

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2015年6月18日(18.06.2015)



(10) 国際公開番号
WO 2015/087458 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 487/04 (2006.01) *A01P 7/02* (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01) *A01P 7/04* (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2013/084176
- (22) 国際出願日: 2013年12月13日(13.12.2013)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (71) 出願人: 住友化学株式会社(SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁目2番1号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 伊藤 舞衣(ITO, Mai); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号住友化学株式会社内 Hyogo (JP). 野倉 吉彦(NOKURA, Yoshihiko); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号住友化学株式会社内 Hyogo (JP). 田邊 貴将(TANABE, Takamasa); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号住友化学株式会社内 Hyogo (JP). 清水 千枝(SHIMIZU, Chie); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号住友化学株式会社内 Hyogo (JP).
- (74) 代理人: 中山 亨, 外(NAKAYAMA, Tohru et al.); 〒5418550 大阪府大阪市中央区北浜四丁目5番33号住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).

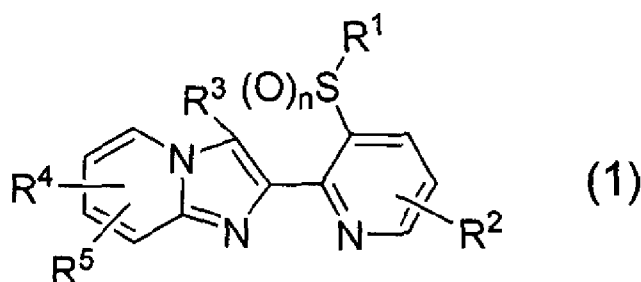
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第21条(3))

(54) Title: FUSED HETEROCYCLIC COMPOUND AND PEST CONTROL APPLICATION THEREOF

(54) 発明の名称: 縮合複素環化合物及びその有害生物防除用途



(57) Abstract: A fused heterocyclic compound represented by formula (1) (In the formula, R¹ is a C1-C4 alkyl group, cyclopropyl group, or cyclopropylmethyl group, R² is a C1-C3 alkyl group, C1-C3 haloalkyl group, -OR⁶, halogen atom, or hydrogen atom, R³ is a C1-C3 alkyl group, halogen atom, or hydrogen atom, R⁴ is a C1-C3 haloalkyl group or -S(O)_mR⁷, R⁵ is a C1-C3 alkyl group, C1-C3 haloalkyl group, -OR⁸, halogen atom, or hydrogen atom, and n is 0, 1, or 2.) or an N-oxide thereof has control efficacy on pests and is useful as an active ingredient for a pest control agent.

(57) 要約: 式(1) [式中、R¹はC1-C4アルキル基、シクロプロピル基又はシクロプロピルメチル基を表し、R²はC1-C3アルキル基、C1-C3ハロアルキル基、-OR⁶、ハロゲン原子又は水素原子を表し、R³はC1-C3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、R⁴はC1-C3ハロアルキル基又は-S(O)_mR⁷を表し、R⁵はC1-C3アルキル基、C1-C3ハロアルキル基、-OR⁸、ハロゲン原子又は水素原子を表し、nは0、1又は2を表す。]で示される縮合複素環化合物、又はそのN-オキシドは、有害生物に対して防除効力を有し、有害生物防除剤の有効成分として有用である。



WO 2015/087458 A1

明細書

発明の名称：縮合複素環化合物及びその有害生物防除用途

5 技術分野

本発明は、ある種の縮合複素環化合物及びその有害生物防除用途に関する。

背景技術

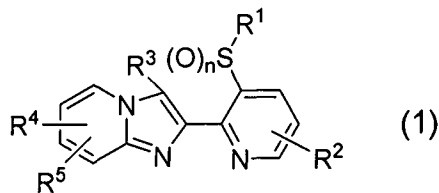
10 種々の縮合複素環化合物が医薬品としての活性を示すことが知られている（例えば *Journal of Medicinal Chemistry*, 8 (3), 305 (1965) 参照）。また、有害生物の防除を目的として、様々な化合物が検討されている（例えば WO 2013/018928 参照）。

発明の概要

15 本発明は、有害生物に対して優れた防除効力を有する化合物及びその化合物を用いる有害生物の防除方法を提供する。

本発明は、以下のものである。

[1] 式 (1)



20 [式中、

R^1 は C1-C4 アルキル基、シクロプロピル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^2 は C1-C3 アルキル基、C1-C3 ハロアルキル基、 $-OR^6$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^3 は C1-C3 アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

25 R^4 は C1-C3 ハロアルキル基又は $-S(O)_m R^7$ を表し、

R^5 は C1-C3 アルキル基、C1-C3 ハロアルキル基、 $-OR^8$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^6 及び R^8 は同一又は相異なり、C 1－C 3アルキル基又はC 1－C 3ハロアルキル基を表し、

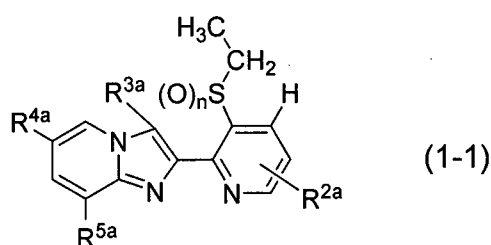
R^7 はC 1－C 3ハロアルキル基を表し、

n は0、1又は2を表し、

5 m は0、1又は2を表す。]

で示される縮合複素環化合物、又はそのN－オキシド（以下、式（1）で示される縮合複素環化合物及びそのN－オキシドを本発明化合物と記す）。

[2] 式（1－1）



10 [式中、

R^{2a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、 $-OR^{6a}$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} はC 1－C 3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

15 R^{5a} はC 1－C 3アルキル基、 $-OR^{8a}$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{6a} 又は R^{8a} は同一又は相異なり、C 1－C 3アルキル基を表し、

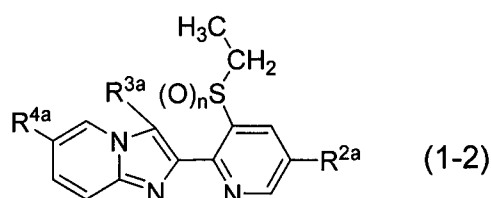
R^{7a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基を表し、

n は0、1又は2を表し、

m は0、1又は2を表す。]

20 で示される化合物、又はそのN－オキシド。

[3] 式（1－2）



[式中、

R^{2a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} はC 1－C 3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

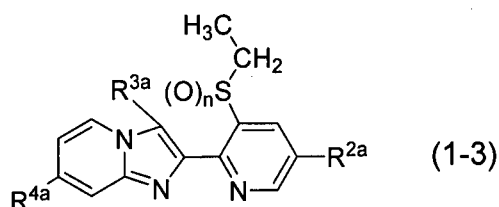
R^{7a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基を表し、

n は0、1又は2を表し、

5 m は0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN－オキシド。

[4] 式(1-3)



[式中、

10 R^{2a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} はC 1－C 3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

R^{7a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基を表し、

n は0、1又は2を表し、

15 m は0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN－オキシド。

[5] R^2 又は R^{2a} が水素原子である[1]～[4]のいずれかに記載の化合物。

[6] R^2 又は R^{2a} がトリフルオロメチル基である[1]～[4]のいずれかに記載の化合物。

20 [7] R^3 又は R^{3a} が水素原子である[1]～[4]のいずれかに記載の化合物。

[8] R^4 又は R^{4a} がトリフルオロメチル基である[1]～[4]のいずれかに記載の化合物。

[9] [1]～[8]のいずれかに記載の化合物と不活性担体とを含有する有害生物防除剤。

25 [10] [1]～[8]いずれかに記載の化合物の有効量を有害生物又はその生息場所に施用する有害生物の防除方法。

発明を実施するための形態

本明細書において、記号で表される基について、具体例を挙げて以下に説明する。

本発明化合物において「C1-C4アルキル基」としては、メチル、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基及びtert-ブチル基が挙げられる。

本発明化合物において「C1-C3ハロアルキル基」の表記は、炭素原子に結合した1個以上の水素原子がハロゲン原子によって置換された炭素原子数が1~3個の直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基を表し、C1-C3ハロアルキル基が2個以上のハロゲン原子を有する場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも異なってもよい。

「C1-C3ハロアルキル基」としては、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブromodifluoromethyl基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基が挙げられる。

本明細書におけるC_a-C_bパーフルオロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が全てフッ素原子によって置換された炭素原子数がa-b個の直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基を表す。

「C1-C3パーフルオロアルキル基」としては、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基が挙げられる。

本発明化合物において「C1-C3アルキル基」としては、メチル、エチル基、プロピル基及びイソプロピル基が挙げられる。

本発明化合物において「ハロゲン原子」とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である。

本発明化合物としては、例えば、以下の化合物が挙げられる。

式(1)において、R¹がC1-C4アルキル基である化合物；

式(1)において、R¹がエチル基、シクロプロピルメチル基又はシクロプロピル基である化合物；

- 式(1)において、 R^1 がエチル基である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がC 1－C 3パーフルオロアルキル基である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がトリフルオロメチル基である化合物；
- 式(1)において、 R^2 が $-OR^8$ である化合物；
- 5 式(1)において、 R^2 がメトキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がエトキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がプルポキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がイソプロポキシ基である化合物；
- 式(1)において、 R^2 がハロゲン原子又は水素原子である化合物；
- 10 式(1)において、 R^2 がフッ素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 が塩素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 が臭素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^2 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^3 がC 1－C 3アルキル基である化合物；
- 15 式(1)において、 R^3 がメチル基である化合物；
- 式(1)において、 R^3 がメチル基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^3 がハロゲン原子又は水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^3 が塩素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^3 が臭素原子である化合物；
- 20 式(1)において、 R^3 が水素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^4 がC 1－C 3パーフルオロアルキル基である化合物；
- 式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチル基である化合物；
- 式(1)において、 R^4 がペンタフルオロエチル基である化合物；
- 式(1)において、 R^4 が $-S(O)_m R^7$ である化合物；
- 25 式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチルスルファニル基である化合物；
- 式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチルスルフィニル基である化合物；
- 式(1)において、 R^4 がトリフルオロメチルスルホニル基である化合物；
- 式(1)において、 R^4 がペンタフルオロエチルスルファニル基である化合物；
- 式(1)において、 R^4 がペンタフルオロエチルスルフィニル基である化合物；

式(1)において、 R^4 がペンタフルオロエチルスルホニル基である化合物；

式(1)において、 R^5 がC1-C3アルキル基である化合物；

式(1)において、 R^5 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^5 が $-OR^8$ である化合物；

5 式(1)において、 R^5 がメトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^5 がエトキシ基である化合物；

式(1)において、 R^5 がプルポキシ基である化合物；

式(1)において、 R^5 がイソプロポキシ基である化合物；

式(1)において、 R^5 がハロゲン原子又は水素原子である化合物；

10 式(1)において、 R^5 がフッ素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が塩素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が臭素原子である化合物；

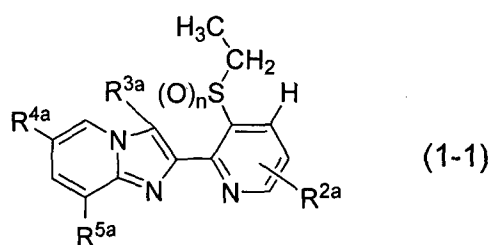
式(1)において、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 n が0である化合物；

15 式(1)において、 n が1である化合物；

式(1)において、 n が2である化合物；

式(1-1)



[式中、

20 R^{2a} はC1-C3パーフルオロアルキル基、 $-OR^{6a}$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} はC1-C3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC1-C3パーフルオロアルキル基、又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

R^{5a} はC1-C3アルキル基、 $-OR^{8a}$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

25 R^{6a} 又は R^{8a} は同一又は相異なり、C1-C3アルキル基を表し、

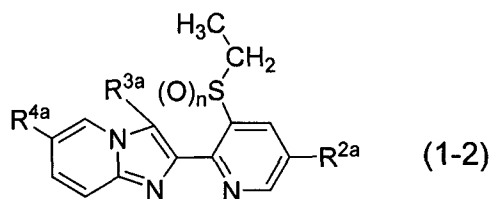
R^{7a} はC1-C3パーフルオロアルキル基を表し、

nは0、1又は2を表し、

mは0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

式(1-2)



[式中、

R^{2a} はC1-C3パーフルオロアルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} はC1-C3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC1-C3パーフルオロアルキル基、又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

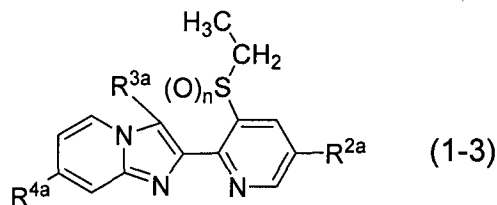
10 R^{7a} はC1-C3パーフルオロアルキル基を表し、

nは0、1又は2を表し、

mは0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

式(1-3)



[式中、

R^{2a} はC1-C3パーフルオロアルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} はC1-C3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC1-C3パーフルオロアルキル基、又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

20 R^{7a} はC1-C3パーフルオロアルキル基を表し、

nは0、1又は2を表し、

mは0、1又は2を表す。]

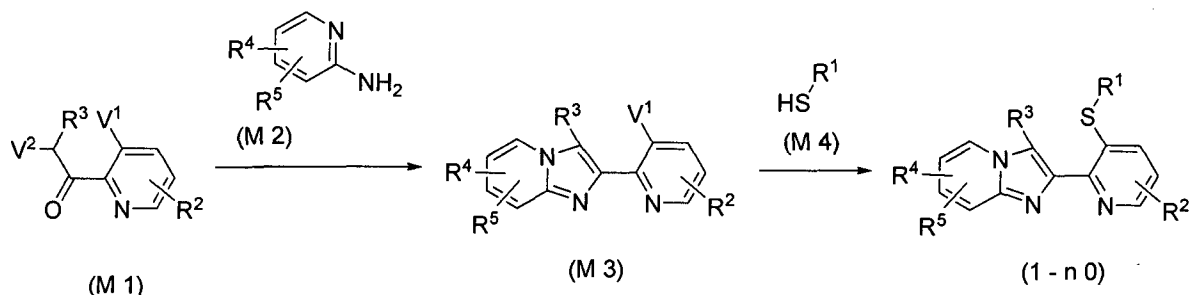
で示される化合物、又はそのN-オキシド。

次に、本発明化合物の製造法について説明する。

本発明化合物及び中間体化合物は、例えば、以下の（製造法１）～（製造法１０）により製造することができる。

（製造法１）

式（１）において n が 0 である本発明化合物（１－ n ０）は、下記のスキームに従って製造することができる。



[式中、 V^1 はハロゲン原子を表し、 V^2 は塩素原子又は臭素原子を表し、その他の記号は式（１）と同じ意味を表す。]

中間体化合物（M3）は、中間体化合物（M1）と化合物（M2）とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、中間体化合物（M1）が塩酸塩又は臭化水素酸塩であるものを使用することもできる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタ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（以下、THFと記す）、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、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（以下、DMFと記す）、*N*-メチルピロリドン（以下、NMPと記す）、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン（以下、DMIと記す）、ジメチルスルホキシド（以下、DMSOと記す）等の非プロトン性極性溶媒、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要であれば塩基の存在下で行うこともできる。塩基としては、例えば炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、及びトリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（M1）１モルに対して、化合物（M2）が通常１～２モルの割合、塩基が通常１～５モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0～150℃の範囲内である。反応時間は、通常0.1～24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M3)を単離することができる。単離された中間体化合物(M3)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

nが0である本発明化合物(1-n0)は、中間体化合物(M3)と化合物(M4)とを塩基の存在下に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、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、及び水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M3)1モルに対して、化合物(M4)が通常1～10モルの割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

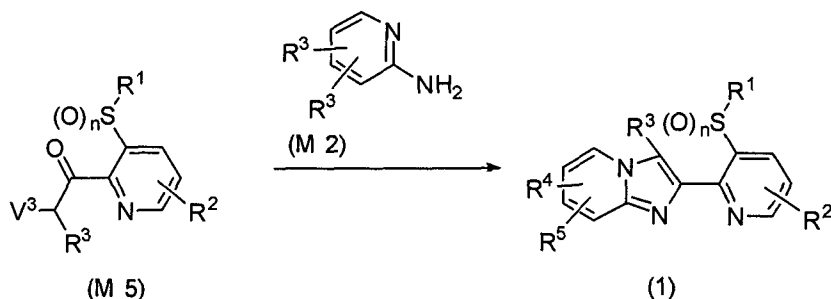
反応温度は、通常-50～100℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、nが0である本発明化合物(1-n0)を単離することができる。単離されたnが0である本発明化合物(1-n0)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

