

(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  
2016年3月17日(17.03.2016)



(10) 国際公開番号  
WO 2016/039444 A1

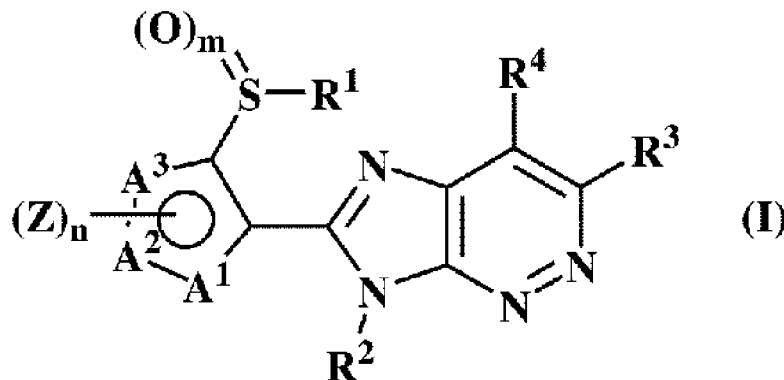
- (51) 国際特許分類:  
C07D 487/04 (2006.01) A61K 31/5025 (2006.01)  
A01N 43/90 (2006.01) A61P 33/10 (2006.01)  
A01N 47/02 (2006.01) A61P 33/14 (2006.01)  
A01P 7/04 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2015/075845
- (22) 国際出願日: 2015年9月11日(11.09.2015)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願 2014-186649 2014年9月12日(12.09.2014) JP  
特願 2014-201326 2014年9月30日(30.09.2014) JP
- (71) 出願人: 日本農薬株式会社(NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1048386 東京都中央区京橋1丁目19番8号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 松尾 宗一郎(MATSUO, Soichiro); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 諏訪明之(SUWA, Akiyuki); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP).
- (74) 代理人: 岩谷 龍(IWATANI, Ryo); 〒5300003 大阪府大阪市北区堂島2丁目1番31号 京阪堂島ビル3階 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, 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, ST, 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: IMIDAZOPYRIDAZINE COMPOUND OR SALTS THEREOF, AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL INSECTICIDE CONTAINING SAID COMPOUND, AND USE OF SAME

(54) 発明の名称: イミダゾピリダジン化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



(57) Abstract: The purpose of the present invention is to disclose and provide an agricultural and horticultural insecticide that is novel in terms of factors such as the occurrence of pests resistant to existing chemicals, since damage due to pests and the like is still significant in crop production such agriculture and horticulture. Provided are an imidazopyridazine compound represented by general formula (I) (in the formula, A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, A<sup>3</sup>, and A<sup>4</sup> may be the same or different, and indicate a nitrogen atom or CH group, R<sup>1</sup> indicates an alkyl group, R<sup>2</sup> indicates an alkyl group, R<sup>3</sup> indicates a haloalkyl group, R<sup>4</sup> indicates a hydrogen atom, Z indicates a haloalkyl group or the like, m indicates 0 or 2, n indicates 1) or salts thereof, an agricultural and horticultural insecticide having the same as an active ingredient, and a method for using this insecticide.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2016/039444 A1

---

本発明は、農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害が今なお大きいことから、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤を開発し、提供することを課題とし、一般式 (I) {式中、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 又は $A^4$ は、同一又は異なっても良く、窒素原子又はCH基を示し、 $R^1$ はアルキル基を示し、 $R^2$ はアルキル基を示し、 $R^3$ は、ハロアルキル基を示し、 $R^4$ は水素原子を示し、Zはハロアルキル基等を示し、mは0又は2を示し、nは1を示す。}で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類、これを有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法を提供する。

## 明 細 書

発明の名称：

イミダゾピリダジン化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

### 技術分野

[0001] 本発明は、新規なイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びに該使用方法に関する。

### 背景技術

[0002] これまでに農園芸用殺虫剤として様々な化合物が検討されており、ある種の縮合複素環化合物が殺虫剤として有用であることが報告されている（例えば特許文献1～6参照）。かかる文献中には、イミダゾピリダジンからなる化合物は、一切開示されていない。

### 先行技術文献

#### 特許文献

- [0003] 特許文献1：特開2009-280574号公報  
特許文献2：特開2010-275301号公報  
特許文献3：特開2011-79774号公報  
特許文献4：特開2012-131780号公報  
特許文献5：国際公開第2012/086848号パンフレット  
特許文献6：国際公開第2013/018928号パンフレット

### 発明の概要

#### 発明が解決しようとする課題

[0004] 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤であって、毒性の軽減された薬剤の開発が望まれている。

#### 課題を解決するための手段

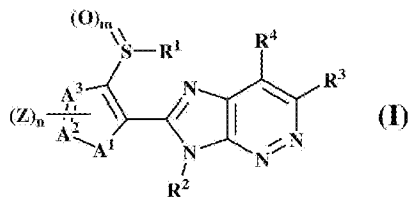
[0005] 本発明者等は上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、一般式 (I) で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類が農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有すると共に、防除対象以外の生物に対する毒性が軽減されることを見出し、本発明に至った。

[0006] 即ち本発明は、

[1]

一般式 (I) :

[0007] [化1]



{式中、R<sup>1</sup>は、(a 1) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(a 2) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルケニル基；

(a 3) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルキニル基；

(a 4) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル基又は

(a 5) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、

R<sup>2</sup>は、(b 1) 水素原子；

(b 2) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(b 3) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルケニル基；

(b 4) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルキニル基；

(b 5) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル基又は

(b 6) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、

R<sup>3</sup>は、

(c 1) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(c 2) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルコキシ基；

(c 3) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(c 4) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルコキシ基；

- (c 5) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルチオ基 ;
- (c 6) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基 ;
- (c 7) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基 ;
- (c 8) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルチオ基 ;
- (c 9) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基又は
- (c 10) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基を示し、

R<sup>4</sup>は、

- (d 1) 水素原子 ;
- (d 2) ハロゲン原子 ;
- (d 3) シアノ基 ;
- (d 4) ニトロ基 ;
- (d 5) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基又は
- (d 6) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルコキシ基を示し、

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、及びA<sup>3</sup>は同一又は異なっても良く、窒素原子、硫黄原子、又はC  
Hを示し、

Zは、同一又は異なってもよく、

- (e 1) 水素原子 ;
- (e 2) ハロゲン原子 ;
- (e 3) シアノ基 ;
- (e 4) ニトロ基 ;
- (e 5) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基 ;
- (e 6) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルコキシ基 ;
- (e 7) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基 ;
- (e 8) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルコキシ基 ;
- (e 9) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルチオ基 ;
- (e 10) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基 ;
- (e 11) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基 ;
- (e 12) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルチオ基 ;

(e 1 3) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基又は  
(e 1 4) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基を示し、nは1～2の整数を示し、mは0～2の整数を示す。} で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類、

[0008] [2] R<sup>1</sup>が、

(a 1) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、  
R<sup>2</sup>が、  
(b 2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、  
R<sup>3</sup>が、(c 3) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は  
(c 8) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基を示し、  
R<sup>4</sup>が、(d 1) 水素原子を示し、  
A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、及びA<sup>3</sup>が、同一又は異なっても良く、窒素原子、硫黄原子、又は  
CHを示し、Zが、同一又は異なってもよく、  
(e 1) 水素原子；  
(e 2) ハロゲン原子；  
(e 5) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は  
(e 7) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示す、[1]に記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類、

[0009] [3] A<sup>2</sup>及びA<sup>3</sup>がCHで、A<sup>1</sup>が硫黄である[1]又は[2]に記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類、

[4] [1]乃至[3]の何れかに記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類の農園芸用殺虫剤としての使用、

[5] [5]に記載の農園芸用殺虫剤の有効成分で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用法、

[6] 有効量の[4]に記載の農園芸用殺虫剤で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用害虫の防除方法、

[7] [1]1乃至[3]の何れかに記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする外部寄生生物防除剤、

[8] 有効量の[7]に記載の外部寄生生物防除剤を外部寄生生物に接触させることを特徴とする外部寄生生物の防除方法、に関する。

### 発明の効果

[0010] 本発明のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類は農園芸用殺虫剤として優れた効果を有するだけでなく、犬や猫といった愛玩動物、又は牛や羊等の家畜の体外又は体内に寄生する害虫に対しても殺虫効果を有する。

### 発明を実施するための形態

[0011] 本発明のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類の一般式(1)の定義において、「ハロ」とは「ハロゲン原子」を意味し、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

[0012] 「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、イソペンチル基、ターシャリーペンチル基、ネオペンチル基、2,3-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、ノルマルヘキシル基、イソヘキシル基、2-ヘキシル基、3-ヘキシル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、1,1,2-トリメチルプロピル基、3,3-ジメチルブチル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニル基」とは、例えばビニル基、アリル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、ペンテニル基、1-ヘキセニル基、3,3-ジメチル-1-ブテニル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数2~6個のアルケニル基を示し、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニル基」とは、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、3-メチル-1-プロピニル基、2-メチル-3-プロピニル基、ペンチニル基、1-ヘキシニル基、3-メチル-1-ブチニル基、3,3-

ジメチル-1-ブチニル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニル基を示す。

[0013] 「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル基」とは、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素原子数3~6個の環状のアルキル基を示し、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ターシャリーペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、2,3-ジメチルプロピルオキシ基、1-エチルプロピルオキシ基、1-メチルブチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、1,1,2-トリメチルプロピルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルコキシ基を示し、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基」としては、例えば、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基、ペンテニルオキシ基、ヘキセニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルケニルオキシ基を示し、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルオキシ基」としては、例えば、プロピニルオキシ基、ブチニルオキシ基、ペンチニルオキシ基、ヘキシニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルオキシ基を示す。

[0014] 「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基」としては、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ターシャリーペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、2,3-ジメチルプロピルチオ基、1-エチルプロピルチオ基、1-メチルブチルチオ基、ノルマルヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、1,1,2-トリメチルプロピルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルチオ基を示し、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基」としては、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ノルマ

ルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ターシャリーペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、2, 3-ジメチルプロピルスルフィニル基、1-エチルプロピルスルフィニル基、1-メチルブチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルフィニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルスルフィニル基を示し、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基」としては、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリーブチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ターシャリーペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、2, 3-ジメチルプロピルスルホニル基、1-エチルプロピルスルホニル基、1-メチルブチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルホニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルスルホニル基を示す。

[0015] 上記「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル基」、「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルオキシ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニルオキシ基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基」の置換し得る位置に1又は2以上のハロゲン原子が置換されていても良く、置換されるハロゲン原子が2以上の場合は、ハロゲン原子は同一又は異なっても良い。

[0016] 上記の「置換し得る位置に1又は2以上のハロゲン原子が置換されている置換基」は、それぞれ、「ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基」、「ハロ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル基」、「ハロ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル基」、「ハロ(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>

) シクロアルキル基」、「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルコキシ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルケニルオキシ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルキニルオキシ基」、「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ基」、「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルフィニル基」、又は「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルホニル基」と示される。

[0017] 「( $C_1-C_6$ )」、「( $C_2-C_6$ )」、「( $C_3-C_6$ )」等の表現は各種置換基の炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「( $C_3-C_6$ ) シクロアルキル ( $C_1-C_6$ ) アルキル基」の場合は炭素数3~6個のシクロアルキル基が直鎖又は分岐鎖状の炭素数1~6個のアルキル基に結合していることを示す。

[0018] 本発明の一般式(1)で表されるイミダゾピリダジン化合物の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類；酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類；ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

[0019] 本発明の一般式(1)で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉中心を有する場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(1)で表される化合物又はその塩類は、その構造式中に炭素-炭素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

[0020] 本発明で好ましくは、

$R^1$ が、(a1) ( $C_1-C_6$ ) アルキル基であり、

$R^2$ が、(b2) ( $C_1-C_6$ ) アルキル基であり、

$R^3$ が、(c3) ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基又は (c8) ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ基であり、 $R^4$ が、(d1) 水素原子である。

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、及びA<sup>3</sup>が、同一又は異なっても良く、窒素原子、硫黄原子、又はCHであり、Zが、同一又は異なってもよく、(e 1) 水素原子；(e 2) ハロゲン原子；

(e 5) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は(e 7) ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基である。nが1~2の整数であり、mは0~2の整数である。

[0021] 本発明で更に好ましくは、

R<sup>1</sup>が、(a 1) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基であり、

R<sup>2</sup>が、(b 2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基であり、

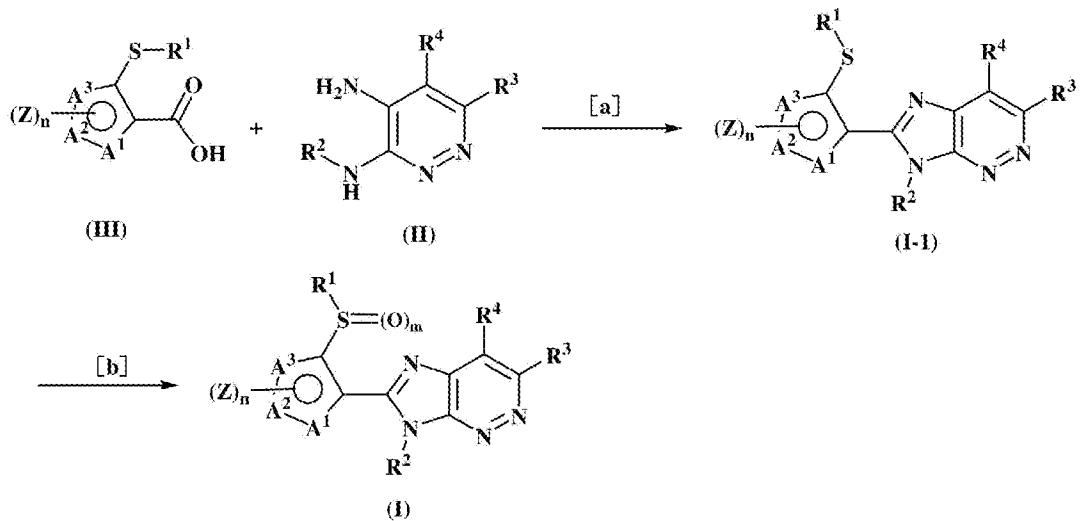
R<sup>3</sup>が、(c 3) ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は(c 8) ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基であり、R<sup>4</sup>が、(d 1) 水素原子であり、

A<sup>2</sup>及びA<sup>3</sup>が、CHであり、A<sup>1</sup>が窒素原子であり、Zが、同一又は異なってもよく、(e 1) 水素原子；(e 2) ハロゲン原子；(e 5) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は(e 7) ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基である。nが1~2の整数であり、mは0~2の整数である。

[0022] 本発明のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類は、例えば下記製造方法によって製造することができるが、本発明はこれらに限定されるものではない。

[0023] 製造方法 1

[0024] [化2]



[0025] {式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、Z、m、及びnは前記と同じ。}

[0026] 工程 [a] の製造方法

一般式 (I I I) で表されるカルボン酸化合物と一般式 (I I) で表されるピリダジン化合物とを縮合剤、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより一般式 (I - 1) で表されるイミダゾピリダジン化合物を製造することができる。

[0027] 本反応で使用する縮合剤としては、例えばシアノリン酸ジエチル (DEPC)、カルボニルジイミダゾール (CDI)、1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウム、国嶋試薬 (DMT-MM) 等を例示することができ、その使用量は一般式 (I I I) で表され化合物に対して1倍モルから1. 5倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

[0028] 塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類；カリウムt - ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8 - ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック - 7 - エン等の第三級アミン類；ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (I I I) で表される化合物に対して通常1倍モル～10倍モルの範囲で使用される。

[0029] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類；酢酸エチル等のエステル類；ジ

メチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0030] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を、例えば、転溶、濃縮、蒸留、結晶化等の常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0031] 工程 [b] の製造方法

本反応は、一般式 (1 - 1) で表されるイミダゾピリダジン化合物を、不活性溶媒中、酸化剤と反応させることにより一般式 (1) で表されるイミダゾピリダジン化合物を製造することができる。

[0032] 本反応で使用する酸化剤としては、過酸化水素水、過安息香酸、m - クロル過安息香酸などの過酸化物などが挙げられる。これら酸化剤は、一般式 (1 - 1) で表されるイミダゾピリダジン化合物類に対して0.8倍モル～5倍モルの範囲で適宜選択することができるが、好ましくは1倍モル～2倍モルの範囲が好ましい。

