  アルキル -  $(C_1 - C_4)$  アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$  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、 $(C_1 - C_4)$  アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$  アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$  ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$  アルキルアミノカルボニル、ジ -  $(C_1 - C_4)$  アル

10

20

30

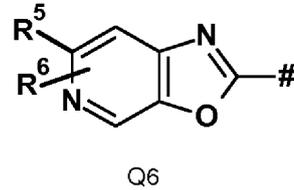
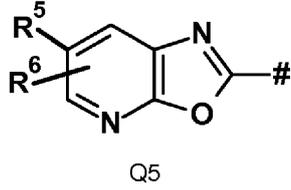
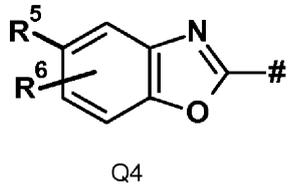
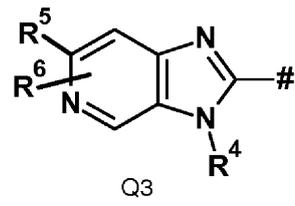
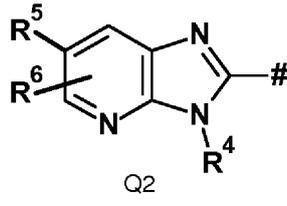
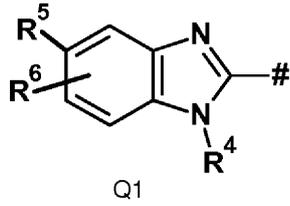
40

50

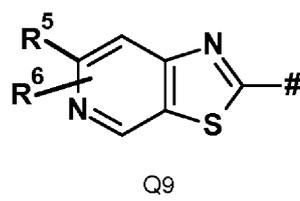
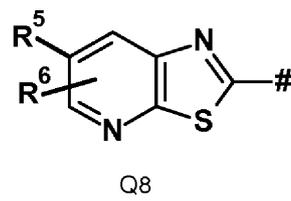
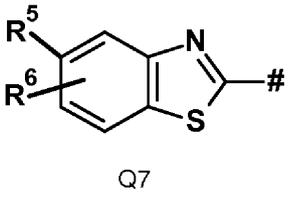
キルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノスルホニル、NHCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル((C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニルアミノ)]であり;

Qは、Q<sub>1</sub> ~ Q<sub>21</sub>

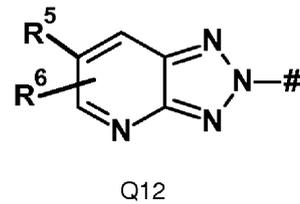
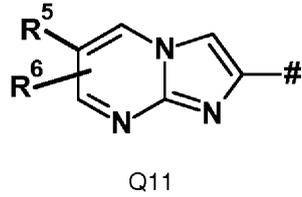
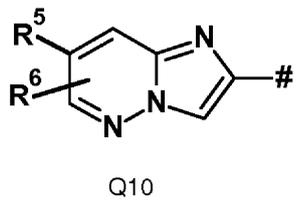
【化 2】



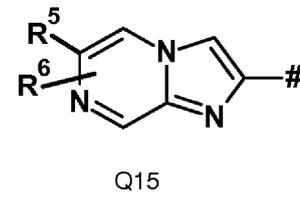
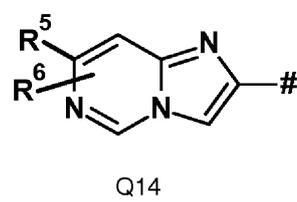
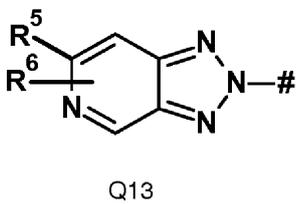
10



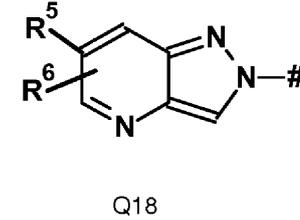
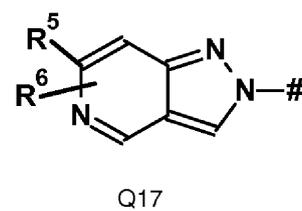
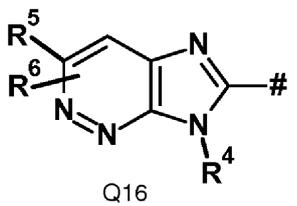
20

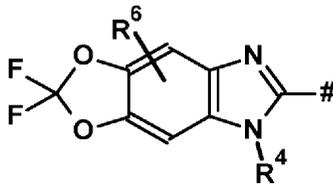


30

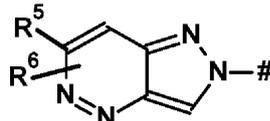


40

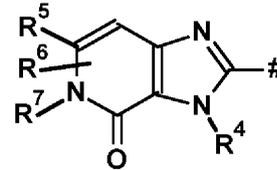




Q19



Q20



Q21

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三環式の環系であり；

R<sup>4</sup>は、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-シアノアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-シアノアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、ハロ-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルチオ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル又は(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルであり；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>は、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、シアノ-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルアミノスルホニル又はジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルアミノスルホニルであり；

R<sup>7</sup>は、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-シアノアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-シアノアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、ハロ-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルチオ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル又は(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルであり；

nは、0、1又は2である；

10

20

30

40

50

請求項 1 に記載の式 ( I ) で表される化合物。

【請求項 4】

A a は、 $-C(R^8)(R^9)-$  であり；

A b は、 $-C(R^{10})(R^{11})-$  であり；

A c は、 $-C(R^{12})(R^{13})-$  であり；

A d は、 $-C(R^{14})(R^{15})-$  であり；

R<sup>1</sup> 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、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；

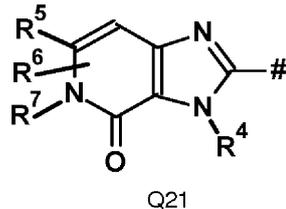
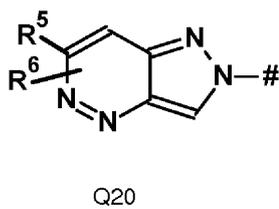
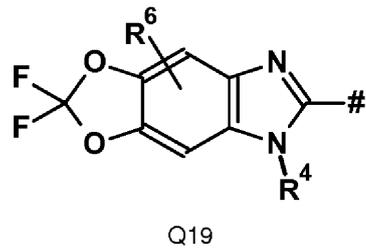
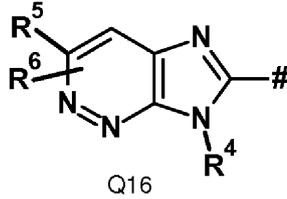
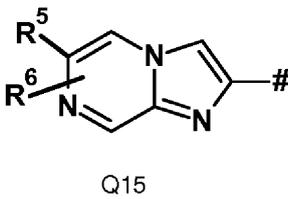
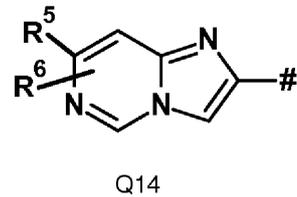
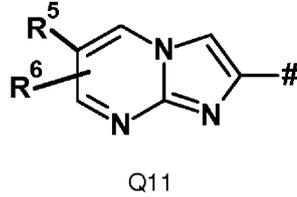
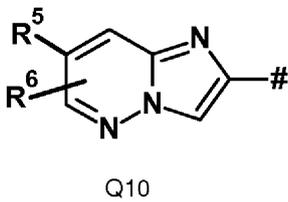
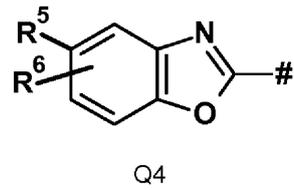
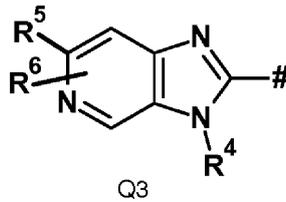
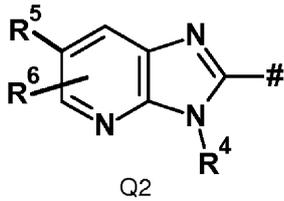
10

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup> は、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、シアノ-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルホニル又はNHCO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルカルボニルアミノ)であり；

Q は、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>、Q<sub>10</sub>、Q<sub>11</sub>、Q<sub>14</sub>、Q<sub>15</sub>、Q<sub>16</sub>、Q<sub>19</sub>、Q<sub>20</sub> 又は Q<sub>21</sub>

20

## 【化 3】



10

20

30

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三環式の環系であり；

R<sup>4</sup> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル又は (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルであり；

R<sup>5</sup> は、水素、シアノ、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、シアノ - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ (alkylthio)、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノスルホニル又はジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノスルホニルであり；

R<sup>6</sup> は、水素又はメチルであり；

R<sup>7</sup> は、水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>

40

50

) ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル又は(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 である；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 5】

A a は、-C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>)- であり；

A b は、-C(R<sup>10</sup>)(R<sup>11</sup>)- であり；

A c は、-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)- であり；

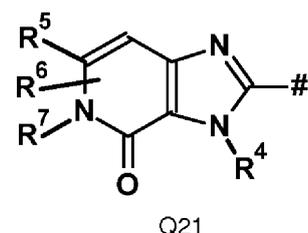
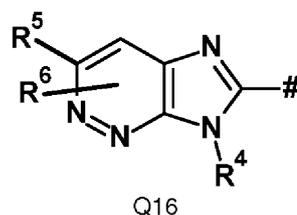
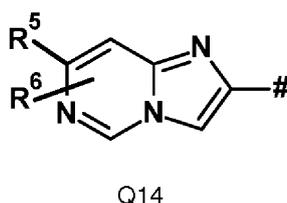
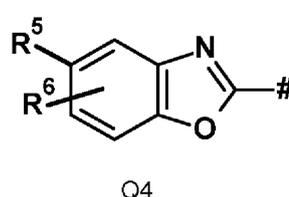
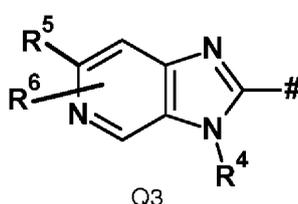
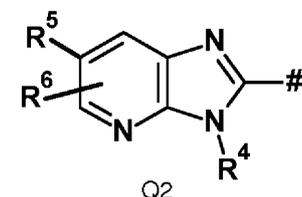
A d は、-C(R<sup>14</sup>)(R<sup>15</sup>)- であり；

R<sup>1</sup> は、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル又はシクロプロピルであり；

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup> は、独立して、水素、シアノ、シクロプロピル、シクロブチル、シアノシクロプロピル、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロエチル、メトキシ又はエトキシであり；

Q は、Q 2、Q 3、Q 4、Q 10、Q 14、Q 16 又は Q 21

【化 4】



の群から選択されるヘテロ芳香族の 9 員縮合二環式環系であり；

R<sup>4</sup> は、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

R<sup>5</sup> は、フッ素、塩素、臭素、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 (CH<sub>2</sub>CFH<sub>2</sub>、CHFCH<sub>3</sub>)、ジフルオロエチル (CF<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>、CHFCHF<sub>2</sub>)、トリフルオロエチル (CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、CHFCHF<sub>2</sub>、CF<sub>2</sub>CFH<sub>2</sub>)、テトラフルオロエチル (CHFCHF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>)、

10

20

30

40

50

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フィニル、トリフルオロメチルスルホニル又はシアノシクロプロピルであり；

R<sup>6</sup> は、水素であり；

R<sup>7</sup> は、メチル、エチル、i - プロピル、シクロプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

n は、0、1又は2である；

請求項1に記載の式(I)で表される化合物。

【請求項6】

A a は、- C ( R<sup>8</sup> ) ( R<sup>9</sup> ) - であり；

10

A b は、- C ( R<sup>1 0</sup> ) ( R<sup>1 1</sup> ) - であり；

A c は、- C ( R<sup>1 2</sup> ) ( R<sup>1 3</sup> ) - であり；

A d は、- C ( R<sup>1 4</sup> ) ( R<sup>1 5</sup> ) - であり；

R<sup>1</sup> は、エチルであり；

R<sup>8</sup> は、水素であり；

R<sup>9</sup> は、水素であり；

R<sup>1 0</sup> は、水素、メチル又はトリフルオロメチルであり；

R<sup>1 1</sup> は、水素であり；

R<sup>1 2</sup> は、水素、メチル又はトリフルオロメチルであり；

R<sup>1 3</sup> は、水素であり；

20

R<sup>1 4</sup> は、水素であり；

R<sup>1 5</sup> は、水素であり；

Q は、Q 2、Q 3、Q 4 又は Q 2 1 の群から選択されるヘテロ芳香族の9員縮合二環式環系であり；

R<sup>4</sup> は、メチルであり；

R<sup>5</sup> は、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；

R<sup>6</sup> は、水素であり；

R<sup>7</sup> は、メチルであり；

30

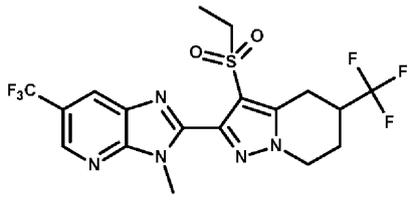
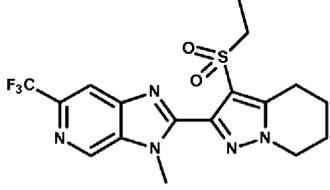
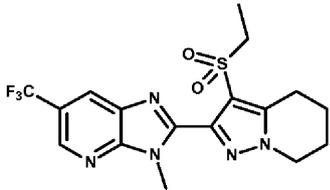
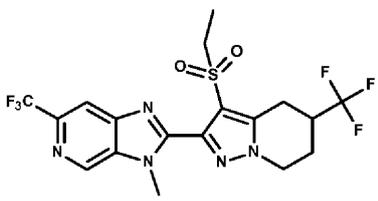
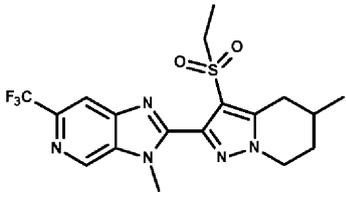
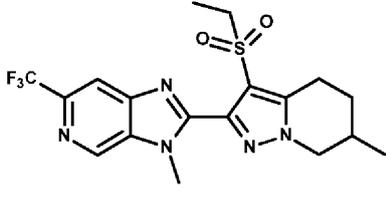
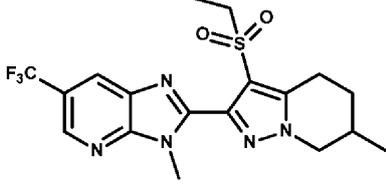
n は、2である；

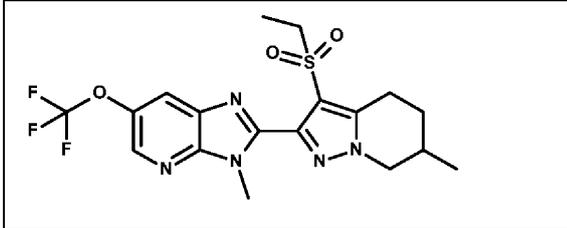
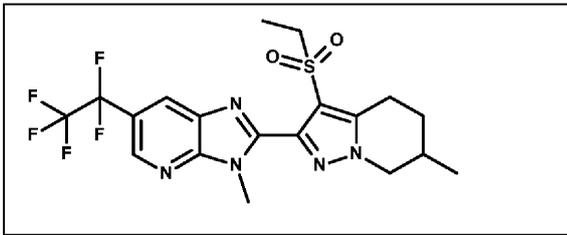
請求項1に記載の式(I)で表される化合物。

【請求項7】

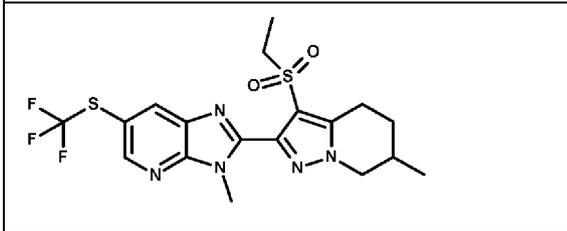
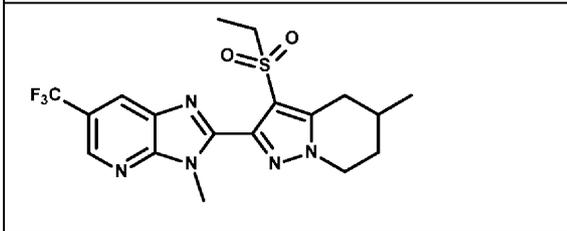
前記化合物が、下記構造：

【表 1】

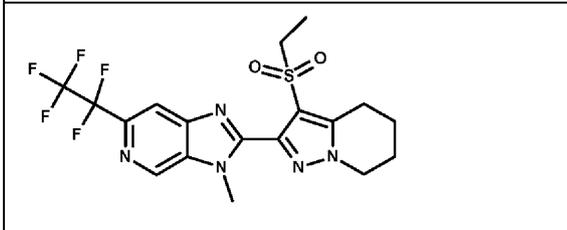
	
	10
	20
	30
	40
	
	



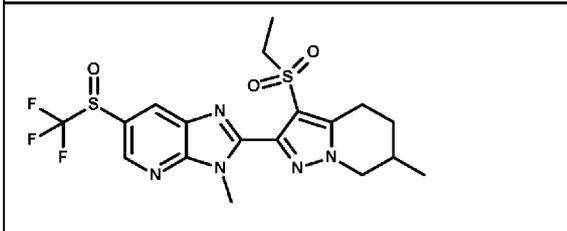
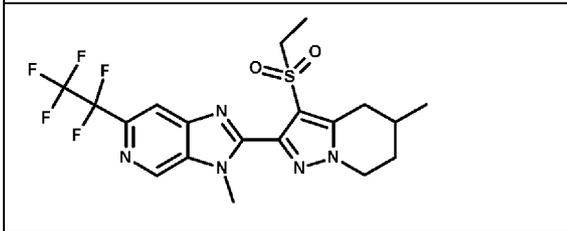
10



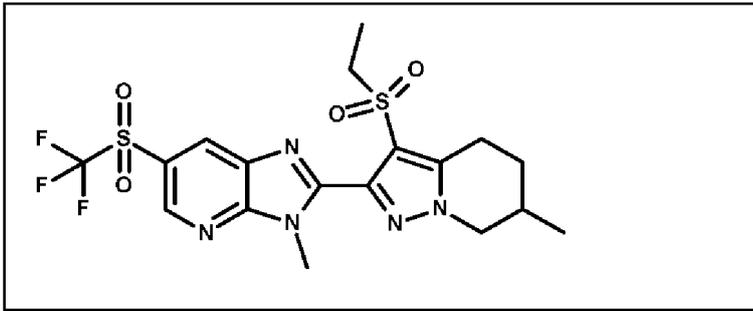
20



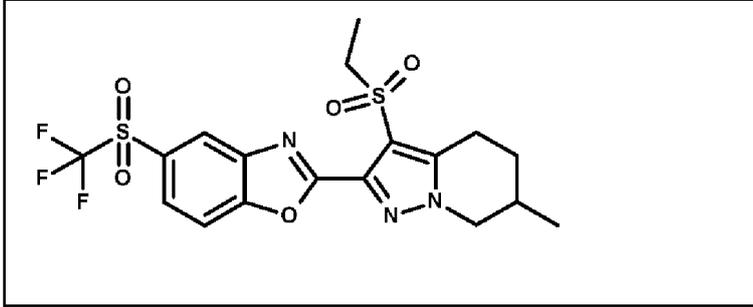
30



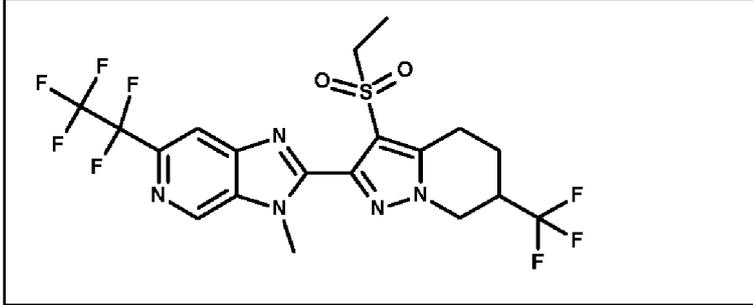
40



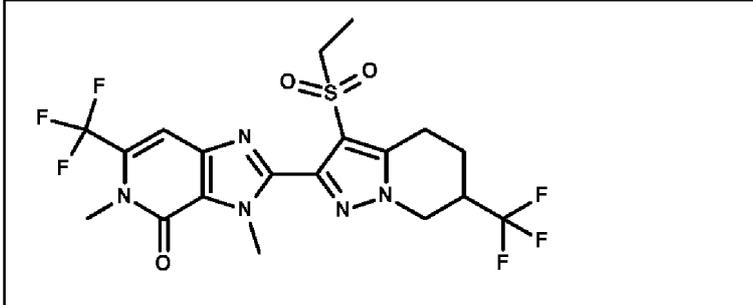
10



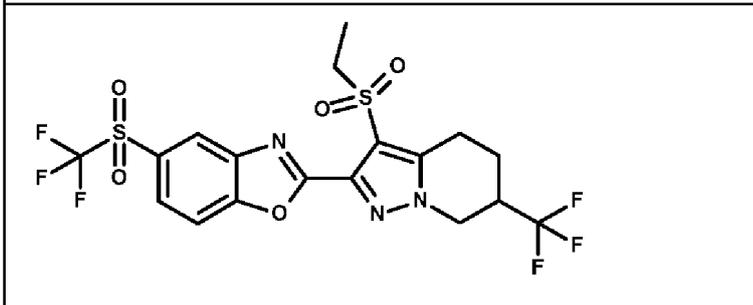
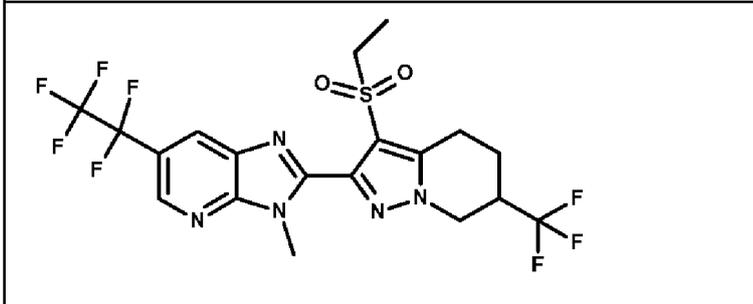
20



30



40



50

を有する、請求項 1 に記載の式 ( I ) で表される化合物。

【請求項 8】

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んでおり、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 9】

さらなる農薬活性成分を付加的に含んでいる、請求項 8 に記載の農薬製剤。

【請求項 10】

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 8 若しくは 9 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する、前記方法。

10

【請求項 11】

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 8 若しくは 9 に記載の農薬製剤の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式 ( I ) で表される新規縮合二環式ヘテロ環誘導体、害虫 ( animal pests ) 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。

20

【背景技術】

【0002】

殺虫特性を有している縮合二環式ヘテロ環誘導体は、文献中に、例えば、WO 2010 / 125985、WO 2012 / 074135、WO 2012 / 086848、WO 2013 / 018928、WO 2013 / 191113、WO 2014 / 142292、WO 2014 / 148451、WO 2015 / 000715、WO 2016 / 124563、WO 2016 / 124557、WO 2016 / 162318、WO 2017 / 093180、WO 2017 / 125340、WO 2017 / 174414、EP - A - 3241830、EP 17154789 . 6、WO 2015 / 121136、WO 2015 / 002211、WO 2015 / 071180、WO 2016 / 020286、WO 2015 / 059039、WO 2015 / 190316、WO 2016 / 091731、WO 2016 / 107742、WO 2016 / 162318、PCT / EP 2016 / 075365、WO 2017 / 055185、EP 3272756、EP 16189445 . 6、EP 16200177 . 0、EP 17153317 . 7、WO 2016 / 129684、WO 2017 / 001311、WO 2017 / 001314、WO 2017 / 061497、WO 2017 / 084879、WO 2017 / 089190、WO 2017 / 133994 などに、既に記載されている。