該反応においてV¹としては、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

(製造法2)

本発明化合物(1)は、中間体化合物(M5)と化合物(M2)とを反応させることにより製造することができる。



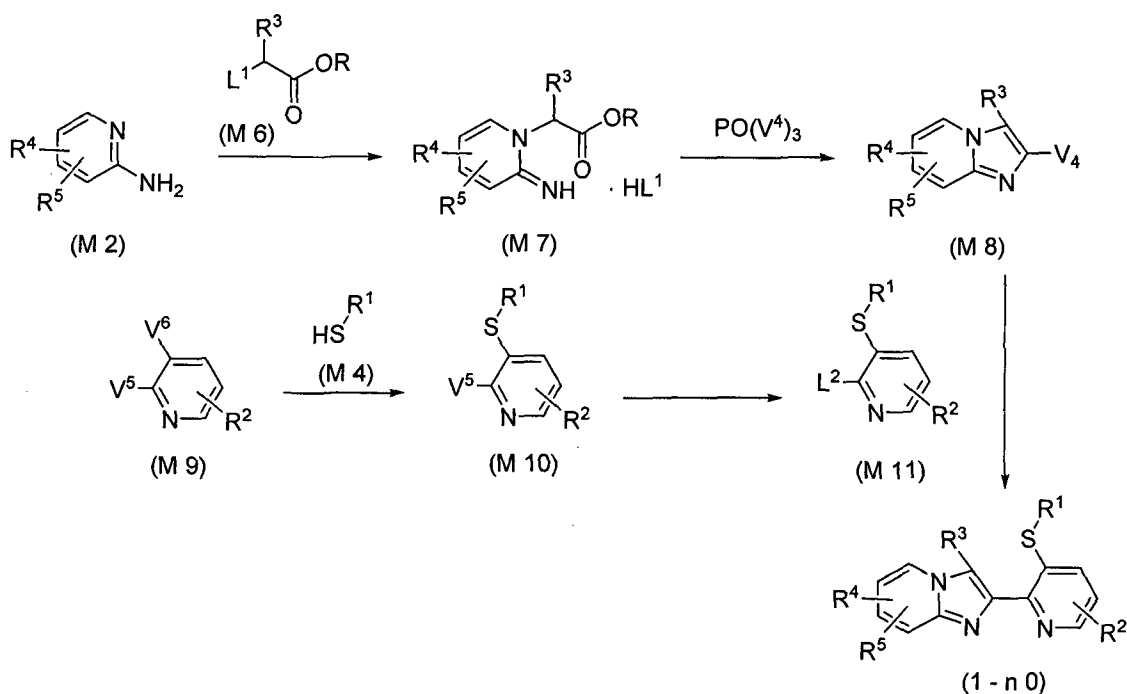
[式中、 V^3 は塩素原子又は臭素原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、化合物(M5)が塩酸塩又は臭化水素酸塩であるものを使用することもできる。

- 5 中間体化合物(M1)に代えて中間体化合物(M5)を用い、製造法1の方法に準じて、本発明化合物(1)を製造することができる。

(製造法3)

式(1)においてnが0である本発明化合物(1-n0)は、下記のスキームに従って製造することができる。



10

[式中、Rはメチル基又はエチル基を表し、 L^1 は塩素原子又は臭素原子を表し、 L^2 は $B(OH)_2$ 基、 $B(OR^f)_2$ 基(式中、2つの R^f は互いに結合して $-C(CH_3)_2C(CH_3)_2-$ 基を形成する。)又はトリオールボレート塩を表し、 V^4 は塩素原子又は臭素原子を表し、 V^5 は臭素原子又はヨウ素原子を表し、 V^6 はフッ素原子、塩素原子又は臭素原子等のハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

15

中間体化合物(M7)は、化合物(M2)と化合物(M6)とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒中、又は溶媒の非存在下で行われる。溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、t e

tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、化合物 (M2) 1 モルに対して、化合物 (M6) が通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

- 5 反応温度は、通常 0 ~ 200 °C の範囲内である。反応時間は、通常 0.1 ~ 24 時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物 (M7) を単離することができる。単離された中間体化合物 (M7) は、再結晶等によりさらに精製することもできる。

- 10 中間体化合物 (M8) は、中間体化合物 (M7) とオキシ塩化りん又はオキシ臭化りんを反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒中、又は溶媒の非存在下で行われる。溶媒としては、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 15 該反応には、中間体化合物 (M7) 1 モルに対して、オキシ塩化りん又はオキシ臭化りんが通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常 60 ~ 120 °C の範囲内である。反応時間は、通常 0.1 ~ 24 時間の範囲内である。

- 20 反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物 (M8) を単離することができる。単離された中間体化合物 (M8) は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

- 25 中間体化合物 (M10) は、化合物 (M9) と化合物 (M4) 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。塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、及びトリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素

類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMI、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、化合物(M9) 1モルに対して、化合物(M4)が通常0.8~1.2モルの割合、塩基が通常0.8~1.2モルの割合で用いられる。

- 5 反応温度は、通常0~100℃の範囲内である。反応時間は、通常0.1~24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M10)を単離することができる。中間体化合物(M10)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

- 10 該反応においてV⁶としては、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

- L²がB(OH)₂基、あるいは、B(OR^f)₂基(式中、2つのR^fが結合して-C(CH₃)₂-C(CH₃)₂-基を形成する。)である中間体化合物(M11)は中間体化合物(M10)をアルキルリチウム化合物と反応させた後に生成する反応中間体とイソプロポキシボロン酸ピナコールエステルとを反応させるか、あるいは、生成する反応中
15 間体とホウ酸トリアルキルとを反応させた後、加水分解することにより製造することができる。アルキルリチウム化合物としては、例えば、ブチルリチウム(n-, s e c-又はt e r t-)が挙げられる。ホウ酸トリアルキルとしては、例えばホウ酸トリメチル、ホウ酸トリエチル及びホウ酸トリイソピロピルが挙げられる。

- 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジエチルエーテル、THF、
20 エチレングリコールジメチルエーテル、t e r t-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M10) 1モルに対して、アルキルリチウム化合物が通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

- 25 該反応には、中間体化合物(M10) 1モルに対して、イソプロポキシボロン酸ピナコールエステル又はホウ酸トリアルキルが通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

中間体化合物(M10)とアルキルリチウム化合物との反応における反応温度は、通常-78~20℃の範囲内であり、反応時間は、通常0.1~12時間の範囲内である。

該反応中間体とイソプロポキシボロン酸ピナコールエステル又はホウ酸トリアルキルの反応における反応温度は、通常 -78°C から 40°C の範囲内であり、反応時間は、通常0.1時間から24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M11)を単離することができる。単離された中間体化合物(M11)は、再結晶、クロマトグラフィー等によりさらに精製することもできる。

L^2 が $\text{B}(\text{OR}^f)_2$ 基(式中、2つの R^f は互いに結合して $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 基を形成する。)である中間体化合物(M11)は中間体化合物(M10)とビス(ピナコレート)ジボロンとを触媒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。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、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム塩化メチレン錯体、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)等のパラジウム触媒が挙げられる。塩基としては、例えば、酢酸カリウムが挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて、触媒のための配位子を加えることもできる。配位子としては、例えばトリシクロヘキシルホスフィンが挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M10)1モルに対して、ビス(ピナコレート)ジボロンが通常1~2モルの割合、パラジウム触媒が0.0001から0.1モルの割合、配位子が0.0002から0.2モルの割合、塩基が通常1~5モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常 $50\sim 120^{\circ}\text{C}$ の範囲内である。反応時間は、通常0.1~24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M11)を単離することができる。単離された中間体化合物(M11)は、再結晶、クロマトグラフィー等によりさらに精製することもできる。

L^2 がトリオールボレート塩である中間体化合物(M11)は、中間体化合物(M10)とアルキルリチウム化合物とを反応させた後に生成する反応中間体とホウ酸トリアルキルとを反応させて得られる有機トリアルコキシボレートにトリオールを反応させること

により製造することができる。

反応に用いられるアルキルリチウム化合物としては、例えば、ブチルリチウム（*n*-、*sec*-または*tert*-）が挙げられる。反応に用いられるホウ酸トリアルキルとしては、例えば、ホウ酸トリメチル、ホウ酸トリイソピロピルが挙げられる。反応に用いられるトリオールとしては、例えば、トリス（ヒドロキシメチル）エタンが挙げられる。

これらの反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（M10）1モルに対して、アルキルリチウム化合物が通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

該反応には、中間体化合物（M10）1モルに対して、ホウ酸トリアルキルが通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

該反応には、中間体化合物（M10）1モルに対して、トリオールが通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

中間体化合物（M10）とアルキルリチウム化合物との反応における反応温度は、通常-78~20℃の範囲内であり、反応時間は、通常0.1~12時間の範囲内である。

反応中間体とホウ酸トリアルキルとの反応における反応温度は、通常-78℃から40℃の範囲内であり、反応時間は、通常0.1時間から24時間の範囲内である。

有機トリアルコキシボレートとトリオールとの反応における反応温度は、通常-20℃から40℃の範囲内であり、反応時間は、通常0.1時間から24時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を濃縮することにより、中間体化合物（M11）を単離することができる。

式（1）において*n*が0である本発明化合物（1-*n*0）は、中間体化合物（M8）と中間体化合物（M11）とを触媒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。L²がB（OH）₂基又はB（OR'）₂基（式中、2つのR'が結合して-C（CH₃）₂-C（CH₃）₂-基を形成する）である中間体化合物（M11）を用いる場合は塩基の存在下で反応が行われる。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、[1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン]ジクロロパラジウム塩化メチレン錯体、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）、酢

酸パラジウム等のパラジウム触媒が挙げられる。塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウム *tert*-ブトキシド、リン酸カリウム等の無機塩基類、及び酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の有機酸塩類が挙げられる。

- 5 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF等の非プロトン性極性溶媒、水及びこれらの混合物が挙げられる。

- 10 該反応は必要に応じて、触媒のための配位子を加えることもできる。配位子としては、例えばトリシクロヘキシルホスフィン、トリフェニルホスフィン、X-Phos（2-ジシクロヘキシルホスフィノー-2', 4', 6'-トリイソプロピルビフェニル、John Phos（（2-ビフェニル）ジ-*tert*-ブチルホスフィン）が挙げられる。

該反応は必要に応じて、ヨウ化銅（I）を加えることもできる。

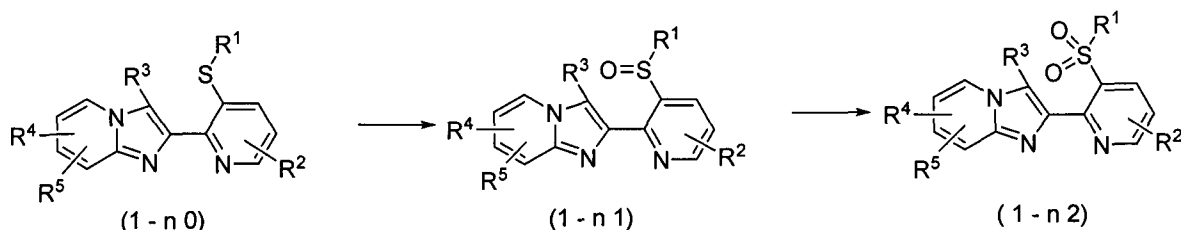
- 15 該反応には、中間体化合物（M9）1モルに対して、中間体化合物（M13）が通常1～3モルの割合、パラジウム触媒が0. 0001から0. 1モルの割合、配位子が0. 0002から0. 2モルの割合、ヨウ化銅（I）が0. 01から0. 4モルの割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常50～150℃の範囲内である。反応時間は、通常0. 1～24時間の範囲内である。

- 20 反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1-n0）を単離することができる。単離された本発明化合物（1-n0）は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

（製造法4）

- 25 式（1）においてnが1又は2である本発明化合物は、nが0である本発明化合物を酸化することにより製造することができる。



[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

式(1)において n が1である本発明化合物(1-n 1)は、 n が0である本発明化合物(1-n 0)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。酸化剤としては、例えば過ヨウ素酸ナトリウム及び m -クロロ過安息香酸が挙げられる。

5 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、本発明化合物(1-n 0) 1モルに対して、酸化剤が通常1~3モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物(1-n 0) 1モルに対して、酸化剤が1~
10 1. 2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常-50~50℃の範囲内である。反応時間は通常0. 1~12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)
15 の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-n 1)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-n 1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

式(1)において n が2である本発明化合物(1-n 2)は、 n が1である本発明化合物(1-n 1)と酸化剤とを反応させることにより製造できる。酸化剤としては、例えば
20 m -クロロ過安息香酸、過酸化水素水又はオキシソ(ペルオキシ)硫酸カリウム、イーアイデュポン社登録商標)が挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙
25 げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム及びタングステン酸カリウムが挙げられる。

該反応には、本発明化合物(1-n 1) 1モルに対して、酸化剤が通常1~4モルの割合、触媒が通常0. 01~0. 5モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物

(1-n 1) 1モルに対して、酸化剤が1～2モルの割合、触媒が0.05～0.2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常-50～100℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

5 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1-n 2）を単離することができる。本発明化合物（1-n 2）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

10 また、式（1）においてnが2である本発明化合物（1-n 2）は、nが0である本発明化合物（1-n 0）と酸化剤とを反応させることにより一段階反応（ワンポット）で製造することができる。酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸、過酸化水素水及びオキシソ（ペルオキシ-硫酸カリウム、イーアイデュポン社登録商標）が挙げられる。

15 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム及びタングステン酸カリウムが挙げられる。

20 該反応には、本発明化合物（1-n 0）1モルに対して、酸化剤が通常2～5モルの割合、触媒が通常0.01～0.5モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物（1-n 0）1モルに対して、酸化剤が2～3モルの割合、触媒が0.05～0.2モルの割合で用いられる。

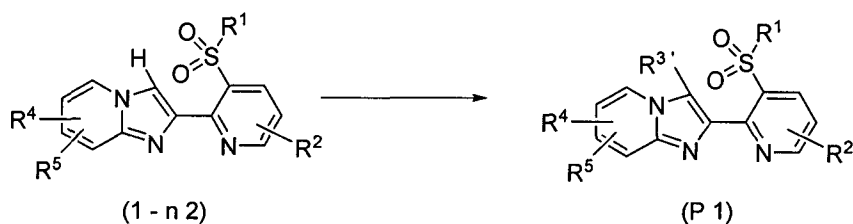
25 反応温度は、通常0～120℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1-n 2）を単離することができる。単離された本発明化合物（1-n 2）は、クロマトグ

ラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造法5)

式(1)において R^3 が塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である本発明化合物(P1)は、式(1)において n が2である本発明化合物(1-n2)とハロゲン化剤とを反応させることにより製造することができる。



[式中、 $R^{3'}$ は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

ハロゲン化剤としては、例えば塩素、臭素、ヨウ素、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド及びハロニウム塩が挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

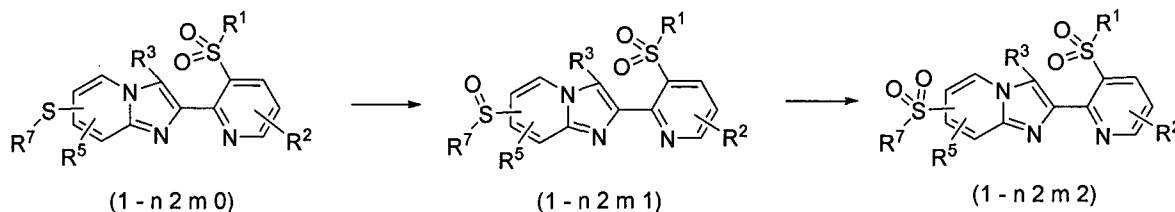
該反応には、本発明化合物(1-n2)1モルに対して、ハロゲン化剤が通常1~2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0~150℃の範囲内である。反応時間は、通常0.1~24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(P1)を単離することができる。単離された本発明化合物(P1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造例6)

式(1)において R^4 が $-S(O)_mR^7$ であり、 n が2であり、 m が1又は2である本発明化合物(1-n2m1)又は本発明化合物(1-n2m2)は、 R^4 が $-S(O)_mR^7$ であり、 n が2であり、 m が0である本発明化合物(1-n2m0)を酸化することにより製造することができる。