[0033] 本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；アセトニトリル等のニトリル類；酢酸エチル等のエステル類；蟻酸、酢酸等の有機酸類；N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン、水等の極性溶媒を挙げ

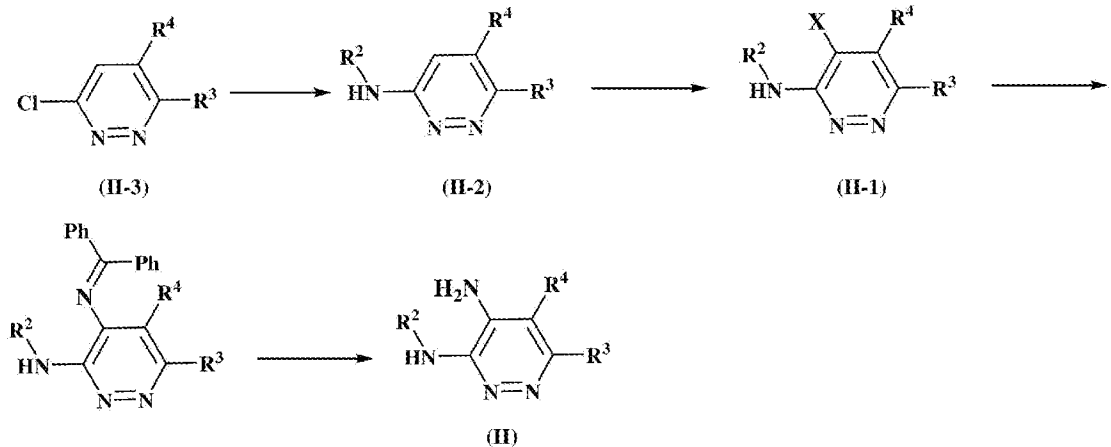
ることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0034] 本反応における反応温度は $-10^{\circ}\text{C}$ から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0035] 本発明化合物の製造中間体である一般式(II)は、以下の方法により製造することができる。

中間体の製造方法

[0036] [化3]



[0037] [式中、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 及び $\text{R}^4$ は前記と同じくし、 $\text{X}$ はハロゲン原子を示す。]

一般式(II-2)で表される化合物は、不活性溶媒中一般式(II-3)で表される化合物とアミノ化合物( $\text{R}^2\text{NH}_2$ )とを反応させることにより製造することができる。アミノ化合物は、一般式(II-3)で表される化合物に対して、1倍モルから5倍モルの範囲で適宜選択することができる。

[0038] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；ジ

エチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類；酢酸エチル等のエステル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0039] 必要に応じて塩基を使用しても良く、塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類；カリウムt-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類；ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式(11-2)で表される化合物に対して通常1倍モル～10倍モルの範囲で使用される。

[0040] 本反応における反応温度は-10℃から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。

反応終了後、目的物を含む反応系から、例えば、転溶、濃縮、蒸留、結晶化等の常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0041] 一般式(11-1)で表される化合物は、不活性溶媒中一般式(11-2)で表される化合物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。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；ベンゼン、トルエン、キ

シレン等の芳香族炭化水素類；酢酸エチル等のエステル類；N，N - ジメチルホルムアミド、N，N - ジメチルアセトアミド、1，3 - ジメチル - 2 - イミダゾリノン、水、酢酸等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0042] 反応に用いられるハロゲン化剤としては、例えば、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素のハロゲン分子、NCS，NBS等のハロゲン化スクシンイミド類；DBDMH（1，3 - ジブromo - 5，5 - ジメチルヒダントイン），DIH等のハロゲン化ヒダントイン類；塩化チオニル等が挙げられる。

本反応における反応温度は $-30^{\circ}\text{C}$ から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。

反応終了後、目的物を含む反応系から、例えば、転溶、濃縮、蒸留、結晶化等の常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0043] 一般式（I - 1）で表されるハロピリダジン化合物及びジフェニルイミンとを塩基、金属触媒及び溶媒存在下、反応させ、その後加水分解することにより、アミノピリダジン化合物（I）を製造することができる。

[0044] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、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等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0045] 本反応で使用できる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、リン酸カリウム等の無機塩基類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類；ナトリウムt - ブトキシド、カリウムt - ブトキシド、

ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第三級アミン類；ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができる。

[0046] 本反応で使用する金属触媒は  $Pd_2(bda)_3$ 、 $PdCl_2(dppf) \cdot CH_2Cl_2$ 、 $Pd(tppe)_4$ 、 $Pd(OAc)_2$ 等を例示することができ、また、配位子として、Xantphos、BINAP、 $(Ph_2P)_2$ -binaphthyl等を使用することができる。金属触媒の使用量は、一般式(11-1)で表されるハロピリダジン化合物に対して0.001倍モル～0.1倍モルの範囲で適宜選択することができる。

[0047] 本反応における反応温度は $-10^{\circ}C$ から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分から48時間の範囲で適宜選択すればよい。ジフェニルイミンは、一般式(11-1)で表されるハロピリダジン化合物に対して、1倍モルから5倍モルの範囲で適宜選択することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から、例えば、転溶、濃縮、蒸留、結晶化等の常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することによりジフェニルイミノピリダジンを製造することができる。

[0048] その後、当該ジフェニルイミノピリダジンを酸及び不活性溶媒下、加水分解することにより、一般式(11)で表わされるアミノピリダジン化合物を製造することができる。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；酢酸エチル等のエステル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、1,3-ジメチル-2-イ

ミダゾリノン、水、酢酸等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

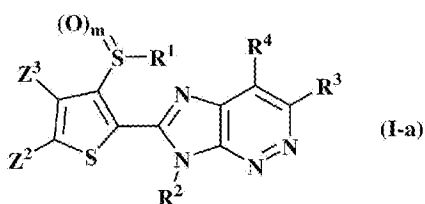
[0049] 本反応で使用できる酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸；酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸；メタンスルホン酸等のスルホン酸等を例示することができるが、その他にヒドロキシルアミンと酢酸ナトリウム、パラジウムと炭酸アンモニウムを用いることができる。

[0050] 本反応における反応温度は $-30^{\circ}\text{C}$ から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。

反応終了後、目的物を含む反応系から、例えば、転溶、濃縮、蒸留、結晶化等の常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0051] 次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。下記の表において、Meはメチル基を表し、Etはエチル基を示す。物性は融点( $^{\circ}\text{C}$ )、NMRデータ又は屈折率(測定温度)を示す。

[0052] [化4]



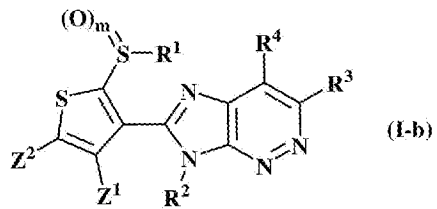
[0053]

[表1]

第 1 表

| 化合物番号 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                | R <sup>4</sup> | Z <sup>2</sup>                | Z <sup>3</sup> | m | 物性値         |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|---|-------------|
| 1-1   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 0 | 133.7-135.7 |
| 1-2   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 1 | 181.6-185.9 |
| 1-3   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 2 | 170.0-172.4 |
| 1-4   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 0 | 87.1-88.7   |
| 1-5   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 1 | 197.5-198.6 |
| 1-6   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 2 | 160.5-168.0 |
| 1-7   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 0 |             |
| 1-8   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 1 |             |
| 1-9   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | CF <sub>3</sub>               | H              | 2 |             |
| 1-10  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | 0 |             |
| 1-11  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | 1 |             |
| 1-12  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | 2 |             |
| 1-13  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | 0 |             |
| 1-14  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | 1 |             |
| 1-15  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | 2 |             |

[0054] [化5]



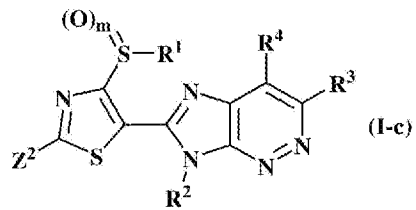
[0055]

[表2]

第 2 表

| 化合物番号 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                | R <sup>4</sup> | Z <sup>1</sup> | Z <sup>2</sup>                | m | 物性値 |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|-------------------------------|---|-----|
| 2-1   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 0 |     |
| 2-2   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 1 |     |
| 2-3   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 2 |     |
| 2-4   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 0 |     |
| 2-5   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 1 |     |
| 2-6   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 2 |     |
| 2-7   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 0 |     |
| 2-8   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 1 |     |
| 2-9   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | H              | CF <sub>3</sub>               | 2 |     |
| 2-10  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 0 |     |
| 2-11  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 1 |     |
| 2-12  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 2 |     |
| 2-13  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 0 |     |
| 2-14  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 1 |     |
| 2-15  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 2 |     |

[0056] [化6]



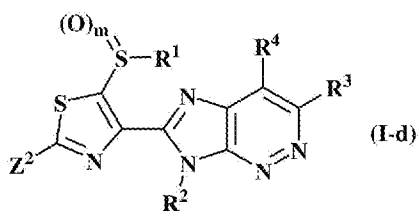
[0057]

[表3]

第3表

| 化合物番号 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                | R <sup>4</sup> | Z <sup>2</sup>                | m | 物性値         |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------|----------------|-------------------------------|---|-------------|
| 3-1   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub>               | 0 | NMR         |
| 3-2   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub>               | 1 | NMR         |
| 3-3   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub>               | 2 | 232.1-224.9 |
| 3-4   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub>               | 0 |             |
| 3-5   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub>               | 1 |             |
| 3-6   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub>               | 2 |             |
| 3-7   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | CF <sub>3</sub>               | 0 |             |
| 3-8   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | CF <sub>3</sub>               | 1 |             |
| 3-9   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | CF <sub>3</sub>               | 2 |             |
| 3-10  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 0 |             |
| 3-11  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 1 |             |
| 3-12  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 2 |             |
| 3-13  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 0 |             |
| 3-14  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 1 |             |
| 3-15  | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | 2 |             |
| 3-16  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | I                             | 0 | 149.6-151.0 |
| 3-17  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | I                             | 1 |             |
| 3-18  | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | I                             | 2 | NMR         |

[0058] [化7]



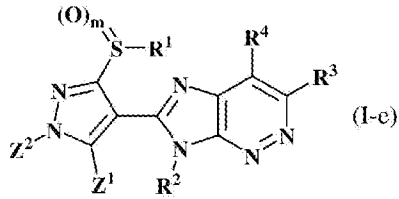
[0059] [表4]

第4表

| 化合物番号 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                | R <sup>4</sup> | R <sup>2</sup>  | m | 物性値     |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------|----------------|-----------------|---|---------|
| 4-1   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub> | 0 | 237-241 |
| 4-2   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub> | 1 | 157-160 |
| 4-3   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | CF <sub>3</sub> | 2 |         |
| 4-4   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | 0 |         |
| 4-5   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | 1 |         |

[0060]

[化8]



[0061] [表5]

第5表

| 化合物番号 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                | R <sup>4</sup> | Z <sup>1</sup> | Z <sup>2</sup> | m | 物性値            |
|-------|----------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|----------------|
| 5-1   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | Me             | 0 | 1.5614(26.4°C) |
| 5-2   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | Me             | 1 | 210.9(decomp.) |
| 5-3   | Et             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | H              | Me             | 2 | 184.7-187.9    |
| 5-4   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | Me             | 0 |                |
| 5-5   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | Me             | 1 |                |
| 5-6   | Et             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | H              | Me             | 2 |                |
| 5-7   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | H              | Me             | 0 |                |
| 5-8   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | H              | Me             | 1 |                |
| 5-9   | Et             | Me             | SCF <sub>3</sub>              | H              | H              | Me             | 2 |                |

[0062] [表6]

第6表

| 化合物番号 | <sup>1</sup> H-NMR   |
|-------|--|
| 3-1   | 8. 21(s, 1H), 4. 24(s, 3H), 3. 36(q, 2H), 1. 43 (t, 3H)      |
| 3-2   | 8. 21(s, 1H), 4. 19(s, 3H), 3. 40-3. 28(q, 2H), 1. 35(t, 3H) |
| 3-18  | 8. 19(s, 1H), 4. 13(s, 3H), 3. 44(q, 2H), 1. 33 (t, 3H)      |

[0063] 本発明の一般式(1)で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉類を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫類等の害虫防除に適している。

[0064] 上記害虫又は線虫類等として以下のものが例示される。

鱗翅目(チョウ目)害虫として例えば、アオイラガ(*Parasa consocia*)、アカキリバ(*Anomis mesogona*)、アゲハ(*Papilio xuthus*)、アズキサヤムシガ(*Matsumuraeses azukivora*)、アズキノメイガ(*Ostrinia scapulalis*)、アフリカヨトウ(*Spodoptera exempta*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イガ(*Tinea translucens*)、イグサシンムシガ(*Bactra furfurana*)、イチモン

ジセセリ (*Parnara guttata*)、イネタテハマキ (*Marasmia exigua*)、イネツトムシ (*Parnara guttata*)、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、イモキバガ (*Brachmia triannulella*)、イラガ (*Monema flavescens*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、ウコンノメイガ (*Pleuroptya ruralis*)、ウメエダシャク (*Cystidia couaggaria*)、ウラナミシジミ (*Lampides boeticus*)、オオスカシバ (*Cephonodes hylas*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、オオトビモンシャチホコ (*Phalerodonta manleyi*)、オオミノガ (*Eumeta japonica*)、オオモンシロチョウ (*Pieris brassicae*)、オビカレハ (*Malacosoma neustria testacea*)、

[0065] カキノヘタムシガ (*Stathmopoda masinissa*)、カキホソガ (*Cuphodes diospyrosella*)、カクモンハマキ (*Archips xylosteanus*)、カブラヤガ (*Agrotis segetum*)、カンショシンクイハマキ (*Tetramoera schistaceana*)、キアゲハ (*Papilio machaon hippocrates*)、キマダラコウモリ (*Endoclyta sinensis*)、ギンモンハモグリガ (*Lyonetia prunifoliella*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoneella*)、クリミガ (*Cydia kurokoi*)、クリミドリシンクイガ (*Eucoenogenes aestuosa*)、グレープベリーモス (*Lobesia botrana*)、クロシタアオイラガ (*Latoia sinica*)、クロフタモンマダラメイガ (*Euzophera batangensis*)、クワイホソハマキ (*Phalonidia mesotypa*)、クワゴマダラヒトリ (*Spilosoma imparilis*)、クワノメイガ (*Glyphodes pyloalis*)、クワヒメハマキ (*Olethreutes mori*)、コイガ (*Tineola bisselliella*)、コウモリガ (*Endoclyta excrescens*)、コクガ (*Nemapogon granelus*)、コスカシバ (*Synanthedon hector*)、コドリリング (*Cydia pomonella*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、サザンピンクボーラー (*Sesamia calamistis*)、サンカメイガ (*Scirpophaga incertulas*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、シャチホコガ (*Stauropus fagi persimilis*)、シロイチモジマダラメイガ (*Etiella zinckenella*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、シロテンコウモリ (*Palpifer senotata*)、シロナヨトウ (*Spodoptera mauritia*)、イネシロオオメイガ (*Scirp*

ophaga innotata)、シロモンヤガ(*Xestia c-nigrum*)、スジキリヨトウ(*Spodoptera depravata*)、スジコナマダラメイガ(*Ephestia kuehniella*)、スモモエダシャク(*Angerona prunaria*)、セグロシャチホコ (*Clostera anastomosis*)

、

[0066] ソイビーンルーパー(*Pseudoplusia includens*)、ダイズサヤムシガ(*Matsumuraeses falcana*)、タバコガ(*Helicoverpa assulta*)、タマナギンウワバ(*Autographa nigrisigna*)、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon*)、チャドクガ(*Euproctis pseudoconspersa*)、チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)、チャノホソガ(*Caloptilia theivora*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、チャミノガ(*Eumeta minuscula*)、ツマアカシャチホコ(*Clostera anachoreta*)、ツメクサガ(*Heliothis maritima*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、トウモロコシメイガ(*Busseola fusca*)、ドクガ(*Euproctis subflava*)、トビモンオオエダシャク (*Biston robustum*)、トマトフルーツワーム(*Heliothis zea*)、ナカジロシタバ(*Aedia leucomelas*)、ナシイラガ(*Narosoideus flavidorsalis*)、ナシケンモン (*Viminia rumicis*)、ナシチビガ(*Bucculatrix pyrivorella*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、ナシホソガ(*Spulerina astaurota*)、ナシマダラメイガ(*Ectomyelois pyrivorella*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、ネギコガ(*Acrolepiopsis sapporensis*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、バクガ(*Sitotroga cerealella*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、ハマキガの一種(*Eucosma aporema*)、バラハマキ(*Acleris comariana*)、ヒメクロイラガ(*Scopelodes contractus*)、ヒメシロモンドクガ (*Orgyia thyellina*)、フォールアーミーワーム(*Spodoptera frugiperda*)、フキノメイガ(*Ostrinia zaguliaevi*)、フタオビコヤガ(*Naranga aenescens*)、フタテンカギバモドキ(*Andraca bipunctata*)、ブドウスカシバ(*Paranthrene regalis*)、ブドウスズメ(*Acosmeryx castanea*)、ブドウハモグリガ(*Phyllocnistis toparcha*)、ブドウヒメハマキ(*Endopiza viteana*)、ブドウホソハマキ(*Eupoecillia ambiguella*)、ベルベットビーンキャタピ

