

(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
2017年4月13日(13.04.2017)



(10) 国際公開番号
WO 2017/061497 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 471/04 (2006.01) A61K 31/5025 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01) A61K 31/519 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01) A61P 33/14 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01) C07D 519/00 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2016/079677
- (22) 国際出願日: 2016年10月5日(05.10.2016)
- (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 2015-198456 2015年10月6日(06.10.2015) JP
特願 2016-081581 2016年4月14日(14.04.2016) JP
特願 2016-123463 2016年6月22日(22.06.2016) JP
特願 2016-140925 2016年7月15日(15.07.2016) 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 1 9 番 8 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 宮坂 彰浩(MIYASAKA, Akihiro); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 米村 樹(YONEMURA, Ikki); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 諏訪 明之(SUWA, Akiyuki); 〒

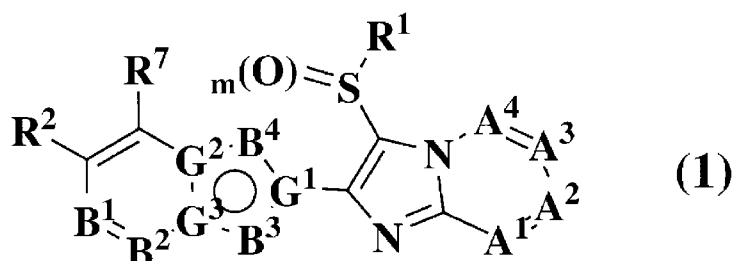
5860094 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 藤江 隼平(FUJIE, Shunpei); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP).

- (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 3 1 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, DJ, 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, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, 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),

[続葉有]

(54) Title: CONDENSED HETEROCYCLIC COMPOUND OR SALTS THEREOF, AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL INSECTICIDE CONTAINING SAID COMPOUND, AND METHOD FOR USING SAME

(54) 発明の名称: 縮合複素環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: Since damage due to harmful insects and the like remains significant in the production of agricultural or horticultural crops, the present invention provides a condensed heterocyclic compound or salts thereof, said compound being a new insecticide compound for agricultural and horticultural use for controlling the occurrence, etc., of harmful insects resistant to existing drugs, is represented by general formula (1) (in the formula, R¹ represents (a1) a (C₁-C₆) alkyl group, and R² represents (b1) a halo (C₁-C₆) alkyl group; A¹, A³, and A⁴ represent a CH group; A² represents a C-CF₃ group; B¹ and B² represent a nitrogen atom or a CH group; B³ represents N-Me; B⁴ represents a nitrogen atom; and G¹, G², and G³ represent a carbon atom. R³ represents (c7) a halo (C₁-C₆) alkyl group, R⁵ represents (d2) a (C₁-C₆) alkyl group, and R⁴ and R⁷ represent (e1) a hydrogen atom. m represents 0, 1, or 2). The present invention also provides an insecticide containing said compound, and a method for using same.

(57) 要約: 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を防除するために新規な農園芸用殺虫化合物である、【化1】一般式(1)〔式中、R¹は、(a1) (C₁-C₆) アルキル基; R²は、(b1) ハロ (C₁-C₆) アルキル基; を示し、A¹、A³及びA⁴はCH基を示し、A²は、C-CF₃基を示し、B¹及びB²は、窒素原子、又はCH基を示し、B³はN-Meを示し、B⁴は、窒素原子を示し、G¹、G²及びG³は、炭素原子を示す。R³は、(c7)ハロ (C₁-C₆) アルキル基; R⁵は、(d2) (C₁-C₆) アルキル基; R⁴及びR⁷は、(e1)水素原子; を示し、mは0、1、又は2を示す。〕で表わされる縮合複素環化合物又はその塩、及びそれらを含む殺虫剤並びにそれらの使用方法を提供する。

WO 2017/061497 A1

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))

明 細 書

発明の名称：

縮合複素環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、縮合複素環化合物又はその塩類、該化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤及び該殺虫剤の使用方法に関する。

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、ある種のイミダゾピリジン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、イミダゾピリジン環が他のイミダゾピリジンと結合した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の開発が望まれている。さらに昨今では、農園芸分野の害虫に対する優れた防除効果のみならず、人体及び家畜等の哺乳類に対する安全性が高く、且つ環境生

物に対する影響や環境中への蓄積性等の環境負荷の小さい農園芸用殺虫剤への要望が強い。

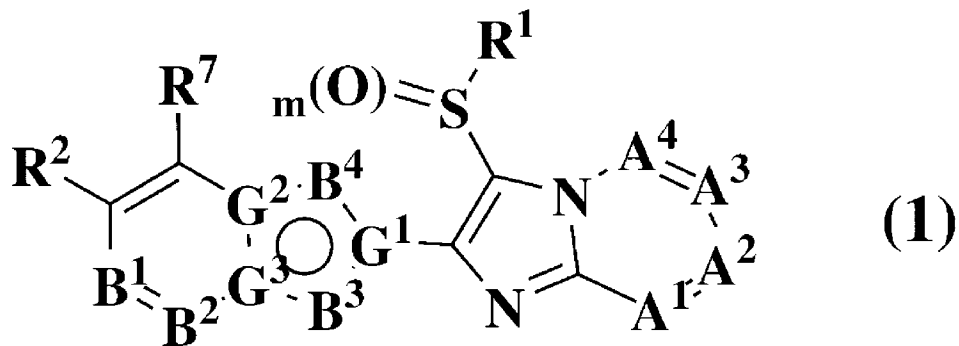
課題を解決するための手段

[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（１）で表される縮合複素環化合物又はその塩類が、種々の農園芸分野の害虫に対して広い殺虫スペクトラム且つ優れた防除効果を有するとともに、高い哺乳類安全性とを併せ持ち、さらに環境中での適度な分解性を有することで環境に対する負荷も軽度であることを見出し、本発明を完成するに至った。

即ち、本発明は、

[１]一般式（１）

[化1]



{式中、 R^1 は、

- (a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；
- (a2) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基；
- (a3) ($C_2 - C_6$) アルケニル基；又は
- (a4) ($C_2 - C_6$) アルキニル基；を示す。

R^2 は、

- (b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；
- (b2) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；
- (b3) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；
- (b4) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；又は
- (b5) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；を示す。

A¹、A²、A³及びA⁴は、同一又は異なってもよく、窒素原子、又はC - R³を示し、B¹及びB²は、窒素原子、又はC - R⁴を示し、B³及びB⁴は、窒素原子、N - R⁵、C - R⁶、酸素原子、又は硫黄原子を示し、G¹、G²及びG³は、窒素原子、又は炭素原子を示す。

R³は、

- (c1)水素原子；
- (c2)ハロゲン原子；
- (c3)シアノ基；
- (c4)ニトロ基；
- (c5) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c6) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；
- (c7) (C₁ - C₆) アルコキシ基；
- (c8) (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c9)ハロ (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c10) ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基；
- (c11) (C₁ - C₆) アルキルチオ基；
- (c12) (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基；
- (c13) (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基；
- (c14)ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基；
- (c15)ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基；
- (c16)ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基；
- (c17) (C₁ - C₆) アルコキシカルボニル基；
- (c18) R⁸ (R⁹) N基 (式中、R⁸及びR⁹は同一又は異なってもよく水素原子、(C₁ - C₆) アルキル基、(C₂ - C₆) アルケニル基、(C₂ - C₆) アルキニル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基、(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル基、(C₁ - C₆) アルコキシカ

ルボニル基、フェニル基、(C₁ - C₆) アルコキシフェニル基、又はフェニル (C₁ - C₆) アルキル基を示す。) ;

(c19) C (R¹⁰) = N O R¹¹ 基 (式中、R¹⁰ 及び R¹¹ は同一又は異なっても良く、水素原子、(C₁ - C₆) アルキル基、(C₂ - C₆) アルケニル基、(C₂ - C₆) アルキニル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基、(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基、フェニル基、又はフェニル (C₁ - C₆) アルキル基を示す。) ;

(c20) フェニル基 ;

(c21) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) ホルミル基、(e) (C₁ - C₆) アルキル基、(f) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(g) (C₁ - C₆) アルコキシ基、(h) ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基、(i) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルコキシ基、(j) (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(k) ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基、及び(o) ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基からなる群から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基 ;

(c22) フェニル (C₁ - C₆) アルキル基 ;

(c23) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) ホルミル基、(e) (C₁ - C₆) アルキル基、(f) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(g) (C₁ - C₆) アルコキシ基、(h) ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基、(i) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルコキシ基、(j) (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(k) ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基、及び(o) ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基からなる群から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基 ;

ル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;

(c24) R^8 (R^9) Nカルボニル基 (式中、 R^8 及び R^9 は、前記と同じ。) ;

(c25) ($C_2 - C_6$) アルケニル基 ;

(c26) フェニル ($C_2 - C_6$) アルキニル基 ;

(c27) ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基 ;

(c28) ($C_3 - C_6$) シクロアルキルチオ基 ;

(c29) フェニル ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基 ;

(c30) カルボキシル基 ;

(c31) $C(NH_2) = NOR^{10}$ 基 (式中、 R^{10} は、水素原子、($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_2 - C_6$) アルケニル基、($C_2 - C_6$) アルキニル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、フェニル基、又はフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。) ;

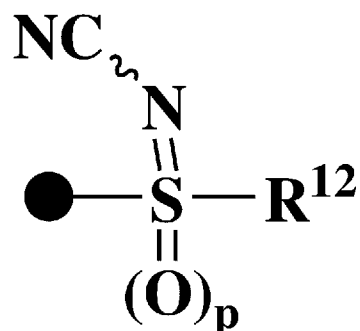
(c32) 複素環基 ;

(c33) 複素環チオ基 ;

(c34) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) ($C_1 - C_6$) アルキル基、(f)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(h)ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(k)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(n) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基、及び(o)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基からなる群から選択される1~2の置換基を環上に有する複素環チオ基 ;

(c35)

[化2]



(式中、 R^{12} は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル基、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基、又はハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基を示し、 p は、0又は1を示す。)；又は
(c36)ホルミル基；を示す。

R^5 は、(d1)水素原子；(d2) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；(d3) $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；又は(d4)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；を示す。

R^4 、 R^6 及び R^7 は、同一又は異なってもよく、(e1)水素原子；(e2)ハロゲン原子；(e3)シアノ基；(e4)ニトロ基；(e5) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；又は(e6) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ基；を示す。 m は0、1、又は2を示す。} で表わされる縮合複素環化合物又はその塩、