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。

40

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

【特許文献 1】 WO 2010 / 125985

50

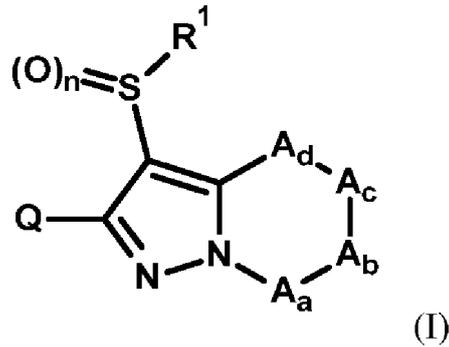
- 【特許文献2】WO2012/074135
- 【特許文献3】WO2012/086848
- 【特許文献4】WO2013/018928
- 【特許文献5】WO2013/191113
- 【特許文献6】WO2014/142292
- 【特許文献7】WO2014/148451
- 【特許文献8】WO2015/000715
- 【特許文献9】WO2016/124563
- 【特許文献10】WO2016/124557
- 【特許文献11】WO2016/162318 10
- 【特許文献12】WO2017/093180
- 【特許文献13】WO2017/125340
- 【特許文献14】WO2017/174414
- 【特許文献15】EP-A-3241830
- 【特許文献16】EP17154789.6
- 【特許文献17】WO2015/121136
- 【特許文献18】WO2015/002211
- 【特許文献19】WO2015/071180
- 【特許文献20】WO2016/020286
- 【特許文献21】WO2015/059039 20
- 【特許文献22】WO2015/190316
- 【特許文献23】WO2016/091731
- 【特許文献24】WO2016/107742
- 【特許文献25】WO2016/162318
- 【特許文献26】PCT/EP2016/075365
- 【特許文献27】WO2017/055185
- 【特許文献28】EP3272756
- 【特許文献29】EP16189445.6
- 【特許文献30】EP16200177.0
- 【特許文献31】EP17153317.7 30
- 【特許文献32】WO2016/129684
- 【特許文献33】WO2017/001311
- 【特許文献34】WO2017/001314
- 【特許文献35】WO2017/061497
- 【特許文献36】WO2017/084879
- 【特許文献37】WO2017/089190
- 【特許文献38】WO2017/133994
- 【発明の概要】
- 【発明が解決しようとする課題】
- 【0005】 40
- 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 (pesticide) のスペクトルを拡大させる及び/又はそれらの活性を向上させる化合物を提供することであった。
- 【課題を解決するための手段】
- 【0006】
- 新規縮合二環式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な点を有している。そのような有利点の例としては、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、向上した殺虫効果又は殺ダニ効果、及び、作物植物との良好な適合性などがある。該縮合二環式ヘテロ環誘導体は、効力(特に、防除が困難な昆虫類に対する効力)を向上させるために別の作用剤と組合せて使用すること 50

が可能である。

【0007】

従って、本発明は、式(I)

【化1】



10

【0008】

[式中(構成1-1)、

Aaは、-C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>)-であり；

Abは、-C(R<sup>10</sup>)(R<sup>11</sup>)-であり；

Acは、-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-であり；

Adは、-C(R<sup>14</sup>)(R<sup>15</sup>)-であり；

20

R<sup>1</sup>は、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-シアノアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-シアノアルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルキニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキニルオキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアル  
 キニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-シアノアルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキ  
 ル-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、ハロ-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、アミノ  
 、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル-アミノ、(C<sub>3</sub>-  
 C<sub>8</sub>)-シクロアルキルアミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)-アルキルチオ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルチオ  
 -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハ  
 ロアルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ-(C  
 1-C<sub>6</sub>)-アルキルチオ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシ-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルフィニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>  
 -C<sub>6</sub>)-アルキルカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアル  
 キルカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルコキシカルボニル-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルコキシカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
 )-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル-(C<sub>1</sub>  
 -C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルアミノスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ア  
 ルキル、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルアミノスルホニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキルで  
 あり；

30

40

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>は、独立して、水素、  
 シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C<sub>1</sub>-

50

$C_6$ ) - アルキルシリル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキル - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、ハロ - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、シアノ - ( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - シアノアルキル、( $C_1 - C_6$ ) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_2 - C_6$ ) - アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) - ハロアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) - シアノアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) - アルキニル、( $C_2 - C_6$ ) - ハロアルキニル、( $C_2 - C_6$ ) - シアノアルキニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - シアノアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルヒドロキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシイミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルフィニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルチオカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルキルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルカルボニルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、( $C_2 - C_6$ ) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - ( $C_2 - C_6$ ) - アルケニルアミノカルボニル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノ、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノスルホニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノチオカルボニル、( $C_3 - C_8$ ) - シクロアルキルアミノ、 $NHCO - (C_1 - C_6)$  - アルキル ( $(C_1 - C_6)$  - アルキルカルボニルアミノ) であり、  
 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  は、いずれの場合にも、1回又は複数回、同じように又は異なるように置換されていてもよいアリール又はヘタリール [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/又は、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、 $SCN$ 、トリ - ( $C_1 - C_6$ ) アルキルシリル、( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキル - ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_3 - C_8$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) ハロアルキル、( $C_1 - C_6$ ) シアノアルキル、( $C_1 - C_6$ ) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) - アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル - ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ - ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) ハロアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) シアノアルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、( $C_2 - C_6$ ) ハロアルキニル、( $C_2 - C_6$ ) シアノアルキニル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) ハロアルコキ

シ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルアミノカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>)シクロアルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノチオカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>)シクロアルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ]であり；

Qは、部分的飽和又は飽和のヘテロ環式又はヘテロ芳香族の8員、9員、10員、11員又は12員の縮合二環式又は三環式の環系[ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、該環系は、同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよく、及び、ここで、該置換基は、独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルシリル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、シアノ - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、ハロ - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルキニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アル

キル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - アミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルアミノカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - アミノチオカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキルアミノ、NHCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル((C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニルアミノ)から選択されることができ、

又は、ここで、該置換基は、独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環(ここで、フェニル又は該環は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてよい)から選択されることができ]であり；

nは、0、1又は2である]

で表される新規化合物を提供する。

#### 【0009】

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、さらに、概して、植物との極めて良好な適合性、特に、作物植物に関して、植物との極めて良好な適合性を示すということが、見いだされた。

#### 【発明を実施するための形態】

#### 【0010】

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。

#### 【0011】

##### 構成2 - 1

A aは、好ましくは、-C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>)-であり；

A bは、好ましくは、-C(R<sup>10</sup>)(R<sup>11</sup>)-であり；

A cは、好ましくは、-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-であり；

A dは、好ましくは、-C(R<sup>14</sup>)(R<sup>15</sup>)-であり；

R<sup>1</sup>は、好ましくは、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキニルオキ

10

20

30

40

50

シ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - アミノ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルアミノであり；

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup> は、好ましくは、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルシリル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、シアノ - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルキニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、NHCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルカルボニルアミノ) であり、

及び、さらに、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup> は、好ましくは、それぞれが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フェニル又はヘタリール [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/又は、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、アミノ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルキニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C

4) アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルアミノスルホニル、NHCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル ( (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルカルボニルアミノ ) ] であり；

Qは、好ましくは、ヘテロ芳香族の8員、9員、10員、11員又は12員の縮合二環式又は三環式の環系 [ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、ここで、該環系は、同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよく、及び、ここで、該置換基は、独立して、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルシリル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、シアノ - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、ハロ - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - アルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノチオカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アル

10

20

30

40

50

キルアミノチオカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルアミノチオカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>) - シクロアルキルアミノ、NHCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル((C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルカルボニルアミノ)から選択されることができ、

又は、ここで、該置換基は、独立して、フェニル又は5員若しくは6員のヘテロ芳香族環(ここで、フェニル又は該環は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてよい)から選択されることができ]であり；

nは、好ましくは、0、1又は2である。

### 【0012】

#### 構成3 - 1

A aは、さらに好ましくは、-C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>) - であり；

A bは、さらに好ましくは、-C(R<sup>10</sup>)(R<sup>11</sup>) - であり；

A cは、さらに好ましくは、-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>) - であり；

A dは、さらに好ましくは、-C(R<sup>14</sup>)(R<sup>15</sup>) - であり；

R<sup>1</sup>は、さらに好ましくは、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル又は(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>は、さらに好ましくは、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルシリル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、シアノ - (C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルキニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルヒドロキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノスルホニル、NHCO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル((C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニルアミノ)であり、

及び、さらに、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>は、さらに好ましくは、それぞれが同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてよいフェニル又はヘタリール[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/又は、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、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル - (C<sub>3</sub> -

10

20

30

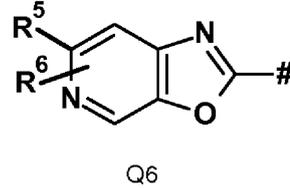
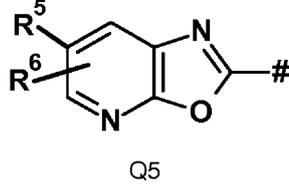
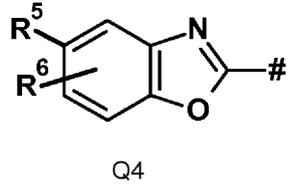
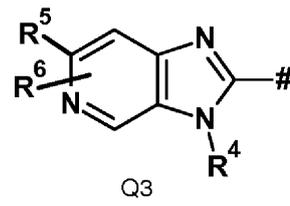
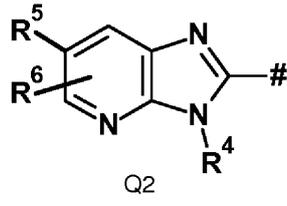
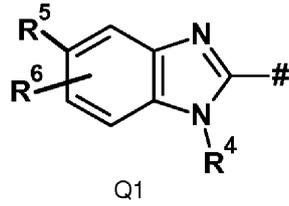
40

50

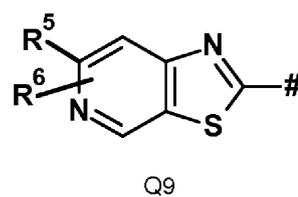
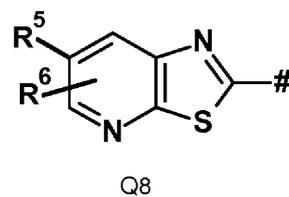
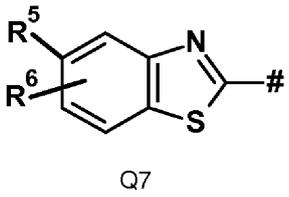
$C_6$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_1 - C_4$ ) アルキル、  
 ( $C_1 - C_4$ ) ハロアルキル、( $C_1 - C_4$ ) シアノアルキル、( $C_2 - C_4$ ) アルケニ  
 ル、( $C_2 - C_4$ ) ハロアルケニル、( $C_2 - C_4$ ) シアノアルケニル、( $C_2 - C_4$ )  
 アルキニル、( $C_2 - C_4$ ) ハロアルキニル、( $C_2 - C_4$ ) シアノアルキニル、( $C_1$   
 -  $C_4$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) ハロアルコキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルヒドロキ  
 シイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) アルキル - ( $C_1 - C_4$ )  
 アルコキシイミノ、( $C_1 - C_4$ ) 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、( $C_1 - C_4$ )  
 アルキルスルホニルオキシ、( $C_1 - C_4$ ) アルキルカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) ハロア  
 ルキルカルボニル、アミノカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノカルボニル、ジ -  
 ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_4$ ) アルキルスルホニルアミノ、  
 ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノ、ジ - ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノ、アミノスルホニル  
 、( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノスルホニル、ジ - ( $C_1 - C_4$ ) アルキルアミノスルホ  
 ニル、 $NHCO - (C_1 - C_4)$  アルキル ( $(C_1 - C_4)$  アルキルカルボニルアミノ)  
 ] であり；

Q は、さらに好ましくは、Q 1 ~ Q 2 1

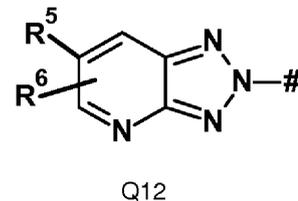
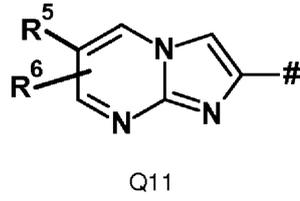
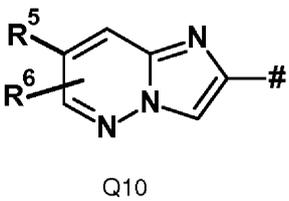
【化 2】



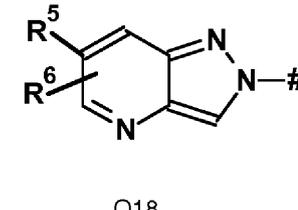
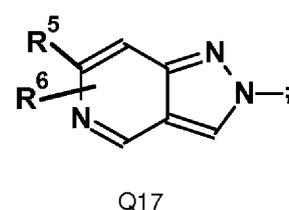
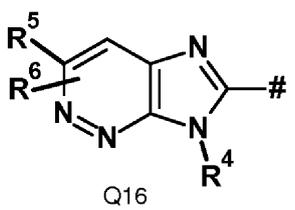
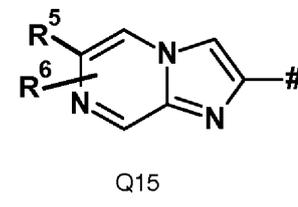
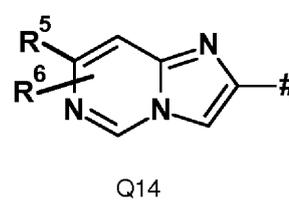
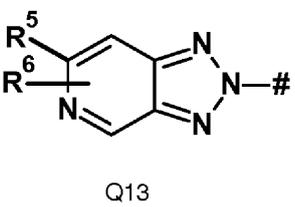
10



20

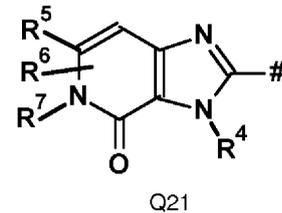
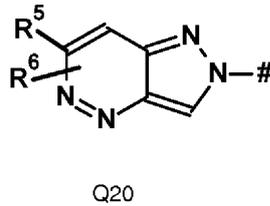
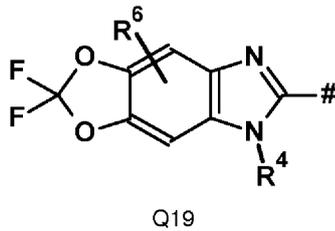


30



40

【 0 0 1 3 】



## 【 0 0 1 4 】

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三環式の環系であり；

R<sup>4</sup>は、さらに好ましくは、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、ハロ - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル又は(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルカルボニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルであり；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>は、独立して、さらに好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、シアノ - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノカルボニル、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノスルホニル又はジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノスルホニルであり；

R<sup>7</sup>は、さらに好ましくは、水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ヒドロキシアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルケニルオキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) ハロアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル又は(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルであり；

10

20

30

40

50

n は、さらに好ましくは、0、1又は2である。

【0015】

構成4-1

A a は、一層さらに好ましくは、 $-C(R^8)(R^9)-$  であり；

A b は、一層さらに好ましくは、 $-C(R^{10})(R^{11})-$  であり；

A c は、一層さらに好ましくは、 $-C(R^{12})(R^{13})-$  であり；

A d は、一層さらに好ましくは、 $-C(R^{14})(R^{15})-$  であり；

R<sup>1</sup> 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、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；

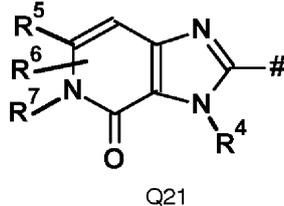
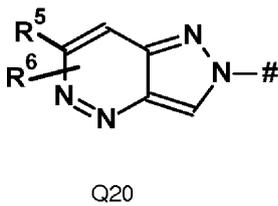
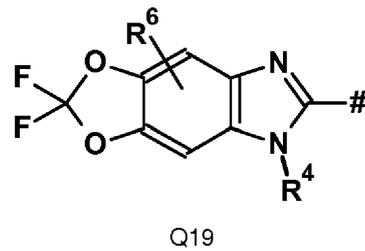
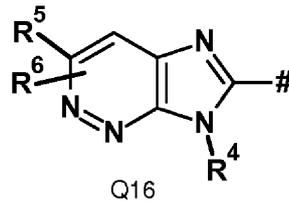
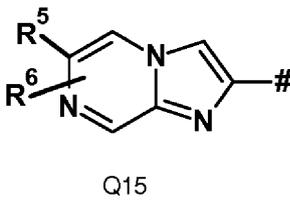
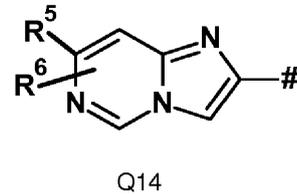
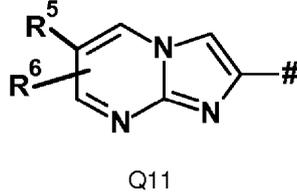
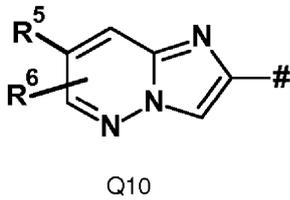
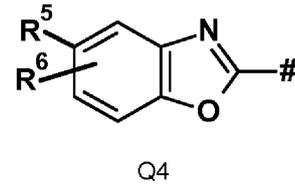
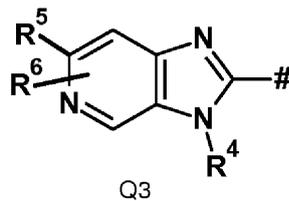
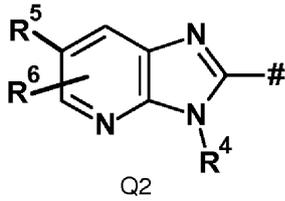
R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup> は、一層さらに好ましくは、独立して、水素、シアノ、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、シアノ-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルホニル又はNHCO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルカルボニルアミノ)であり；

Q は、一層さらに好ましくは、Q 2、Q 3、Q 4、Q 10、Q 11、Q 14、Q 15、Q 16、Q 19、Q 20又はQ 21

10

20

## 【化3】



10

20

30

## 【0016】

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三環式の環系であり；

R<sup>4</sup>は、一層さらに好ましくは、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル又は(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルであり；

R<sup>5</sup>は、一層さらに好ましくは、水素、シアノ、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、シアノ-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシイミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルアミノカルボニル、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルアミノスルホニル又はジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルアミノスルホニルであり；

R<sup>6</sup>は、一層さらに好ましくは、水素又はメチルであり；

R<sup>7</sup>は、一層さらに好ましくは、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)シアノアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)

40

50

アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)シアノアルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルフィニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル又は(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；

nは、一層さらに好ましくは、0、1又は2である。

【0017】

10

構成5 - 1

Aaは、特に、-C(R<sup>8</sup>)(R<sup>9</sup>)-であり；

Abは、特に、-C(R<sup>10</sup>)(R<sup>11</sup>)-であり；

Acは、特に、-C(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>)-であり；

Adは、特に、-C(R<sup>14</sup>)(R<sup>15</sup>)-であり；

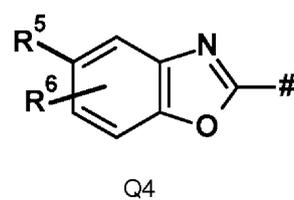
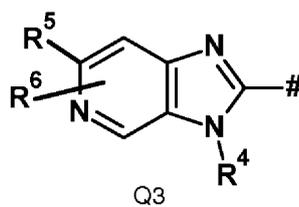
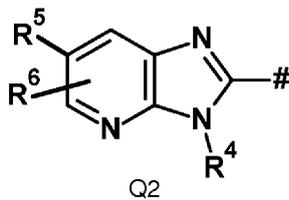
R<sup>1</sup>は、特に、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル又はシクロプロピルであり；

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>は、特に、独立して、水素、シアノ、シクロプロピル、シクロブチル、シアノシクロプロピル、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロエチル、メトキシ又はエトキシであり；

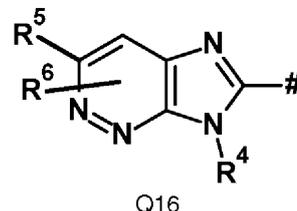
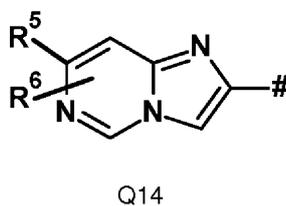
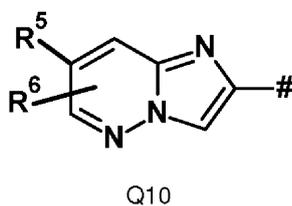
20

Qは、特に、Q2、Q3、Q4、Q10、Q14、Q16又はQ21

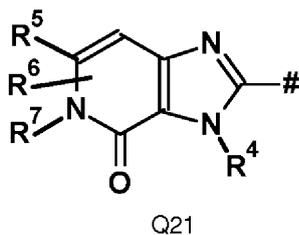
【化4】



30



40



【0018】

の群から選択されるヘテロ芳香族の9員縮合二環式環系であり；

R<sup>4</sup>は、特に、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

R<sup>5</sup>は、特に、フッ素、塩素、臭素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオ

50

ロメチル、フルオロエチル ( $\text{CH}_2\text{CFH}_2$ 、 $\text{CHFCH}_3$ )、ジフルオロエチル ( $\text{CF}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CHF}_2$ 、 $\text{CHFCHF}_2$ )、トリフルオロエチル ( $\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CHFCHF}_2$ 、 $\text{CF}_2\text{CFH}_2$ )、テトラフルオロエチル ( $\text{CHF CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CHF}_2$ )、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フィニル、トリフルオロメチルスルホニル又はシアノシクロプロピルであり；

$\text{R}^6$  は、特に、水素であり；

$\text{R}^7$  は、特に、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

$n$  は、特に、0、1又は2である。

10

#### 【0019】

##### 構成6-1

A a は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^8)(\text{R}^9)-$  であり；

A b は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^{10})(\text{R}^{11})-$  であり；

A c は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^{12})(\text{R}^{13})-$  であり；

A d は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^{14})(\text{R}^{15})-$  であり；

$\text{R}^1$  は、とりわけ、エチルであり；

$\text{R}^8$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^9$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{10}$  は、とりわけ、水素又はメチルであり；

20

$\text{R}^{11}$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{12}$  は、とりわけ、水素、メチル又はトリフルオロメチルであり；

$\text{R}^{13}$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{14}$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{15}$  は、とりわけ、水素であり；

Q は、とりわけ、Q 2 又は Q 3 の群から選択されるヘテロ芳香族の9員縮合二環式環系であり；

$\text{R}^4$  は、とりわけ、メチルであり；

$\text{R}^5$  は、とりわけ、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；

30

$\text{R}^6$  は、とりわけ、水素であり；

$n$  は、とりわけ、2である。

#### 【0020】

##### 構成6-2

A a は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^8)(\text{R}^9)-$  であり；

A b は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^{10})(\text{R}^{11})-$  であり；

A c は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^{12})(\text{R}^{13})-$  であり；

A d は、とりわけ、 $-\text{C}(\text{R}^{14})(\text{R}^{15})-$  であり；

$\text{R}^1$  は、とりわけ、エチルであり；

40

$\text{R}^8$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^9$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{10}$  は、とりわけ、水素、メチル又はトリフルオロメチルであり；

$\text{R}^{11}$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{12}$  は、とりわけ、水素、メチル又はトリフルオロメチルであり；

$\text{R}^{13}$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{14}$  は、とりわけ、水素であり；

$\text{R}^{15}$  は、とりわけ、水素であり；

Q は、とりわけ、Q 2、Q 3、Q 4 又は Q 2 1 の群から選択されるヘテロ芳香族の9員縮合二環式環系であり；

50

R<sup>4</sup> は、とりわけ、メチルであり；

R<sup>5</sup> は、とりわけ、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル又はトリフルオロメチルスルホニルであり；

R<sup>6</sup> は、とりわけ、水素であり；

R<sup>7</sup> は、とりわけ、メチルであり；

n は、とりわけ、2である。

【0021】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、Q<sub>2</sub>であり、並びに、Aa、Ab、Ac、Ad、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>及びnは、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

10

【0022】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、Q<sub>3</sub>であり、並びに、Aa、Ab、Ac、Ad、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>及びnは、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

20

【0023】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、Q<sub>4</sub>であり、並びに、Aa、Ab、Ac、Ad、R<sup>1</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>及びnは、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

【0024】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、Qは、Q<sub>21</sub>であり、並びに、Aa、Ab、Ac、Ad、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>及びnは、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

30

【0025】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>は、水素であり、並びに、Q、Aa、Ab、Ac、Ad、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>及びnは、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

【0026】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>は、水素であり、並びに、R<sup>12</sup>は、トリフルオロメチルであり、並びに、Q、Aa、Ab、Ac、Ad、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>及びnは、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

40

【0027】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>は、水素であり、並びに、R<sup>12</sup>は、メチルであり、並びに、Q、Aa、Ab、Ac、Ad、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>及びnは、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

50

## 【0028】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ は、水素であり、並びに、 $R^{10}$ は、メチルであり、並びに、 $Q$ 、 $Aa$ 、 $Ab$ 、 $Ac$ 、 $Ad$ 、 $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 及び $n$ は、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

## 【0029】

好ましい実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ は、水素であり、並びに、 $R^{10}$ は、トリフルオロメチルであり、並びに、 $Q$ 、 $Aa$ 、 $Ab$ 、 $Ac$ 、 $Ad$ 、 $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 及び $n$ は、構成(1-1)又は構成(2-1)又は構成(3-1)又は構成(4-1)又は構成(5-1)又は構成(6-1)又は構成(6-2)に記載されている定義を有する〕で表される化合物に関する。

