

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2017-8029

(P2017-8029A)

(43) 公開日 平成29年1月12日(2017.1.12)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>C07D 213/81</b> (2006.01)	C07D 213/81 C S P	4C055
<b>A61P 33/14</b> (2006.01)	A61P 33/14	4C086
<b>A61K 31/444</b> (2006.01)	A61K 31/444	4H011
<b>C07D 213/82</b> (2006.01)	C07D 213/82	
<b>A01P 7/02</b> (2006.01)	A01P 7/02	

審査請求 未請求 請求項の数 9 O L (全 26 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2016-101001 (P2016-101001)	(71) 出願人	000000354 石原産業株式会社
(22) 出願日	平成28年5月20日 (2016. 5. 20)		大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
(31) 優先権主張番号	特願2015-120715 (P2015-120715)	(72) 発明者	松本 真洋
(32) 優先日	平成27年6月16日 (2015. 6. 16)		大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		石原産業株式会社内
		(72) 発明者	吉田 幸太郎
			大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
			石原産業株式会社内
		(72) 発明者	可児 達也
			大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
			石原産業株式会社内

最終頁に続く

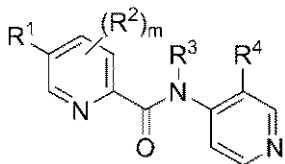
(54) 【発明の名称】 N - ( 4 - ピリジル ) ピコリンアミド化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤

(57) 【要約】

【課題】 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である。

【解決手段】 式 ( I ) :

【化 1】



〔式中、R<sup>1</sup> はアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルコキシハロアルキルであり；R<sup>2</sup> はハロゲン原子、アルコキシ又はハロアルコキシであり；R<sup>3</sup> は水素原子又はアルキルカルボニルであり；R<sup>4</sup> はハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキニルスルホニル、アルコキシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルであり；m が 0、1 又は 2 である〕で表される N - ( 4 - ピリジル ) ピコリンアミド化合物又はその塩、該化合物又はその塩を提供する。

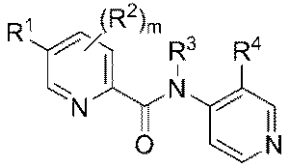
【選択図】 なし

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 (I) :

## 【化 1】



〔式中、R<sup>1</sup>はアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、アルコキシハロアルキル、アルキルチオ又はハロアルキルチオであり；

R<sup>2</sup>はハロゲン原子、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アルケニルオキシアルキル、アルキニルオキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、アルコキシハロアルキル、トリアルキルシリル、アミノ、アルキルアミノ、アルケニルアミノ、アルキニルアミノ、ジアルキルアミノ、ジアルケニルアミノ、ジアルキニルアミノ、カルボキシル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアミノ又はアルキルカルボニルアルキルアミノであり；

R<sup>3</sup>は、水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニル又はアリアルカルボニルであり；

R<sup>4</sup>はハロゲン原子、メルカプト、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシルアルキル、ホルミル、カルボキシル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルカルボニルオキシ又はアルキルカルボニルチオであり；

mは0～3の整数である〕

で表されるN-(4-ピリジル)ピコリンアミド化合物又はその塩。

## 【請求項 2】

R<sup>4</sup>がハロゲン原子、メルカプト、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシルアルキル、ホルミル、カルボキシル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルカルボニルオキシ又はアルキルカルボニルチオである請求項1に記載の化合物又はその塩。

## 【請求項 3】

R<sup>1</sup>がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルコキシハロアルキルであり；R<sup>2</sup>がハロゲン原子、アルコキシ又はハロアルコキシであり；R<sup>3</sup>が、水素原子、アルキル又はアルキルカルボニルであり；R<sup>4</sup>がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニル

チオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルであり；mが0、1又は2である請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項4】

R<sup>3</sup>が水素原子又はアルキルカルボニルであり；R<sup>4</sup>がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルコシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルである請求項3に記載の化合物又はその塩。

【請求項5】

R<sup>1</sup>がハロアルキルであり；R<sup>2</sup>がハロゲン原子であり；R<sup>3</sup>が水素原子又はアルキルカルボニルであり；R<sup>4</sup>がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルコシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルであり；mが0又は1である請求項3に記載の化合物又はその塩。

【請求項6】

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有害生物防除剤。

【請求項7】

請求項1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、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤。

【請求項8】

請求項1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。

【請求項9】

請求項1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。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規なN-(4-ピリジル)ピコリンアミド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、N-ピリジルピコリンアミド誘導体を含む特定化合物が、農業用有害生物防除剤として有用であることが記載されている。しかしながら、この化合物は、ピコリンアミドのピリジン環の3位に硫黄を含む置換基が入る点で、本発明化合物とは異なっている。

特許文献2には、医薬用途のピコリンアミド誘導体が記載されているが、後記式(I)のようなN-(4-ピリジル)ピコリンアミドの具体的記載はない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】国際公開第2014/021468号