[2] A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $\text{C} - \text{R}^3$ (式中、 R^3 は、前記と同じ。)を示し、 B^1 が $\text{C} - \text{R}^4$ (式中、 R^4 は、前記と同じ。)を示し、 B^2 が、窒素原子、 B^3 が $\text{N} - \text{R}^5$ (式中、 R^5 は、前記と同じ。)を示し、 B^4 が、窒素原子を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を示す、[1]に記載の縮合複素環化合物又はその塩、

[3] R^1 が、(a1) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；を示し、
 R^3 が、(c1)水素原子；(c2)ハロゲン原子；(c6) $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル基；(c9)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；(c10)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ基；(c14)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルチオ基；(c15)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル

スルフィニル基；(c16)ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルスルホニル基；(c18) R^8 （ R^9 ）N基（式中、 R^8 と R^9 は前記と同意義）、又は(c19) $C(R^{10})=NO$
 R^{11} 基（式中、 R^{10} と R^{11} は前記と同意義）を示し、 R^5 が、(d2)（ $C_1 - C_6$ ）アルキル基；を示し、 R^4 及び R^7 が、(e1)水素原子；を示す、[1]又は
 [2]に記載の縮合複素環化合物又はその塩、

[4] R^2 が、(b1) ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル基；を示し、
 A^1 、 A^3 及び A^4 が、 $C-H$ を示し、
 A^2 が $C-R^3$ （式中、 R^3 は、(c6)（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル基；を示す。）を示す、[1]乃至[3]のいずれかに記載の縮合複素環化合物又はその塩、

[5] R^2 が、(b1) ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル基；を示し、
 A^1 、 A^3 及び A^4 が、 $C-H$ を示し、
 A^2 が $C-R^3$ （式中、 R^3 は、シクロプロピル基；を示す。）を示す、[1]乃至[3]のいずれかに記載の縮合複素環化合物又はその塩、

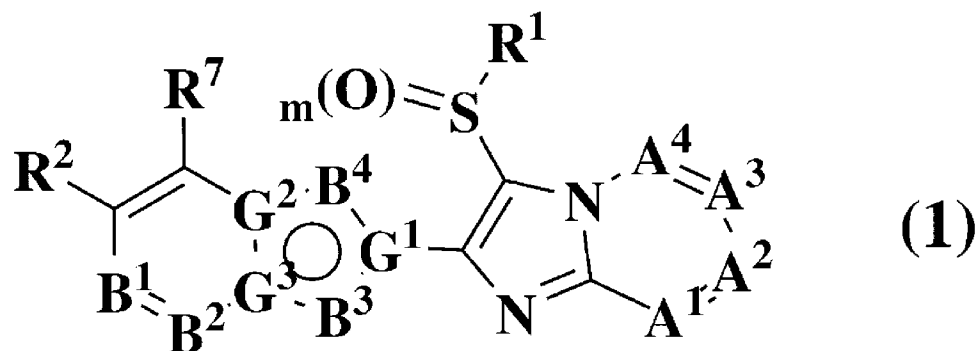
[6] 前記[1]乃至[5]のいずれかに記載の化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤、

[7] 前記[6]に記載の農園芸用殺虫剤の有効量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、

[8] 前記[1]乃至[5]のいずれかに記載の化合物又はその塩の有効量を有効成分として含有することを特徴とする哺乳動物外部寄生虫防除剤、

[9]一般式(1)

[化3]



{式中、 R^1 は、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；(a2) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基；(a3) ($C_2 - C_6$) アルケニル基；又は(a4) ($C_2 - C_6$) アルキニル基；を示す。

R^2 は、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；(b2) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；(b3) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(b4) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；又は(b5) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；を示す。

A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 は、同一又は異なってもよく、窒素原子、又は $C - R^3$ を示し、 B^1 及び B^2 は、窒素原子、又は $C - R^4$ を示し、 B^3 及び B^4 は、窒素原子、 $N - R^5$ 、又は $C - R^6$ を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 は、窒素原子、又は炭素原子を示す。

R^3 は、(c1)水素原子；(c2)ハロゲン原子；(c3)シアノ基；(c4)ニトロ基；(c5) ($C_1 - C_6$) アルキル基；(c6) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、(c7) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；(c8) ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(c9)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；(c10) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；(c11) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(c12) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；(c13) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；(c14)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(c15)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；(c16)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；(c17) ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基；(c18) R^8 (R^9) N基 (式中、 R^8 及び R^9 は同一又は異なっても良く水素原子、($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_2 - C_6$) アルケニル基、($C_2 - C_6$) アルキニル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル基、フェニル基、又はフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。)；(c19) $C(R^{10}) = NOR^{11}$ 基 (式中、 R^{10} 及び R^{11} は同一又は異なっても良く、水素原子、($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_2 - C_6$) アルケニル基、($C_2 - C_6$) アルキニル基、($C_3 -$

C_6) シクロアルキル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、フェニル基、又はフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。) ; (c20)フェニル基 ; (c21)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) ($C_1 - C_6$) アルキル基、(f)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(h)ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(k)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(n) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基、及び(o)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基からなる群から選択される1～5の置換基を環上に有するフェニル基 ; (c22)フェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; (c23)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) ($C_1 - C_6$) アルキル基、(f)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(h)ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(k)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(n) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基、及び(o)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基からなる群から選択される1～5の置換基を環上に有するフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; 又は(c24) R^8 (R^9) Nカルボニル基 (式中、 R^8 及び R^9 は、前記と同じ。) ; を示す。 R^5 は、(d1)水素原子 ; (d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; (d3)シクロ ($C_3 - C_6$) アルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; 又は(d4) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示す。 R^4 、 R^6 及び R^7 は、同一又は異なってもよく、(e1)水素原子 ; (e2)ハロゲン原子 ; (e3)シアノ基 ; (e4)ニトロ基 ; (e5) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; 又は(e6) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基 ; を示す。 m は0、1、又は2を示す。} で表わされるイミダゾピリジン化合物又はその塩、

[10] A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C - R^3$ （式中、 R^3 は、前記と同じ。）を示し、 B^1 及び B^2 が、窒素原子、又は $C - R^4$ （式中、 R^4 は、前記と同じ。）を示し、 B^3 及び B^4 が、窒素原子、又は $N - R^5$ （式中、 R^5 は、前記と同じ。）を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を示す、[9]に記載のイミダゾピリジン化合物又はその塩、

[11] R^1 が、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C - R^3$ を示し、 B^1 及び B^2 が、窒素原子、又は $C - R^4$ （式中、 R^4 は、水素原子を示す。）を示し、 B^3 及び B^4 が、窒素原子、又は $N - R^5$ （式中、 R^5 は、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。）を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を示し、 R^3 が、(c1)水素原子；(c2)ハロゲン原子；(c3)シアノ基；(c5) ($C_1 - C_6$) アルキル基；(c7) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；(c9)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；(c10)ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；(c11) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(c12) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；(c13) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；(c14)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(c15)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；(c16)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；(c17) ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基；(c18) R^8 (R^9) N基（式中、 R^8 及び R^9 は同一又は異なっても良く水素原子、($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_2 - C_6$) アルケニル基、($C_2 - C_6$) アルキニル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル基、フェニル基、又はフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。）；又は、(c24) R^8 (R^9) Nカルボニル基（式中、 R^8 及び R^9 は、[1]に記載された R^8 及び R^9 と同じ。）；を示し、 R^7 が、(e1)水素原子；を示す、[9]又は[10]に記載のイミダゾピリジン化合物又はその塩、

[12] R^1 が、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C - R^3$ を示し

、 B^1 及び B^2 が、窒素原子、又は $C - R^4$ を示し、 B^3 及び B^4 が、窒素原子、又は $N - R^5$ を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を示し、 R^3 が、(c9)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基;を示し、 R^5 が、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基;を示し、 R^4 、及び R^7 が、(e1)水素原子;を示す、[9]乃至[11]のいずれかに記載のイミダゾピリジン化合物又はその塩、

[13] 前記[9]乃至[12]のいずれかに記載の化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤、

[14] 前記[9]乃至[12]のいずれかに記載の化合物又はその塩の有効量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方法、

[15] 前記[9]乃至[12]のいずれかに記載の化合物又はその塩の有効量を有効成分として含有することを特徴とする哺乳動物外部寄生虫防除剤、に関する。

発明の効果

[0006] 本発明の縮合複素環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、人間以外の犬や猫といった愛玩動物、又は牛や羊等の家畜の体外に寄生する害虫に対しても効果を有する。

また、本発明の化合物は広い殺虫スペクトラムを有し、例えばウンカ等の水稻分野の害虫、チョウ目、カメムシ目（アブラムシ等）等の園芸分野の害虫等の幅広い害虫に対して優れた防除効果を有する。さらに、本発明の化合物は農薬として開発する際に重要な要因である人体及び家畜等の哺乳類に対する安全性と環境安全性を併せ持つ。すなわち、急性毒性が軽く、長期毒性や発がん性等の試験において重篤な懸念がなく、ミジンコ等の環境生物、及びミツバチ等の有用昆虫に対する影響が少なく、水中や土壌中等の環境中で適度に分解し、蓄積性等の環境負荷の小さい薬剤である。

発明を実施するための形態

[0007] 本発明の縮合複素環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、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子

又はフッ素原子を示す。

[0008] 「(C₁ - C₆) 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す。

[0009] 「(C₃ - C₆) 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、「(C₁ - C₆) 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、「(C₂ - C₆) 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、「(C₂ - C₆) 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。

[0010] 「(C₁ - C₆) 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、「(C₁ - C₆) 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、「(C₁ - C₆) 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。

[0011] 上記「(C₁ - C₆) アルキル基」、「(C₂ - C₆) アルケニル基」、「(C₂ - C₆) アルキニル基」、「(C₃ - C₆) シクロアルキル基」、「(C₃ - C₆) シクロアルキルオキシ基」、「(C₁ - C₆) アルコキシ基」、「(C₂

