

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6303250号
(P6303250)

(45) 発行日 平成30年4月4日(2018.4.4)

(24) 登録日 平成30年3月16日(2018.3.16)

(51) Int.Cl.	F 1
C07D 213/16	(2006.01) C07D 213/16
C07D 213/26	(2006.01) C07D 213/26 C S P
C07D 213/57	(2006.01) C07D 213/57
C07D 213/61	(2006.01) C07D 213/61
C07D 213/85	(2006.01) C07D 213/85

請求項の数 4 (全 52 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2013-258710 (P2013-258710)	(73) 特許権者	000000354 石原産業株式会社 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
(22) 出願日	平成25年12月13日(2013.12.13)	(72) 発明者	桐山 和久 滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原 産業株式会社 中央研究所内
(65) 公開番号	特開2015-96482 (P2015-96482A)	(72) 発明者	松本 真洋 滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原 産業株式会社 中央研究所内
(43) 公開日	平成27年5月21日(2015.5.21)	(72) 発明者	吉田 幸太郎 滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原 産業株式会社 中央研究所内
審査請求日	平成28年11月14日(2016.11.14)	(72) 発明者	ダミティンスレン ボルドバーテル 滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原 産業株式会社 中央研究所内
(31) 優先権主張番号	特願2013-212795 (P2013-212795)		
(32) 優先日	平成25年10月10日(2013.10.10)		
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		
(31) 優先権主張番号	特願2013-162860 (P2013-162860)		
(32) 優先日	平成25年8月6日(2013.8.6)		
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		
(31) 優先権主張番号	特願2012-280207 (P2012-280207)		
(32) 優先日	平成24年12月21日(2012.12.21)		
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		

最終頁に続く

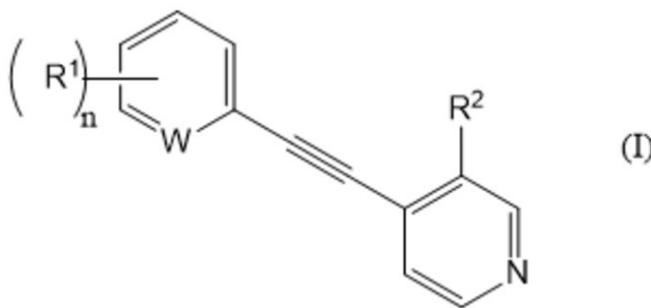
(54) 【発明の名称】有害生物防除剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) :

【化 1】



〔式(I)中、

R¹はハロゲン原子、アミノ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₆)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₂-C₆)アルケニルチオ基、(C₂-C₆)アルキニルチオ基、(C₃-C₆)シクロアルキルチオ基、(C₁-C₆)ハロアルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルアミノ基、(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₃-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₄-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₅-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₆-C₆)アルキルアミノ基。

)アルケニルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基、(C₃-C₆)シクロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)ハロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基、カルボキシル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基又は(C₁-C₆)アルキルカルボニル(C₁-C₆)アルキルアミノ基であり；

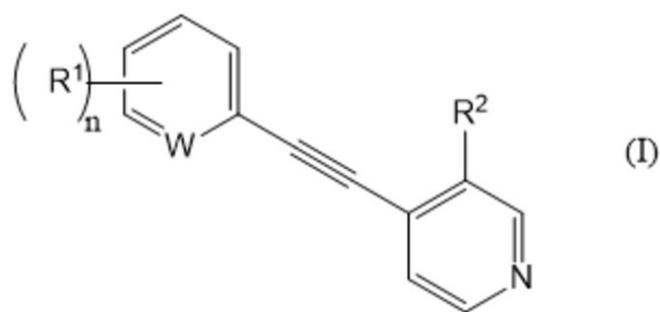
R^2 はハロゲン原子、アミノ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、
 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、 (C_1-C_6) ハロアルキ
 基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基、
 (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_2-C_6) アルケニルチオ基、 (C_2-C_6) アルキニルチオ基、 (C_1-C_6)
 アルキルアミノ基、 (C_2-C_6) アルケニルアミノ基、 (C_2-C_6) アルキニルアミノ基、ジ (C_1-C_6)
)アルキルアミノ基、ジ (C_2-C_6) アルケニルアミノ基、ジ (C_2-C_6) アルキニルアミノ基、 $(C_1$
 $-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 (C_2-C_6) アルケニルスルフィニル基、 (C_2-C_6) アルキニルス
 ルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_2-C_6) アルケニルスルホニル基、 (C_2-C_6)
)アルキニルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルオキシ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキ
 チオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキルアミノ (C_1-C_6) アルキル基、ジ (C_1-C_6) アルキ
 ルアミノ (C_1-C_6) アルキル基、ヒドロキシル (C_1-C_6) アルキル基、ホルミル基、カルボキシ
 基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキカルボニル基、 (C_1-C_6) アルキ
 ルアミノカルボニル基、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニ
 ルオキシ基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニルアミノ基又
 はジ (C_1-C_6) アルキルカルボニルアミノ基であり；WはCH又は窒素原子であり；nは1
 ~4の整数であり；nが2以上のとき、複数のR¹は同一又は異なっていてもよい]で表
 される化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤又は殺ダニ剤。

【請求項2】

一般式 (T) :

放逐

【化 1】



(式(I)中、

R¹はハロゲン原子、アミノ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₆)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₂-C₆)アルケニルチオ基、(C₂-C₆)アルキニルチオ基、(C₃-C₆)シクロアルキルチオ基、(C₁-C₆)ハロアルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルアミノ基、(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基、(C₃-C₆)シクロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)ハロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基、カルボキシル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカル

ボニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基又は(C₁-C₆)アルキルカルボニル(C₁-C₆)アルキルアミノ基であり；

R²はハロゲン原子、ヒドロキシリ基、メルカプト基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₂-C₆)アルケニルチオ基、(C₂-C₆)アルキニルチオ基、(C₁-C₆)アルキルアミノ基、(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルオキシ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルキルチオ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルキルアミノ(C₁-C₆)アルキル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ(C₁-C₆)アルキル基、ヒドロキシリ(C₁-C₆)アルキル基、カルボキシリ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルチオ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基又はジ(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基であり；WはCH又は窒素原子であり；nは1～4の整数であり；nが2以上のとき、複数のR¹は同一又は異なつっていてもよく；R²が(C₁-C₆)アルキル基のとき、R¹の置換位置はオルト位ではない]で表される化合物又はその塩。

【請求項3】

請求項1に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺動物寄生生物剤。

【請求項4】

請求項1に記載の化合物又はその塩の有効量を施用して害虫又はダニを防除する方法(但し、人間を治療する方法を除く)。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な4-(アリ-ルエチニル)ピリジン系化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

【背景技術】

【0002】

特許文献1には、特定の4-(アリール)ピリジン誘導体が農園芸用殺虫剤として有用であることが記載され、特許文献2には、特定のピリジン化合物が有害生物に対して防除効力を有することが記載され、特許文献3には、殺虫、殺ダニ作用を有するピリジン誘導体及びその塩が記載されている。しかしながら、特許文献1、2及び3には、本発明化合物については何ら記載されていない。特許文献4には、肝炎ウイルスの治療剤に係るピロロピリジン化合物に関し、該化合物の合成スキーム中に、一定の4-(アリールエチニル)ピリジン誘導体が開示されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】国際公開第2010/064711号

【特許文献2】国際公開第2012/008526号

【特許文献3】特開平1-316359

【特許文献4】国際公開第2010/115901号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分である、害虫等が抵抗性を獲得しその使用が制限されるなど、種々の課題を有するものが少なくない。

10

20

30

40

50

従って、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤の開発が望まれている。本発明の目的は、有害生物に対して高活性な化合物を提供すること、該化合物を用いた有害生物防除剤を提供すること、該化合物を施用して有害生物を防除する方法を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明者らは、より優れた有害生物防除剤を見出すべく、ピリジン誘導体につき種々検討した。その結果、新規な4-(アリ-ルエチニル)ピリジン系化合物が、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有することを見出し、本発明を完成した。

【0006】

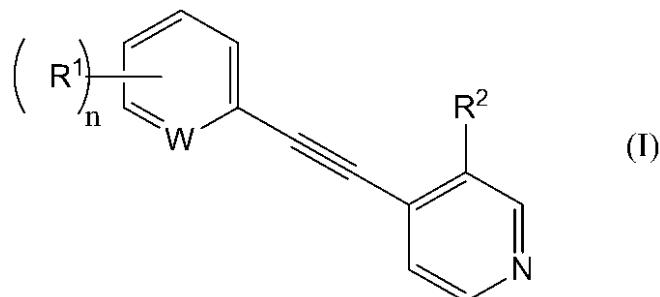
即ち本発明は、下記(1)～(8)を要旨とするものである。

10

(1) 一般式(I)：

【0007】

【化1】



20

[式(I)中、R¹はハロゲン原子、アミノ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₆)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₂-C₆)アルケニルチオ基、(C₂-C₆)アルキニルチオ基、(C₃-C₆)シクロアルキルチオ基、(C₁-C₆)ハロアルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルアミノ基、(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基、(C₃-C₆)シクロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)ハロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基、カルボキシル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基又は(C₁-C₆)アルキルカルボニル(C₁-C₆)アルキルアミノ基であり；R²はハロゲン原子、アミノ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₂-C₆)アルケニルチオ基、(C₂-C₆)アルキニルチオ基、(C₁-C₆)アルキルアミノ基、(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルオキシ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルキルチオ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルキルアミノ(C₁-C₆)アルキル基、ヒドロキシル(C₁-C₆)アルキル基、ホルミル基、カルボキシル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルチオ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基又はジ(C₁-C₆)アルキルカルボニル

40

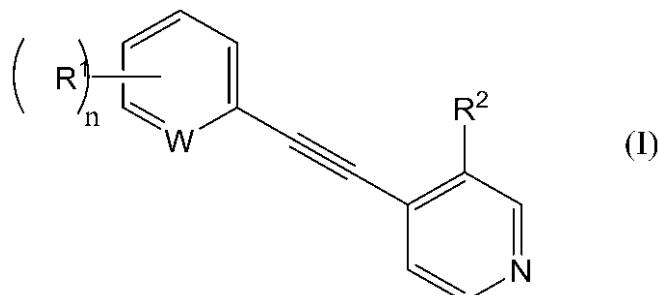
50

アミノ基であり；WはC H又は窒素原子であり；nは1～4の整数であり；nが2以上のとき、複数のR¹は同一又は異なっていてもよい]で表される化合物又はその塩、

(2) 一般式(I)：

【0008】

【化2】



10

[式(I)中、

R¹はハロゲン原子、アミノ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₃-C₆)シクロアルキル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₃-C₆)シクロアルコキシ基、(C₁-C₆)ハロアルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₂-C₆)アルケニルチオ基、(C₂-C₆)アルキニルチオ基、(C₃-C₆)シクロアルキルチオ基、(C₁-C₆)ハロアルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルアミノ基、(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基、(C₃-C₆)シクロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)ハロアルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基、カルボキシル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基又は(C₁-C₆)アルキルカルボニル(C₁-C₆)アルキルアミノ基であり；

R²はハロゲン原子、ヒドロキシル基、メルカプト基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₂-C₆)アルケニルオキシ基、(C₂-C₆)アルキニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₂-C₆)アルケニルチオ基、(C₂-C₆)アルキニルチオ基、(C₁-C₆)アルキルアミノ基、(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルケニルアミノ基、ジ(C₂-C₆)アルキニルアミノ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基、(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₂-C₆)アルコキカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルチオ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基又はジ(C₁-C₆)アルキルカルボニルアミノ基であり；WはC H又は窒素原子であり；nは1～4の整数であり；nが2以上のとき、複数のR¹は同一又は異なっていてもよく；R²が(C₁-C₆)アルキル基のとき、R¹の置換位置はオルト位ではない]で表される(1)の化合物又はその塩。

(3)(1)に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤、

(4)(1)に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤、

(5)(1)に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺

20

30

40

50

線虫剤又は殺土壌害虫剤、

(6)(1)に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤又は殺ダニ剤、
(7)(1)に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺動物寄生生物剤、
(8)(1)に記載の化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

【発明の効果】

【0009】

前記一般式(I)の化合物又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤は、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有する。

【発明を実施するための形態】

【0010】

前記一般式(I)中のハロゲン原子又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲン原子の数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、各ハロゲン原子は同一でも相異なってもよい。また、ハロゲン原子の置換位置は何れの位置でもよい。

【0011】

前記一般式(I)中のアルキル又はアルキル部分としては、例えば、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ノルマルブチル、イソブチル、セカンダリーブチル、ターシャリーブチル、ノルマルペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ノルマルヘキシル、ネオヘキシルのような直鎖又は分岐鎖状のC₁~C₆の基が挙げられる。

本明細書中、「ターシャリー」を「tert-」と表記する場合がある。

【0012】

前記一般式(I)中のアルケニル又はアルケニル部分としては、例えば、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、イソプロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、2-メチル-2-ブテニル、1-ヘキセニル、2,3-ジメチル-2-ブテニルのような直鎖又は分岐鎖状のC₂~C₆の基が挙げられる。

【0013】

前記一般式(I)中のアルキニル又はアルキニル部分としては、例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブロピニル、2-メチル-3-ブチニル、3,3-ジメチル-1-ブチニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニルのような直鎖又は分岐鎖状のC₂~C₆の基が挙げられる。

【0014】

前記一般式(I)中のシクロアルキル又はシクロアルキル部分としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルのようなC₃~C₆の基が挙げられる。

【0015】

前記一般式(I)の化合物の塩としては、当該技術分野で許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば、ジメチルアンモニウム塩、トリエチルアンモニウム塩のようなアンモニウム塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

【0016】

前記一般式(I)の化合物又はその塩には、光学異性体のような異性体が存在する場合があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。本願明細書においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、前記一般式(I)とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内で

10

20

30

40

50

あることは明らかである。

【0017】

前記一般式(Ⅰ)の化合物又はその塩(以下、本発明化合物と略す)は、以下の製造方法、並びに通常の塩の製造方法に従って製造することができるが、これらの方に限定されるものではない。

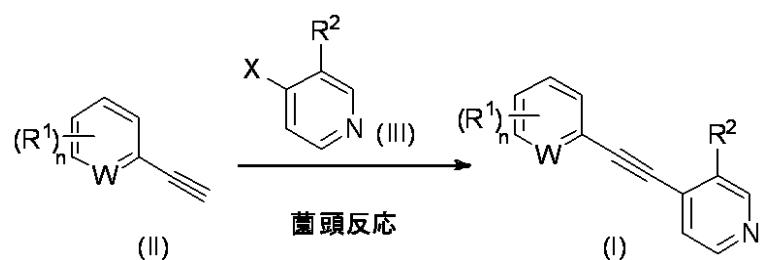
【0018】

製法[1]

本発明化合物は、式(Ⅱ)の化合物と式(Ⅲ)の化合物を、パラジウム触媒、銅塩及び塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

【0019】

【化3】



【0020】

(製法[1]中、Xはハロゲン原子であり、n、R¹、R²及びWは前述のとおりである。)

パラジウム触媒としては、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリドなどが挙げられる。

銅塩としてはヨウ化銅(I)が挙げられる。

塩基としては、有機塩基でも無機塩基でもいずれのものでもよい。有機塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルアミンのようなアミン塩基などが挙げられる。無機塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばアミン塩基；N,N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリルのような非プロトン性極性溶媒；テトラヒドロフランのようなエーテル類；などから1種又は2種以上を選択することができる。

反応温度は、通常約20℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～24時間で行うことができる。

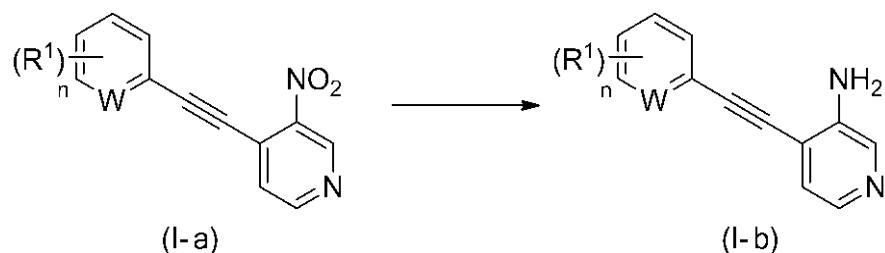
【0021】

製法[2]

前記一般式(Ⅰ)中、R²がNH₂である式(Ⅰ-a)の化合物は、R²がNO₂である式(Ⅰ-b)の化合物を金属及び酸を用いて還元することにより、或いはそれに準じる反応により製造することができる。

【0022】

【化4】



【0023】

10

20

30

40

50

(製法 [2] 中、 n 、 R^{-1} 及び W は前述のとおりである。)