ラー(*Anticarsia gemmatalis*)、ホソバハイイロハマキ(*Cnephasia cinereipalpana*)、

[0067] マイマイガ(*Lymantria dispar*)、マツカレハ(*Dendrolimus spectabilis*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinivorella*)、マメノメイガ(*Maruca testulalis*)、マメヒメサヤムシガ(*Matsumuraeses phaseoli*)、マメホソガ(*Caloptilia soyella*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、マエウスキノメイガ(*Omiodes indicata*)、ミダレカクモンハマキ(*Archips fuscocupreanus*)、ミツモンキンウワバ(*Acanthoplusia agnata*)、ミノガ(*Bambalina* sp.)、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)、モモノゴマダラノメイガ(*Conogethes punctiferalis*)、モモスカシバ類 (*Synanthedon* sp.)、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)、モンキアゲハ(*Papilio helenus*)、モンキチョウ(*Colias erate poliographus*)、モンクロシャチホコ(*Phalera flavescens*)、例えばモンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、モンシロドクガ(*Euproctis similis*)、ヤマノイモコガ(*Acrolepiopsis suzukiella*)、ヨーロピアンコーンボーラー(*Ostrinia nubilalis*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、ヨモギエダシャク(*Ascotis selenaria*)、ヨモギオオホソハマキ(*Phtheochroides clandestina*)、リンゴオオハマキ(*Hoshinoa adumbratana*)、リンゴカレハ(*Odonestis pruni japonensis*)、リンゴケンモン(*Triaena intermedia*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、リンゴコシンクイ(*Grapholita inopinata*)、リンゴシロヒメハマキ(*Spilonota ocellana*)、リンゴハイイロハマキ(*Spilonota lechriaspis*)、リンゴハマキクロバ(*Illiberis pruni*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、リンゴホソガ(*Caloptilia zachrysa*)、リンゴモンハマキ(*Archips breviplicanus*)、ワタアカキリバ(*Anomis flava*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、ワタノメイガ(*Notarcha derogata*)、ワタヘリクロノメイガ(*Diaphania indica*)、ニセアメリカタバコガ(*Heliothis virescens*)、及びワタリング(*Earias cupreoviridis*)等が挙げられる。

[0068] 半翅目 (カメムシ目) 害虫として例えば、アオクサカメムシ(*Nezara antenn*

nata)、アカスジカスミカメ(*Stenotus rubrovittatus*)、アカスジカメムシ(*Graphosoma rubrolineatum*)、アカヒゲホソミドリカスミカメ(*Trigonotylus coelestialium*)等、アカヒメヘリカメムシ(*Aeschynteles maculatus*)、アカホシカスミカメ(*Creontiades pallidifer*)、アカホシカメムシ(*Dysdercus cingulatus*)、アカホシマルカイアガラムシ(*Chrysomphalus ficus*)、アカマルカイガラムシ(*Aonidiella aurantii*)、アブラゼミ(*Graptopsaltria nigrofuscata*)、アメリカコバネナガカメムシ(*Blissus leucopterus*)、イセリヤカイガラムシ(*Icerya purchasi*)、イチモンジカメムシ(*Piezodorus hybneri*)、イネカメムシ(*Lagynotomus elongatus*)、イネキイロヒメヨコバイ(*Thaia subrufa*)、イネクロカメムシ(*Scotinophara lurida*)、イバラヒゲナガアブラムシ(*Sitobion ibarae*)、イワサキカメムシ(*Stariodes iwasaki*)、ウスイロマルカイガラムシ(*Aspidiotus destructor*)、ウスモンミドリカスミカメ(*Taylorilygus pallidulus*)、ウメコブアブラムシ(*Myzomumecola*)、ウメシロカイガラムシ(*Pseudaulacaspis prunicola*)、エンドウヒゲナガアブラムシ(*Acyrtosiphon pisum*)、オオクモヘリカメムシ(*Anacanthocoris stricornis*)、オオクロトビカスミカメ(*Ectometopterus micantulus*)、オオトゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris lewisi*)、オオヘリカメムシ(*Molipteryx fuliginosa*)、オオヨコバイ(*Cicadella viridis*)、オカボノアカアブラムシ(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、オリーブカタカイガラムシ(*Saissetia oleae*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、カシヒメヨコバイ(*Aguriahana quercus*)、カスミカメムシ類(*Lygus* spp.)、カバワタフキマダラアブラムシ(*Euceraphis punctipennis*)、カンキツカイガラムシ(*Andaspis kashicola*)、カンキツカタカイガラムシ(*Coccus pseudomagnoliarum*)、カンシャコバネナガカメムシ(*Cavelerius saccharivorus*)、キクグンバイ(*Galeatus spinifrons*)、キクヒメヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphonia sanborni*)、キマルカイガラムシ(*Aonidiella citrina*)、クサギカメムシ(*Halyomorpha mista*)、クスグンバイ(*Stephanitis fasciicarina*)、クストガリキジラミ(*Trioza camphorae*)、クモヘリカメムシ(*Leptocorisa chine*

nsis)、クリトガリキジラミ (*Trioza quercicola*)、クルミグンバイ (*Uhlerites latius*)、グレープリーフホッパー (*Erythroneura comes*)、クロアシホソナガカメムシ (*Paromius exiguus*)、クロカタマルカイガラムシ (*Duplaspidiotus claviger*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、クロトビカスミカメ (*Halticiellus insularis*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、クロリンゴキジラミ (*Psylla malivorella*)、クワキジラミ (*Anomomeura mori*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinis*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、クワワタカイガラムシ (*Pulvinaria kuwacola*)、コアオカスミカメ (*Apolygus lucorum*)、コバネヒヨウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*)、

[0069] サトウキビコナカイガラムシ (*Saccharicoccus sacchari*)、サトウキビネワタムシ (*Geoica lucifuga*)、サトウノウスイロウンカ (*Numata muii*)、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*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、シロオオヨコバイ (*Cicadella spectra*)、シロマルカイガラムシ (*Aspidiotus hederae*)、スカシヒメヘリカメムシ (*Liorhyssus hyalinus*)、セグロヒメキジラミ (*Calophya nigradorsalis*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ (*Megoura crassicauda*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ダイズアブラムシ (*Aphis glycines*)、タイワンクモヘリカメムシ (*Leptocorisa oratorius*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、タイワンヒゲナガアブラムシ (*Uroeucon formosanum*)、タバコカスミカメ (*Cyrtopeltis tenuis*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、チャノカタカイガラムシ (*Lecanium persicae*)、チャノクロホシカイガラムシ (*Parlatoria theae*)、チャノマルカイガラムシ (*Pseudaonidia paeoniae*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、チャバネアオカメムシ (*Plautia stali*)、チューリップネアブラ

ムシ (*Dysaphis tulipae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ツバキクロホシカイガラムシ (*Parlatoria camelliae*)、ツマグロアオカスミカメ (*Apolygus spinolai*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、ツヤアオカメムシ (*Glaucias subpunctatus*)、テンサイカスミカメ (*Orthotylus flavosparsus*)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、トコジラミ (*Cimex lectularius*)、トドキジラミ (*Psylla abietis*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、トベラキジラミ (*Psylla tobirae*)、

[0070] ナガメ (*Eurydema rugosum*)、ナシアブラムシ (*Schizaphis piricola*)、ナシキジラミ (*Psylla pyricola*)、ナシクロホシカイガラムシ (*Parlatoreopsis pyri*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ナシコナカイガラムシ (*Dysmicoccus wistariae*)、ナシシロナガカイガラムシ (*Lepholeucaspis japonica*)、ナシマルアブラムシ (*Sappaphis piri*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ネギアブラムシ (*Neotoxoptera formosana*)、ハスクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum nymphaeae*)、バラヒメヨコバイ (*Edwardianarosae*)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspisaspidistrae*)、ハンノキジラミ (*Psylla alni*)、ハンノナガヨコバイ (*Speusotettix subfuscus*)、ハンノヒメヨコバイ (*Alnetoidia alneti*)、ヒエウンカ (*Sogatella panicicola*)、ヒゲナガカスミカメ (*Adelphocoris lineolatus*)、ヒメアカホシカメムシ (*Dysdercus poecilus*)、ヒメクロカイガラムシ (*Parlatoria ziziphi*)、ヒメグンバイ (*Uhlerites debile*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、ヒメハリカメムシ (*Cletus trignonus*)、ヒメフタテンナガアワフキ (*Clovium punctata*)、ヒメヨコバイ類 (*Empoasca* spp.)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ヒラタヒョウタンナガカメムシ (*Pachybrachius luridus*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、フタスジカスミカメ (*Stenotus binotatus*)、フタ

テンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、フタテンヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ブチヒゲカメムシ (*Dolycoris baccarum*)、ブチヒゲクロカスミカメ (*Adelphocoris triannulatus*)、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*)、ホオズキカメムシ (*Acanthocoris sordidus*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisa acuta*)、ホソコバネナガカメムシ (*Macropes obnubilus*)、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ポテトピシリド (*Paratrioza cockerelli*)、

[0071] マエキアワフキ (*Aphrophora costalis*)、マキバカスミカメ (*Lygus disponsi*)、マダラカスミカメ (*Lygus saundersi*)、マツコナカイガラムシ (*Crisicoccus pini*)、マツヒメヨコバイ (*Empoasca abietis*)、マツモトコナカイガラムシ (*Crisicoccus matsumotoi*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、マルカメムシ (*Megacopta punctatissimum*)、マルシラホシカメムシ (*Eysarcoris guttiger*)、ミカンカキカイガラムシ (*Lepidosaphes beckii*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、ミカンヒメコナカイガラムシ (*Pseudococcus citriculus*)、ミカンヒメヨコバイ (*Zyginella citri*)、ミカンヒメワタカイガラムシ (*Pulvinaria citricola*)、ミカンヒラタカイガラムシ (*Coccus discrepans*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、ムギカスミカメ (*Stenodema calcaratum*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ムギヒゲナガアブラムシ (*Sitobion akebiae*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*)、ムギヨコバイ (*Sorhoanus tritici*)、ムギワラギクオマルアブラムシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ムラサキカメムシ (*Carpocoris purpureipennis*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*)、ヤナギアブラムシ (*Aphis farinose yanagicola*)、ヤナギグンバイ (*Metasalis populi*)

、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、ヤマアサキジラミ (*Mesohomotoma camphorae*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、リンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、リンゴカキカイガラムシ (*Lepidosaphes ulmi*)、リンゴキジラミ (*Psylla mali*)、リンゴクロカスミカメ (*Heterocordylus flavipes*)、リンゴコブアブラムシ (*Myzus malisuctus*)、リンゴネアブラムシ (*Aphidonuguis mali*)、リンゴマダラヨコバイ (*Orientus ishidai*)、リンゴミドリアブラムシ (*Ovatus malicolens*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、及びワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)等が挙げられる。

[0072] 鞘翅目 (コウチュウ目) 害虫として例えば、アオスジカミキリ (*Xystrocera globosa*)、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*)、アオハナムグリ (*Eucetonia roelofsi*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、アリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、イネネクイハムシ (*Donacia provosti*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、イモサルハムシ (*Colasposoma dauricum*)、イモゾウムシ (*Euscepes postfasciatus*)、インゲンテントウ (*Epilachna varivestis*)、インゲンマメゾウムシ (*Acanthoscelides obtectus*)、ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ウメチョッキリゾウムシ (*Involvulus cupreus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、エンドウゾウムシ (*Bruchus pisorum*)、オオニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctomaculata*)、ガイマイデオキスイ (*Carpophilus dimidiatus*)、カメノコハムシ (*Cassida nebulosa*)、キアシノミハムシ (*Luperomorpha tenebrosa*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、キボシカミキリ (*Psacotheta hilaris*)、キマダラカミキリ (*Aeolesthes chrysothrix*)、クリシギゾウムシ (*Curculio sikkimensis*)、クリヤケシキスイ (*Carpophilus hemipterus*)、コアオハナムグリ (*Oxycetonia jucunda*)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica* spp.)、コガネムシ (*Mimela splendens*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeae*

mais)、コクヌストモドキ(*Tribolium castaneum*)、ココクゾウムシ(*Sitophilus oryzae*)、コヒメコクヌストモドキ (*Palorus subdepressus*)、コフキコガネ (*Melolontha japonica*)、ゴマダラカミキリ(*Anoplophora malasiaca*)、ゴミムシダマシ (*Neatus picipes*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、サザンコーンルートワーム(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、シバオサゾウムシ(*Sphenophorus venatus*)、ジュウシホシクビナガハムシ(*Crioceris quatuordecimpunctata*)、スモモゾウムシ(*Conotrachelus nenuphar*)、

[0073] ダイコンサルゾウムシ(*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*)、ダイコンハムシ (*Phaedon brassicae*)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricorne*)、チビコフキゾウムシ(*Sitona japonicus*)、チャイロコガネ(*Adoretus tenuimaculatus*)、チャイロコメノゴミムシダマシ(*Tenebrio molitor*)、チャイロサルハムシ(*Basilepta balyi*)、ツメクサタコゾウムシ(*Hypera nigrirostris*)、テンサイトビハムシ(*Chaetocnema concinna*)、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)、ノーザンコーンルートワーム(*Diabrotica longicornis*)、ハナムグリ(*Eucetonia pilifera*)、ハリガネムシ類(*Agriotes* sp. )、ヒメカツオブシムシ(*Attagenus unicolor japonicus*)、ヒメキバネサルハムシ(*Pagria signata*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、ヒメコクヌストモドキ(*Palorus ratzeburgii*)、ヒメゴミムシダマシ (*Alphitobius laevigatus*)、ヒメマルカツオブシムシ(*Anthrenus verbasci*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、ヒラタコクヌストモドキ(*Tribolium confusum*)、フタスジヒメハムシ(*Medythia nigrobilineata*)、ブドウトラカミキリ(*Xylotrechus pyrrhoderus*)、ポテトフリービートル(*Epitrix cucumeris*)、マツノキクイムシ(*Tomicus piniperda*)、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、マメハンミヨウ(*Epicauta gorhami*)、メイズウィービル(*Sitophilus zeamais*)、モモチヨッキリゾウムシ(*Rhynchites heros*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、ヨツモンマメゾウ

ムシ (*Callosobruchus maculatus*)、リンゴコフキゾウムシ(*Phyllobius armatus*)、リンゴハナゾウムシ(*Anthonomus pomorum*)、ルリハムシ(*Linnaeidea aenea*)、及びワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)等が挙げられる。