- C₆) アルケニルオキシ基」、「(C₂ - C₆) アルキニルオキシ基」、「(C₁ - C₆) アルキルチオ基」、「(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基」、「(C₁ - C₆) アルキルスルホニル基」、「(C₂ - C₆) アルケニルチオ基」、「(C₂ - C₆) アルキニルチオ基」、「(C₂ - C₆) アルケニルスルフィニル基」、「(C₂ - C₆) アルキニルスルフィニル基」、「(C₂ - C₆) アルケニルスルホニル基」、「(C₂ - C₆) アルキニルスルホニル基」、「(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ基」、「(C₃ - C₆) シクロアルキルスルフィニル基」又は「(C₃ - C₆) シクロアルキルスルホニル基」の具体例は上記の具体例より全て明らかであり、これら括弧内に記載された置換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。

[0012] それぞれ、「ハロ (C₁ - C₆) アルキル基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルケニル基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルキニル基」、「ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキル基」、「ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキルオキシ基」、「ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルケニルオキシ基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルキニルオキシ基」、「ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基」、「ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基」、「ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルケニルチオ基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルキニルチオ基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルケニルスルフィニル基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルキニルスルフィニル基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルケニルスルホニル基」、「ハロ (C₂ - C₆) アルキニルスルホニル基」、「ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキルチオ基」、「ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキルスルフィニル基」又は「ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキルスルホニル基」と示す。

[0013] 「(C₁ - C₆)」、「(C₂ - C₆)」、「(C₃ - C₆)」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、「(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C

6) アルキル基」の場合は直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1 ～ 6 個のアルコキシ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。

[0014] 「複素環基」及び「複素環」としては、環構成原子として炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子および窒素原子から選ばれるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 5 または 6 員の単環式芳香族複素環基及びそれらに対応する複素環が挙げられる。そのような複素環基としては、例えば、フリル、チエニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、トリアジニル等の単環式芳香族複素環基が挙げられる。

[0015] 本発明の一般式 (1) で表される縮合複素環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。

[0016] 本発明の一般式 (1) で表される縮合複素環化合物及びその塩類は、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ます、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) で表される化合物及びその塩類は、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。

[0017] 本発明の一般式 (1) で表される縮合複素環化合物又はその塩類において、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C - R^3$ が好ましく、 B^1 及び B^2 が、窒素原子、又は $C - R^4$ が好ましく、 B^3 及び B^4 が、窒素原子、又は $N - R^5$ が好まし

く、 G^1 、 G^2 及び G^3 が、炭素原子が好ましい。

[0018] 更に好ましくは、 R^1 が、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C - R^3$ であり、 B^1 が、窒素原子であり、 B^2 が、 $C - R^4$ であり、 B^3 が、 $N - R^5$ であり、 B^4 が、窒素原子であり、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子であり、 R^3 が、(c1)水素原子；(c2)ハロゲン原子；(c6) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基；(c9)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；(c10)ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；(c14)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(c15)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；(c16)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；(c18) R^8 (R^9) N基 (式中、 R^8 及び R^9 は、前記と同じ。)、又は(c19) $C(R^{10}) = NO R^{11}$ 基 (式中、 R^{10} 及び R^{11} は、前記と同じ。) であり、 R^5 が、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 R^4 及び R^7 が、(e1)水素原子；である。

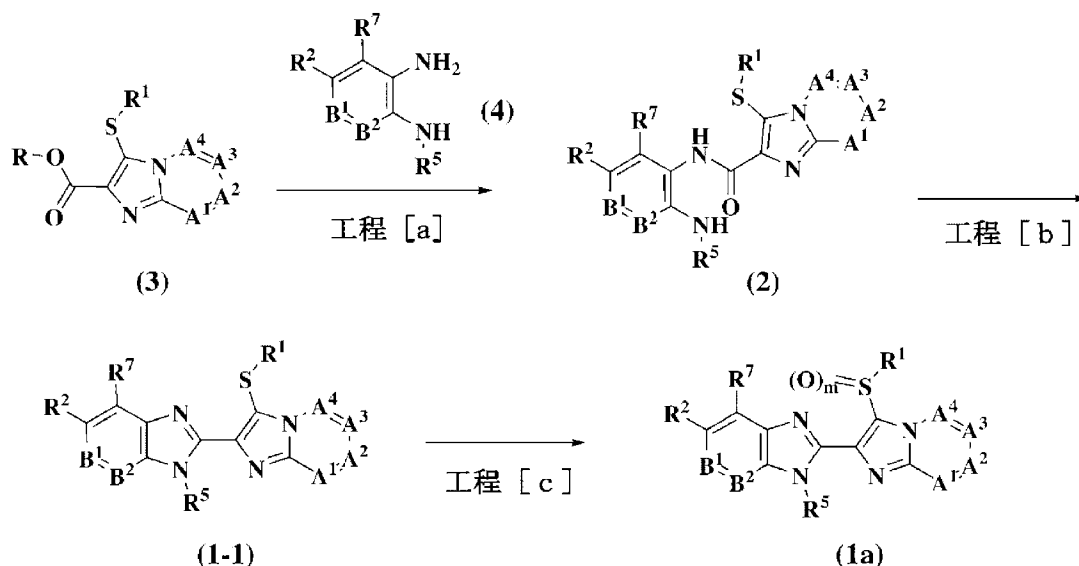
[0019] 特に好ましくは、 R^1 が、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 A^1 、 A^3 及び A^4 が、 $C-H$ であり、 A^2 が、 $C - R^3$ であり、 B^1 が、窒素原子であり、 B^2 が、 $C - R^4$ であり、 B^3 が、 $N - R^5$ であり、 B^4 が、窒素原子であり、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子であり、 R^3 が、(c6) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基；であり、 R^5 が、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 R^4 及び R^7 が、(e1)水素原子；である。

[0020] 最も好ましくは、 R^1 が、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 A^1 、 A^3 及び A^4 が、 $C-H$ であり、 A^2 が、 $C - R^3$ であり、 B^1 が、窒素原子であり、 B^2 が、 $C - R^4$ であり、 B^3 が、 $N - R^5$ であり、 B^4 が、窒素原子であり、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子であり、 R^3 が、シクロプロピル基；であり、 R^5 が、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基；であり、 R^4 及び R^7 が、(e1)水素原子；である。

[0021] 本発明の縮合複素環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。

[0022] 製造方法 1

[化4]



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^7 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 B^1 、 B^2 、及び m は前記と同じくし、 R は $C_1 \sim C_3$ のアルキル基又は水素原子を示す。)

[0023] 工程 [a] の製造方法

一般式 (3) で表されるカルボン酸エステルと一般式 (4) で表される化合物とを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 (2) で表されるカルボン酸アミド化合物を製造することができる。本反応は文献記載の方法 (Org. Synth. 78、23、; Coll. Vol. 10、423、J. A. C. S. (1999)、121 (18)、4369-4378) に従って行うことができる。また、カルボン酸を使用する場合は、国際公開第2013/018928号パンフレット、国際公開第2013/180193号パンフレット、又は国際公開第2015/133603号パンフレットに記載された方法により製造することができる。

[0024] 本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナト

リウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドリド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。

[0025] 本反応で利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（THF）、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（AcOEt）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、ジメチルスルホキシド、1，3-ジメチル-2-イミダゾリノン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もできる。

[0026] 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。本反応における反応温度は通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から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。また、単離・精製せずに次工程進んでもよい。場合によっては、本製造工程で次工程にかかる脱水縮合反応が進行し、次工程を省略することもできる。

[0027] 工程〔b〕の製造方法

一般式（1-1）で表される化合物は、一般式（2）で表される化合物を酸と、不活性溶媒存在下、反応させることにより製造することができる。ま

た、文献記載 (Bull. Chem. Soc. Jpn., 1967, 40, 935) のアゾジカルボン酸ジエチル (DEAD)、又はアゾジカルボン酸ジメトキシエチル (DMEAD)、及びトリフェニルホスフィン (Ph_3P) を使用する方法でも製造することができる。

[0028] 本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸等のスルホン酸 (PTS)、リン酸等を例示することができる。

[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 (MTBE)、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、N-メチルピロリドン等のアミド類、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] 本反応における反応温度は通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を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 [c] の製造方法

本反応は、一般式 (1-1) で表される化合物を、不活性溶媒中、酸化剤と反応させることにより一般式 (1a) で表される化合物を製造することができる。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

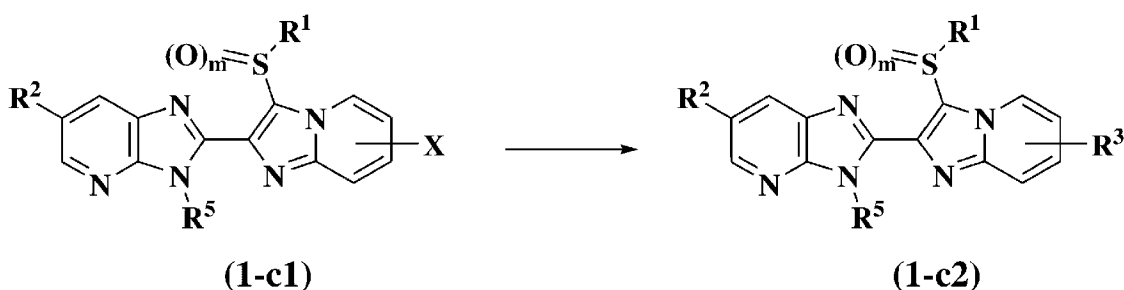
- クロル過安息香酸 (m - C P B A) 等の過酸化物などが挙げられる。

[0032] 本反応で利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。

[0033] 本反応における反応温度は -10°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mが1又は2である目的物を製造することができる。

[0034] 製造方法2

[化5]