金属としては、例えば鉄、亜鉛、スズなどが挙げられる。

酸としては、例えば塩酸、硫酸のような無機酸；酢酸のような有機酸；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1，4-ジオキサンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約20℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～24時間で行うことができる。

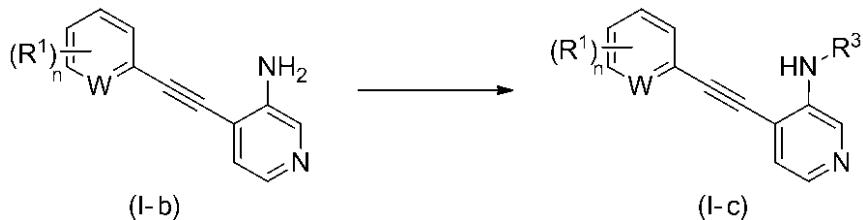
【 0 0 2 4 】

製法〔3〕

前記一般式(Ⅰ)中、 R^2 がNHR³である式(Ⅰ-c)の化合物は、式(Ⅰ-b)の化合物とR³Xとを塩基の存在下反応させることで製造することができる。

【 0 0 2 5 】

【化 5 】



【 0 0 2 6 】

(製法〔3〕中、R³は(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基又は(C₂-C₆)アルキニル基を示す。n、R¹、W及びXは前述のとおりである。)

塩基としては、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1，4-ジオキサンのようなエーテル類；N，N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約20℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

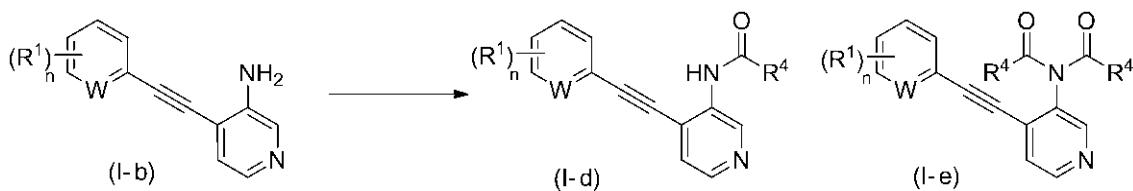
【 0 0 2 7 】

製法〔4〕

前記一般式(I)において、R²がNHCOR⁴である式(I-d)の化合物及びR²がN(COR⁴)₂である式(I-e)の化合物は、式(I-b)の化合物とカルボン酸ハロゲン化物R⁴COXまたはカルボン酸無水物(R⁴CO)₂Oとを反応させることで製造することができる。

【 0 0 2 8 】

【化 6】



〔 0 0 2 9 〕

(製法〔4〕中、R⁴は(C₁-C₆)アルキル基を示す。n、R¹、W及びXは前述のとおりである。)

該反応は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化ナトリウムのようなアルカリ金属水酸化物；トリエチルアミンのようなアミン類；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサンのようなエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジクロロメタン、クロロホルムのような脂肪族ハロゲン化炭化水素；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。
10

反応温度は、通常約-20℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

【0030】

製法〔5〕

前記一般式(I)中、R²がSR³である式(I-f)の化合物は、式(I-b)の化合物と、無機亜硝酸塩又は亜硝酸エステルとを反応させてジアゾニウム化合物とした後、R³SH又は(R³S)₂と反応させることにより、製造することができる。

20

【0031】

【化7】



30

【0032】

(製法〔5〕中、n、R¹、R³及びWは前述のとおりである。)

無機亜硝酸塩としては、例えば亜硝酸ナトリウム、亜硝酸カリウムなどが挙げられる。

亜硝酸エステルとしては、例えば亜硝酸ターシャリーブチル、亜硝酸イソアミルなどが挙げられる。

該反応は、必要に応じて銅触媒の存在下で行うことができる。銅触媒としては、酸化銅(I)、硫酸銅(II)五水和物などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて酸の存在下で行うことができる。酸としては、塩酸、硫酸のような無機酸；酢酸、メタンスルホン酸のような有機酸；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；などが挙げられる。
40

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルムのような脂肪族ハロゲン化炭化水素類；トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。

反応温度は通常-20℃～200℃の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～24時間で行うことができる。

50

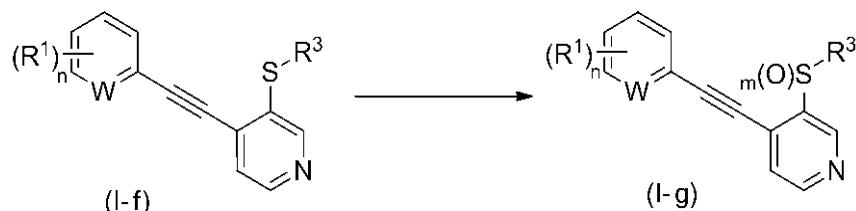
【0033】

製法〔6〕

式(I-g)の化合物は、式(I-f)の化合物と酸化剤とを反応させることにより製造することができる。

【0034】

【化8】



【0035】

(製法〔6〕中、mは1又は2であり、n、R¹、R³及びWは前述のとおりである。)

酸化剤としては、例えば3-クロロ過安息香酸のようなカルボン酸の過酸化物；過酸化水素水；などが挙げられる。

溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルムのような脂肪族ハロゲン化炭化水素などが挙げられる。

反応温度は、通常約-20から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～24時間で行うことができる。

【0036】

製法〔7〕

前記一般式(I)中、R²がXである式(I-h)の化合物は、式(I-b)の化合物を、無機亜硝酸塩もしくは亜硝酸エステルとの反応にてジアゾニウム塩とした後、ハロゲン化剤と反応させることにより、製造することができる。

【0037】

【化9】



【0038】

(製法〔7〕中、n、R¹、W及びXは前述のとおりである。)

無機亜硝酸塩及び亜硝酸エステルとしては、前記製法〔5〕と同様のものが挙げられる。

ハロゲン化剤としては、例えば塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン；塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸等のハロゲン化水素酸；塩化銅(I)、臭化銅(I)、ヨウ化銅(I)等のハロゲン化銅(I)； 塩化銅(II)、臭化銅(II)等のハロゲン化銅(II)；テトラフルオロホウ酸；などが挙げられる。

該反応は必要に応じて銅触媒の存在下で行うことができる。銅触媒としては、前記したハロゲン化銅(I)、ハロゲン化銅(II)、酸化銅(I)、硫酸銅(II)五水和物などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて酸の存在下で行うことができる。酸としては、前記に挙げたハロゲン化水素酸、硫酸等の無機酸；酢酸、メタンスルホン酸等の有機酸；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、前記製法〔5〕と同様のものが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

10

20

30

40

50

反応温度は通常 - 20 ~ 200 の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 24 時間で行うことができる。

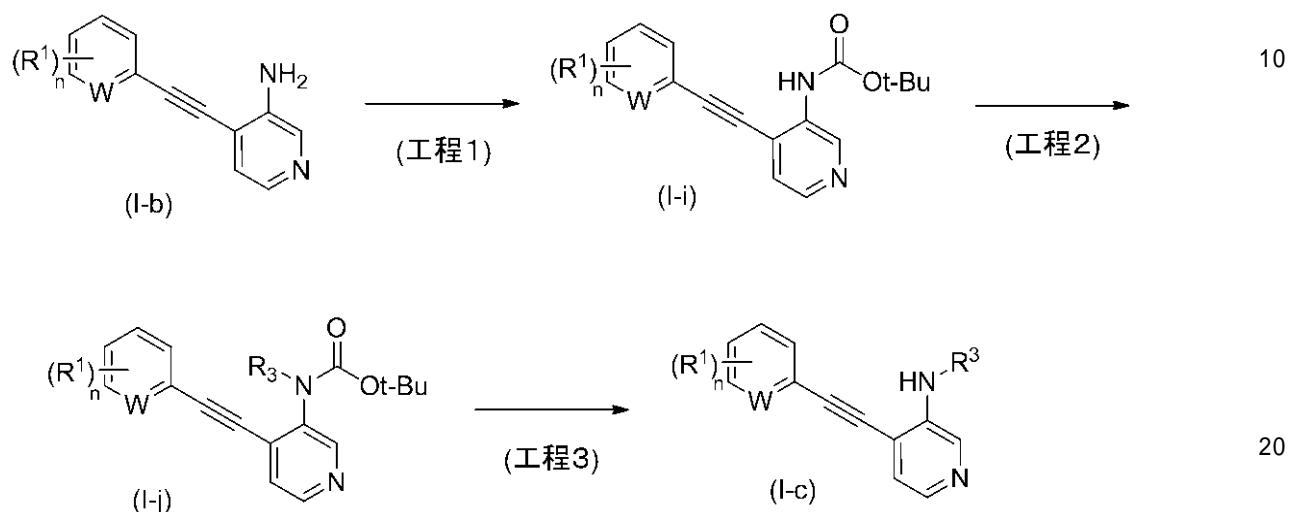
【0039】

製法 [8]

前記一般式 (I) 中、R² がNHR³ である式 (I-c) の化合物は、下記のスキームに示される方法にて製造することができる。

【0040】

【化10】



【0041】

(製法 [8] 中、t-Buはターシャリーブチルを示す。n、R¹、R³ 及びWは前述のとおりである。)

(工程 1)

式 (I-i) の化合物は、式 (I-b) の化合物と二炭酸ジターシャリー - ブチルを塩基の存在下反応させることで製造できる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミドのようなアルカリ金属アミド；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば前記製法 [3] と同様のものが挙げられ、これらの 1 種又は 2 種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約 - 20 から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 48 時間で行うことができる。

(工程 2)

式 (I-j) の化合物は、式 (I-i) の化合物と R³X (Xは前述のとおりである。) とを塩基の存在下反応させることで製造することができる。

塩基としては、前記製法 [3] と同様のものが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、工程 1 と同様のものが挙げられ、これらの 1 種又は 2 種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約 - 20 から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 48 時間で行うことができる。

(工程 3)

式 (I-c) の化合物は、式 (I-j) の化合物と酸とを反応させることで製造することができる。

10

20

30

40

50

酸としては、例えば塩酸、硫酸等の無機酸、酢酸等の有機酸が挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば前記製法〔2〕と同様のものが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～24時間で行うことができる。

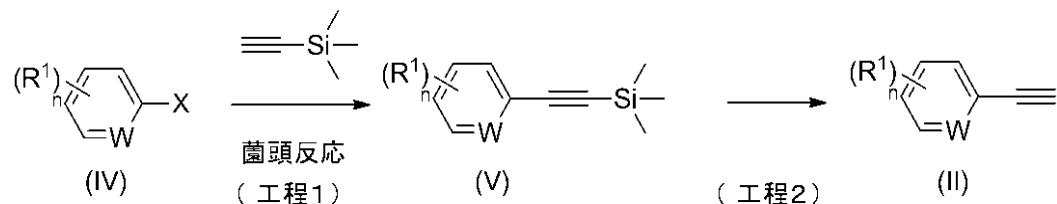
【0042】

中間体製法〔1〕

式(II)の化合物は下記のスキームに示される方法にて製造することができる。

【0043】

【化11】



【0044】

(中間体製法〔1〕中、n、X、W及びR¹は前述のとおりである。)

(工程1)

式(V)の化合物は、式(IV)の化合物とトリメチルシリルアセチレンとの菌頭反応(前記製法〔1〕に準ずる)にて製造することができる。

(工程2)

式(II)の化合物は、式(V)の化合物と塩基又はテトラブチルアンモニウムフルオリド(TBAF)とを反応させることにより製造することができる。

塩基としては、例えば炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化ナトリウムのようなアルカリ金属水酸化物；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばアセトン、アセトニトリルのような非プロトン性極性溶媒；ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタンのような脂肪族ハロゲン化炭化水素；酢酸エチルのようなエステル類；テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；メタノールなどのプロトン性溶媒；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常-90℃～50℃の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～24時間で行うことができる。

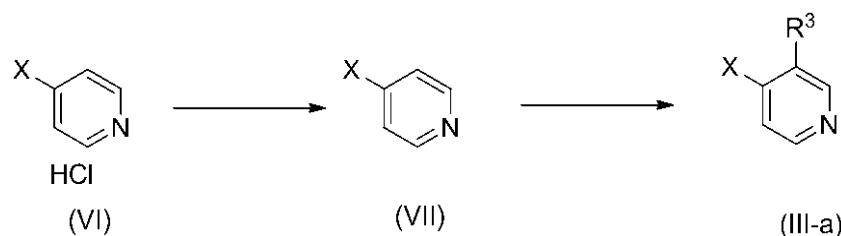
【0045】

中間体製法〔2〕

式(III-a)の化合物は、式(VI)の化合物と塩基とを反応させて式(VII)で表される4-ハロピリジンを生成した後、4-ハロピリジンとアルキルリチウム又はリチウムジアルキルアミドとを反応させた後に生成する中間体とR³Xとを反応させることにより製造することができる。

【0046】

【化12】



10

20

30

40

50

(0 0 4 7)

(中間体製法〔2〕中、X 及び R³ は前述のとおりである。)

塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；などが挙げられる。

アルキルリチウムとしては、例えばノルマルブチルリチウム、セカンダリーブチルリチウム、ターシャリーブチルリチウムなどが挙げられる。

リチウムジアルキルアミドとしては、例えばリチウムジイソプロピルアミドなどが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては反応に不活性な溶媒であればいすれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1，4-ジオキサンのようなエーテル類；トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができます。

反応温度は通常 -90 ~ -50 の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分~24時間で行うことができる。

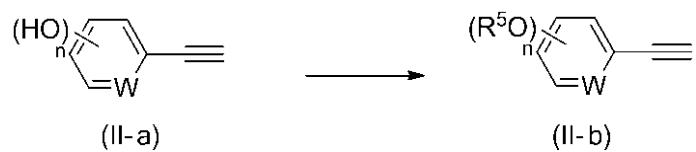
〔 0 0 4 8 〕

中間体製法〔3〕

式(II)中、R¹がOR⁵である式(II-b)の化合物は、式(II-a)の化合物とR⁵Xとを塩基の存在下反応させることで製造することができる。

[0 0 4 9]

【化 1 3】



【 0 0 5 0 】

(中間体製法〔3〕中、R⁵は(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、(C₁-C₆)ハロアルキル基又は(C₃-C₆)シクロアルキル基を示す。n、W及びXは前述のとおりである。)

塩基としては、例えば、前記製法〔3〕と同様のものなどが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、前記製法〔3〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約20℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

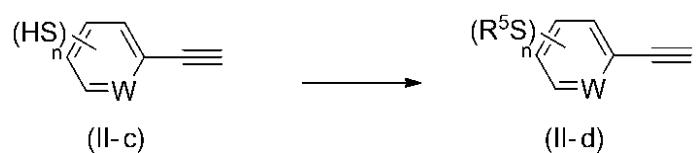
[0 0 5 1]

中間体製法〔4〕

式(II)中、R¹がSR⁵である式(II-d)の化合物は、式(II-c)の化合物とR⁵Xとを塩基の存在下反応させることで製造することができる。

[0 0 5 2]

【化 1 4】



【 0 0 5 3 】

(中間体製法 [4] 中、n、R⁵、W及びXは前述のとおりである。)

塩基としては、例えば、前記製法〔3〕と同様のものなどが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、前記製法〔3〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約20℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

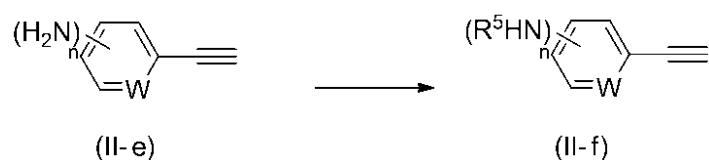
[0 0 5 4]

中間体製法〔5〕

式(II)中、R¹がNHR⁵である式(II-f)の化合物は、式(II-e)の化合物とR⁵Xとを塩基の存在下反応させることで製造することができる。

[0 0 5 5]

【化 1 5】



〔 0 0 5 6 〕

(中間体製法〔5〕中、n、R⁵、W及びXは前述のとおりである。)

塩基としては、例えば、前記製法〔3〕と同様のものなどが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、前記製法〔3〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約20℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

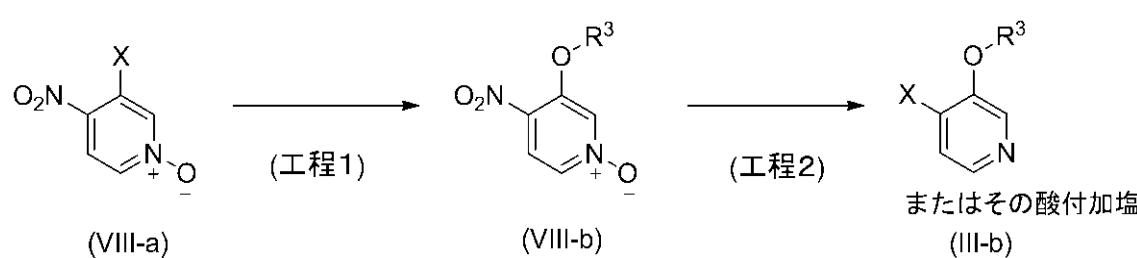
[0 0 5 7]