【特許文献2】国際公開第2008/106692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。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】

10

20

30

40

50

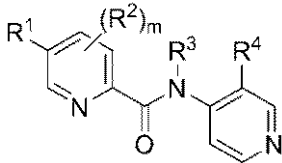
## 【 0 0 0 5 】

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 N - ( 4 - ピリジル ) ピコリンアミド誘導体が、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。

即ち本発明は、式 ( I ) :

## 【 0 0 0 6 】

## 【 化 1 】



10

## 【 0 0 0 7 】

〔式中、R<sup>1</sup>はアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、アルコキシハロアルキル、アルキルチオ又はハロアルキルチオであり；

R<sup>2</sup>はハロゲン原子、ヒドロキシル、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アルケニルオキシアルキル、アルキニルオキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、アルコキシハロアルキル、トリアルキルシリル、アミノ、アルキルアミノ、アルケニルアミノ、アルキニルアミノ、ジアルキルアミノ、ジアルケニルアミノ、ジアルキニルアミノ、カルボキシル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアミノ又はアルキルカルボニルアルキルアミノであり；

20

R<sup>3</sup>は、水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニル又はアリールカルボニルであり；

R<sup>4</sup>はハロゲン原子、メルカプト、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシルアルキル、ホルミル、カルボキシル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルカルボニルオキシ又はアルキルカルボニルチオであり；mは0～3の整数である〕で表される N - ( 4 - ピリジル ) ピコリンアミド化合物又はその塩、該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、該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に関する。

30

40

## 【 発明の効果 】

## 【 0 0 0 8 】

前記式 ( 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 】

## 【 0 0 0 9 】

前記式 ( 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。

50

## 【0010】

前記式(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 $C_1 - C_6$ の基が挙げられる。

## 【0011】

前記式(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 $C_2 - C_6$ の基が挙げられる。

10

## 【0012】

前記式(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-プロピニル、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 $C_2 - C_6$ の基が挙げられる。

## 【0013】

前記式(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 $C_3 - C_6$ の基が挙げられる。

20

## 【0014】

前記式(I)中のアリール又はアリール部分としては、例えば、フェニル、ナフチルのような $C_6 - C_{10}$ の基が挙げられる。

## 【0015】

前記式(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。

30

## 【0016】

前記式(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、本発明の範囲内であることは明らかである。

## 【0017】

前記式(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、これらの方法に限定されるものではない。

40

## 【0018】

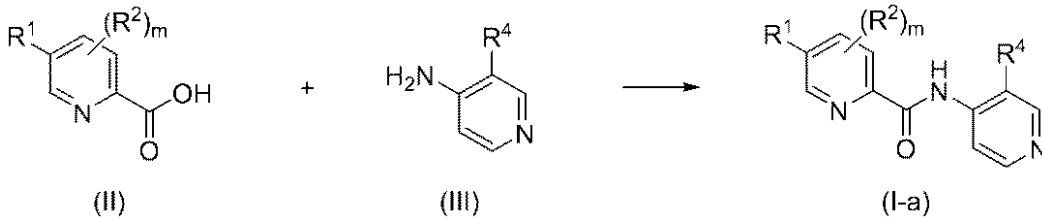
## 製法〔1〕

前記式(I)中、 $R^3$ がHである式(I-a)の化合物は、式(II)の化合物と式(III)の化合物を脱水縮合剤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。なお、式(II)の化合物及び式(III)の化合物は、公知の方法にて製造できる他、市販品を使用することもできる。

## 【0019】

50

## 【化2】



## 【0020】

(製法〔1〕中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 及び $m$ は前述のとおりである。)

脱水縮合剤としては、例えば1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミドなどが挙げられる。該反応は、必要に応じて添加剤を加えて行うことができる。添加剤としては、例えば1-ヒドロキシベンゾトリアゾール、N-ヒドロキシコハク酸イミド、N,N-ジメチル-4-アミノピリジンなどが挙げられる。

10

## 【0021】

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；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；ピリジンのような含窒素芳香族化合物類；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。

20

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。

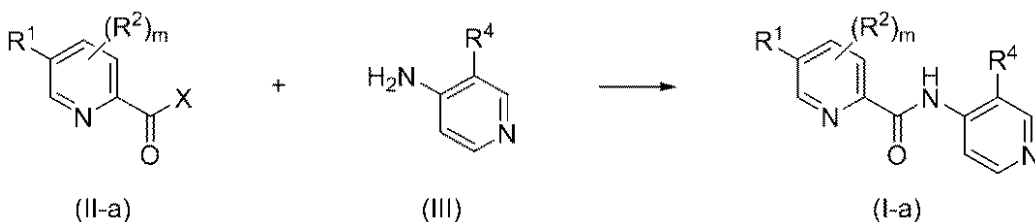
## 【0022】

製法〔2〕

前記式(I)中、 $R^3$ がHである式(I-a)の化合物は、式(II-a)の化合物と式(III)の化合物を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。式(II-a)の化合物は、後記中間体製法に記載の方法にて製造できる他、市販品を使用することもできる。