10

## 【0030】

好ましい定義において、別途示されていない限り：

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

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

20

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

30

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

## 【0031】

40

特に好ましい定義において、別途示されていない限り：

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

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

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

50

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

【0032】

本発明に関連して、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロアルキル）、1～12個の炭素原子を有する飽和脂肪族炭化水素基のラジカルを意味するものと理解され、そして、分枝鎖又は非分枝鎖であることができる。C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-アルキルラジカルの例は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、1-エチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、n-デシル、n-ウンデシル及びn-ドデシルである。これらのアルキルラジカルの中で、特に好ましいのは、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルラジカルである。とりわけ好ましいのは、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルラジカルである。

10

【0033】

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C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-アルケニルラジカル、例えば、ビニル、アリル、1-プロベニル、イソプロベニル、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、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニルラジカルであり、特に好ましいのは、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニルラジカルである。

20

【0034】

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C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-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、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニルラジカルであり、特に好ましいのは、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-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。

30

【0035】

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、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-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、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキルラジカルである。

【0036】

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。

40

【0037】

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。

【0038】

別途示されていない限り、置換されているラジカルは、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。

50

## 【0039】

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。

## 【0040】

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。

## 【0041】

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。

10

## 【0042】

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。

## 【0043】

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。

## 【0044】

とりわけ、上記においてとりわけ重要であるものとして挙げられている意味の組み合わせを含んでいる式(I)で表される化合物を本発明に従って使用する。

20

## 【0045】

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り得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の望ましい混合物を包含する。

## 【0046】

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。

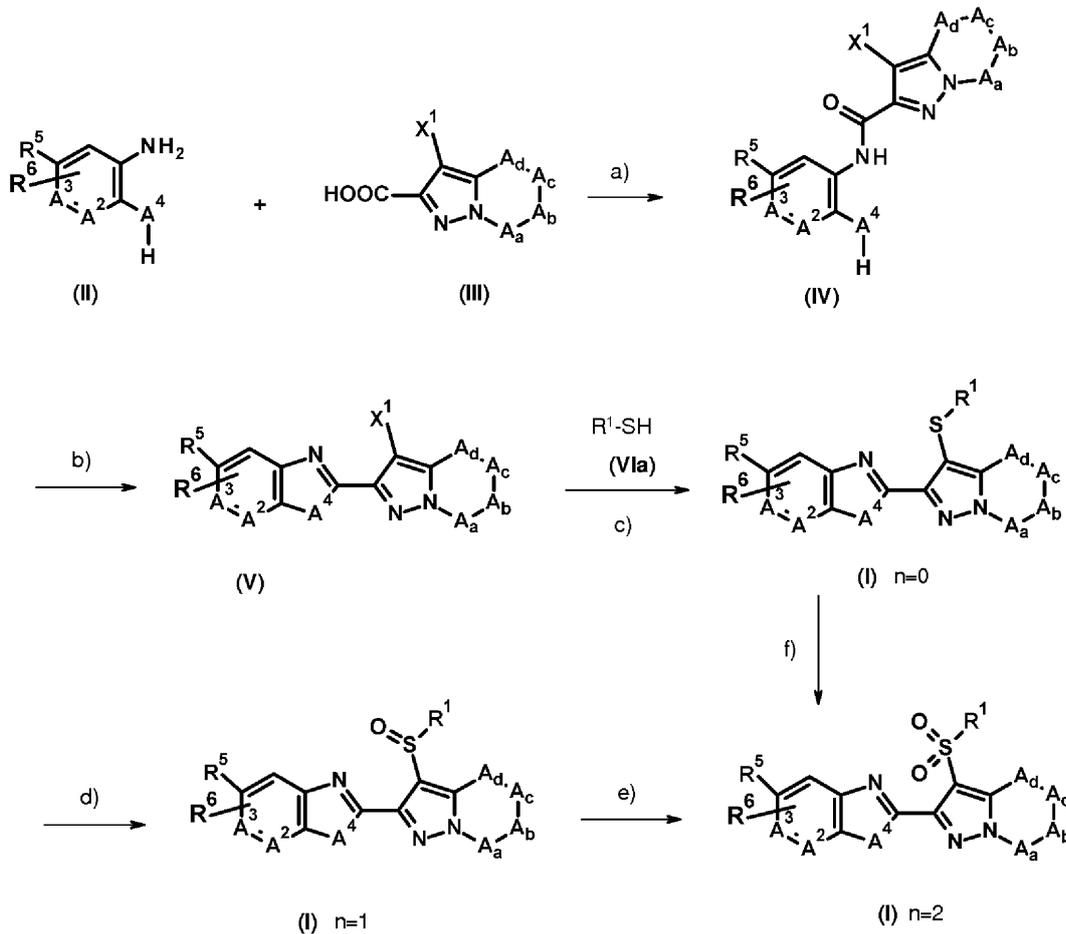
## 【0047】

30

スキーム A - 1

式(I)〔式中、Qは、Q1~Q9、Q19及びQ21である〕で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO2009/131237、WO2010/125985、WO2011/043404、WO2011/040629、WO2012/086848、WO2013/018928、WO2015/000715、WO2015/121136、WO2016/124563、WO2016/124557、WO2017/001311、WO2017/001314、WO2017/061497、WO2017/084879、WO2017/089190、WO2017/133994に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

## 【化5】



10

20

## 【0048】

ラジカル  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^6$ 、 $\text{R}^7$ 、 $\text{A}_a$ 、 $\text{A}_b$ 、 $\text{A}_c$ 、 $\text{A}_d$  及び  $n$  は、上記で記載されている定義を有し、 $\text{A}^2$  及び  $\text{A}^3$  は、 $\text{CH}$  又は  $\text{N}$  であり、 $\text{A}^4$  は、 $\text{O}$ 、 $\text{S}$  又は  $\text{N-R}^4$  であり、並びに、 $\text{X}^1$  は、ハロゲンである。

30

## 【0049】

式 (I) (式中、 $\text{Q}$  は、 $\text{Q}21$  である) で表される化合物の場合、 $\text{A}^2$  は、カルボニルであり、及び、 $\text{A}^3$  は、 $\text{N-R}^7$  である。

## 【0050】

## 段階 (a)

式 (IV) で表される化合物は、US 5576335 に記載されているプロセスと同様にして、式 (II) で表される化合物を縮合剤または塩基の存在下で式 (III) で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

## 【0051】

式 (II) 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 2003/69257、WO 2006/65703、WO 2009/131237、WO 2010/125985、WO 2011/043404、WO 2011/040629、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2015/000715、WO 2016/091731、WO 2016/142326、WO 2016/169882、WO 2016/23954 若しくは WO 2017/84879 に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

40

## 【0052】

式 (III) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。可能な調製経路は、調製方法 E に記載されている。

## 【0053】

50

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

10

**【 0 0 5 4 】**

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

**【 0 0 5 5 】**

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

20

**【 0 0 5 6 】**

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

**【 0 0 5 7 】**段階 ( b )

式 ( V ) で表される化合物は、例えば、WO 2 0 0 9 / 1 3 1 2 3 7、WO 2 0 1 0 / 1 2 5 9 8 5、WO 2 0 1 1 / 0 4 3 4 0 4、WO 2 0 1 1 / 0 4 0 6 2 9、WO 2 0 1 2 / 0 8 6 8 4 8、WO 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8、WO 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 又はWO 2 0 1 5 / 1 2 1 1 3 6 に記載されているプロセスと同様にして、式 ( I V ) で表される化合物を縮合させることによって、調製することができる。

30

**【 0 0 5 8 】**

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

40

**【 0 0 5 9 】**

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

**【 0 0 6 0 】**

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 6 1 】**

50

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

【0062】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)；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。

【0063】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

10

【0064】

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

【0065】

段階(c)

式(I)〔式中、nは0である〕で表される化合物は、式(V)で表される化合物を塩基の存在下で式(VIa)で表される化合物と反応させることによって調製することができる。

【0066】

式(VIa)で表されるメルカプタン誘導体(例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン)は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2006/25633、US2006/111591、US2820062、「Chemical Communications, 13(2000), 1163-1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 44(1922), p.1329」に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

20

【0067】

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

30

【0068】

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

40

【0069】

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

【0070】

上記反応において、X<sup>1</sup>は、好ましくは、フッ素原子又は塩素原子である。

【0071】

別の選択肢(X<sup>1</sup>が臭素又はヨウ素である場合)は、適切なりチウム塩基を用いた金属交換反応とそれに続く適切な市販されているジスルフィドとの反応である；「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 20(2010), 2770-2775」を参照されたい。

50

## 【0072】

さらに、 $X^1$  が臭素又はヨウ素である場合、JP 2017/25059 に記載されているプロセスと同様にして、適切なリガンド（例えば、4,5-ビス（ジフェニルホスフィノ）-9,9-ジメチルキサンテン（キサントホス））の存在下、及び、適切な塩基（例えば、N,N-ジイソプロピルエチルアミン）の存在下で、式（VI a）で表されるメルカプタン誘導体を適切なパラジウム触媒（例えば、ビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウム（0））と一緒に導入することも可能である。該反応は、溶媒の中で、好ましくは、エーテル（例えば、ジオキサン）の中で、実施する。

## 【0073】

段階（d）

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

10

## 【0074】

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

## 【0075】

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

20

## 【0076】

段階（e）

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

30

## 【0077】

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。

## 【0078】

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

## 【0079】

段階（f）

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

40

## 【0080】

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。

## 【0081】

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

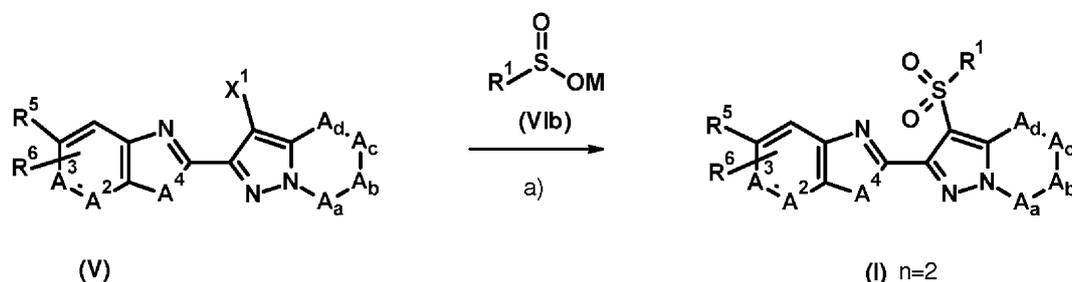
## 【0082】

調製方法 A - 2

50

式 (I) [ 式中、n は、2 であり、及び、Q は、Q 1 ~ Q 9、Q 19 及び Q 2 1 である ] で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO 2 0 0 9 / 1 3 1 2 3 7、WO 2 0 1 0 / 1 2 5 9 8 5、WO 2 0 1 1 / 0 4 3 4 0 4、WO 2 0 1 1 / 0 4 0 6 2 9、WO 2 0 1 2 / 0 8 6 8 4 8、WO 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8、WO 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 及び WO 2 0 1 5 / 1 2 1 1 3 6 に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

【化 6】



10

【0083】

ラジカル R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、A<sub>a</sub>、A<sub>b</sub>、A<sub>c</sub>、A<sub>d</sub>、A<sup>2</sup> 及び A<sup>3</sup> は、上記で記載されている定義を有し、A<sup>4</sup> は、O、S 又は N - R<sup>4</sup> であり、並びに、X<sup>1</sup> は、ハロゲン (好ましくは、臭素又はヨウ素) である。

20

【0084】

式 (I) [ 式中、Q は、Q 2 1 である ] で表される化合物の場合、A<sup>2</sup> は、カルボニルであり、及び、A<sup>3</sup> は、N - R<sup>7</sup> である。

【0085】

段階 (a)

あるいは、式 (II) [ 式中、n は、2 である ] で表される化合物は、例えば、「Journal of Organic Chemistry 2005, 70, 2696 - 2700」に記載されているプロセスと同様にして、式 (V) で表される化合物から出発し、式 (VIb) で表される化合物を用いるハロゲン - スルホン交換によって、1 段階法によって調製することもできる。該交換は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましくは、極性非プロトン性溶媒 (例えば、ジメチルスルホキシド及び N, N - ジメチルホルムアミド) を使用する。

30

【0086】

式 (VIb) 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、「Organic Synthesis 1977, 57, 88 - 92」、「Tetrahedron Letters 1979, 9, 821 - 824」及び「Bulletin de la Societe Chimique de France 1958, 4, 447 - 450」に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

【0087】

適切な硫黄試薬の例は、スルフィン酸のリチウム塩、ナトリウム塩又はカリウム塩である。

40

【0088】

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

【0089】

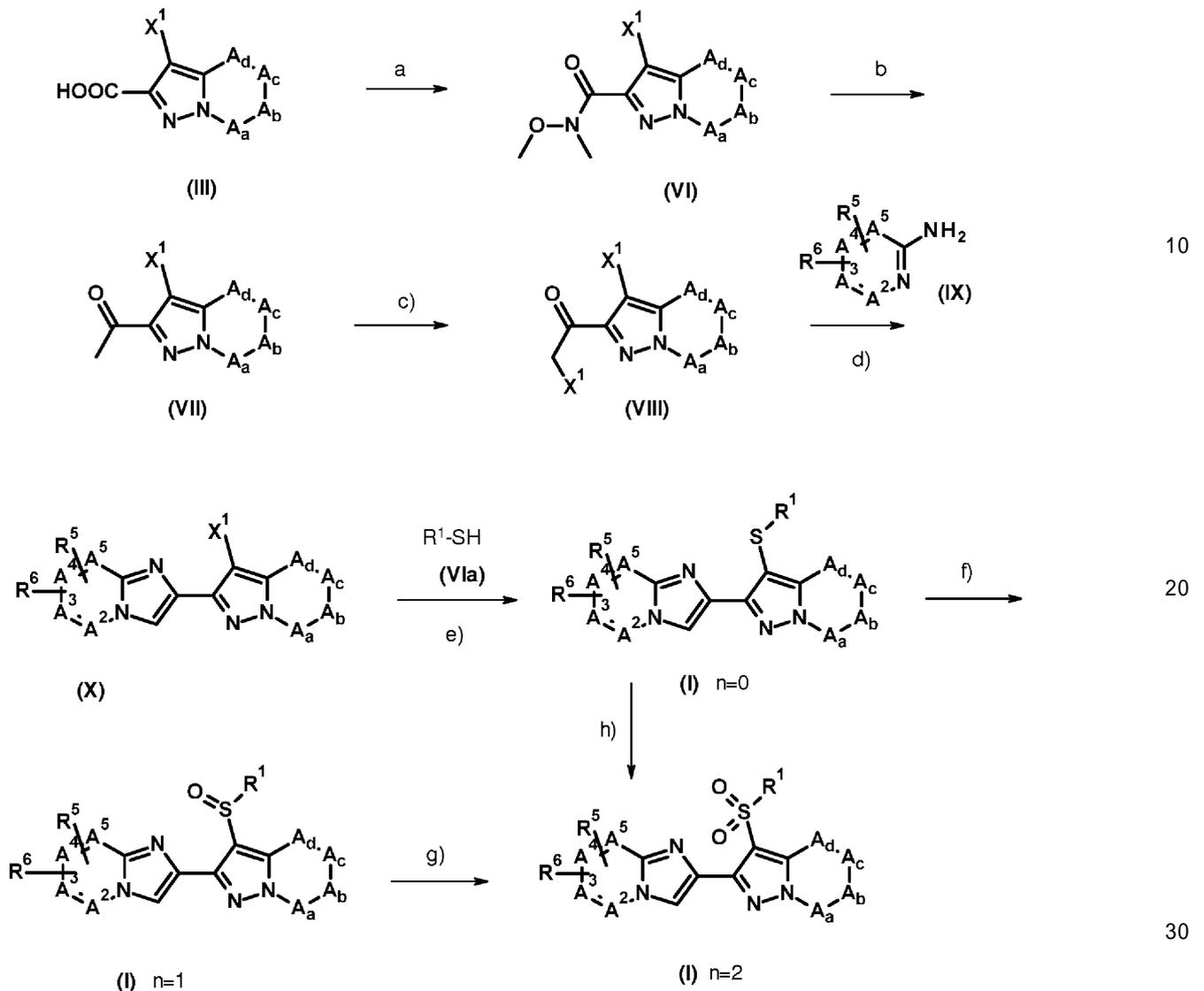
調製方法 B

式 (I) [ 式中、Q は、Q 1 0、Q 1 1、Q 1 4 又は Q 1 5 を表す ] で表される化合物は、既知方法で、例えば、US 2 0 0 9 / 2 0 3 7 0 5、US 2 0 1 2 / 2 5 8 9 5 1、WO 2 0 1 3 / 3 2 9 8 又は「J. Med. Chem. 31, (1988) 159

50

0 - 1 5 9 5」に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

【化 7】



【0090】

ラジカル  $R^1$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A^a$ 、 $A^b$ 、 $A^c$ 、 $A^d$  及び  $n$  は、上記に記載されている定義を有する。 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$  及び  $A^5$  は、CH 又は N (ここで、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$  及び  $A^5$  は、全てが N であることはない) であり、並びに、 $X^1$  は、ハロゲンである。

【0091】

段階 (a)

式 (III) で表されるカルボン酸を、WO2015/107117、WO2011/75643 又は EP2671582 に記載されているプロセスと同様にして、O、N - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩の存在下で、式 (VI) で表されるワインレブアミドに変換させる。

【0092】

式 (III) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。可能な調製経路は、調製方法 E に記載されている。

【0093】

段階 (b)、段階 (c)

次いで、式 (VI) で表される化合物を、既知方法で、例えば、WO2011/75643 に記載されているプロセスと同様にして、グリニャール試薬 (例えば、臭化メチルマグネシウム) を用いて、式 (VII) で表されるケトンに変換させることができる。次い

で、例えば、US 2012/302573に記載されている既知方法と同様にして、ハロゲン化に付すことによって、式(VIII)で表される化合物が得られる。

【0094】

段階(d)

式(X)で表される化合物は、式(VIII)で表される化合物を式(IX)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、例えば、WO2005/66177、WO2012/88411、WO2013/3298、US2009/203705、US2012/258951、WO2012/168733、WO2014/187762又は「J. Med. Chem. 31(1988) 1590-1595」に記載されているプロセスと同様の既知方法で、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。

10

【0095】

式(IX)で表される化合物は、市販されている。

【0096】

段階(e)

式(I)〔式中、nは0である〕で表される化合物は、式(X)で表される化合物を塩基の存在下で式(VIa)で表される化合物と反応させることによって調製することができる。式(VIa)で表されるメルカプタン誘導体(例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン)は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2006/25633、US2006/111591、US2820062、「Chemical Communications, 13(2000), 1163-1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 44(1922), p.1329」に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

20

【0097】

別の選択肢(X<sup>1</sup>が臭素又はヨウ素である場合)は、適切なリチウム塩基を用いた金属交換反応とそれに続く適切な市販されているジスルフィドとの反応である;「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 20(2010), 2770-2775」を参照されたい。

【0098】

さらに、X<sup>1</sup>が臭素又はヨウ素である場合、JP2017/25059に記載されているプロセスと同様にして、適切なリガンド(例えば、4,5-ビス(ジフェニルホスフィン)-9,9-ジメチルキサンテン(キサントホス))の存在下、及び、適切な塩基(例えば、N,N-ジイソプロピルエチルアミン)の存在下で、式(VIa)で表されるメルカプタン誘導体を適切なパラジウム触媒(例えば、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0))と一緒に導入することも可能である。該反応は、溶媒の中で、好ましくは、エーテル(例えば、ジオキサン)の中で、実施する。

30

【0099】

段階(f)、段階(g)

式(I)〔式中、nは1である〕で表される化合物は、式(I)〔式中、nは0である〕で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。この酸化は、既知方法で、適切な酸化剤(例えば、過酸化水素、メタ-クロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウム)を用いて実施する。

40

【0100】

式(I)〔式中、nは2である〕で表される化合物は、式(I)〔式中、nは1である〕で表される化合物を酸化することによって、調製することができる。

【0101】

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類、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン;アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール;ギ酸、

50

酢酸、プロピオン酸；又は、水。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。

【0102】

段階(h)

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

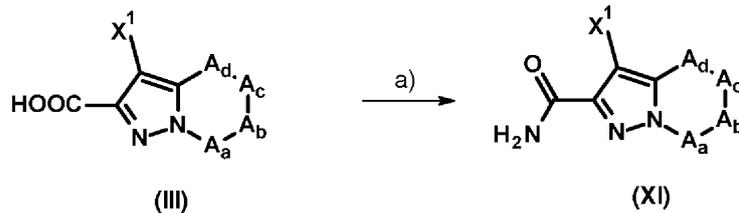
10

【0103】

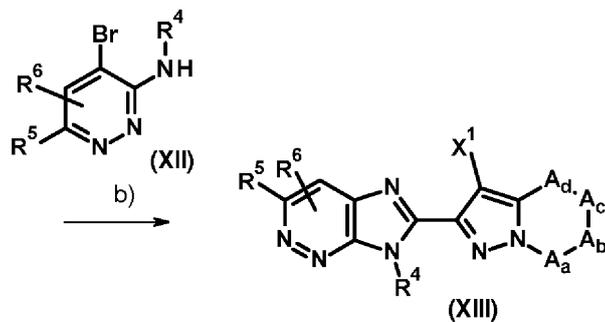
調製方法C

式(I)〔式中、Qは、Q16である〕で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO2014/142292に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

【化8】



20



30

【0104】

ラジカルR<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、Aa、Ab、Ac及びAdは、上記に記載されている定義を有する。X<sup>1</sup>は、ハロゲンである。

【0105】

段階(a)

式(XI)で表される化合物は、US5374646又は「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093-1096」に記載されているプロセスと同様にして、式(III)で表される化合物を縮合剤の存在下でアンモニア源と反応させることによって、調製することができる。

40

【0106】

式(III)で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で調製することができる。可能な調製経路は、調製方法Eに記載されている。

【0107】

殆どの場合、使用するアンモニア源は、水酸化アンモニウムである。

【0108】

式(III)で表される化合物とアンモニア源の該反応は、好ましくは、一般的な反応

50

条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、エーテル類、例えば、ジオキサン又はテトラヒドロフランなどである。

【0109】

適切な縮合剤は、例えば、カルボニルジイミダゾールである。

【0110】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で実施することが可能である。好ましくは、該反応は、大気圧下、20 ~ 70 の温度で実施する。

【0111】

段階 (b)

式 (XIII) で表される化合物は、WO2014/142292 に記載されているプロセスと同様にして、式 (XI) で表される化合物を、パラジウム触媒の存在下、塩基性媒体中で、式 (XII) で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

10

【0112】

式 (XII) で表される化合物は、例えば、WO2014/142292 に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。使用するパラジウム触媒は、例えば、[1,1'-ビス-(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム (II) である。多くの場合、使用する塩基は、カリウム *tert*-ブトキシドなどの無機塩基である。

【0113】

該反応は、溶媒の中で実施する。多くの場合、トルエンを使用する。

20

【0114】

該反応は、減圧下、大気圧下又は高圧下で実施することが可能である。好ましくは、該反応は、大気圧下、20 ~ 110 の温度で実施する。

【0115】

式 (XIII) で表される化合物の式 (I) で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法 A と同様に実施する。

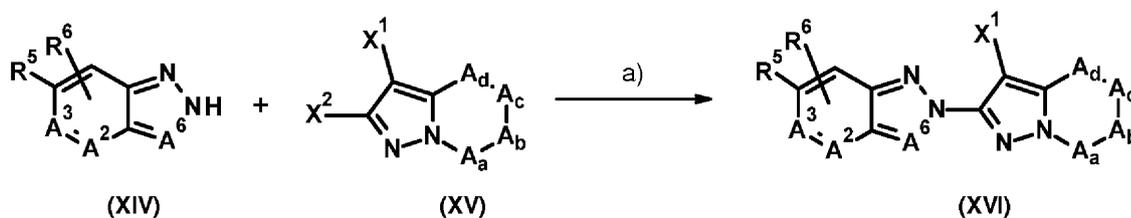
【0116】

調製方法 D

式 (I) [式中、Q は、Q12、Q13、Q17、Q18 又は Q20 を表す] で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO2010/91310、WO2012/66061 又は WO2013/99041 に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

30

【化9】



40

【0117】

ラジカル R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、A<sub>a</sub>、A<sub>b</sub>、A<sub>c</sub> 及び A<sub>d</sub> は、上記で記載されている定義を有する。A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup> 及び A<sup>6</sup> は、CH 又は N である (ここで、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup> 及び A<sup>6</sup> は、同時に N であることはできない)。X<sup>1</sup> 及び X<sup>2</sup> は、ハロゲンである。

【0118】

段階 (a)

式 (XVI) で表される化合物は、例えば、WO2006/19831、WO2009/127686、「Chem. Eur. J. 20(2014), 974-978」、WO2005/80388、WO2010/91310、WO2012/66061

50

又はWO2013/99041に記載されているプロセスと同様にして、式(XIV)で表される化合物を塩基性条件下で式(XV)で表される化合物と反応させることによって、調製することができる。