[0074] 双翅目 (ハエ目) 害虫として例えば、アカイエカ(*Culex pipiens pallens*)、アカザモグリハナバエ(*Pegomya hyoscyami*)、アシグロハモグリバエ (*Liriomyza huidobrensis*)、イエバエ(*Musca domestica*)、イネキモグリバエ(*Chlorops oryzae*)、イネクキミギワバエ (*Hydrellia sasakii*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、イネヒメハモグリバエ(*Hydrellia griseola*)、イネミギワバエ (*Hydrellia griseola*)、インゲンモグリバエ(*Ophiomyia phaseoli*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オウトウショウジョウバエ (*Drosophila suzukii*)、オウトウハマダラミバエ (*Rhacochlaena japonica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、オオキモンノミバエ(*Megaselia spiracularis*)等のノミバエ類、オオチョウバエ(*Clogmia albipunctata*)、キリウジガガンボ (*Tipula aino*)、クロキンバエ (*Phormia regina*)、コガタアカイエカ(*Culex tritaeniorhynchus*)、シナハマダラカ(*Anopheles sinensis*)、ダイコンバエ(*Hylemya brassicae*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia sp.*)、タネバエ(*Delia platura*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、ヨーロッパオウトウミバエ(*Rhagoletis cerasi*)、チカイエカ (*Culex pipiens molestus* Forskal)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、チビクロバネキノコバエ (*Bradysia agrestis*)、テンサイモグリハナバエ (*Pegomya cunicularia*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ナスハモグリバエ (*Liriomyza bryoniae*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*)、ネギハモグリバエ (*Liriomyza chinensis*)、ネッタイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ミカンコミバエ (*Dacus dorsalis*)、ミカンバエ (*Dacus tsuneonis*)、ムギアカタマバエ(*Sitodiplosis mosellana*)、ムギキモグリバエ (*Meromyza nigriventris*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、及びリンゴミバエ(*Rhagoleti*

s pomonella)等が挙げられる。

[0075] 膜翅目 (ハチ目) 害虫として例えば、アミメアリ (*Pristomyrmex pungens*)、アリガタバチ類、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、オオズアリ (*Pheidole noda*)、カブラハバチ (*Athalia rosae*)、クリタマバチ (*Dryocosmus kuriphilus*)、クロヤマアリ (*Formica fusca japonica*)、スズメバチ類、セグロカブラハバチ (*Athalia infumata infumata*)、チュウレンジハバチ (*Arge pagana*)、ニホンカブラハバチ (*Athalia japonica*)、ハキリアリ (*Acromyrmex* spp.)、ファイヤーアント (*Solenopsis* spp.)、リンゴハバチ (*Arge mali*)、及びルリアリ (*Ochetellus glaber*)等が挙げられる。

[0076] 直翅目 (バッタ目) 害虫として例えば、クサキリ (*Homorocoryphus lineosus*)、ケラ (*Grylotalpa* sp.)、コイナゴ (*Oxya hyla intricata*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、ハネナガイナゴ (*Oxya japonica*)、ヒメクサキリ (*Homorocoryphus jezoensis*)、及びエンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)等が挙げられる。

[0077] アザミウマ目害虫として例えば、アカオビアザミウマ (*Selenothrips rubrocinctus*)、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、イネクダアザミウマ (*Haplothrips aculeatus*)、カキクダアザミウマ (*Ponticulothrips diospyrosi*)、キイロハナアザミウマ (*Thrips flavus*)、クサキイロアザミウマ (*Anaphothrips obscurus*)、クスクダアザミウマ (*Liothrips floridensis*)、グラジオラスアザミウマ (*Thrips simplex*)、クロゲハナアザミウマ (*Thrips nigropilosus*)、クロトンアザミウマ (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、クワアザミウマ (*Pseudodendrothrips mori*)、コスモスアザミウマ (*Microcephalothrips abdominalis*)、シイオナガクダアザミウマ (*Leeuwenia pasanii*)、シイマルクダアザミウマ (*Litotetothrips pasaniae*)、シトラススリップス (*Scirtothrips citri*)、シナクダアザミウマ (*Haplothrips chinensis*)、ダイズアザミウマ (*Mycterothrips glycines*)、ダイズウスイロアザミウマ (*Thrips setosus*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、チャノクロアザミウマ (*Dendrothrips minowai*)、ツメクサクダアザミウマ (*Haplothrips niger*)、ネギ

アザミウマ(*Thrips tabaci*)、ネギクロアザミウマ(*Thrips alliorum*)、ハナアザミウマ(*Thrips hawaiiensis*)、ハナクダアザミウマ(*Haplothrips kurdjumovi*)、ヒゲブトアザミウマ(*Chirothrips manicatus*)、ヒラズハナアザミウマ(*Frankliniella intonsa*)、ビワハナアザミウマ(*Thrips coloratus*)、ミカンキイロアザミウマ(*Franklinella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)、ユリキイロアザミウマ(*Frankliniella lilivora*)、及びユリノクダアザミウマ(*Liothrips vaneeckei*)等が挙げられる。

[0078] ダニ目害虫として例えば、アオツツガムシ(*Leptotrombidium akamushi*)、アシノワハダニ(*Tetranychus ludeni*)、アメリカンドックチック (*Dermacentor variabilis*)、イシイナミハダニ(*Tetranychus truncatus*)、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、オウトウハダニ(*Tetranychus viennensis*)、カンザワハダニ(*Tetranychus kanzawai*)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)等のマダニ類、クワガタツメダニ(*Cheyletus malaccensis*)、ケナガコナダニ(*Tyrophagus putrescentiae*)、コナヒヨウヒダニ(*Dermatophagoides farinae*)、セアカゴケグモ(*Latrodectus hasseltii*)、台湾ンカクマダニ(*Dermacentor taiwanicus*)、チャノナガサビダニ(*Acaphylla theavagrans*)、チャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*)、トマトサビダニ(*Aculops lycopersici*)、トリサシダニ(*Ornithonyssus sylvarum*)、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)、ニセナシサビダニ(*Eriophyes chibaensis*)、ヒメハダニの一種 (*Brevipalpus* sp.)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、フタトゲチマダニ(*Haemaphysalis longicornis*)、ブラックレグドチック(*Ixodes scapularis*)、ホウレンソウケナガコナダニ(*Tyrophagus similis*)、ホソツメダニ(*Cheyletus eruditus*)、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、ミナミツメダニ(*Cheyletus moorei*)、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*)、ミミヒゼンダニ (*Octodectes cynotis*)、ヤケヒヨウヒダニ(*Dermatophagoides ptreynssnus*)、ヤマトチマダニ(*Haemaphysalis flava*)、ヤマトマダニ(*Ixodes ovatus*)、リュウキュウミカンサビダニ(*Phyllocoptruta citri*)、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、リンゴハダニ

(*Panonychus ulmi*)、ローンスターチック (*Amblyomma americanum*)、及びワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、ロビンネダニ (*Rhyzoglyphus robini*)、ネダニモドキの一種 (*Sancassania* sp.) 等が挙げられる。

[0079] シロアリ目害虫として例えば、アマミシロアリ(*Reticulitermes miyatakei*)、アメリカカンザイシロアリ(*Incisitermes minor*)、イエシロアリ(*Coptotermes formosanus*)、オオシロアリ(*Hodotermopsis japonica*)、カンモンシロアリ(*Reticulitermes* sp.)、キアシシロアリ(*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、クシモトシロアリ(*Glyptotermes kushimensis*)、コウシュウイエシロアリ(*Coptotermes quangzhoensis*)、コウシュンシロアリ(*Neotermes koshunensis*)、コダマシロアリ(*Glyptotermes kodamai*)、サツマシロアリ(*Glyptotermes satsumensis*)、ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*)、ナカジマシロアリ(*Glyptotermes nakajimai*)、ニトベシロアリ(*Pericapritermes nitobei*)、及びヤマトシロアリ(*Reticulitermes speratus*)等が挙げられる。

[0080] ゴキブリ目害虫として例えば、クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、チャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、トウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*)、トビイロゴキブリ(*Periplaneta brunnea*)、ヒメチャバネゴキブリ(*Blattella lituricollis*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、及びワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)等が挙げられる。

[0081] ノミ目として例えば、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、ネコノミ(*Ctenocephalides felis*)、及びニワトリノミ(*Ceratophyllus gallinae*)等が挙げられる。

[0082] 線虫類として例えば、イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*)、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、キタネグサレセンチュウ(*Pratylenchus penetrans*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ(*Meloidogyne incognita*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、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*)、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*)、及びミカンネセンチュウ(*Tylenchus semipene trans*)等が挙げられる。

[0083] 軟体動物類として例えば、スクミリンゴガイ(*Pomacea canaliculata*)、アフリカマイマイ(*Achatina fulica*)、ナメクジ(*Meghimatium bilineatum*)、チャコウラナメクジ(*Lehmannina valentiana*)、コウラナメクジ(*Limax flavus*)、及びウスカワマイマイ(*Acusta despecta sieboldiana*)等が挙げられる。

[0084] また、本発明の農園芸用殺虫剤は、その他の害虫としてトマトキバガ (*Tuta absoluta*) に対しても強い殺虫効果を有するものである。

[0085] また防除対象の一つである動物寄生性のダニとして例えば、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、イスカチマダニ (*Haemaphysalis concinna*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ヒゲナガチマダニ (*Haemaphysalis kitaokai*)、イヤスチマダニ (*Haemaphysalis ias*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、シュルツエマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、及びタイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanesis*) のようなマダニ類、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、及びミナミトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*) のようなトリサシダニ類、ナンヨウツツガムシ (*Eutrombicula wichmanni*)、アカツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*)、フトゲツツガムシ (*Leptotrombidium pallidum*)、フジツツガムシ (*Leptotrombidium fuji*)、トサツツガムシ (*Leptotrombidium tosa*)、ヨーロッパアキダニ (*Neotrombicula autumnalis*)、アメリカツツガムシ (*Eutrombicula alfreddugesi*)、及びミヤガワタマツツガムシ (*Helenicula miyagawai*) のようなツツガムシ類、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*)、ウサギツメダニ (*Cheyletiella parasitivorax*)、及びネコツ

メダニ (*Cheyletiella blakei*) のようなツメダニ類、ウサギキュウセンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウシシヨクヒダニ (*Chorioptes bovis*)、イヌミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、及びネコシヨウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) のようなヒゼンダニ類、並びにイヌニキビダニ (*Demodex canis*) のようなニキビダニ類等が挙げられる。

[0086] 他の防除対象であるノミとして例えば、ノミ目 (*Siphonaptera*) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (*Pulicidae*)、及びナガノミ科 (*Ceratophyllus*) などに属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、メクラネズミノミ (*Leptopsylla segnis*)、ヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*)、及びヤマトネズミノミ (*Monopsyllus anisus*) 等が挙げられる。

[0087] さらに他の防除対象である動物の外部寄生生物としては例えば、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ウマジラミ (*Haematopinus asini*)、ヒツジジラミ (*Dalmanella ovis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ケジラミ (*Phthirus pubis*)、及びアタマジラミ (*Pediculus capitis*) のようなシラミ類、並びにイヌハジラミ (*Trichodectes canis*) のようなハジラミ類、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、ウアイヌカカ (*Culicoides schultzei*)、及びツメトゲブユ (*Simulium ornatum*) のような吸血性双翅目害虫などが挙げられる。また動物の内部寄生生物としては例えば、肺虫、ベンチュウ、結節状ウオーム、胃内寄生虫、回虫、及び糸状虫類のような線虫類、マンソン裂頭条虫、広節裂頭条虫、瓜実条虫、多頭条虫、単包条虫、及び多包条虫のような条虫類、日本住血吸虫、及び肝蛭のような吸虫類、並びにコクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、及びクリプトスポリジウムのような原生動物等が挙げられる。

なお、上記から明らかなように、本発明化合物は農園芸用害虫のみならず広く衛生害虫を駆除できる。

[0088] 本発明の一般式(1)で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で育苗施設、水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌等の栽培担体等に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。中でも、作物、花卉等の育苗土壌、移植時の植え穴土壌、株元、灌漑水、水耕栽培における栽培水等に処理して、土壌を介し又は介さずして根から本発明化合物を吸収させることによるいわゆる浸透移行性を利用した施用が好ましい使用形態である。

[0089] 本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる有用植物は特に限定されるものではないが、例えば穀類（例えば、稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦、とうもろこし等）、豆類（大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、いんげん豆、落花生等）、果樹・果実類（林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、桜桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ等）、葉・果菜類（キャベツ、トマト、ほうれんそう、ブロッコリー、レタス、たまねぎ、ねぎ（あさつき、わけぎ）、ピーマン、なす、いちご、ペッパー、おくら、にら等）、根菜類（にんじん、馬鈴薯、さつまいも、さといも、だいこん、かぶ、れんこん、ごぼう、にんにく、らっきょう等）、加工用作物（棉、麻、ビート、ホップ、さとうきび、てんさい、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等）、ウリ類（かぼちゃ、きゅうり、すいか、まくわうり、メロン等）、牧草類（オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等）、芝類（高麗芝、ベントグラス等）、香料等鑑賞用作物（ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、生姜等）、花卉類（きく、ばら、カーネーション、蘭、チューリップ、ゆり等）、庭木（いちょう、さくら類、あおき等）、林

木（トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧、ユウカリ等）等の植物を挙げることができる。

[0090] 上記「植物」には、イソキサフルトール等のH P P D阻害剤；イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のA L S阻害剤；グリホサート等のE P S P合成酵素阻害剤；グルホシネート等のグルタミン合成酵素阻害剤；セトキシジム等のアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤；ブロモキシニル、ジカンバ、2，4-D等の除草剤に対する耐性を古典的な育種法により付与された植物、もしくは遺伝子組換え技術により耐性を付与された植物も含まれる。

[0091] 古典的な育種法により耐性を付与された「植物」の例としては、イマゼタピル等のイミダゾリノン系A L S阻害型除草剤に耐性のナタネ、コムギ、ヒマワリ、イネがあり、イネはC l e a r f i e l d（登録商標）の商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によるチフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系A L S阻害型除草剤に耐性のダイズがあり、S T Sダイズの商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によりトリオンオキシム系、アリアルオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤などのアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物の例としてS Rコーン等がある。

またアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物はP r o c . N a t l . A c a d . S c i . U S A 87巻、7175～7179頁（1990年）等に記載されている。またアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルC o AカルボキシラーゼがW e e d S c i e n c e 53巻、728～746頁（2005年）等に報告されており、こうした変異アセチルC o Aカルボキシラーゼ遺伝子を遺伝子組換え技術により植物に導入するかもしくは抵抗性付与に関わる変異を植物アセチルC o Aカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルC o Aカル

ボキシラーゼ阻害剤に耐性の植物を作出することができ、さらに、キメラプラスティ技術 (Gura T, 1999, Repairing the Genome's Spelling Mistakes, Science 285: 316-318.) に代表される塩基置換変異導入核酸を植物細胞内に導入して植物のアセチルCoAカルボキシラーゼ遺伝子やALS遺伝子等に部位特異的アミノ酸置換変異を導入することにより、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤やALS阻害剤等に耐性の植物を作出することができ、これらの植物に対しても本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる。

[0092] 更に遺伝子組換え植物で発現される毒素として、バチルス・セレウスやバチルス・ポピリエ由来の殺虫性タンパク；バチルス・チューリングエンシス由来のCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の $\delta$ -エンドトキシン；VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパク；線虫由来の殺虫タンパク；さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素；糸状菌類毒素；植物レクチン；アグルチニン；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サポリン、ブリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク (RIP)；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素；エクダイソン阻害剤；HMG-CoAリダクターゼ；ナトリウムチャンネル、カルシウムチャンネル阻害剤等のイオンチャンネル阻害剤；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体；スチルベンシンターゼ；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ等が挙げられる。

[0093] またこの様な遺伝子組換え植物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C、Cry34AbまたはCry35Ab等の $\delta$

ーエンドトキシンタンパク；VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパクのハイブリッド毒素；一部を欠損した毒素；修飾された毒素も含まれる。ハイブリッド毒素は組換え技術を用いて、これらタンパクの異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出される。一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したCry1Abが知られている。修飾された毒素としては、天然型の毒素のアミノ酸の1つまたは複数が置換されている。

これら毒素の例及びこれら毒素を合成することができる組換え植物は、EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878、WO 03/052073等に記載されている。

[0094] これらの組換え植物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、半翅目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫、線虫類への耐性を植物に付与する。本発明の農園芸用殺虫剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることもできる。

[0095] 本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫あるいは線虫防除に有効な量を当該害虫および線虫の発生が予測される植物に使用すればよく、例えば果樹、穀類、野菜等において発生する害虫および線虫に対しては茎葉部に散布する他に、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。加えて、養液（水耕）栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。

更に、本発明の農園芸用殺虫剤は、そのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される場所に使用すればよく、例えば貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫、森林害虫等に散布する他に、家屋建材への塗布、くん煙、ベイト等として使用することも

できる。

[0096] 種子処理の方法としては、例えば、液状又は固体状の製剤を希釈又は希釈せずして液体状態にて種子を浸漬して薬剤を浸透させる方法、固形製剤又は液状製剤を種子と混和、粉衣処理して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の担体と混和して種子にコーティングする方法、植え付けと同時に種子付近に散布する方法等が挙げられる。

当該種子処理を行う「種子」とは、植物の繁殖に用いられる栽培初期の植物体を意味し、例えば、種子の他、球根、塊茎、種芋、株芽、むかご、鱗茎、あるいは挿し木栽培用の栄養繁殖用の植物体を挙げるができる。

本発明の使用方法を実施する場合の植物の「土壌」又は「栽培担体」とは、作物を栽培するための支持体、特に根を生えさせる支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、いわゆる土壌、育苗マット、水等であっても良く、具体的な素材としては例えば、砂、軽石、バーミキュライト、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、バーク等であっても良い。