## 【0023】

## 【化3】



30

## 【0024】

(製法〔2〕中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 及び $m$ は前述のとおりであり；Xはハロゲン原子である。)

塩基は、有機塩基でも無機塩基でもよい。有機塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチ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。

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、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；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；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

50

は、通常数分～24時間で行うことができる。

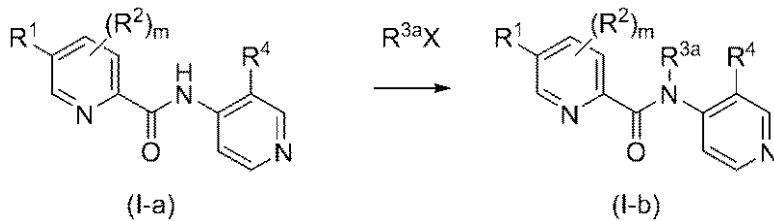
【0025】

製法〔3〕

前記式(I)中、 $R^3$ が以下の $R^{3a}$ である式(I-b)の化合物は、式(I-a)の化合物と、式： $R^{3a}X$ で表される化合物とを、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。

【0026】

【化4】



10

【0027】

(製法〔3〕中、 $R^{3a}$ はアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニル又はアリールカルボニルであり； $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $X$ 及び $m$ 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。

20

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；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；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。

【0028】

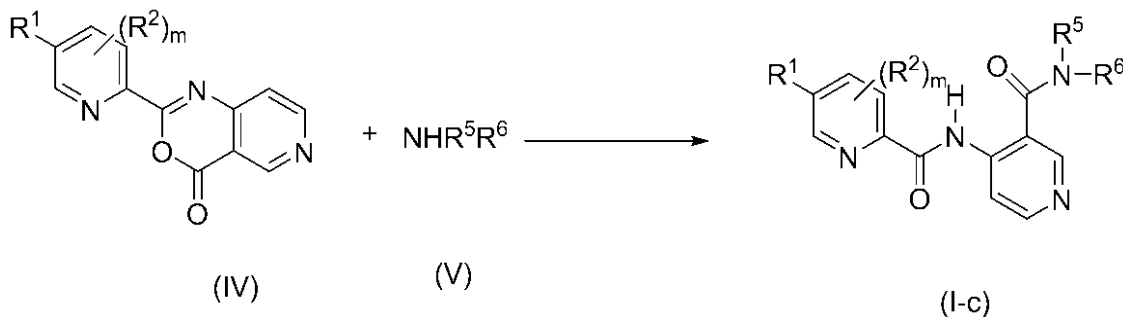
製法〔4〕

前記式(I)中、 $R^3$ がHである式(I-c)の化合物は、式(IV)の化合物と式(V)の化合物を反応させることにより製造することができる。なお、式(IV)の化合物は、後記中間体製法〔2〕の方法にて製造することができる。また、式(V)の化合物は、公知の方法にて製造できる他、市販品を使用することもできる。

30

【0029】

【化5】



40

【0030】

(製法〔4〕中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $m$ は前述のとおりであり、 $R^5$ 及び $R^6$ は各々独立にアルキルである。)

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。溶媒は、反応に不活性な溶

50

媒であればいずれのものでもよく、例えば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；テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、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；ジクロロメタン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；ピリジンのような含窒素芳香族化合物類；メタノール、エタノールなどの低級アルコール類；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。

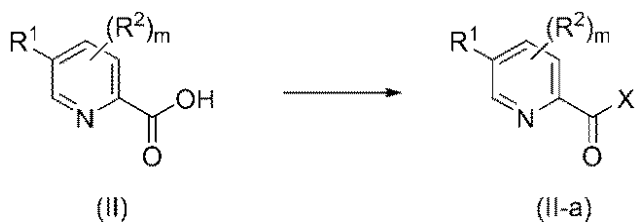
【0031】

中間体製法〔1〕

前記式(II-a)の化合物は、下記のスキームに示した通り、式(II)の化合物を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。

【0032】

【化6】



【0033】

(中間体製法中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X及びmは前述のとおりである。)

ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル、塩化ホスホリル、塩化スルフリル、三塩化リン、五塩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、例えば塩化メチレン、ジクロロエタン、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、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類などから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。