【0119】

式(XIV)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、WO2005/100353、WO2012/66061若しくは「European Journal of Medicinal Chemistry 45(2010), 2214-2222」に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

【0120】

式(XV)で表される化合物は、既知方法で、例えば、 $X^2$ がハロゲンであり及び $X^1$ が水素である中間体を介して、WO2015/95788又はWO2015/95792に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。 $X^1$ の水素からハロゲンへのその後の変換は、既知方法で、ハロゲン化剤(例えば、N-クロロスクシンイミド又はN-プロモスクシンイミド)を用いて、例えば、「Synthesis 47(2015), 3221-3230」、「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 27(2017)4044-4050」又はWO2011/50284に記載されているプロセスと同様にして、実施する。

10

【0121】

使用する塩基は、通常、水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの無機塩基である。

20

【0122】

式(XVI)で表される化合物への上記変換は、通常、溶媒の中で、好ましくは、ニトリル(例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル)の中で、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)の中で、実施する。

【0123】

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

【0124】

あるいは、式(XVI)で表される化合物を生成させるための式(XIV)で表される化合物と式(XV)で表される化合物の該反応は、例えば、「Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947」に記載されているプロセスと同様にして、パラジウムが触媒するN-アリアル化によって実施することも可能である。

30

【0125】

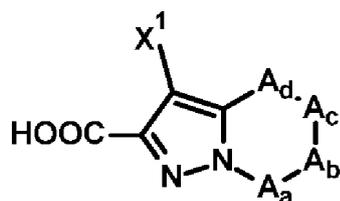
式(XVI)で表される化合物の式(I)で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法Aと同様に実施する。

【0126】

調製方法E

【化10】

40



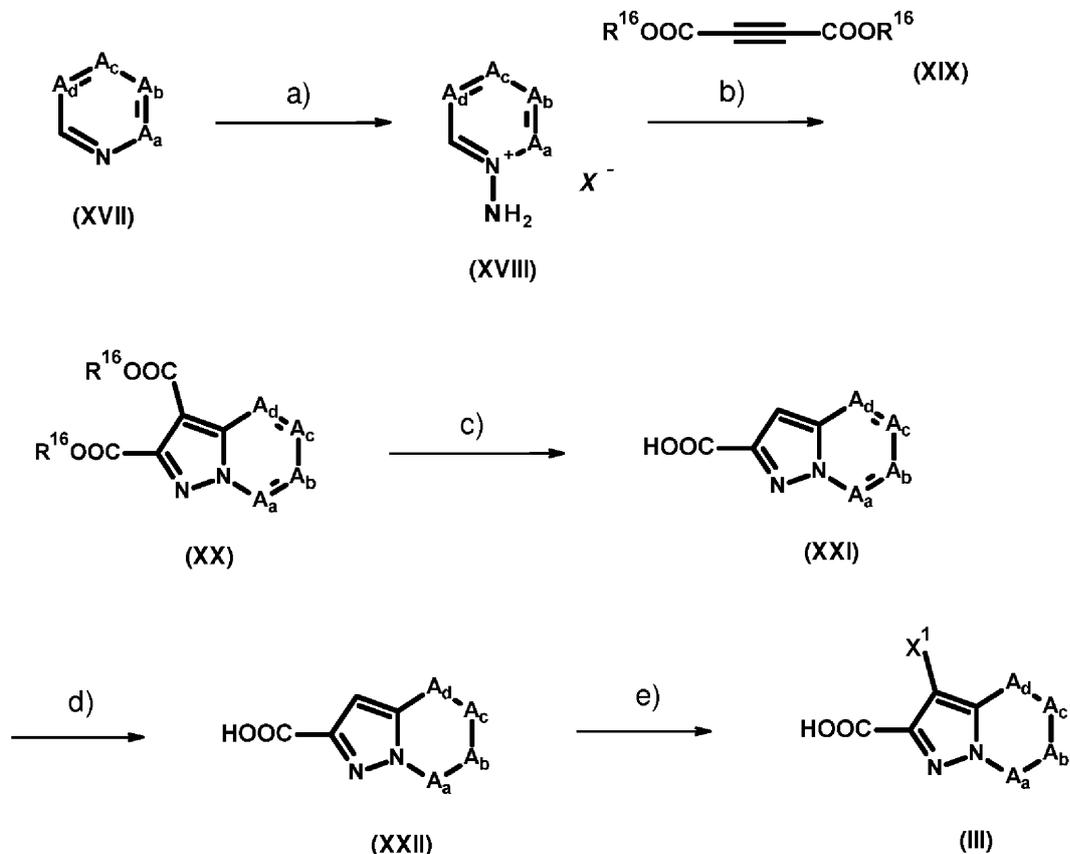
(III)

【0127】

50

式 ( I I I ) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、式 ( X V I I ) で表されるピリジンから、WO2006/15737、WO2007/108750、US2009/186902、WO2009/23179、WO2009/095253、WO2010/34738、WO2010/91411、WO2011/15343、WO2011/41713、WO2011/50284、WO2014/14874、WO2016/12896及び「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 22(2012), 3460-3466」に記載されているプロセスと同様にして、調製することができる。

【化11】



【0128】

ラジカル A a、A b、A c 及び A d は、上記で記載されている定義を有し、X<sup>-</sup> は、ハロゲン化物イオン（好ましくは、ヨウ化物）であり、X<sup>1</sup> は、ハロゲンであり、及び、R<sup>16</sup> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルである。

【0129】

段階 ( a )

式 ( X V I I I ) で表される化合物は、WO2009/095253、WO2011/15343、WO2014/14874 又は WO2010/34738 に記載されているプロセスと同様にして、式 ( X V I I ) で表される化合物を塩基（例えば、炭酸カリウム）の存在下でヒドロキシルアミン - O - スルホン酸と反応させ、及び、その中間体を、第 2 段階において、酸（例えば、ヨウ化水素酸 ( H I ) ）の存在下、適切な溶媒（例えば、エタノール）の中で、式 ( X V I I I ) で表される 1 - アミノピリジウム誘導体に変換させることによって、N - イミノピリジニウム中間体に変換させることができる。式 ( X V I I ) で表されるピリジン誘導体は、市販されている。

【0130】

段階 ( b ) 及び段階 ( c )

式 ( X X ) で表される化合物は、WO2009/095253、WO2011/15343、WO2014/14874 又は WO2010/34738 に記載されているプロセ

10

20

30

40

50

スと同様にして、式 (X I X) で表されるアルキンを用いた 1, 3 - 双極子付加環化において、式 (X V I I I) で表される化合物から調製することができる。異性体が形成される場合、それらは、クロマトグラフィー法によって、個々の異性体に分離させることができる。このようにして、式 (X X) で表されるジエステルを異性体的に純粋な形態で得ることができる。適切な酸 (例えば、水性硫酸) の中で加熱することにより、脱カルボキシル化及びエステル官能基の同時加水分解によって、式 (X X) で表される化合物を式 (X X I) で表される酸に変換させることができる。

【0131】

式 (X I X) で表される化合物は、市販されている。

【0132】

段階 (d)

式 (X X I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、WO 2006 / 15737、WO 2007 / 108750 若しくは US 2009 / 186902 に記載されているプロセスと同様にして、式 (X X I) で表される化合物の水素化を介して、合成することができる。

【0133】

段階 (e)

式 (I I I) で表される化合物は、既知方法で、例えば、WO 2009 / 23179、WO 2010 / 91411、WO 2011 / 41713、WO 2011 / 50284、WO 2016 / 12896 及び「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 22 (2012), 3460 - 3466」に記載されているプロセスと同様にして、例えば、溶媒 (例えば、ジメチルホルムアミド、クロロホルム又はアセトニトリル) の中でハロゲン化剤として N - クロロスクシンイミド又は N - プロモスクシンイミドを使用して、式 (X X I I) で表される化合物からハロゲン化によって調製することができる。

【0134】

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。

【0135】

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。

【0136】

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。

【0137】

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、畜産業において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、特に、線虫類、及び、軟体動物を防除するのに適している。

【0138】

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

10

20

30

40

50

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、好ましくは、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、本発明による保護の範囲から除外される。

【0139】

用語「衛生学の分野」には、そのような衛生学的な手段、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。

10

【0140】

従って、用語「衛生害虫」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。

20

【0141】

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。

【0142】

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：

30

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 (*Amphitetranychus viennensis*)、アルガス属種 (*Argas* spp.)、ボオフィルス属種 (*Boophilus* spp.)、ブレビバルプス属種 (*Brevipalpus* spp.)、例えば、ブレビバルプス・ホエニシス (*Brevipalpus phoenicis*)、プリオビア・グラミナム (*Bryobia graminum*)、プリオビア・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 (*Choriotptes* spp.)、デルマニクス・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス (*Dermatophagoides pteronyssinus*)、デルマトファゴイデス・ファリナエ (*Dermatophagoides farinae*)、デルマセントロ属種 (*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*)

40

50

、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.)、イキソデス属種 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクツス属種 (*Latrodectus* spp.)、ロキソスケレス属種 (*Loxosceles* spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コフェアエ (*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・イオテルシ (*Oligonychus yothersi*)、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・スピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフスス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズス (*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 (*Sminthurus viridis*) ;

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

ulus 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・アウストララシアエ (Periplaneta australasiae)、ピクノセルス・スリナムシス (Pycnoscelus surinamensis)、スペラ・ロンギパルパ (Supella longipalpa);

コウチュウ目 (Coleoptera) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (Acalymma vittatum)、アカントセリデス・オブテクツス (Acanthoscelides obtectus)、アドレツス属種 (Adoretus spp.)、アエチナ・ツミダ (Aethina tumida)、アゲラスチカ・アルニ (Agelastica alni)、アグリルス属種 (Agrilus spp.)、例えば、アグリルス・プラニペンニス (Agrilus planipennis)、アグリルス・コキサリス (Agrilus coxalis)、アグリルス・ビリネアツス (Agrilus bilineatus)、アグリルス・アンキシウス (Agrilus 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・ジアペリヌス (Alphitobius diaperinus)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (Amphimallon solstitialis)、アノビウム・プンクタツム (Anobium punctatum)、アノプロホラ属種 (Anoplophora spp.)、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・グルンジス (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.)、パリス・カエルレセンス (Baris caerulescens)、ブルキジウス・オブテクツス (Bruchidius obtectus)、ブルクス属種 (Bruchus spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (Bruchus pisorum)、ブルクス・ルフィマヌス (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・ラバエ (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・

ゼアルンジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera* spp.)、クルクリオ属種 (*Curculio* spp.)、例えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコブツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコブツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adpersus*)、シリンドロコブツルス・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・ボンデロサエ (*Dendroctonus ponderosae*)、デルメステス属種 (*Dermestes* 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・ウンデシムブクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムブクタタ・ウンデシムブクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zeaee*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis* spp.)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボデルス属種 (*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・スブクリニタ (*Epitrix subcrinita*)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faustinus* spp.)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronyx arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx* spp.)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・プベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサングイネア (*Lachnosterma consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricornis*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius* spp.)、レマ属種 (*Lema* spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera c*

10

20

30

40

50

*offeella* )、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.*)、リクスス属種 (*Lixus spp.*)、ルペロデ  
 ス属種 (*Luperodes spp.*)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Luper  
 omorpha xanthodera*)、リクツス属種 (*Lyctus 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 oreg  
 onensis*)、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.*)、ナウバクツス・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 (*Neogalerucella  
 spp.*)、ニブツス・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 (*Oti  
 orhynchus spp.*)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Oti  
 orhynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Oti  
 orhynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Oti  
 orhynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Oti  
 orhynchus rugosostriarius*)、オチオリンクス・スルカツス (*Oti  
 orhynchus 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 (*Oxycetoni  
 a jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochlea  
 riae*)、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 (*Phyllo  
 treta spp.*)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllo  
 treta armoraciae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllostreta pu  
 sillia*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllostreta ramosa*)、フィ  
 ロトレタ・ストリオラタ (*Phyllostreta striolata*)、ポピリア・  
 ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Prem  
 notrypes spp.*)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostepha  
 nus 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 v  
 e  
 ntralis*)、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 (*Sc  
 olytus spp.*)、例えば、スコリツス・ムルチストリアツス (*Scolyt  
 us 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

10

20

30

40

50

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 (*Sito  
 philus 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 (*Symphyl  
 etes 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 (10  
*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  
 auretanicus*)、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 (*T  
 ribolium 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 (*Xyl  
 otrechus 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 tenebriooides*) ;

ハサミムシ目 (*Dermaptera*) の、例えば、アニソラビス・マリチメ (20  
*Anisolabis maritime*)、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficu  
 la auricularia*)、ラビズラ・リパリア (*Labidura ripar  
 ia*) ;

ハエ目 (*Diptera*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes spp.*)、例え  
 ば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクツス  
 (*Aedes albopictus*)、アエデス・スチクチクス (*Aedes sti  
 cticus*)、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・パルピコルニス (*Agromyza parvi  
 cornis*)、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*)、アスホンジア属種 (*Asphondyli  
 a 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 hort  
 ulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythro  
 cephalae*)、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 (30  
*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 (*Chrysoz  
 ona 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 (*C  
 ontarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contari  
 nia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia sch  
 ulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)  
 、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロピア  
 ・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコト 40  
 50

ブス・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 plat* 10  
*ura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトピア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila spp.*)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus spp.*)、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 20  
 ッポドスカ属種 (*Hippobosca spp.*)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma spp.*)、リリオミザ属種 (*Liriomyza spp.*)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブレシス (*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 (*Mansonina spp.*)、ムスカ属種 (*Musca spp.*)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種 (*Oestrus spp.*)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルス属種 (*Paratanytarsus spp.*)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミア又はペゴミヤ属種 (*Pegomya or Pegomyia spp.*)、例えば、ペゴミア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒオシアミ (*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 (*Piophilina 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 rosa* 40  
*ae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis spp.*)、例えば、ラゴレチス・シングラタ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga spp.*)、シムリウム属種 (*Simulium spp.*)、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 (*Ti 50*

pula spp.)、例えば、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チブラ・シムプレクス (*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*)、アシルトシホン属種 (*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・パロデンシス (*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・ビッグツラ (*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、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*)、アフィス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフィス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス (*Aphis glycines*)、アフィス・ゴシパイ (*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 illinoensis*)、アフィス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフィス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフィス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフィス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・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 melaleuciae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコブシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capulinia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneosephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*C*

10

20

30

40

50

*hionaspis tegalensis* )、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onuki* )、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・  
 ムビラ (*Cicadulina mbila* )、コッコミチルス・ハリイ (*Coccom  
 ytilus 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 vir  
 idis* )、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis* )、クリプ  
 トネオサ属種 (*Cryptoneossa spp.* )、クテナリタイナ属種 (*Cten  
 alytaina 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 (*Di  
 aphorina citri* )、ジアスピス属種 (*Diaspis spp.* )、ジウ  
 ラフィス属種 (*Diuraphis spp.* )、ドラリス属種 (*Doralis sp  
 p.* )、ドロシカ属種 (*Drosicha spp.* )、ジサフィス属種 (*Dysaph  
 is spp.* )、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiif  
 olia* )、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 (*Em  
 poasca maligna* )、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca sola  
 na* )、エムポアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi* )、エリオソ  
 マ属種 (*Eriosoma spp.* )、例えば、エリオソマ・アメリカヌム (*Erio  
 soma americanum* )、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma la  
 nigerum* )、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 (*E  
 ucalyptolyma spp.* )、エウフィルラ属種 (*Euphyllura s  
 pp.* )、エウセリス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus* )、フェリ  
 シア属種 (*Ferrisia spp.* )、フィオリニア属種 (*Fiorinia sp  
 p.* )、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 (*Gly  
 caspis spp.* )、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cu  
 bana* )、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulos  
 a* )、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata* )、ヒ  
 アロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis* )、ヒアロ  
 プテルス・プルニ (*Hyalopterus pruni* )、イセリア属種 (*Icery  
 a 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 (*Idiosc  
 opus spp.* )、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax s  
 triatellus* )、レカニウム属種 (*Lecanium spp.* )、例えば、レ  
 カニウム・コルニ (*Lecanium corni* ) (=バルテノレカニウム・コルニ (*Par  
 thenolecanium corni* ) )、レピドサフェス属種 (*Lepid  
 osaphes spp.* )、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaph  
 es 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* )、マクロシウム属種 (*Ma  
 cro*

10

20

30

40

50

*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 lilii*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンズ (*Macrostoteles 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・ブルイノサ (*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 pecanidis*)、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*)、ネオマスクェリア属種 (*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 (*Nettigoniclla 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 praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp. )、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp. )、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp. )、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp. )、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivenae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属種 (*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 (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp. )、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp. )、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロンギスピヌス (*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

10

20

30

40

50

ば、*Psylla buxi*）、*Psylla mali*）、*Psylla pyri*）、*Pteromalus* spp.）、*Pulvinaria* spp.）、*Pyrilla* spp.）、*Quadraspidiotus* spp.）、例えば、*Quadraspidiotus juglansregiae*）、*Quadraspidiotus ostreaeformis*）、*Quadraspidiotus perniciosus*）、*Quesada gigas*）、*Rastrococcus* spp.）、*Rhopalosiphum* spp.）、例えば、*Rhopalosiphum maidis*）、*Rhopalosiphum oxyacanthae*）、*Rhopalosiphum padi*）、*Rhopalosiphum rufiabdominale*）、*Saissetia* spp.）、例えば、*Saissetia coffeae*）、*Saissetia miranda*）、*Saissetia neglecta*）、*Saissetia oleae*）、*Scaphoideus titanus*）、*Schizaphis graminum*）、*Selenaspis articulatus*）、*Siphia flava*）、*Sitobion avenae*）、*Sogata* spp.）、*Sogatella furcifera*）、*Sogatodes* spp.）、*Stictocephala festina*）、*Siphoninus phillyreae*）、*Tenalaphara malayensis*）、*Tetragonocephala* spp.）、*Tinocallis caryaefoliae*）、*Tomaspis* spp.）、*Toxoptera* spp.）、例えば、*Toxoptera aurantii*）、*Toxoptera citricidus*）、*Trialeurodes vaporariorum*）、*Trioza* spp.）、例えば、*Trioza diospyri*）、*Typhlocyba* spp.）、*Unaspis* spp.）、*Viteus vitifolii*）、*Zygina* spp.）；

カメムシ亜目（*Heteroptera*）の、例えば、*Aelia* spp.）、*Anasa tristis*）、*Antestiopsis* spp.）、*Boisea* spp.）

、*Blissus* spp.）、*Calocoris* spp.）、*Campylomma livida*）、*Cavelerius* spp.）、*Cimex* spp.）

、例えば、*Cimex adjunctus*）、*Cimex hemipterus*）、*Cimex lectularius*）、*Cimex pilosellus*）、*Collaria* spp.）、*Creontiades dilutus*）、*Dasynus piperis*）、*Dichelops furcatus*）、*Diconocoris hewetti*）、*Jisde*

10

20

30

40

50

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・トリステグムス (*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 (*Eurydema* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ハリオモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオバルチス属種 (*Heliopeltis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリサ属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトコリサ・バリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、レプトグロスス・オッシデンタリス (*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リゴコリス属種 (*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、メガコプタ・クリブラリア (*Megacopta cribraria*)、ミリダエ (*Miridae*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonion atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、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 quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・ギイルジニイ (*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*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.)、ジプリオン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジプリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカムパ・テスツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、リネピテマ (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・ノクチリス (*Sirex noctilis*)、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・アウロブククタ (*Wasmannia auro*

punctata)、キセリス属種(Xeris spp.);

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

シロアリ目(Isoptera)の、例えば、コプトテルメス属種(Coptotermes spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス(Coptotermes formosanus)、コルニテルメス・クムランス(Cornitermes cumulans)、クリプトテルメス属種(Cryptotermes spp.)、インシテルメス属種(Incisitermes spp.)、カロテルメス属種(Kaloterme spp.)、マイクロテルメス・オベシ(Microtermes obesius)、ナスチテルメス属種(Nasutitermes spp.)、オドントテルメス属種(Odontotermes spp.)、ポロテルメス属種(Porotermes spp.)、レチクリテルメス属種(Reticulitermes spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス(Reticulitermes flavipes)、レチクリテルメス・ヘスペルス(Reticulitermes hesperus);

チョウ目(Lepidoptera)の、例えば、アクロイア・グリセラ(Achroia grisella)、アクロニクタ・マジヨル(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.)、アウトグラフィア属種(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(Borbocinnara)、ブックラトリキス・ツルベリエラ(Bucculatrix thurberiella)、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、ブッセオラ属種(Busseola spp.)、カコエシア属種(Cacoecia spp.)、カロプチリア・テイボラ(Caloptilia theivora)、カプア・レチクラナ(Capua reticulana)、カルポカプサ・ポモネラ(Carpocapsa pomonella)、カルボシナ・ニポネンシス(Carposina niponensis)、ケイマトビア・ブルマタ(Cheimatobia brumata)、キロ属種(Chilo spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス(Chilo plejadellus)、キロ・スプレッサリス(Chilo suppressalis)、コレウチス・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 medicinalis)、クネファシア属種(Cnephasia spp.)、コノボモルファ属種(Conopomorpha spp.)、コノトラケルス属種(Conotrachelus spp.)、コピタルシア属種(Copitarsia spp.)、シジア属種(Cydia spp.)、例えば、シジア・ニグリカナ(Cydia nigricana)、シジア・ポモネラ(Cydia pomonella)、ダラカ・ノクツイデス(Dalaca noctuides

10

20

30

40

50

)、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 (*Ecdytoplopha 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 (*Epinochia* spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (*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・モレスタ (*Grapholitha molesta*)、グラホリタ・ブルニボラ (*Grapholitha prunivora*)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ランピデス属種 (*Lampides* spp.)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、ラスペイレシア・モレスタ (*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*)、ロベシア属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスバル (*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 (*Oiketicus* spp.)、オンフィサ属種 (*Om*

10

20

30

40

50

phisa 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・オベルクレラ (Phthorimaea operculella)、フィロクニスチス・シトレラ (Phyllocnistis citrella)、フィロノリクテル属種 (Phyllonorycter spp. )、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (Phyllonorycter blancardella)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (Phyllonorycter crataegella)、ピエリス属種 (Pieris spp. )、例えば、ピエリス・ラパエ (Pieris rapae)、プラチノタ・スツルタナ (Platynota stultana)、プロジア・インテルプンクテラ (Plodia interpunctella)、ブルシア属種 (Plusia spp. )、ブルテラ・キシロステラ (Plutella xylostella) (=ブルテラ・マクリペンニス (Plutella maculipennis))、ポデシア属種 (Podesia spp. )、例えば、ポデシア・シリングアエ (Podesia syringae)、プライス属種 (Prays spp. )、プロデニア属種 (Prodenia spp. )、プロトバルセ属種 (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)、プセウドブルシア・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 (Rachiplusia nu)、スコエノビウス属種 (Schoenobius spp. )、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル (Schoenobius bipunctifer)、シルポファガ属種 (Scirpophaga spp. )、例えば、シルポファガ・インノタタ (Scirpophaga innotata)、スコチア・セゲツム (Scotia segetum)、セサミア属種 (Sesamia spp. )、例えば、セサミア・インフェレンス (Sesamia inferens)、スパルガノチス属種 (Sparganothis spp. )、スポドプテラ属種 (Spodoptera spp. )、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (Spodoptera eradiana)、スポドプテラ・エキシグア (Spodoptera exigua)、スポドプテラ・フルギベルダ (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・スブセシベラ (Stomopteryx subsecivella)、シナンテドン属種 (Synanthedon spp. )、テシア・ソラニボラ (Tecia solanivora)、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)、トリコブルシア属種 (Trichoplusia spp. )、例えば、トリコブルシア・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

20

30

40

50

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Achetia 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*) ;

10

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalinia spp.*)、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus spp.*)、リノグナツス属種 (*Linognathus spp.*)、ペジクルス属種 (*Pediculus spp.*)、フィロキセラ・バスタトリキス (*Phylloxera vastatrix*)、フチルス・プビス (*Phthirus pubis*)、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.*)、リポセリス属種 (*Liposcelis spp.*) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus spp.*)、クテノセファリデス属種 (*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*) ;

20

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・レエウウェニ (*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 vaccini*)、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.*)、リビホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips spp.*)、タエニオトリプス・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*) ;

30

40

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*) ;

50

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

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

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

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

例えば、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (*Aphelenchoides arachididis*)、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 (*Cacopaaurus* spp.)、

例えば、カコパウルス・ペスチス (*Cacopaaurus 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 (*Criconemoi des* spp.)、

例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Criconemoi des ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconemoi des onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoi des 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 dihystra*)、ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoi des* 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 glycine*