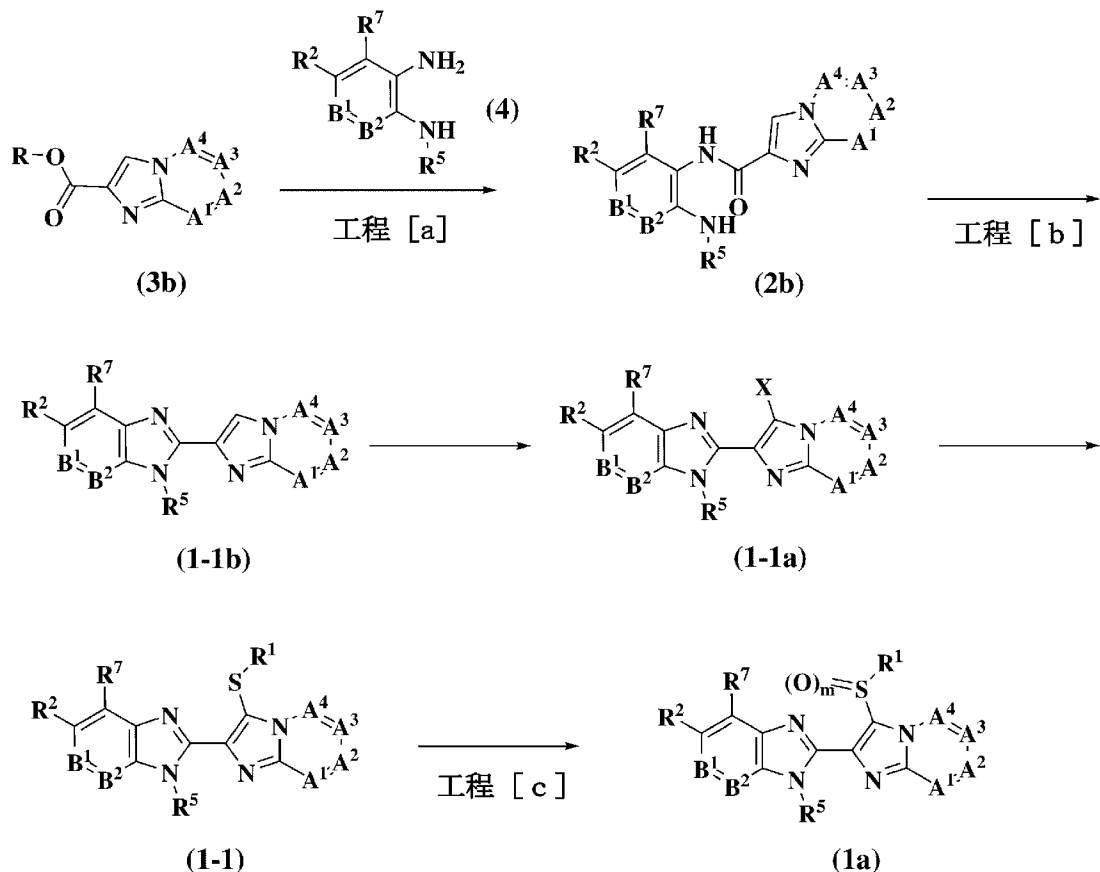
(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 B^1 、 B^2 、及びmは前記と同じくし、Xはハロゲン原子、又はトリフルオロメチルスルホニルオキシ基、若しくはエタンスルホニル基等の脱離基を示す。)

[0035] 一般式(1-c2)で表される化合物は、製造方法1で製造した化合物(

1 - c 1) を、文献記載の方法、例えば、Metal catalyzed Cross-coupling Reactions and More、Wiley-VCH(2014/03/31)、若しくはCross-coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in current chemistry)、Springer (2010/12/01)に記載された方法に従ってクロスカップリング反応により、又はSubstitution Reaction Book on Demand (2012/9/6)に記載された方法に従って求核置換反応により、製造することができる。

[0036] 製造方法 3

[化6]



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^7 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 B^1 、 B^2 、及び m は前記と同じくし、 X はハロゲン原子を示す。)

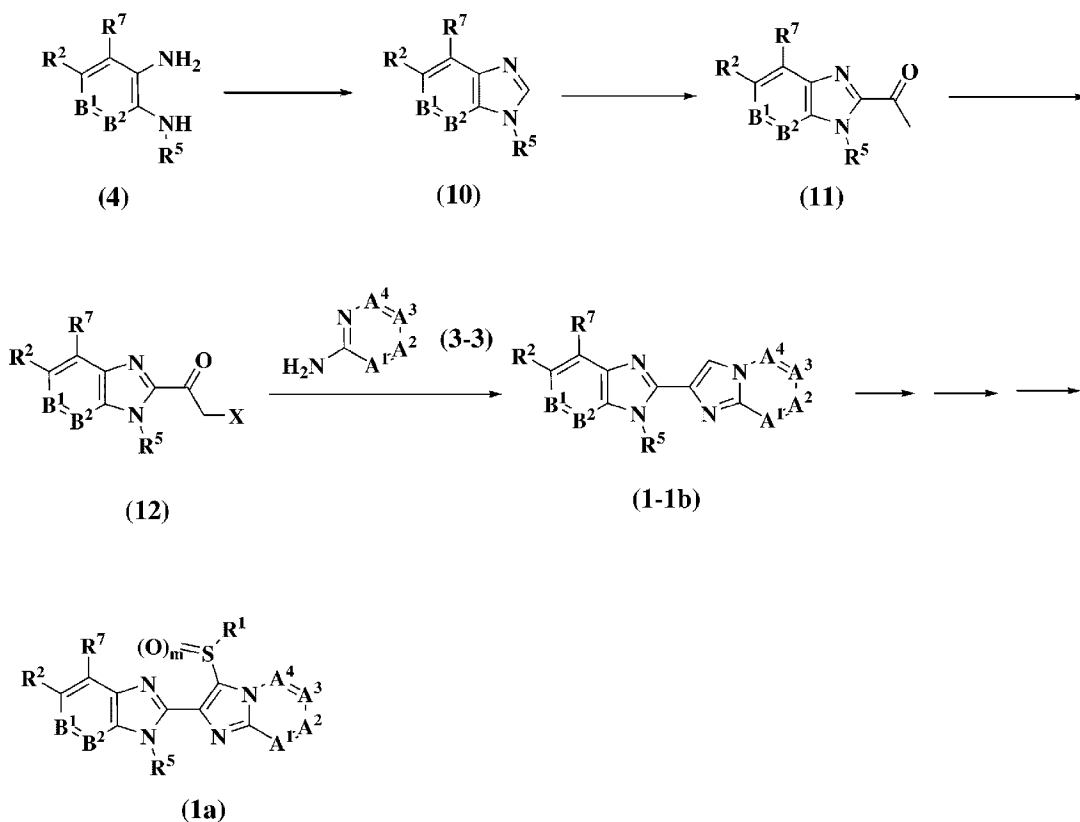
[0037] 工程 [a]、[b] の製造方法

一般式（３ｂ）で表されるカルボン酸エステルと一般式（４）で表される化合物とを前記製造方法１に記載した方法〔ａ〕、〔ｂ〕に従って、一般式（１－１ｂ）で表される化合物を製造することができる。

[0038] 一般式（１－１）で表される化合物は、一般式（１－１ｂ）で表される化合物を下記中間体（３）の製造方法に記載した方法に従って製造することができる。その後当該化合物を前記製造方法１に記載した方法〔ｃ〕に従って、 m が１又は２である一般式（１ａ）で表される化合物を製造することができる。

[0039] 製造方法４

[化７]



（式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^7 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 B^1 、 B^2 及び m は前記と同じくし、 X はハロゲン原子を示す。）

[0040] 一般式（１０）で表される化合物は、一般式（４）で表される化合物を出発原料として、J. Org. Chem., 14, 2421 - 2434, 20

16に記載の方法により製造することができる。

[0041] 一般式(11)で表される化合物は、一般式(10)で表される化合物を反応原料として、T. L., 46(30), 5081-5084, 2005に記載の方法により製造することができる。

[0042] 一般式(12)で表される化合物は、一般式(11)で表される化合物を不活性溶媒中、ハロゲン化剤と反応することにより製造することができる。

本反応で利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、蟻酸、酢酸等の有機酸類、水等の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。

本反応で利用できるハロゲン化剤としては、N-クロロスクシンイミド、塩化スルフリル、臭素、N-ブロモスクシンイミド、ジヨードヒダントイン(DIH)等が挙げられる。

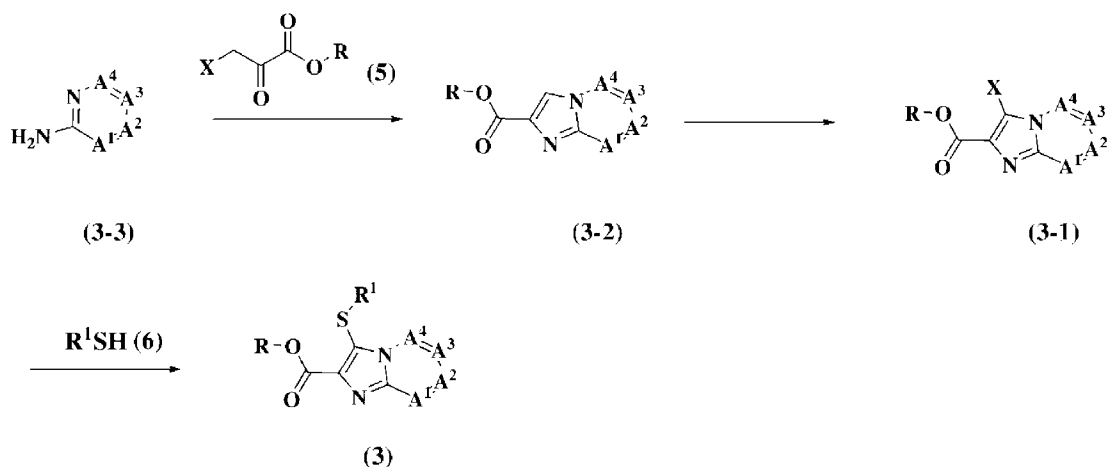
[0043] 本反応は等モル反応であるので、化合物(11)に対してハロゲン化剤を等モル使用すれば良いが、ハロゲン化剤を過剰に使用することもできる。本反応における反応温度は通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。また、単離・精製せずに次工程進んでもよい。

[0044] 一般式(1-1b)で表される化合物は、一般式(12)で表される化合物を反応原料として、下記中間体(3)の製造方法に記載した方法に従って製造することができる。その後当該化合物を前記製造方法1に記載した方法[c]に従って、mが1又は2である一般式(1a)で表される化合物を製造

することができる。

[0045] 中間体 (3) の製造方法

[化8]



(式中、 R^1 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、及び A^4 は前記と同じくし、 X はハロゲン原子、 R は $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ のアルキル基を示す。)

[0046] 本発明化合物である一般式 (3) の化合物は、以下の方法により製造することができる。一般式 (3 - 2) で表されるカルボン酸エステル化合物は、一般式 (3 - 3) で表されるアミノ化合物とハロピルビン酸エステル (5) とを、国際公開第2009/115651号パンフレットに記載の方法に従って反応させて製造することができる。