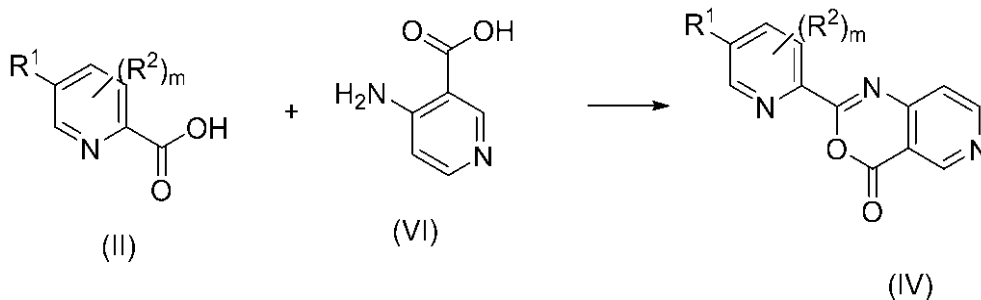
【0034】

中間体製法〔2〕

前記式(IV)の化合物は、下記のスキームに示した通り、式(II)の化合物と式(VI)の化合物を塩化メタンスルホニル、塩基存在下で、カップリング反応を行うことにより、製造できる。

【0035】

【化7】



【0036】

(中間体製法中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びmは前述のとおりである。)

該反応は、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンのような第3級アミン、ピリジンのような複素環式アミンなどが挙げられる。

10

20

30

40

50

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 ~ 48 時間で行うことができる。

#### 【0037】

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、線虫又は土壌害虫の防除剤、即ち農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌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。

10

#### 【0038】

本発明化合物は、農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌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、コドリングア、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、リンゴハダニ、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、コナヒョウダニ、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、イネシガラレセンチュウ、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；等の土壌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、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、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、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、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、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤を土壌に処理することによって土壌有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、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。

20

30

#### 【0039】

本発明化合物を含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌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、土壌害虫類等を総合的に防除する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤が挙げられる。

40

#### 【0040】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、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、

50

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、アルキルアリアル硫酸塩、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、アルキルアリアルスルホン酸塩、アリアルスルホン酸塩、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、アルキルアリアルリン酸塩、スチルルアリアルリン酸塩、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アルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリア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アルエーテル、ポリオキシエチレンスチルルアリアルエーテル、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、カボック油、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。

#### 【0041】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤の施用は、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、線虫又は土壌害虫の防除方法、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。

#### 【0042】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌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）、土壌施用（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。

#### 【0043】

また、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤

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、殺土壌害虫剤、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壌害虫用組成物は、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、両者を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壌害虫用組成物も含まれる。

10

## 【0044】

上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌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)、ジクロロホス (dichlorvos)、フェナミホス (fenamiphos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、E P N、ダイアジノン (diazinon)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos methyl)、アセフェート (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 (dislufoton)、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 (quinalphos)、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)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、プロパホス (propaphos)、ホサロン (phosalone)、ホルモチオン (formothion)、馬拉チオン (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 (phenthoate)、E S P、アジンホスメチル (azinhos-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-メチル (parathion-methyl)、テルブホス (terbufos)、ホスファミドン (phosphamidon)、ホスメット (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；

20

30

カルバリル (carbaryl)、プロボキスル (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)、エチオフエンカルブ (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)、X M C、フェノチオカルブ (fenothiocarb) のようなカーバメート系化合物；

40

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 (dielldrin) 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；

50

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 (deltamethrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、テフルトリン (tefluthrin)、エトフェンプロックス (ethofenprox)、フルフェンプロックス (flufenprox)、シフルトリン (cyfluthrin)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルバリネート (fluvalinate)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、ラムダシハロトリン (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 (protrifenbute)、ピフェントリン (bifenthrin)、ゼータシペルメトリン (zeta-cypermethrin)、アクリナトリン (acrinathrin)、アルファシペルメトリン (alpha-cypermethrin)、アレスリン (allethrin)、ガンマシハロトリン (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)、ベータシフルトリン (beta-cyfluthrin)、メトフルトリン (metofluthrin)、フェノトリン (phenothrin)、フルメトリン (flumethrin)、デカメトリン (decamethrin) のようなピレスロイド系化合物；

10

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)、ルフエヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、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；

20

メトプレン (methoprene)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、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 (pyriprole) 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；

30

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 (pyridalyl)、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)、スピロメシフェン (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；

40

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 (chlordimeform)、シラフルオフエン (silaflofen)、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 (acequinocyl)、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)、ピフェナゼート (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

50

アミド (flubendiamide)、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)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、メタアルデヒド (metaldehyde)、リアノジン (ryanodine)、ベルブチン (verbutin)、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)、NC - 515、テトラニリプロール (tetraniliprole)、フルララネル (fluralaner)、broflanilide、dicloromezotiaz、fluhexafon、チオキサザフェン (tioxazafen)、DKN - 2601、MSI - 1302、NA - 89、MIE - 1209、ZDI - 2502 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 (ivermectin)、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。

#### 【0045】

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-メチルペリジニル-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)、ピテルタノール (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)、オキシボ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)、イプコナゾール (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 (polycarbamate)、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；

10

20

30

40

50

フサライド (fthalide)、クロロタロニル (chlorothalonil)、キントゼン (quintozene) 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；

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

10

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 - ベンジル O、O - ジイソプロピルホスホロチオエート、O - エチル 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ヒ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；