中間体製法〔6〕

前記一般式(III)中、R²がOR³である式(III-b)の化合物は、WO2005/101989等に記載の方法に従って製造できる式(IV-a)の化合物から下記のスキームに示される方法にて製造することができる。また、式(III-b)における化合物は酸を用い処理することによって、その酸付加塩として取り出すこともできる。

○ [0 0 5 8]

【化 1 6 】



【 0 0 5 9 】

(中間体製法〔6〕中、X及びR³は前述のとおりである。)

(工程 1)

式 (VII-*b*) の化合物は式 (VII-*a*) の化合物に R^3OM (M は Na , K , Cs である。) 又は、塩基存在下 R^3OH を反応させることにより製造できる。塩基としては、例えば前記製法 [3] と同様のものが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、2-プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒド

ロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約 - 20 ℃ から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 48 時間で行うことができる。

(工程2)

式(III-b)の化合物は、式(VIII-b)に三ハロゲン化リンを作用させることにより製造できる。また得られた式(III-b)の化合物を酸にて処理することにより、塩として製造することもできる。

三ハロゲン化リンとしては、例えば三塩化リン、三臭化リンなどが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、例えば酢酸エチル等のエステル類、ジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約 -5℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

式(III-b)の化合物における酸付加塩としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、酢酸塩などが挙げられ、処理する酸としては、例えば塩化水素、硫酸、酢酸等が挙げられる。

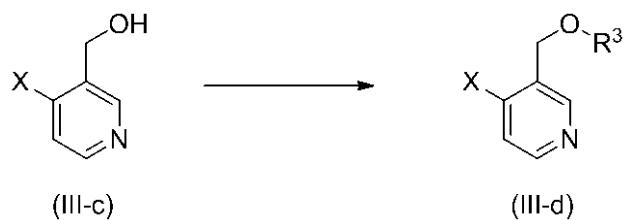
【 0 0 6 0 】

中間体製法〔7〕

式(I)中、R²がCH₂OR³である式(III-d)の化合物は、Org. Lett., 2008, 10, 2701等に記載の方法に従って製造できる式(III-c)の化合物とR³Xとを塩基の存在下反応させることで製造することができる。

【 0 0 6 1 】

【化 1 7】



【 0 0 6 2 】

(中間体製法〔7〕中、X及びR³は前述のとおりである。)

塩基としては、前記製法〔3〕と同様のものが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば前記製法〔3〕と同様のものが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約 - 20 ℃ から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 48 時間で行うことができる。

【 0 0 6 3 】

本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば農園芸分野で問題となる害虫、ダニ、線虫又は土壤害虫の防除剤、即ち農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤として有用である。また、動物寄生生物の防除剤、即ち殺動物寄生生物剤として有用である。

【 0 0 6 4 】

本発明化合物は、農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤として有用であるが、具体的には、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ等のようなアブラムシ類；コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリンガ、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、チャノコカクモンハマキ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、ウンカ類、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、

アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、タマナヤガ、カブラヤガ、アリ類等のような農業害虫類；ナメクジ、マイマイ等のような腹足類；イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカ等のような衛生害虫類；バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類等のような貯穀害虫類；イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類等のような衣類、家屋害虫類；等の害虫、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リングハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダニ等のような植物寄生性ダニ類；ケナガコナダニ、コナヒヨウダニ、ミナミツメダニ等のような屋内塵性ダニ類；等のダニ、ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシンガレセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウ等のような植物寄生性線虫類；等の線虫、ダンゴムシ、ワラジムシのような等脚類；等の土壤害虫の防除に有効である。本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤は、植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類等の防除に特に有効である。
その中でも、植物寄生性ダニ類、農業害虫類の防除にさらに優れた効果を示すため、殺虫剤又は殺ダニ剤として非常に有用である。また、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤、ネオニコチノイド剤等の薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有効である。さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤を土壤に処理することによって土壤有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹足類、等脚類の防除と同時に茎葉部の害虫類をも防除することができる。

10

20

【0065】

本発明化合物を含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤の別の望ましい態様としては、前記した植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類、腹足類、土壤害虫類等を総合的に防除する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤が挙げられる。

【0066】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤は、通常、該化合物と各種農業上の補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、顆粒水溶剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤等の種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリノン、ベントナイト、カオリナイト、セリサイト、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉等の固型担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコール等の溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸塩ホルムアルデヒド縮合物のような陰イオン系の界面活性剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキ

30

40

50

シエチレンスチリルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤；オリーブ油、カポック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィン等の植物油や鉱物油；等が挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤、等通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は0.001：99.999～95：5、望ましくは0.005：99.995～90：10である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油等）を添加して使用することができる。10

【0067】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤の施用は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況等の相違により一概に規定できないが、一般に0.05～800,000ppm、望ましくは0.5～500,000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1ヘクタール当たり本発明化合物が0.05～50,000g、望ましくは1～30,000gである。また、本発明には、このような施用方法による害虫、ダニ、線虫又は土壤害虫の防除方法、特に植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類の防除方法も含まれる。20

【0068】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤の種々の製剤、又はその希釈物の施用は、通常、一般に行なわれている施用方法すなわち、散布（例えば、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用等）、土壤施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）、浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫の発生及び生育を阻害することも可能である。また、いわゆる超高濃度少量散布法(*ultra low volume application method*)により施用することもできる。この方法においては、活性成分を100%含有することが可能である。30

【0069】

また、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤等と混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壤害虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤、等が挙げられる。特に、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用或は併用した殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壤害虫用組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者と一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壤害虫用組成物も含まれる。40

【0070】

上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壤害虫剤の有効成分化合物（一般名；一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会試験コード）としては、例えばプロフェノホス(*profenofos*)、ジクロルボス(*dichlorvos*)、フェナミホス(*fenamiphos*)、フェニトロチオン(*fenitrothion*)、EPN、ダイアジノン(*diazinon*)、クロルピリホス(*chlorpyrifos*)、クロルピリホスマチル(*chlorpyrifos methyl*)、アセフェート(50

acephate)、プロチオホス(prothiofos)、ホスチアゼート(fosthiazate)、カズサホス(cadusafos)、ジスルホトン(disulfoton)、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、エチオン(ethion)、エトリムホス(etrimfos)、キナルホス(quinaphos)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、スルプロホス(sulprofos)、チオメトン(thiometon)、バミドチオン(vamidothion)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、ピリミホスマチル(pirimiphos-methyl)、プロパホス(propaphos)、ホサロン(phosalone)、ホルモチオン(formothion)、マラチオン(malathion)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、シアノホス(cyanophos)、トリクロルホン(trichlorfon)、メチダチオン(methidathion)、フェントエート(phentoate)、E S P、アジンホスマチル(azinphos-methyl)、フェンチオン(fenthion)、ヘプテノホス(heptenophos)、メトキシクロル(methoxychlor)、パラチオン(parathion)、ホスホカルブ(phosphocarb)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、モノクロトホス(monocrotophos)、メタミドホス(methamidophos)、イミシアホス(imicyafos)、パラチオン-Methyl(parathion-methyl)、テルブホス(terbufos)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホスマット(phosmet)、ホレート(phorate)、ホキシム(phoxim)、トリアゾホス(triazophos)のような有機リン酸エステル系化合物；

カルバリル(carbaryl)、プロポキスル(propoxur)、アルジカルブ(aldicarb)、カルボフラン(carbofuran)、チオジカルブ(thiodicarb)、メソミル(methomyl)、オキサミル(oxamyl)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、ピリミカルブ(pirimicarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、カルボスルファン(carbosulfan)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メトルカルブ(metolcarb)、キシリルカルブ(xylylcarb)、XMC、フェノチオカルブ(fenothiocarb)のようなカーバメート系化合物；

カルタップ(cartap)、チオシクラム(thiocyclam)、ベンスルタップ(bensultap)、チオスルタップナトリウム(thiosultap-sodium)、チオスルタップジナトリウム(thiosultap-disodium)、モノスルタップ(monosultap)、ビスルタップ(bisultap)、シュウ酸水素チオシクラム(thiocyclam hydrogen oxalate)のようなネライストキシン誘導体；

ジコホル(dicofol)、テトラジホン(tetradifon)、エンドスルファン(endosulfan)、ジエノクロル(dienochlor)、ディルドリン(dieldrin)のような有機塩素系化合物；

酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、シヘキサチン(cyhexatin)のような有機金属系化合物；

フェンバレレート(fenvalerate)、ペルメトリン(permethrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、デルタメトリン(delta-methrin)、シハロトリル(cyhalothrin)、テフルトリル(tefluthrin)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、フルフェンプロックス(flufenprox)、シフルトリル(cyfluthrin)、フェンプロパトリル(fenpropathrin)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(fluvalinate)、シクロプロトリル(cycloprothrin)、ラムダシハロトリル(lambda-cyhalothrin)、ピレスリン(pyrethrins)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、テトラメスリン(tetramethrin)、レスメスリン(resmethrin)、プロトリフェンブト(protrifenbut)、ビフェントリン(beta-fenethrin)、ゼータシペルメトリン(zeta-cypermethrin)、アクリナトリル(acrinathrin)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、アレスリン(allethrin)、ガンマシハロトリル(gamma-cyhalothrin)、シータシペルメトリン(theta-cypermethrin)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、トラロメスリン(tralomethrin)、プロフルスリン(profluthrin)、ベータシペルメトリン(beta-cypermethrin)、ベータシフルトリル(beta-cyfluthrin)、メトフルトリル(metofluthrin)、フェノトリル(phenothrin)、フルメトリル(flumethrin)、デカメトリル(decamethrin)のようなピレスロイド系化合物；

10

20

30

40

50

ジフルベンズロン(diflubenzuron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、トリフルムロン(triflumuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフェヌロン(lufenuron)、ノバルロン(novaIuron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ビストリフルロン(bistrifluron)、フルアズロン(fluazuron)のようなベンゾイルウレア系化合物；

メトプレン(methoprene)、ピリプロキシフエン(pyriproxyfen)、フェノキシカルブ(fenoxy carb)、ジオフェノラン(diofenolan)のような幼若ホルモン様化合物；

ピリダベン(pyridaben)のようなピリダジノン系化合物；

フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フィプロニル(fipronil)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、エチプロール(ethiprole)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、アセトプロール(acetoprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)、ピリプロール(pyriproxyfen)のようなピラゾール系化合物；

イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、アセタミプリド(acetamiprid)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、クロチアニジン(clothianidin)、ニジノテフラン(nidinotefuran)、ジノテフラン(dinotefuran)、ニチアジン(nithiazine)のようなネオニコチノイド系化合物；

テブフェノジド(tebufenozide)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、クロマフェノジド(chromafenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)のようなヒドラジン系化合物；

ピリダリル(pyridaryl)、フロニカミド(flonicamid)のようなピリジン系化合物；

スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロメシフエン(spiromesifen)、スピロテトラマト(spirotetramat)のような環状ケトエノール系化合物；

フルアクリピリム(fluacrypyrim)のようなストロビルリン系化合物；

フルフェネリム(flufenerim)のようなピリジナミン系化合物；

ジニトロ系化合物、有機硫黄化合物、尿素系化合物、トリアジン系化合物、ヒドラゾン系化合物、また、その他の化合物として、フロメトキン(flometoquin)、ブプロフェジン(buprofezin)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、アミトラズ(amitraz)、クロルジメホルム(chlormeform)、シラフルオフェン(silafluofen)、トリアザメイト(triazamate)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、クロルフェナピル(chlorfenapyr)、インドキサカルブ(indoxacarb)、アセキノシル(acequincyl)、エトキサゾール(etoxazole)、シロマジン(cyromazine)、1,3-ジクロロプロペン(1,3-dichloropropene)、ジアフェンチウロン diafenthiuron)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、ビフェナゼート(bifenazate)、プロパルギット(propargite)、クロフェンテジン(clofentezine)、メタフルミゾン(metaflumizone)、フルベンジアミド(flu bendiamide)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)、シクラニリプロール(cyclaniliprole)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、フェナザキン(fenazaquin)、アミドフルメット(amidoflumet)、スルフルアミド(sulfluramid)、ヒドロメチルノン(hydramethylnon)、メタアルデヒド(metaldehyde)、HG-86、リアノジン(ryanodine)、ベルブチン(verbutin)、AKD 1022、クロロベンゾエート(chlorobenzoate)、チアゾリルシナノニトリル(thiazolylcinnanonitrile)、スルホキサフロル(sulfoxaflor)、フルエンスルホン(fluensulfone)、トリフルメゾピリム(triflumezopyrim)、アフィドピロペン(afidopyropen)、フルピラジフロン(flupyradifuron)、3-プロモ-N-(4-クロロ-2-(1-シクロプロピルエチルカルバモイル)-6-メチルフェニル)-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、3-プロモ-N-(2-プロモ-4-クロロ-6-(シクロプロピルメチルカルバモイル)フェニル)-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、3-プロモ-N-(4-クロロ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル)-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、3-プロモ-1-(3-

10

20

30

40

50

クロロピリジン-2-イル) - N - (4-シアノ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル) - 1H-ピラゾール-5-カルボキサミドのような化合物；等が挙げられる。更に、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*等の*Bacillus thuringiensis*が生成する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤等のような微生物農薬、アベルメクチン(avermectin)、エマメクチンベンゾエート(emamectin Benzoate)、ミルベメクチン(milbemectin)、ミルベマイシン(milbemycin)、スピノサド(spinosad)、イベルメクチン(ivermectin)、レピメクチン(lepimectin)、DE-175、アバメクチン(abamectin)、エマメクチン(emamectin)、スピネットラム(spinetoram)のような抗生物質及び半合成抗生物質；アザディラクチン(azadirachtin)、ロテノン(rotenone)のような天然物；ディート(deet)のような忌避剤；等と、混用、併用することもできる。
10

【0071】

上記他の農薬中の、殺菌剤の有効成分化合物(一般名；一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会試験コード)としては、例えば、メパニピリム(mepanipyrim)、ピリメサニル(pyrimethanil)、シプロジニル(cyprodinil)、フェリムゾン(ferimzone)のようなアニリノピリミジン系化合物；

5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジンのようなトリアゾロピリミジン系化合物；

フルアジナム(fluazinam)のようなピリジナミン系化合物；

トリアジメホン(triadimefon)、ビテルタノール(bitertanol)、トリフルミゾール(triflumizole)、エタコナゾール(etaconazole)、プロピコナゾール(propiconazole)、ペンコナゾール(penconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、マイクロブタニル(myclobutanil)、シプロコナゾール(cyproconazole)、テブコナゾール(tebuconazole)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、ファーコナゾールシス(furconazole cis)、プロクロラズ(prochloraz)、メトコナゾール(metconazole)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、テトラコナゾール(tetraconazole)、オキスピコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole fumarate)、シプロコナゾール(sipconazole)、プロチオコナゾール(prothioconazole)、トリアジメノール(triadimenol)、フルトリアホール(flutriafol)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、ブロムコナゾール(bromuconazole)、ジニコナゾール(diniconazole)、トリシクラゾール(tricyclazole)、プロベナゾール(probenazole)、シメコナゾール(simeconazole)、ペフラゾエート(pefurazoate)、イブコナゾール(ipconazole)、イミベンコナゾール(imibenconazole)のようなアゾール系化合物；

キノメチオネート(quinomethionate)のようなキノキサリン系化合物；

マンネブ(maneb)、ジネブ(zineb)、マンゼブ(mancozeb)、ポリカーバメート(poly carbamate)、メチラム(metiram)、プロピネブ(propineb)、チラム(thiram)のようなジチオカーバメート系化合物；

フサライト(fthalide)、クロロタロニル(chlorothalonil)、キントゼン(quintozenne)のような有機塩素系化合物；

ベノミル(benomyl)、シアゾファミド(cyazofamid)、チオファネートメチル(thiophanate methyl)、カーベンダジム(carbendazim)、チアベンダゾール(thiabendazole)、フベリアゾール(fuberiazole)のようなイミダゾール系化合物；

シモキサニル(cymoxanil)のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシリ(metalaxyl)、メタラキシリ-M(metalaxyl-M)、メフェノキサム(mefenoxam)、オキサジキシリ(oxadixyl)、オフレース(ofurace)、ベナラキシリ(benalaxy)、ベナラキシリ-M(benalaxy-M、別名キララキシリ(kiralaxy)、chiralaxy)、フララキシリ(furalaxy)、シプロフラム(cyprofuram)、カルボキシン(carboxin)、オキシカルボキシン(oxycarboxin)、チフルザミド(thifluzamide)、ボスカリド(boscalid)；