[0047] 一般式 (3 - 1) で表されるハロカルボン酸エステル化合物は、一般式 (3 - 2) で表されるカルボン酸エステル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。

[0048] 本反応で利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] 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類、NCS、NBS等のハロゲン化スクシンイミド類、DIH（1,3-ジヨード-5,5-ジメチルヒダントイン）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。

[0050] 本反応における反応温度は -10°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ハロカルボン酸エステル化合物（3-1）を製造することができる。

[0051] 一般式（3）で表されるカルボン酸エステル化合物は、一般式（3-1）で表されるハロカルボン酸エステル化合物と、一般式（6）で表わされる化合物とを不活性溶媒下、クロスカップリング反応をさせることにより製造することができる。

[0052] 本反応で 사용할 ことができる触媒としては入手可能な0価または2価のパラジウム金属や塩（錯体を含む）などのパラジウム化合物を用いる事ができ、活性炭などに担持されても良い。好ましく用いられる物として、パラジウム（0）／炭素、酢酸パラジウム（II）、塩化パラジウム（II）、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）クロリド、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）等を挙げる事ができる。

[0053] 本反応は配位子を加えて反応を行うこともできる。配位子としては、トリフェニルホスフィン（ PPh_3 ）、メチルジフェニルホスフィン（ $\text{Ph}_2\text{PC}_6\text{H}_5$ ）、トリフリルホスフィン（ $\text{P}(\text{2-furyl})_3$ ）、トリ（o-トリル）ホスフィン（ $\text{P}(\text{o-tol})_3$ ）、トリ（シクロヘキシル）ホスフィン（ PCy_3 ）、ジシクロヘキシルフェニルホスフィン（ PhPCy_2 ）、トリ（t-ブチル）ホスフィン（ Pt-Bu_3 ）、2,2'-ビス（ジフェニルホスフ

ィノ) - 1, 1' - ビナフチル (BINAP)、ジフェニルホスフィノフェロセン (DPPF)、1, 1' - ビス (ジ - t - ブチルホスフィノ) フェロセン (Dt - BPF)、N, N - ジメチル - 1 - [2 - (ジフェニルホスフィノ) フェロセニル] エチルアミン、1 - [2 - (ジフェニルホスフィノ) フェロセニル] エチルメチルエーテル、Xantphos等のホスフィン系配位子等が挙げられる。

[0054] 本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、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 (3 - 1) で表されるハロカルボン酸エステル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。

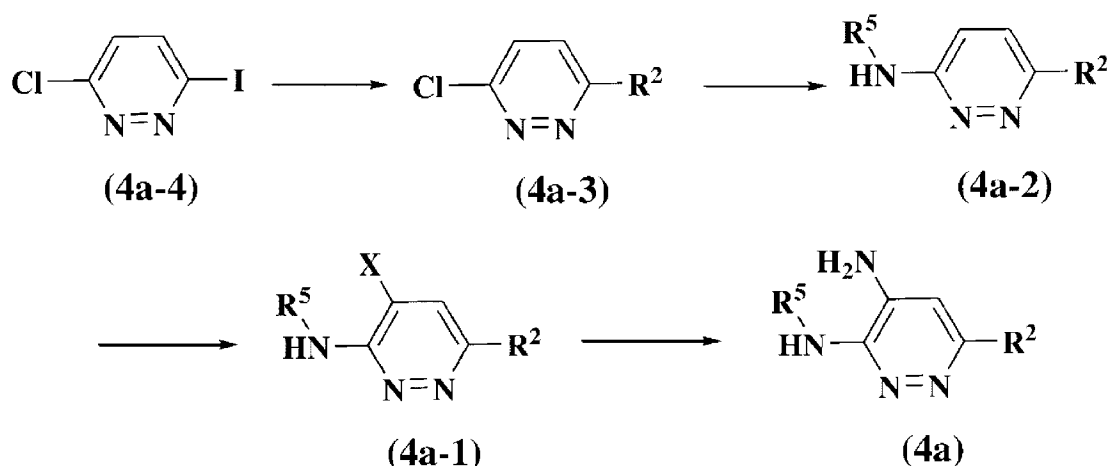
[0055] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、2 - メチルテトラヒドロフラン (2 - MeTHF) 等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 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。

[0056] 本反応は等モル反応であるので、一般式 (6) で表わされる化合物と一般式 (3 - 1) で表されるハロカルボン酸エステル化合物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0℃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（3）を製造することができる。

[0057] 中間体（4a）の製造方法

[化9]



（式中、R²及びR⁵は前記と同じくし、Xはハロゲン原子を示す。）

[0058] 本発明化合物の一般式（4a）で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

[0059] 文献記載の方法（Tetrahedron、1999、55、15067）により製造した一般式（4a-4）で表されるヨードピリダジン化合物とヨードハロアルキル類とを、金属触媒、塩基及び不活性溶媒存在下、文献記載の方法（有機合成化学協会誌 Vol. 69、No. 7、2011；Chem. Rev. 2011、4475；WO2013/018928号パンフレット）に従ってクロスカップリング反応を行い、一般式（4a-3）で表されるピリダジン化合物を製造することができる。

[0060] 本反応で 사용할 ことができる触媒としては入手可能な0価または2価のパラジウム金属や塩（錯体を含む）などのパラジウム化合物を用いる事がで

き、パラジウム化合物は活性炭などに担持されても良い。好ましく用いられる物として、パラジウム(0)/炭素、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリド、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)等を挙げる事ができる。

[0061] 本反応は配位子を加えて反応を行うこともできる。配位子としては、トリフェニルホスフィン(PPh_3)、メチルジフェニルホスフィン(Ph_2PCH_3)、トリフリルホスフィン($\text{P}(\text{2-furyl})_3$)、トリ(o-トリル)ホスフィン($\text{P}(\text{o-tol})_3$)、トリ(シクロヘキシル)ホスフィン(PCy_3)、ジシクロヘキシルフェニルホスフィン(PhPCy_2)、トリ(t-ブチル)ホスフィン(Pt-Bu_3)、2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル(BINAP)、ジフェニルホスフィノフェロセン(DPPF)、1, 1'-ビス(ジ-t-ブチルホスフィノ)フェロセン(D-t-BPF)、N, N-ジメチル-1-[2-(ジフェニルホスフィノ)フェロセニル]エチルアミン、1-[2-(ジフェニルホスフィノ)フェロセニル]エチルメチルエーテル、Xantphos等のホスフィン系配位子や、イミダゾル-2-イリデンカルベン類等のホスフィンミミック配位子(アンゲバンテ・ケミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ(Angewandte Chemie International Edition in English)第36巻、第2163頁(1997年)参照)等が挙げられる。

[0062] 本発明で利用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドリド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、

トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、一般式(4a-3)で表される化合物に対して1倍モル～5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

[0063] 本反応における反応温度は通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

[0064] 一般式(4a-3)で表されるピリダジン化合物とアミノ化合物(R^5NH_2)とを反応することにより一般式(4a-2)で表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。

[0065] 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。

[0066] 所望により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(4a-3)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。

[0067] 本反応における反応温度は -10°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。アミノ化合物 (R^5NH_2) は、一般式 (4a-3) で表されるピリダジン化合物に対して、1倍モル～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。

[0068] 一般式 (4a-2) で表されるアミノピリダジン化合物をハロゲン化剤と反応することにより一般式 (4a-1) で表されるハロピリダジン化合物を製造することができる。

本反応で可以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-イミダゾリジノン、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。

[0069] 反応に用いられるハロゲン化剤としては、例えば、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、DBH (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°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。

[0070] 一般式 (4 a - 1) で表されるハロピリダジン化合物を銅触媒及び溶媒存在下、アンモニアと反応させることにより、アミノピリダジン化合物 (4 a) を製造することができる。

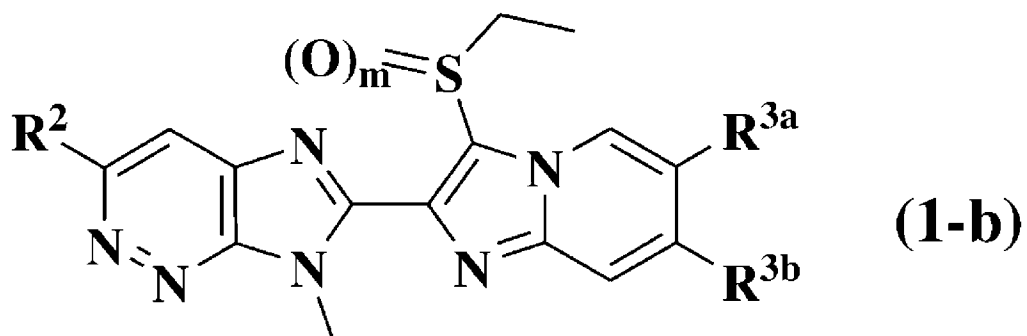
[0071] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2 - プロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリドン等のアミド類、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、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。本反応で使用する銅触媒は、酸化銅、臭化銅、塩化銅等を使用することができる。該使用量は、一般式 (4 a - 1) で表されるハロピリダジン化合物に対して1倍モル～5倍モルの範囲で適宜選択することができる。

[0072] 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から48時間の範囲で適宜選択すればよい。アンモニアは、一般式 (4 a - 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。また効率的に反応を進行させるため、オートクレーブを使用することができる。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。

[0073] 次に、本発明化合物及び中間体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はエチル基を示し、i - Prはイソプロピル

基、c - P r はシクロプロピル基、t - B u はターシャリーブチル基、c - H e x はシクロヘキシル基、A c はアセチル基、P h はフェニル基を示す。物性は融点 (°C) 又は¹H - NMRを示し、NMRデータは第27表及び第36表に示す。

[0074] [化10]



[0075]

[表1]