20

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；

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

ペンチオピラド (penthioopyrad)、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；

30

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) のようなカルピノール系化合物；

フェンプロピジン (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；

40

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；

フルジオキサニル (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

50

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；

ファミキサドン (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) のようなヒ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ンアミド系化合物；

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)、ポリオキシシン (polyoxins) のような抗生物質；

イミノクタジン (iminocladine)、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 (テブフロキン (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-イルデン)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)、ピロキノロン (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) クロロピクリン (chloropicrin)、ダゾメット (dazomet)、メタムナトリウム塩 (metam sodium)、ニコピフェン (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 アミブロードール (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)、メプチルジノキャップ (meptyldinocap)、スピロキサミン (spiroxamine)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)、マンDESTロビン (mandestrobin)、ZF-9646、BCF-051、BCM-061、BCM-062等が挙げられる。

#### 【 0 0 4 6 】

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、例えば、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。

#### 【 0 0 4 7 】

次に、本発明の N - ( 4 - ピリジル ) ピコリンアミド化合物又はその塩の望ましい実施形態のいくつかを例示するが、これらは本発明を限定するものではない。

#### 【 0 0 4 8 】

( 1 ) 前記式 ( I ) の N - ( 4 - ピリジル ) ピコリンアミド化合物又はその塩。

( 2 )  $R^1$  がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルコキシハロアルキルである ( 1 ) に記載の化合物又はその塩。

( 3 )  $R^1$  がハロアルキルである ( 2 ) に記載の化合物又はその塩。

#### 【 0 0 4 9 】

( 4 )  $R^2$  がハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロ

10

20

30

40

50

アルコキシ、アルコキシアルキル、アルケニルオキシアルキル、アルキニルオキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル又はアルコキシハロアルキルである(1)又は(2)に記載の化合物又はその塩。

(5)  $R^2$ がハロゲン原子、アルコキシ又はハロアルコキシである(4)に記載の化合物又はその塩。

(6)  $R^2$ がハロゲン原子である(5)に記載の化合物又はその塩。

【0050】

(7)  $R^3$ が水素原子、アルキル又はアルキルカルボニルである(1)~(6)に記載の化合物又はその塩。

(8)  $R^3$ が水素原子又はアルキルカルボニルである(7)に記載の化合物又はその塩。

【0051】

(9)  $m$ が0、1又は2である(1)~(8)に記載の化合物又はその塩。

(10)  $m$ が0又は1である(9)に記載の化合物又はその塩。

(11)  $m$ が0である(1)~(3)及び(7)~(8)に記載の化合物又はその塩。

【0052】

(12)  $R^4$ がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルである(1)~(11)に記載の化合物又はその塩。

(13)  $R^4$ がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル又はアルコキシカルボニルである(12)に記載の化合物又はその塩。

(14)  $R^4$ がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルコキシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルである(12)に記載の化合物又はその塩。

(15)  $R^4$ がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルコキシカルボニルである(14)に記載の化合物又はその塩。

(16)  $R^4$ がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルである(14)に記載の化合物又はその塩。

(17)  $R^4$ がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルコキシ又はアルコキシカルボニルである(16)に記載の化合物又はその塩。

【0053】

(18)  $R^4$ がハロゲン原子、メルカプト、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシルアルキル、ホルミル、カルボキシル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルカルボニルオキシ又はアルキルカルボニルチオである(1)~(17)に記載の化合物又はその塩。

10

20

30

40

50

## 【 0 0 5 4 】

( 1 9 )  $R^1$  がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルコキシハロアルキルであり； $R^2$  がハロゲン原子、アルコキシ又はハロアルコキシであり； $R^3$  が水素原子、アルキル又はアルキルカルボニルであり； $R^4$  がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルであり； $m$  が 0、1 又は 2 である ( 1 ) に記載の化合物又はその塩。

10

( 2 0 )  $R^1$  がアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はアルコキシハロアルキルであり； $R^2$  がハロゲン原子、アルコキシ又はハロアルコキシであり； $R^3$  が水素原子、アルキル又はアルキルカルボニルであり； $R^4$  がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルキルチオ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル又はアルコキシカルボニルであり； $m$  が 0、1 又は 2 である ( 1 9 ) に記載の化合物又はその塩。

( 2 1 )  $R^3$  が水素原子又はアルキルカルボニルであり； $R^4$  がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルコキシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルである ( 1 9 ) に記載の化合物又はその塩。

20

( 2 2 )  $R^3$  が水素原子又はアルキルカルボニルであり； $R^4$  がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル又はアルコキシカルボニルである ( 2 1 ) に記載の化合物又はその塩。

( 2 3 )  $R^1$  がハロアルキルであり； $R^2$  がハロゲン原子であり； $R^3$  が水素原子又はアルキルカルボニルであり； $R^4$  がハロゲン原子、ニトロ、アルキル、アルコキシカルボニル又はジアルキルアミノカルボニルであり； $m$  が 0 又は 1 である ( 2 1 ) に記載の化合物又はその塩。