[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

式(1)においてR⁴が-S(O)_mR⁷であり、nが2であり、mが1である本発明化合物(1-n2m1)は、R⁴が-S(O)_mR⁷であり、nが2であり、mが0である本発明化合物(1-n2m0)を酸化剤と反応させることにより製造することができる。酸化剤としては、例えば過ヨウ素酸ナトリウム、m-クロロ過安息香酸、過酸化水素水及びオキシソ(ペルオキシ-硫酸カリウム、イーアイデュポン社登録商標)が挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム及びタングステン酸カリウムが挙げられる。

該反応には、本発明化合物(1-n2m0)1モルに対して、酸化剤が通常1~3モルの割合、触媒が通常0.01~0.5モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物(1-n2m0)1モルに対して、酸化剤が1~1.2モルの割合、触媒が0.05~0.2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常-50~100℃の範囲内である。反応時間は通常0.1~12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-n2m1)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-n2m1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

式(1)においてR⁴が-S(O)_mR⁷であり、nが2であり、mが2である本発明化合物(1-n2m2)は、R⁴が-S(O)_mR⁷であり、nが2であり、mが1であ

る本発明化合物（ $1-n2m1$ ）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。酸化剤としては、例えば m -クロロ過安息香酸、過酸化水素水及びオキシソ（ペルオキシ）硫酸カリウム、登録商標）が挙げられる。

5 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム又はタングステン酸カリウムが挙げられる。

10 該反応には、本発明化合物（ $1-n2m1$ ）1モルに対して、酸化剤が通常1～4モルの割合、触媒が通常0.01～0.5モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物（ $1-n2m1$ ）1モルに対して、酸化剤が1～2モルの割合、触媒が0.05～0.2モルの割合で用いられる。

15 反応温度は、通常 $-50\sim100^{\circ}\text{C}$ の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（ $1-n2m2$ ）を単離することができる。本発明化合物（ $1-n2m2$ ）は、クロマトグラ
20 フィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

また、式（1）において R^4 が $-S(O)_mR^7$ であり、 n が2であり、 m が2である本発明化合物（ $1-n2m2$ ）は、 R^4 が $-S(O)_mR^7$ であり、 n が2であり、 m が0である本発明化合物（ $1-n2m0$ ）と酸化剤とを反応させることにより一段階反応（ワンポット）で製造することができる。酸化剤としては、例えば m -クロロ過安息香
25 酸、過酸化水素水及びオキシソ（ペルオキシ）硫酸カリウム、イーアイデュポン社登録商標）が挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙

げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム及びタングステン酸カリウムが挙げられる。

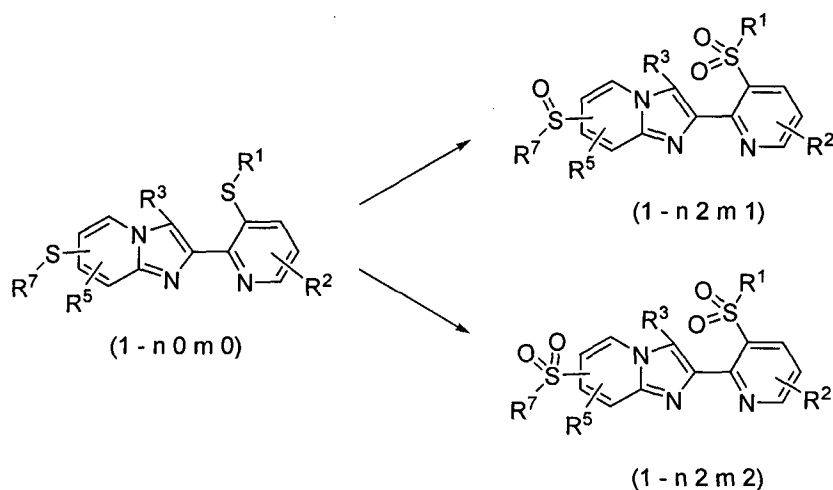
該反応には、本発明化合物(1-n 2 m 0) 1モルに対して、酸化剤が通常2～5モルの割合、触媒が通常0.01～0.5モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物(1-n 2 m 0) 1モルに対して、酸化剤が2～3モルの割合、触媒が0.05～0.2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0～120℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-n 2 m 2)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-n 2 m 2)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造法7)

式(1)において R^4 が $-S(O)_m R^7$ であり、 n が2であり、 m が1又は2である本発明化合物(1-n 2 m 1)又は本発明化合物(1-n 2 m 2)は、 R^4 が $-S(O)_m R^7$ であり、 n が0であり、 m が0である本発明化合物(1-n 0 m 0)を酸化することにより製造することができる。



[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

式(1)において R^4 が $-S(O)_m R^7$ であり、 n が2であり、 m が1である本発明化

化合物(1-n2m1)は、 R^4 が-S(O)_mR⁷であり、nが0であり、mが0である本発明化合物(1-n0m0)を酸化剤と反応させることにより一段階反応(ワンポット)で製造することができる。酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸、過酸化水素水又はオキソン(ペルオキシ-硫酸カリウム、イーアイデュポン社登録商標)が挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム及びタングステン酸カリウムが挙げられる。

該反応には、本発明化合物(1-n0m0)1モルに対して、酸化剤が通常3~10モルの割合、触媒が通常0.01~0.5モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物(1-n0m0)1モルに対して、酸化剤が3~5モルの割合、触媒が0.05~0.2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0~120℃の範囲内である。反応時間は通常0.1~12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-n2m1)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-n2m1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

式(1)において R^4 が-S(O)_mR⁷であり、nが2であり、mが2である本発明化合物(1-n2m2)は、 R^4 が-S(O)_mR⁷であり、nが0であり、mが0である本発明化合物(1-n0m0)を酸化剤と反応させることにより一段階反応(ワンポット)で製造することができる。酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸、過酸化水素水及びオキソン(ペルオキシ-硫酸カリウム、イーアイデュポン社登録商標)が挙げられる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム及びタングステン酸カリウムが挙げられる。

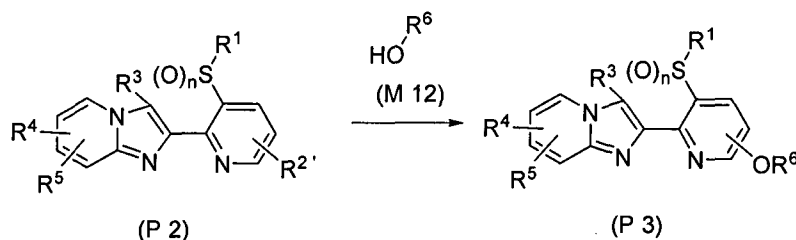
該反応には、本発明化合物（1-n 0 m 0）1モルに対して、酸化剤が通常4～15モルの割合、触媒が通常0.01～0.5モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物（1-n 0 m 0）1モルに対して、酸化剤が4～5モルの割合、触媒が0.05～0.2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0～120℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1-n 2 m 2）を単離することができる。単離された本発明化合物（1-n 2 m 2）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

（製造法8）

式（1）において R^2 が $-OR^6$ である本発明化合物（P3）は、 R^2 がハロゲン原子である本発明化合物（P2）と化合物（M12）とを塩基の存在下に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、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、及び水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類が挙げられる。



〔式中、 $R^{2'}$ はハロゲン原子を表し、その他の記号は式（1）と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DM

F、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、本発明化合物（P2）1モルに対して、化合物（M12）が通常1～10モルの割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

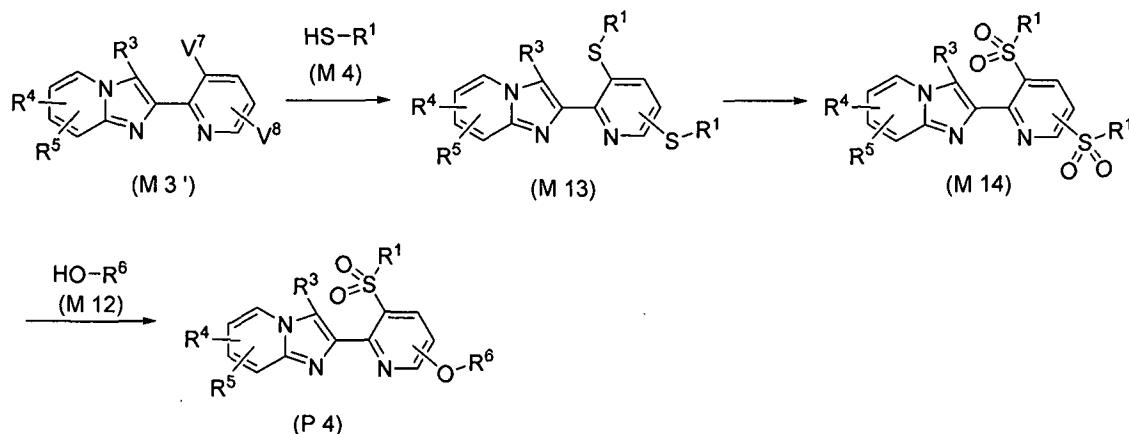
反応温度は、通常－50～100℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、 R^2 が $-OR^6$ である本発明化合物（P3）を単離することができる。単離された本発明化合物（P3）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

該反応において R^2 としては、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

10 （製造法9）

式（1）において R^2 が $-OR^6$ であり、 n が2である本発明化合物（P4）は、下記スキームに従って製造することができる。



[式中、 V^7 及び V^8 は同一又は相異なり、ハロゲン原子を表し、その他の記号は式

15 （1）と同じ意味を表す。]

中間体（M13）は、 V^8 がハロゲン原子である中間体化合物（M3'）と化合物（M4）とを塩基の存在下に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、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、及び水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

20 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（M3'）1モルに対して、化合物（M4）が通常2～10モルの割合、塩基が通常2～10モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常－50～100℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

- 5 反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体（M13）を単離することができる。単離された中間体（M13）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

該反応においてV⁷及びV⁸は同一又は相異なり、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

- 10 中間体化合物（M14）は、中間体化合物（M13）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。酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸、過酸化水素水及びオキシソ（ペルオキシ-硫酸カリウム、イーアイデュポン社登録商標）が挙げられる。

- 15 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。触媒としては、例えばタングステン酸、タングステン酸ナトリウム及びタングステン酸カリウムが挙げられる。

- 20 該反応には、中間体化合物（M13）1モルに対して、酸化剤が通常4～20モルの割合、触媒が通常0.01～0.5モルの割合で用いられる。好ましくは、中間体化合物1モルに対して、酸化剤が4～6モルの割合、触媒が0.05～0.2モルの割合で用いられる。

- 25 反応温度は、通常－50～100℃の範囲内である。反応時間は通常0.1～12時間の範囲内である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物（M14）を単離することができる。中間体化合物（M14）は、クロマトグラフィー、再結

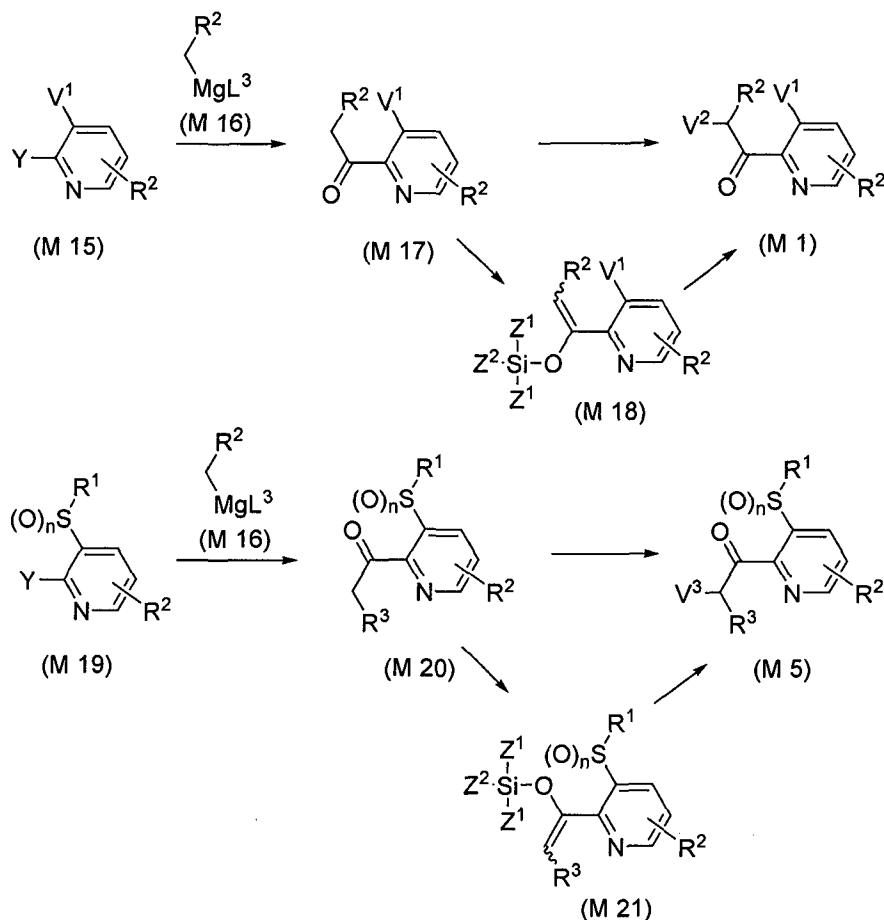
晶等によりさらに精製することもできる。

式(1)において R^2 が $-OR^6$ であり、 n が2である本発明化合物(P4)は、中間体化合物(M14)と化合物(M12)とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

- 5 R^2 がハロゲン原子である本発明化合物(P2)に代えて中間体化合物(M14)を用い、製造法8の方法に準じて、本発明化合物(P4)を製造することができる。

(製造法10)

中間体化合物(M1)及び中間体化合物(M5)は下記スキームに従って製造することができる。



10

[式中、 Y はニトリル基又は N -メトキシ- N -メチルカルバモイル基を表し、 V^1 はハロゲン原子を表し、 V^2 は塩素原子又は臭素原子を表し、 V^3 は塩素原子又は臭素原子を表し、 L^3 は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表し、 Z^1 はメチル基、エチル基又はイソプロピル基を表し、 Z^2 はメチル基、エチル基、イソプロピル基又は t e r t -ブチルを表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

15

中間体化合物 (M17) は、化合物 (M15) と化合物 (M16) とを反応させることにより製造することができる。

中間体化合物 (M20) は、化合物 (M19) と化合物 (M16) とを反応させることにより製造することができる。

- 5 これらの反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、化合物 (M15) 又は化合物 (M19) 1モルに対して、化合物 (M16) が通常0.9～1.5モルの割合で用いられる。

- 10 反応温度は、通常-20～100℃の範囲内である。反応時間は、通常0.1～24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物 (M17) 又は中間体化合物 (M20) を単離することができる。中間体化合物 (M17) 又は中間体化合物 (M20) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

- 15 中間体化合物 (M1) 又は中間体化合物 (M5) は、中間体化合物 (M17) 又は中間体化合物 (M20) と塩素化剤又は臭素化剤とを反応させることにより製造することができる。塩素化剤としては、例えば塩素及びN-クロロスクシンイミドが挙げられ、臭素化剤としては、例えば臭素、N-ブロモスクシンイミド、テトラブチルアンモニウムトリブ
20 ロミドが挙げられる。

- 該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、アセトニトリル等のニトリル類、1,4-ジオキサン等のエーテル
25 類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩化アルミニウムや臭化水素を加えることもできる。

該反応には、中間体化合物 (M17) 又は中間体化合物 (M20) 1モルに対して、塩素化剤又は臭素化剤が通常0.9～1.2モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0～150℃の範囲内である。反応時間は、通常0.1～24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M1)又は中間体化合物(M5)を単離することができる。

- 5 該反応は、中間体化合物(M1)又は中間体化合物(M5)が塩酸塩又は臭化水素酸塩であるものを単離することもできる。

中間体化合物(M18)又は中間体化合物(M21)は、中間体化合物(M17)又は中間体化合物(M20)とシリル化剤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。シリル化剤としては、例えばトリフルオロメタンスルホン酸トリイソプロ
10 ピルシリル、トリフルオロメタンスルホン酸tert-ブチルジメチルシリル、tert-ブチルジメチルクロロシランが挙げられ、塩基としては、例えばトリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミンが挙げられる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、トル
15 エン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて触媒量のヨウ化ナトリウムを加えることもできる。

該反応には、中間体化合物(M17)又は中間体化合物(M20)1モルに対して、シリル化剤が通常0.9～1.2モルの割合、塩基が1～2モルの割合、ヨウ化ナトリウム
20 が0.1～0.5モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0～150℃の範囲内である。反応時間は、通常0.1～24時間の範囲内である。

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M18)又は中間体化合物(M21)を単離することができる。