第1表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-1	CF ₃	H	H	0	
1-2	CF ₃	H	H	1	
1-3	CF ₃	H	H	2	
1-4	CF ₃	Me	H	0	
1-5	CF ₃	Me	H	1	
1-6	CF ₃	Me	H	2	
1-7	CF ₃	CF ₃	H	0	261-265
1-8	CF ₃	CF ₃	H	1	
1-9	CF ₃	CF ₃	H	2	NMR
1-10	CF ₃	Cl	H	0	NMR
1-11	CF ₃	Cl	H	1	
1-12	CF ₃	Cl	H	2	NMR
1-13	CF ₃	I	H	0	
1-14	CF ₃	I	H	1	
1-15	CF ₃	I	H	2	
1-16	CF ₃	OMe	H	0	
1-17	CF ₃	OMe	H	1	
1-18	CF ₃	OMe	H	2	
1-19	CF ₃	OCHF ₂	H	0	
1-20	CF ₃	OCHF ₂	H	1	
1-21	CF ₃	OCHF ₂	H	2	
1-22	CF ₃	SMe	H	0	
1-23	CF ₃	SMe	H	1	
1-24	CF ₃	SMe	H	2	
1-25	CF ₃	SOMe	H	0	
1-26	CF ₃	SOMe	H	1	
1-27	CF ₃	SOMe	H	2	
1-28	CF ₃	SO ₂ Me	H	0	
1-29	CF ₃	SO ₂ Me	H	1	
1-30	CF ₃	SO ₂ Me	H	2	

[0076]

[表2]

第2表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-31	CF ₃	SCF ₃	H	0	
1-32	CF ₃	SCF ₃	H	1	
1-33	CF ₃	SCF ₃	H	2	
1-34	CF ₃	SO CF ₃	H	0	
1-35	CF ₃	SO CF ₃	H	1	
1-36	CF ₃	SO CF ₃	H	2	
1-37	CF ₃	NHi-Pr	H	0	
1-38	CF ₃	NHi-Pr	H	1	
1-39	CF ₃	NHi-Pr	H	2	
1-40	CF ₃	N(Me)Et	H	0	
1-41	CF ₃	N(Me)Et	H	1	
1-42	CF ₃	N(Me)Et	H	2	
1-43	CF ₃	NHAc	H	0	
1-44	CF ₃	NHAc	H	1	
1-45	CF ₃	NHAc	H	2	
1-46	CF ₃	N(Me)Ac	H	0	
1-47	CF ₃	N(Me)Ac	H	1	
1-48	CF ₃	N(Me)Ac	H	2	
1-49	CF ₃	CN	H	0	
1-50	CF ₃	CN	H	1	
1-51	CF ₃	CN	H	2	
1-52	CF ₃	CO ₂ Et	H	0	
1-53	CF ₃	CO ₂ Et	H	1	
1-54	CF ₃	CO ₂ Et	H	2	
1-55	CF ₃	CONHMe	H	0	
1-56	CF ₃	CONHMe	H	1	
1-57	CF ₃	CONHMe	H	2	
1-58	CF ₃	CONMe ₂	H	0	
1-59	CF ₃	CONMe ₂	H	1	
1-60	CF ₃	CONMe ₂	H	2	

[0077]

[表3]

第3表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-61	SCF ₃	H	H	0	
1-62	SCF ₃	H	H	1	
1-63	SCF ₃	H	H	2	
1-64	SCF ₃	Me	H	0	
1-65	SCF ₃	Me	H	1	
1-66	SCF ₃	Me	H	2	
1-67	SCF ₃	CF ₃	H	0	
1-68	SCF ₃	CF ₃	H	1	
1-69	SCF ₃	CF ₃	H	2	
1-70	SCF ₃	Cl	H	0	
1-71	SCF ₃	Cl	H	1	
1-72	SCF ₃	Cl	H	2	
1-73	SCF ₃	I	H	0	
1-74	SCF ₃	I	H	1	
1-75	SCF ₃	I	H	2	
1-76	SCF ₃	OMe	H	0	
1-77	SCF ₃	OMe	H	1	
1-78	SCF ₃	OMe	H	2	
1-79	SCF ₃	OCHF ₂	H	0	
1-80	SCF ₃	OCHF ₂	H	1	
1-81	SCF ₃	OCHF ₂	H	2	
1-82	SCF ₃	SMe	H	0	
1-83	SCF ₃	SMe	H	1	
1-84	SCF ₃	SMe	H	2	
1-85	SCF ₃	SOMe	H	0	
1-86	SCF ₃	SOMe	H	1	
1-87	SCF ₃	SOMe	H	2	
1-88	SCF ₃	SO ₂ Me	H	0	
1-89	SCF ₃	SO ₂ Me	H	1	
1-90	SCF ₃	SO ₂ Me	H	2	

[0078]

[表4]

第4表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-91	SCF ₃	SCF ₃	H	0	
1-92	SCF ₃	SCF ₃	H	1	
1-93	SCF ₃	SCF ₃	H	2	
1-94	SCF ₃	SO CF ₃	H	0	
1-95	SCF ₃	SO CF ₃	H	1	
1-96	SCF ₃	SO CF ₃	H	2	
1-97	SCF ₃	NHi-Pr	H	0	
1-98	SCF ₃	NHi-Pr	H	1	
1-99	SCF ₃	NHi-Pr	H	2	
1-100	SCF ₃	N(Me)Et	H	0	
1-101	SCF ₃	N(Me)Et	H	1	
1-102	SCF ₃	N(Me)Et	H	2	
1-103	SCF ₃	NHAc	H	0	
1-104	SCF ₃	NHAc	H	1	
1-105	SCF ₃	NHAc	H	2	
1-106	SCF ₃	N(Me)Ac	H	0	
1-107	SCF ₃	N(Me)Ac	H	1	
1-108	SCF ₃	N(Me)Ac	H	2	
1-109	SCF ₃	CN	H	0	
1-110	SCF ₃	CN	H	1	
1-111	SCF ₃	CN	H	2	
1-112	SCF ₃	CO ₂ Et	H	0	
1-113	SCF ₃	CO ₂ Et	H	1	
1-114	SCF ₃	CO ₂ Et	H	2	
1-115	SCF ₃	CONHMe	H	0	
1-116	SCF ₃	CONHMe	H	1	
1-117	SCF ₃	CONHMe	H	2	
1-118	SCF ₃	CONMe ₂	H	0	
1-119	SCF ₃	CONMe ₂	H	1	
1-120	SCF ₃	CONMe ₂	H	2	

[0079]

[表5]

第5表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-121	CF ₂ CF ₃	H	H	0	193-195
1-122	CF ₂ CF ₃	H	H	1	
1-123	CF ₂ CF ₃	H	H	2	162-164
1-124	CF ₂ CF ₃	Me	H	0	214-216
1-125	CF ₂ CF ₃	Me	H	1	
1-126	CF ₂ CF ₃	Me	H	2	220-222
1-127	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	0	239-241
1-128	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	1	216-218
1-129	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	2	217-219
1-130	CF ₂ CF ₃	Cl	H	0	255-257
1-131	CF ₂ CF ₃	Cl	H	1	
1-132	CF ₂ CF ₃	Cl	H	2	212-216
1-133	CF ₂ CF ₃	I	H	0	
1-134	CF ₂ CF ₃	I	H	1	
1-135	CF ₂ CF ₃	I	H	2	
1-136	CF ₂ CF ₃	OMe	H	0	
1-137	CF ₂ CF ₃	OMe	H	1	
1-138	CF ₂ CF ₃	OMe	H	2	
1-139	CF ₂ CF ₃	OCHF ₂	H	0	
1-140	CF ₂ CF ₃	OCHF ₂	H	1	
1-141	CF ₂ CF ₃	OCHF ₂	H	2	
1-142	CF ₂ CF ₃	SMe	H	0	
1-143	CF ₂ CF ₃	SMe	H	1	
1-144	CF ₂ CF ₃	SMe	H	2	
1-145	CF ₂ CF ₃	SOMe	H	0	
1-146	CF ₂ CF ₃	SOMe	H	1	
1-147	CF ₂ CF ₃	SOMe	H	2	
1-148	CF ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	0	
1-149	CF ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	1	
1-150	CF ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	2	

[0080]

[表6]

第6表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-151	CF ₂ CF ₃	SCF ₃	H	0	
1-152	CF ₂ CF ₃	SCF ₃	H	1	
1-153	CF ₂ CF ₃	SCF ₃	H	2	
1-154	CF ₂ CF ₃	SOCF ₃	H	0	
1-155	CF ₂ CF ₃	SOCF ₃	H	1	
1-156	CF ₂ CF ₃	SOCF ₃	H	2	
1-157	CF ₂ CF ₃	NHi-Pr	H	0	
1-158	CF ₂ CF ₃	NHi-Pr	H	1	
1-159	CF ₂ CF ₃	NHi-Pr	H	2	
1-160	CF ₂ CF ₃	N(Me)Et	H	0	
1-161	CF ₂ CF ₃	N(Me)Et	H	1	
1-162	CF ₂ CF ₃	N(Me)Et	H	2	
1-163	CF ₂ CF ₃	NHAc	H	0	
1-164	CF ₂ CF ₃	NHAc	H	1	
1-165	CF ₂ CF ₃	NHAc	H	2	
1-166	CF ₂ CF ₃	N(Me)Ac	H	0	
1-167	CF ₂ CF ₃	N(Me)Ac	H	1	
1-168	CF ₂ CF ₃	N(Me)Ac	H	2	
1-169	CF ₂ CF ₃	CN	H	0	
1-170	CF ₂ CF ₃	CN	H	1	
1-171	CF ₂ CF ₃	CN	H	2	
1-172	CF ₂ CF ₃	CO ₂ Et	H	0	
1-173	CF ₂ CF ₃	CO ₂ Et	H	1	
1-174	CF ₂ CF ₃	CO ₂ Et	H	2	
1-175	CF ₂ CF ₃	CONHMe	H	0	
1-176	CF ₂ CF ₃	CONHMe	H	1	
1-177	CF ₂ CF ₃	CONHMe	H	2	
1-178	CF ₂ CF ₃	CONMe ₂	H	0	
1-179	CF ₂ CF ₃	CONMe ₂	H	1	
1-180	CF ₂ CF ₃	CONMe ₂	H	2	

[0081]

[表7]