[0097] 作物茎葉部又は貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫若しくは森林害虫等への散布方法としては、乳剤、フロアブル剤等の液体製剤又は水和剤もしくは顆粒水和剤等の固形製剤を水で適宜希釈し、散布する方法、粉剤を散布する方法、又はくん煙等が挙げられる。

土壌への施用方法としては、例えば、液体製剤を水に希釈又は希釈せずして植物体の株元または育苗用苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の株元又は育苗のための苗床等に散布する方法、播種前または移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壌全体と混和する方法、播種前または植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布する方法等が挙げられる。

[0098] 水稻の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤型で施用すればよい。培土との混和によっても施用するこ

とができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。単に、培土と各種製剤を交互に層状にして施用してもよい。

水田への施用方法としては、ジャンボ剤、パック剤、粒剤、顆粒水和剤等の固形製剤；フロアブル、乳剤等の液体状製剤を、通常は、湛水状態の水田に散布する。その他、田植え時には、適当な製剤をそのまま、あるいは、肥料に混和して土壌に散布、注入することもできる。また、水口や灌漑装置等の水田への水の流入元に乳剤、フロアブル等の薬液を利用することにより、水の供給に伴い省力的に施用することもできる。

[0099] 畑作物においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等へ処理ができる。畑に直接播種する植物においては、種子への直接処理の他、栽培中の植物の株元への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釈あるいは希釈しない薬剤を液状にて灌注処理を行うこと等ができる。粒剤を播種前の栽培担体と混和させた後、播種するのも好ましい処理である。移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接処理の他、育苗用苗床への、液状とした薬剤の灌注処理又は粒剤の散布処理が好ましい。また、定植時に粒剤を植え穴に処理をしたり、移植場所近辺の栽培担体に混和することも好ましい処理である。

[0100] 本発明は、本発明の一般式（1）で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を有効成分として含有する動物の寄生生物防除剤、及び、当該防除剤を動物の寄生生物に接触させる動物の寄生生物の防除方法を包含する。動物の寄生生物は、動物の外部寄生生物であってもよく、動物の内部寄生生物であってもよい。本発明の動物の外部寄生生物防除剤は、本発明の一般式（1）で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を含有する水溶液又は乳剤を調製することにより製造され得る。本発明の動物の外部寄生生物防除剤は、動物が入っている浴槽に入れて、その動物の体外に通過させて使用され得る。使用回数は特に限定されないが、例えば、1日当たり1～3回であってもよい。本発明の動物の外部寄生生物防除剤を使用することにより

、動物の外部寄生虫を死滅させることができる。本発明の動物の内部寄生生物防除剤は、本発明の一般式（1）で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を含有する粒剤、粉剤、乳剤又は水溶液を調製することにより製造され得る。本発明の動物の内部寄生生物防除剤を、餌と混合することにより、動物に与え得る。本発明の動物の内部寄生生物防除剤を使用することにより、動物の内部寄生虫を駆除することができる。

[0101] 本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、本発明の一般式（1）で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

[0102] 本発明の組成物である農園芸用殺虫剤又は動物寄生生物防除剤は、有効成分の他に必要に応じて農薬製剤又は動物寄生生物防除剤に通常用いられる添加成分を含有することができる。この添加成分としては、固体担体、液体担体等の担体、界面活性剤、分散剤、湿潤剤、結合剤、粘着付与剤、増粘剤、着色剤、拡張剤、展着剤、凍結防止剤、固結防止剤、崩壊剤、分解防止剤等が挙げられる。その他必要に応じて、防腐剤、植物片等を添加成分に用いてもよい。これらの添加成分は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0103] 固体担体としては、例えば石英、クレー、カオリナイト、ピロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物類；炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類；合成ケイ酸、合成ケイ酸塩、デンプン、セルロース、植物粉末（例えばおがくず、ヤシガラ、トウモロコシ穂軸、タバコ茎等）等の有機固体担体；ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体；尿素；無機中空体；プラスチック中

空体；フュームド シリカ (fumed silica, ホワイトカーボン) 等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0104] 液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール等の一価アルコール類や；エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類のようなアルコール類；プロピレングリコールエーテル等の多価アルコール化合物類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類；エチルエーテル、ジオキサン、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類；ノルマルパラフィン、ナフテン、イソパラフィン、ケロシン、鉱油等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート、アジピン酸ジメチル等のエステル類； $\gamma$ -ブチロラクトン等のラクトン類；ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-アルキルピロリジノン等のアミド類；アセトニトリル等のニトリル類；ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類；大豆油、なたね油、綿実油、ヒマシ油等の植物油；水等を挙げることができる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0105] 分散剤や湿展剤として用いる界面活性剤としては、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、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樹脂酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸ジエステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンジアルキルフェニ

ルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルホルマリン縮合物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリスチレンポリオキシエチレンブロックポリマー、アルキルポリオキシエチレンポリプロピレンブロックコポリマーエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアミン、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脂肪酸ビスフェニルエーテル、ポリアルキレンベンジルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンスチリルフェニルエーテル、アセチレンジオール、ポリオキシアルキレン付加アセチレンジオール、ポリオキシエチレンエーテル型シリコーン、エステル型シリコーン、フッ素系界面活性剤、ポリオキシエチレンひまし油、ポリオキシエチレン硬化ひまし油等の非イオン性界面活性剤；アルキル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、ポリアクリル酸塩、N-メチル-脂肪酸サルコシネート、樹脂酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸塩等のアニオン性界面活性剤；ラウリルアミン塩酸塩、ステアリルアミン塩酸塩、オレイルアミン塩酸塩、ステアリルアミン酢酸塩、ステアリルアミノプロピルアミン酢酸塩、アルキルトリメチルアンモニウムクロライド、アルキルジメチルベンザルコニウムクロライド等のアルキルアミン塩等のカチオン界面活性剤；アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤等が挙げられる。これらの界面活性剤は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0106] 結合剤や粘着付与剤としては、例えばカルボキシメチルセルロースやその塩、デキストリン、水溶性デンプン、キサンタンガム、グアーガム、蔗糖、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニル

アセテート、ポリアクリル酸ナトリウム、平均分子量6000~20000のポリエチレングリコール、平均分子量10万~500万のポリエチレンオキサイド、燐脂質（例えばセファリン、レシチン等）セルロース粉末、デキストリン、加工デンプン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、架橋ポリビニルピロリドン、マレイン酸とスチレン類の共重合体、（メタ）アクリル酸系共重合体、多価アルコールからなるポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリスチレンスルホン酸の水溶性塩、パラフィン、テルペン、ポリアミド樹脂、ポリアクリル酸塩、ポリオキシエチレン、ワックス、ポリビニルアルキルエーテル、アルキルフェノールホルマリン縮合物、合成樹脂エマルジョン等が挙げられる。

[0107] 増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グアーガム、ダイユウタンガム、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、アクリル系ポリマー、デンプン化合物、多糖類のような水溶性高分子、高純度ベントナイト、フュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)のような無機微粉等が挙げられる。

[0108] 着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーのような無機顔料、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料のような有機染料等が挙げられる。

[0109] 凍結防止剤としては、例えば、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類等が挙げられる。

[0110] 固結防止や崩壊促進のための補助剤としては、例えばデンプン、アルギン酸、マンノース、ガラクトース等の多糖類、ポリビニルピロリドン、フュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)、エステルガム、石油樹脂、トリポリリン酸ナトリウム、ヘキサメタリン酸ナトリウム、ステアリン酸金属塩、セルロース粉末、デキストリン、メタクリル酸エステルの共重合体、ポリビニルピロリドン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、スルホン化スチレン・イソブチレン・無水マレイン酸共重合体、デンプン・ポリアクリ

ロニトリルグラフト共重合体等が挙げられる。

[0111] 分解防止剤としては、例えばゼオライト、生石灰、酸化マグネシウムのような乾燥剤、フェノール化合物、アミン化合物、硫黄化合物、リン酸化合物等の酸化防止剤；サリチル酸化合物、ベンゾフェノン化合物等の紫外線吸収剤等が挙げられる。

[0112] 防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、1, 2-ベンゾチアゾリン-3-オン等が挙げられる。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤；プロピレングリコール等の凍結防止剤；BHT等の酸化防止剤；紫外線吸収剤等その他の補助剤も使用することができる。

[0113] 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、本発明の農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、粉剤、粒剤、乳剤又は水和剤とする場合は0.01～50重量部が適当である。

[0114] 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g～10kg、好ましくは0.01g～1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、防除対象病虫害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、また、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

[0115] かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤として例えば、3, 5-キシリルメチルカルバメイト (3,5-xyllyl methylcarbamate(XMC))、バチルス・チューリンゲンシス (Bacillus thuringiensis : 例えば、バチルス・チューリンゲンシス・アイザワイ (Bacillus thuringiensis aizawa

i)、バチルス・チューリングエンシス・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israelensis*)、バチルス・チューリングエンシス・ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis japonensis*)、バチルス・チューリングエンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*)、バチルス・チューリングエンシス・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis tenebrionis*) 等) が生成する結晶タンパク毒素、BPMC、Btトキシン系殺虫性化合物、クロルフェンソン(chlorfenson: CPCBS)、ジクロロジイソプロピルエーテル(dichlorodii sopropyl ether: DCIP)、1, 3-ジクロロプロペン(1, 3-Dichloropropene: D-D)、DDT、NAC、O-4-ジメチルスルファモイルフェニルO, O-ジエチルフォスフォロチオエート (O-4-dimethylsulfamoylphenyl O, O-diethyl phosphorothioate: DSP)、O-エチル-O-4-ニトロフェニルフェニルフォスフォノチオエート(O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate: EPN)、トリプロピルイソシアヌレート (tripropylisocyanurate: TPIC)、アクリナトリン(acrinathrin)、アザディラクチン(azadirachtin)、アジンホス・メチル(azinphos-methyl)、アセキノシル(acequinocyl)、アセタミプリド(acetamiprid)、アセトプロール(acetoprole)、アセフェート(acephate)、アバメクチン(abamectin)、アベルメクチン(ivermectin-B)、アミドフルメット(amidoflumet)、アミトラズ(amitraz)、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、アルドリン(aldrin)、アルファーエンドスルファン (alpha-endosulfan)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、アルベンダゾール(albendazole)、アレスリン(all ethrin)、イサゾホス(isazofos)、イサミドホス(isamidofos)、イソアミドホス(isoamidofos)、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロカルブ(isoprocab: MIPC)、イベルメクチン (ivermectin)、イミシアホス(imicyafos)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イミプロトリン(imiprothrin)、インドキサカルブ(indoxacarb)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、エチオン(ethion)、エチプロール(ethiprole)、エトキサゾール(etoxazole)、エトフェンプロック

ス(ethofenprox)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrifos)、エマメクチン(emamectin)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、エンドスルファン(endosulfan)、エンペントリン(empenthrin)、オキサミル(oxamyl)、オキシジメトン・メチル(oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス(oxydeprofos: ESP)、オキシベンダゾール(oxibendazole)、オクスフェンダゾール(oxfendazole)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、オレイン酸ナトリウム(sodium oleate)、

[0116] カズサホス(cadusafos)、カルタップ(cartap)、カルバリル(carbaryl)、カルボスルファン(carbosulfan)、カルボフラン(carbofuran)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、キシリルカルブ(xylylcarb)、キナルホス(quinalphos)、キノプレン(kinoprene)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロエトカルブ(cloethocarb)、クロチアニジン(clothianidin)、クロフェンテジン(clofentezine)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルジメホルム(chlordimeform)、クロルデン(chlordane)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロルフェナピル(chlorphenapyr)、クロルフェンソン(chlorfenson)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロルベンジレート(chlorobenzilate)、クロロベンゾエート(chlorobenzoate)、ケルセン(ジコホル: dicofol)、サリチオン(salithion)、シアノホス(cyanophos: CYAP)、ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、ジアミダホス(diamidafos)、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)、シーター-シペルメトリン(theta-cypermethrin)、ジエノクロル(dienochlor)、シエノピラフェン(cyenoxyrafen)、ジオキサベンゾホス(dioxabenzofos)、ジオフェノラン(diofenolan)、シグマ-サイパーメトリン(sigma-cypermethrin)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion: ECP)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、ジクロルボス(dichlorvos: DDVP)、ジスルホトン(disulfoton)、ジノテフラン(dinotefuran)、シハロトリン(cyhalothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、シフルトリ

ン(cyfluthrin)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、ジフロビダジン(diflovidazin)、シヘキサチン(cyhexatin)、シペルメトリン(cypermethrin)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメフルスリン(dimefluthrin)、シラフルオフェン(silafluofen)、シロマジン(cyromazine)、スピネトラム(spinetoram)、スピノサッド(spinosad)、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetramat)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スルフルラミド(sulfluramid)、スルプロホス(sulprofos)、スルホキサフロール(sulfoxaflor)、ゼータ-シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ダイアジノン(diazinon)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、ダゾメット(dazomet)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオシクラム(thiocyclam)、チオスルタップ(thiosultap)、チオスルタップナトリウム(thiosultap-sodium)、チオナジン(thionazin)、チオメトン(thiometon)、ディート(deet)、ディルドリン(dieldrin)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テトラジホン(tetradifon)、テトラメチルフルトリン(tetramethylfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テブフェノジド(tebufenozide)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、テフルトリン(tefluthrin)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、テムホス(temephos)、デルタメトリン(deltamethrin)、テルブホス(terbufos)、トラロピリル(tralopyril)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、トリアザメート(triazamate)、トリアズロン(triazuron)、トリクラミド(trichlamide)、トリクロルホン(trichlorphon: DEP)、トリフルムロン(triflumuron)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、

[0117] ナレド(naled: BRP)、ニチアジン(nithiazine)、ニテンピラム(nitenpyram)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ハイドロプレレン(hydroprene)、バニリプロール(vaniliprole)、バミドチオン(vamidithion)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、ハ

ルフエンプロックス(halfenprox)、ハロフェノジド(halofenozide)、ビストリフルロン(bistrifluron)、ビスルタップ(bisultap)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、ヒドロキシプロピルデンプン(hydroxy propyl starch)、ビナパクリル(binapacryl)、ビフェナゼート(bifenazate)、ビフェントリン(bifenthrin)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclorfos)、ピラフルプロール(pyrafluprole)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、ピリダベン(pyridaben)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、ピリプロール(pyriprole)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ピリミカーブ(pirimicarb)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピレトリン(pyrethrins)、フィプロニル(fipronil)、フェナザキン(fenazaquin)、フェナミフォス(fenamiphos)、フェニソブromoレート(phenisobromolate)、フェニトロチオン(fenitrothion: MEP)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノトリン(phenothrin)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェンスルフォチオン(fensulfothion)、フェンチオン(fenthion: MPP)、フェントエート(phenthoate: P AP)、フェンバレレート(fenvalerate)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンベンダゾール(fenbendazole)、フォスチアゼート(fosthiazate)、フォルメタネート(formetanate)、ブタチオホス(butathiofos)、ブプロフェジン(buprofezin)、フラチオカルブ(furathiocarb)、プラレトリン(prallethrin)、フルアクリピリム(flucacrypyrim)、フルアジナム(fluzinam)、フルアズロン(fluzuron)、フルエンスルホン(fluensulfone)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(flualinate)、フルピラゾホス(flupyr azofos)、フルフェネリム(flufenerim)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、フルフェンジン(flufenzine)、フルフエンプロックス(flufenoprox)、フルプロキシフェン(fluproxyfen)、フルブロシスリネート(flubrocylthrininate)、フルベンジアミド(flubendiamide)、フルメトリン(flumethrin)、フルリムフェン(flurimfen)、プロチオホス(prothiofos)、プロトリフェンブト(protrif

enbute)、フロニカミド(flonicamid)、プロパホス(propaphos)、プロパルギット(propargite: BPPS)、プロフェノホス(profenofos)、プロフルスリン (profluthrin)、プロポキスル(propoxur: PHC)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、ヘプテノホス(heptenophos)、ペルメトリン(permethrin)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、