- 25 中間体化合物(M17)又は中間体化合物(M20)に代えて中間体化合物(M18)又は中間体化合物(M21)を用い、製造法9の方法に準じて、中間体化合物(M1)又は中間体化合物(M5)を製造することができる。

(製造法11)

本発明化合物及び上述の中間体化合物のうち、窒素原子上に孤立電子対を持つ含窒素複

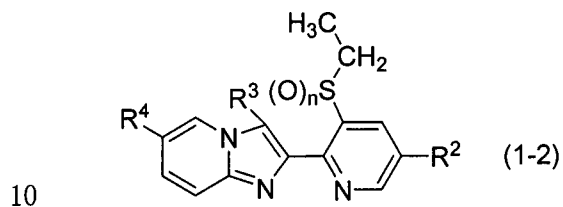
素環基を有する化合物と酸化剤とを反応させることにより、該窒素原子が酸化されたN-オキシドを製造することができる。

該含窒素複素環基としては、例えばピリジン環が挙げられる。

5 該反応は、公知の方法で行うことができ、例えばジクロロメタン、クロロホルム、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水及びこれらの混合物等の溶媒中で、m-クロロ過安息香酸又は過酸化水素等の酸化剤を用いて行われる。

次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。

式 (1-2)



において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 、 R^3 及び n が、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

表 1

R^2	R^3	n
H	H	0
H	H	1
H	H	2
F	H	0
F	H	1
F	H	2
Cl	H	0
Cl	H	1
Cl	H	2
Br	H	0
Br	H	1
Br	H	2
CF ₃	H	0
CF ₃	H	1
CF ₃	H	2
H	Cl	0
H	Cl	1
H	Cl	2

F	Cl	0
F	Cl	1
F	Cl	2
Cl	Cl	0
Cl	Cl	1
Cl	Cl	2
Br	Cl	0
Br	Cl	1
Br	Cl	2
CF ₃	Cl	0
CF ₃	Cl	1
CF ₃	Cl	2

表2

R ²	R ³	n
H	Br	0
H	Br	1
H	Br	2
F	Br	0
F	Br	1
F	Br	2
Cl	Br	0
Cl	Br	1
Cl	Br	2
Br	Br	0
Br	Br	1
Br	Br	2
CF ₃	Br	0
CF ₃	Br	1
CF ₃	Br	2
H	CH ₃	0
H	CH ₃	1
H	CH ₃	2
F	CH ₃	0
F	CH ₃	1
F	CH ₃	2
Cl	CH ₃	0
Cl	CH ₃	1
Cl	CH ₃	2

Br	CH ₃	0
Br	CH ₃	1
Br	CH ₃	2
CF ₃	CH ₃	0
CF ₃	CH ₃	1
CF ₃	CH ₃	2

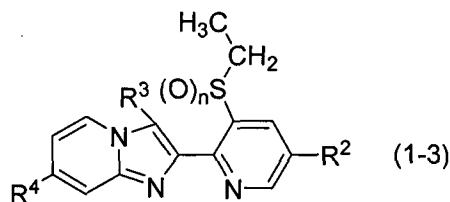
式(1-2)において、R⁴がペンタフルオロエチル基であり、R²、R³及びnが、
〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-2)において、R⁴がトリフルオロメチルスルファニル基であり、R²、R³及
びnが、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-2)において、R⁴がトリフルオロメチルスルフィニルであり、R²、R³及び
nが、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-2)において、R⁴がトリフルオロメチルスルホニル基であり、R²、R³及び
nが、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-3)



において、R⁴がトリフルオロメチル基であり、R²、R³及びnが、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-3)において、R⁴がペンタフルオロエチル基であり、R²、R³及びnが、
〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-3)において、R⁴がトリフルオロメチルスルファニル基であり、R²、R³及
びnが、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-3)において、R⁴がトリフルオロメチルスルフィニルであり、R²、R³及び
nが、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

式(1-3)において、R⁴がトリフルオロメチルスルホニル基であり、R²、R³及び
nが、〔表1〕～〔表2〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

本発明化合物が効力を有する有害生物としては、例えば、有害昆虫類や有害ダニ類等の

有害節足動物及び有害線虫が挙げられる。かかる有害生物としては、具体的には例えば、以下のものが挙げられる。

半翅目害虫：ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) 等のウンカ類、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*) 等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*) 等のアブラムシ類、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*) 等のカメムシ類、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*) 等のホソヘリカメムシ類、アカヒゲホソミドリカスミカメ (*Trigonotylus caelestialium*)、アカスジカスミカメ (*Stenotus rubrovittatus*) 等のカスミカメ類、オンシツコナジラミ (*Trialetodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*) 等のコナジラミ類、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、シトラススノースケール (*Unaspis citri*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pse*

udococcus longispinis)、クワシロカイガラムシ (Pseudaulacaspis pentagona) 等のカイガラムシ類、ミカンキジラミ (Diphorina citri)、ナシキジラミ (Psylla pyrisuga)、ポテトプシリッド (Bactericerca cockerelli) などのキジラミ
5 類、ナシグンバイ (Stephanitis nasi) 等のグンバイムシ類、トコジラミ (Cimex lectularius) 等のトコジラミ類。

鱗翅目害虫: ニカメイガ (Chilo suppressalis)、サンカメイガ (Tryporyza incertulas)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、ワタノメイガ (Notarcha derogata)、
10 ノシメマダラメイガ (Plodia interpunctella)、アワノメイガ (Ostrinia furnacalis)、ハイマダラノメイガ (Hellula undalis)、シバツトガ (Pediasia teterrellus) 等のメイガ類、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura)、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua)、アワヨトウ (Pseudaletia se
15 parata)、ヨトウガ (Mamestra brassicae)、タマナヤガ (Agrotis ipsilon)、タマナギンウワバ (Plusia nigrisigna)、トリコプルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属等のヤガ類、モンシロチョウ (Pieris rapae) 等のシロチョウ類、アドキソフィエス属、ナシヒメシンクイ (Grapholita molesta)、マメシンクイガ (Leguminiv
20 ora glycinivorella)、アズキサヤムシガ (Matsumuraesia azukivora)、リンゴコカクモンハマキ (Adoxophyes orana fasciata)、チャノコカクモンハマキ (Adoxophyes honmai.)、チャハマキ (Homona magnanima)、ミダレカクモンハマキ (Archips fuscocupreanus)、コドリング (Cydia pomonella) 等のハマキガ類、チャノホソガ (Caloptilia theivor
25 a)、キンモンホソガ (Phyllonorycter ringoneella) のホソガ類、モモシンクイガ (Carposina niponensis) 等のシンクイガ類、リオネティア属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユープロクティス属等のドクガ類、コナガ (Plutella xylostella) 等のスガ類、ワタアカミムシ

(*Pectinophora gossypiella*) ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*) 等のキバガ類、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ類、及びイガ (*Tinea translucens*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 等のヒロズコガ類。

- 5 アザミウマ目害虫：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips parvi*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*) 等のアザミウマ類。
- 10 双翅目害虫：アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、ネツタイイエカ (*Culex quinquefasciatus*) 等のイエカ類、ネツタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*) 等のエーデス属、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*) 等のアノフェレス属、ユ
- 15 スリカ類、イエバエ (*Musca domestica*)、オオイエバエ (*Muscina stabulans*) 等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*) 等のハナバエ類、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、イネヒメハモグリバエ (*Hydrellia griseola*)、トマトハモグリバエ、(*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*) 等のハモグリバエ類、イネキモグリバエ (*Chlorops oryzae*) 等のキモグリバエ類、ウリミバエ (*Dacus cucurbitae*)、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*) 等のミバエ類、ショウジョウバエ類、オオキモンノミバ
- 20 エ (*Megaselia spiracularis*) 等のノミバエ類、オオチョウバエ (*Clogmia albipunctata*) 等のチョウバエ類、クロバネキノコバエ類、ブユ類、ウシアブ (*Tabanus trigonus*) 等のアブ類、シラミバエ類及びサシバエ類。

鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera*)

a virgifera)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) 等のハムシ類、
5 ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*) 等のコガネムシ類、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptus oryzophilus*)、
10 シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus*) 等のイネゾウムシ類、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*) 等のゾウムシ類、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chienensis*) 等のマメゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*) 等のゴミムシダマシ類、
15 ヒメマルカツオブシムシ (*Anthrenus verbasci*)、ハラジロカツオブシムシ (*Dermestes maculatus*) 等のカツオブシムシ類、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*) 等のシバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*) 等のキクイムシ類、
20 ナガシנקイムシ類、ヒョウホンムシ類、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*) 等のカミキリムシ類、トビイロムナボソコメツキ (*Agriotes ogurae fuscicollis*) 等のコメツキムシ類 (*Agriotes* spp.)、及びアオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) 等のハネカクシ類。
25 直翅目害虫：トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、ケラ (*Gryllotalpa africana*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、ハネナガイナゴ (*Oxya japonica*)、及びコオロギ類。
隠翅目害虫：ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)

s), ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) 等。

シラミ目害虫: コロモジラミ (*Pediculus humanus corporis*), アタマジラミ (*Pediculus humanus humanus*), ケジラミ (*Phthirus pubis*), ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*), ヒツジジラミ (*Dalmanella ovis*), ブタジラミ (*Haematopinus suis*), イヌジラミ (*Linognathus setosus*) 等。

ハジラミ目害虫: ヒツジハジラミ (*Dalmanella ovis*), ウシハジラミ (*Dalmanella bovis*), ニワトリハジラミ (*Menopon gallinae*), イヌハジラミ (*Trichodectes canis*), ネコハジラミ (*Felicola subrostrata*) 等

膜翅目害虫: イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*), クロヤマアリ (*Formica fusca japonica*), ルリアリ (*Ochetellus glaber*), アミメアリ (*Pristomyrmex pungens*), オオズアリ (*Pheidole noda*), ハキリアリ (*Acromyrmex* spp.), ファイヤーアント (*Solenopsis* spp.), アルゼンチンアリ (*Linepithema humile*) 等のアリ類, スズメバチ類, アリガタバチ類, 及びカブラハバチ (*Athalia rosae*), ニホンカブラハバチ (*Athalia japonica*) 等のハバチ類。

線虫類: イネシנגアレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*), イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*), サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*), キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*), ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*), ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*), ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*), ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*), ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*) 等。

ゴキブリ目害虫: チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*), クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*), ワモンゴキブリ (*Per*

iplaneta americana)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*) 等。

シロアリ目害虫：ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、アメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、台湾シロアリ (*Odontotermes formosanus*)、コウシュンシロアリ (*Neotermes koshunensis*)、サツマシロアリ (*Glyptotermes satsumensis*)、ナカジマシロアリ (*Glyptotermes nakajimai*)、カタンシロアリ (*Glyptotermes fuscus*)、コダマシロアリ (*Glyptotermes kodamai*)、クシモトシロアリ (*Glyptotermes kushimensis*)、オオシロアリ (*Hodotermopsis japonica*)、コウシュウイエシロアリ (*Coptotermes guangzhouensis*)、アマミシロアリ (*Reticulitermes miyatakei*)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、カンモンシロアリ (*Reticulitermes* sp.)、タカサゴシロアリ (*Nasutitermes takasagoensis*)、ニトベシロアリ (*Pericapritermes nitobei*)、ムシャシロアリ (*Sinocapritermes mushae*) 等。

ダニ目害虫：ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、オリゴニカス属等のハダニ類、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、リュウキュウミカンサビダニ (*Phyllocoptruta citri*)、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*) 等のフシダニ類、チャノホコリダニ (*Polypogon tarsonemus latus*) 等のホコリダニ類、ミナミヒメハダニ

(*Brevipalpus phoenicis*) 等のヒメハダニ類、ケナガハダニ類、
フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトチ
マダニ (*Haemaphysalis flava*)、台湾カクマダニ (*Derma*
centor taiwanicus)、アメリカンヌカクマダニ (*Dermacen*
5 *tor variabilis*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュ
ルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、ブラックレグドチック (*Ix*
odes scapularis)、アメリカキララマダニ (*Amblyomma am*
ericanum)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリ
イロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) 等のマダニ
10 類、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ホウレン
ソウケナガコナダニ (*Tyrophagus similis*) 等のコナダニ類、コナヒ
ョウヒダニ (*Dermatophagoides farinae*)、ヤケヒョウヒダニ
(*Dermatophagoides ptrencyssus*) 等のヒョウヒダニ類、
ホソツメダニ (*Cheyletus eruditus*)、クワガタツメダニ (*Chey*
15 *letus malaccensis*)、ミナミツメダニ (*Cheyletus moo*
rei)、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*) 等のツメダニ
類、ミミヒゼンダニ (*Octodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sacr*
optes scabiei) 等のヒゼンダニ類、イヌニキビダニ (*Demodex c*
anis) 等のニキビダニ類、ズツキダニ類、ササラダニ類、イエダニ (*Ornitho*
20 *nyssus bacoti*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylv*
airum)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等のワクモ類、ア
オツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*) 等のツツガムシ
類。

クモ目害虫：カバキコマチグモ (*Chiracanthium japonicum*)、
25 セアカゴケグモ (*Latrodectus hasseltii*) 等のクモ類等。

唇脚綱類：ゲジ (*Thereuonema hilgendorfi*)、トビズムカデ
(*Scolopendra subspinipes*) 等。

倍脚綱類：ヤケヤスデ (*Oxidus gracilis*)、アカヤスデ (*Nedyop*
us tambanus) 等。

等脚目類：オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*) 等。

腹足綱類：チャコウラナメクジ (*Limax marginatus*)、キイロコウラナメクジ (*Limax flavus*) 等。

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物と不活性担体とを含有する。本発明の有害生物防除剤は、通常、本発明化合物と固体担体、液体担体、ガス状担体等の不活性担体とを混合し、必要に応じて界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、乳剤、油剤、粉剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤、樹脂製剤、シャンプー剤、ペースト状製剤、泡沫剤、炭酸ガス製剤、錠剤等に製剤化される。これらの製剤は蚊取り線香、電気蚊取りマット、液体蚊取り製剤、燻煙剤、燻蒸剤、シート製剤、スポットオン剤、経口処理剤に加工されて、使用されることもある。

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物を通常 0.01～95 重量%含有する。

本発明において、本発明化合物が界面活性剤を含有する水に分散されてなる有害生物防除剤とは、通常、本発明化合物と界面活性剤と水とを混合し、必要に応じてその他の製剤用補助剤を添加して、フロアブル剤やマイクロカプセル剤等に製剤化されたものである。

該有害生物防除剤は、本発明化合物を通常 0.01～95 重量%含有する。

水に分散されてなるとは、本発明化合物が水に乳濁された状態及び懸濁された状態を指す。

界面活性剤としては、非イオン界面活性剤及び／又は陰イオン界面活性剤が挙げられる。非イオン界面活性剤としては、例えばポリオキシアルキレンアルキルエーテル、ポリオキシアルキレンアルキルアリールエーテル、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル等が挙げられ、陰イオン界面活性剤としては、アルキルスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキル硫酸塩、ポリオキシアルキレンアリールフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシアルキレンアリールフェニルエーテルリン酸塩等が挙げられる。

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤、着色剤、増粘剤、防腐剤、消泡剤、凍結防止剤及び安定剤等、具体的にはカゼイン、ゼラチン、澱粉、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸、リグニン誘導体、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）、PAP（酸性りん酸イソプロピル）、BHT（2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）、BHA（2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと

の混合物)が挙げられる。

本発明の農業分野での有害生物の防除方法としては、本発明化合物（例えば本発明化合物 1-18 のいずれか）の有効量を、植物の茎葉部又は植物を栽培する土壤に施用する方法が挙げられ、具体的には茎葉散布などの植物の茎葉への処理、土壤処理、水耕液処理などの植物の栽培地への処理等が挙げられ、施用回数は 1 回でも複数回でもよい。

かかる植物の茎葉への処理としては、具体的には、例えば、茎葉散布、樹幹散布等の植物の表面に施用する処理方法が挙げられる。

かかる土壤処理としては、例えば、土壤への散布、土壤混和、土壤への薬液灌注（薬液灌水、土壤注入、薬液ドリップ）が挙げられ、処理する場所としては例えば、植穴、作条、植穴付近、作条付近、栽培地の全面、植物地際部、株間、樹幹下、主幹畦、培土、育苗箱、育苗トレイ、苗床等が挙げられ、処理時期としては播種前、播種時、播種直後、育苗期、定植前、定植時、及び定植後の生育期等が挙げられる。