( 2 4 )  $R^1$  がハロアルキルであり； $R^2$  がハロゲン原子であり； $R^3$  が水素原子又はアルキルカルボニルであり； $R^4$  がハロゲン原子、ニトロ、アルキル又はアルコキシカルボニルであり； $m$  が 0 又は 1 である ( 2 3 ) に記載の化合物又はその塩。

30

## 【 0 0 5 5 】

( 2 5 ) ( 1 ) ~ ( 2 4 ) 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。

( 2 6 ) ( 1 ) ~ ( 2 4 ) 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、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤。

( 2 7 ) ( 1 ) ~ ( 2 4 ) 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。

( 2 8 ) ( 1 ) ~ ( 2 4 ) 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。

40

## 【 実施例 】

## 【 0 0 5 6 】

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。

## 【 0 0 5 7 】

## 合成例 1

N - ( 3 - プロモピリジン - 4 - イル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピコリンアミド ( 化合物 No . I - 3 ) の合成

5 - ( トリフルオロメチル ) ピコリノイルクロリド ( 1 . 1 g 、 5 . 2 m m o l ) 、 4

50

- アミノ - 3 - プロモピリジン ( 0 . 9 g 、 5 . 2 m m o l ) 、 ジイソプロピルエチルアミン ( 2 . 7 m L 、 1 5 . 7 m m o l ) をテトラヒドロフラン ( 1 7 m L ) に溶解させ 6 0 で 1 時間攪拌した。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、目的物 ( 1 . 2 g 、 収率 6 6 % ) を得た。

【 0 0 5 8 】

合成例 2

N - アセチル - N - ( 3 - プロモピリジン - 4 - イル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピコリンアミド ( 化合物 No . I - 2 9 ) の合成

6 0 % 水素化ナトリウム ( 1 3 0 m g 、 3 . 2 m m o l ) を懸濁させたテトラヒドロフラン ( 1 0 m L ) の溶液中に N - ( 3 - プロモピリジン - 4 - イル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピコリンアミド ( 化合物 No . 1 - 3 ) ( 1 . 0 g 、 2 . 9 m m o l ) を加え、室温で 3 0 分間攪拌した後、塩化アセチル ( 2 7 0 m g 、 3 . 5 m m o l ) を加え 1 時間加熱還流した。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。残渣をフラッシュクロマトグラフィー ( 溶離液 : n - ヘプタン / 酢酸エチル ) で精製し、目的物 ( 4 6 0 m g 、 収率 4 1 % ) を得た。

10

【 0 0 5 9 】

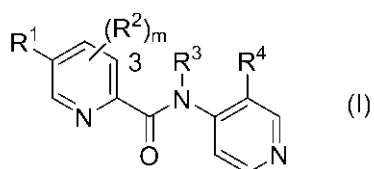
次に、本発明に係る式 ( I ) の化合物の代表例を第 1 表に挙げる。また、これらの化合物は、前記合成例或いは前記した種々の製造方法に基づいて合成することができる。第 1 表中、物性欄に記載の数値は融点 ( ) を示し、融点が記載されていない化合物についてはそれらの <sup>1</sup>H-NMR スペクトルデータを第 2 表に挙げる。尚、第 1 表中の No. は化合物番号を示す。また、表中、Me はメチル基を、Et はエチル基を、n-Pr はノルマルプロピル基を、i-Pr はイソプロピル基を、i-Bu はイソブチル基を、Ac はアセチル基を表す。

20

【 0 0 6 0 】

【表 1】

式 (I) :



第 1 表

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性
I-1	CF <sub>3</sub>	-	0	H	F	144.0
I-2	CF <sub>3</sub>	-	0	H	Cl	130.9
I-3	CF <sub>3</sub>	-	0	H	Br	108.8
I-4	CF <sub>3</sub>	-	0	H	I	177.2
I-5	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	F	94.0
I-6	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	Cl	126.9
I-7	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	Br	118.6
I-8	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	I	135.8
I-9	CF <sub>3</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Me	135.7
I-10	CF <sub>3</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Et	165.0
I-11	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-12	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-13	CF <sub>3</sub>	-	0	H	NO <sub>2</sub>	181.8
I-14	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	NO <sub>2</sub>	
I-15	CF <sub>3</sub>	-	0	H	Me	145.1
I-16	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	Me	
I-17	CF <sub>3</sub>	-	0	H	OMe	128.3
I-18	CF <sub>3</sub>	-	0	H	OEt	119.4
I-19	CF <sub>3</sub>	-	0	H	O(n-Pr)	116.6
I-20	CF <sub>3</sub>	-	0	H	O(i-Pr)	
I-21	CF <sub>3</sub>	-	0	H	O(i-Bu)	
I-22	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	OMe	
I-23	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	OEt	
I-24	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	O(n-Pr)	
I-25	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	O(i-Pr)	
I-26	CF <sub>3</sub>	3-Cl	1	H	O(i-Bu)	
I-27	CF <sub>3</sub>	-	0	Ac	F	
I-28	CF <sub>3</sub>	-	0	Ac	Cl	
I-29	CF <sub>3</sub>	-	0	Ac	Br	105.0
I-30	CF <sub>3</sub>	-	0	Ac	I	