10

20

30

40

50

s)、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(H  
oplolaimus 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 africanu  
s)、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(Meloi  
dogyne hapla)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne  
incognita)、メロイネマ属種(Meloinema spp.)、ナコツプス  
属種(Nacobbus spp.)、ネオチレンクス属種(Neotylenchus 10  
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(Paraty  
lenchus 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 penet  
rans)、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(Punct  
odera spp.)、クイニスルシウス属種(Quinisolcius 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(R  
adopholus similis)、ロチレンクルス属種(Rotylenchu  
lus 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(Subang  
uina spp.)、トリコドルス属種(Trichodorus spp.)、例え  
ば、トリコドルス・オブツス(Trichodorus obtusus)、トリコド  
ルス・プリミチブス(Trichodorus primitivus)、チレンコリン  
クス属種(Tylenchorhynchus spp.)、例えば、チレンコリンクス  
・アンヌラツス(Tylenchorhynchus annulatus)、チレンク  
ルス属種(Tylenchulus spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトラ  
ンス(Tylenchulus semipenetrans)、キシフィネマ属種(X  
iphinema spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス(Xiphinem  
a index)。

#### 【0143】

式(I)で表される化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除  
草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得る  
か、又は、殺微生物剤(microbicide)若しくは除雄剤(gametocide)として、例えば、殺菌剤(fungicide)、抗真菌剤(antimycotic)  
、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤(これは、ウイロイドに対する作用薬も包含する)  
としても使用し得るか、又は、MLO(マイコプラズマ様生物)及びRLO(リケッチア  
様生物)に対する作用薬としても使用し得る。それらは、場合により、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。

#### 【0144】

##### 製剤

本発明は、さらに、式(I)で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいる、殺有  
害生物剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態〔例えば、灌注液、滴下液及  
び散布液〕にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる殺有害生物剤、及び/又は  
、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油(例えば、ナタネ油  
、ヒマワリ油)、鉱油(例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル(例え  
ば、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル)、又は、アルカノールアルコ

キシレート類、及び/又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び/又は塩、例えば、有機又は無機のアモンニウム塩又はホスホニウム塩（例えば、硫酸アモンニウム又はリン酸水素ニアモンニウム）、及び/又は、保持促進剤（retention promoter）（例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアールポリマー）、及び/又は、湿潤剤（例えば、グリセロール）、及び/又は、肥料（例えば、アモンニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料）を含有する。

【0145】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである：水溶性液剤（SL）、乳剤（EC）、水中油型エマルジョン剤（EW）、懸濁製剤（SC、SE、FS、OD）、顆粒水和剤（WG）、顆粒剤（GR）、及び、カプセル製剤（capsule concentrates）（CS）；これらの製剤型及び別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている：Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173（作製元：the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576）。該製剤は、式（I）で表される1種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性成分を含有する。

10

【0146】

好ましいのは、補助剤〔例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤（spontaneity promoter）、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤（frost protection agent）、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（spreading）、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。

20

【0147】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式（I）で表される化合物を補助剤（例えば、増量剤、溶媒及び/若しくは固体担体、並びに/又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤）と混合させることにより製造する。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。

30

【0148】

使用する補助剤は、式（I）で表される化合物の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態（例えば、即時使用可能な（ready-to-use）殺有害生物剤、例えば、散布液又は種子粉衣製品）に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び/又は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。

【0149】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである：芳香族及び非芳香族の炭化水素類（例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類）、アルコール類及びポリオール類（これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び/又は、エステル化されていてもよい）、ケトン類（例えば、アセトン、シクロヘキサノン）、エステル類（これは、脂肪類及び油類を包含する）及び（ポリ）エーテル類、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）、カルボネート類及びニトリル類。

40

【0150】

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

50

、トルエン若しく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、クロロエチレン類若しくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン若しくはパラフィン類、例えば、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール若しく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若しく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若しくはジメチルスルホキシド、カルボネート類、例えば、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、炭酸ジエチル若しくは炭酸ジブチル、又は、ニトリル類、例えば、アセトニトリル若しくはプロパンニトリル。

#### 【0151】

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、カルボネート類、例えば、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、炭酸ジエチル若しくは炭酸ジブチル、ニトリル類、例えば、アセトニトリル若しくはプロパンニトリル、及び、水である。

#### 【0152】

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ことができる： 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ことができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の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。

#### 【0153】

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。

#### 【0154】

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、アルキルタウレート）、イセチオネート誘導體、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體、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式（I）で表される化合物のうちの1種類及び/又は該

10

20

30

40

50

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。

【0155】

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（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などがある。

【0156】

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。

10

【0157】

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、粉末若しくは顆粒若しく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。

【0158】

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。

20

【0159】

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。

【0160】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬活性成分の浸透を向上させるために典型的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、（一般には、水性の）施用液から、及び/又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性成分のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献（Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152）に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナツ脂肪エトキシレート（coconut fatty ethoxy late）（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。

30

【0161】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.000000001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。

40

【0162】

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

50

物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態の中の式 ( 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 . 0 0 0 0 0 0 0 1 重量 % ~ 9 5 重量 % の式 ( I ) で表される化合物、好ましくは、0 . 0 0 0 0 1 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。

#### 【 0 1 6 3 】

##### 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 ( m i c r o b i o l o g i c a l a g e n t ) 、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤 ( p h y t o t o n i c ) 、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含水量若しくは土壌塩分濃度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、収穫量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。

10

20

#### 【 0 1 6 4 】

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。

#### 【 0 1 6 5 】

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。

30

#### 【 0 1 6 6 】

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。

#### 【 0 1 6 7 】

##### 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 Classification Scheme」に基づいている。

40

#### 【 0 1 6 8 】

( 1 ) アセチルコリンエステラーゼ ( A C h E ) 阻害薬、好ましくは、カーバメート系、これは、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

50

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から選択される；又は、

有機リン酸エステル系、これは、アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス - 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、ジメチルピンホス、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、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、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、メピンホス、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、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン及びバミドチオンから選択される。

10

#### 【0169】

(2) G A B A 制御塩化物チャンネル遮断薬、好ましくは、シクロジエン - 有機塩素系、これは、クロルダン及びエンドスルファンから選択される；又は、

20

フェニルピラゾール系 (フィプロール系)、これは、エチプロール及びフィプロニルから選択される。

#### 【0170】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター、好ましくは、ピレスロイド系、これは、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シベルメトリン、アルファ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベルメトリン、シフェノトリン [ (1 R) - トランス異性体 ]、デルタメトリン、エムベントリン [ (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 - フルパリネート、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、ベルメトリン、フェノトリン [ (1 R) - トランス異性体 ]、ブラレトリン、プレトリン類 (除虫菊 (pyrethrum))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [ (1 R) 異性体 ]、トラロメトリン及びトランスフルトリンから選択される；又は、

30

D D T；又は、メトキシクロル。

40

#### 【0171】

(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、好ましくは、

ネオニコチノイド系、これは、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から選択される；又は、

ニコチン；又は、

スルホキシイミン系、これは、スルホキサフロルから選択される；又は、

ブテノリド系、これは、フルピラジフロンから選択される。

#### 【0172】

50

(5) ニコチン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、好ましくは、

スピノシン系、これは、スピネトラム及びスピノサドから選択される。

【0173】

(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、好ましくは、

アベルメクチン系/ミルベマイシン系、これは、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から選択される。

【0174】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、好ましくは、

幼若ホルモン類似体、これは、ヒドロプレン、キノプレン及びメトプレンから選択される；又は、

フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン。

【0175】

(8) 種々の特定されていない(多部位)阻害薬、好ましくは、

ハロゲン化アルキル系、これは、臭化メチル及び別のハロゲン化アルキルから選択される；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、これは、ダゾメット (diazomet) 及びメタムから選択される。

【0176】

(9) 弦音器官のTRPVチャンネルモジュレーター、これは、ピメトロジン及びピリフルキナゾン (pyrifluquinazone) から選択される。

【0177】

(10) ダニ成長阻害薬、これは、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、ジフロピダジン及びエトキサゾールから選択される。

【0178】

(11) 昆虫中腸膜の微生物ディスラプター、これは、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 (これは、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb及びCry34Ab1/35Ab1から選択される) から選択される。

【0179】

(12) ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、好ましくは、

ATPディスラプター、これは、ジアフェンチウロンから選択される；又は、

有機スズ化合物、これは、アゾシクロチン、シヘキサチン及び酸化フェンブタスズから選択される；又は、

プロパルギット；又は、テトラジホン。

【0180】

(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、これは、クロルフェナピル、DNOC及びスルフルラミドから選択される。

【0181】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬、これは、ペンシルタッ

10

20

30

40

50

ブ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム及びチオスルタップ - ナトリウムから選択される。

【0182】

(15) キチン生合成の阻害薬(タイプ0)、これは、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から選択される。

【0183】

(16) キチン生合成の阻害薬(タイプ1)、これは、プロロフェジンから選択される。

【0184】

(17) 脱皮ディスラプター(特に、双翅目の場合)、これは、シロマジンから選択される。

【0185】

(18) エクジソン受容体作動薬、これは、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から選択される。

【0186】

(19) オクトパミン受容体作動薬、これは、アミトラズから選択される。

【0187】

(20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、これは、ヒドラメチルノン、アセキノシル及びフルアクリピリムから選択される。

【0188】

(21) ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬、好ましくは、METI殺ダニ剤、これは、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から選択される；又は、ロテノン(Derris)。

【0189】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、これは、インドキサカルブ及びメタフルミゾンから選択される。

【0190】

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、好ましくは、テロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、これは、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から選択される。

【0191】

(24) ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害薬、好ましくは、ホスフィン系、これは、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から選択される；又は、シアン化物、これは、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から選択される。

【0192】

(25) ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬、好ましくは、  
- ケトニトリル誘導体、これは、シエノピラフェン及びシフルメトフェンから選択される；又は、  
カルボキシアニリド系、これは、ピフルブミドから選択される。

【0193】

(28) リアノジン受容体モジュレーター、好ましくは、ジアミド系、これは、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から選択される。

【0194】

(29) 弦音器官のモジュレーター(標的構造が定義されていない)、これは、フロニカミドから選択される。

10

20

30

40

50

## 【 0 1 9 5 】

( 3 0 ) 以下のものから選択されるさらなる活性成分：アフィドピロペン、アフォキシソレイナー、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 ( broflani l i d e )、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 ( chloroprall e t h r i n )、氷晶石 ( cryol i t e )、シクラニリプロール、シクロキサプリド ( cyclo x a p r i d )、シハロジアミド ( cyhalodi a m i d e )、ジクロロメゾチアズ ( dicloromezot i a z )、ジコホル、 $\epsilon$ -メトフルトリン ( epsilon metofluthrin )、 $\epsilon$ -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 ( fluazaindolizine )、フルエンシルホン、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 ( guadi pyr )、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、 $\epsilon$ -ピフェントリン、 $\epsilon$ -テフルトリン、ロチラネル ( lotil ane r )、メペルフルトリン、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 )、チゴラネル ( tigolaner )、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 ( WO2006 / 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 ( WO2003 / 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 ( WO2006 / 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 ( WO2010052161 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 ( EP2647626 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 ( WO2004 / 099160 から既知 ) ( CAS 792914 - 58 - 0 )、PF1364 ( JP2010 / 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 ( WO2012 / 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 ( WO2013 / 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 ( WO2010 / 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 -

10

20

30

40

50

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-チエタニル)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-チエタニル)ベンズアミド及び4-[(5S)-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-チエタニル)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-プロモ-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、(Liudai ben jia xuan an、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-プロモ-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-ジクロロエチニル)-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-アザピシクロ[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 ( WO2007040280A1、WO2007040282A1 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 ( WO2015/058021A1、WO2015/058028A1 から既知) ( CAS 1477919 - 27 - 9 )、及び、N - [ 4 - ( アミノチオソメチル) - 2 - メチル - 6 - [ ( メチルアミノ) - カルボニル] フェニル] - 3 - プロモ - 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 )、5 - ( 1 , 3 - ジオキサン - 2 - イル) - 4 - [ [ 4 - ( トリフルオロメチル) フェニル] メトキシ] ピリミジン ( WO2013/115391A1 から既知) ( CAS 1449021 - 97 - 9 )、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 - メチル - 1 , 8 - ジアザスピロ [ 4 . 5 ] デカ - 3 - エン - 2 - オン ( WO2010/066780A1、WO2011/151146A1 から既知) ( CAS 1229023 - 34 - 0 )、3 - ( 4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 1 - メチル - 1 , 8 - ジアザスピロ [ 4 . 5 ] デカン - 2 , 4 - ジオン ( WO2014/187846A1 から既知) ( CAS 1638765 - 58 - 8 )、3 - ( 4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 1 - メチル - 2 - オキソ - 1 , 8 - ジアザスピロ [ 4 . 5 ] デカ - 3 - エン - 4 - イル - カルボン酸エチルエステル ( WO2010/066780A1、WO2011/151146A1 から既知) ( CAS 1229023 - 00 - 0 )、N - [ 1 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 2 ( 1H) - ピリジニリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトアミド ( DE3639877A1、WO2012029672A1 から既知) ( CAS 1363400 - 41 - 2 )、[ N ( E ) ] - N - [ 1 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 2 ( 1H) - ピリジニリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトアミド ( WO2016005276A1 から既知) ( CAS 1689566 - 03 - 7 )、[ N ( Z ) ] - N

- [ 1 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 2 ( 1H) - ピリジニリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトアミド ( CAS 1702305 - 40 - 5 )、3 - エンド - 3 - [ 2 - プロボキシ - 4 - ( トリフルオロメチル) フェノキシ] - 9 - [ [ 5 - ( トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] オキシ] - 9 - アザビシクロ [ 3 . 3 . 1 ] ノナン ( WO2011/105506A1、WO2016/133011A1 から既知) ( CAS 1332838 - 17 - 1 )。

#### 【0196】

##### 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>」)。

#### 【0197】

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。

#### 【0198】

( 1 ) エルゴステロール生合成阻害薬、例えば、( 1 . 001 ) シプロコナゾール、

10

20

30

40

50

( 1 . 0 0 2 ) ジフェノコナゾール、( 1 . 0 0 3 ) エボキシコナゾール、( 1 . 0 0 4 ) フェンヘキサミド、( 1 . 0 0 5 ) フェンプロピジン、( 1 . 0 0 6 ) フェンプロピモルフ、( 1 . 0 0 7 ) フェンピラザミン、( 1 . 0 0 8 ) フルキンコナゾール、( 1 . 0 0 9 ) フルトリアホール、( 1 . 0 1 0 ) イマザリル、( 1 . 0 1 1 ) 硫酸イマザリル、( 1 . 0 1 2 ) イブコナゾール、( 1 . 0 1 3 ) メトコナゾール、( 1 . 0 1 4 ) ミクロブタニル、( 1 . 0 1 5 ) パクロブトラゾール、( 1 . 0 1 6 ) プロクロラズ、( 1 . 0 1 7 ) プロピコナゾール、( 1 . 0 1 8 ) プロチオコナゾール、( 1 . 0 1 9 ) ピリソキサゾール、( 1 . 0 2 0 ) スピロキサミン、( 1 . 0 2 1 ) テブコナゾール、( 1 . 0 2 2 ) テトラコナゾール、( 1 . 0 2 3 ) トリアジメノール、( 1 . 0 2 4 ) トリデモルフ、( 1 . 0 2 5 ) トリチコナゾール、( 1 . 0 2 6 ) ( 1 R , 2 S , 5 S ) - 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 2 7 ) ( 1 S , 2 R , 5 R ) - 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 2 8 ) ( 2 R ) - 2 - ( 1 - クロロシクロプロピル ) - 4 - [ ( 1 R ) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル ] - 1 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) ブタン - 2 - オール ( 1 . 0 2 9 ) ( 2 R ) - 2 - ( 1 - クロロシクロプロピル ) - 4 - [ ( 1 S ) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル ] - 1 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) ブタン - 2 - オール、( 1 . 0 3 0 ) ( 2 R ) - 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 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール、( 1 . 0 3 1 ) ( 2 S ) - 2 - ( 1 - クロロシクロプロピル ) - 4 - [ ( 1 R ) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル ] - 1 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) ブタン - 2 - オール、( 1 . 0 3 2 ) ( 2 S ) - 2 - ( 1 - クロロシクロプロピル ) - 4 - [ ( 1 S ) - 2 , 2 - ジクロロシクロプロピル ] - 1 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) ブタン - 2 - オール、( 1 . 0 3 3 ) ( 2 S ) - 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 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール、( 1 . 0 3 4 ) ( 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 . 0 3 5 ) ( S ) - [ 3 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル ) - 5 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル ] ( ピリジン - 3 - イル ) メタノール、( 1 . 0 3 6 ) [ 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 3 7 ) 1 - ( { ( 2 R , 4 S ) - 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 ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、( 1 . 0 3 8 ) 1 - ( { ( 2 S , 4 S ) - 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 ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、( 1 . 0 3 9 ) 1 - { [ 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、( 1 . 0 4 0 ) 1 - { [ r e l ( 2 R , 3 R ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、( 1 . 0 4 1 ) 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 - 5 - イルチオシアネート、( 1 . 0 4 2 ) 2 - [ ( 2 R , 4 R , 5 R ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 4 3 ) 2 - [ ( 2 R , 4 R , 5 S ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 4 4 ) 2 - [ ( 2 R , 4 S , 5 R ) - 1 - (

10

20

30

40

50

2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.045) 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 - 3 H - 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 - 3 H - 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 - 3 H - 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 - 3 H - 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 - 3 H - 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 - 3 H - 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 - 3 H - 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 - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.058) 2 - {[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} - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.059) 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、(1.060) 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} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.061) 5 - (アリルスルファニル) - 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、(1.062) 5 - (アリルスルファニル) - 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、(1.063) 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、(1.064) 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、(1.065) 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、(1.066) 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)

10

20

30

40

50

- 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 - [ ( 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 ) イブフェントリフルコナゾール ( i p f e n t r i f l u c o n a z o l e ) 。

【 0 1 9 9 】

( 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 ) ベンゾピンジフルピル、( 2 . 0 0 2 ) ピキサフェン、( 2 . 0 0 3 ) ポスカリド、( 2 . 0 0 4 ) カルボキシソ、( 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 ) イソフエタミド、( 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 S R ) 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 S R ) 、 ( 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 ( p y 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 ) ピフェニル - 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  
 10  
 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  
 ザール - 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  
 20  
 ザール - 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 - t e r t -  
 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 -  
 t e r t - 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 )  
 30  
 - 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  
 40  
 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

10

20

30

40

50

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 - カルボチオアミド、 ( 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 0 0 】

( 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 ) アゾキシストロビン、 ( 3 . 0 0 4 ) クメトキシストロビン ( coumethoxystrobin )、 ( 3 . 0 0 5 ) クモキシストロビン、 ( 3 . 0 0 6 ) シアゾファミド、 ( 3 . 0 0 7 ) ジモキシストロビン、 ( 3 . 0 0 8 ) エノキサストロビン、 ( 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ビン ( flufenoxystrobin )、 ( 3 . 0 1 2 ) フルオキサストロビン、 ( 3 . 0 1 3 ) クレソキシム - メチル、 ( 3 . 0 1 4 ) メトミノストロビン、 ( 3 . 0 1 5 ) オリサストロビン、 ( 3 . 0 1 6 ) ピコキシストロビン、 ( 3 . 0 1 7 ) ピラクロストロビン、 ( 3 . 0 1 8 ) ピラメトストロビン、 ( 3 . 0 1 9 ) ピラオキシストロビン、 ( 3 . 0 2 0 ) トリフロキシストロビン、 ( 3 . 0 2 1 ) ( 2 E ) - 2 - { 2 - [ ( { [ ( 1 E ) - 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 . 0 2 2 ) ( 2 E , 3 Z ) - 5 - { [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 1 H - 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 . 0 2 3 ) ( 2 R ) - 2 - { 2 - [ ( 2 , 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、 ( 3 . 0 2 4 ) ( 2 S ) - 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 . 0 2 5 ) ( 3 S , 6 S , 7 R , 8 R ) - 8 - ベンジル - 3 - [ ( { 3 - [ ( イソブチリルオキシ ) メトキシ ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル ) アミノ ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート、 ( 3 . 0 2 6 ) 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 . 0 2 7 ) 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 . 0 2 8 ) ( 2 E , 3 Z ) - 5 - { [ 1 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル ) - 1 H - 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

ルペンタ - 3 - エンアミド、( 3 . 0 2 9 ) { 5 - [ 3 - ( 2 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 H - 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。

【 0 2 0 1 】

( 4 ) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、( 4 . 0 0 1 ) カルベンダジム、( 4 . 0 0 2 ) ジエトフェンカルブ、( 4 . 0 0 3 ) エタボキサム、( 4 . 0 0 4 ) フルオピコリド、( 4 . 0 0 5 ) ペンシクロン、( 4 . 0 0 6 ) チアベンダゾール、( 4 . 0 0 7 ) チオファネート - メチル、( 4 . 0 0 8 ) ゾキサミド、( 4 . 0 0 9 ) 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 . 0 1 0 ) 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 . 0 1 1 ) 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 . 0 1 2 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 3 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 4 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - ブロモフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 5 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 6 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 7 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 8 ) 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 9 ) 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 0 ) 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 1 ) 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 2 ) 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 . 0 2 3 ) N - ( 2 - ブロモ - 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 4 ) N - ( 2 - ブロモフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - 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 - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン。

10

20

30

【 0 2 0 2 】

( 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 ( chlorothalonil )、( 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 ) ホルペット、( 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 ( zinc metiram )、( 5 . 0 1 7 ) オキシシン銅 ( copper oxine )、( 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 - 5 H - 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。

40

【 0 2 0 3 】

( 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

50

-メチル、(6.002)イソチアニル、(6.003)プロベナゾール、(6.004)チアジニル。

【0204】

(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、(7.001)シプロジニル、(7.002)カスガマイシン、(7.003)カスガマイシン塩酸塩水和物、(7.004)オキシテトラサイクリン、(7.005)ピリメタニル、(7.006)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。

【0205】

(8) ATP産生阻害薬、例えば、(8.001)シルチオフアム。

10

【0206】

(9) 細胞壁合成阻害薬、例えば、(9.001)ベンチアバリカルブ、(9.002)ジメトモルフ、(9.003)フルモルフ、(9.004)イプロバリカルブ、(9.005)マンジプロパミド、(9.006)ピリモルフ(pyrimorph)、(9.007)バリフェナレート、(9.008)(2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン、(9.009)(2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン。

20

【0207】

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10.001)プロパモカルブ、(10.002)プロパモカルブ塩酸塩、(10.003)トルクロホス-メチル。

【0208】

(11)メラニン生合成阻害薬、例えば、(11.001)トリシクラゾール、(11.002)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。

【0209】

(12) 核酸合成阻害薬、例えば、(12.001)ベナラキシル、(12.002)ベナラキシル-M(キララキシル)、(12.003)メタラキシル、(12.004)メタラキシル-M(メフェノキサム)。

30

【0210】

(13) シグナル伝達阻害薬、例えば、(13.001)フルジオキシニル、(13.002)イプロジオン、(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。

【0211】

(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。

【0212】

(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(oxxyfenthin)、(15.024)ペンタクロロフェノール及び塩、(15.0

40

50

25) 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-fosetyl ate)、(15.027) ピリオフェノン (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  
 20 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  
 20 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  
 30 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  
 30 メタンスルホネート、(15.041) 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) - 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  
 40 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) - 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} フェニル  
 40 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 (1H) - 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、(15.0

52) 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 1 3 】

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 1 4 】

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 1 5 】

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 1 6 】

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 ) 及び株 Q S T 2 8 0 8 ( 受託番号 N R R L B - 3 0 0 8 7 )、又は、バシルス・スブチリス ( *Bacillus subtilis* )、特に、株 G B 0 3 ( 受託番号 A T C C S D - 1 3 9 7 )、又は、バシルス・スブチリス ( *Bacillus subtilis* ) 株 Q S T 7 1 3 ( 受託番号 N R R L B - 2 1 6 6 1 )、又は、バシルス・スブチリス ( *Bacillus subtilis* ) 株 O S T 3 0 0 0 2 ( 受託番号 N R R L B - 5 0 4 2 1 )、バシルス・ツリングエンシス ( *Bacillus thuringiensis* )、特に、バシルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス ( *B. thuringiensis subspecies israelensis* ) ( 抗原型 H - 1 4 ) 株 A M 6 5 - 5 2 ( 受託番号 A T C C 1 2 7 6 )、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ ( *B. thuringiensis subsp. aizawai* )、特に、株 A B T S - 1 8 5 7 ( S D - 1 3 7 2 )、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ ( *B. thuringiensis subsp. kurstaki* ) 株 H D - 1、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス ( *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* ) 株 N B 1 7 6 ( S D - 5 4 2 8 )、パステウリア・ペネトランス ( *Pasteuria penetrans* )、パステウリア属種 ( *Pasteuria spp.* ) ( 口チレンクルス・レニホルミス ( *Rotylenchulus reniformis* ) 線虫 ) - P R 3 ( 受託番号 A T C C S D - 5 8 3 4 )、ストレプトミセス

10

20

30

40

50

・ミクロフラブス (*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)。

【0217】

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)、メトスクニコウイア・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・アトロピリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に、株 SC1 (受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*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)。

【0218】

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 (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV。

【0219】

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、同様に含まれる。例としては、以下のものを挙げることができる：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種 (*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セパシア (*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.)、