第7表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-181	CF ₃	H	Me	0	
1-182	CF ₃	H	Me	1	
1-183	CF ₃	H	Me	2	
1-184	CF ₃	H	CF ₃	0	
1-185	CF ₃	H	CF ₃	1	
1-186	CF ₃	H	CF ₃	2	
1-187	CF ₃	H	Cl	0	
1-188	CF ₃	H	Cl	1	
1-189	CF ₃	H	Cl	2	
1-190	CF ₃	H	I	0	
1-191	CF ₃	H	I	1	
1-192	CF ₃	H	I	2	
1-193	CF ₃	H	OMe	0	
1-194	CF ₃	H	OMe	1	
1-195	CF ₃	H	OMe	2	
1-196	CF ₃	H	OCHF ₂	0	
1-197	CF ₃	H	OCHF ₂	1	
1-198	CF ₃	H	OCHF ₂	2	
1-199	CF ₃	H	SMe	0	
1-200	CF ₃	H	SMe	1	
1-201	CF ₃	H	SMe	2	
1-202	CF ₃	H	SOMe	0	
1-203	CF ₃	H	SOMe	1	
1-204	CF ₃	H	SOMe	2	
1-205	CF ₃	H	SO ₂ Me	0	
1-206	CF ₃	H	SO ₂ Me	1	
1-207	CF ₃	H	SO ₂ Me	2	
1-208	CF ₃	H	SCF ₃	0	
1-209	CF ₃	H	SCF ₃	1	
1-210	CF ₃	H	SCF ₃	2	

[0082]

[表8]

第8表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-211	CF ₃	H	SO CF ₃	0	
1-212	CF ₃	H	SO CF ₃	1	
1-213	CF ₃	H	SO CF ₃	2	
1-214	CF ₃	H	NHi-Pr	0	
1-215	CF ₃	H	NHi-Pr	1	
1-216	CF ₃	H	NHi-Pr	2	
1-217	CF ₃	H	N(Me)Et	0	
1-218	CF ₃	H	N(Me)Et	1	
1-219	CF ₃	H	N(Me)Et	2	
1-220	CF ₃	H	NHAc	0	
1-221	CF ₃	H	NHAc	1	
1-222	CF ₃	H	NHAc	2	
1-223	CF ₃	H	N(Me)Ac	0	
1-224	CF ₃	H	N(Me)Ac	1	
1-225	CF ₃	H	N(Me)Ac	2	
1-226	CF ₃	H	CN	0	
1-227	CF ₃	H	CN	1	
1-228	CF ₃	H	CN	2	
1-229	CF ₃	H	CO ₂ Et	0	
1-230	CF ₃	H	CO ₂ Et	1	
1-231	CF ₃	H	CO ₂ Et	2	
1-232	CF ₃	H	CONHMe	0	
1-233	CF ₃	H	CONHMe	1	
1-234	CF ₃	H	CONHMe	2	
1-235	CF ₃	H	CONMe ₂	0	
1-236	CF ₃	H	CONMe ₂	1	
1-237	CF ₃	H	CONMe ₂	2	
1-238	SCF ₃	H	Me	0	
1-239	SCF ₃	H	Me	1	
1-240	SCF ₃	H	Me	2	

[0083]

[表9]

第9表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-241	SCF ₃	H	CF ₃	0	
1-242	SCF ₃	H	CF ₃	1	
1-243	SCF ₃	H	CF ₃	2	
1-244	SCF ₃	H	Cl	0	
1-245	SCF ₃	H	Cl	1	
1-246	SCF ₃	H	Cl	2	
1-247	SCF ₃	H	I	0	
1-248	SCF ₃	H	I	1	
1-249	SCF ₃	H	I	2	
1-250	SCF ₃	H	OMe	0	
1-251	SCF ₃	H	OMe	1	
1-252	SCF ₃	H	OMe	2	
1-253	SCF ₃	H	OCHF ₂	0	
1-254	SCF ₃	H	OCHF ₂	1	
1-255	SCF ₃	H	OCHF ₂	2	
1-256	SCF ₃	H	SMe	0	
1-257	SCF ₃	H	SMe	1	
1-258	SCF ₃	H	SMe	2	
1-259	SCF ₃	H	SOMe	0	
1-260	SCF ₃	H	SOMe	1	
1-261	SCF ₃	H	SOMe	2	
1-262	SCF ₃	H	SO ₂ Me	0	
1-263	SCF ₃	H	SO ₂ Me	1	
1-264	SCF ₃	H	SO ₂ Me	2	
1-265	SCF ₃	H	SCF ₃	0	
1-266	SCF ₃	H	SCF ₃	1	
1-267	SCF ₃	H	SCF ₃	2	
1-268	SCF ₃	H	SOCF ₃	0	
1-269	SCF ₃	H	SOCF ₃	1	
1-270	SCF ₃	H	SOCF ₃	2	

[0084]

[表10]

第10表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-271	SCF ₃	H	NHi-Pr	0	
1-272	SCF ₃	H	NHi-Pr	1	
1-273	SCF ₃	H	NHi-Pr	2	
1-274	SCF ₃	H	N(Me)Et	0	
1-275	SCF ₃	H	N(Me)Et	1	
1-276	SCF ₃	H	N(Me)Et	2	
1-277	SCF ₃	H	NHAc	0	
1-278	SCF ₃	H	NHAc	1	
1-279	SCF ₃	H	NHAc	2	
1-280	SCF ₃	H	N(Me)Ac	0	
1-281	SCF ₃	H	N(Me)Ac	1	
1-282	SCF ₃	H	N(Me)Ac	2	
1-283	SCF ₃	H	CN	0	
1-284	SCF ₃	H	CN	1	
1-285	SCF ₃	H	CN	2	
1-286	SCF ₃	H	CO ₂ Et	0	
1-287	SCF ₃	H	CO ₂ Et	1	
1-288	SCF ₃	H	CO ₂ Et	2	
1-289	SCF ₃	H	CONHMe	0	
1-290	SCF ₃	H	CONHMe	1	
1-291	SCF ₃	H	CONHMe	2	
1-292	SCF ₃	H	CONMe ₂	0	
1-293	SCF ₃	H	CONMe ₂	1	
1-294	SCF ₃	H	CONMe ₂	2	
1-295	CF ₂ CF ₃	H	Me	0	
1-296	CF ₂ CF ₃	H	Me	1	
1-297	CF ₂ CF ₃	H	Me	2	
1-298	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	0	247-250
1-299	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	1	
1-300	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	159-162

[0085]

[表11]

第11表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-301	CF ₂ CF ₃	H	Cl	0	
1-302	CF ₂ CF ₃	H	Cl	1	
1-303	CF ₂ CF ₃	H	Cl	2	
1-304	CF ₂ CF ₃	H	I	0	
1-305	CF ₂ CF ₃	H	I	1	
1-306	CF ₂ CF ₃	H	I	2	
1-307	CF ₂ CF ₃	H	OMe	0	
1-308	CF ₂ CF ₃	H	OMe	1	
1-309	CF ₂ CF ₃	H	OMe	2	
1-310	CF ₂ CF ₃	H	OCHF ₂	0	
1-311	CF ₂ CF ₃	H	OCHF ₂	1	
1-312	CF ₂ CF ₃	H	OCHF ₂	2	
1-313	CF ₂ CF ₃	H	SMe	0	
1-314	CF ₂ CF ₃	H	SMe	1	
1-315	CF ₂ CF ₃	H	SMe	2	
1-316	CF ₂ CF ₃	H	SOMe	0	
1-317	CF ₂ CF ₃	H	SOMe	1	
1-318	CF ₂ CF ₃	H	SOMe	2	
1-319	CF ₂ CF ₃	H	SO ₂ Me	0	
1-320	CF ₂ CF ₃	H	SO ₂ Me	1	
1-321	CF ₂ CF ₃	H	SO ₂ Me	2	
1-322	CF ₂ CF ₃	H	SCF ₃	0	
1-323	CF ₂ CF ₃	H	SCF ₃	1	
1-324	CF ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
1-325	CF ₂ CF ₃	H	SOCF ₃	0	
1-326	CF ₂ CF ₃	H	SOCF ₃	1	
1-327	CF ₂ CF ₃	H	SOCF ₃	2	
1-328	CF ₂ CF ₃	H	NHi-Pr	0	
1-329	CF ₂ CF ₃	H	NHi-Pr	1	
1-330	CF ₂ CF ₃	H	NHi-Pr	2	

[0086]

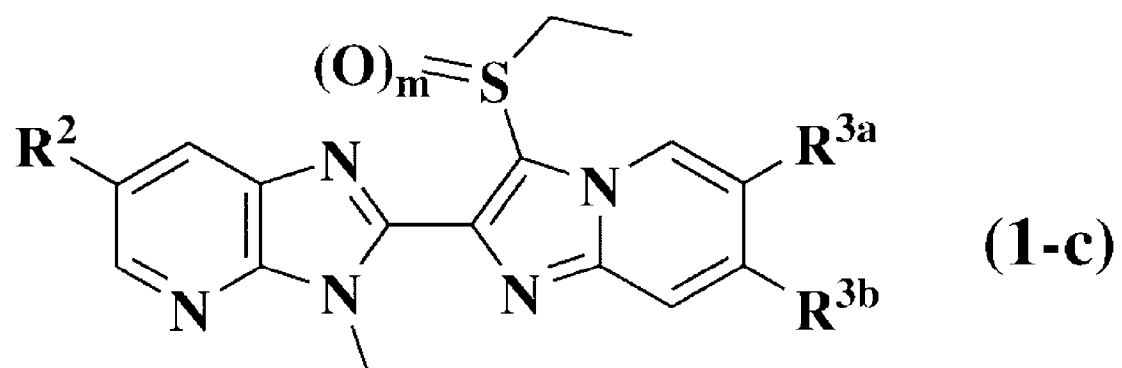
[表12]

第12表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
1-331	CF ₂ CF ₃	H	N(Me)Et	0	
1-332	CF ₂ CF ₃	H	N(Me)Et	1	
1-333	CF ₂ CF ₃	H	N(Me)Et	2	
1-334	CF ₂ CF ₃	H	NHAc	0	
1-335	CF ₂ CF ₃	H	NHAc	1	
1-336	CF ₂ CF ₃	H	NHAc	2	
1-337	CF ₂ CF ₃	H	N(Me)Ac	0	
1-338	CF ₂ CF ₃	H	N(Me)Ac	1	
1-339	CF ₂ CF ₃	H	N(Me)Ac	2	
1-340	CF ₂ CF ₃	H	CN	0	
1-341	CF ₂ CF ₃	H	CN	1	
1-342	CF ₂ CF ₃	H	CN	2	
1-343	CF ₂ CF ₃	H	CO ₂ Et	0	
1-344	CF ₂ CF ₃	H	CO ₂ Et	1	
1-345	CF ₂ CF ₃	H	CO ₂ Et	2	
1-346	CF ₂ CF ₃	H	CONHMe	0	
1-347	CF ₂ CF ₃	H	CONHMe	1	
1-348	CF ₂ CF ₃	H	CONHMe	2	
1-349	CF ₂ CF ₃	H	CONMe ₂	0	
1-350	CF ₂ CF ₃	H	CONMe ₂	1	
1-351	CF ₂ CF ₃	H	CONMe ₂	2	
1-352	CF ₂ CF ₃	c-Pr	H	0	212-213
1-353	CF ₂ CF ₃	c-Pr	H	1	
1-354	CF ₂ CF ₃	c-Pr	H	2	201-203
1-355	CF ₃	Br	H	0	
1-356	CF ₃	Br	H	1	
1-357	CF ₃	Br	H	2	
1-358	CF ₃	H	Br	0	
1-359	CF ₃	H	Br	1	
1-360	CF ₃	H	Br	2	