[0118] ホキシム(phoxim)、ホサロン(phosalone)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホスチエタン(fosthietan)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホスホカルブ(phosphocarb)、ホスメット(phosmet: PMP)、ポリナクチン複合体(polynactins)、ホルメタネート(formetanate)、ホルモチオン(formothion)、ホレート(phorate)、マシン油(machine oil)、マラチオン(malathion)、ミルベマイシン(milbemycin)、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ミルベメクチン(milbemectin)、メカルバム(mecarbam)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メソミル(methomyl)、メタアルデヒド(metaldehyde)、メタフルミゾン(metaflumizone)、メタミドホス(methamidophos)、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、メチオカルブ(methiocarb)、メチダチオン(methidathion: DMTP)、メチルイソチオシアネート(methylisothiocyanate)、メチルネオデカナミド(methylneodecanamide)、メチルパラチオン(methylparathion)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、メトキシクロル(methoxychlor)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、メトフルトリン(metofluthrin)、メトプレン(methoprene)、メトルカルブ(metolcarb)、メルフルスリン(meperfluthrin)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、モノスルタップ(monosultap)、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、リアノジン(ryanodine)、ルフェヌロン(lufenuron)、レスメトリン(resmethrin)、レピメクチン(lepimectin)、ロテノン(rotenone)、塩酸レバミゾール(levamisol hydrochloride)、酸化フェンブタスズ(fenbutati

n oxide)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、臭化メチル(methyl bromide)、水酸化トリシクロヘキシルスズ(cyhexatin)、石灰窒素(calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(calcium polysulfide)、硫黄(sulfur)、及び硫酸ニコチン(nicotine-sulfate)等を例示することができる。

[0119] 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤として例えば、アウレオフンギン (aureofungin)、アザコナゾール (azaconazole)、アジチラム (azithiram)、アシペタックス (acypetacs)、アシベンゾラル (acibenzolar)、アシベンゾラルSメチル(acibenzolar-S-methyl)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、アニラジン (anilazine)、アミスルブロム (amisulbrom)、アンプロピルホス (ampropylfos)、アメトクトラジン (ametoctradin)、アリルアルコール (allyl alcohol)、アルジモルフ (aldimorph)、アンバム(amobam)、イソチアニル (isotianil)、イソバレジオン (isovalledione)、イソピラザム (isopyrazam)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イプコナゾール (ipconazole)、イプロジオン (iprodone)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、イプロベンホス (iprobenfos)、イマザリル (imazalil)、イミノクタジン (iminocadine)、イミノクタジンアルベシル酸塩(iminocadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩(iminocadine-triacetate)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、ウニコナゾール (uniconazole)、ウニコナゾールP (uniconazole-P)、エクロメゾール(echlomezole)、エジフェンホス(edifenphos)、エタコナゾール (etaconazole)、エタボキサム (ethaboxam)、エチリモール (ethirimol)、エテム (etem)、エトキシキン (ethoxyquin)、エトリジアゾール(etridiazole)、エネストロブリン (enestroburin)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキシキノリン銅 (copper-8-quinolinolate)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、オキシ銅(copper-oxinate)、オキスポコナゾール(oxpoconazole)、オキスポコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole-fumarate)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オクチリノン (octhilinone)、オフラセ (ofurace)、オリサストロビ

ン (orysastrobin) 、カーバム(metam-sodium) 、カスガマイシン (kasugamycin) 、カルバモルフ (carbamorph) 、カルプロパミド (carpropamid) 、カルベンダジム (carbendazim) 、カルボキシシン (carboxin) 、カルボン (carvone) 、キナザミド (quinazamid) 、キナセトール (quinacetol) 、キノキシフェン (quinoxifen) 、キノメチオネート(quinomethionate) 、キャプタホール (captafol) 、キャプタン (captan) 、キララキシル (kiralaxyl) 、キンコナゾール (quinconazole) 、キントゼン (quintozene) 、グアザチン (guazatine) 、クフラネブ (cufraneb) 、クプロバム (cuprobam) 、グリオジン (glyodin) 、グリセオフルビン (griseofulvin) 、クリムバゾール (climbazole) 、クレゾール (cresol) 、クレソキシムメチル(kresoxim-methyl) 、クロゾリネート (chlozolate) 、クロトリマゾール (clotrimazole) 、クロベンチアゾン (chlobenthiazole) 、クロラニホルメタン (chloraniformethan) 、クロラニル (chloranil) 、クオルキノックス (chlorquinox) 、クオルピクリン (chloropicrin) 、クオルフェナゾール (chlorfenazole) 、クロロジニトロナフタレン (chlorodinitronaphthalene) 、ククロタロニル (chlorothalonil) 、ククロネブ (chloroneb) 、

[0120] ザリラミド (zarilamid) 、サリチルアニリド (salicylanilide) 、シアゾファミド (cyazofamid) 、ジエチルピロカーボナート (diethyl pyrocarbonate) 、ジエトフェンカルブ (diethofencarb) 、シクラフラミド (cyclafuramid) 、シクロシメット (diclocymet) 、ジクロゾリン (dichlozoline) 、ジクロブトラゾール (diclobutrazol) 、ジクロフルアニド(dichlofluanid) 、シクロヘキシミド (cycloheximide) 、ジクロメジン (diclomezine) 、ジクロラン (dicloran) 、ジクロロフェン (dichlorophen) 、ジクロロン (dichlone) 、ジスルフィラム (disulfiram) 、ジタリムフォス (ditalimfos) 、ジチアノン (dithianon) 、ジニコナゾール (diniconazole) 、ジニコナゾールM (diniconazole-M) 、ジネブ (zineb) 、ジノカップ (dinocap) 、ジノクトン (dinocton) 、ジノスルホン (dinosulfon) 、ジノテルボン (dinoterbon) 、ジノブトン (dinobuton) 、ジノペントン (dinopenton) 、ジピリチオン

(dipyrithione)、ジフェニルアミン (diphenylamine)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、ジフルメトリム (diflumetorim)、シプロコナゾール (cyproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、シペンダゾール (cypendazole)、シメコナゾール (simeconazole)、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、シモキサニル (cymoxanil)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、臭化メチル (methyl bromide)、ジラム (ziram)、シルチオファム (silthiofam)、ストレプトマイシン (streptomycin)、スピロキサミン (spiroxamine)、スルトロペン (sultropen)、セダキサ (sedaxane)、ゾキサミド (zoxamide)、ダゾメット (dazomet)、チアジジン (thiadiazin)、チアジニル (tiadinil)、チアジフルオル (thiadifluor)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオキシミド (tioxyimid)、チオクロルフェンフィム (thiochlorfenphim)、チオファネート (thiophanate)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、チシオフエン (thicyofen)、チノキノックス (thioquinox)、キノメチオネート (chinomethionate)、チオフルザミド (thifluzamide)、チラム (thiram)、デカフェンチン (decafentin)、テクナゼン (tecnazene)、テクロフタラム (tecloftalam)、テコラム (tecoram)、テトラコナゾール (tetraconazole)、デバカルブ (debacarb)、デヒドロ酢酸 (dehydroacetic acid)、テブコナゾール (tebuconazole)、テブフロキン (tebufloquin)、ドジシン (dodicin)、ドジン (dodine)、ドデシルベンゼンスルホン酸ビスエチレンジアミン銅錯塩 (I I) (DBEDC)、ドデモルフ (dodemorph)、ドラゾキサロン (drazoxolon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアズブチル (triazbutil)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリアミホス (triamiphos)、トリアリモール (triarimol)、トリクラミド (trichlamide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリチコナゾール (triticonazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリブチルチンオキシド (tributyltin oxide)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリフロキシストロビン (tr

ifloxystrobin)、トリホリン (triforine)、トリルフルアラニド (tolylfluorid)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、ナタマイシン (natamycin)、ナバム (nabam)、ニトロタサルイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ニトラスチレン (nitrostyrene)、ヌアリモール (nuarimol)、ノニルフェノールスルホン酸銅(copper nonylphenol sulfonate)、

[0121] ハラクリネート (halacrinat)、バリダマイシン (validamycin)、バリフェナレート (valifenalate)、ハルピンタンパク(harpin protein)、ビキサフェン (bixafen)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピコベンザミド(picobenzamide)、ビチオノール (bithionol)、ビテルタノール (bitertanol)、ヒドロキシイソキサゾール (hydroxyisoxazole)、ヒドロキシイソキサゾールカリウム(hydroisoxazole-potassium)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ピペラリン (piperalin)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、ピリオフェノン (pyriofenone)、ピリジニトリル (pyridinitril)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキシクロル (pyroxychlor)、ピロキシフル (pyroxyfur)、ピロキロン (pyroquilon)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ファミキサドン (famoxadone)、フェナパニル (fenapanil)、フェナミドン (fenamidone)、フェナミノスルフ (fenaminosulf)、フェナリモール (fenarimol)、フェニトロパン (fenitropan)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェリムゾン (ferimzone)、フェルバム (ferbam)、フェンチン (fentin)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラム (fenfuram)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フタリド (phthalide)、ブチオベート (buthiobate)、ブチルアミン (butylamine)、ブピリメート (bupirimate)、フベリダゾール (fuberidazole)

ole)、ブラストサイジンS (blasticidin-S)、フラメトピル (furametpyr)、フララキシル (furalaxyl)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルアジナム (fluazinam)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピラム (fluopyram)、フルオロイミド (fluoroimide)、フルカルバニル (furcarbanil)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルコナゾール (furconazole)、フルコナゾール-シス (furconazole-cis)、フルジオキサニル (fludioxonil)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルチアニル (flutianil)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアホール (flutriafol)、フルフラール (furfural)、フルメシクロックス (furmecyclox)、フルメットベル (flumetover)、フルモルフ (flumorph)、プロキナジド (proquinazid)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロチオカルブ (prothiocarb)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、プロパモカルブ (propamocarb)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、フロファネート (furophanate)、プロベナゾール (probenazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ヘキサクロロブタジエン (hexachlorobutadiene)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヘキシルチオホス (hexylthiofos)、ベトキサジン (bethoxazin)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルM (benalaxyl-M)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ベンキノックス (benquinox)、ペンコナゾール (penconazole)、ベンザモルフ (benzamorf)、ペンシクロン (pencycuron)、ベンゾヒドロキサム酸 (benzohydroxamic acid)、ベントルロン (bentaluron)、ベンチアゾール (benthiazole)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、ベンチオピラド (penthiopyrad)、ペンフルフェン (penflufen)、

[0122] ボスカリド (boscalid)、ホスジフェン (phosdiphen)、ホセチル (fosetyl)、ホセチルアルミニウム (fosetyl-Al)、ポリオキシシン (polyoxins)、

ポリオキソリン (polyoxorim)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ホルペット (folpet)、ホルムアルデヒド (formaldehyde)、マシン油 (machine oil)、マネブ (maneb)、マンコゼブ (mancozeb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、ミクロゾリン (myclozolin)、ミクロブタニル (myclobutani l)、ミルディオマイシン (mildiomyacin)、ミルネブ (milneb)、メカルビンジド (mecarbinzid)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メタゾキシロン (metazoxolon)、メタム (metam)、メタムナトリウム塩 (metam-sodium)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルM (metalaxyl-M)、メチラム (metiram)、メチルイソチオシアナート (methyl isothiocyanate)、メチルジノカップ (mepthyldinocap)、メトコナゾール (metconazole)、メトスルホバックス (metsulfovax)、メトフロキサム (methfuroxam)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、メパニピリム (mepanipyrim)、メフェノキサム (mefenoxam)、メプチルジノカップ (meptyldinocap)、メプロニル (mepronil)、メベニル (mebenil)、

[0123] ヨウ化メチル (iodomethane)、ラベンザゾール (rabenzazole)、塩化ベンザルコニウム (benzalkonium chloride)、塩基性塩化銅 (basic copper chloride)、塩基性硫酸銅 (basic copper sulfate)、無水硫酸銅 (copper sulfate anhydride) 硫酸銅五水塩 (copper sulfate pentahydrate)、水酸化第二銅 (cupric hydroxide)、8-ヒドロキシキノリン銅 (oxine copper) のような銅系化合物、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル (nickel dimethyldithiocarbamate)、硫酸亜鉛 (zinc sulfate) 金属銀 (silver) 等の無機殺菌剤、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、水和硫黄剤 (wetable sulfur)、石灰硫黄合剤 (calcium polysulfide)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、無機硫黄 (sulfur) を例示することができる。

[0124] 同様に除草剤として例えば、1-ナフチルアセトアミド、2, 4-PA、2, 3, 6-TB A、2, 4, 5-T、2, 4, 5-TB、2, 4-D、2, 4-DB、2, 4-DEB、2, 4-DEP、3, 4-DA、3, 4-DB、3, 4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、MCPAチオエチル、MCPB、アイ

オキシニル (ioxynil)、アクロニフェン (aclonifen)、アザフェニジン (azafenidin)、アシフルオルフェン (acifluorfen)、アジプロトリン (aziprotrotryne)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、アシュラム (asulam)、アセトクロール (acetochlor)、アトラジン (atrazine)、アトラトン (atraton)、アニスロン (anisuron)、アニロホス (anilofos)、アビグリシン (aviglycine)、アブシジン酸 (abscisic acid)、アミカルバゾン (amicarbazone)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アミトロール (amitrole)、アミノシクロピラクロール (aminocyclopyrachlor)、アミノピラリド (aminopyralid)、アミブジン (amibuzin)、アミプロホスメチル (amiprophos-methyl)、アメトリジオン (ametridione)、アメトリン (ametryn)、アラクロール (alachlor)、アリドクロール (allidochlor)、アロキシジム (alloydim)、アロラック (alorac)、イソウロン (isouron)、イソカルバミド (isocarbamid)、イソキサクロルトール (isoxachlortole)、イソキサピリホップ (isoxapyrifop)、イソキサフルトール (isoxaflutole)、イソキサベン (isoxaben)、イソシル (isocil)、イソノルロン (isonoruron)、イソプロツロン (isoproturon)、イソプロパリン (isopropalin)、イソポリナート (isopolinate)、イソメチオジン (isomethiozin)、イナベンフィド (inabenfide)、イパジン (ipazine)、イプフェンカルバゾン (ipfencarbazone)、イプリミダム (iprymidam)、イマザキン (imazaquin)、イマザピック (imazapic)、イマザピル (imazapyr)、イマザメタピル (imazamethapyr)、イマザメタベンズ (imazamethabenz)、イマザメタベンズメチル (imazamethabenz-methyl)、イマザモックス (imazamox)、イマゼタピル (imazethapyr)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、インダジフラム (indaziflam)、インダノファン (indanofan)、インドール酪酸 (indolebutyric acid)、ウニコナゾール-P (uniconazole-P)、エグリナジン (eglinazine)、エスプロカルブ (esprocarb)、エタメスルフロン (ethametsulfuron)、エタメトスルフロンメチル (ethametsulfuron-methyl)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、エチオレート (ethiolate)、エチクロゼート-エチル (ethychlozate ethyl)、

エチジムロン (ethidimuron)、エチノフェン (etinofen)、エテホン (ethephon)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エトキシフェン (ethoxyfen)、エトニプロミド (etnipromid)、エトフメセート (ethofumesate)、エトベンザニド (etobenzanid)、エプロナズ (epronaz)、エルボン (erbon)、エンドタール (endothal)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、オキサピラゾン (oxapyrazon)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、オリザリン (oryzalin)、オルソスルファミロン (orthosulfamuron)、オルベンカルブ (orbencarb)、

[0125] カフェンストロール (cafenstrole)、カムベンジクロール (cambendichlor)、カルバスラム (carbasulam)、カルフェントラゾン (carfentrazone)、カルフェントラゾン-エチル (carfentrazone-ethyl)、カルブチレート (karbutilate)、カルベタミド (carbetamide)、カルボキサゾール (carboxazole)、キザロホップ (quizalofop)、キザロホップ-P (quizalofop-P)、キザロホップ-エチル (quizalofop-ethyl)、キシラクロール (xylachlor)、キノクラミン (quinoclamine)、キノナミド (quinonamid)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、クミルロン (cumyluron)、クリオジネート (cliodinate)、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)、クレダジン (credazine)、クレトジム (clethodim)、クロキシホナック (cloxyfonac)、クロジナホップ (clodinafop)、クロジナホップ-プロパルギル (clodinafop-propargyl)、クロトルロン (chlorotoluron)、クロピラリド (clopyralid)、クロプロキシジム (cloproxydim)、クロプロップ (cloprop)、クロブロムロン (chlorbromuron)、クロホップ (clofop)、クロマゾン (clomazone)、クロメトキシニル (chlomethoxynil)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロメプロップ (clomeprop)、クロラジホップ (chlorazifop)、クロラジン (chlorazine)、クロラスラム (cloransulam)、クロラノクリル (chloranocryl)、クロラムベン (chloramben)、クロランスラム-メチル (cloransulam