かかる水耕液処理としては、例えば、灌水設備（灌水チューブ、灌水パイプ、スプリンクラー等）への注入、条間湛水液への混入、水耕液へ混入等が挙げられる。

本発明の有害生物防除方法には、通常、本発明の有害生物防除剤の形態で用いられる。

本発明の有害生物防除剤を農業分野の有害生物防除に用いる場合、その施用量は、10000m² あたりの本発明化合物量で通常 1~10000g である。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常、有効成分濃度が 0.01~10000ppm となるように水で希釈して施用し、粒剤、粉剤等は、通常、そのまま施用する。

本発明の有害生物防除剤を水稻の育苗箱に施用する場合、本発明化合物の施用量は、通常、育苗箱あたり 0.1~10g である。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常、本発明化合物が 0.01~10000ppm となるよう水で希釈して施用し、粒剤、粉剤等は 1~500g の本発明化合物をそのまま施用する。

これらの製剤や製剤の水希釈液は、有害生物又は有害生物から保護すべき作物等の植物に直接散布処理してもよく、また耕作地の土壤に生息する有害生物を防除するために、該土壤に処理してもよい。

また、シート状やひも状に加工した樹脂製剤を作物に巻き付ける、作物近傍に張り渡

す、株元土壤に敷く等の方法により処理することもできる。

本発明において、本発明化合物と喫食性担体とを含有する有害生物防除剤は、通常、本発明化合物と喫食性担体（例えば、水や、炭水化物、たんぱく質、脂質等の栄養物）とを混合したものである。

5 かかる喫食性担体としては、例えば蔗糖、ブドウ糖、グラニュー糖、果糖、乳糖、麦芽糖、黒砂糖、赤砂糖、三温糖、デキストリン、アラビノース、ガラクトース、ソルビトース、糖蜜、蜂蜜などの糖類；脱脂乳、脱脂粉乳、チーズなどの乳製品；トウモロコシ、ジャガイモ、サツマイモ等に由来する澱粉；小麦粉、米粉、トウモロコシ粉、ジャガイモ粉などの穀物粉；ウシ、ブタ、魚介類、昆虫等の動物粉末や昆虫粉末；ヤシ油、カカオ油、
10 コーン油、ゴマ油、落花生油、サラダ油等の植物油；哺乳類油である体脂、バター脂、鳥類、爬虫類、両生類、昆虫等から得られる油等の動物油；ソース、醤油等の調味料が挙げられ、更に必要に応じて、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料等が添加される。

15 本発明毒餌組成物は、特にその形態は限定されず、例えば顆粒状、塊状、錠剤形状、液状、半練り状、ゲル状など種々の形態をとりうる。

本発明の防疫分野での有害生物の防除方法においては、有害生物が集まりやすい場所に、（１）本発明毒餌組成物が粉状、顆粒状、塊状、錠剤形状等の固形物の場合は、本発明毒餌組成物を撒いたり、あるいは開放容器に入れた後に設置する、（２）本発明毒餌組成物が液状の場合は、本発明毒餌組成物を塗布する、（３）本発明毒餌組成物がゲル状又は半練り状の場合は、本発明毒餌組成物をベイトガン等を用いて隙間に注入したり、付着させたりする等により、設置し本発明毒餌組成物を摂食させる。

25 本発明において、本発明化合物、溶剤及び噴射ガスを含む有害生物防除剤は、通常、本発明化合物を溶剤と共にエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、噴射ガスを充填しアクチュエータを装着することで得られる。

かかる溶剤としては、例えば水、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、フェノキシエタノール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、エチルベンゼ

ン、ドデシルベンゼン、フェニルキシリルエタン、メチルナフタレン等)、脂肪族炭化水素類(ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等)、エステル類(酢酸エチル、酢酸ブチル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸エチル、アジピン酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソブチル、プロピレングリコールモノメチルエーテルアセテート等)、ニトリル類(アセトニトリル、イソブチロニトリル等)、エーテル類(ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、3-メトキシ-3-メチル-1-ブタノール等)、酸アミド類(N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等)、ハロゲン化炭化水素類(ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等)、スルホキシド類(ジメチルスルホキシド等)、炭酸プロピレン及び植物油(大豆油、綿実油等)が挙げられる。

かかる噴射ガスとしては、例えばフルオロカーボン、ブタンガス、LPG(液化石油ガス)、ジメチルエーテル及び炭酸ガスがあげられる。

かかるエアゾールバルブとしては特に限定されないが、プッシュダウン式エアゾールバルブが通常使用される。

本発明において、本発明化合物とガス発生剤とを含有する有害生物防除剤は、通常、本発明化合物とガス発生剤とを混合して得られる。

かかるガス発生剤としては、例えばアゾジカルボンアミド、4, 4'-オキシビス(ベンゼンスルホニルヒドラジド)、ジニトロソペンタメチレンテトラミン、2, 2'-アゾビスイソブチロニトリル、p-トルエンスルホニルヒドラジドなどが挙げられる。

本発明の有害生物防除剤を防疫分野に用いる場合、その施用量は、面上に処理する場合は処理面積 1 m^2 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01\sim1000\text{ mg}$ であり、空間に処理する場合は処理空間 1 m^3 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01\sim500\text{ mg}$ である。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常有効成分濃度が $0.1\sim10000\text{ ppm}$ となるように水で希釈して施用し、油剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤等は希釈せずにそのまま施用する。本発明エアゾールを有害生物又は有害生物の生息場所に噴射する場合、その施用量は、面上に処理する場合は処理面積 1 m^2 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01\sim1000\text{ mg}$ であ

り、空間に処理する場合は処理空間 1 m^3 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01 \sim 500\text{ mg}$ である。

本発明の有害生物防除剤を防疫分野に用いる場合、有害生物が寄生する動物の体表面に施用する方法や、有害生物が寄生する動物の体表面に施用する経口服用させる方法が挙げられる。具体的には、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、ニワトリ用の家畜、イヌ、ネコ、ラット、マウス等の小動物の外部寄生虫防除に用いる場合は、獣医学的に公知の方法で家畜や小動物に使用することができる。具体的な使用方法としては、全身抑制を目的とする場合には、例えば錠剤、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）により投与され、非全身的抑制を目的とする場合には、例えば油剤若しくは水性液剤を噴霧する、ポアオン処理又はスポットオン処理を行う、シャンプー製剤で動物を洗う又は樹脂製剤を首輪や耳札にして家畜や小動物に付ける等の方法により用いられる。動物体表面に投与する場合の本発明化合物の量は、通常家畜や小動物の体重 1 kg に対して、 $0.1 \sim 1000\text{ mg}$ の範囲内である。動物に経口服用させる場合の本発明化合物の量は、通常家畜や小動物の体重 1 kg に対して、 $0.1 \sim 1000\text{ mg}$ の範囲内である。

本発明の有害生物防除剤は、下記の作物が栽培されている農地で使用することができる。

農作物：トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等。

野菜：ナス科野菜（ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス）、セリ科野菜（ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等）、アカザ科野菜（ハウレンソウ、フダンソウ等）、シソ科野菜（シソ、ミント、バジル等）、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等。

果樹：仁果類（リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、ク

ルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等)、液果類(ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等)、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ、アブラヤシ等。

果樹以外の樹木: チャ、クワ、花木類(サツキ、ツバキ、アジサイ、サザンカ、シキミ、サクラ、ユリノキ、サルスベリ、キンモクセイ等)、街路樹(トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチョウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ、ニレ、トチノキ等)、サンゴジュ、イヌマキ、スギ、ヒノキ、クロトン、マサキ、カナメモチ、等。

芝生: シバ類(ノシバ、コウライシバ等)、バミューダグラス類(ギョウギシバ等)、ベントグラス類(コヌカグサ、ハイコヌカグサ、イトコヌカグサ等)、ブルーグラス類(ナガハグサ、オオスズメノカタビラ等)、フェスク類(オニウシノケグサ、イトウシノケグサ、ハイウシノケグサ等)、ライグラス類(ネズミムギ、ホソムギ等)、カモガヤ、オオアワガエリ等。

その他: 花卉類(バラ、カーネーション、キク、トルコギキョウ、カスミソウ、ガーベラ、マリーゴールド、サルビア、ペチュニア、バーベナ、チューリップ、アスター、リンドウ、ユリ、パンジー、シクラメン、ラン、スズラン、ラベンダー、ストック、ハボタン、プリムラ、ポインセチア、グラジオラス、カトレア、デージー、シンビジューム、ベゴニア等)、バイオ燃料植物(ヤトロファ、クルカス、ベニバナ、アマナズナ類、スイッチグラス、ミスカンサス、クサヨシ、ダンチク、ケナフ、キャッサバ、ヤナギ、藻類等)、観葉植物等。

本出願において、作物という用語は遺伝子組換え作物も含む。

本発明の有害生物防除剤は、他の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物成長調節剤、除草剤及び共力剤と混用又は併用することができる。かかる殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤及び共力剤の有効成分の例を以下に示す。

殺虫剤の有効成分

(1) 有機リン化合物

アセフェート(acephate)、りん化アルミニウム(Aluminium phosphide)、ブタチオホス(buthiofos)、カズサホス(cadus

a fos)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビン
ホス(chlorfenvinphos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、
クロルピリホスメチル(chlorpyrifos-methyl)、シアノホス
(cyanophos: CYAP)、ダイアジノン(diazinon)、DCIP(d
5 ichlorodiisopropyl ether)、ジクロフェンチオン(dich
lofenthion: ECP)、ジクロルボス(dichlorvos: DDVP)、
ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinp
hos)、ジスルホトン(disulfoton)、EPN、エチオン(ethio
n)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrifos)、
10 フェンチオン(fenthion: MPP)、フェニトロチオン(fenitrothi
on: MEP)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホルモチオン(form
othion)、りん化水素(Hydrogen phosphide)、イソフェンホ
ス(isofenphos)、イソキサチオン(isoxathion)、馬拉チオン
(malathion)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メチダチオン
15 (methidathion: DMTP)、モノクロトホス(monocrotopho
s)、ナレド(naled: BRP)、オキシデプロホス(oxydeprofos:
ESP)、パラチオン(parathion)、ホサロン(phosalone)、ホス
メット(phosmet: PMP)、ピリミホスメチル(pirimiphos-met
hyl)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、キナルホス(qui
20 nalphos)、フェントエート(phenthoate: PAP)、プロフェノホス
(profenofos)、プロパホス(propaphos)、プロチオホス(pro
thiofos)、ピラクロホス(pyraclorfos)、サリチオン(salit
hion)、スルプロホス(sulprofos)、テブピリムホス(tebupiri
mfos)、テムホス(temephos)、テトラクロルビンホス(tetrachl
25 orvinphos)、テルブホス(terbufos)、チオメトン(thiomet
on)、トリクロルホン(trichlorphon: DEP)、バミドチオン(vam
idothion)及びフォレート(phorate)。

(2) カーバメート化合物

アラニカルブ(alanycarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、

ベンフラカルブ (benfuracarb)、BPMC、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、クロエトカルブ (cloethocarb)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、フラチオカルブ (furathiocarb)、イソプロカルブ (isoprocarb: MIPC)、メトルカルブ (metolcarb)、メソミル (methomyl)、メチオカルブ (methiocarb)、NAC、オキサミル (oxamyI)、ピリミカーブ (pirimicarb)、プロポキスル (propoxur: PHC)、XMC、チオジカルブ (thiodicarb)、キシリルカルブ (xyllylcarb)、及びアルジカルブ (aldicarb)。

(3) ピレスロイド化合物

アクリナトリン (acrinathrin)、アレスリン (allethrin)、ベンフルスリン (benfluthrin)、ベーターシフルトリン (beta-cyfluthrin)、ビフエントリン (bifenthrin)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、シフルトリン (cyfluthrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エトフェンプロックス (ethofenprox)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンバレレート (fenvalerate)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェンプロックス (flufenoprox)、フルメスリン (flumethrin)、フルバリネート (fluvalinate)、ハルフエンプロックス (halfenprox)、イミプロトリン (imiprothrin)、ペルメトリン (permethrin)、プラレトリン (prallethrin)、ピレトリン (pyrethrins)、レスメトリン (resmethrin)、シグマーサイパーメスリン (sigma-cypermethrin)、シラフルオフェン (silaflofen)、テフルトリン (tefluthrin)、トラロメトリン (tralomethrin)、トランスフルトリン (transfluthrin)、テトラメトリン (tetramethrin)、フェノトリン (phenoth

rin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、ゼータシペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ラムダシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、フラメトリン(furamethrin)、
5 タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、メトフルトリン(metofluthrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ジメフルトリン(dimethylfluthrin)、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、及び2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-(2-メチル-1-プロペニル)シクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-(2-シアノ-1-プロペニル)シクロプロパンカルボキシレート。
10

(4) ネライストキシン化合物

カルタップ(cartap)、ベンスルタップ(bensultap)、チオシクラム(thiocyclam)、モノスルタップ(monosultap)、及びビスルタップ(bisultap)。
20

(5) ネオニコチノイド化合物

イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、アセタミプリド(acetamiprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チアクロプリド(thiacloprid)、ジノテフラン(dinotefuran)、及びクロチアニジン(clothianidin)。
25

(6) ベンゾイル尿素化合物

クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ビストリフルロン(bistrifluron)、ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルアズロン(flauazuron)、フルシ

クロクスロン (flucycloxuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、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)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、トリフルムロン (triflumuron)、及びトリアズロン (triazuron)。

(7) フェニルピラゾール化合物

アセトプロール (acetoprole)、エチプロール (ethiprole)、フィプロニル (fipronil)、バニリプロール (vaniliprole)、ピリプロール (pyriprole)、及びピラフルプロール (pyrafluprole)。

(8) Btトキシシン

バチルス・チューリンゲンシス菌由来の生芽胞及び産生結晶毒素、及びそれらの混合物；

(9) ヒドラジン化合物

クロマフェノジド (chromafenozide)、ハロフェノジド (halofenozide)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、及びテブフェノジド (tebufenozide)。

(10) 有機塩素化合物

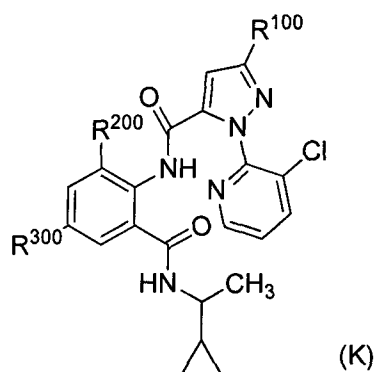
アルドリン (aldrin)、ディルドリン (dieldrin)、ジエノクロル (dienochlor)、エンドスルファン (endosulfan)、及びメトキシクロル (methoxychlor)。

(11) その他の殺虫剤有効成分

マシン油 (machine oil)、硫酸ニコチン (nicotine-sulfate)；アベルメクチン (avermectin-B)、ブロモプロピレート (bromopropylate)、ブプロフェジン (buprofezin)、クロルフェナピル (chlorphenapyr)、シロマジン (cyromazine)、D-D (1,3-Dichloropropene)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、フェナザキン (fenazaquin)、フルピラゾホス (flupyrazofos)、ハイドロプレン (hydroprene)、メトプレン (methoprene)、インドキサカルブ (indoxacarb)、メトキサジアゾン

(metoxadiazone)、ミルベマイシンA (milbemycin-A)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、スピノサッド (spinosad)、スルフラミド (sulfluramid)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トリアザメイト (triazamate)、レピメクチン (lepimectin)、亜ヒ酸 (Arsenic acid)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、石灰窒素 (Calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤 (Calcium polysulfide)、クロルデン (chlordane)、DDT、DSP、フルフェネリウム (flufennerim)、フロニカミド (flonicamid)、フルリムフェン (flurimfen)、ホルメタネート (formetanate)、メタム・アンモニウム (metam-ammonium)、メタム・ナトリウム (metam-sodium)、臭化メチル (Methyl bromide)、オレイン酸カリウム (Potassium oleate)、プロトリフェンビュート (protrifenbutate)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スルフォキサフロール (sulfoxafloer)、硫黄 (Sulfur)、メタフルミゾン (metaflumizone)、スピロテトラマト (spirotetramat)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazone)、スピネトラム (spinetoram)、トラロピリル (tralopyril)、フルピラジフロネ (flupyradifurone)、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)、フルベンジアミド (flubendiamide)、

下記式 (K)



[式中、

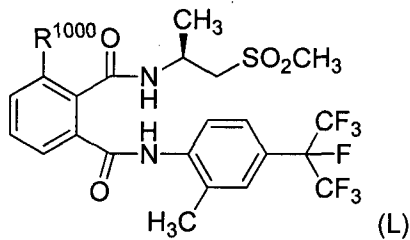
R^{100} は塩素、臭素又はトリフルオロメチル基を表し、

R^{200} は塩素、臭素又はメチル基を表し、

R^{300} は塩素、臭素又はシアノ基を表す。]