10

20

30

40

50

id)、ビキサafen(bixafen)、イソチアニル(isothianil)、チアジニル(tiadinil)、セダキサン(sedaxane)のようなアニリド系化合物；

ジクロフルアニド(dichlofluanid)のようなスルファミド系化合物；

水酸化第二銅(cupric hydroxide)、有機銅(oxine copper)のような銅系化合物；

ヒメキサゾール(hymexazol)のようなイソキサゾール系化合物；

ホセチルアルミニウム(fosetyl Al)、トルクロホスメチル(tolclofos Methyl)、S-O,O-ジイソプロピルホスホロチオエート、O-Eチル-S,S-ジフェニルホスホロジチオエート、アルミニウムエチルハイドロゲンホスホネート、エジフェンホス(edifenphos)、イプロベンホス(iprobenfos)のような有機リン系化合物；

キャプタン(captan)、キャプタホル(captafol)、フォルペット(folpet)のようなフタルイミド系化合物；

プロシミドン(procymidone)、イプロジオン(iprodione)、ビンクロゾリン(vinclozolin)のようなジカルボキシイミド系化合物；

フルトラニル(flutolanil)、メプロニル(mepronil)のようなベンズアニリド系化合物；

ベンチオピラド(penthiopyrad)、3-(ジフロロメチル)-1-メチル-N-[(1RS,4SR,9RS)-1,2,3,4-テトラヒドロ-9-イソプロピル-1,4-メタノナフタレン-5-イル]ピラゾール-4-カルボキサミドと3-(ジフロロメチル)-1-メチル-N-[(1RS,4SR,9SR)-1,2,3,4-テトラヒドロ-9-イソプロピル-1,4-メタノナフタレン-5-イル]ピラゾール-4-カルボキサミドの混合物(イソピラザム(isopyrazam))、シルチオファム(silthiopham)、フェノキサニル(fenoxanil)、フラメトピル(furametpyr)のようなアミド系化合物；

フルオピラム(fluopyram)、ゾキサミド(zoxamide)のようなベンズアミド系化合物；

トリホリン(triforine)のようなピペラジン系化合物；

ピリフェノックス(pyrifenoxy)のようなピリジン系化合物；

フェナリモル(fenarimol)のようなカルビノール系化合物；

フェンプロピディン(fenpropidin)のようなピペリジン系化合物；

フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、トリデモルフ(tridemorph)のようなモルフォリン系化合物；

フェンチンヒドロキシド(fentin hydroxide)、フェンチンアセテート(fentin acetate)のような有機スズ系化合物；

ペンシキュロン(pencycuron)のような尿素系化合物；

ジメトモルフ(dimethomorph)、フルモルフ(flumorph)のようなシンナミック酸系化合物；

ジエトフェンカルブ(diethofencarb)のようなフェニルカーバメート系化合物；

フルジオキソニル(fludioxonil)、フェンピクロニル(fenpiclonil)のようなシアノピロール系化合物；

アゾキシストロビン(azoxystrobin)、クレスオキシムメチル(kresoxim methyl)、メトミノストロビン(metominostrobin)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)、ピコキシストロビン(picoxystrobin)、オリザストロビン(oryzastrobin)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、フルオキサストロビン(fluoxastrobin)のようなストロビルリン系化合物；

ファモキサドン(famoxadone)のようなオキサゾリジノン系化合物；

エタボキサム(ethaboxam)のようなチアゾールカルボキサミド系化合物；

イプロバリカルブ(iprovalicarb)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル(benthiavalicarb-isopropyl)のようなバリンアミド系化合物；

メチルN-(イソプロポキシカルボニル)-L-バリル-(3RS)-3-(4-クロロフェニル)-アラニナート(valiphenalate)のようなアシリルアミノアシッド系化合物；

フェナミドン(fenamidone)のようなイミダゾリノン系化合物；

フェンヘキサミド(fenhexamid)のようなハイドロキシアニリド系化合物；

フルスルファミド(flusulfamide)のようなベンゼンスルホニアミド系化合物；

10

20

30

40

50

シフルフェナミド (cyflufenamid) のようなオキシムエーテル系化合物；
アトラキノン系化合物；
クロトン酸系化合物；
バリダマイシン (validamycin)、カスガマイシン (kasugamycin)、ポリオキシン (polyoxins) のような抗生物質；

イミノクタジン (iminoctadine)、ドディン (dodine) のようなグアニジン系化合物；
6-ターシャリーブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチルキノリン-4-イル アセテート (テブフルキン (tebufloquin)) のようなキノリン系化合物；
(Z)-2-(2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニルチオ)-2-(3-(2-メトキシフェニル)チアゾリジン-2-イリデン)アセトニトリル (フルチアニル (flutianil)) のようなチアゾリジン系化合物；

その他の化合物として、ピリベンカルブ (pyribencarb)、イソプロチオラン (isoprotiolane)、ピロキロン (pyroquilon)、ジクロメジン (diclomezine)、キノキシフェン (quinoxifen)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) クロルピクリン (chloropicrin)、ダゾメット (dazomet)、メタムナトリウム塩 (metam sodium)、ニコビフェン (nicobifen)、メトラフェノン (metrafenone)、UBF-307、ジクロシメット (diclocymet)、プロキンアジド (proquinazid)、アミスルブロム (amisulbrom; 別名アミブロドール (amibromdole))、3-(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルベンゾイル)-5-クロロ-2-メトキシ-4-メチルピリジン、4-(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルベンゾイル)-2,5-ジクロロ-3-トリフルオロメチルピリジン、ピリオフェノン (pyriofenone)、イソフェタミド (isofetamid) マンジプロパミド (mandipropamid)、フルオピコリド (fluopicolide)、カルプロパミド (carpropamid)、メブチルジノキヤップ (meptyldinocap)、N-[(3', 4'-ジクロロ-1,1-ジメチル)フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[(3', 4'-ジクロロ-1,1-ジメチル)フェナシル]-3-メチル-2-チオフェンカルボキサミド、N-[(3', 4'-ジクロロ-1,1-ジメチル)フェナシル]-1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-ピラゾールカルボキサミド、N-[[2'-メチル-4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[[2'-メチル-4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-ピラゾールカルボキサミド、N-[[4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-メチル-2-チオフェンカルボキサミド、N-[[2'-メチル-4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-ピラゾールカルボキサミド、N-[[4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-メチル-2-チオフェンカルボキサミド、N-[[4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-ピラゾールカルボキサミド、N-[[2'-メチル-4'-(2-ペンチルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[[4'-(2-ペンチルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、スピロキサミン (spiroxamine)、S-2188 (fenpyrazamine)、S-2200、ZF-9646、BCF-051、BCM-061、BCM-062等が挙げられる。

【0072】
その他、本発明化合物と混用或いは併用することが可能な農薬としては、例えは、The Pesticide Manual (第15版) に記載されているような除草剤の有効成分化合物、特に土壌処理型のもの等がある。

【0073】
殺動物寄生生物剤としては、具体的には、宿主動物の体表 (背、腋下、下腹部、内股部等) に寄生する有害な外部寄生虫や、宿主動物の体内 (胃、腸管、肺、心臓、肝臓、血管、皮下、リンパ組織など) に寄生する有害な内部寄生虫の防除に有効であるが、中でも、外部寄生虫の防除に有効である。

【0074】
外部寄生虫としては、例えば、動物寄生性のダニやノミ等が挙げられる。これらの種類は非常に多く、全てを列記することが困難であるので、その一例を挙げる。

【0075】

動物寄生性のダニとしては、例えばオウシマダニ (Boophilus microplus)、クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus)、フトゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis)、キチマダニ (Haemaphysalis flava)、ツリガネチマダニ (Haemaphysalis campanulata)、イスカチマダニ (Haemaphysalis concinna)、ヤマトチマダニ (Haemaphysalis japonica)、ヒゲナガチマダニ (Haemaphysalis kitaokai)、イヤスチマダニ (Haemaphysalis ias)、ヤマトマダニ (Ixodes ovatus)、タネガタマダニ (Ixodes nipponensis)、シュルツエマダニ (Ixodes persulcatus)、タカサゴキララマダニ (Amblyomma testudinarium)、オオトゲチマダニ (Haemaphysalis megaspinosa)、アミノカクマダニ (Dermacentor reticulatus)、タイワンカクマダニ (Dermacentor taiwanensis)のようなマダニ類；ワクモ (Dermanyssus gallinae)；トリサシダニ (Ornithonyssus sylviarum)、ミナミトリサシダニ (Ornithonyssus bursa)のようなトリサシダニ類；ナンヨウツツガムシ (Eutrombicula ichimanni)、アカツツガムシ (Leptotrombidium akamushi)、フトゲツツガムシ (Leptotrombidium pallidum)、フジツツガムシ (Leptotrombidium fuji)、トサツツガムシ (Leptotrombidium tosa)、ヨーロッパアキダニ (Neotrombicula autumnalis)、アメリカツツガムシ (Eutrombicula alfreddugesi)、ミヤガワタマツツガムシ (Helenicula miyagawai)のようなツツガムシ類；イヌツメダニ (Cheyletiella yasguri)、ウサギツメダニ (Cheyletiella parasitivorax)、ネコツメダニ (Cheyletiella blakei)のようなツメダニ類；ウサギキュウセンダニ (Psoroptes cuniculi)、ウシショクヒダニ (Chorioptes bovis)、イヌミミヒゼンダニ (Otodectes cynotis)、ヒゼンダニ (Sarcoptes scabiei)、ネコショウセンコウヒゼンダニ (Notoedres cati)のようなヒゼンダニ類；イヌニキビダニ (Demodex canis)のようなニキビダニ類等が挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する殺動物寄生生物剤は、マダニ類等の防除に特に有効である。

【0076】

動物寄生性のノミとしては、例えば、ノミ目 (Siphonaptera) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (Pulicidae)、ナガノミ科 (Ceratophyllidae) 等に属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、ヒトノミ (Pulex irritans)、ニワトリフトノミ (Echidnophaga gallinacea)、ケオブスネズミノミ (Xenopsylla cheopis)、メクラネズミノミ (Leptopsylla segnis)、ヨーロッパネズミノミ (Nosopsyllus fasciatus)、ヤマトネズミノミ (Monopsyllus anisus)；等が挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する殺動物寄生生物剤は、ヒトノミ科に属するノミ類、特にイヌノミ、ネコノミ等の防除に有効である。

【0077】

その他の外部寄生虫としては、例えば、ウシジラミ、ウマジラミ、ヒツジジラミ、ウシホソジラミ、アタマジラミのようなシラミ類；イヌハジラミのようなハジラミ類；ウシアブ、ウアイヌカカ、ツメトゲブユのような吸血性双翅目害虫等が挙げられる。また、内部寄生虫としては、例えば、肺虫、ベンチュウ、結節状ウォーム、胃内寄生虫、回虫、糸状虫類のような線虫類；マンソン裂頭条虫、広節裂頭条虫、瓜実条虫、多頭条虫、单包条虫、多包条虫のような条虫類；日本住血吸虫、肝蛭のような吸虫類；コクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、クリプトスピリジウムのような原生動物など；が挙げられる。

【0078】

宿主動物としては、種々の愛玩動物、家畜、家禽等が挙げられ、より具体的には、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ハムスター、モルモット、リス、ウサギ、フェレット、鳥（例えば、ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリアなど）、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、アヒル、ニワトリ、などが挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する殺動物寄生生物剤は、愛玩動物又は家畜に外部寄生する害虫又はダニの防除に有効である。愛玩動物又は家畜の中ではイヌ、ネコ、ウシ又はウマに特に有効である。

【0079】

本発明化合物を殺動物寄生生物剤として使用する際、そのまま使用してもよく、また、適当な補助剤と共に粉剤、粒剤、錠剤、散剤、カプセル剤、液状剤、乳剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤等の種々の形態に製剤して使用することもできる。尚、前記製剤形態以外にも、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、前記した農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤の製剤用補助剤として例示した陰イオン系の界面活性剤や非イオン系の界面活性剤；セチルトリメチルアンモニウムプロミドのような陽イオン系の界面活性剤；水、アセトン、アセトニトリル、N-メチルアセトアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、2-ピロリドン、N-メチル-2-ピロリドン、ケロシン、トリアセチン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンジルアルコール、エチレンギリコール、プロピレンギリコール、ポリエチレンギリコール、液体ポリオキシエチレンギリコール、ブチルジグリコール、エチレンギリコールモノメチルエーテル、エチレンギリコールモノエチルエーテル、ジエチレンギリコールモノエチルエーテル、ジエチレンギリコールノルマルブチルエーテル、ジプロピレンギリコールモノメチルエーテル、ジプロピレンギリコールノルマルブチルエーテルのような溶剤；ブチルヒドロキシアニソール、ブチルヒドロキシトルエン、アスコルビン酸、メタ亜硫酸水素ナトリウム、プロピル没食子酸塩、チオ硫酸ナトリウムのような酸化防止剤；ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、酢酸ビニルとビニルピロリドンのコポリマーのような被膜形成剤；前記した農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壤害虫剤の製剤用補助剤として例示した植物油や鉱物油；乳糖、蔗糖、ブドウ糖、澱粉、麦粉、コーン粉、大豆油粕、脱脂米糠、炭酸カルシウム、その他市販の飼料原料のような担体；等が挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選択して使用することもでき、更には、前記した農園芸分野で使用される各種補助剤等から適宜選択して使用することもできる。

【0080】

本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は、通常、0.1：99.9～90：10程度である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油等）を添加して使用することができる。

【0081】

宿主動物への本発明化合物の投与は、経口又は非経口によって行われる。経口投与法としては、例えば本発明化合物を含有する錠剤、液状剤、カプセル剤、ウエハース、ビスケット、ミンチ肉、その他の飼料等を投与する方法等が挙げられる。非経口投与方法としては、例えば本発明化合物を適当な製剤に調製した上で、静注投与、筋肉内投与、皮内投与、皮下投与等により体内に取り込ませる方法；スポットオン（spot-on）処理、ポワオン（pour-on）処理、スプレー処理等により体表面に投与する方法；宿主動物の皮下に本発明化合物を含有する樹脂片等を埋め込む方法等が挙げられる。

【0082】

宿主動物への本発明化合物の投与量は、投与方法、投与目的、疾病症状等によって異なるが、通常、宿主動物の体重1kgに対して0.01mg～100g、望ましくは0.1mg～10gの割合で投与するのが適当である。

【0083】

本発明には、前記したような投与方法又は投与量による動物寄生生物の防除方法、特に外部寄生虫又は内部寄生虫の防除方法も含まれる。

【0084】

また、本発明においては、前述のようにして有害な動物寄生生物を防除することにより、それらに起因する宿主動物の各種疾患を予防又は治療できる場合がある。このように、本発明には、本発明化合物を有効成分として含有する寄生虫起因動物疾患の予防剤又は治

10

20

30

40

50

療剤並びに、寄生虫起因動物疾患を予防又は治療する方法も含まれる。

【0085】

本発明化合物を殺動物寄生生物剤として使用する際、補助剤と共に各種ビタミン類、ミネラル類、アミノ酸類、栄養剤、酵素製剤、解熱剤、鎮静剤、消炎剤、殺菌剤、着色剤、芳香剤、保存剤等と混用又は併用することができる。また、必要に応じて他の各種動物薬や農薬、例えば駆虫剤、抗コクシジウム剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺ノミ剤、殺線虫剤、殺菌剤、抗菌剤等と混用又は併用することができ、この場合に一層優れた効果を示すこともある。本発明には、前記したような各種成分を混用又は併用した動物寄生生物防除用組成物が含まれ、また、それを使用した動物寄生生物の防除方法、特に外部寄生虫又は内部寄生虫の防除方法も含まれる。

10

【実施例】

【0086】

次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず、本発明化合物の合成例を記載する。

【0087】

合成例 1

4 - ((4 - (t e r t - ブチル) フェニル) エチニル) - 3 - ニトロピリジン (化合物 N o . 13) の合成

4 - クロロ - 3 - ニトロピリジン (5.0 g, 31.6 mmol) 、 4 - t e r t - ブチルフェニルアセチレン (5.0 g, 31.6 mmol) 、トリエチルアミン (1.3 mL, 93.3 mmol) 、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (I I) ジクロリド (1.1 g, 1.6 mmol) 、ヨウ化銅 (I) (0.3 g, 1.6 mmol) 、 N , N - ジメチルホルムアミド (60 mL) を窒素雰囲気下、室温で 15 時間攪拌した。反応溶液に水、酢酸エチルを加えた後、混合溶液をセライトろ過し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液 : n - ヘプタン / 酢酸エチル = 95 / 5 から 80 / 20 · 容量比) で精製し、目的物 (7.6 g, 収率 85%) を得た。

20

【0088】

合成例 2

3 - アリル - 4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル) エチニル) ピリジン (化合物 N o . 17) の合成