-methyl)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン (chlorimuron)、クロリムロン-エチル(chlorimuron-ethyl)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルタル (chlorthal)、クロルチアミド (chlorthiamid)、クロルトルロン(chlortoluron)、クロルニトロフェン (chlornitrofen)、クロルフェナック (chlorfenac)、クロルフェンプロップ (chlorfenprop)、クロルブファミ (chlorbufam)、クロルフルラゾール (chlorflurazole)、クロルフルレノール (chlorflurenol)、クロルプロカルブ (chlorprocarb)、クロルプロファミ (chlorpropham)、クロルメコート(chlormequat)、クロレツロン (chloreturon)、クロロキシニル (chloroxynil)、クロロクスロン (chloroxuron)、クロロポン (chloropon)、

[0126] サフルフェナシル (saflufenacil)、シアナジン (cyanazine)、シアナトリン (cyanatryn)、ジアレート(di-allate)、ジウロン (diuron)、ジエタムコート (diethamquat)、ジカンバ (dicamba)、シクルロン (cycluron)、シクロエート (cycloate)、シクロキシジム (cycloxydim)、ジクロスラム (diclosulam)、シクロスルフファミロン (cyclosulfamuron)、ジクロプロップ (dichlorprop)、ジクロプロップ-P (dichlorprop-P)、ジクロベニル (dichlobenil)、ジクロホップ (diclofop)、ジクロホップメチル(diclofop-methyl)、ジクロメート (dichlormate)、ジクロラルウレア (dichloralurea)、ジクワット (diquat)、シサニリド (cisanilide)、ジスル (disul)、シズロン (siduron)、ジチオピル (dithiopyr)、ジニトラミン (dinitramine)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、ジノサム (dinosam)、シノスルフロン (cinosulfuron)、ジノセブ (dinoseb)、ジノテルブ (dinoterb)、ジノフェナート (dinofenate)、ジノプロップ (dinoprop)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ジフェナミド (diphenamid)、ジフェノクスロン (difenoxuron)、ジフェノペンテン (difenopenten)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、シブトリン (cybutryne)、シプラジン (cyprazine)、シプラゾール (cyprazole)、ジフルフェニカン (diflufenican)、ジフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、ジプロペトリン (dipropetryn)、シプロミド

(cypromid)、シペルコート (cyperquat)、ジベレリン(gibberellin)、シマジン (simazine)、ジメキサノ (dimexano)、ジメタクロール (dimethachlor)、ジメダゾン (dimidazon)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、シメトリン (simetryn)、シメトン (simeton)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメフロン (dimefuron)、シンメチリン (cinmethylin)、スエップ (swep)、スルグリカピン (sulglycapin)、スルコトリオン (sulcotrione)、スルファレート (sulfallate)、スルフェントラゾン (sulfentrazone)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、スルホメツロン (sulfometuron)、スルホメツロンメチル(sulfometuron-methyl)、セクブメトン (secbumeton)、セトキシジム (sethoxydim)、セブチラジン (sebuthylazine)、

[0127] ターバシル(terbacil)、ダイムロン (daimuron)、ダゾメット (dazomet)、ダラポン (dalapon)、チアザフルロン (thiazafluron)、チアゾピル (thiazopyr)、チエンカルバゾン (thiencarbazon)、チエンカルバゾンメチル(thiencarbazon-methyl)、チオカルバジル (tiocarbazil)、チオクロリム (tioclorim)、チオベンカルブ (thiobencarb)、チジアジミン (thidiazimin)、チジアズロン (thidiazuron)、チフェンスルフロン (thifensulfuron)、チフェンスルフロンメチル(thifensulfuron-methyl)、デスメディファム (desmedipham)、デスメトリン (desmetryn)、テトラフルロン (tetrafluron)、テニルクロール (thenylchlor)、テブタム (tebutam)、テブチウロン (tebuthiuron)、テルブメトン (terbumeton)、テプラロキシジム (tepraloxymid)、テフリールトリオン (tefuryltrione)、テムボトリオン (tembotrione)、デラクロール (delachlor)、テルバシル (terbacil)、テルブカルブ (terbucarb)、テルブクロール (terbuchlor)、テルブチラジン (terbuthylazine)、テルブトリン (terbutryn)、トプラメゾン (topramezone)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、トリアジフラム (triaziflam)、トリアスルフロン (triasulfuron)、トリアレート(tri-allate)、トリエタジン (trietazine)、トリカンバ (tricamba)、トリクロピル (triclopyr)、ト

リジファン (tridiphane)、トリタック (tritac)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、トリフルスルフロン (triflusulfuron)、トリフルスルフロンメチル(triflusulfuron-methyl)、トリフルラリン (trifluralin)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリプロピンダン (tripropindan)、トリベニューロンメチル(tribenuron-methyl)、トリベヌロン (tribenuron)、トリホップ (trifop)、トリホプシメ (trifopsime)、トリメツロン (trimeturon)、ナプタラム (naptalam)、ナプロアニリド (naproanilide)、ナプロパミド (napropamide)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、ニトラリン (nitralin)、ニトロフェン (nitrofen)、ニトロフルオルフェン (nitrofluorfen)、ニピラクロフェン (nipyraclufen)、ネブロン (neburon)、ノルフルラゾン (norflurazon)、ノルロン (noruron)、

[0128] バーバン (barban)、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、パラコート (paraquat)、パラフルロン (parafluron)、ハロキシジン (haloxydine)、ハロキシホップ (haloxyfop)、ハロキシホップ-P (haloxyfop-P)、ハロキシホップメチル(haloxyfop-methyl)、ハロサフェン (halosafen)、ハロスルフロン (halosulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ビスクロピロン (bicyclopyrone)、ビスピリバック (bispyribac)、ビスピリバックナトリウム(bispyribac-sodium)、ピダノン (pydanon)、ピノキサデン (pinoxaden)、ビフェノックス (bifenox)、ピペロホス (piperophos)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラスルホトール (pyrasulfotole)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピラゾスルフロン (pyrazosulfuron)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラナホス (bilanafos)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、ピリクロール (pyriclor)、ピリダホール (pyridafol)、ピリチオバック (pyrithiobac)、ピリチオバックナトリウム(pyrithiobac-sodium)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリミスルファ

ン (pyrimisulfan)、ピリミスルフロン (primisulfuron)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl)、ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、ピロクスラム (pyroxsulam)、

[0129] フェナスラム (fenasulam)、フェニソファム (phenisopham)、フェヌロン (fenuron)、フェノキサスルホン (fenoxasulfone)、フェノキサプロップ (fenoxaprop)、フェノキサプロップ-P (fenoxaprop-P)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フェノチオール (phenothiol)、フェノプロップ (fenoprop)、フェノベンズロン (phenobenzuron)、フェンチアプロップ (fenthiaaprop)、フェンテラコール (fenteracol)、フェントラザミド (fentrazamide)、フェンメディファム (phenmedipham)、フェンメディファムエチル (phenmedipham-ethyl)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホス (butamifos)、ブチウロン (buthiuron)、ブチダゾール (buthidazole)、ブチレート (butylate)、ブツロン (buturon)、ブテナクロール (butenachlor)、ブトキシジム (butroxydim)、ブトラリン (butralin)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、フラムプロップ (flamprop)、フリロオキシフェン (furyloxyfen)、プリナクロール (prynachlor)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、フルアジホップ (fluazifop)、フルアジホップ-P (fluazifop-P)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、フルアゾレート (fluazolate)、フルロキシピル (fluroxypyr)、フルオチウロン (fluothiuron)、フルオメツロン (fluometuron)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen)、フルロクロリドン (flurochloridone)、フルオロジフェン (fluorodifen)、フルオロニトロフェン (fluronitrofen)、フルオロミジン (fluoromidine)、フルカルバゾン (flucarbazone)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazone-sodium)、フルクロラリン (fluchloralin)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、フルチアセット (fluthiacet)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェニカン (flufenican)、フルフェンピル (flufenpyr)、フルプロパシル

(flupropacil)、フルプロパナート (flupropanate)、フルポキサム (flupoxam)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルミクロラック (flumiclorac)、フルミクロラックペンチル(flumiclorac-pentyl)、フルミプロピン (flumipropyn)、フルメジン (flumezin)、フルオメツロン (fluometuron)、フルメトスラム (flumetsulam)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、フルロキシピル(fluroxypyr)、プレチラクロール (pretilachlor)、プロキサン (proxan)、プログリナジン (proglinazine)、プロシアジン (procyazine)、プロジアミン (prodiamine)、プロスルファリン (prosulfalin)、プロスルフロン (prosulfuron)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、プロパキザホップ (propaquizafof)、プロパクロール (propachlor)、プロパジン (propazine)、プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、プロピソクロール (propisochlor)、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron)、プロファム (propham)、プロフルアゾール (profluazol)、プロフルラリン (profluralin)、プロヘキサジオンカルシウム(prohexadione-calcium)、プロポキシカルバゾン (propoxycarbazone)、プロポキシカルバゾンナトリウム(propoxycarbazone-sodium)、プロホキシジム (profoxydim)、ブロマシル (bromacil)、ブロムピラゾン (brompyrazon)、プロメトリン (prometryn)、プロメトン (prometon)、ブromoキシニル (bromoxynil)、ブromoフェノキシム (bromofenoxim)、ブromoブチド (bromobutide)、ブromoボニル (bromobonil)、フロラスラム (florasulam)、

[0130] ヘキサクロロアセトン (hexachloroacetone)、ヘキサジノン (hexazinone)、ペトキサミド (pethoxamid)、ベナゾリン (benazolin)、ペノクスラム (penoxsulam)、ペブレート (pebulate)、ベフルブタミド (beflubutamid)、ベルノレート (vernolate)、ペルフルイドン (perfluidone)、ベンカルバゾン (bencarbazone)、ベンザドックス (benzadox)、ベンジプラム (benzipram)、ベンジルアミノプリン(benzylaminopurine)、ベンズチアズロン (benzthiazuron)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ベンスリド (ben

sulide)、ベンスルフロロンメチル (bensulfuron-methyl)、ベンゾイルプロップ (benzoylprop)、ベンゾビスクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンゾフルオール (benzofluor)、ベントゾン (benta zone)、ペントクロール (pentanochlor)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペントキサゾン (pentoxazone)、ベンフラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ホサミン (fosamine)、ホメサフェン (fomesafen)、ホラムスルフロロン (foramsulfuron)、ホルクロルフエニユロン (forchlorfenuron)、

[0131] マレイン酸ヒドラジド (maleic hydrazide)、メコプロップ (mecoprop)、メコプロップ-P (mecoprop-P)、メジノテルブ (medinoterb)、メソスルフロロン (mesosulfuron)、メソスルフロロンメチル (mesosulfuron-methyl)、メソトリオン (mesotrione)、メソプラジン (mesoprazine)、メソプロトリン (methoprotryne)、メタザクロール (metazachlor)、メタゾール (methazole)、メタゾスルフロロン (metazosulfuron)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、メタミトロン (metamitron)、メタミホップ (metamifop)、メタム (metam)、メタルプロパリン (methalpropalin)、メチウロン (methiuron)、メチオゾリン (methiozolin)、メチオベンカルブ (methiobencarb)、メチルダイムロン (methyldymron)、メトクスロン (metoxuron)、メトスラム (metosulam)、メトスルフロロン (metsulfuron)、メトスルフロロンメチル (metsulfuron-methyl)、メトフラゾン (metflurazon)、メトブロムロン (metobromuron)、メトベンズロン (metobenzuron)、メトメトン (methometon)、メトラクロール (metolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メピコートクロリド (mepiquat-chloride)、メフェナセット (mefenacet)、メフルイジド (mefluidide)、モナリド (monalide)、モニソウロン (monisouron)、モニュヌロン (monuron)、モノクロル酢酸 (monochloroacetic acid)、モノリニュヌロン (monolinuron)、モリネート (molinate)、モルフアムコート (morfamquat)、ヨードスルフロロン (iodosulfuron)、ヨードスルフロロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、ヨードボニル (iodob

onil)、ヨードメタン (iodomethane)、ラクトフェン (lactofen)、リヌロン (linuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、レナシル (lenacil)、ローデタニル (rhodethanil)、過酸化カルシウム (calcium peroxide)、臭化メチル (methyl bromide) 等を例示することができる。

[0132] また、生物農薬として例えば、核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ポックスウイルス (Entomopoxi virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスפורウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ (Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema kushidai)、パスツーリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobactor)、非病原性エルビニア・カロトボーラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

[0133] 更に、生物農薬として例えば、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレマンアブラバチ (Aphidius colemani)、シヨクガタマバエ (Aphidolestes aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメリスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ (Orius sauteri) 等の天敵生物、ポーベリア・ブロンニアティ (Beauveria brongniartii) 等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等

のフェロモン剤と併用することも可能である。

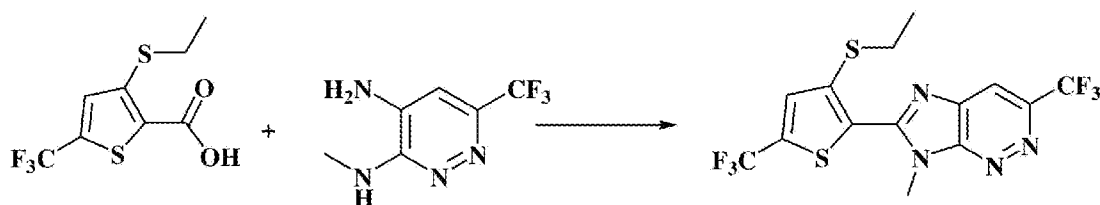
[0134] 以下に本発明の代表的な化合物、及び製造中間体の製造例によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

## 実施例

[0135] 製造実施例 1.

2 - (3 - エチルチオ - 5 - トリフルオロメチルチオフエン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - C] ピリダジンの製法 (化合物番号 1 - 1)

[0136] [化9]



4 - アミノ - 3 - メチルアミノ - 6 - トリフルオロメチルピリダジン (133 mg, 0.7 mmol)、3 - エチルチオ - 5 - トリフルオロメチルチオフエン - 2 - カルボン酸 (195 mg, 0.76 mmol) を無水テトラヒドロフラン (THF、5 mL) に溶解し、2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウムヨード (357 mg, 1.4 mmol)、トリエチルアミン (212 mg, 2.1 mmol)、ジメチルアミノピリジン (10 mg) を加え、6 時間還流させた。冷却後、酢酸エチルを添加し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した。濃縮して得られる残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し、2 - (3 - エチルチオ - 5 - トリフルオロメチルチオフエン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - C] ピリダジン (113 mg, 35%) を得た。

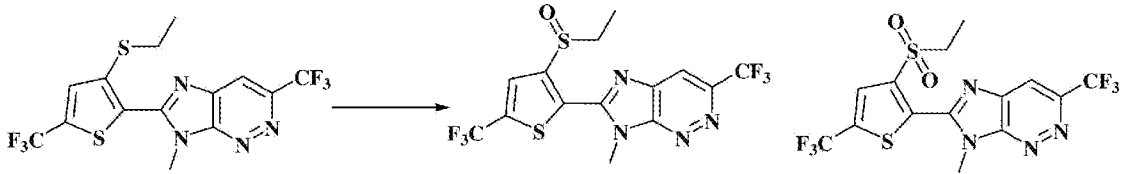
融点： 133.7 - 135.7 °C

[0137] 製造実施例 2.

2 - (3 - エチルスルフィニル - 5 - トリフルオロメチルチオフエン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 -

C] ピリダジン（化合物番号 1 - 2）及び、2 - （3 - エチルスルホニル - 5 - トリフルオロメチルチオフェン - 2 - イル） - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - C] ピリダジン（化合物番号 1 - 3）の製法

[0138] [化10]



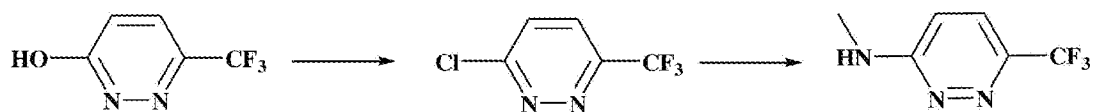
製造実施例 1 で製造した化合物（66 mg, 0.16 mmol）を酢酸エチル（1 mL）に溶解し、m-CPBA（47 mg, 0.17 mmol）を添加して 1 時間室温で撹拌した。ジメチルスルホキシド（DMSO）及びトリエチルアミンを加え、後処理した後、濃縮して得られる残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し、2 - （3 - エチルスルフィニル - 5 - トリフルオロメチルチオフェン - 2 - イル） - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン（41 mg, 66%）及び 2 - （3 - エチルスルホニル - 5 - トリフルオロメチルチオフェン - 2 - イル） - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン（21 mg, 32%）を得た。

融点（化合物番号 1 - 2）： 181.6 - 185.9 °C

融点（化合物番号 1 - 3）： 170.0 - 172.4 °C

[0139] 参考例 1. N-メチル-3-アミノ-6-トリフルオロメチルピリダジンの製造

[0140] [化11]

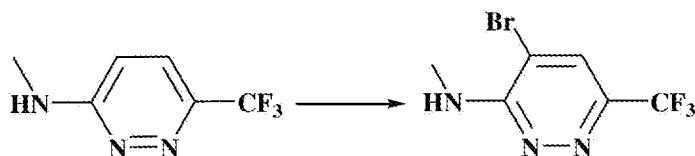


WO/2005/047279 に記載の方法に従って合成した 6-トリフルオロメチル-3-ピリダジノール（11.5 g）、塩化チオニル（12.