10

20

30

40

50

ラッカリア属種 (*Laccaria* spp.)、ラクトバシルス・ブクネリ (*Lactobacillus buchneri*)、パラグロムス属種 (*Paraglomus* spp.)、ピソリツス・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*)、プセウドモナス属種 (*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.)。

#### 【0220】

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<sup>TM</sup> 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。

#### 【0221】

##### 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、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。

#### 【0222】

##### 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の処理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物（天然に発生している作物植物を包含する）のような全ての植物及び植物個体群、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、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、ハウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物 (*Brassica oleracea*) (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含まれ、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含まれる。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。

#### 【0223】

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。

#### 【0224】

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

#### 【0225】

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

特に有利で有益な特性 (「形質」) を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種 (遺伝子工学により得られたもの) に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、渇水又は水中若しくは土壌中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開花能力、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能及び / 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 Cry I A (a)、Cry I A (b)、Cry I A (c)、Cry I I A、Cry I I I A、Cry I I I B 2、Cry 9 c、Cry 2 A b、Cry 3 B b 及び Cry I F 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、特定の除草活性化合物(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

#### 【0226】

##### 作物保護 - 処理の種類

20

植物及び植物の部分は、式(I)で表される化合物で、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散(spreading-on)、注入、灌水(灌漑(drenching))、点滴灌漑などによって、直接的に処理するか、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、スラリー処理によって、被覆によって、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。

30

#### 【0227】

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。

#### 【0228】

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、灌漑(drenching)によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させること〔即ち、植物の生育場所(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)植物の生育場所に導入すること〕によって、又は、滴下施用(多くの場合、「化学溶液灌水(chemigation)」とも称される)〔即ち、植物の生育場所内の定められた位置に変動する量の水と一緒に特定の期間にわたって地表面又は地下の滴下チューブを用いて式(I)で表される本発明の化合物を導入すること〕によって、達成することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式(I)で表される化合物(例えば、粒剤として)を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

40

#### 【0229】

##### 種子処理

50

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。

10

**【0230】**

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

20

**【0231】**

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。

**【0232】**

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。

30

**【0233】**

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。

**【0234】**

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。

40

**【0235】**

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。

**【0236】**

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。

**【0237】**

さらに、式(I)で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することも可能であり、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

50

適化される。

【0238】

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。

10

【0239】

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・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する。

20

【0240】

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、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子(例えば、ブライミング)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。

30

【0241】

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ない。

40

【0242】

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方法は、当業者には知られている。

【0243】

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。

【0244】

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、

50

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。

【0245】

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。

【0246】

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。

10

【0247】

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。

20

【0248】

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。

【0249】

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。

30

【0250】

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。

【0251】

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することができる。

40

【0252】

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であり；特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている(c f . R . Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401 - 412)。

【0253】

50

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、エンパ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。

10

#### 【0254】

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。

#### 【0255】

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 1 kg 当たり 0.001 ~ 50 g であり、好ましくは、種子 1 kg 当たり 0.01 ~ 15 g である。

20

#### 【0256】

##### 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。

30

#### 【0257】

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、動物育種及び畜産において、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。

#### 【0258】

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。

40

#### 【0259】

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。

#### 【0260】

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。

#### 【0261】

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

50

、又は、特に、家禽類に対して、投与される。

【0262】

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

【0263】

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。

10

【0264】

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：

アノプルリダ目(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.)；

20

マロファギダ目(Mallophagida)並びにアムブリセリナ亜目(Amblycerina)及びイスクノセリナ亜目(Ichnocerina)の、例えば、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.)、ウェルネキエラ属種(Werneckiella spp.)；

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(Hydrotaea 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

30

40

50

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.)、ツंगा属種 (*Tunga* spp.)、キセノブシラ属種 (*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。

10

#### 【0265】

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 (*Acarari* (*Acarina*)) 及びメタスティグマ目 (*Metastigmata*) の、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*) の、例えば、アルガス属種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ科 (*Ixodidae*) の、例えば、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、デルマセントル属種 (*Dermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種 (*Haemaphysalis* spp.)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、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)；

20

メソスティグマ目 (*Mesostigmata*) の、例えば、デルマニスス属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニスス属種 (*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.)、パロア属種 (*Varroa* spp.)；

30

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.)、ミオビア属種 (*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 (*Laminosioptes* 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.)

40

#### 【0266】

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ことで

50

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 (Spirotrichomonas 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.)、ペントトリコモナス属種 (Pentatrichomonas spp.)、テトラトリコモナス属種 (Tetratrichomonas spp.)、トリコモナス属種 (Trichomonas spp.)、トリトリコモナス属種 (Tritrichomonas 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 spp.)、ユーアメーバ科 (Euamoebidae)、例えば、ハルトマネラ属種 (Hartmannella spp.)；

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.)、トキソプラズマ属種 (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 (Encyphalitozoon 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.)。

【0267】

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、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。

【0268】

10

20

30

40

50

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事ができる

:

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.)、ジフロゴノボルス属種 (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 (Andryra 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.)、ダバイネア属種 (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 (Dipylidium 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.)、スチレシア属種 (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 (Catatropis 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 (Cotylophoron 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 (Echinocasmus 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 (Gastrothylacus 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

10

20

30

40

50

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.)、オルニトビルハルギア属種 (*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.)、トリコビルハルギア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、トログロトレマ属種 (*Troglootrema* 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 (*Cyclocoercus* 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 (*Cylicocycclus* spp.)、シリコステファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、シリンドロファリンキス属種 (*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 (*Hyostongylus* 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 (*Neostrongylus* 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 (*Obeliscoides* 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 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*Ollulanus* spp.) ; オルニトストロンギルス属種 (*Ornithostrongylus* 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.) ;

peria spp. )、パラクレノソマ属種 ( Paracrenosoma spp. )、パラフィロイデス属種 ( Parafilaroides spp. )、パレラホストロンギルス属種 ( Parelaphostromylylus spp. )、ブネウモカウルス属種 ( Pneumocaulus spp. )、ブネウモストロンギルス属種 ( Pneumostromylylus spp. )、ポテリオストムム属種 ( Poteriosomum 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 ( Trichostrongylus 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 ( Troglostrostrongylus 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 ( Oxuyuris 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. )、スクジュラピネマ属種 ( 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 ( Siphacia 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.)。

【0269】

獣医学の分野において、及び、畜産業において、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。

【0270】

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。

【0271】

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。

【0272】

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。

【0273】

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。

【0274】

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、極めて特定的には、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。

【0275】

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。

【0276】

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。

【0277】

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 (*ectoparasiticidal formulations*) 及び殺内部寄生生物薬製剤 (*endoparasiticidal 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 formulations*) 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、殺扁形動物薬製剤 (*platyhelminthocidal formulations*)、殺鉤頭動物薬製剤 (*acanthocephalocidal formulations*)

10

20

30

40

50

、殺舌形動物薬製剤 (pentastomocidal formulations)、殺虫薬製剤及び殺ダニ薬製剤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。

【0278】

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。

【0279】

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。

10

【0280】

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。

【0281】

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。

20

【0282】

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。

【0283】

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

【0284】

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>」）。

【0285】

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ことができる。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

40

50

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、双翅目において)；(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)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、トリゴラネル(trigolanner)、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、アウトチオホス、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、バニリプロール、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、ピオベルメトリン、フェンピリトリン、シス-シベルメトリン、シス-ベルメトリン、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；

トリブレン、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(chloromebiform)、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 acaricides)、例えば、有機酸、例えば、ギ酸、シュウ酸。

#### 【0286】

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ことができる。

。

10

20

30

40

50

## 【0287】

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/又は殺糸虫活性成分などを挙げることができる：

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 (oxibendazole)、メベンダゾール、トリクラベンダゾール (triclabendazole)、チオファネート (thiophanate)、パルベンダゾール (parbendazole)、オキシフェンダゾール (oxfendazole)、ネトビミン (netobimin)、フェンベンダゾール、フェバンテル、チアベンダゾール (thiabendazole)、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：エモデブシド (emodepside)、PF1022A；

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、オキサントール；

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 (dAMD)、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 (monepantel)；

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 (meniclopholan)；

有機リン酸エステル類のクラスの、例えば：トリクロルホン、ナフタロホス (naphthalofos)、ジクロルボス/DDVP、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 (praziquantel)、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 (mirasan)、ミラシル (miracil)、ルカントン、ヒカントン、ヘトリン (hetolin)、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 (amoscanate)、クロルスロン。

## 【0288】

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ことができる：

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；

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

10

20

30

40

50

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・プラエコクス (*Eimeria praecox*)、エイメリア・ネカトリクス (*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・アセルプリナ (*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・ビビパルス (*Dictyocaulus viviparus*)。

【0289】

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。

【0290】

#### 媒介動物の防除

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

【0291】

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；

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

・ ブユ (*Simuliidae*) : 蠕虫類 (特に、回旋系状虫 (*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、条虫；

(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、

10

20

30

40

50

野兔病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症 (borreliosis) ;

(6) マダニ類: ボレリア症 (borellioses)、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 (babesioses) (Babesia canis canis)、エーリキア症 (ehrlichiosis)。

【0292】

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

【0293】

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。

20

【0294】

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。

【0295】

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。

【0296】

30

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。

【0297】

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

40

【0298】

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。

【0299】

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。

【0300】

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

50

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

### 【0301】

#### 衛生分野における害虫の防除

式（I）で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内保護分野において、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、動物育種施設）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

### 【0302】

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

### 【0303】

施用は、例えば、エアゾル、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】

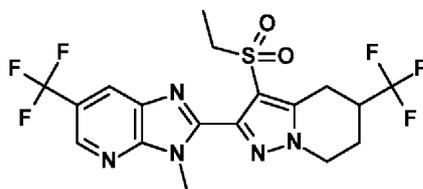
### 【0304】

#### 調製実施例：

2 - [ 3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン ( I - 1 )

40

### 【化12】



### 【0305】

50

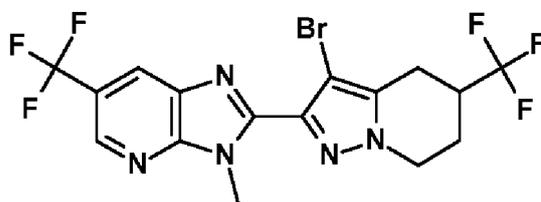
265.0 mg (0.56 mmol) の 2 - [ 3 - プロモ - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4, 5 - b ] ピリジン、657.2 mg (5.66 mmol) のエタン sulfon 酸ナトリウム及び 16.2 mg (0.08 mmol) のヨウ化銅 (I) を、マイクロ波合成装置 (Anton Paar, Monowave 400) 内で、15 mL の N, N - ジメチルホルムアミドの中で 120 °C で 12 時間 (h) 撈拌した。次いで、その反応混合物に塩化ナトリウム溶液を添加し、それを酢酸エチルで抽出した。その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、その溶媒を減圧下で留去した。その残渣を、溶離液として水 / アセトニトリルの勾配を使用する分取 HPLC によるカラムクロマトグラフィー精製で精製した。

【 0306 】

logP (HCOOH): 3.21; MH<sup>+</sup>: 482; <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm: 1.26 (t, 3H), 2.18-2.22 (m, 1H), 2.33-2.37 (m, 1H), 3.00-3.06 (m, 1H), 3.19 (br. s, 1H), 3.47-3.53 (m, 1H), 3.75 (q, 2H), 3.95 (s, 3H), 4.30-4.36 (m, 1H), 4.47-4.51 (m, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.86 (s, 1H).

2 - [ 3 - プロモ - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [ 4, 5 - b ] ピリジン

【化 13】



【 0307 】

250 mg (1.30 mmol) の N2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2, 3 - ジアミン、502 mg (1.63 mmol) の 3 - プロモ - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリジン - 2 - カルボン酸及び 251 mg (1.30 mmol) の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) を、アルゴン下、10 mL のピリジンの中で室温で 16 時間撈拌した。その反応混合物から溶媒を減圧下で除去し、その残渣に水を添加し、それを酢酸エチルで抽出した。その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、その溶媒を減圧下で留去した。次いで、その残渣を 10 mL の濃酢酸の中で 100 °C で 8 時間撈拌した。その混合物を水で稀釈し、酢酸エチルで 3 回抽出した。その有機相を合して水及び炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、その有機相を除去し、その水相を酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、その溶媒を減圧下で留去した。

【 0308 】

logP (HCOOH): 3.99; MH<sup>+</sup>: 468; <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm: 2.12-2.17 (m, 1H), 2.33-2.37 (m, 1H), 2.76-2.83 (m, 1H), 3.05-3.10 (m, 1H), 3.17 (br. s, 1H), 4.10 (s, 3H), 4.24-4.32 (m, 1H), 4.44-4.48 (m, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.80 (s, 1H).

3 - プロモ - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロピラゾロ [ 1, 5 - a ] ピリジン - 2 - カルボン酸

10

20

30

40

## 【化 1 4】



## 【0309】

881 mg (3.76 mmol) の 5-(トリフルオロメチル)-4,5,6,7-テトラヒドロピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-カルボン酸及び 337 mg (4.13 mmol) の N-ブロモスクシンイミドを 60 mL のクロロホルムに溶解させ、室温で 72 時間攪拌した。その反応混合物に水を添加し、その有機相を除去し、硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、その溶媒を減圧下で留去した。

10

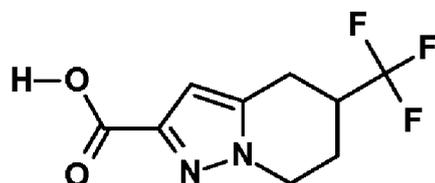
## 【0310】

logP (HCOOH): 1.75; MH<sup>+</sup>: 313; <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm: 2.00-2.10 (m, 1H), 2.27-2.33 (m, 1H), 2.64-2.71 (m, 1H), 2.93-2.98 (m, 1H), 3.05-3.14 (s, 1H), 4.11-4.19 (m, 1H), 4.31-4.35 (m, 1H), 12.95 (br. s, 1H).

5-(トリフルオロメチル)-4,5,6,7-テトラヒドロピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-カルボン酸

20

## 【化 1 5】



## 【0311】

1.00 g (4.34 mmol) の 5-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-カルボン酸を、65 mL のエタノールの中で、100 mg (0.44 mmol) の酸化白金(IV)の存在下、4 バールで、12 時間水素化した。次いで、その反応混合物をセライトで濾過し、エタノールで洗浄し、その溶媒を減圧下で留去した。

30

## 【0312】

logP (HCOOH): 1.28; MH<sup>+</sup>: 235; <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm: 1.98-2.08 (m, 1H), 2.26-2.30 (m, 1H), 2.74-2.81 (m, 1H), 2.97-3.08 (m, 1H), 3.11-3.16 (s, 1H), 4.10-4.17 (m, 1H), 4.30-4.34 (m, 1H), 6.52 (s, 1H), 12.50 (br. s, 1H).

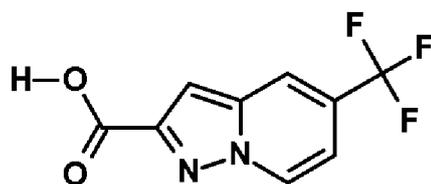
該実施例と同様にして、及び、上記で記載した調製方法によって、式(I)で表される下記化合物を得ることができる。

## 【0313】

5-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-2-カルボン酸

40

## 【化 1 6】



## 【0314】

2.00 g (6.61 mmol) の 5-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]

50

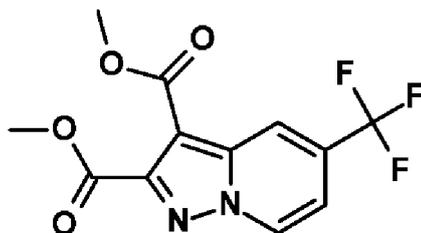
] ピリジン - 2 , 3 - ジカルボン酸ジメチルを、50 mL の 50 % 硫酸の中で、80 で 3 時間攪拌した。その冷却した溶液を、氷浴で冷却しながら、5 N 水酸化ナトリウム溶液でアルカリ性とし、酢酸エチルで抽出した。その水相を、2 N 塩酸を用いて pH 2 - 3 に調節し、完全に溶解するまで水で希釈した。その水相を酢酸エチルで 3 回抽出し、硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、その溶媒を減圧下で留去した。その残渣を、溶離液として水 / アセトニトリル混合物を使用する分取 H P L C によるカラムクロマトグラフィー精製で精製した。

## 【 0 3 1 5 】

logP (HCOOH): 1.58; MH<sup>+</sup>: 231; <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm: 7.29-7.32 (m, 2H), 8.36 (s, 1H), 8.93 (d, 1H), 13.4 (br. s, 1H).

5 - (トリフルオロメチル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン - 2,3 - ジカルボン酸ジメチル

## 【化 1 7】



10

20

## 【 0 3 1 6 】

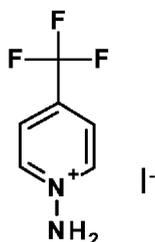
1.00 g (3.44 mmol) の 4 - (トリフルオロメチル) - 1 - アミノピリジニウムヨード及び 953 mg (6.89 mmol) の炭酸カリウムを 7 mL のジメチルホルムアミドに最初に装入し、それに、室温で、514 mg (3.62 mmol) のアセチレンジカルボン酸ジメチルを滴下して加えた。その反応混合物を室温で 2 時間攪拌し、その間に、空気を導入した。次いで、その混合物を濾過し、その母液を除去し、その溶媒を減圧下で留去した。その残渣を取って水の中に入れ、エーテルで抽出した。その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、次いで、その溶媒を減圧下で留去した。

## 【 0 3 1 7 】

logP (HCOOH): 2.57; MH<sup>+</sup>: 303; <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm: 3.89 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 7.57 (d, 1H), 8.38 (s, 1H), 9.15 (d, 1H).

4 - (トリフルオロメチル) - 1 - アミノピリジニウムヨード

## 【化 1 8】



40

## 【 0 3 1 8 】

8.54 g (67.9 mmol) のヒドロキシルアミン - O - スルホン酸を 50 mL の水の中に最初に装入し、それに、10.00 g (67.9 mmol) の 4 - (トリフルオロメチル)ピリジンを添加した。その混合物を 90 で 30 分間攪拌し、冷却後、9.395 g (67.9 mmol) の炭酸カリウムを添加した。その残渣を取って 85 mL のエタノールの中に入れ、濾過し、その母液に 9 mL のヨウ化水素酸 (67.9 mmol、57 % 強度) を添加した。- 20 で 14 時間経過した後、沈澱した固体を濾過し、そして、それ以上精製することなくさらに変換させた。

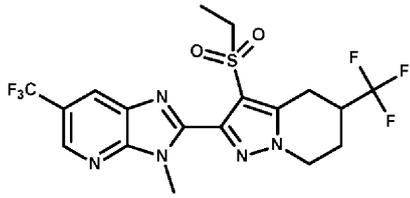
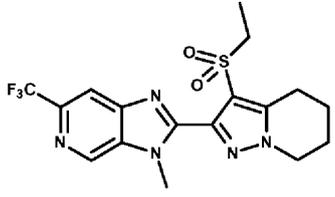
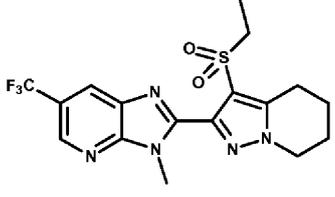
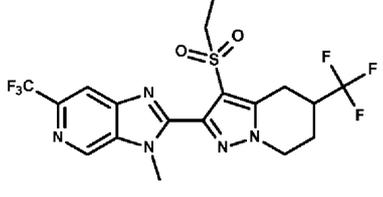
## 【 0 3 1 9 】

該実施例と同様にして、及び、上記で記載した調製方法によって、式 (I) で表される

50

下記化合物を得ることができる。

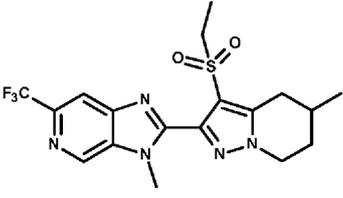
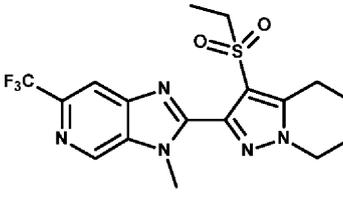
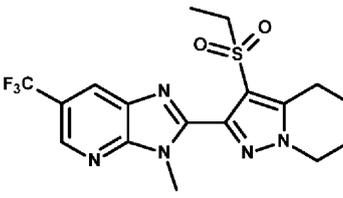
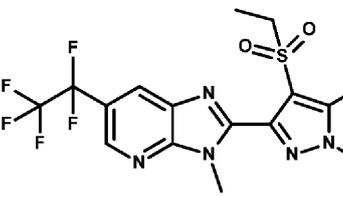
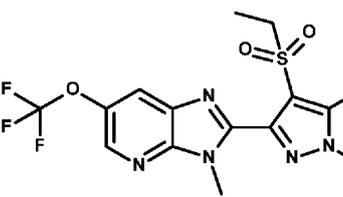
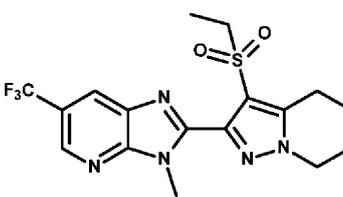
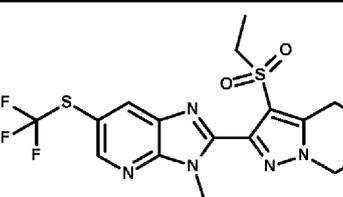
【表 1】

実施例	構造
I-01	
I-02	
I-03	
I-04	

10

20

30

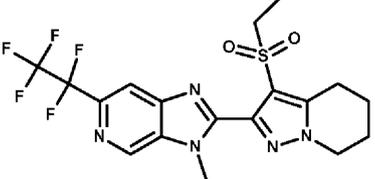
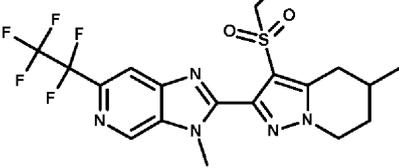
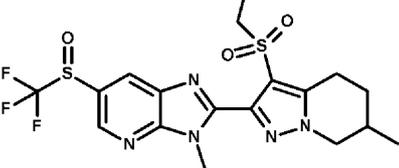
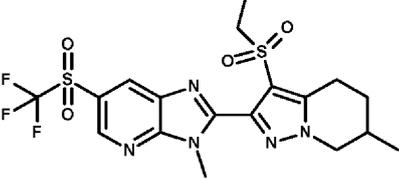
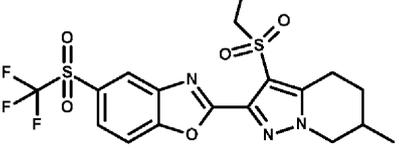
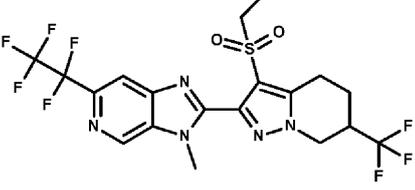
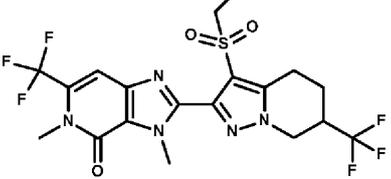
I-05	
I-06	
I-07	
I-08	
I-09	
I-10	
I-11	

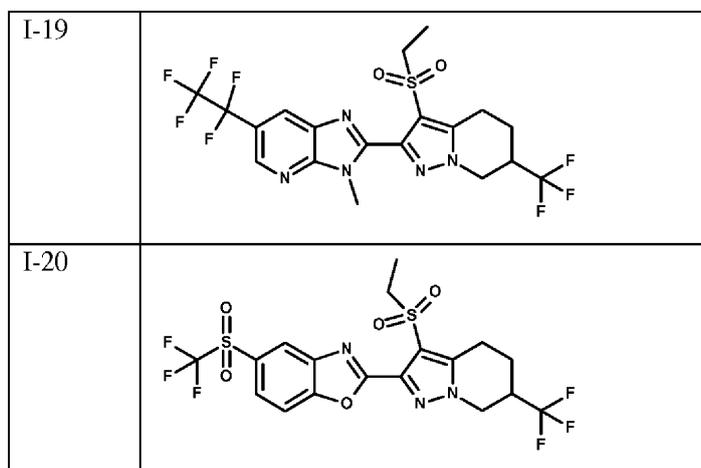
10

20

30

40

I-12		
I-13		10
I-14		
I-15		20
I-16		30
I-17		
I-18		40



10

## 【0320】

分析的測定

以下に記載されている分析的測定の手順は、明細書の個々の部分において特定の分析的測定に関する手順の個別的な記載がなされていない場合、本明細書全体における全ての情報に関する。

## 【0321】

log P 値

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

20

## 【0322】

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

## 【0323】

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

30

## 【0324】

較正は、log P 値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン (3個～16個の炭素原子を有している) を用いて実施する (log P 値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間によって、保持時間に基づいて決定する)。