30

(1) 3 - アリル - 4 - プロモピリジンの合成

氷冷下、 4 - プロモピリジン塩酸塩 (5.0 g, 25.7 mmol) に、トルエン (25 mL) 、 3 M 水酸化ナトリウム水溶液 (15 mL) を加え 30 分間攪拌した。反応混合物を分液し、有機層に無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した後、無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた。得られた 4 - プロモピリジンのトルエン溶液にテトラヒドロフラン (50 mL) を加え、窒素雰囲気下、 - 78 に冷却し、 1 M リチウムジイソプロピルアミドのヘキサン・テトラヒドロフラン溶液 (25 mL) を滴下した後、同温度で 1 時間攪拌した。 - 78 にてヨウ化アリル (2.5 mL, 27.4 mmol) を滴下し、 3 時間かけて室温まで昇温した。反応混合物に飽和食塩水を加え分液し、有機層に無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液 : n - ヘプタン / 酢酸エチル = 90 / 10 · 容量比) で精製し、 3 - アリル - 4 - プロモピリジン (0.95 g, 収率 19%) を得た。

40

(2) 目的物の合成

3 - アリル - 4 - プロモピリジン (500 mg, 2.5 mmol) 、 4 - t e r t - ブチルフェニルアセチレン (400 mg, 2.5 mmol) 、ヨウ化銅 (I) (30 mg, 0.16 mmol) 、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (I I) ジクロリド (90 mg, 0.13 mmol) 、トリエチルアミン (1 mL, 7.2 mmol) 、 N , N - ジメチルホルムアミド (5 mL) を窒素雰囲気下、 90 で 5 時間反応した。室温まで放冷した後、反応溶液に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナト

50

リウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n - ヘプタン / 酢酸エチル = 90 / 10・容量比）で精製し、目的物（500 mg, 収率72%）を得た。

【0089】

合成例3

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン - 3 - アミン（化合物 No. 30）の合成

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) - 3 - ニトロピリジン（7.6 g, 27.0 mmol）と鉄（4.5 g, 81.0 mmol）を酢酸エチル（30 mL）、酢酸（15 mL）、水（15 mL）の混合溶液に加え、還流下、1時間反応した。反応溶液をセライトろ過した後、溶媒を減圧下留去し、残渣を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n - ヘプタン / 酢酸エチル = 30 / 70・容量比）で精製し、目的物（7.2 g, 収率100%）を得た。

【0090】

合成例4

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) - 3 - (メチルチオ) ピリジン（化合物 No. 26）の合成

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン - 3 - アミン（400 mg, 1.6 mmol）、ジメチルジスルフィド（301 mg, 3.2 mmol）をクロロホルム（3 mL）に溶解し、氷冷した。その溶液にクロロホルム（2 mL）に溶解した亜硝酸tert - ブチル（214 mg, 2.1 mmol）を滴下した。その後氷冷下10分間攪拌し、80まで昇温し1時間攪拌した。室温まで放冷した後、溶媒を減圧下留去し、残渣をフラッシュクロマトグラフィーで精製し、目的物（184 mg, 収率41%）を得た。

【0091】

合成例5

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) - N - プロピルピリジン - 3 - アミン（化合物 No. 32）の合成

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン - 3 - アミン（300 mg, 1.2 mmol）をN,N - デミチルホルムアミド（5 mL）に溶解し、氷冷した。その溶液に60%水素化ナトリウム（60 mg, 1.5 mmol）を加え、氷冷下20分間攪拌した。その後、1 - ヨウ化プロピル（300 mg, 1.8 mmol）を加え、80で5時間攪拌した。室温まで放冷した後、反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n - ヘプタン / 酢酸エチル = 70 / 30・容量比）で精製して、目的物（45 mg, 収率13%）を得た。

【0092】

合成例6

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) - 3 - (メチルスルフィニル) ピリジン（化合物 No. 37）及び4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) - 3 - (メチルスルホニル) ピリジン（化合物 No. 41）の合成

4 - ((4 - (tert - ブチル) フェニル) エチニル) - 3 - (メチルチオ) ピリジン（83 mg, 0.3 mmol）をクロロホルム（2 mL）に溶解し、氷冷した。3 - クロロ過安息香酸（100 mg, 0.6 mmol）を加え、氷冷下2時間攪拌した。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をフラッシュクロマトグラフィーで精製し、化合物37 No. (26 mg, 収率30%)、化合物No. 41 (31 mg, 収率33%)を得た。

【0093】

合成例7

10

20

30

40

50

N - (4 - ((4 - (t e r t - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン - 3 - イル) プロピオニアミド (化合物 N o . 5 9) 及び N - (4 - ((4 - (t e r t - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン - 3 - イル) - N - プロピオニルプロピオニアミド (化合物 N o . 6 0) の合成

4 - ((4 - (t e r t - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン - 3 - アミン (300 mg, 1.2 mmol) 、トリエチルアミン (1.0 mL, 7.2 mmol) を N , N - ジメチルホルムアミド (10 mL) に溶解し、氷冷した。その溶液に塩化プロピオニル (550 mg, 6.0 mmol) を滴下し、その後室温で 16 時間攪拌した。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液 : n - ヘプタン / 酢酸エチル = 80 / 20 から 60 / 40 · 容量比) で精製し、化合物 No. 5 9 (73 mg, 収率 20%) 、化合物 No. 6 0 (91 mg, 収率 20%) を得た。

【 0 0 9 4 】

合成例 8

1 - (4 - ((3 - アリルピリジン - 4 - イル) エチニル) フェニル) エタノン (化合物 N o . 9 2) の合成

(1) 1 - (4 - ((トリメチルシリル) エチニル) フェニル) エタノンの合成

4 - ヨードアセトフェノン (1.2 g, 4.9 mmol) 、トリメチルシリルアセチレン (1.0 g, 10 mmol) 、ヨウ化銅 (I) (50 mg, 0.26 mmol) 、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) ジクロリド (170 mg, 0.24 mmol) 、トリエチルアミン (2.0 mL, 14 mmol) 、 N , N - ジメチルホルムアミド (10 mL) を窒素雰囲気下、 80 °C で 16 時間反応した。室温まで放冷した後、反応溶液に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をフラッショクロマトグラフィーで精製し、 1 - (4 - ((トリメチルシリル) エチニル) フェニル) エタノン (0.91 g, 収率 84%) を得た。

(2) 1 - (4 - エチニルフェニル) エタノンの合成

1 - (4 - ((トリメチルシリル) エチニル) フェニル) エタノン (0.86 g, 4.0 mmol) 、炭酸カリウム (1.1 g, 8.0 mmol) 、メタノール (8 mL) を室温で 1 時間反応した。溶媒を減圧下留去した後、水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をフラッショクロマトグラフィーで精製し、 1 - (4 - エチニルフェニル) エタノン (0.53 g, 収率 91%) を得た。

(3) 目的物の合成

3 - アリル - 4 - プロモピリジン (200 mg, 1 mmol) 、 1 - (4 - エチニルフェニル) エタノン (160 mg, 1.1 mmol) 、ヨウ化銅 (I) (10 mg, 0.05 mmol) 、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) (60 mg, 0.05 mmol) 、トリエチルアミン (4 mL) 、 N , N - ジメチルホルムアミド (4 mL) を窒素雰囲気下、 50 °C で 24 時間反応した。室温まで放冷した後、水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をフラッショクロマトグラフィーで精製し、目的物 (90 mg, 収率 34%) を得た。

【 0 0 9 5 】

合成例 9

3 - プロモ - 4 - ((4 - (t e r t - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン (化合物 N o . 1 0) の合成

氷冷下、 4 - ((4 - (t e r t - ブチル) フェニル) エチニル) ピリジン - 3 - アミン (1.0 g, 3.99 mmol) とアセトニトリル (25 mL) の混合溶液に、亜硝酸ターシャリーブチル (0.61 g, 5.92 mmol) とアセトニトリル (5 mL) の混合溶液を滴下し、滴下後同温下 30 分間攪拌した。臭化銅 (II) (1.12 g, 5.01 mmol) を加えた後、室温まで昇温し、同温下 15 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチル (50 mL) 及び水 (50 mL) を加

10

20

30

40

50

え、不溶解物をセライトろ過にて除去した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去した。残渣をフラッショクロマトグラフィーで精製し、目的物(0.36 g, 収率29%)を得た。

【0096】

合成例10

4 - ((4 - (tert - ブチル)フェニル)エチニル) - 3 - メトキシピリジン(化合物No.21)の合成

(1) 3 - メトキシ - 4 - ニトロピリジン 1 - オキシドの合成

氷冷下、3 - フルオロ - 4 - ニトロピリジン 1 - オキシド(9.75 g, 61.7 mmol)とメタノール(145 mL)の混合懸濁液に、28%ナトリウムメトキシドメタノール溶液(11.9 g, 61.7 mmol)を加えた。室温まで昇温し、同温下1時間攪拌した。メタノールを減圧下留去し、残渣に水(50 mL)を加えクロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、3 - メトキシ - 4 - ニトロピリジン 1 - オキシド(9.54 g, 収率91%)を得た。

(2) 4 - ブロモ - 3 - メトキシピリジン塩酸塩の合成

室温下、3 - メトキシ - 4 - ニトロピリジン 1 - オキシド(9.54 g, 56.1 mmol)と酢酸エチル(100 mL)の混合懸濁液に、三臭化リン(45 mL, 477 mmol)を反応系内の温度が40°Cを超えない速度で滴下した。滴下後、同温下10分間攪拌した後、溶媒が還流する温度まで昇温し、同温下17時間攪拌した。室温まで放冷した後、反応混合物を氷水(500 mL)に注ぎ入れた。分液し、得られた水層を氷冷した。氷冷下、反応系内の温度が20°Cを超えない速度で水酸化ナトリウムを加え、反応系内をpH10以上に調製した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。残渣をフラッショクロマトグラフィーで精製し、4 - ブロモ - 3 - メトキシピリジンを得た。得られた4 - ブロモ - 3 - メトキシピリジンを酢酸エチル100 mLに溶かした溶液に、1.0 M塩化水素エーテル溶液(60 mL, 60 mmol)を加えた。溶媒を減圧により留去し、4 - ブロモ - 3 - メトキシピリジン塩酸塩(7.80 g, 収率62%)を得た。(3)目的物の合成

4 - ブロモ - 3 - メトキシピリジン塩酸塩(4.8 g, 21.4 mmol)、4 - tert - ブチルフェニルアセチレン(5.1 g, 32.1 mmol)、ヨウ化銅(I)(0.68 g, 3.2 mmol)、ビス(トリフェニルホスфин)パラジウム(II)ジクロリド(0.75 g, 1.1 mmol)、トリエチルアミン(12 mL, 85.5 mmol)N,N - デメチルホルムアミド(100 mL)を窒素雰囲気下、60°Cで15時間反応した。室温まで放冷した後、水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液:n - ヘプタン / 酢酸エチル = 67 / 33・容量比)で精製し、固体の目的物(3.2 g, 収率56%)を得た。

【0097】

合成例11

4 - ((4 - (tert - ブチル)フェニル)エチニル) - 3 - (メトキシメチル)ピリジン(化合物No.46)の合成

(1) 4 - ブロモ - 3 - (メトキシメチル)ピリジンの合成

氷冷下、(4 - ブロモピリジン - 3 - イル)メタノール(304 mg, 1.62 mmol)とテトラヒドロフラン(10 mL)の混合溶液に、60%水素化ナトリウム(434 mg, 10.9 mmol)を加えた。氷冷下、10分間攪拌した後、室温まで昇温し、同温下7時間攪拌した。氷冷した後、ヨウ化メチル(0.11 mL, 1.78 mmol)を加えた。室温まで昇温し、同温下7時間攪拌した。氷冷した後、水(20 mL)を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をフラッショクロマトグラフィーで精製し、4 - ブロモ - 3 -

10

20

30

40

50

- (メトキシメチル)ピリジン (275 mg, 収率84%)を得た。

(2) 目的物の合成

4 - プロモ - 3 - (メトキシメチル)ピリジン (275 mg, 1.36 mmol)、4 - t e r t - ブチルフェニルアセチレン (247 mg, 1.56 mmol)、トリエチルアミン (0.6 mL, 4.3 mmol)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド (48 mg, 0.07 mmol)、ヨウ化銅(I) (20 mg, 0.11 mmol)、N, N - ジメチルホルムアミド (4 mL) を窒素雰囲気下、80 で11時間反応した。室温まで放冷した後、水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: n - ヘプタン / 酢酸エチル = 85 / 15 · 容量比)で精製し、目的物 (219 mg, 収率58%)を得た。
10

【0098】

合成例 12

4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル) - N - エチルピリジン - 3 - アミンの合成(化合物No. 112)

(1) t e r t - ブチル(4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル)ピリジン - 3 - イル)カーバメートの合成

氷冷下、4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル)ピリジン - 3 - アミン (2.5 g, 10 mmol) に、テトラヒドロフラン (50 mL)、1.0 M のナトリウムビス(トリメチルシリル)アミドのテトラヒドロフラン溶液 (24 mL) を加え 10 分間攪拌した。反応液を室温まで昇温した後、同温度で 1 時間攪拌した。反応液を再度氷冷し、二炭酸ジターシャリーブチル (2.6 g, 11.9 mmol) を加え 15 分間攪拌した。反応液を室温まで昇温した後、同温度で 4 時間攪拌した。反応混合物を塩化アンモニウム水に加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: n - ヘプタン / 酢酸エチル = 90 / 10 · 容量比)で精製し、アモルファス状の t e r t - ブチル(4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル)ピリジン - 3 - イル)カーバメート (0.87 g, 収率25%)を得た。
20

(2) t e r t - ブチル(4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル)ピリジン - 3 - イル) (エチル)カーバメートの合成

t e r t - ブチル(4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル)ピリジン - 3 - イル)カーバメート (200 mg, 0.57 mmol) に、N, N - ジメチルホルムアミド (10 mL)、ヨウ化エチル (180 mg, 1.15 mmol)、60 % 水素化ナトリウム (48 mg, 1.2 mmol) を加え、室温で 2 時間 30 分攪拌した。反応混合物を水に加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: n - ヘプタン / 酢酸エチル = 95 / 5 · 容量比)で精製し、アモルファス状の t e r t - ブチル(4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル)ピリジン - 3 - イル) (エチル)カーバメート (190 mg, 収率88%)を得た。
30

(3) 目的物の合成

t e r t - ブチル(4 - ((4 - t e r t - ブチルフェニル)エチニル)ピリジン - 3 - イル) (エチル)カーバメート (130 mg, 0.34 mmol) に、酢酸エチル (5 mL)、10 % 塩酸 (5 mL) を加え、60 で 1 時間攪拌した。反応液を室温まで放冷した後、水酸化ナトリウム水溶液を加え中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で除いた後、減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: n - ヘプタン / 酢酸エチル = 85 / 15 · 容量比)で精製して固体の目的物 (73 mg, 収率77%)を得た。
40

【0099】

次に、本発明に係る化合物の代表例を第1表に挙げる。これらの化合物は、前記合成例或いは前記した種々の製造方法に基づいて合成することができる。第1表中、物性欄に記

載の数値は融点()を示し、NMRと記載されている化合物はそれらの¹H-NMRスペクトルデータを第2表及び第3表に挙げる。尚、第1表、第2表及び第3表中、No.は化合物番号を示す。また、表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、n-Prはノルマルプロピル基を、i-Prはイソプロピル基を、cyc-Prはシクロプロピル基を、n-Buはノルマルブチル基を、i-Buはイソブチル基を、sec-Buはセカンダリーブチル基を、tert-Buはターシャリーブチル基を、n-Penはノルマルペンチル基を、i-Penはイソペンチル基を、cyc-Penはシクロペンチル基を、neo-Penはネオペンチル基を、n-Hexはノルマルヘキシル基を、neo-Hexはネオヘキシル基を、cyc-Hexはシクロヘキシル基を表す。また、R¹の欄において、例えば「4-F」と記載された化合物は、表中の化学構造式に付与した置換位置のみがR¹で置換されていること、即ち、4位のみがフッ素原子にて置換されていることを表し、「2,4-F₂」と記載された化合物は、2位及び4位がフッ素原子にて置換されていることを表し、他の同様の記載もこれに準じる。記載された化合物が塩を形成している場合には、備考欄に塩の名称を記載した。

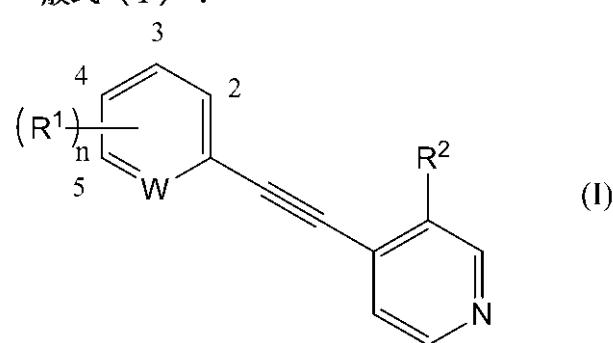
10

20

【0100】

【表1】

一般式(I) :