5 g)、ジメチルホルムアミド(1 ml)の混合物を3時間加熱還流した。反応混合物に氷水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をテトラヒドロフラン(5 ml)に溶解し、氷冷下、メチルアミン(40%メタノール溶液、16.2 g)に滴下した。室温で一晩攪拌後、反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、3-メチルアミノ-6-トリフルオロメチルピリダジン(5.1 g)を得た。物性：150-152 °C(融点)

[0141] 参考例2. 3-メチルアミノ-4-ブロモ-6-トリフルオロメチルピリダジンの合成

[0142] [化12]



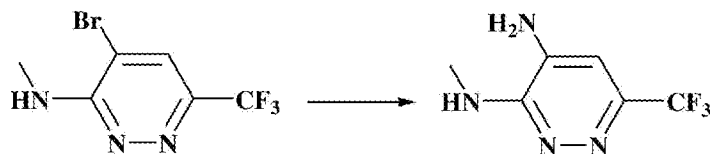
参考例1で製造された3-メチルアミノ-6-トリフルオロメチルピリダジン(1.8 g)、1,3-ジブロモ-5,5-ジメチルヒダントイン(3.15 g)、アセトニトリル(10 ml)の混合物を3時間加熱還流した。反応混合物に飽和チオ硫酸水素ナトリウム溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、3-メチルアミノ-4-ブロモ-6-トリフルオロメチルピリダジンの化合物(0.9 g)を得た。

物性：<sup>1</sup>H-NMR(CDCI<sub>3</sub>): 7.70(s, 1H)、5.41(b r s、1H)、3.26(d、1H)

[0143] 参考例3. 4-アミノ-3-メチルアミノ-6-トリフルオロメチルピリダジンの合成

[0144]

[化13]



4-ブロモ-3-メチルアミノ-6-トリフルオロメチルピリダジン (25.6 g, 100 mmol)、ナトリウムターシャリーブトキシド (NaOtBu) (13.5 g, 140 mmol)、ベンゾフェノンイミン (21.7 g, 120 mmol) のトルエン懸濁液に、PdCl<sub>2</sub> (dppf) · CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (4.08 g, 5.0 mmol) を加えてアルゴン置換した。この混合物を100℃で15時間反応した。室温まで冷却して反応混合物をカラムクロマトグラフィーにて精製し、4-ジフェニルイミノ-3-メチルアミノ-6-トリフルオロメチルピリダジンを38.15 g (88%) 得た。

<sup>1</sup>H-NMR : 9.20 (s, 1H), 7.56 - 7.40 (m, 6H), 7.29 - 7.26 (m, 4H), 6.38 (s, 1H), 2.81 (s, 3H)

前反応で得られた4-ジフェニルイミノ-3-メチルアミノ-6-トリフルオロメチルピリダジン (37.9 g, 88 mmol) のエタノール (300 mL) 溶液に6N塩酸 (300 mL, 1.8 mol) を加え、この混合物を100℃で2時間反応させた。反応混合物を室温まで冷却して、エタノールを減圧留去し、残った酸性溶液をジエチルエーテルで抽出して、ベンゾフェノンを除いた。残った酸性水溶液を氷冷下に9N NaOH水溶液で中和後、ジエチルエーテルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。乾燥剤をろ別して、有機溶媒を濃縮して得られた固体生成物をエーテルで洗浄して、4-アミノ-3-メチルアミノ-6-トリフルオロメチルピリダジンを淡黄色固体として15.33 g (80 mmol, 91%) 得た。

融点 : 220 - 221℃

[0145] 以下に、製剤の実施例を示すが、これらに限定されるものではない。製剤

例中、部とあるのは重量部を示す。

[0146] 製剤例 1.

|   |     |
|---|-----|
| 本発明化合物 (1)                                      | 10部 |
| キシレン  | 70部 |
| N-メチルピロリドン                                      | 10部 |
| ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと<br>アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合 | 10部 |
| 以上を均一に混合溶解して乳剤とする。                              |     |

[0147] 製剤例 2.

|                    |     |
|--------------------|-----|
| 本発明化合物 (1)         | 3部  |
| クレー粉末              | 82部 |
| 珪藻土粉末              | 15部 |
| 以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。 |     |

[0148] 製剤例 3.

|                                     |     |
|-------------------------------------|-----|
| 本発明化合物 (1)                          | 5部  |
| ベントナイトとクレーの混合粉末                     | 90部 |
| リグニンスルホン酸カルシウム                      | 5部  |
| 以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。 |     |

[0149] 製剤例 4.

|   |     |
|---|-----|
| 本発明化合物 (1)                                      | 20部 |
| カオリンと合成高分散珪酸                                    | 75部 |
| ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと<br>アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合 | 5部  |
| 以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。                             |     |

[0150] 次に本発明の試験例を示すが、これらに限定されるものではない。

[0151] 試験例 1. モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) に対する防除価試験

直径 8 cm、高さ 8 cm のプラスチックポットにハクサイを植えてモモア

カアブラムシを繁殖させ、それぞれのポットの寄生虫数を調査した。本発明の一般式（1）で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を水に分散させて500ppmの薬液に希釈し、該薬液をポット植えハクサイの茎葉に散布して風乾後、ポットを温室に保管し、薬剤散布後6日目にそれぞれのハクサイに寄生しているモモアカアブラムシの寄生虫数を調査し、下記の式より防除価を算出し、下記判定基準に従って判定した。

[0152] [数1]

$$\text{防除価} = 100 - \left\{ (T \times C_a) / (T_a \times C) \right\} \times 100$$

[0153] T<sub>a</sub> : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C<sub>a</sub> : 無処理区の散布前寄生虫数

C : 無処理区の散布後寄生虫数

[0154] 判定基準

A . . . 防除価100%

B . . . 防除価99%~90%

C . . . 防除価89%~80%

D . . . 防除価79%~50%

[0155] その結果、本発明化合物の1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、3-3、及び5-3は、Aの活性を示した。

[0156] 試験例2. ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*) に対する殺虫試験

本発明の一般式（1）で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を水に分散させて500ppmの薬液に希釈し、該薬液にイネ実生（品種：日本晴）を30秒間浸漬し、風乾した後にガラス試験管に入れ、ヒメトビウンカ3令を各10頭ずつ接種した後に綿栓をし、接種8日後に生死虫数を調査し、補正死虫率を下記の式より算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。

[0157]

[数2]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{(\text{無処理区生存率} - \text{処理区生存率})}{(\text{無処理区生存率})} \times 100$$

[0158] その結果、本発明化合物の1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、5-1、及び5-3は、Aの活性を示した。

[0159] 試験例3. コナガ(*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を本発明の一般式(1)で表されるイミダゾピリダジン化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制。

[0160] [数3]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

[0161] その結果、本発明化合物の1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、3-3、5-3及びは、Aの活性を示した。

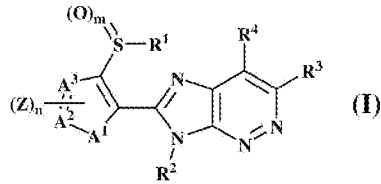
### 産業上の利用可能性

[0162] 本発明に係る化合物は、幅広い農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有しており、かつ防除対象以外の生物に対して影響が少ない化合物群である。

## 請求の範囲

[請求項1] 一般式 ( I ) :

[化1]



{式中、R<sup>1</sup>は、(a 1) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(a 2) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルケニル基；

(a 3) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルキニル基；

(a 4) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル基又は

(a 5) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基を示

し、

R<sup>2</sup>は、

(b 1) 水素原子；

(b 2) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(b 3) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルケニル基；

(b 4) (C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>) アルキニル基；

(b 5) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル基又は

(b 6) (C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基を示

し、

R<sup>3</sup>は、

(c 1) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(c 2) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルコキシ基；

(c 3) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基；

(c 4) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルコキシ基；

(c 5) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；

(c 6) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基；

(c 7) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基；  
(c 8) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；  
(c 9) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基又は  
(c 10) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基を示し、  
R<sup>4</sup>は、

(d 1) 水素原子；  
(d 2) ハロゲン原子；  
(d 3) シアノ基；  
(d 4) ニトロ基；  
(d 5) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は  
(d 6) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基を示し、

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、及びA<sup>3</sup>は同一又は異なっても良く、窒素原子、硫黄原子、又はCHを示し、

Zは、同一又は異なってもよく、

(e 1) 水素原子；  
(e 2) ハロゲン原子；  
(e 3) シアノ基；  
(e 4) ニトロ基；  
(e 5) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；  
(e 6) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基；  
(e 7) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；  
(e 8) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基；  
(e 9) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；  
(e 10) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基；  
(e 11) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基；  
(e 12) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；  
(e 13) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基又は  
(e 14) ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基を示し、 n は 1

～2の整数を示し、mは0～2の整数を示す。} で表されるイミダゾピリダジン化合物又はその塩類。

[請求項2]

R<sup>1</sup>が、

(a 1) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、

R<sup>2</sup>が、

(b 2) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、

R<sup>3</sup>が、(c 3) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基又は

(c 8) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキルチオ基を示し、

R<sup>4</sup>が、(d 1) 水素原子を示し、

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、及びA<sup>3</sup>が、同一又は異なってよく、窒素原子、硫黄原子、又はCHを示し、Zが、同一又は異なってよく、

(e 1) 水素原子；

(e 2) ハロゲン原子；

(e 5) (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基又は

(e 7) ハロ (C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>) アルキル基を示す、請求項1に記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類。

[請求項3]

A<sup>2</sup>及びA<sup>3</sup>がCHで、A<sup>1</sup>が硫黄である請求項1又は2に記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類。

[請求項4]

請求項1乃至3の何れか1項に記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類の農園芸用殺虫剤としての使用。

[請求項5]

請求項4に記載の農園芸用殺虫剤の有効成分で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用する方法。

[請求項6]

有効量の請求項4に記載の農園芸用殺虫剤で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用害虫の防除方法。

[請求項7]

請求項1乃至3の何れか1項に記載のイミダゾピリダジン化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする外部寄生生物防除剤。

[請求項8]

有効量の請求項7に記載の外部寄生生物防除剤を外部寄生生物に接

触させることを特徴とする外部寄生生物の防除方法。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2015/075845

| <b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b><br>C07D487/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, A61K31/5025(2006.01)i, A61P33/10(2006.01)i, A61P33/14(2006.01)i<br>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC   |   |   |
|--|---|---|
| <b>B. FIELDS SEARCHED</b><br>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)<br>C07D487/04, A01N43/90, A01N47/02, A01P7/04, A61K31/5025, A61P33/10, A61P33/14<br>Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched<br>Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2015<br>Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2015 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2015<br>Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)<br>CAPLUS/REGISTRY (STN), JSTPlus/JSTChina/JST7580 (JDreamIII)  |   |   |
| <b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>  |   |   |
| Category*  | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No.   |
| P, X   | WO 2015/000715 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG),<br>08 January 2015 (08.01.2015),<br>claims; examples<br>(Family: none)  | 1-8   |
| A  | WO 2013/144088 A1 (BASF SE),<br>03 October 2013 (03.10.2013),<br>claims; page 18, line 6 to page 35, line 4;<br>page 84, line 7 to page 94, line 16<br>& JP 2015-512905 A & US 2015/0105405 A1<br>& EP 2831076 A1 & CN 104220440 A<br>& MX 2014011752 A | 1-8   |
| <input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.   |   |   |
| * Special categories of cited documents:<br>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance<br>"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date<br>"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)<br>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means<br>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed<br>"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention<br>"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<br>"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<br>"&" document member of the same patent family |   |   |
| Date of the actual completion of the international search<br>03 December 2015 (03.12.15)   |   | Date of mailing of the international search report<br>15 December 2015 (15.12.15) |
| Name and mailing address of the ISA/<br>Japan Patent Office<br>3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,<br>Tokyo 100-8915, Japan   |   | Authorized officer<br><br>Telephone No.   |

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2015/075845

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| A         | WO 2013/180193 A1 (Sumitomo Chemical Co.,<br>Ltd.),<br>05 December 2013 (05.12.2013),<br>claims; page 84, line 5 to page 117, line 27;<br>examples<br>& US 2015/0094329 A1<br>claims; paragraphs [0583] to [0811]; examples<br>& EP 2857396 A1 & CN 104334552 A  | 1-8                   |
| A         | WO 2013/189801 A1 (BASF SE),<br>27 December 2013 (27.12.2013),<br>claims; page 27, line 13 to page 68, line 6;<br>page 123, line 16 to page 136<br>& JP 2015-525234 A & US 2015/0150257 A1<br>& EP 2864320 A1 & CA 2874382 A<br>& AU 2013279540 A & IL 235893 A<br>& KR 10-2015-0023824 A & CN 104703982 A<br>& EA 201500020 A | 1-8                   |

|   |   |                |
|---|---|----------------|
| A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))<br>Int.Cl. C07D487/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, A61K31/5025(2006.01)i, A61P33/10(2006.01)i, A61P33/14(2006.01)i  |   |                |
| B. 調査を行った分野<br>調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))<br>Int.Cl. C07D487/04, A01N43/90, A01N47/02, A01P7/04, A61K31/5025, A61P33/10, A61P33/14  |   |                |
| 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<br>日本国実用新案公報 1922-1996年<br>日本国公開実用新案公報 1971-2015年<br>日本国実用新案登録公報 1996-2015年<br>日本国登録実用新案公報 1994-2015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)<br>CAplus/REGISTRY (STN), JSTPlus/ JSTChina /JST7580 (JDreamIII)  |   |                |
| C. 関連すると認められる文献   |   |                |
| 引用文献の<br>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<br>請求項の番号 |
| P, X  | WO 2015/000715 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2015.01.08, 特許請求の範囲、実施例 (ファミリーなし)  | 1-8            |
| A   | WO 2013/144088 A1 (BASF SE) 2013.10.03, 特許請求の範囲、第18頁第6行~第35頁第4行、第84頁第7行~第94頁第16行 & JP 2015-512905 A & US 2015/0105405 A1 & EP 2831076 A1 & CN 104220440 A & MX 2014011752 A | 1-8            |
| <input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> 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<br>「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの<br>「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<br>「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)<br>「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献<br>「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献<br>「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<br>「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<br>「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<br>「&」 同一パテントファミリー文献 |   |                |
| 国際調査を完了した日  | 03.12.2015  | 国際調査報告の発送日     |
|   |   | 15.12.2015     |
| 国際調査機関の名称及びあて先<br>日本国特許庁 (ISA/J P)<br>郵便番号100-8915<br>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)<br>井上 千弥子<br>電話番号 03-3581-1101 内線 3443   | 4H 5809        |

| C (続き) . 関連すると認められる文献 |  |                |
|-----------------------|--|----------------|
| 引用文献の<br>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<br>請求項の番号 |
| A                     | WO 2013/180193 A1 (住友化学株式会社) 2013. 12. 05, 特許請求の範囲、第 84 頁第 5 行～第 117 頁第 27 行、実施例 & US 2015/0094329 A1, 特許請求の範囲、段落[0583]-[0811]、実施例 & EP 2857396 A1 & CN 104334552 A  | 1-8            |
| A                     | WO 2013/189801 A1 (BASF SE) 2013. 12. 27, 特許請求の範囲、第 27 頁第 13 行～第 68 頁第 6 行、第 123 頁第 16 行～第 136 頁 & JP 2015-525234 A & US 2015/0150257 A1 & EP 2864320 A1 & CA 2874382 A & AU 2013279540 A & IL 235893 A & KR 10-2015-0023824 A & CN 104703982 A & EA 201500020 A | 1-8            |