で示される化合物、及び

5 下記式 (L)



〔式中、

R^{1000} は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表す。〕

で示される化合物。

10 殺ダニ剤の有効成分

アセキノシル (acequinocyl)、アミトラズ (amitraz)、ベンゾキシメート (benzoximate)、ビフェナゼート (bifenaate)、フェニソプロモレート (bromopropylate)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロルベンジレート (chlorobenzilate)、CPCB S (chlorfenson)、クロフェンテジン (clofentezine)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、ケルセン (ジコホル: dicofol)、エトキサゾール (etoxazole)、酸化フェンブタスズ (fenbutatin oxide)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルプロキシフェン (fluproxyfen)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、プロパルギット (propargite: BPPS)、ポリナクチン複合体 (polynactins)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン (Pyrimidifen)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テトラジホン (tetradi fon)、スピロディクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロテトラマット (spirotetramat)、アミドフルメット (amidoflumet)、及びシエノピラフェン

(cyenopyrafen)。

殺線虫剤の有効成分

DCIP、フォスチアゼート (fosthiazate)、塩酸レバミゾール (levamisol)、メチルイソチオシアネート (methyisothiocyanate)、
5 酒石酸モランテル (morantel tartarate)、及びイミシアホス (imicyafos)。

殺菌剤の有効成分

(1) アゾール系化合物

トリホリン (triforine)、イマザリル (imazalil)、ペフラゾエー
10 ト (pefurazoate)、プロクロラズ (prochloraz)、トリフルミゾール (triflumizole)、ビテルタノール (bitertanol)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジニコナゾール-M (diniconazole-M)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、
15 フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルトリアホール (flutriafol)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、イプコナゾール (ipconazole)、メトコナゾール (metconazole)、マイクロブタニル (myclobutanil)、ペンコナゾール (penconazole)、
20 プロピコナゾール (propiconazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、トリチコナゾール (triticonazole)、等；

(2) ストロビルリン系化合物

25 アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クレソキシムメチル (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)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、エネストロビン (enestrobin)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)

n)、オリサストロビン (orysastrobins)、フルオキサストロビン (fluoxastrobins)、ファモキサドン (famoxadone)、フェナミドン (fenamidone)、ピリベンカルブ (pyribencarb) 等;

(3) その他の殺菌剤有効成分

- 5 カルベンダジム (carbendazim)、ベノミル (benomyl)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、ゾキサミド (zoxamide)、ジエトフェンカルブ (dethofencarb)、ペンシクロン (pencycuron)、フルオピコリド (fluopicolide)、カルボキシシン (carboxin)、フルトラニル (frutolanil)、フラメトピル (frametpyr)、チフルザミド (thi fluzamide)、ボスカリド (boscalid)、ペンチオピラド (penthio pyrad)、フルオピラム (fluopyram)、ビキサフェン (bixafen)、イソピラザム (isopyrazam)、ペンフルフェン (penflufen)、セダキサン (sedaxan)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フルアジ
10 ナム (fluazinam)、フェリムゾン (ferimzone)、シルチオファム (siltthiofam)、プロシミドン (procymidone)、イプロジオン (iprodione)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、メタラキシル (metalaxy l)、ベナラキシル (benalaxy l)、ピリメサニル (pyrimethanil)、メパニピリム (mepanipyrim)、シプロジニル (cy
15 prodinil)、キノキシフェン (quinoxifen)、プロキナジド (proquinazid)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、フルジオキシニル (fludioxonil)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、トリデモルフ (tridemorph)、フ
20 エンプロピジン (fenpropidin)、スピロキサミン (spiroxamine)、チウラム (thiuram)、ジラム (ziram)、マンコゼブ (mancozeb)、クロロタロニル (chlorothalonil)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、キャプタン (captan)、フォルペット (folpet)、イミノクタジン (iminocladine)、エタボキサム (ethaboxa
25 m)、メトラフェノン (metrafenone)、ドジン (dodine)、フサライ

ド (fthalide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、ピロキロン (pyroquilon)、カルプロパミド (carpropamid)、ジクロシメツト (diclocymet)、フェノキサニル (fenoxanil)、ジメトモルフ (dimethomorph)、イプロヴァリカルブ (iprovalicarb)、ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、キン
5 トゼン (quintozene)、シアゾファミド (cyazofamid)、アミスル
ブロム (amisulbrom)、アメトクトラジン (ametoctradin)、シ
フルフェナミド (cyflufenamid)、バリダマイシンA (validamycin
10 A)、ポリオキシンB (polyoxin B)、ブラストサイジンS (blastocidin-S)、カスガマイシン (kasugamycin)、オキシリニック酸
(oxolinic acid) 等;

(4) 抵抗性誘導化合物

アシベンゾラルSメチル (acibenzolar-S-methyl)、プロベナゾ
15 ール (probenazole)、イソチアニル (isotianil) 及びチアジニル
(tiadinil)。

除草剤の有効成分

(1) フェノキシ脂肪酸除草性化合物

2, 4-PA、MCP、MCPB、フェノチオール (phenothiol)、メコプロ
20 ップ (mecoprop)、フルロキシピル (fluroxypyr)、トリクロピル
(triclopyr)、クロメプロップ (clomeprop)、及びナプロアニリド
(naproanilide)。

(2) 安息香酸除草性化合物

2, 3, 6-TBA、ジカンバ (dicamba)、クロピラリド (clopyralid)、
25 ピクロラム (picloram)、アミノピラリド (aminopyralid)、
キンクロラック (quinclorac)、及びキンメラック (quinmerac)。

(3) 尿素除草性化合物

ジウロン (diuron)、リニュロン (linuron)、クロルトロン (chlo

rtoluron)、イソプロツロン (isoproturon)、フルオメツロン (fluometuron)、イソウロン (isouron)、テブチウロン (tebuthiuron)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、クミルロン (cumyluron)、ダイムロン (daimuron)、及びメチルダイムロン (methyl-daimuron)。

(4) トリアジン除草性化合物

アトラジン (atrazine)、アメトリン (ametoryn)、シアナジン (cyanazine)、シマジン (simazine)、プロパジン (propazine)、シメトリン (simetryn)、ジメタメトリン (dimethametryn)、プロメトリン (prometryn)、メトリブジン (metribuzin)、トリアジフラム (triaziflam)、及びインダジフラム (indaziflam)。

(5) ビピリジニウム除草性化合物

パラコート (paraquat)、及びジクワット (diquat)。

(6) ヒドロキシベンゾニトリル除草性化合物

ブロモキシニル (bromoxynil)、及びアイオキシニル (ioxynil)。

(7) ジニトロアニリン除草性化合物

ペンディメタリン (pendimethalin)、プロジアミン (prodiamine)、及びトリフルラリン (trifluralin)。

(8) 有機リン除草性化合物

アミプロホスメチル (amiprofos-methyl)、ブタミホス (butamifos)、ベンスリド (bensulide)、ピペロホス (piperophos)、アニロホス (anilofos)、グリホサート (glyphosate)、グルホシネート (glufosinate)、グルホシネート-P (glufosinate-P)、及びビアラホス (bialaphos)。

(9) カーバメート除草性化合物

ジアレート (di-allate)、トリアレート (tri-allate)、EPTC、ブチレート (butylate)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、エスプロカルブ (esprocarb)、モリネート (molinate)、ジメピペレー

ト (dimepiperate)、スエップ (swep)、クロルプロファム (chlorpropham)、フェンメディファム (phenmedipham)、フェニソファム (phenisopham)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、及びアシュラム (asulam)。

5 (10) 酸アミド除草性化合物

プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、ブロモブチド (bromobutide)、及びエトベンザニド (etobenzanid)。

(11) クロロアセトアニリド除草性化合物

アセトクロール (acetochlor)、アラクロール (alachlor)、ブタクロール (butachlor)、ジメテナミド (dimethenamid)、プロパクロール (propachlor)、メタザクロール (metazachlor)、メトラクロール (metolachlor)、プレチラクロール (pretilachlor)、テニルクロール (thenylchlor)、及びペトキサミド (pethoxamid)。

15 (12) ジフェニルエーテル除草性化合物

アシフルオルフェン (acifluorfen-sodium)、ビフェノックス (bifenox)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、ラクトフェン (lactofen)、フオメサフェン (fomesafen)、クロメトキシニル (chloromethoxynil)、及びアクロニフェン (aclonifen)。

20 (13) 環状イミド除草性化合物

オキサジアゾン (oxadiazon)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、カルフェントラゾンエチル (carfentrazone-ethyl)、スルフェントラゾン (sulfentrazone)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl)、フルミオキサジン (flumioxazin)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、オキサジアルギル (oxadialargyl)、ペントキサゾン (pentoxazone)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、ブタフェナシル (butafenacil)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ベンカルバゾン (bencarbazone)、及びサフルフェナシル (saflufenacil)。

(14) ピラゾール除草性化合物

ベンゾフェナップ (benzofenap)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、トプラメゾン (topramezone)、及びピラスルホトール (pyrasulfotole)。

5 (15) トリケトン除草性化合物

イソキサフルトール (isoxaflutole)、ベンゾビスクロン (benzobicyclon)、スルコトリオン (sulcotrione)、メソトリオン (mesotrione)、テンボトリオン (tembotrione)、及びテフリルトリオン (tefuryltrione)。

10 (16) アリールオキシフェノキシプロピオン酸除草性化合物

クロジナホッププロパルギル (clodinafop-propargyl)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、ハロキシホップメチル (haloxyfop-methyl)、及びキザロホップエチル (quizalofop-ethyl)、メタミホップ (metamifop)。

(17) トリオンオキシム除草性化合物

アロキシジム (alloxym-sodium)、セトキシジム (sethoxym)、ブトロキシジム (butoxym)、クレソジム (clethodim)、クロプロキシジム (cloproxym)、シクロキシジム (cycloxydim)、テブラロキシジム (tepraloxym)、トラルコキシジム (tralkoxym)、及びプロフォキシジム (profoxym)。

(18) スルホニル尿素除草性化合物

クロルスルフロン (chlorsulfuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)、クロリムロンエチル (chlorimuron-ethyl)、トリベニユロンメチル (tribenuron-methyl)、トリアスルフロン (triasulfuron)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、チフェンスルフロンメチル (thifensulfuron-methyl)、ピラズス

ルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、シノスルフロン (cinosulfuron)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、プロスルフロン (prosulfuron)、エタメトスルフロンメチル (ethametsulfuron-methyl)、トリフルスルフロンメチル (triflusulfuron-methyl)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamuron)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、フォラムスルフロン (foramsulfuron)、メソスルフロンメチル (mesosulfuron-methyl)、トリフロキシスルフロン (trifloxy sulfuron)、トリトスルフロン (tritofosulfuron)、オルソスルフアムロン (orthosulfamuron)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、及びプロピリスルフロン (propyrisulfuron)。

(19) イミダゾリノン除草性化合物

イマザメタベンズメチル (imazamethabenz-methyl)、イマザメタピル (imazamethapyr)、イマザモックス (imazamox)、イマザピル (imazapyr)、イマザキン (imazaquin)、及びイマゼタピル (imazethapyr)。

(20) スルホンアミド除草性化合物

フルメトスラム (flumetsulam)、メトスラム (metosulam)、ジクロスラム (diclosulam)、フロラスラム (florasulam)、クロランスラムメチル (cloransulam-methyl)、ペノキススラム (penoxsulam)、及びピロキススラム (pyroxsulam)。

(21) ピリミジニルオキシ安息香酸除草性化合物

ピリチオバックナトリウム (pyrithiobac-sodium)、ビスピリバック
ナトリウム (bispyribac-sodium)、ピリミノバックメチル (pyri
minobac-methyl)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピ
リフタリド (pyrifthalid)、及びピリミスルファン (pyrimisulfa
5 n)。

(22) その他の除草性化合物

ベンタゾン (bentazon)、ブロマシル (bromacil)、ターバシル (te
rbacil)、クロルチアミド (chlorthiamid)、イソキサベン (iso
xaben)、ジノセブ (dinoseb)、アミトロール (amitrole)、シン
10 メチリン (cinmethylin)、トリジファン (tridiphane)、ダラポ
ン (dalapon)、ジフルフェンゾピルナトリウム (diflufenzopyr-
sodium)、ジチオピル (dithiopyr)、チアゾピル (thiazopyr
r)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazone-sodium)、プロポ
キシカルバゾンナトリウム (propoxycarbazine-sodium)、メフ
15 エナセット (mefenacet)、フルフェナセット (flufenacet)、フェ
ントラザミド (fentraxamide)、カフェンストロール (cafenstro
le)、インダノファン (indanofan)、オキサジクロメホン (oxazicl
omefone)、ベンフレセート (benfuresate)、ACN、ピリデート
(pyridate)、クロリダゾン (chloridazon)、ノルフルラゾン (n
20 orflurazon)、フルルタモン (flurtamone)、ジフルフェニカン
(diflufenican)、ピコリナフェン (picolinafen)、ベフルブ
タミド (beflubutamid)、クロマゾン (clomazone)、アミカルバ
ゾン (amicarbazine)、ピノキサデン (pinoxaden)、ピラクロニ
ル (pyraclonil)、ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、チエ
25 ンカルバゾンメチル (thiencarbazine-methyl)、アミノシクロピ
ラクロール (aminocyclopyrachlor)、イプフェンカルバゾン (ip
fencarbazine)、及びメチオゾリン (methiozolin)。

共力剤の有効成分

ピペロニル ブトキサイド (piperonyl butoxide)、セサメックス

(sesame x)、スルホキシド(sulfoxide)、N-(2-エチルヘキシル)-8, 9, 10-トリノルボルン-5-エン-2, 3-ジカルボキシイミド(MGK 264)、N-デクリイミダゾール(N-decylimidazole)、WARF-アンチレジスタント(WARF-antiresistant)、TBPT、TPP、IBP、PSCP、ヨウ化メチル(CH₃I)、t-フェニルブテノン(t-phenyl butenone)、ジエチルマレエート(diethylmaleate)、DMC、FDMC、ETP、及びETN。

実施例

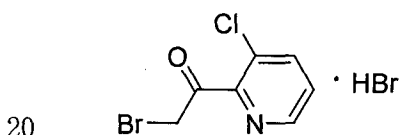
以下、本発明を製造例、参考製造例、製剤例及び試験例等でさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

まず、本発明化合物の製造について、製造例を示す。

製造例 1 (1)

1-(3-クロロピリジン-2-イル)エタノン 1.21 g、25%臭化水素-酢酸溶液 3 ml、酢酸 5 ml 及び水 2.5 ml の混合物に臭素 0.48 ml を 85°C で滴下し、85°C で 1 時間攪拌した。反応混合物を室温まで放冷し、析出した固体をろ過した。得られた固体を tert-ブチルメチルエーテルで洗浄後、乾燥して 2-ブロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-エタノン臭化水素酸塩 1.40 g を得た。

2-ブロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)エタノン臭化水素酸塩



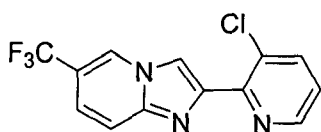
¹H-NMR (DMSO-D₆) δ: 8.68 (1H, dd), 8.14 (1H, dd), 7.70 (1H, dd), 4.96 (2H, s).

製造例 1 (2)

2-ブロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)エタノン臭化水素酸塩 700 mg、2-アミノ-5-トリフルオロメチルピリジン 360 mg、炭酸水素ナトリウム 187 mg 及びエタノール 4 ml の混合物を 3 時間還流した。反応混合物に炭酸水素ナトリウム 187 mg を加え、1 時間還流した。室温まで放冷した反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-クロロピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン426mgを得た。

2-(3-クロロピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン

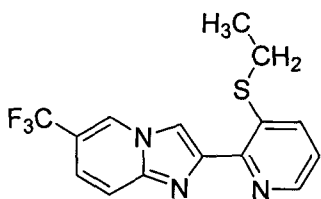


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.74 (1H, dd), 8.59–8.56 (1H, m), 8.52 (1H, s), 7.87–7.81 (2H, m), 7.37 (1H, dd), 7.29–7.24 (1H, m).