10

20

30

40

【 0 0 6 1 】

【表 2】

第1表続き						
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性
I-31	CF <sub>3</sub>	—	0	Ac	Me	
I-32	CF <sub>3</sub>	—	0	Ac	CO <sub>2</sub> Me	
I-33	CF <sub>3</sub>	—	0	H	SMe	114.7
I-34	CF <sub>3</sub>	—	0	H	SOMe	
I-35	CF <sub>3</sub>	—	0	H	SO <sub>2</sub> Me	
I-36	CF <sub>3</sub>	—	0	H	SEt	87.1
I-37	CF <sub>3</sub>	—	0	H	SOEt	
I-38	CF <sub>3</sub>	—	0	H	SO <sub>2</sub> Et	>250
I-39	CF <sub>3</sub>	—	0	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	197.2
I-40	CF <sub>3</sub>	6-OMe	1	H	Cl	
I-41	CF <sub>3</sub>	6-OMe	1	H	Br	
I-42	CF <sub>3</sub>	6-OMe	1	H	Me	
I-43	CF <sub>3</sub>	6-OMe	1	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-44	CF <sub>3</sub>	6-OMe	1	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-45	CF <sub>3</sub>	6-OMe	1	H	OMe	
I-46	CF <sub>3</sub>	6-OMe	1	H	OEt	
I-47	CF <sub>3</sub>	6-OEt	1	H	Cl	
I-48	CF <sub>3</sub>	6-OEt	1	H	Br	
I-49	CF <sub>3</sub>	6-OEt	1	H	Me	
I-50	CF <sub>3</sub>	6-OEt	1	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-51	CF <sub>3</sub>	6-OEt	1	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-52	CF <sub>3</sub>	6-OEt	1	H	OMe	
I-53	CF <sub>3</sub>	6-OEt	1	H	OEt	
I-54	CF <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	H	Cl	
I-55	CF <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	H	Br	
I-56	CF <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	H	Me	
I-57	CF <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-58	CF <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-59	CF <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	H	OMe	
I-60	CF <sub>3</sub>	6-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	H	OEt	
I-61	CF <sub>3</sub>	3-Cl, 6-Cl	2	H	Cl	
I-62	CF <sub>3</sub>	3-Cl, 6-Cl	2	H	Br	
I-63	CF <sub>3</sub>	3-Cl, 6-Cl	2	H	Me	
I-64	CF <sub>3</sub>	3-Cl, 6-Cl	2	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-65	CF <sub>3</sub>	3-Cl, 6-Cl	2	H	CO <sub>2</sub> Et	

10

20

30

40

【 0 0 6 2 】

【表 3】

第1表続き						
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性
I-66	CF <sub>3</sub>	3-Cl, 6-Cl	2	H	OMe	
I-67	CF <sub>3</sub>	3-Cl, 6-Cl	2	H	OEt	
I-68	Me	—	0	H	Cl	
I-69	Me	—	0	H	Br	
I-70	Me	—	0	H	Me	
I-71	Me	—	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-72	Me	—	0	H	CO <sub>2</sub> Et	10
I-73	Me	—	0	H	OMe	
I-74	Me	—	0	H	OEt	
I-75	OMe	—	0	H	Cl	
I-76	OMe	—	0	H	Br	
I-77	OMe	—	0	H	Me	
I-78	OMe	—	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-79	OMe	—	0	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-80	OMe	—	0	H	OMe	20
I-81	OMe	—	0	H	OEt	
I-82	OEt	—	0	H	Cl	
I-83	OEt	—	0	H	Br	
I-84	OEt	—	0	H	Me	
I-85	OEt	—	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-86	OEt	—	0	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-87	OEt	—	0	H	OMe	
I-88	OEt	—	0	H	OEt	
I-89	0(n-Pr)	—	0	H	Cl	
I-90	0(n-Pr)	—	0	H	Br	30
I-91	0(n-Pr)	—	0	H	Me	
I-92	0(n-Pr)	—	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-93	0(n-Pr)	—	0	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-94	0(n-Pr)	—	0	H	OMe	
I-95	0(n-Pr)	—	0	H	OEt	
I-96	0(i-Pr)	—	0	H	Cl	
I-97	0(i-Pr)	—	0	H	Br	
I-98	0(i-Pr)	—	0	H	Me	
I-99	0(i-Pr)	—	0	H	CO <sub>2</sub> Me	40
I-100	0(i-Pr)	—	0	H	CO <sub>2</sub> Et	