第1表

No.	R ¹	R ²	W	n	物性
1	4-F	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
2	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
3	4-Br	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
4	4-I	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
5	4-NO ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
6	4-CN	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
7	4-Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
8	4-tert-Bu	F	CH	1	91
9	4-tert-Bu	Cl	CH	1	NMR
10	4-tert-Bu	Br	CH	1	109
11	4-tert-Bu	I	CH	1	
12	4-tert-Bu	CN	CH	1	NMR
13	4-tert-Bu	NO ₂	CH	1	NMR
14	4-tert-Bu	Me	CH	1	NMR
15	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1	NMR
16	4-tert-Bu	n-Bu	CH	1	
17	4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
18	4-tert-Bu	CH ₂ C≡CH	CH	1	
19	4-tert-Bu	CF ₃	CH	1	NMR
20	4-tert-Bu	OH	CH	1	142
21	4-tert-Bu	OMe	CH	1	93
22	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	NMR
23	4-tert-Bu	OCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
24	4-tert-Bu	OCH ₂ C≡CH	CH	1	
25	4-tert-Bu	SH	CH	1	
26	4-tert-Bu	SMe	CH	1	NMR
27	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1	NMR
28	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
29	4-tert-Bu	SCH ₂ C≡CH	CH	1	
30	4-tert-Bu	NH ₂	CH	1	149

10

20

30

40

50

【0101】

【表2】

第1表の続き					
No.	R ¹	R ²	W	n	物性
31	4-tert-Bu	NHMe	CH	1	161
32	4-tert-Bu	NH-n-Pr	CH	1	NMR
33	4-tert-Bu	NHCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
34	4-tert-Bu	NHCH ₂ C≡CH	CH	1	130
35	4-tert-Bu	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	CH	1	NMR
36	4-tert-Bu	N(CH ₂ C≡CH) ₂	CH	1	117
37	4-tert-Bu	SOMe	CH	1	NMR
38	4-tert-Bu	SO-n-Pr	CH	1	
39	4-tert-Bu	SOCH ₂ CH=CH ₂	CH	1	69
40	4-tert-Bu	SOCH ₂ C≡CH	CH	1	
41	4-tert-Bu	SO ₂ Me	CH	1	NMR
42	4-tert-Bu	SO ₂ -n-Pr	CH	1	NMR
43	4-tert-Bu	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	144
44	4-tert-Bu	SO ₂ CH ₂ C≡CH	CH	1	
45	4-tert-Bu	CH ₂ OH	CH	1	NMR
46	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1	82
47	4-tert-Bu	CH ₂ SMe	CH	1	NMR
48	4-tert-Bu	CH ₂ NHMe	CH	1	NMR
49	4-tert-Bu	CH ₂ NMe ₂	CH	1	NMR
50	4-tert-Bu	CHO	CH	1	NMR
51	4-tert-Bu	CO ₂ H	CH	1	101
52	4-tert-Bu	CO ₂ Et	CH	1	NMR
53	4-tert-Bu	COEt	CH	1	NMR
54	4-tert-Bu	CONHMe	CH	1	NMR
55	4-tert-Bu	CONMe ₂	CH	1	
56	4-tert-Bu	OCOMe	CH	1	NMR
57	4-tert-Bu	SCOMe	CH	1	
58	4-tert-Bu	NHCOMe	CH	1	NMR
59	4-tert-Bu	NHCOEt	CH	1	NMR
60	4-tert-Bu	N(COEt) ₂	CH	1	NMR
61	4-tert-Bu	NHCO-i-Pr	CH	1	NMR

10

20

30

40

【0102】

50

【表3】

第1表の続き					
No.	R ¹	R ²	W	n	物性
62	4-tert-Bu	N(CO-i-Pr) ₂	CH	1	123
63	4-n-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
64	4-cyc-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
65	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
66	4-OH	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
67	4-OMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
68	4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
69	4-O-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
70	4-O-sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
71	4-O-i-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
72	4-O-cyc-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
73	4-OCH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
74	4-OCH ₂ C≡CH	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
75	4-OCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
76	4-OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
77	4-OCF(CF ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
78	4-SH	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
79	4-SMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
80	4-S-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
81	4-S(O)Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
82	4-S(O)-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
83	4-S(O) ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
84	4-S(O) ₂ -i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
85	4-NH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
86	4-NHMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
87	4-NH-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
88	4-NMe ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
89	4-CO ₂ H	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
90	4-CO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
91	4-CO ₂ Et	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	

10

20

30

40

【表4】

第1表の続き					
No.	R ¹	R ²	W	n	物性
92	4-COMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	56
93	4-CONHMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
94	4-CONMe ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
95	4-OCOMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
96	4-NHCOMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
97	4-NMeCOMe	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	
98	2-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
99	3-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR
100	2,4-F ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
101	2-NO ₂ -4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
102	2-NH ₂ -4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
103	2-Cl-4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
104	2-Br-4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
105	2-F-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
106	2,6-F ₂ -4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	3	
107	3-F-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR
108	3-Cl-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	
109	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	N	1	NMR
110	2-Cl-4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	N	2	
111	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1	NMR
112	4-tert-Bu	NHEt	CH	1	90
113	4-tert-Bu	NH-n-Bu	CH	1	81
114	4-tert-Bu	NH-n-Pen	CH	1	102
115	4-tert-Bu	NH-n-Hex	CH	1	73
116	4-tert-Bu	NH-i-Pr	CH	1	76
117	4-tert-Bu	NH-i-Bu	CH	1	73
118	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1	NMR
119	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1	NMR
120	4-tert-Bu	OEt	CH	1	NMR
121	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1	NMR
122	4-tert-Bu	O-i-Bu	CH	1	NMR
123	4-tert-Bu	O-n-Pent	CH	1	NMR

10

20

30

40

【表5】

第1表の続き						
No.	R ¹	R ²	W	n	物性	備考
124	4-CH=C(CH ₃) ₂	OMe	CH	1	NMR	
125	4-C≡C-tert-Bu	OMe	CH	1	NMR	
126	4-Me	OMe	CH	1	NMR	
127	4-CF ₃	OMe	CH	1	NMR	
128	4-F	OMe	CH	1	63	
129	4-O-i-Pr	OMe	CH	1	107	
130	4-O-sec-Bu	OMe	CH	1	NMR	
131	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1	69	
132	4-O-neo-Pen	OMe	CH	1	NMR	
133	4-OCF ₃	OMe	CH	1	NMR	
134	4-O-cyc-Pen	OMe	CH	1	NMR	
135	4-S-tert-Bu	OMe	CH	1	NMR	
136	4-SCF ₃	OMe	CH	1	94	
137	4-COOMe	OMe	CH	1	143	
138	3-tert-Bu	OMe	CH	1	NMR	
139	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1	NMR	
140	4-O-n-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
141	4-O-CH(CH ₂ CH ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
142	4-O-CH=CH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
143	4-CF(CF ₃) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
144	3-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
145	3-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
146	3-O-sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
147	3-O-i-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
148	3-O-i-Pen	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	
149	3,4-(MeO) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
150	3,5-(MeO) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
151	3,5-(tert-Bu) ₂	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
152	3-Me-4-O-i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	CH	2	NMR	
153	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
154	4-CF ₃	NHEt	CH	1	89	
155	4-tert-Bu	OMe	CH	1	164	塩酸塩
156	4-tert-Bu	CH(OH)CH ₂ CH ₃	CH	1	NMR	
157	4-tert-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	CH	1	NMR	塩酸塩

【表6】

第1表の続き						
No.	R ¹	R ²	W	n	物性	備考
158	4-S-cyc-Pen	OMe	CH	1	NMR	
159	4-F	CH=CHCH ₃	CH	1	NMR	
160	4-OCF ₃	CH=CHCH ₃	CH	1	NMR	
161	4-neo-Hex	OMe	CH	1		
162	4-cyc-Hex	OMe	CH	1	110	
163	4-SMe	OMe	CH	1	101	
164	4-SOMe	OMe	CH	1		
165	4-SO ₂ Me	OMe	CH	1	152	
166	4-CN	OMe	CH	1	88	
167	4-NH-i-Pr	OMe	CH	1	145	
168	4-CONHMe	OMe	CH	1		
169	4-CONMe ₂	OMe	CH	1		
170	4-NHCOMe	OMe	CH	1	181	
171	4-NMeCOMe	OMe	CH	1	172	
172	4-OCOMe	OMe	CH	1		
173	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1	130	塩酸塩
174	4-tert-Bu	OEt	CH	1	194	塩酸塩
175	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1	141	塩酸塩
176	4-CF ₃	OEt	CH	1	NMR	
177	4-OCF ₃	OEt	CH	1	52	
178	4-SCF ₃	OEt	CH	1	92	
179	4-Me	OEt	CH	1	NMR	
180	4-F	OEt	CH	1	NMR	
181	2-SEt-4-CF ₃	OEt	CH	2		
182	2-S(O)Et-4-CF ₃	OEt	CH	2		
183	2-S(O) ₂ Et-4-CF ₃	OEt	CH	2		
184	4-Me	O-n-Pr	CH	1	NMR	
185	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	196	塩酸塩
186	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	NMR	
187	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	141	塩酸塩
188	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1	NMR	
189	4-OCF ₃	O-n-Pr	CH	1	NMR	
190	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1	99	
191	4-F	O-n-Pr	CH	1	NMR	

10

20

30

40

【表7】

第1表の続き						
No.	R ¹	R ²	W	n	物性	備考
192	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1	134	塩酸塩
193	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
194	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		塩酸塩
195	4-CF ₃	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
196	4-OCF ₃	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
197	4-SCF ₃	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
198	4-Me	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
199	4-F	CH ₂ OMe	CH	1	NMR	
200	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1	74	塩酸塩
201	4-O-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
202	4-O-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		塩酸塩
203	4-CF ₃	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
204	4-OCF ₃	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
205	4-SCF ₃	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
206	4-Me	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
207	4-F	CH ₂ OEt	CH	1	NMR	
208	4-tert-Bu	CH ₂ O-i-Pr	CH	1		
209	4-tert-Bu	CH ₂ O-n-Pr	CH	1	NMR	
210	4-tert-Bu	CH ₂ O-i-Bu	CH	1		
211	4-tert-Bu	SEt	CH	1	NMR	
212	4-tert-Bu	CH ₂ Cl	CH	1	177	塩酸塩
213	3-tert-Bu	NO ₂	CH	1	NMR	
214	4-O-tert-Bu	NO ₂	CH	1	NMR	
215	4-O-sec-Bu	NO ₂	CH	1	NMR	
216	4-S-tert-Bu	NO ₂	CH	1		
217	4-S-sec-Bu	NO ₂	CH	1		
218	4-Me	NH ₂	CH	1	254	
219	3-tert-Bu	NH ₂	CH	1	NMR	
220	4-O-tert-Bu	NH ₂	CH	1	NMR	
221	4-O-sec-Bu	NH ₂	CH	1		
222	4-S-tert-Bu	NH ₂	CH	1		
223	4-S-sec-Bu	NH ₂	CH	1		
224	4-Me	NHEt	CH	1	NMR	

10

20

30

40

【表8】

第1表の続き						
No.	R ¹	R ²	W	n	物性	備考
225	4-tert-Bu	NHEt	CH	1	154	塩酸塩
226	3-tert-Bu	NHEt	CH	1	NMR	
227	4-S-sec-Bu	NHEt	CH	1		
228	4-S-tert-Bu	NHEt	CH	1		
229	4-Et	NHEt	CH	1		
230	4-n-Pr	NHEt	CH	1		
231	4-n-Bu	NHEt	CH	1		
232	4-F	NHEt	CH	1		
233	4-OMe	NHEt	CH	1		
234	4-OCF ₃	NHEt	CH	1		
235	4-O-sec-Bu	NHEt	CH	1		
236	4-O-tert-Bu	NHEt	CH	1		
237	2-SEt-4-CF ₃	NHEt	CH	2		
238	2-S(O)Et-4-CF ₃	NHEt	CH	2		
239	2-S(O) ₂ Et-4-CF ₃	NHEt	CH	2		
240	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1	NMR	
241	4-tert-Bu	Et	CH	1	NMR	
242	4-OMe	CH ₂ OMe	N	1		
243	4-OEt	CH ₂ OMe	N	1		
244	4-O-n-Pr	CH ₂ OMe	N	1		
245	4-O-i-Pr	CH ₂ OMe	N	1	NMR	
246	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	N	1		
247	4-OMe	CH ₂ OEt	N	1		
248	4-OEt	CH ₂ OEt	N	1		
249	4-O-n-Pr	CH ₂ OEt	N	1		
250	4-O-i-Pr	CH ₂ OEt	N	1	NMR	
251	4-O-tert-Bu	CH ₂ OEt	N	1		
252	4-OMe	OMe	N	1		
253	4-OEt	OMe	N	1	NMR	
254	4-O-n-Pr	OMe	N	1		
255	4-O-i-Pr	OMe	N	1	NMR	
256	4-O-tert-Bu	OMe	N	1		

10

20

30

40

【表9】

第1表の続き						
No.	R ¹	R ²	W	n	物性	備考
257	4-tert-Bu	OMe	CH	1		シユウ酸塩
258	4-tert-Bu	OMe	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
259	4-tert-Bu	OMe	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
260	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		塩酸塩
261	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		シユウ酸塩
262	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
263	4-O-i-Pr	OMe	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
264	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1		シユウ酸塩
265	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
266	4-O-tert-Bu	OMe	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
267	4-SCF ₃	OMe	CH	1		塩酸塩
268	4-SCF ₃	OMe	CH	1		シユウ酸塩
269	4-SCF ₃	OMe	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
270	4-SCF ₃	OMe	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
271	4-tert-Bu	OEt	CH	1		シユウ酸塩
272	4-tert-Bu	OEt	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
273	4-tert-Bu	OEt	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
274	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1		シユウ酸塩
275	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
276	4-O-tert-Bu	OEt	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
277	4-OCF ₃	OEt	CH	1		塩酸塩
278	4-OCF ₃	OEt	CH	1		シユウ酸塩
279	4-OCF ₃	OEt	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
280	4-OCF ₃	OEt	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
281	4-SCF ₃	OEt	CH	1		塩酸塩
282	4-SCF ₃	OEt	CH	1		シユウ酸塩
283	4-SCF ₃	OEt	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
284	4-SCF ₃	OEt	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
285	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	149	シユウ酸塩
286	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	96	トリフルオロ酢酸塩
287	4-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1	141	p-トルエンスルホン酸塩
288	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1		シユウ酸塩
289	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
290	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩

10

20

30

40

【表10】

第1表の続き						
No.	R ¹	R ²	W	n	物性	備考
291	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		塩酸塩
292	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		シユウ酸塩
293	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
294	4-CF ₃	O-n-Pr	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
295	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		塩酸塩
296	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		シユウ酸塩
297	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
298	4-SCF ₃	O-n-Pr	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
299	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		シユウ酸塩
300	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
301	4-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
302	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		シユウ酸塩
303	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
304	4-O-tert-Bu	CH ₂ OMe	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
305	4-tert-Bu	Et	CH	1	NMR	塩酸塩
306	4-tert-Bu	Et	CH	1		シユウ酸塩
307	4-tert-Bu	Et	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
308	4-tert-Bu	Et	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
309	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		塩酸塩
310	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		シユウ酸塩
311	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
312	4-tert-Bu	n-Pr	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
313	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		シユウ酸塩
314	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
315	4-tert-Bu	CH ₂ OEt	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
316	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		塩酸塩
317	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		シユウ酸塩
318	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
319	4-tert-Bu	O-i-Pr	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
320	4-tert-Bu	NHEt	CH	1		シユウ酸塩
321	4-tert-Bu	NHEt	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
322	4-tert-Bu	NHEt	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
323	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		塩酸塩
324	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		シユウ酸塩

10

20

30

40

【表 11】

第1表の続き						
No.	R ¹	R ²	W	n	物性	備考
325	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
326	4-tert-Bu	NMe ₂	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
327	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		塩酸塩
328	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		シユウ酸塩
329	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
330	4-tert-Bu	N(Me)Et	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
331	4-tert-Bu	SEt	CH	1		塩酸塩
332	4-tert-Bu	SEt	CH	1		シユウ酸塩
333	4-tert-Bu	SEt	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
334	4-tert-Bu	SEt	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
335	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		塩酸塩
336	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		シユウ酸塩
337	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
338	4-tert-Bu	S-n-Pr	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
339	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		塩酸塩
340	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		シユウ酸塩
341	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
342	4-tert-Bu	S-i-Pr	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
343	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		塩酸塩
344	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		シユウ酸塩
345	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
346	4-tert-Bu	S-i-Bu	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
347	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		塩酸塩
348	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		シユウ酸塩
349	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
350	4-tert-Bu	S-sec-Bu	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩
351	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		塩酸塩
352	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		シユウ酸塩
353	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		トリフルオロ酢酸塩
354	4-tert-Bu	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	1		p-トルエンスルホン酸塩