製造例1(3)

水素化ナトリウム(60%油性)40mg及びDMF1mLの混合物に、氷冷下でエタ
ンチオール63 μ Lを加えた後、DMF1.5mLに溶解させた2-(3-クロロピリジ
ン2-イル)-6-トリフルオロメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン213mgを加
えた。反応混合物を室温で30分間攪拌後、水に加え、tert-ブチルメチルエーテル
で抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得ら
れた固体をtert-ブチルメチルエーテル：ヘキサン=2：1の溶液で洗浄後、乾燥し
て2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルイミダ
ゾ[1,2-a]ピリジン(以下、本発明化合物1と記す)155mgを得た。

本発明化合物1



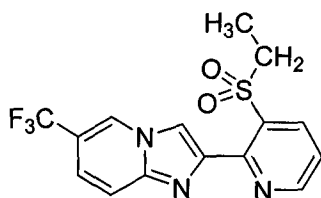
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.57–8.51 (2H, m), 8.43 (1H, s), 7.83 (1H, d), 7.71 (1H, dd), 7.34 (1H, dd), 7.27–7.22 (1H, m), 2.99 (2H, q), 1.37 (3H, t).

製造例2

本発明化合物1(155mg)及びクロロホルム2mLの混合物に、氷冷下、3-クロ

口過安息香酸（純度65%以上）265mgを添加し、室温で1時間攪拌した。反応混合物に10%チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた固体をtert-ブチルメチルエーテル：ヘキサン=2：1の溶液で洗浄後、乾燥して2-（3-エチルスルホニルピリジン-2-イル）-6-トリフルオロメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン（以下、本発明化合物2と記す）131mgを得た。

本発明化合物2

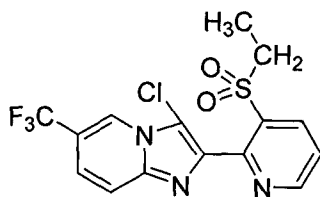


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.92 (1H, dd), 8.59–8.52 (2H, m), 8.33 (1H, s), 7.75 (1H, d), 7.54 (1H, dd), 7.39 (1H, dd), 3.81 (2H, q), 1.31 (3H, t).

製造例3

本発明化合物2（180mg）、N-クロロスクシンイミド68mg、DMF 2ml及びアセトニトリル0.5mlの混合物を50℃にて30分間攪拌した後、70℃にて1時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた固体をtert-ブチルメチルエーテル：ヘキサン=2：1の溶液で洗浄後、乾燥して3-クロロ-2-（3-エチルスルホニルピリジン-2-イル）-6-トリフルオロメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン（以下、本発明化合物3と記す）196mgを得た。

本発明化合物3

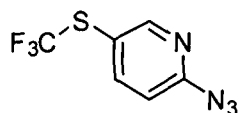


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.96 (1H, dd), 8.55–8.50 (2H, m), 7.72 (1H, d), 7.61 (1H, dd), 7.45 (1H, dd), 3.91 (2H, q), 1.36 (3H, t).

製造例 4

2-クロロ-5-トリフルオロメチルスルファニルピリジン 4 g、アジ化ナトリウム 1.22 g 及び NMP 10 ml の混合物を 50°C にて 3 時間攪拌し、80°C にて 3 時間攪拌した後、90°C にて 3 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-アジド-5-トリフルオロメチルスルファニルピリジン 894 mg を得た。

2-アジド-5-トリフルオロメチルスルファニルピリジン

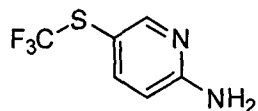


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.20–9.17 (1H, m), 8.12 (1H, d), 7.86 (1H, dd).

製造例 4 (2)

2-アジド-5-トリフルオロメチルスルファニルピリジン 894 mg、トリフェニルホスフィン 1.12 g、THF 6 ml 及び水 0.6 ml の混合物を室温にて 1 時間攪拌した後、50°C にて 2 時間攪拌した。反応混合物に 2N 塩酸 5 ml 加え、室温で 4 時間攪拌した。反応混合物に 1N 塩酸を加え、トルエンで洗浄した後、水層に 1M 水酸化ナトリウム水溶液を加えて中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下で濃縮して 2-アミノ-5-トリフルオロメチルスルファニルピリジン 567 mg を得た。

2-アミノ-5-トリフルオロメチルスルファニルピリジン



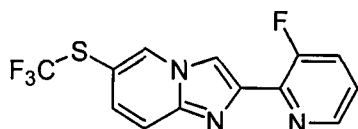
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.28 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 6.51 (1H, d), 4.77 (2H, brs).

製造例 4 (3)

2-アミノ-5-トリフルオロメチルスルファニルピリジン 567 mg、2-ブロモ-1-(3-フルオロピリジン-2-イル)エタノン臭化水素酸塩 1.05 g、炭酸水素ナ

トリウム 294 mg 及びエタノール 4 ml の混合物を 2 時間還流した。反応混合物に 2-
 ブロモ-1-(3-フルオロピリジン-2-イル)エタノン臭化水素酸塩 178 mg 及び
 炭酸水素ナトリウム 49 mg を加え、80 分間還流した。放冷した反応混合物に飽和炭酸
 5 水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリ
 ウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー
 に付し、2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルスルファニルイミダゾ
 [1, 2-a]ピリジン 665 mg を得た。

2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルスルファニルイミダ
 ゴ [1, 2-a]ピリジン

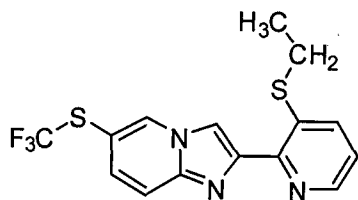


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.67–8.60 (1H, m), 8.57–8.53
 (1H, m), 8.30–8.25 (1H, m), 7.80–7.74 (1H, m),
 7.59–7.50 (1H, m), 7.43–7.36 (1H, m), 7.35–7.2
 9 (1H, m).

製造例 4 (4)

エタンチオール 0.19 ml、水素化ナトリウム (60%油性) 118 mg 及び DMF
 2 ml の混合物に、氷冷下にて 2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-6-トリフル
 オロメチルスルファニルイミダゾ [1, 2-a]ピリジン 657 mg と DMF 2 ml の混
 合物を加え、室温にて 1 時間攪拌した。反応混合物を水に注ぎ、析出した固体をろ過し
 20 た。得られた固体を水及びヘキサンで洗浄後、乾燥して 2-(3-エチルスルファニルピ
 リジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルスルファニルイミダゾ [1, 2-a]ピ
 リジン (以下、本発明化合物 11 と記す) 616 mg を得た。

本発明化合物 11



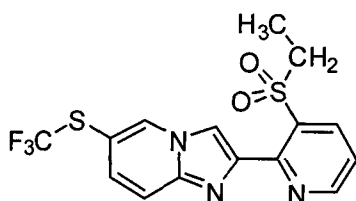
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.54–8.51 (2H, m), 8.37 (1H,

d), 7.77–7.73 (1H, m), 7.70 (1H, dd), 7.36 (1H, dd), 7.24 (1H, dd), 2.99 (2H, q), 1.38 (3H, t).

製造例5

本発明化合物11 (616mg) 及び酢酸エチル20mlの混合物に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸 (純度65%以上) 797mgを加え、室温にて3時間攪拌した。反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、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で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下で濃縮して2-(3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルスルファニルイミダゾ[1,2-a]ピリジン (以下、本発明化合物12と記す) 642mgを得た。

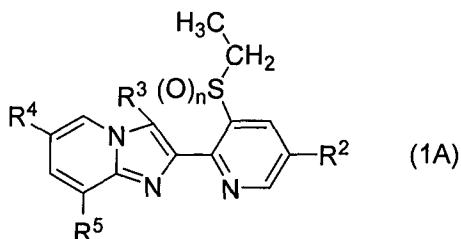
本発明化合物12



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.91 (1H, dd), 8.57–8.53 (2H, m), 8.28 (1H, d), 7.67 (1H, d), 7.54 (1H, dd), 7.41 (1H, dd), 3.86 (2H, q), 1.32 (3H, t).

前記の製造例に記載の化合物及び前記の製造例に記載の方法に準じた製造方法により製造される化合物を表に示す。

式(1A)で表される化合物。



式中の R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び n は〔表3〕に記載の組み合わせを表す。

表3

本発明化合物	R^2	R^3	R^4	R^5	n
1	H	H	CF_3	H	0
2	H	H	CF_3	H	2

〔表3〕～〔表5〕に記載した本発明化合物の ^1H -NMRデータを以下に示す。

本発明化合物4

^1H -NMR (CDCl_3) δ : 8.96 (1H, dd), 8.59–8.57 (1H, m), 8.52 (1H, dd), 7.72 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 7.46 (1H, dd), 3.88 (2H, q), 1.35 (3H, t).

本発明化合物5

^1H -NMR (CDCl_3) δ : 8.71 (1H, s), 8.58 (1H, s), 8.48 (1H, s), 7.87–7.82 (2H, m), 7.38 (1H, dd), 3.05 (2H, q), 1.43 (3H, t).

本発明化合物6

^1H -NMR (CDCl_3) δ : 9.12 (1H, d), 8.78 (1H, d), 8.59 (1H, d), 8.40 (1H, s), 7.76 (1H, d), 7.41 (1H, dd), 4.05 (2H, q), 1.38 (3H, t).

15 本発明化合物7

^1H -NMR (CDCl_3) δ : 8.56–8.54 (1H, m), 8.44 (1H, d), 8.38 (1H, s), 7.82 (1H, d), 7.63 (1H, d), 7.35 (1H, dd), 3.00 (2H, q), 1.41 (3H, t).

本発明化合物8

20 ^1H -NMR (CDCl_3) δ : 8.84 (1H, d), 8.56 (1H, d), 8.53 (1H, d), 8.31 (1H, s), 7.74 (1H, d), 7.39 (1H, dd), 3.91 (2H, q), 1.35 (3H, t).

本発明化合物16

25 ^1H -NMR (CDCl_3) δ : 8.56 (1H, d), 8.35 (1H, d), 8.23 (1H, s), 7.73 (1H, d), 7.37 (1H, dd), 6.88 (1H, d), 4.05 (3H, s), 3.87 (2H, q), 1.32 (3H, t).

次に本発明化合物の製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

製剤例1

本発明化合物1～18のいずれか1種 10部を、キシレン35部とN, N-ジメチル

ホルムアミド 35 部との混合物に溶解し、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部及びドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、混合して各々の乳剤を得る。

製剤例 2

- 5 ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、シリカ微粉末 20 部及び珪藻土 54 部を混合し、更に本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 20 部を加え、混合して各々の水和剤を得る。

製剤例 3

- 10 本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 2 部に、シリカ微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部及びカオリン 65 部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

製剤例 4

- 15 本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 1 部を適当量のアセトンに溶解し、これにシリカ微粉末 5 部、PAP0.3 部及びパイロフィライト 93.7 部を加え、充分攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の粉剤を得る。

製剤例 5

- 20 ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩及びホワイトカーボンの混合物（重量比 1：1）35 部と、本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 10 部と、水 55 部とを混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々のフロアブル剤を得る。

製剤例 6

本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 0.1 部をキシレン 5 部及びトリクロロエタン 5 部に溶解し、これを脱臭灯油 89.9 部に混合して各々の油剤を得る。

25 製剤例 7

本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 10mg をアセトン 0.5ml に溶解し、この溶液を、動物用固形飼料粉末（飼育繁殖用固形飼料粉末 CE-2、日本クレア株式会社商品）5g に処理し、均一に混合する。ついでアセトンを蒸発乾燥させて各々の毒餌剤を得る。

製剤例 8

本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 0. 1 部、ネオチオゾール（中央化成株式会社）49. 9 部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、ジメチルエーテル 25 部、LPG 25 部を充填し振とうを加え、アクチュエータを装着することで油剤エアゾールを得る。

製剤例 9

本発明化合物 1～18 のいずれか 1 種 0. 6 部、BHT（2, 6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）0. 01 部、キシレン 5 部、脱臭灯油 3. 39 部及び乳化剤〔レオドールMO-60（花王株式会社製）〕1 部を混合溶解したものと、蒸留水 50 部とをエアゾール容器に充填し、バルブを装着した後、該バルブを通じて噴射剤（LPG）40 部を加圧充填して水性エアゾールを得る。

製剤例 10

本発明化合物 1～18 のいずれか 0. 1 g を、プロピレングリコール 2 ml に溶解させ、4. 0×4. 0 cm、厚さ 1. 2 cm の多孔セラミック板に含浸させて、加熱式くん煙剤を得る。

製剤例 11

本発明化合物 1～18 のいずれか 5 部とエチレン-メタクリル酸メチル共重合体（共重合体中のメタクリル酸メチルの割合：10 重量%、アクリフトWD301、住友化学製）95 部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で熔融混練し、得られた混練物を押出し成型機から成型ダイスを介して押出し、長さ 15 cm、直径 3 mm の棒状成型体を得る。

製剤例 12

本発明化合物 1～18 のいずれか 5 部と軟質塩化ビニル樹脂 95 部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で熔融混練し、得られた混練物を押出し成型機から成型ダイスを介して押出し、長さ 15 cm、直径 3 mm の棒状成型体を得る。

製剤例 13

本発明化合物 1～18 のいずれか 100 mg、ラクトース 68. 75 mg、トウモロコシデンプン 237. 5 mg、微結晶性セルロース 43. 75 mg、ポリビニルピロリドン 18. 75 mg、ナトリウムカルボキシメチルデンプン 28. 75 mg、及びステアリン酸マグネシウム 2. 5 mg を混合し、得られた混合物を適切な大きさに圧縮して、錠剤を

得る。

製剤例 14

本発明化合物 1～18 のいずれか 25mg、ラクトース 60mg、トウモロコシデンプン 25mg、カルメロースカルシウム 6mg、及び 5% ヒドロキシプロピルメチルセルロース適量を混合し、得られた混合物をハードシェルゼラチンカプセル又はヒドロキシプロピルメチルセルロースカプセルに充填し、カプセル剤を得る。

製剤例 15

本発明化合物 1～18 のいずれか 1000mg、フマル酸 500mg、塩化ナトリウム 2000mg、メチルパラベン 150mg、プロピルパラベン 50mg、顆粒糖 2500mg、ソルビトール（70% 溶液）13000mg、Vee gum K（Vanderbilt Co.）100mg、香料 35mg、及び着色料 500mg に、最終容量が 100ml となるよう蒸留水を加え、混合して、経口投与用サスペンションを得る。

製剤例 16

本発明化合物 1～18 のいずれか 5 重量%を、ポリソルベート 85 5 重量%、ベンジルアルコール 3 重量%、及びプロピレングリコール 30 重量%に溶解し、この溶液の pH が 6.0～6.5 となるようにリン酸塩緩衝液を加えた後、最終容量となるまで水を加えて、経口投与用液剤を得る。

製剤例 17

分留ヤシ油 57 重量%及びポリソルベート 85 3 重量%中にジステアリン酸アルミニウム 5 重量%を加熱により分散させる。これを室温に冷却し、その油状ビヒクル中のサッカリン 25 重量%を分散させる。これに本発明化合物 1～18 のいずれか 10 重量%を配分し、経口投与用ペースト状製剤を得る。

製剤例 18

本発明化合物 1～18 のいずれか 5 重量%を石灰石粉 95 重量%と混合し、湿潤顆粒形成法を使用して経口投与用粒剤を得る。

製剤例 19

本発明化合物 1～18 のいずれか 5 部をジエチレングリコールモノエチルエーテル 80 部に溶解し、これに炭酸プロピレン 15 部を混合して、スポットオン液剤を得る。

製剤例 20

本発明化合物 1 ～ 18 のいずれか 10 部をジエチレングリコールモノエチルエーテル 70 部に溶解し、これに 2-オクチルドデカノール 20 部を混合して、ポアオン液剤を得る。

製剤例 2 1

- 5 本発明化合物 1 ～ 18 のいずれか 0.5 部に、ニッコール TEALS-42（日光ケミカルズ・ラウリル硫酸トリエタノールアミンの 42% 水溶液）60 部、プロピレングリコール 20 部を添加し、均一溶液になるまで充分攪拌混合した後、水 19.5 部を加えてさらに充分攪拌混合し、均一溶液のシャンプー剤を得る。

製剤例 2 2

- 10 本発明化合物 1 ～ 18 のいずれか 0.15 重量%、動物飼料 95 重量%、並びに、第 2 リン酸カルシウム、珪藻土、Aerosil、及びカーボネート（又はチョーク）からなる混合物 4.85 重量%を充分攪拌混合し、動物用飼料プレミックスを得る。

製剤例 2 3

- 15 本発明化合物 1 ～ 18 のいずれか 7.2 g、及びホスコ S-55（丸石製薬株式会社製）92.8 g を 100℃で溶解混和し、坐剤形に注いで、冷却固化して、坐剤を得る。