## 【0325】

質量分析法

酸性クロマトグラフィー条件下での LC-MS を用いた  $[M+H]^+$  又は  $M^-$  の測定は、溶離液として、1リットルのアセトニトリル当たり 1 mL のギ酸及び1リットルのミリポア水当たり 0.9 mL のギ酸を用いて実施した。「Zorbax Eclipse Plus C18 50 mm x 2.1 mm、1.8 μm カラム」を、カラムオープン温度 55 で使用した。

40

## 【0326】

機器：

LC-MS3：SQD2 質量分析計と Sample Manager オートサンプラーが付いている Waters UPLC。直線勾配：0.0 1.70分 10% アセトニトリル 95% アセトニトリル、1.70 2.40分 一定95% アセトニトリル、流量：0.85 mL / 分。

50

## 【0327】

LC-MS6、及び、LC-MS7：Agilent 1290 LC、Agilent MSD質量分析計、HTS PALオートサンプラー。直線勾配：0.0 1.80分 10%アセトニトリル 95%アセトニトリル、1.80 2.50分、一定95%アセトニトリル、流量：1.0 mL/分。

## 【0328】

中性クロマトグラフィー条件下でのLC-MSを用いた[M+H]<sup>+</sup>の測定は、溶離液として、アセトニトリル及びミリポア水(79 mg/Lの炭酸アンモニウム含有)を使用して実施した。

## 【0329】

機器：

LC-MS4：QDA質量分析計とFTNオートサンプラーが付いているWaters IClass Acquity (Waters Acquity 1.7 μm 50 mm x 2.1 mmカラム、カラムオープン温度：45 )。直線勾配：0.0 2.10分 10%アセトニトリル 95%アセトニトリル、2.10 3.00分 一定95%アセトニトリル、流量：0.7 mL/分。

## 【0330】

LC-MS5：MSD質量分析計とHTS PALオートサンプラーが付いているAgilent 1100 LC System (カラム：Zorbax XDB C18 1.8 μm 50 mm x 4.6 mm、カラムオープン温度：55 )。直線勾配：0.0 4.25分 10%アセトニトリル 95%アセトニトリル、4.25 5.80分 一定95%アセトニトリル、流量：2.0 mL/分。

## 【0331】

全ての場合において、保持時間インデックスは、3個～16個の炭素を有する同族の一連の直鎖アルカン-2-オンの校正測定から決定し、ここで、最初のアルカノンに対するインデックスを300に設定し、最後のアルカノンに対するインデックスを1600に設定し、そして、連続するアルカノンの値の間で線形補間を実施した。

## 【0332】

<sup>1</sup>H NMRスペクトルの測定は、1.7 mm TCIプローブヘッドを備えた「Bruker Avance I II 400 MHz 分光計」で、標準(0.00 ppm)としてテトラメチルシランを使用して、溶媒CD<sub>3</sub>CN、CDCl<sub>3</sub>又はd<sub>6</sub>-DMSOの中の溶液で実施した。あるいは、5 mm CPNMPプローブヘッドを備えた「Bruker Avance I II 600 MHz 分光計」又は5 mm TCIプローブヘッドを備えた「Bruker Avance NEO 600 MHz 分光計」を当該測定に使用した。一般に、当該測定は、プローブヘッド温度298 Kで実施した。異なる測定温度を使用した場合、そのことは個別に注記されている。

## 【0333】

選択された実施例に関するNMRデータNMRピークリスト法

選択された実施例の<sup>1</sup>H-NMRデータは、<sup>1</sup>H-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。

## 【0334】

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：

<sub>1</sub> (強度<sub>1</sub>) ; <sub>2</sub> (強度<sub>2</sub>) ; . . . ; <sub>i</sub> (強度<sub>i</sub>) ; . . . ; <sub>n</sub> (強度<sub>n</sub>)。

## 【0335】

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

10

20

30

40

50

強いシグナルとの比較で示され得る。

【0336】

1H NMRスペクトルの化学シフトを校正するために、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。

【0337】

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。

【0338】

さらに、それらは、従来の1H NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体（これも、同様に、本発明の対象の一部を構成する）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。

10

【0339】

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<sub>6</sub>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。

【0340】

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。

20

【0341】

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つ。

【0342】

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

30

【0343】

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

【表 2】

実施例	
I-01	I-01: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta$ = 8.8634 (2.3); 8.8600 (2.3); 8.6422 (2.4); 8.6381 (2.3); 4.5119 (0.4); 4.5032 (0.4); 4.4798 (0.6); 4.4711 (0.6); 4.3624 (0.4); 4.3513 (0.4); 4.3315 (0.6); 4.3210 (0.6); 4.3014 (0.4); 3.9466 (16.0); 3.7755 (0.9); 3.7571 (3.0); 3.7386 (3.1); 3.7202 (0.9); 3.5280 (0.6); 3.5159 (0.6); 3.4858 (0.7); 3.4731 (0.7); 3.3274 (227.4); 3.1916 (0.4); 3.1857 (0.4); 3.0643 (0.9); 3.0363 (0.6); 3.0212 (0.7); 2.9935 (0.5); 2.6758 (0.4); 2.6714 (0.6); 2.6670 (0.5); 2.5245 (1.6); 2.5109 (36.0); 2.5067 (76.0); 2.5023 (103.0); 2.4978 (75.6); 2.4936 (37.4); 2.3748 (0.4); 2.3392 (0.7); 2.3337 (0.8); 2.3291 (0.8); 2.3249 (0.5); 2.2211 (0.5); 2.2071 (0.6); 2.1886 (0.5); 2.1751 (0.4); 1.2733 (3.2); 1.2550 (7.3); 1.2364 (3.2); 0.0079 (1.6); -0.0002 (50.7); -0.0083 (2.2)
I-02	I-02: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta$ = 9.2242 (4.0); 8.3148 (0.4); 8.2511 (4.2); 4.2975 (1.5); 4.2823 (2.9); 4.2672 (1.5); 4.0245 (16.0); 3.6736 (1.0); 3.6553 (3.2); 3.6368 (3.3); 3.6184 (1.0); 3.3180 (112.0); 3.0924 (1.4); 3.0766 (3.0); 3.0607 (1.5); 2.6748 (1.1); 2.6704 (1.5); 2.6658 (1.2); 2.5098 (86.5); 2.5056 (177.3); 2.5011 (247.6); 2.4967 (196.4); 2.4926 (106.2); 2.3323 (1.0); 2.3280 (1.4); 2.3236 (1.1); 2.0758 (1.2); 2.0695 (1.6); 2.0594 (1.3); 2.0552 (1.3); 1.9027 (1.3); 1.8976 (1.3); 1.8880 (1.5); 1.8738 (1.1); 1.2421 (3.4); 1.2237 (7.6); 1.2052 (3.3); 0.1460 (0.7); 0.0176 (0.8); 0.0079 (6.3); -0.0002 (162.0); -0.0081 (11.2); -0.1497 (0.7)
I-03	I-03: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta$ = 8.8532 (2.4); 8.8500 (2.4); 8.6270 (2.4); 8.6232 (2.4); 4.3015 (1.4); 4.2865 (2.8); 4.2712 (1.5); 3.9304 (16.0); 3.7068 (0.9); 3.6884 (3.2); 3.6699 (3.2); 3.6515 (1.0); 3.3235 (49.0); 3.0973 (1.3); 3.0817 (2.9); 3.0657 (1.4); 2.8707 (0.5); 2.8594 (0.5); 2.6807 (0.3); 2.6761 (0.3); 2.6713 (0.4); 2.6666 (0.4); 2.5065 (44.4); 2.5022 (59.7); 2.4978 (44.2); 2.3289 (0.3); 2.0846 (1.0); 2.0703 (1.5); 2.0573 (1.2); 2.0409 (0.6); 1.9030 (1.3); 1.8883 (1.5); 1.8743 (1.1); 1.2485 (3.3); 1.2302 (7.4); 1.2117 (3.2); 0.0077 (1.2); -0.0002 (31.0); -0.0083 (1.4)
I-04	I-04: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta$ = 9.2338 (4.8); 9.2218 (2.6); 8.2658 (5.0); 8.2531 (2.7); 4.4947 (1.1); 4.4643 (1.6); 4.3438 (1.0); 4.3141 (1.6); 4.2826 (0.9); 4.1230 (0.3); 4.0398 (16.0); 4.0264 (8.3); 3.7431 (1.1); 3.7255 (3.7); 3.7073 (4.4); 3.6940 (2.4); 3.5185 (0.9); 3.5073 (1.4); 3.4768 (1.1); 3.4643 (1.6); 3.3176 (70.4); 3.3059 (47.4); 3.1830 (1.0); 3.0620 (1.5); 3.0335 (1.0); 3.0183 (1.5); 2.9911 (0.9); 2.6657 (1.4); 2.5005 (234.4); 2.4966 (246.4); 2.4935 (227.9); 2.3717 (1.2); 2.3282 (2.4); 2.2432 (0.4); 2.2300 (0.6); 2.2141 (1.0); 2.2002 (1.3); 2.1837 (1.2); 2.1694 (1.1); 2.1399 (0.4); 1.2862 (0.6); 1.2659 (4.0); 1.2479 (9.0); 1.2301 (5.8); 1.2159 (2.2); -0.0009 (59.4); -0.0037 (47.4); -0.0148 (25.6); -0.1501 (0.3)
I-05	I-05: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta$ = 9.2904 (0.4); 9.2240 (4.0); 8.3189 (0.4); 8.2511 (4.2); 4.4034 (0.5); 4.3957 (0.5); 4.3712 (0.8); 4.3633 (0.7); 4.2758 (0.4); 4.2653 (0.5); 4.2470 (0.6); 4.2359 (0.7); 4.2155 (0.4); 4.2027 (0.4); 4.0822 (1.6); 4.0566 (0.6); 4.0251 (16.0); 3.7194 (0.3); 3.7011 (0.4); 3.6765 (0.9); 3.6580 (2.6); 3.6394 (2.7); 3.6211

10

20

30

40

	(0.9); 3.3243 (75.2); 3.2809 (0.7); 3.2696 (0.7); 2.6716 (0.3); 2.6120 (0.7); 2.5865 (0.8); 2.5673 (0.7); 2.5422 (0.8); 2.5244 (1.8); 2.5202 (1.6); 2.5107 (20.0); 2.5067 (42.0); 2.5022 (57.0); 2.4978 (42.8); 2.3288 (0.3); 2.0989 (0.8); 2.0728 (1.1); 2.0490 (0.7); 1.8309 (0.4); 1.8176 (0.5); 1.7979 (0.5); 1.7845 (0.4); 1.2427 (3.7); 1.2244 (8.3); 1.2058 (3.7); 1.1365 (5.0); 1.1204 (4.9); 0.0079 (1.1); -0.0002 (35.2); -0.0081 (2.1)
I-06	I-06: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.2242 (4.3); 8.3139 (0.4); 8.2519 (4.6); 4.4083 (0.8); 4.3974 (0.9); 4.3774 (0.9); 4.3639 (0.9); 4.0229 (16.0); 3.8560 (0.9); 3.8292 (1.2); 3.7970 (0.8); 3.7063 (0.5); 3.6881 (0.8); 3.6706 (1.7); 3.6522 (1.7); 3.6464 (1.7); 3.6282 (1.7); 3.6105 (0.9); 3.5924 (0.4); 3.3259 (677.2); 3.2631 (0.8); 3.2307 (0.9); 3.0007 (0.4); 2.9839 (0.5); 2.9737 (0.5); 2.9554 (0.8); 2.9400 (0.4); 2.9269 (0.4); 2.9128 (0.4); 2.6751 (1.8); 2.6708 (2.2); 2.5058 (317.1); 2.5019 (398.8); 2.4980 (297.1); 2.3285 (2.4); 2.2437 (0.6); 2.2331 (0.7); 2.0003 (0.6); 1.9926 (0.6); 1.9652 (0.7); 1.5937 (0.3); 1.5788 (0.6); 1.5656 (0.6); 1.5469 (0.6); 1.5361 (0.5); 1.2388 (3.9); 1.2206 (7.8); 1.2022 (3.6); 1.1088 (6.2); 1.0923 (6.1); 0.1455 (0.4); -0.0002 (102.8); -0.1498 (0.6)
I-07	I-07: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.8528 (2.4); 8.8495 (2.4); 8.6248 (2.5); 8.6209 (2.4); 4.4127 (0.7); 4.3999 (0.8); 4.3800 (0.8); 4.3679 (0.8); 3.9298 (16.0); 3.8587 (0.8); 3.8316 (1.0); 3.8010 (0.8); 3.7416 (0.5); 3.7237 (0.7); 3.7064 (1.5); 3.6963 (0.5); 3.6879 (1.4); 3.6782 (1.4); 3.6697 (0.5); 3.6598 (1.5); 3.6426 (0.8); 3.6243 (0.4); 3.3201 (11.0); 3.2930 (0.6); 3.2853 (0.6); 3.2787 (0.6); 3.2720 (0.5); 3.2471 (0.5); 3.2393 (0.7); 3.2333 (0.7); 3.2267 (0.5); 3.0032 (0.4); 2.9871 (0.5); 2.9755 (0.5); 2.9586 (0.7); 2.9429 (0.3); 2.9307 (0.4); 2.6758 (0.4); 2.6712 (0.5); 2.5243 (1.2); 2.5065 (63.9); 2.5021 (83.5); 2.4977 (60.3); 2.3332 (0.4); 2.3288 (0.5); 2.3244 (0.4); 2.2457 (0.5); 1.9998 (0.5); 1.9922 (0.5); 1.9661 (0.6); 1.5812 (0.5); 1.5669 (0.6); 1.5475 (0.5); 1.5340 (0.5); 1.2457 (3.4); 1.2273 (7.5); 1.2088 (3.3); 1.1089 (5.8); 1.0923 (5.7); 0.0079 (0.9); -0.0002 (25.2)
I-08	I-08: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.7867 (2.2); 8.7820 (2.3); 8.5825 (2.3); 8.5780 (2.2); 4.4151 (0.6); 4.4019 (0.7); 4.3831 (0.7); 4.3703 (0.7); 3.9419 (16.0); 3.8613 (0.7); 3.8349 (0.9); 3.8034 (0.7); 3.7579 (0.5); 3.7398 (0.7); 3.7225 (1.4); 3.7040 (1.3); 3.6912 (1.3); 3.6728 (1.4); 3.6553 (0.7); 3.6375 (0.5); 3.3239 (123.8); 3.2927 (0.4); 3.2858 (0.5); 3.2799 (0.5); 3.2722 (0.4); 3.2479 (0.5); 3.2404 (0.6); 3.2345 (0.6); 3.2270 (0.5); 2.9878 (0.4); 2.9757 (0.4); 2.9590 (0.6); 2.6756 (0.4); 2.6710 (0.6); 2.6665 (0.4); 2.5244 (1.4); 2.5196 (2.1); 2.5109 (36.9); 2.5065 (77.9); 2.5020 (104.3); 2.4975 (74.4); 2.4931 (35.4); 2.3331 (0.4); 2.3288 (0.6); 2.3242 (0.4); 2.2490 (0.4); 1.9983 (0.4); 1.9909 (0.4); 1.9725 (0.4); 1.9657 (0.5); 1.5801 (0.4); 1.5661 (0.5); 1.5471 (0.5); 1.5339 (0.4); 1.2469 (3.2); 1.2285 (7.3); 1.2101 (3.1); 1.1078 (5.4); 1.0912 (5.3); -0.0002 (5.7)
I-09	I-09: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.5778 (2.0); 8.5721 (2.1); 8.3469 (1.9); 8.3436 (1.9); 4.4049 (0.6); 4.3925 (0.7); 4.3734 (0.8); 4.3606 (0.8); 3.9667 (0.3); 3.9010 (16.0); 3.8517 (0.8); 3.8252 (0.9); 3.7939 (0.7); 3.7441 (0.5); 3.7261 (0.8); 3.7088 (1.4); 3.6904 (1.4); 3.6772 (1.4); 3.6588 (1.5); 3.6414 (0.8); 3.6235 (0.5); 3.3239 (216.4); 3.2860 (0.5); 3.2797 (0.6); 3.2740 (0.6); 3.2667 (0.5); 3.2414 (0.5); 3.2344 (0.6); 3.2280 (0.6); 3.2214 (0.5); 2.9956 (0.3); 2.9800 (0.4); 2.9683 (0.4); 2.9507 (0.6); 2.9220 (0.3); 2.6756 (0.6); 2.6711 (0.8); 2.6667 (0.6); 2.5244 (1.9); 2.5108 (48.4); 2.5065 (101.0); 2.5021 (135.0); 2.4976 (98.2); 2.4935 (48.5); 2.3333 (0.6); 2.3288 (0.8); 2.3245 (0.6); 2.2391 (0.4); 2.2250 (0.4); 2.0019 (0.4); 1.9955 (0.4); 1.9887 (0.4); 1.9680 (0.5); 1.9612 (0.5); 1.5762 (0.4); 1.5618 (0.5); 1.5432 (0.5); 1.5297 (0.4); 1.2412 (3.3); 1.2228 (7.3); 1.2043 (3.2); 1.1056 (5.6); 1.0891 (5.5); 0.0078 (1.7); -0.0002 (53.7); -0.0080 (2.2)
I-10	I-10: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.8522 (2.3); 8.8487 (2.4); 8.6251 (2.4); 8.6203 (2.4); 8.3145 (0.4); 4.4071 (0.4); 4.3980 (0.5); 4.3738 (0.7); 4.3666 (0.7); 4.2788 (0.4); 4.2678 (0.5); 4.2515 (0.6); 4.2402 (0.6); 4.2195

10

20

30

40

	(0.3); 3.9926 (1.5); 3.9631 (0.4); 3.9299 (16.0); 3.7564 (0.3); 3.7384 (0.4); 3.7076 (0.8); 3.6901 (2.1); 3.6697 (2.2); 3.6518 (0.8); 3.3192 (104.3); 3.2904 (0.7); 3.2780 (0.7); 2.8687 (0.4); 2.8572 (0.4); 2.6752 (1.1); 2.6707 (1.5); 2.6662 (1.2); 2.6139 (0.7); 2.5872 (0.8); 2.5681 (0.8); 2.5431 (1.1); 2.5239 (4.8); 2.5104 (93.2); 2.5061 (194.4); 2.5016 (260.8); 2.4972 (189.4); 2.4931 (93.4); 2.3328 (1.0); 2.3284 (1.5); 2.3241 (1.1); 2.0990 (0.8); 2.0738 (1.2); 2.0656 (1.0); 2.0501 (0.6); 1.8343 (0.4); 1.8212 (0.5); 1.8013 (0.4); 1.7919 (0.4); 1.2479 (3.5); 1.2296 (7.8); 1.2112 (3.4); 1.1368 (4.8); 1.1209 (4.9); 1.1073 (0.6); 0.0080 (0.3); -0.0002 (11.2)	
I-11	I-11: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.7291 (2.7); 8.7244 (3.0); 8.6054 (2.7); 8.6008 (2.6); 4.4096 (0.6); 4.3967 (0.7); 4.3773 (0.8); 4.3649 (0.7); 3.9820 (0.4); 3.9149 (16.0); 3.8561 (0.7); 3.8291 (0.9); 3.7983 (0.7); 3.7451 (0.5); 3.7270 (0.8); 3.7098 (1.4); 3.6914 (1.4); 3.6796 (1.4); 3.6733 (0.5); 3.6612 (1.4); 3.6438 (0.8); 3.6259 (0.5); 3.3231 (81.1); 3.2898 (0.5); 3.2837 (0.5); 3.2767 (0.5); 3.2688 (0.4); 3.2443 (0.5); 3.2372 (0.6); 3.2312 (0.6); 3.2244 (0.5); 2.9988 (0.4); 2.9834 (0.4); 2.9709 (0.4); 2.9551 (0.6); 2.9267 (0.3); 2.6757 (0.4); 2.6711 (0.5); 2.6667 (0.4); 2.5243 (1.6); 2.5109 (31.5); 2.5066 (64.5); 2.5021 (85.4); 2.4976 (62.4); 2.4933 (31.1); 2.3332 (0.4); 2.3289 (0.5); 2.3242 (0.4); 2.2522 (0.4); 2.2432 (0.4); 1.9954 (0.4); 1.9892 (0.4); 1.9688 (0.5); 1.9631 (0.5); 1.5778 (0.4); 1.5640 (0.5); 1.5450 (0.5); 1.5315 (0.4); 1.2448 (3.3); 1.2264 (7.3); 1.2079 (3.2); 1.1062 (5.5); 1.0897 (5.4); 0.0079 (3.1); -0.0002 (78.3); -0.0084 (3.5); -0.1496 (0.4)	10
I-12	I-12: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.2486 (4.0); 8.2755 (4.3); 8.2740 (4.3); 4.2999 (1.5); 4.2852 (2.9); 4.2702 (1.5); 4.0310 (16.0); 3.6868 (1.0); 3.6684 (3.3); 3.6499 (3.4); 3.6315 (1.0); 3.3178 (65.2); 3.0938 (1.4); 3.0781 (2.9); 3.0623 (1.5); 2.6749 (0.7); 2.6705 (1.0); 2.6661 (0.7); 2.5236 (3.4); 2.5099 (63.1); 2.5059 (124.2); 2.5014 (162.0); 2.4970 (120.0); 2.3326 (0.8); 2.3281 (1.1); 2.3237 (0.8); 2.0832 (1.0); 2.0765 (1.2); 2.0701 (1.6); 2.0610 (1.3); 2.0404 (0.6); 1.9030 (1.4); 1.8975 (1.2); 1.8881 (1.5); 1.8744 (1.1); 1.2461 (3.4); 1.2277 (7.7); 1.2092 (3.4); 0.0078 (1.6); -0.0003 (44.8); -0.0082 (2.0)	20
I-13	I-13: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.3141 (0.4); 9.2478 (3.7); 8.3456 (0.4); 8.3136 (0.4); 8.2750 (4.1); 8.2730 (4.1); 4.4064 (0.4); 4.3984 (0.4); 4.3919 (0.4); 4.3735 (0.7); 4.3657 (0.6); 4.3591 (0.5); 4.2781 (0.3); 4.2668 (0.5); 4.2496 (0.5); 4.2371 (0.6); 4.2175 (0.3); 4.2057 (0.3); 4.0877 (1.6); 4.0618 (0.3); 4.0304 (16.0); 3.7297 (0.3); 3.7113 (0.3); 3.6880 (0.7); 3.6705 (2.1); 3.6684 (2.1); 3.6498 (2.2); 3.6323 (0.8); 3.3212 (259.2); 3.2842 (0.8); 3.2720 (0.8); 2.6797 (0.4); 2.6752 (1.0); 2.6707 (1.4); 2.6661 (1.0); 2.6615 (0.5); 2.6122 (0.6); 2.5865 (0.7); 2.5677 (0.6); 2.5415 (1.0); 2.5241 (4.8); 2.5193 (6.3); 2.5106 (81.0); 2.5062 (164.8); 2.5016 (216.6); 2.4971 (156.4); 2.4926 (75.8); 2.3374 (0.5); 2.3329 (1.0); 2.3284 (1.4); 2.3238 (1.0); 2.3194 (0.5); 2.1001 (0.7); 2.0737 (1.0); 1.8318 (0.4); 1.8174 (0.5); 1.7985 (0.4); 1.7887 (0.3); 1.7843 (0.4); 1.2455 (3.6); 1.2272 (8.2); 1.2087 (3.5); 1.1372 (4.7); 1.1211 (4.6); 0.0079 (2.1); -0.0002 (68.7); -0.0086 (2.3)	30
I-14	I-14: <sup>1</sup> H-NMR(601.6 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 19.9789 (1.4); 8.9186 (2.0); 8.9154 (2.1); 8.6789 (1.7); 8.3096 (1.0); 3.9575 (16.0); 3.7166 (1.1); 3.7047 (1.0); 3.6829 (1.0); 3.6709 (1.2); 3.3026 (90.0); 2.6119 (2.5); 2.6088 (1.8); 2.5213 (5.7); 2.5181 (7.0); 2.5151 (6.3); 2.5063 (142.3); 2.5033 (318.3); 2.5002 (458.5); 2.4971 (320.9); 2.4940 (145.4); 2.3875 (1.9); 2.3844 (2.4); 1.2439 (2.9); 1.2316 (7.1); 1.2194 (2.9); 1.1071 (4.7); 1.0960 (4.6); 0.0965 (1.1); 0.0053 (9.9); -0.0002 (370.2); -0.0057 (10.5); -0.1001 (1.0)	40
I-15	I-15: <sup>1</sup> H-NMR(601.6 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 19.9775 (0.5); 9.1201 (2.5); 9.1166 (2.6); 8.9586 (2.2); 8.9551 (2.1); 8.3093 (0.4); 4.4157 (0.5); 4.4071 (0.6); 4.3951 (0.6); 4.3865 (0.6); 3.9955 (16.0); 3.8606 (0.5); 3.8428 (0.7); 3.8225 (0.6); 3.7512 (0.5); 3.7390 (0.7); 3.7276 (1.3); 3.7154 (1.0); 3.7056 (0.4); 3.6936 (1.1); 3.6813 (1.2); 3.6699 (0.7);	