10

20

30

40

50

【0 1 1 1】

【表 1 2】

第2表

No	1H-NMR δ 値 ppm 測定機器 : JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒 : CDCl ₃	
1	3.60 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, d), 7.08 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.53 (2H, d), 8.46 (1H, d), 8.50 (1H, s)	
5	3.63 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.01 (1H, m), 7.40 (1H, d), 7.70 (2H, d), 8.26 (2H, d), 8.53 (1H, s), 8.56 (1H, s)	
7	2.38 (3H, s), 3.61 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.18 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.45 (1H, d), 8.48 (1H, s)	10
9	1.34 (9H, s), 7.43 (2H, d), 7.55 (2H, d), 7.59 (1H, br), 8.52 (1H, br), 8.70 (1H, br)	
12	1.34 (9H, s), 7.43 (2H, d), 7.55 (1H, br), 7.58 (2H, d), 8.6-9.2 (2H, br)	
13	1.34 (9H, s), 7.44 (2H, d), 7.57 (2H, d), 7.59 (1H, d), 8.77 (1H, d), 9.31 (1H, s)	
14	1.34 (9H, s), 2.65 (3H, s), 7.47 (2H, d), 7.54 (2H, d), 7.83 (1H, d), 8.50 (1H, d), 8.51 (1H, s)	
15	1.05 (3H, t), 1.34 (9H, s), 1.80 (2H, m), 2.95 (2H, t), 7.48 (2H, d), 7.54 (2H, d), 7.82 (1H, d), 8.48 (1H, d), 8.53 (1H, s)	
17	1.34 (9H, s), 3.60 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.00 (1H, m), 7.35 (1H, d), 7.40 (2H, d), 7.48 (2H, d), 8.45 (1H, d), 8.49 (1H, s)	20
19	1.34 (9H, s), 7.42 (2H, d), 7.52 (2H, d)	
22	1.12 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.90 (2H, tq), 4.13 (2H, t), 7.40 (2H, d), 7.40 (1H, br), 7.49 (2H, d), 8.0-8.6 (2H, br)	
26	1.33 (9H, s), 2.59 (3H, s), 7.32 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.53 (2H, d), 7.35 (1H, d), 8.42 (1H, s)	
27	1.13 (3H, t), 1.34 (9H, s), 1.82 (2H, m), 3.05 (2H, t), 7.47 (2H, d), 7.57 (2H, d), 7.73 (1H, d), 8.45-8.33 (2H, m)	
32	1.04 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.73 (2H, m), 3.23 (2H, br), 4.61 (1H, br), 7.25 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.47 (2H, d), 7.91 (2H, d), 8.03 (1H, s)	30
33	1.32 (9H, s), 3.94 (2H, br), 4.78 (1H, br), 5.22 (1H, d), 5.33 (1H, d), 5.96 (1H, m), 7.41 (2H, d), 7.48 (2H, d), 7.94 (1H, d), 8.02 (1H, s)	
35	1.34 (9H, s), 4.18 (4H, d), 5.29 (2H, d), 5.35 (2H, d), 5.89 (2H, m), 7.44 (2H, d), 7.49 (2H, d), 7.70 (1H, d), 7.97 (1H, d), 8.06 (1H, s)	
37	1.34 (9H, s), 2.97 (3H, s), 7.44-7.55 (5H, m), 8.74 (1H, d), 9.12 (1H, s)	
41	1.34 (9H, s), 3.32 (3H, s), 7.45 (2H, d), 7.57-7.59 (3H, m), 8.82 (1H, d), 9.25 (1H, d)	
42	1.03 (3H, t), 1.34 (9H, s), 1.79 (2H, tq), 3.45 (2H, t), 7.46 (2H, d), 7.59 (2H, d), 7.69 (1H, d), 8.86 (1H, d), 9.23 (1H, s)	
52	1.33 (9H, s), 1.43 (3H, d), 4.46 (4H, t), 7.42 (2H, d), 7.55 (2H, d)	40
53	1.26 (3H, t), 1.36 (9H, s), 3.17 (2H, q), 7.42 (2H, d), 7.47-7.51 (3H, m), 8.65 (1H, d), 8.92 (1H, s)	

【0 1 1 2】

【表13】

第2表のつづき	
No.	1H-NMR δ 値ppm 測定機器 : JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒 : CDCl ₃
58	1.36 (9H, s), 2.36 (3H, s), 7.51 (2H, d), 7.56 (2H, d), 7.81 (1H, d), 8.08 (1H, s), 8.41 (1H, d), 9.86 (1H, s)
59	1.30 (3H, t), 1.35 (9H, s), 2.53 (2H, q), 7.42–7.46 (3H, m), 7.50 (2H, d), 7.87 (1H, s), 8.36 (1H, d), 9.73 (1H, s)
60	1.15 (6H, t), 1.32 (9H, s), 2.64 (4H, q), 7.40 (4H, br), 7.56 (1H, d), 8.48 (1H, s), 8.63 (1H, d)
61	1.33 (6H, d), 1.34 (9H, s), 2.65 (1H, m), 7.29 (2H, d), 7.45–7.46 (3H, m), 7.96 (1H, s), 8.35 (1H, d), 9.73 (1H, s)
63	0.93 (3H, t), 1.36 (2H, sext), 1.60 (2H, quin), 2.64 (2H, t), 3.61 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.19 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.46 (2H, d), 8.45 (1H, d), 8.90 (1H, s),
65	3.62 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, d), 7.38 (1H, d), 7.65 (4H, s), 8.50 (1H, d), 8.54(1H, s)
67	3.59 (2H, d), 3.81 (3H, s), 5.13 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.48 (2H, d), 8.43(1H, d), 8.48(1H, s)
68	1.35 (6H, d), 3.60 (2H, d), 4.59 (1H, d), 5.13 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.87 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.46 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.48 (1H, s)
69	1.36 (9H, s), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.00 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
70	0.98 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.70 (2H, m), 3.60 (2H, d), 4.35 (1H, m), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.88 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.48 (2H, br)
71	1.03 (6H, d), 2.10 (1H, m), 3.60 (2H, d), 3.74 (2H, d), 5.14 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.47 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.48 (1H, s)
75	3.60 (2H, d), 5.12 (2H, m), 6.00 (1H, m), 7.23 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.58 (2H, d), 8.46 (1H, d), 8.51 (1H, s)
79	2.50 (3H, s), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 5.98 (1H, m), 7.22 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
85	3.59 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.59 (4H, m), 7.32 (3H, m), 8.41(1H, d), 8.46 (1H, s)
88	3.01 (6H, s), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.67 (2H, d), 7.31 (1H, d), 7.42 (2H, d), 8.41 (1H, d), 8.45(1H, s)
98	3.62 (2H, d), 5.11 (2H, m), 6.02 (1H, m), 7.38 (1H, d), 7.48 (1H, t), 7.55 (1H, t), 7.70 (2H, t), 8.48(1H, d), 8.53(1H, s)
99	3.62 (2H, d), 5.16 (2H, m), 6.01 (1H, m), 7.37 (1H, d), 7.52 (1H, t), 7,65 (1H, d), 7.72 (1H, d), 7.80 (1H, s), 8.50 (1H, d), 8.54(1H, s)
100	3.61 (2H, d), 5.12 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.90 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.50 (1H, d), 8.48 (1H, s), 8.52 (1H, s)

【表14】

第2表のつづき	
No.	1H-NMR δ 値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒：CDCl ₃
101	1.38 (9H, s), 3.66 (2H, d), 5.13 (2H, m), 6.03 (1H, m), 7.41 (1H, d), 7.66 (2H, s), 8.13 (1H, s), 8.49 (1H, d), 8.53 (1H, s)
105	1.36 (6H, d), 3.61 (2H, d), 4.56 (1H, m), 5.16 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.68 (2H, m), 7.35 (1H, d), 7.40 (1H, m), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
107	1.38 (6H, d), 3.59 (2H, d), 4.61 (1H, m), 5.14 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.95 (1H, m), 7.25 (2H, d), 7.34 (1H, d), 8.47 (2H, br)
109	3.65 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.01 (1H, m), 7.37 (1H, d), 7.67 (1H, d), 7.96 (1H, d), 8.52 (1H, d), 8.56 (1H, s), 8.92 (1H, s)
111	1.33 (9H, s), 3.06 (6H, s), 7.28 (1H, d), 7.39 (2H, d), 7.48 (2H, d), 8.10 (1H, d), 8.26 (1H, s)
118	1.33 (9H, s), 1.35 (6H, d), 3.62–3.66 (1H, m), 7.36 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.52 (2H, d), 8.42 (1H, br), 8.62 (1H, br)
119	1.07 (6H, d), 1.33 (9H, s), 1.89–1.94 (1H, m), 2.92 (2H, d), 7.31 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.52 (2H, d), 8.49 (1H, d), 8.53 (1H, s)
120	1.33 (9H, s), 1.51 (3H, t), 4.24 (2H, q), 7.34 (1H, br), 7.39 (2H, d), 7.50 (2H, d), 8.22 (1H, br), 8.31 (1H, br)
121	1.33 (9H, s), 1.42 (6H, d), 4.66 (1H, m), 4.38 (1H, br), 7.40 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.06 (1H, br), 8.27 (1H, br)
122	1.14 (6H, d), 1.34 (9H, s), 2.27 (1H, m), 3.97 (2H, d), 7.46 (2H, d), 7.53 (2H, d), 7.78 (1H, d), 8.25 (1H, d), 8.27 (1H, s)
123	0.94 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.43 (2H, qt), 1.54 (2H, tt), 1.88 (2H, tt), 4.16 (2H, t), 7.33 (1H, br), 7.37 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.22 (1H, br), 8.31 (1H, br)
126	2.38 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.17 (2H, d), 7.42 (1H, br), 7.47 (2H, d), 8.0–8.7 (2H, br)
127	4.03 (3H, s), 7.38 (1H, br), 7.63 (2H, d), 7.68 (2H, d), 8.29 (1H, d), 8.39 (1H, br)
130	0.99 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.70 (2H, m), 4.01 (3H, s), 4.35 (1H, m), 6.87 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.24 (1H, d), 8.32 (1H, s)
132	1.03 (9H, d), 3.60 (2H, s), 4.00 (3H, s), 6.88 (2H, d), 7.49 (2H, d)
133	4.00 (3H, s), 7.22 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.60 (2H, d), 8.26 (1H, s), 8.35 (1H, s)
134	1.76 (8H, m), 4.00 (3H, s), 4.77 (1H, m), 6.85 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.48 (2H, d), 8.23 (1H, d), 8.31 (1H, s)
135	1.29 (9H, s), 4.00 (3H, s), 7.35 (1H, d), 7.53 (4H, s), 8.25 (1H, s), 8.35 (1H, s)
138	1.31 (9H, s), 4.01 (3H, s), 7.39 (3H, m), 7.60 (1H, s), 8.25 (1H, s), 8.35 (1H, s)
139	1.37 (9H, s), 1.48 (3H, t), 4.23 (2H, q), 6.97 (2H, d), 7.47 (2H, d)
140	1.03 (3H, t), 1.80 (2H, sext), 3.59 (2H, d), 3.92 (2H, t), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.48 (1H, s)
141	0.88 (3H, t), 0.94 (3H, t), 1.68 (4H, m), 3.60 (2H, d), 5.15 (2H, m), 5.98 (2H, m), 6.89 (2H, d), 7.47 (3H, m), 8.41 (2H, br)

10

20

30

40

【0114】

【表 15】

第2表のつづき	
No.	1H-NMR δ 値ppm 測定機器 : JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒 : CDCl ₃
142	3.61 (2H, d), 4.54 (1H, d), 4.86 (1H, d), 5.12 (2H, m), 6.03 (1H, m), 6.66 (1H, m), 7.01 (2H, d), 7.35 (1H, d), 7.50 (2H, d), 8.45 (1H, s), 8.50 (1H, s)
143	3.61 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.00 (1H, m), 7.43 (1H, s), 7.65 (4H, m), 8.51 (2H, br)
144	1.34 (9H, s), 3.63 (2H, d), 5.16 (2H, m), 6.03 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.37 (2H, d), 7.43 (1H, d), 7.57 (1H, s), 8.47 (1H, s), 8.51 (1H, s)
145	1.35 (6H, d), 3.60 (2H, d), 4.57 (1H, m), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.93 (1H, d), 7.05 (1H, s), 7.11 (1H, d), 7.27 (1H, m), 7.35 (1H, d), 8.45 (2H, br)
146	0.99 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.70 (2H, m), 3.51 (2H, d), 4.33 (1H, m), 5.15 (2H, m), 5.98 (1H, m), 6.93 (1H, dd), 7.05 (1H, s), 7.11 (1H, d), 7.27 (1H, m), 7.49 (1H, d), 8.43 (2H, br)
147	1.04 (6H, d), 2.01 (1H, m), 3.74 (2H, d), 5.15 (2H, m), 6.00 (1H, m), 6.94 (1H, d), 7.07 (1H, s), 7.12 (1H, d), 7.27 (1H, m), 8.43 (2H, br)
148	0.97 (6H, d), 1.69 (2H, q), 1.82 (1H, m), 3.62 (2H, d), 4.01 (2H, t), 5.16 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.94 (1H, d), 7.06 (1H, s), 7.13 (1H, d), 7.26 (1H, m), 7.39 (1H, s), 8.49 (2H, br)
149	3.60 (2H, d), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.83 (1H, d), 7.03 (1H, s), 7.15 (1H, d), 7.32 (1H, d), 8.44 (1H, d), 8.49 (1H, s)
150	3.60 (2H, d), 3.80 (6H, s), 5.14 (2H, m), 6.01 (1H, m), 6.51 (1H, d), 6.69 (2H, d), 7.35 (1H, d), 8.46 (1H, s), 8.50 (1H, s)
151	1.32 (18H, s), 3.64 (2H, d), 5.16 (2H, m), 6.03 (1H, m), 7.39 (3H, m), 7.47 (1H, t), 8.50 (2H, br)
152	1.36 (6H, d), 2.20 (3H, s), 3.60 (2H, d), 4.58 (1H, m), 5.15 (2H, m), 6.02 (1H, m), 6.81 (1H, d), 7.35 (3H, m), 8.42 (2H, br)
153	1.26 (3H, t), 1.32 (9H, s), 3.64 (2H, q), 4.72 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.40 (2H, m), 7.47 (2H, m), 8.50 (1H, d), 8.70 (1H, s)
157	1.35 (9H, s), 3.71 (2H, d), 5.25 (2H, m), 5.98 (1H, m), 7.45 (2H, d), 7.53 (2H, d), 7.71 (1H, s), 8.59 (1H, br)
158	1.61 (4H, m), 1.77 (2H, m), 2.07 (2H, m), 3.63 (1H, m), 3.98 (3H, s), 7.27 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.22 (1H, d), 8.31 (1H, s)
159	1.98 (3H, d), 6.48 (1H, m), 6.77 (1H, d), 7.09 (2H, m), 7.31 (1H, d), 7.55 (2H, m), 8.39 (1H, d), 8.76 (1H, s)
160	1.98 (3H, d), 6.48 (1H, m), 6.78 (1H, d), 7.24 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.60 (2H, d), 8.40 (1H, d), 8.77 (1H, s)
28	1.33 (9H, s), 3.68 (2H, d), 5.11–5.15 (2H, m), 5.86–5.91 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.39–7.41 (2H, m), 7.53 (2H, d), 8.38 (1H, d), 8.54 (1H, s)
45	1.33 (9H, s), 4.92 (2H, d), 7.39 (1H, br), 7.41 (2H, d), 7.48 (2H, d), 8.55 (1H, br), 8.72 (1H, br)
47	1.34 (9H, s), 2.07 (3H, s), 3.88 (2H, s), 7.38 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.51 (2H, d), 8.48 (1H, d), 8.57 (1H, s)