製剤例 2 4

- 20 本発明化合物 1 ～ 18 のいずれか 1 種 10 部、ポリオキシアルキレンアリールフェニルエーテルリン酸塩 2 部、プロピレングリコール 5 部、シリコーン系消泡剤 0.2 部及び水 58.5 部を混合し、湿式粉碎法により微粉碎し、懸濁液を得る。該懸濁液に、ケイ酸アルミニウムマグネシウム 0.4 部、キサンタンガム 0.2 部、防腐剤 0.2 部及び水 23.5 部の混合物を加えて混合し、各々のフロアブル剤を得る。

製剤例 2 5

- 25 水 43.5 部にポリビニルアルコール 3 部を溶解させて調製されるポリビニルアルコール水溶液に、本発明化合物 1 ～ 18 のいずれか 1 種 10 部及び芳香族炭化水素（Solvesso 200ND、ExxonMobil Chemical 社製）20 部の混合物を加え、攪拌機を用いて攪拌することにより、乳濁液を得る。該乳濁液に、ケイ酸アルミニウムマグネシウム 0.3 部、キサンタンガム 0.15 部、防腐剤 0.2 部及び水 17.65 部の混合物と、プロピレングリコール 5 部と、シリコーン系消泡剤 0.2 部とを加えて混合し、各々のフロアブル剤を得る。

製剤例 26

本発明化合物 1～18 の各々 3.6 部とアセトン 14.3 部とを混合し溶液を得る。これに、酸化亜鉛 0.2 部、 α -澱粉 1.0 部及びアゾジカルボンアミド 42.8 部を加え、水 38.1 部を加えて混練、押出機で顆粒状に成形、乾燥させる。中央部がアルミ製隔壁で区分された容器の上部空間に前記本発明化合物を含有する顆粒を、酸化カルシウム 50 g をこの容器の下部空間に収容し、燻煙剤を得る。

製剤例 27

酸化亜鉛 0.5 部、 α -澱粉 2 部、及びアゾジカルボンアミド 97.5 部を混合し、ここに水を加えて混練し、混練物を押出機で顆粒状に成形し、乾燥して顆粒を得る。この顆粒 2 g に本発明化合物 1～18 の各々 0.58 g を含有するアセトン溶液を均一に含浸させた後、乾燥して本発明化合物 1～18 の各々を含有する顆粒を得る。中央部がアルミ製隔壁で区分された容器の上部空間に前記本発明化合物を含有する顆粒を、酸化カルシウム 50 g をこの容器の下部空間に収容し、燻煙剤を得る。

次に、本発明化合物の有害生物防除効力を試験例により示す。

試験例 1

製剤例 5 により得られた本発明化合物 2、3、4、6、12 及び 16 の製剤を、各々有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたキュウリ幼苗（第 1 本葉展開期）にワタアブラムシ（*Aphis gossypii*）（全ステージ）約 30 頭を接種し、1 日間放置した。

この幼苗に、前記試験用薬液 20 ml を散布した。

散布 6 日後に該キュウリの葉上に寄生したワタアブラムシ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{ 1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の処理前の虫数

C_{ai} : 無処理区の観察時の虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

T_{ai} : 処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量

の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 2、3、4、6、12 及び 16 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90%以上を示した。

試験例 2

- 5 製剤例 5 により得られた本発明化合物 2、3、4 及び 6 の製剤を、各々有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたキュウリ幼苗（第 2 本葉展開期）に、前記試験用薬液 5 ml を株元灌注し、7 日間 25℃温室内に保った。ワタアブラムシ（*Aphis gossypii*）（全ステージ）約 30 頭をキュウリ葉面に接種し、更に 6 日該温室内に
10 保った後に、該キュウリの葉上に寄生したワタアブラムシ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の処理前の虫数

15 C_{ai} : 無処理区の観察時の虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

T_{ai} : 処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

- 20 その結果、本発明化合物 2、3、4 及び 6 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90%以上を示した。

試験例 3

製剤例 5 により得られた本発明化合物 2 及び 12 の製剤を、各々有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

- 25 ポリエチレンカップに植えた第 2 葉展開期のイネ幼苗に、前記試験用薬液 10 ml を散布した。風乾後、トビイロウンカ（*Nilaparvata lugens*）の 3~4 齢幼虫を 20 頭放して、25℃の温室内に保管した。6 日後イネに寄生したトビイロウンカの数調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

5 T a i : 処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 2 及び 1 2 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 9 0 % 以上を示した。

10 試験例 4

製剤例 5 により得られた本発明化合物 2 の製剤を、各々有効成分濃度が 5 0 0 p p m となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたイネ幼苗（播種 2 週間後、第 2 葉展開期）に、前記試験用薬液 5 m l を株元灌注し、7 日間 2 5 ° C 温室内に保った。トビイロウンカ（*N i l*
15 *a p a r v a t a l u g e n s*）の 3 ~ 4 齢幼虫を 2 0 頭放して、更に 6 日該温室内に保った後に、該イネの葉上に寄生したトビイロウンカ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 1 0 0$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

20 C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の虫数

25 ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 2 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 9 0 % 以上を示した。

試験例 5

製剤例 5 により得られた本発明化合物の製剤を、各々有効成分濃度が 5 0 0 p p m とな

るように水で希釈し、試験用薬液を調製する。

一方、ポリエチレンカップに植えたトマト幼苗（第3本葉展開期）に、タバココナジラミ（*Bemisia tabaci*）成虫を放ち、約72時間産卵させる。該トマト苗を8日間温室内に保持し、産下された卵から幼虫が孵化してきたところへ前記試験用薬液を20mL／カップの割合で散布し、25℃で温室内に保持する。7日後トマト葉上の生存幼虫数の調査を行い、次の式により防除価を求める。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{a_i}) / (C_{a_i} \times T_b)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の処理前の虫数

C_{a_i} : 無処理区の観察時の虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

T_{a_i} : 処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例5において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物の試験用薬液を用いた処理区は、防除価90%以上を示す。

試験例6

製剤例5により得られた本発明化合物2、3、4、6、12及び16の製剤を、各々有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、ポリエチレンカップに植えた3葉期キャベツに、前記試験用薬液を20mL／カップの割合で散布した。薬液が乾いた後、莖葉部を切り取って50mLカップに収容し、コナガ（*Plutella xylostella*）2令幼虫5頭を放ち、蓋をした。25℃で保管し、5日後に生存虫数を数え、次式より死虫率を求めた。

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

その結果、本発明化合物2、3、4、6、12及び16の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率80%以上を示した。

試験例7

製剤例5により得られた本発明化合物2及び6の製剤を、各々有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

一方、プラスチックカップにリンゴを植え、第7本葉ないしは第8本葉が展開するまで生

育させた。そのリングに上記試験用薬液を20mL／カップの割合で散布した。薬液が乾いた後、リングコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*) 初齢幼虫60頭を放ち、底面をくりぬき、ろ紙を貼ったプラスチックカップを逆さにして被せた。7日後に生存虫数を数え、次式より死虫率を求めた。

5
$$\text{死虫率 (\%)} = (\text{死亡虫数} / \text{供試虫数}) \times 100$$

その結果、本発明化合物2及び6の試験用薬液の処理区は、死虫率90%以上を示した。

試験例8

10 製剤例5により得られた本発明化合物2及び6の各々の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

直径5.5cmのポリエチレンカップの底に同大の濾紙を敷き、上記試験用薬液0.7mLを濾紙上に滴下し、餌としてショ糖30mgを均一に入れた。該ポリエチレンカップ内にイエバエ (*Musca domestica*) 雌成虫10頭を放ち、蓋をした。24時間後にイエバエの生死を調査し、次式より死虫率を求めた。

15
$$\text{死虫率 (\%)} = (\text{死亡虫数} / \text{供試虫数}) \times 100$$

その結果、本発明化合物2及び6の処理においては死虫率100%を示した。

試験例9

製剤例5により得られた本発明化合物の各々の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製する。

20 直径5.5cmのポリエチレンカップの底に同大の濾紙を敷き、上記試験用薬液0.7mLを濾紙上に滴下し、餌としてショ糖30mgを均一に入れる。該ポリエチレンカップ内にチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 雄成虫2頭を放ち、蓋をする。6日後にチャバネゴキブリの生死を調査し、次式より死虫率を求める。

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

25 その結果、本発明化合物の処理においては死虫率100%を示す。

試験例10

製剤例5により得られた本発明化合物2、3、6、12及び16の各々の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

上記試験用薬液0.7mLをイオン交換水100mLに加えた（有効成分濃度3.5p

pm)。該液中にアカイエカ (*Culex pipiens pallens*) 終令幼虫 20頭を放ち、1日後にその生死を調査し、次式より死虫率を求めた。

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

その結果、本発明化合物 2、3、6、12 及び 16 の処理においては死虫率 95% 以

5 上を示した。

試験例 11

本発明化合物の各々 2mg をスクリー管 (マルエム (登録商標) No. 5; 27 × 55mm) に量り取りアセトン 0.2mL を加えて蓋をし溶解する。スクリー管を回転・反転させ内壁全体に均一になるよう薬液をコーティングする。蓋を取り約 2 時間風乾
10 させた後、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*) 未吸血若ダニ 1 群 5 頭を放し蓋をする。2 日後に致死数を調査し、以下の計算式で死虫率を算出する。

$$\text{死虫率 (\%)} = 100 \times (\text{死亡マダニ数} / \text{供試マダニ数})$$

その結果、本発明化合物の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率 100% を示す。

15

産業上の利用可能性

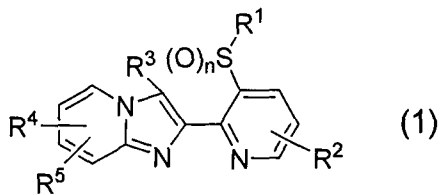
本発明化合物は、有害生物に対して防除効力を有し、有害生物防除剤の有効成分として有用である。

20

請求の範囲

[請求項 1]

式 (1)



[式中、

R^1 はC 1－C 4アルキル基、シクロプロピル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^2 はC 1－C 3アルキル基、C 1－C 3ハロアルキル基、 $-OR^6$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^3 はC 1－C 3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^4 はC 1－C 3ハロアルキル基又は $-S(O)_m R^7$ を表し、

R^5 はC 1－C 3アルキル基、C 1－C 3ハロアルキル基、 $-OR^8$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^6 及び R^8 は同一又は相異なり、C 1－C 3アルキル基又はC 1－C 3ハロアルキル基を表し、

R^7 はC 1－C 3ハロアルキル基を表し、

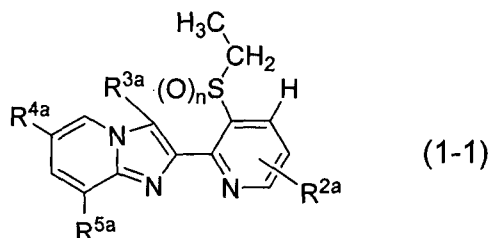
n は0、1又は2を表し、

m は0、1又は2を表す。]

で示される縮合複素環化合物、又はそのN－オキシド。

[請求項 2]

式 (1-1)



[式中、

R^{2a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、 $-OR^{6a}$ 、ハロゲン原子又は水素原子を

表し、

R^{3a} はC 1－C 3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

R^{5a} はC 1－C 3アルキル基、 $-OR^{8a}$ 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

5 R^{6a} 又は R^{8a} は同一又は相異なり、C 1－C 3アルキル基を表し、

R^{7a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基を表し、

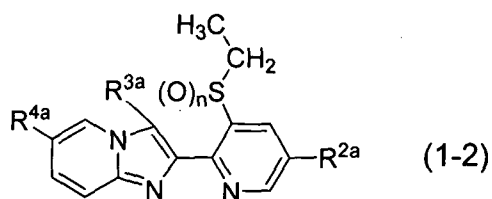
n は0、1又は2を表し、

m は0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN－オキシド。

10 [請求項3]

式(1-2)



[式中、

R^{2a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

15 R^{3a} はC 1－C 3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

R^{7a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基を表し、

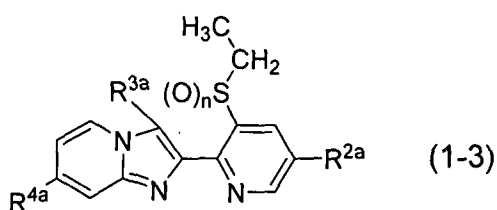
n は0、1又は2を表し、

m は0、1又は2を表す。]

20 で示される化合物、又はそのN－オキシド。

[請求項4]

式(1-3)



[式中、

R^{2a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} はC 1－C 3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{4a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基又は $-S(O)_m R^{7a}$ を表し、

R^{7a} はC 1－C 3パーフルオロアルキル基を表し、

5 n は0、1又は2を表し、

m は0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN－オキシド。

[請求項5]

R^2 又は R^{2a} が水素原子である [1] ～ [4] のいずれかに記載の化合物。

10 [請求項6]

R^2 又は R^{2a} がトリフルオロメチル基である [1] ～ [4] のいずれかに記載の化合物。

[請求項7]

R^3 又は R^{3a} が水素原子である [1] ～ [4] のいずれかに記載の化合物。

15 [請求項8]

R^4 又は R^{4a} がトリフルオロメチル基である [1] ～ [4] のいずれかに記載の化合物。

[請求項9]

[1] ～ [8] のいずれかに記載の化合物と不活性担体とを含有する有害生物防除剤。

20 [請求項10]

[1] ～ [8] のいずれかに記載の化合物の有効量を有害生物又はその生息場所に施用する有害生物の防除方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/084176

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D487/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D487/04, A01N43/90, A01P7/02, A01P7/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2014
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2014	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2014

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
E, X	WO 2013/191113 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 27 December 2013 (27.12.2013), claims; page 67, lines 12 to 16; page 69, line 28 to page 70, line 5; table 17 (Family: none)	1-9
A	WO 2013/180194 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 05 December 2013 (05.12.2013), claims (Family: none)	1-9
A	JP 10-298011 A (Nippon Soda Co., Ltd.), 10 November 1998 (10.11.1998), claims (Family: none)	1-9

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
11 March, 2014 (11.03.14)

Date of mailing of the international search report
25 March, 2014 (25.03.14)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/084176

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2008-308448 A (Sankyo Agro Co., Ltd.), 25 December 2008 (25.12.2008), claims (Family: none)	1-9
A	JP 8-506331 A (Bayer AG.), 09 July 1996 (09.07.1996), claims & CN 1117732 A & US 5658857 A & WO 1994/018198 A1	1-9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/084176

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 10
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
(See extra sheet)
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/084176

Continuation of Box No.II-1 of continuation of first sheet(2)

Since it is considered that claim 10 involves a method for treatment of the human body or animal body by therapy, the claim relates to a subject matter on which this International Searching Authority is not required to carry out an international search under the provisions of PCT Article 17(2)(a)(i) and [PCT Rule 39.1(iv)].

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. C07D487/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. C07D487/04, A01N43/90, A01P7/02, A01P7/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 1 4 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 1 4 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 1 4 年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

REGISTRY (STN)
CAplus (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
E, X	WO 2013/191113 A1（住友化学株式会社）2013. 12. 27, 請求の範囲、第 67 頁第 12-16 行、第 69 頁第 28 行-第 70 頁第 5 行、 表 17 (ファミリーなし)	1-9
A	WO 2013/180194 A1（住友化学株式会社）2013. 12. 05, 請求の範囲 (ファミリーなし)	1-9

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

1 1 . 0 3 . 2 0 1 4

国際調査報告の発送日

2 5 . 0 3 . 2 0 1 4

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁（I S A / J P）
郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5
東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号

特許庁審査官（権限のある職員）

江間 正起

4 P

4 0 4 8

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 10-298011 A (日本曹達株式会社) 1998. 11. 10, 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-9
A	JP 2008-308448 A (三共アグロ株式会社) 2008. 12. 25, 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-9
A	JP 8-506331 A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト) 1996. 07. 09, 特許請求の範囲 & CN 1117732 A & US 5658857 A & WO 1994/018198 A1	1-9

第Ⅱ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求項 10 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、
請求項10は、治療による人体又は動物の体の処置方法を包含するものと認められるから、PCT17条(2)(a)(i)及び[PCT規則39.1(iv)]の規定により、この国際調査機関が国際調査をすることを要しない対象に係るものである。
2. ☐ 請求項 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求項 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅲ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求項について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求項について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求項のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求項について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料及び、該当する場合には、異議申立手数料の納付と共に、出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあったが、異議申立手数料が納付命令書に示した期間内に支払われなかった。
- ☐ 追加調査手数料の納付はあったが、異議申立てはなかった。