【 0 0 6 3 】

【表4】

第1表続き						
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	m	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物性
I-101	O(i-Pr)	-	0	H	OMe	
I-102	O(i-Pr)	-	0	H	OEt	
I-103	O(i-Bu)	-	0	H	Cl	
I-104	O(i-Bu)	-	0	H	Br	
I-105	O(i-Bu)	-	0	H	Me	
I-106	O(i-Bu)	-	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-107	O(i-Bu)	-	0	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-108	O(i-Bu)	-	0	H	OMe	
I-109	O(i-Bu)	-	0	H	OEt	
I-110	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	0	H	Cl	
I-111	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	0	H	Br	
I-112	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	0	H	Me	
I-113	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-114	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-115	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	0	H	OMe	
I-116	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-	0	H	OEt	
I-117	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	Cl	
I-118	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	Br	
I-119	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	Me	
I-120	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-121	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-122	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	OMe	
I-123	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	OEt	
I-124	C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	Cl	
I-125	C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	Br	
I-126	C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	Me	
I-127	C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Me	
I-128	C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	CO <sub>2</sub> Et	
I-129	C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	OMe	
I-130	C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	OEt	
I-131	CF <sub>3</sub>	-	0	H	CON(Me) <sub>2</sub>	117.6
I-132	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	CON(Me) <sub>2</sub>	
I-133	CF <sub>3</sub>	-	0	H	CON(Me)Et	Oil
I-134	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-	0	H	CON(Me)Et	
I-135	CF <sub>3</sub>	-	0	Me	CON(Me) <sub>2</sub>	
I-136	CF <sub>3</sub>	-	0	Ac	CON(Me) <sub>2</sub>	

10

20

30

40

【0064】

【表 5】

第2表	
No	<sup>1</sup> H-NMR δ値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒：CDCl <sub>3</sub>
I-133	1.23 (3H, t), 3.08 (3H, broad s), 3.51 (2H, broad d), 8.37 (1H, d), 8.52 (1H, d), 8.56 (3H, m), 8.94 (1H, s), 11.33 (1H, s)

## 【0065】

## 試験例 1 トビイロウンカに対する効果試験

10

本発明化合物の濃度が200ppm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頭放虫し、管口をガーゼでふたをして25℃の照明付恒温室内に静置した。処理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. I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-7、I-9、I-10、I-17、I-18、I-19、I-29、I-33及びI-36が90%以上の死虫率を示した。

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

## 【0066】

## 試験例 2 タバココナジラミに対する効果試験

20

ポット植えのキュウリ苗にタバココナジラミ成虫を放虫した。1日間産卵させた後、キュウリ苗を取り出して25℃の照明付恒温室内に静置した。7日後、キュウリ苗に寄生している1～2齢幼虫数を調査し、本発明化合物の濃度が200ppm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静置した。処理7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. I-1、I-2、I-3、I-4、I-9、I-10、I-13、I-17、I-18、I-19、I-29、I-33、I-36、I-38、I-131及びI-133が90%以上の防除価を示した。

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

Ta: 処理キュウリ苗における処理後の老齢幼虫数

30

Tb: 処理キュウリ苗における処理前の1～2齢幼虫数

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

## 【0067】

## 試験例 3 モモアカアブラムシに対する効果試験

試験管に水挿ししたダイコン葉上にモモアカアブラムシ成虫を5頭放虫した。1日後に成虫を取り除いた後、ダイコン葉上に寄生している幼虫数を数え、本発明化合物の濃度が200ppmとなるように調製した薬液に浸漬処理した。薬液が風乾した後に、25℃の照明付恒温室内に静置した。処理5日後にモモアカアブラムシの生死を判定し、下記の計算式により死虫率を求めた。尚、離脱虫及び異常虫は死亡虫とみなした。その結果、前記化合物No. I-1、I-2、I-3、I-4、I-9、I-10、I-13、I-17、I-18、I-19、I-29、I-33、I-36、I-39、I-131及びI-133が90%以上の死虫率を示した。

40

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

## 【0068】

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

50

- (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。

【0069】

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。

10

【0070】

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。

【0071】

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アルサルフェート 5重量部  
 (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。

20

【0072】

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  
 (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。

30

【0073】

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。

40

【0074】

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。

【0075】

50

## 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
  - ( 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		テーマコード(参考)
<b>A 0 1 P 7/04 (2006.01)</b>	A 0 1 P	7/04	
<b>A 0 1 P 5/00 (2006.01)</b>	A 0 1 P	5/00	
<b>A 0 1 N 43/40 (2006.01)</b>	A 0 1 N	43/40	1 0 1 J

Fターム(参考)	4C055	AA01	BA01	BA02	BA03	BA39	BA42	BA58	BB02	BB07	BB08	
			BB09	BB10	BB11	CA02	CA03	CA06	CA13	CA16	CA39	CA42
			CA47	CA51	CA57	CA58	CB02	CB07	CB15	DA01	DA53	DB02
			DB07	DB08	DB10	EA01						
	4C086	AA01	AA02	AA03	BC17	GA08	MA01	MA04	NA14	ZB37		
	4H011	AC01	AC04	BA01	BB09	DA02	DA13	DA15	DA16			