【表 16】

第2表のつづき	
No.	1H-NMR δ 値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒：CDCl ₃
48	1.33 (9H, s), 2.47 (3H, s), 3.96 (2H, s), 7.37 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.49 (1H, d), 8.60 (1H, s)
49	1.34 (9H, s), 2.33 (6H, s), 3.66 (2H, s), 7.37 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.50 (2H, d), 8.48 (1H, d), 8.64 (1H, s)
50	1.34 (9H, s), 7.44 (2H, d), 7.49 (1H, d), 7.54 (2H, d), 8.76 (1H, d), 9.11 (1H, s), 10 1.64 (1H, s)
54	1.35 (9H, s), 3.09 (3H, d), 7.41–7.50 (5H, m), 8.66 (1H, br), 9.22 (1H, br)
56	1.33 (9H, s), 2.40 (3H, s), 7.39–7.47 (5H, m), 8.44 (1H, s), 8.47 (1H, d)
124	1.88 (3H, s), 1.92 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.26 (1H, s), 7.22 (2H, d), 7.36 (1H, s), 7.51 (2H, d), 8.23–8.41 (2H, br)
125	1.30 (9H, s), 4.00 (3H, s), 7.37 (2H, d), 7.48 (2H, d)
176	1.53 (3H, t), 4.23 (2H, q), 7.35 (1H, d), 7.64 (4H, m), 8.23 (1H, d), 8.34 (1H, s)
179	1.51 (3H, t), 2.36 (3H, s), 4.23 (2H, q), 7.17 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.22 (1H, s), 8.30 (1H, s)
180	1.51 (3H, t), 4.24 (2H, q), 7.07 (2H, m), 7.34 (1H, s), 7.55 (2H, m), 8.23 (1H, s), 20 8.33 (1H, s)
184	1.11 (3H, t), 1.90 (2H, sext), 4.12 (2H, t), 7.17 (2H, d), 7.33 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.21 (1H, s), 8.30 (1H, s)
186	1.11 (3H, t), 1.38 (9H, s), 1.90 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 6.98 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.46 (2H, d), 8.22 (1H, s), 8.30 (1H, s)
188	1.11 (3H, t), 1.89 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 7.35 (1H, d), 7.64 (4H, m), 8.24 (1H, s), 8.34 (1H, s)
189	1.10 (3H, t), 1.91 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 7.22 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.58 (2H, d), 8.22 (1H, s), 8.33 (1H, s)
191	1.11 (t, 3H), 1.90 (2H, sext), 4.13 (2H, t), 7.06 (2H, m), 7.32 (1H, d), 7.54 (2H, m), 8.22 (1H, s), 8.32 (1H, s)
193	1.38 (9H, s), 3.49 (3H, s), 4.68 (2H, s), 6.99 (2H, d), 7.36 (1H, s), 7.46 (2H, d), 8.61 (2H, br)
195	3.50 (3H, s), 4.69 (2H, s), 7.40 (1H, d), 7.66 (4H, m), 8.57 (1H, d), 8.73 (1H, s)
196	3.49 (3H, s), 4.68 (2H, s), 7.24 (2H, d), 7.26 (1H, s), 7.59 (2H, d), 8.60 (1H, s), 8.76 (1H, s)
197	3.50 (3H, s), 4.68 (2H, s), 7.40 (1H, s), 7.60 (2H, d), 7.66 (2H, d), 8.61 (2H, br)
198	2.39 (3H, s), 3.48 (3H, s), 4.69 (2H, s), 7.19 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.45 (2H, d), 8.53 (1H, s), 8.70 (1H, s)

【表17】

第2表のつづき	
No.	1H-NMR δ値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒：CDCl ₃
199	3.49 (3H, s), 4.68 (2H, s), 7.09 (2H, m), 7.36 (1H, d), 7.54 (2H, m), 8.54 (1H, d), 8.70 (1H, s)
201	1.29 (3H, t), 1.38 (9H, s), 3.65 (2H, q), 4.73 (2H, s), 7.00 (2H, d), 7.35 (1H, br), 7.45 (2H, d), 8.53 (1H, br), 8.73 (1H, br)
203	1.29 (3H, t), 3.65 (2H, q), 4.72 (2H, s), 7.38 (1H, d), 7.65 (4H, s), 8.35 (1H, d), 8.72 (1H, s)
204	1.28 (3H, t), 3.65 (2H, q), 4.71 (2H, s), 7.24 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.57 (2H, d), 8.54 (1H, d), 8.72 (1H, s)
205	1.29 (1H, t), 3.65 (2H, q), 4.71 (2H, s), 7.25 (1H, s), 7.58 (2H, d), 7.67 (2H, d), 8.55 (1H, d), 8.73 (1H, s)
206	1.28 (3H, t), 2.39 (3H, s), 3.65 (2H, q), 4.73 (2H, s), 7.19 (2H, d), 7.36 (1H, d), 7.44 (2H, d), 8.35 (1H, br), 8.72 (1H, br)
207	1.28 (3H, t), 3.65 (2H, q), 4.72 (2H, s), 7.06–7.11 (2H, m), 7.36 (1H, d), 7.51–7.55 (2H, m), 8.53 (1H, br), 8.72 (1H, br)
209	0.96 (3H, t), 1.33 (9H, s), 1.67 (2H, m), 3.54 (2H, t), 4.72 (2H, s), 7.35 (1H, s), 7.41 (2H, d), 7.47 (2H, d), 8.52 (1H, br), 8.73 (1H, br)
211	1.33 (9H, s), 1.38 (3H, t), 3.08 (2H, q), 7.32 (1H, d), 7.40 (2H, d), 7.52 (2H, d), 8.37 (1H, d), 8.52 (1H, s)
213	1.35 (9H, s), 7.33–7.36 (1H, m), 7.45 (1H, d), 7.49 (1H, d), 7.60 (1H, d), 7.63 (1H, d), 8.77 (1H, d), 9.31 (1H, s)
214	1.40 (9H, s), 7.01 (2H, d), 7.53–7.56 (3H, m), 8.75 (1H, d), 9.30 (1H, s)
215	0.98 (3H, t), 1.31 (3H, d), 1.60–1.69 (1H, m), 1.72–1.79 (1H, m), 4.34–4.40 (1H, m), 6.89 (2H, d), 7.53–7.57 (3H, m), 8.73 (1H, d), 9.29 (1H, s)
219	1.34 (9H, s), 4.25 (2H, br), 7.20 (1H, d), 7.29–7.32 (1H, m), 7.35–7.37 (1H, m), 7.41–7.43 (1H, m), 7.55–7.56 (1H, m), 7.97 (1H, d), 8.16 (1H, s)
220	1.38 (9H, s), 4.23 (2H, br), 6.99 (2H, d), 7.17 (1H, d), 7.45 (2H, d), 7.96 (1H, d), 8.15 (1H, s)
224	1.33 (3H, t), 2.83 (3H, s), 3.22 (2H, q), 4.39 (1H, br), 7.16–7.19 (3H, m), 7.42 (2H, d), 7.92 (1H, d), 8.05 (1H, s)
226	1.34 (9H, s), 1.34 (3H, t), 3.32 (2H, q), 4.41 (1H, br), 7.19 (1H, d), 7.30–7.36 (3H, m), 7.41–7.43 (1H, m), 7.93 (1H, d), 8.09 (1H, s)
240	1.24 (3H, t), 1.32 (9H, s), 2.97 (3H, s), 4.11 (2H, q), 7.28 (1H, d), 7.38 (2H, d), 7.47 (2H, d), 8.07 (1H, d), 8.24 (1H, s)
241	1.32 (3H, t), 1.34 (9H, s), 2.86 (2H, q), 7.33 (1H, d), 7.41 (2H, d), 7.49 (2H, d), 8.43 (1H, d), 8.50 (1H, s)
245	1.34 (6H, d), 3.46 (3H, s), 4.60 (1H, m), 4.68 (2H, s), 7.15 (2H, m), 7.44 (1H, d), 7.65 (1H, d), 8.28 (1H, d), 8.53 (1H, br), 8.70 (1H, br)
250	1.25 (3H, t), 1.33 (6H, d), 3.62 (2H, q), 4.58 (1H, m), 4.73 (2H, s), 7.13 (1H, m), 7.37 (1H, d), 7.43 (1H, d), 8.27 (1H, d), 8.50 (1H, br), 8.70 (1H, br)

【表18】

第2表のつづき	
No.	1H-NMR δ値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒：CDCl ₃
253	1.43 (3H, t), 4.07 (3H, s), 4.08 (2H, q), 7.14 (1H, m), 7.36 (1H, d), 7.48 (1H, d), 8.22-8.31 (3H, m)
255	1.35 (6H, d), 3.99 (3H, s), 4.59 (1H, m), 7.13 (1H, m), 7.36 (1H, d), 7.48 (1H, d), 8.22 (1H, br), 8.27 (1H, d), 8.32 (1H, br)

【0118】

10

【表19】

第3表	
No.	1H-NMR δ値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒：DMSO-d ₆
156	0.90 (3H, t), 1.28 (9H, s), 1.68 (2H, m), 4.95 (1H, m), 5.47 (1H, d), 7.50 (5H, m), 8.29 (1H, br), 8.64 (1H, br)
305	1.29 (12H, m), 2.96 (2H, q), 7.53 (2H, d), 7.62 (2H, d), 8.09 (1H, br), 8.60-9.20 (2H, br)

【0119】

20

試験例1 トビイロウンカに対する効果試験

本発明化合物の濃度が200 ppmとなるよう調製した薬液に、イネ幼苗を浸漬処理した。薬液が風乾した後に、湿った脱脂綿で根部を包んで試験管に入れた。この中にトビイロウンカ2~3齢幼虫を約10頭放ち、管口をガーゼでふたをして25の照明付恒温室内に放置した。放虫5日後にトビイロウンカの生死を判定し、下記の計算式により死虫率(%)を求めた。その結果、前記化合物No.1、7、8、9、10、14、15、17、19、21、22、26、27、28、30、31、32、33、35、36、39、46、53、63、65、67、68、69, 70, 71、75、79、98、99、100、101、105、107、111、112、113、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、136、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、154、155、156、157、159、160、162、163、165、167、171、173、174、175、176、177、178、179、180、184、185、186、187、188、189、190、191、192、193、197、198、199、200、201、209、211、212、224、225、226、240、241、253、285、286、287及び305が90%以上の死虫率を示した。

$$\text{死虫率(%)} = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

【0120】

40

試験例2 タバココナジラミに対する効果試験

タバココナジラミ1~2齢幼虫が寄生したポット植えのキュウリ苗に、本発明化合物の濃度が200 ppmとなるよう調製した薬液を、ハンドスプレーを用いて散布処理した。薬液が風乾した後に、25の照明付恒温室内に放置した。処理10日後に老齢幼虫数を調査し、下記計算式により防除価を求めた。その結果、前記化合物No.1、7、9、10、12、15、17、19、20、21、22、26、27、28、31、32、33、35、36、39、46、47、49、51、52、53、56、58、61、63、65、67、68、69、70、71、75、79、88、100、101、105, 107、109、111、112、113、116、117、118、119、120、121、122、124、126、127、128、129、130、131、132、133が90%以上の死虫率を示した。

33、135、136、138、139、140、141、143、144、149、1
 50、151、152、153、154、155、156、157、160、162、1
 63、165、166、173、174、175、176、177、178、179、1
 80、185、186、187、188、189、190、191、192、193、1
 97、199、200、201、203、204、206、207、209、211、2
 12、224、225、226、240、241、253、255、285、286、2
 87及び305が90以上の防除価を示した。

$$\text{防除価} = (1 - (Ta \times Cb) / (Tb \times Ca)) \times 100$$

Ta: 処理キュウリ苗における処理後の老齢幼虫数

Tb: 処理キュウリ苗における処理前の1~2齢幼虫数

10

Ca: 無処理キュウリ苗における処理後の老齢幼虫数

Cb: 無処理キュウリ苗における処理前の1~2齢幼虫数

【0121】

試験例3 フタトゲチマダニに対する効果試験

本発明化合物の濃度が100ppmになるように調製した溶液をプラスチックバイアル瓶に処理した。薬液が風乾した後に20頭の幼ダニを入れ、25、相対湿度80~100%の恒暗条件下に静置した。薬剤接触24時間後に死亡したダニ数を記録し、下記計算式により死虫率(%)を求めた。その結果、前記化合物No.7、15、17、65、67、68、69、75、79、99、100、109、140、159、160、179、191、196、203、204、206、207が90%以上の死虫率を示した。

20

$$\text{死虫率(%)} = \text{死亡したマダニ数} / \text{総マダニ数} \times 100$$

【0122】

次に製剤例を記載する。

製剤例1

- (1) 本発明化合物 20重量部
- (2) クレー 70重量部
- (3) ホワイトカーボン 5重量部
- (4) ポリカルボン酸ナトリウム 3重量部
- (5) アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム 2重量部

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

30

【0123】

製剤例2

- (1) 本発明化合物 5重量部
- (2) タルク 60重量部
- (3) 炭酸カルシウム 34.5重量部
- (4) 流動パラフィン 0.5重量部

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

【0124】

製剤例3

- (1) 本発明化合物 20重量部
- (2) N,N-ジメチルアセトアミド 20重量部
- (3) ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル 10重量部
- (4) ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 2重量部
- (5) キシレン 48重量部

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

40

【0125】

製剤例4

- (1) クレー 68重量部
- (2) リグニンスルホン酸ナトリウム 2重量部
- (3) ポリオキシエチレンアルキルアリールサルフェート 5重量部

50

(4) ホワイトカーボン 25重量部

以上の各成分の混合物と、本発明化合物とを4：1の重量割合で混合し、水和剤とする。

【0126】

製剤例5

(1) 本発明化合物 50重量部

(2) アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物 2重量部

(3) シリコーンオイル 0.2重量部

(4) 水 47.8重量部

以上のものを均一に混合、粉碎した原液に更に

(5) ポリカルボン酸ナトリウム 5重量部

10

(6) 無水硫酸ナトリウム 42.8重量部

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

【0127】

製剤例6

(1) 本発明化合物 5重量部

(2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル 1重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル 0.1重量部

(4) 粒状炭酸カルシウム 93.9重量部

(1)～(3)を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4)に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

20

【0128】

製剤例7

(1) 本発明化合物 2.5重量部

(2) N,N-ジメチルアセトアミド 2.5重量部

(3) 大豆油 95.0重量部

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤(ultra low volume formulation)とする。

【0129】

製剤例8

(1) 本発明化合物 10重量部

(2) ジエチレングリコールモノエチルエーテル 80重量部

30

(3) ポリオキシエチレンアルキルエーテル 10重量部

以上の成分を均一に混合し、液剤とする。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I
C 0 7 D 213/65 (2006.01)	C 0 7 D 213/65
C 0 7 D 213/70 (2006.01)	C 0 7 D 213/70
C 0 7 D 213/73 (2006.01)	C 0 7 D 213/73
C 0 7 D 213/74 (2006.01)	C 0 7 D 213/74
C 0 7 D 213/71 (2006.01)	C 0 7 D 213/71
C 0 7 D 213/30 (2006.01)	C 0 7 D 213/30
C 0 7 D 213/32 (2006.01)	C 0 7 D 213/32
C 0 7 D 213/38 (2006.01)	C 0 7 D 213/38
C 0 7 D 213/48 (2006.01)	C 0 7 D 213/48
C 0 7 D 213/80 (2006.01)	C 0 7 D 213/80
C 0 7 D 213/82 (2006.01)	C 0 7 D 213/82
C 0 7 D 213/75 (2006.01)	C 0 7 D 213/75
C 0 7 D 213/46 (2006.01)	C 0 7 D 213/46
A 0 1 N 43/40 (2006.01)	A 0 1 N 43/40 101A
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 N 43/40 101J
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 N 43/40 101B
A 6 1 K 31/44 (2006.01)	A 0 1 N 43/40 101E
A 6 1 K 31/444 (2006.01)	A 0 1 N 43/40 101C
A 6 1 P 33/00 (2006.01)	A 0 1 N 43/40 101D A 0 1 P 7/02 A 0 1 P 7/04 A 6 1 K 31/44 A 6 1 K 31/444 A 6 1 P 33/00 171

(72)発明者 重黒木 達也	滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社	中央研究所内
(72)発明者 梅本 直	滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社	中央研究所内
(72)発明者 可児 達也	滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社	中央研究所内
(72)発明者 松田 洋子	滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社	中央研究所内
(72)発明者 田中 久美子	滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社	中央研究所内
(72)発明者 神沼 路子	滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社	中央研究所内
(72)発明者 嶋田 達也	滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社	中央研究所内

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 特開昭56-123903(JP,A)
 国際公開第2010/115901(WO,A1)
 特開昭61-060638(JP,A)
 特開平01-316359(JP,A)
 特開2000-053647(JP,A)

国際公開第2010/137302 (WO, A1)

Ziegler, H. J. et al., Benzofurans. XXXIII. New methods of preparing basic benzofurans . Neurodepressive 2-pyridylbenzofuran and 2-(aminoalkyl)benzofuran , Chimica Therapeutica , 1971年, 6(3), pp. 159-166

Rustagi, Vineeta et al., Highly efficient Ag(I)-catalyzed regioselective tandem synthesis of diversely substituted quinoxalines and benzimidazoles in water , Green Chemistry , 2011年, 13(7), pp. 1640-1643

Harcken, Christian et al., A General and Efficient Synthesis of Azaindoles and Diazaindoles , Synlett , 2005年, (20), pp. 3121-3125

REGISTRY(STN)[online] , ED Entered STN: 18 Sep 2012 , 検索日 : 2017年6月21日 , CAS登録番号 1394839-61-2

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D

A 0 1 N

A 6 1 K

C A p l u s / R E G I S T R Y / M A R P A T (S T N)