	3.6577 (0.5); 3.3044 (146.5); 3.2598 (0.5); 2.9689 (0.5); 2.6152 (0.9); 2.6121 (1.2); 2.6091 (0.9); 2.5215 (2.6); 2.5183 (3.2); 2.5153 (2.8); 2.5065 (67.5); 2.5035 (149.6); 2.5004 (213.6); 2.4973 (150.9); 2.4943 (68.3); 2.3877 (0.9); 2.3846 (1.2); 2.2459 (0.3); 1.9804 (0.4); 1.5775 (0.4); 1.5676 (0.4); 1.5550 (0.4); 1.2476 (3.0); 1.2353 (7.0); 1.2230 (2.9); 1.1081 (4.6); 1.0970 (4.5); 0.0965 (0.7); 0.0052 (5.0); -0.0002 (184.8); -0.0058 (5.6); -0.1001 (0.7)	
I-16	I-16: <sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.7157 (5.2); 8.7116 (5.2); 8.3329 (3.6); 8.3112 (7.7); 8.2777 (3.8); 8.2734 (3.6); 8.2559 (1.7); 8.2517 (1.8); 4.4284 (1.4); 4.4160 (1.5); 4.3959 (1.7); 4.3837 (1.6); 3.8732 (1.6); 3.8467 (1.9); 3.8418 (1.8); 3.8147 (1.6); 3.8041 (0.3); 3.7927 (0.9); 3.7850 (0.4); 3.7746 (1.6); 3.7572 (3.8); 3.7392 (4.3); 3.7230 (3.8); 3.7052 (1.5); 3.6874 (0.7); 3.3258 (50.7); 3.3102 (1.0); 3.3026 (1.1); 3.2958 (1.1); 3.2889 (0.9); 3.2637 (1.0); 3.2566 (1.3); 3.2506 (1.3); 3.2433 (1.0); 3.0025 (0.8); 2.9862 (1.0); 2.9752 (0.9); 2.9585 (1.4); 2.9411 (0.8); 2.9296 (0.7); 2.9141 (0.6); 2.6796 (1.3); 2.6751 (1.8); 2.6706 (1.3); 2.6664 (0.7); 2.5285 (5.3); 2.5237 (8.2); 2.5149 (117.7); 2.5107 (241.2); 2.5062 (318.1); 2.5017 (226.9); 2.4972 (109.0); 2.3375 (1.4); 2.3329 (1.9); 2.3286 (1.4); 2.2435 (0.9); 2.2326 (0.9); 1.9903 (0.9); 1.9837 (0.9); 1.9738 (0.9); 1.9642 (1.0); 1.9566 (1.1); 1.5965 (0.4); 1.5816 (0.5); 1.5678 (1.0); 1.5541 (1.1); 1.5351 (1.0); 1.5207 (0.8); 1.5070 (0.5); 1.4934 (0.4); 1.3516 (0.5); 1.3331 (1.0); 1.3140 (0.5); 1.2889 (0.5); 1.2760 (7.2); 1.2576 (16.0); 1.2392 (7.3); 1.1031 (11.7); 1.0865 (11.5); 0.0043 (0.7)	10
I-17	I-17: <sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.2582 (3.6); 8.3157 (0.3); 8.2910 (3.8); 8.2888 (4.0); 4.6285 (0.6); 4.6152 (0.6); 4.5966 (0.8); 4.5831 (0.7); 4.3605 (0.7); 4.3339 (0.9); 4.3115 (1.4); 4.3026 (0.6); 4.0514 (16.0); 3.7604 (0.5); 3.7422 (0.8); 3.7250 (1.4); 3.7065 (1.5); 3.6883 (1.5); 3.6700 (1.4); 3.6526 (0.8); 3.6345 (0.5); 3.4174 (0.4); 3.3682 (0.5); 3.3561 (0.4); 3.3217 (46.7); 3.0949 (0.4); 3.0843 (0.4); 3.0670 (0.6); 3.0386 (0.3); 2.6752 (0.6); 2.6706 (0.9); 2.6660 (0.7); 2.5242 (2.5); 2.5196 (3.8); 2.5108 (52.1); 2.5063 (108.2); 2.5017 (144.2); 2.4971 (104.0); 2.4925 (50.3); 2.3331 (0.7); 2.3285 (0.9); 2.3239 (0.7); 2.3194 (0.4); 2.2738 (0.4); 2.2675 (0.4); 2.2576 (0.4); 2.2499 (0.5); 2.2418 (0.5); 2.0742 (1.6); 1.9927 (0.4); 1.9781 (0.5); 1.9596 (0.4); 1.9452 (0.4); 1.2579 (3.1); 1.2395 (7.4); 1.2210 (3.1); 0.1457 (0.4); 0.0080 (3.6); -0.0002 (117.6); -0.0085 (4.0); -0.0165 (0.3); -0.0172 (0.3); -0.0179 (0.3); -0.1497 (0.5)	20
I-18	I-18: <sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 7.4013 (4.4); 4.5894 (0.7); 4.5763 (0.7); 4.5580 (0.9); 4.5445 (0.8); 4.3262 (0.8); 4.2995 (1.0); 4.2685 (0.7); 4.0649 (16.0); 3.6267 (0.7); 3.6108 (8.3); 3.5916 (1.8); 3.5840 (0.6); 3.5730 (1.6); 3.5652 (1.5); 3.5544 (0.6); 3.5468 (1.6); 3.5295 (0.8); 3.5112 (0.5); 3.4023 (0.5); 3.3242 (140.3); 3.2981 (0.9); 3.2899 (0.9); 3.0840 (0.4); 3.0690 (0.5); 3.0573 (0.5); 3.0405 (0.6); 3.0234 (0.4); 3.0119 (0.4); 2.6752 (0.7); 2.6708 (0.9); 2.6663 (0.7); 2.5239 (4.1); 2.5105 (62.8); 2.5064 (117.4); 2.5019 (147.5); 2.4973 (107.0); 2.4931 (53.4); 2.3332 (0.7); 2.3288 (0.9); 2.3241 (0.7); 2.3197 (0.4); 2.2582 (0.5); 2.2507 (0.5); 2.2408 (0.5); 2.2251 (0.6); 1.9781 (0.5); 1.9639 (0.6); 1.9456 (0.5); 1.9324 (0.4); 1.2182 (3.4); 1.1998 (7.5); 1.1814 (3.3); 0.0078 (3.6); -0.0002 (74.6); -0.0084 (3.6); -0.1494 (0.3)	30
I-19	I-19: <sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.7973 (2.6); 8.7933 (2.6); 8.5973 (2.7); 8.5934 (2.5); 4.6302 (0.7); 4.6171 (0.8); 4.5987 (0.9); 4.5850 (0.9); 4.3648 (0.9); 4.3382 (1.1); 4.3071 (0.8); 3.9614 (16.0); 3.9428 (0.6); 3.7952 (0.6); 3.7773 (0.9); 3.7599 (1.5); 3.7415 (1.4); 3.7168 (1.3); 3.6984 (1.5); 3.6811 (0.9); 3.6629 (0.6); 3.4243 (0.5); 3.4101 (0.5); 3.3751 (0.8); 3.3626 (0.7); 3.3246 (197.2); 3.1130 (0.4); 3.0972 (0.5); 3.0854 (0.5); 3.0694 (0.7); 3.0522 (0.4); 3.0407 (0.4); 2.6753 (1.0); 2.6710 (1.3); 2.6664 (1.0); 2.5063 (164.0); 2.5020 (203.0); 2.4976 (147.5); 2.3332 (1.0); 2.3289 (1.3); 2.3245 (1.0); 2.2749 (0.5); 2.2674 (0.5); 2.2489 (0.6); 2.2414 (0.6); 1.9951 (0.5); 1.9810 (0.6); 1.9618 (0.6); 1.9508 (0.4); 1.2614 (3.4); 1.2430 (7.5); 1.2247 (3.4); 0.1461 (0.4); 0.0078	40

	(4.5); -0.0001 (89.9); -0.0082 (4.6); -0.1495 (0.4)
I-20	I-20: <sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): $\delta$ = 8.7248 (4.8); 8.7206 (4.9); 8.3434 (3.7); 8.3217 (7.4); 8.3156 (0.6); 8.2830 (3.6); 8.2785 (3.5); 8.2613 (1.8); 8.2567 (1.8); 4.6396 (1.2); 4.6263 (1.4); 4.6077 (1.7); 4.5943 (1.6); 4.3727 (1.6); 4.3464 (1.9); 4.3410 (1.6); 4.3148 (1.4); 3.8113 (0.9); 3.7932 (1.6); 3.7755 (3.2); 3.7691 (1.0); 3.7570 (3.1); 3.7506 (3.0); 3.7380 (1.1); 3.7322 (3.3); 3.7145 (1.7); 3.6962 (0.9); 3.4165 (0.8); 3.3899 (1.1); 3.3776 (1.2); 3.3687 (1.0); 3.3236 (188.3); 3.1088 (0.6); 3.0938 (0.9); 3.0830 (0.8); 3.0655 (1.2); 3.0486 (0.6); 3.0371 (0.7); 3.0212 (0.6); 2.6801 (0.4); 2.6756 (0.9); 2.6711 (1.3); 2.6666 (1.0); 2.6622 (0.4); 2.5246 (3.1); 2.5198 (4.8); 2.5111 (75.9); 2.5067 (157.5); 2.5021 (208.6); 2.4976 (148.1); 2.4931 (69.5); 2.3379 (0.4); 2.3334 (0.9); 2.3289 (1.3); 2.3244 (1.0); 2.3199 (0.4); 2.2632 (0.8); 2.2559 (0.8); 2.2460 (0.8); 2.2371 (1.0); 2.2294 (1.0); 2.0744 (1.0); 2.0102 (0.4); 1.9959 (0.5); 1.9822 (0.9); 1.9681 (1.0); 1.9497 (0.9); 1.9353 (0.8); 1.9217 (0.4); 1.9076 (0.3); 1.2771 (7.0); 1.2587 (16.0); 1.2403 (6.9); 0.1459 (0.9); 0.0080 (6.8); -0.0002 (211.3); -0.0086 (6.4); -0.1495 (0.9)

10

## 【0344】

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、9 mgの活性成分を、最初に、1 mLのアセトン p . a . に溶解させ、次いで、アセトン p . a . を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び揺動させる（揺動回転 30 rpm で 2 時間）ことによって 250  $\mu$ L の該溶液を 25 mL 容ガラス管の内壁及び底面に均一に分配させる。900 ppm の活性成分溶液及び 44 . 7 cm<sup>2</sup> の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5  $\mu$ g / cm<sup>2</sup> の面積基準薬量が達成される。

20

## 【0345】

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で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。

30

## 【0346】

ある物質がこの試験において 5  $\mu$ g / cm<sup>2</sup> 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。

## 【0347】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、5  $\mu$ g / cm<sup>2</sup> (= 500 g / ha) の施用量で、100 % の効力を示す： I - 05。

40

## 【0348】

クリロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus) - 成体クリロコイタマダニ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、9 mgの活性成分を、最初に、1 mLのアセトン p . a . に溶解させ、次いで、アセトン p . a . を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び揺動させる（揺動回転 30 rpm で 2 時間）ことによって 250  $\mu$ L の該溶液を 25 mL 容試験管の内壁及び底面に均一に分配させる。900 ppm の活性成分溶液及び 44 . 7 cm<sup>2</sup> の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5  $\mu$ g / cm<sup>2</sup> の面積基準薬量が達成される。

50

## 【0349】

溶媒を蒸発させた後、該管に5～10匹の成体クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) 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、暗所において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、トントンと叩いてクリイロコイタマダニを該管の床面に落とし、5分を超えない時間、ホットプレート上で45～50℃でインキュベートする。該管の床面で動かないままにいるか又は這い上がることによって熱を意図的に避けることができないような動きがギクシャクとしているクリイロコイタマダニは、死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

【0350】

ある物質がこの試験において $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で少なくとも80%の効力を達成した場合、その物質は、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのクリイロコイタマダニ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、損傷を受けたクリイロコイタマダニが無かったことを意味する。

10

【0351】

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 - 05。

【0352】

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。

【0353】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ (*Boophilus microplus*) の腹部に $1\mu\text{L}$ 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。

【0354】

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

【0355】

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 $20\mu\text{g}$ の施用量で、100%の効力を示す： I - 05、I - 13。

【0356】

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

【0357】

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。

【0358】

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

【0359】

50

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 - 11、I - 13。

【0360】

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 - 05。

【0361】

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 - 02、I - 15。

【0362】

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希釈して所望の濃度とする。

【0363】

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。

【0364】

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。

【0365】

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 - 02。

【0366】

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希釈して所望の濃度とする。

【0367】

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。

【0368】

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。

【0369】

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 - 02、I - 05。

【0370】

ジアブロチカ・バルテアタ (Diabrotica balteata) - 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、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度は、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈することによって得る。

【0371】

予め膨潤させたコムギ (Triticum aestivum) 粒を寒天と少量の水で満たされているマルチウェルプレートの中で1日間インキュベートする(窪み1つ当たり5種子粒)。発芽したコムギ粒に所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。次いで、各窪み

10

20

30

40

50

に10～20匹のジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) の幼虫を寄生させる。

【0372】

7日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのコムギ植物が無処理の寄生されていない対照と同様に成長したことを意味し；0%は、成長したコムギ植物が無かったことを意味する。

【0373】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、160 μg / 窪みの施用量で、100%の効力を示す： I - 17、I - 18、I - 19。

【0374】

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。

【0375】

50 μL の該活性成分調製物をマイクロタイタープレートの中に移し、150 μL の IPL 4 1 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。

【0376】

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。

【0377】

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 - 01、I - 02、I - 03、I - 04、I - 05、I - 07、I - 08、I - 10、I - 11、I - 12、I - 13、I - 14、I - 17、I - 18、I - 19。

【0378】

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 - 09、I - 15、I - 16。

【0379】

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する。

【0380】

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。

【0381】

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。

【0382】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、100%の効力を示す： I - 04、I - 05、I - 14。

10

20

30

40

50

## 【0383】

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 - 02、I - 03、I - 06、I - 09、I - 10、I - 11、I - 12、I - 13、I - 15、I - 18。

## 【0384】

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、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。

10

## 【0385】

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。

## 【0386】

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。

20

## 【0387】

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 - 01、I - 03、I - 12。

## 【0388】

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、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。

30

## 【0389】

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 (armyworm) (Spodoptera frugiperda) の幼虫を寄生させる。

## 【0390】

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。

40

## 【0391】

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 - 01、I - 08、I - 13、I - 15、I - 17、I - 19。

## 【0392】

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 - 11。

## 【0393】

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

50

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、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。

【0394】

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

10

【0395】

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。

【0396】

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-04、I-13。

【0397】

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-10。

20

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP2019/053631

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> <i>C07D 471/04</i> (2006.01)i; <i>A01N 43/90</i> (2006.01)i		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D; A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2017125340 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 27 July 2017 (2017-07-27) cited in the application formula A14; claim 2	1-11
A	WO 2018015289 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 25 January 2018 (2018-01-25) claims 1, 9-12	1-11
A	WO 2017093180 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 08 June 2017 (2017-06-08) cited in the application claims 1, 8-11	1-11
A	WO 2017072039 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 04 May 2017 (2017-05-04) claims 1, 9-12	1-11
A	WO 2012086848 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; TAKYO HAYATO [JP]; TAKAHASHI MASAKI [JP]; T) 28 June 2012 (2012-06-28) cited in the application claims 1, 14, 15	1-11
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	"T" later document published after the international filing date, or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family	
Date of the actual completion of the international search <b>19 March 2019</b>	Date of mailing of the international search report <b>27 March 2019</b>	
Name and mailing address of the ISA/EP <b>European Patent Office p.b. 5818, Patentlaan 2, 2280 HV Rijswijk Netherlands</b> Telephone No. (+31-70)340-2040 Facsimile No. (+31-70)340-3016	Authorized officer <b>Sarakinos, Georgios</b>  Telephone No.	

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP2019/053631

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2009076440 A2 (DU PONT [US]; BISAHA JOHN JOSEPH [US]; CREWS ALVIN DONALD JR [US]; HOW) 18 June 2009 (2009-06-18) claims 1, 12-14	1-11
A	HIROYUKI KAWAI ET AL. "Regioselective Synthesis of Pyrazole Triflones Based on Triflyl Alkyne Cycloadditions" <i>ORGANIC LETTERS</i> , 14(23), 6012-6015 CODEN: ORLEF7; ISSN: 1523-7052, Vol. 14, No. 20, 19 October 2012 (2012-10-19), pages 5330-5333 DOI: 10.1021/ol3025154 ISSN: 1523-7060, XP055468007 compounds 5a-5i	1-11

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
**Information on patent family members**

International application No.

**PCT/EP2019/053631**

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
WO	2017125340	A1	27 July 2017	AR	107397	A1	25 April 2018
				TW	201738248	A	01 November 2017
				UY	37081	A	31 August 2017
				WO	2017125340	A1	27 July 2017
WO	2018015289	A1	25 January 2018	AR	109076	A1	24 October 2018
				AU	2017298972	A1	31 January 2019
				CA	3031139	A1	25 January 2018
				TW	201811804	A	01 April 2018
				UY	37327	A	28 February 2018
				WO	2018015289	A1	25 January 2018
WO	2017093180	A1	08 June 2017	NONE			
WO	2017072039	A1	04 May 2017	AR	106473	A1	17 January 2018
				AU	2016347345	A1	10 May 2018
				BR	112018008440	A2	06 November 2018
				CA	3002888	A1	04 May 2017
				CL	2018001077	A1	14 December 2018
				CN	108430986	A	21 August 2018
				CO	2018004344	A2	19 July 2018
				EP	3368521	A1	05 September 2018
				JP	2018536639	A	13 December 2018
				KR	20180069005	A	22 June 2018
				PE	11982018	A1	23 July 2018
				PH	12018500877	A1	29 October 2018
				TW	201726621	A	01 August 2017
				US	2018305353	A1	25 October 2018
				UY	36966	A	31 May 2017
				WO	2017072039	A1	04 May 2017
WO	2012086848	A1	28 June 2012	AR	084588	A1	29 May 2013
				AU	2011345747	A1	06 June 2013
				BR	112013016022	A2	10 July 2018
				CA	2822919	A1	28 June 2012
				CN	103261170	A	21 August 2013
				EP	2655337	A1	30 October 2013
				EP	3006429	A1	13 April 2016
				JP	5853669	B2	09 February 2016
				JP	6011698	B2	19 October 2016
				JP	6048554	B2	21 December 2016
				JP	2013136519	A	11 July 2013
				JP	2015232035	A	24 December 2015
				JP	2015232036	A	24 December 2015
				KR	20130140125	A	23 December 2013
				RU	2013134464	A	27 January 2015
				TW	201234965	A	01 September 2012
US	2014018373	A1	16 January 2014				
US	2014364444	A1	11 December 2014				
WO	2012086848	A1	28 June 2012				
ZA	201303654	B	29 October 2014				
WO	2009076440	A2	18 June 2009	AU	2008335151	A1	18 June 2009
				CN	101889012	A	17 November 2010

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
**Information on patent family members**

International application No.  
**PCT/EP2019/053631**

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
		EP 2217600 A2	18 August 2010
		ES 2398677 T3	20 March 2013
		JP 2011506465 A	03 March 2011
		KR 20100110815 A	13 October 2010
		US 2010273775 A1	28 October 2010
		WO 2009076440 A2	18 June 2009

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2019/053631

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> INV. C07D471/04 A01N43/90 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b> Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2017/125340 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 27. Juli 2017 (2017-07-27) in der Anmeldung erwähnt Formula A14; Anspruch 2 -----	1-11
A	WO 2018/015289 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 25. Januar 2018 (2018-01-25) Ansprüche 1, 9-12 -----	1-11
A	WO 2017/093180 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 8. Juni 2017 (2017-06-08) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1, 8-11 -----	1-11
A	WO 2017/072039 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 4. Mai 2017 (2017-05-04) Ansprüche 1, 9-12 -----	1-11
-/--		
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 19. März 2019		Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 27/03/2019
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Sarakinos, Georgios

1

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (April 2005)

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2019/053631
---

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2012/086848 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; TAKYO HAYATO [JP]; TAKAHASHI MASAKI [JP]; T) 28. Juni 2012 (2012-06-28) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1, 14, 15 -----	1-11
A	WO 2009/076440 A2 (DU PONT [US]; BISAHA JOHN JOSEPH [US]; CREWS ALVIN DONALD JR [US]; HOW) 18. Juni 2009 (2009-06-18) Ansprüche 1, 12-14 -----	1-11
A	HIROYUKI KAWAI ET AL: "Regioselective Synthesis of Pyrazole Triflones Based on Triflyl Alkyne Cycloadditions", ORGANIC LETTERS , 14(23), 6012-6015 CODEN: ORLEF7; ISSN: 1523-7052, Bd. 14, Nr. 20, 19. Oktober 2012 (2012-10-19), Seiten 5330-5333, XP055468007, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/o13025154 Verbindungen 5a-5i -----	1-11

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2019/053631

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2017125340 A1	27-07-2017	AR 107397 A1	25-04-2018
		TW 201738248 A	01-11-2017
		UY 37081 A	31-08-2017
		WO 2017125340 A1	27-07-2017
-----			
WO 2018015289 A1	25-01-2018	AR 109076 A1	24-10-2018
		AU 2017298972 A1	31-01-2019
		CA 3031139 A1	25-01-2018
		TW 201811804 A	01-04-2018
		UY 37327 A	28-02-2018
		WO 2018015289 A1	25-01-2018
-----			
WO 2017093180 A1	08-06-2017	KEINE	
-----			
WO 2017072039 A1	04-05-2017	AR 106473 A1	17-01-2018
		AU 2016347345 A1	10-05-2018
		BR 112018008440 A2	06-11-2018
		CA 3002888 A1	04-05-2017
		CL 2018001077 A1	14-12-2018
		CN 108430986 A	21-08-2018
		CO 2018004344 A2	19-07-2018
		EP 3368521 A1	05-09-2018
		JP 2018536639 A	13-12-2018
		KR 20180069005 A	22-06-2018
		PE 11982018 A1	23-07-2018
		PH 12018500877 A1	29-10-2018
		TW 201726621 A	01-08-2017
		US 2018305353 A1	25-10-2018
		UY 36966 A	31-05-2017
		WO 2017072039 A1	04-05-2017
-----			
WO 2012086848 A1	28-06-2012	AR 084588 A1	29-05-2013
		AU 2011345747 A1	06-06-2013
		BR 112013016022 A2	10-07-2018
		CA 2822919 A1	28-06-2012
		CN 103261170 A	21-08-2013
		EP 2655337 A1	30-10-2013
		EP 3006429 A1	13-04-2016
		JP 5853669 B2	09-02-2016
		JP 6011698 B2	19-10-2016
		JP 6048554 B2	21-12-2016
		JP 2013136519 A	11-07-2013
		JP 2015232035 A	24-12-2015
		JP 2015232036 A	24-12-2015
		KR 20130140125 A	23-12-2013
		RU 2013134464 A	27-01-2015
		TW 201234965 A	01-09-2012
		US 2014018373 A1	16-01-2014
		US 2014364444 A1	11-12-2014
		WO 2012086848 A1	28-06-2012
		ZA 201303654 B	29-10-2014
-----			
WO 2009076440 A2	18-06-2009	AU 2008335151 A1	18-06-2009
		CN 101889012 A	17-11-2010
		EP 2217600 A2	18-08-2010
		ES 2398677 T3	20-03-2013
		JP 2011506465 A	03-03-2011
		KR 20100110815 A	13-10-2010

Formblatt PCT/ISA/210 (Anhang Patentfamilie) (April 2005)

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2019/053631

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
		US 2010273775 A1	28-10-2010
		WO 2009076440 A2	18-06-2009

## フロントページの続き

(51) Int. Cl.	F I		テーマコード (参考)	
<b>A 0 1 N 47/02 (2006.01)</b>	A 0 1 N	43/90	1 0 4	
<b>A 0 1 M 1/20 (2006.01)</b>	A 0 1 N	47/02		
	A 0 1 M	1/20		A

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

(74) 代理人 100143823

弁理士 市川 英彦

(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 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 100182132

弁理士 河野 隆

(74) 代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74) 代理人 100127812

弁理士 城山 康文

(72) 発明者 フィッシャー, リュディガー

ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツォー・デン・フースフェレン・2 3

(72) 発明者 ハイガー, ドミニク

ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、ロッテンシュトラーセ・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 ウィロット, マチュー

ドイツ国、4 0 2 1 5・デュッセルドルフ、ヤーンシュトラーセ・1 5

(72) 発明者 イルグ, ケルスティン

ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、ノイツァー・ヴァール・3 2

(72) 発明者 ゲルゲンス, ウルリッヒ

ドイツ国、4 0 8 8 2・ラーティンゲン、フェスター・シュトラーセ・3 7

(72) 発明者 ツベルグ, アンドレアス

ドイツ国、4 2 7 8 1・ハーン、シンターシュトラーセ・8 6

Fターム(参考) 2B121 AA11 CC02

4C065 AA01 AA03 BB05 CC01 DD02 EE02 HH02 HH03 JJ01 KK08  
LL09 PP16  
4C072 MM02 UU02  
4H011 AC01 AC04 BB09 BB11