[0087]

[化11]



[0088]

[表13]

第13表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-1	CF ₃	H	H	0	196-198
2-2	CF ₃	H	H	1	
2-3	CF ₃	H	H	2	146-148
2-4	CF ₃	Me	H	0	
2-5	CF ₃	Me	H	1	
2-6	CF ₃	Me	H	2	
2-7	CF ₃	CF ₃	H	0	229-233
2-8	CF ₃	CF ₃	H	1	
2-9	CF ₃	CF ₃	H	2	NMR
2-10	CF ₃	Cl	H	0	238-241
2-11	CF ₃	Cl	H	1	NMR
2-12	CF ₃	Cl	H	2	213-215
2-13	CF ₃	I	H	0	249-251
2-14	CF ₃	I	H	1	
2-15	CF ₃	I	H	2	229-223
2-16	CF ₃	OMe	H	0	207-208
2-17	CF ₃	OMe	H	1	
2-18	CF ₃	OMe	H	2	179-181
2-19	CF ₃	OCHF ₂	H	0	
2-20	CF ₃	OCHF ₂	H	1	
2-21	CF ₃	OCHF ₂	H	2	
2-22	CF ₃	SMe	H	0	
2-23	CF ₃	SMe	H	1	
2-24	CF ₃	SMe	H	2	
2-25	CF ₃	SOMe	H	0	
2-26	CF ₃	SOMe	H	1	
2-27	CF ₃	SOMe	H	2	
2-28	CF ₃	SO ₂ Me	H	0	
2-29	CF ₃	SO ₂ Me	H	1	
2-30	CF ₃	SO ₂ Me	H	2	

[0089]

[表14]

第14表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-31	CF ₃	SCF ₃	H	0	
2-32	CF ₃	SCF ₃	H	1	
2-33	CF ₃	SCF ₃	H	2	
2-34	CF ₃	SO CF ₃	H	0	
2-35	CF ₃	SO CF ₃	H	1	
2-36	CF ₃	SO CF ₃	H	2	
2-37	CF ₃	NHi-Pr	H	0	
2-38	CF ₃	NHi-Pr	H	1	
2-39	CF ₃	NHi-Pr	H	2	
2-40	CF ₃	N(Me)Et	H	0	
2-41	CF ₃	N(Me)Et	H	1	
2-42	CF ₃	N(Me)Et	H	2	
2-43	CF ₃	NHAc	H	0	
2-44	CF ₃	NHAc	H	1	
2-45	CF ₃	NHAc	H	2	
2-46	CF ₃	N(Me)Ac	H	0	
2-47	CF ₃	N(Me)Ac	H	1	
2-48	CF ₃	N(Me)Ac	H	2	
2-49	CF ₃	CN	H	0	
2-50	CF ₃	CN	H	1	
2-51	CF ₃	CN	H	2	
2-52	CF ₃	CO ₂ Et	H	0	
2-53	CF ₃	CO ₂ Et	H	1	
2-54	CF ₃	CO ₂ Et	H	2	
2-55	CF ₃	CONHMe	H	0	
2-56	CF ₃	CONHMe	H	1	
2-57	CF ₃	CONHMe	H	2	
2-58	CF ₃	CONMe ₂	H	0	
2-59	CF ₃	CONMe ₂	H	1	
2-60	CF ₃	CONMe ₂	H	2	

[0090]

[表15]

第15表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-61	SCF ₃	H	H	0	
2-62	SCF ₃	H	H	1	
2-63	SCF ₃	H	H	2	
2-64	SCF ₃	Me	H	0	
2-65	SCF ₃	Me	H	1	
2-66	SCF ₃	Me	H	2	
2-67	SCF ₃	CF ₃	H	0	
2-68	SCF ₃	CF ₃	H	1	
2-69	SCF ₃	CF ₃	H	2	
2-70	SCF ₃	Cl	H	0	
2-71	SCF ₃	Cl	H	1	
2-72	SCF ₃	Cl	H	2	
2-73	SCF ₃	I	H	0	
2-74	SCF ₃	I	H	1	
2-75	SCF ₃	I	H	2	
2-76	SCF ₃	OMe	H	0	
2-77	SCF ₃	OMe	H	1	
2-78	SCF ₃	OMe	H	2	
2-79	SCF ₃	OCHF ₂	H	0	
2-80	SCF ₃	OCHF ₂	H	1	
2-81	SCF ₃	OCHF ₂	H	2	
2-82	SCF ₃	SMe	H	0	
2-83	SCF ₃	SMe	H	1	
2-84	SCF ₃	SMe	H	2	
2-85	SCF ₃	SOMe	H	0	
2-86	SCF ₃	SOMe	H	1	
2-87	SCF ₃	SOMe	H	2	
2-88	SCF ₃	SO ₂ Me	H	0	
2-89	SCF ₃	SO ₂ Me	H	1	
2-90	SCF ₃	SO ₂ Me	H	2	

[0091]

[表16]

第16表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-91	SCF ₃	SCF ₃	H	0	
2-92	SCF ₃	SCF ₃	H	1	
2-93	SCF ₃	SCF ₃	H	2	
2-94	SCF ₃	SO CF ₃	H	0	
2-95	SCF ₃	SO CF ₃	H	1	
2-96	SCF ₃	SO CF ₃	H	2	
2-97	SCF ₃	NHi-Pr	H	0	
2-98	SCF ₃	NHi-Pr	H	1	
2-99	SCF ₃	NHi-Pr	H	2	
2-100	SCF ₃	N(Me)Et	H	0	
2-101	SCF ₃	N(Me)Et	H	1	
2-102	SCF ₃	N(Me)Et	H	2	
2-103	SCF ₃	NHAc	H	0	
2-104	SCF ₃	NHAc	H	1	
2-105	SCF ₃	NHAc	H	2	
2-106	SCF ₃	N(Me)Ac	H	0	
2-107	SCF ₃	N(Me)Ac	H	1	
2-108	SCF ₃	N(Me)Ac	H	2	
2-109	SCF ₃	CN	H	0	
2-110	SCF ₃	CN	H	1	
2-111	SCF ₃	CN	H	2	
2-112	SCF ₃	CO ₂ Et	H	0	
2-113	SCF ₃	CO ₂ Et	H	1	
2-114	SCF ₃	CO ₂ Et	H	2	
2-115	SCF ₃	CONHMe	H	0	
2-116	SCF ₃	CONHMe	H	1	
2-117	SCF ₃	CONHMe	H	2	
2-118	SCF ₃	CONMe ₂	H	0	
2-119	SCF ₃	CONMe ₂	H	1	
2-120	SCF ₃	CONMe ₂	H	2	

[0092]

[表17]

第17表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-121	CF ₃	H	Me	0	
2-122	CF ₃	H	Me	1	
2-123	CF ₃	H	Me	2	
2-124	CF ₃	H	CF ₃	0	229-231
2-125	CF ₃	H	CF ₃	1	
2-126	CF ₃	H	CF ₃	2	212-214
2-127	CF ₃	H	Cl	0	218-220
2-128	CF ₃	H	Cl	1	
2-129	CF ₃	H	Cl	2	211-214
2-130	CF ₃	H	I	0	
2-131	CF ₃	H	I	1	
2-132	CF ₃	H	I	2	215-217
2-133	CF ₃	H	OMe	0	
2-134	CF ₃	H	OMe	1	
2-135	CF ₃	H	OMe	2	
2-136	CF ₃	H	OCHF ₂	0	
2-137	CF ₃	H	OCHF ₂	1	
2-138	CF ₃	H	OCHF ₂	2	
2-139	CF ₃	H	SMe	0	
2-140	CF ₃	H	SMe	1	
2-141	CF ₃	H	SMe	2	185-187
2-142	CF ₃	H	SOMe	0	
2-143	CF ₃	H	SOMe	1	
2-144	CF ₃	H	SOMe	2	248-249
2-145	CF ₃	H	SO ₂ Me	0	
2-146	CF ₃	H	SO ₂ Me	1	
2-147	CF ₃	H	SO ₂ Me	2	NMR
2-148	CF ₃	H	SCF ₃	0	
2-149	CF ₃	H	SCF ₃	1	
2-150	CF ₃	H	SCF ₃	2	222-225

[0093]

[表18]

第18表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-151	CF ₃	H	SOCF ₃	0	
2-152	CF ₃	H	SOCF ₃	1	
2-153	CF ₃	H	SOCF ₃	2	
2-154	CF ₃	H	NHi-Pr	0	
2-155	CF ₃	H	NHi-Pr	1	
2-156	CF ₃	H	NHi-Pr	2	
2-157	CF ₃	H	N(Me)Et	0	
2-158	CF ₃	H	N(Me)Et	1	
2-159	CF ₃	H	N(Me)Et	2	
2-160	CF ₃	H	NHAc	0	
2-161	CF ₃	H	NHAc	1	
2-162	CF ₃	H	NHAc	2	NMR
2-163	CF ₃	H	N(Me)Ac	0	
2-164	CF ₃	H	N(Me)Ac	1	
2-165	CF ₃	H	N(Me)Ac	2	
2-166	CF ₃	H	CN	0	249-251
2-167	CF ₃	H	CN	1	
2-168	CF ₃	H	CN	2	NMR
2-169	CF ₃	H	CO ₂ Et	0	
2-170	CF ₃	H	CO ₂ Et	1	
2-171	CF ₃	H	CO ₂ Et	2	161-163
2-172	CF ₃	H	CONHMe	0	
2-173	CF ₃	H	CONHMe	1	
2-174	CF ₃	H	CONHMe	2	
2-175	CF ₃	H	CONMe ₂	0	
2-176	CF ₃	H	CONMe ₂	1	
2-177	CF ₃	H	CONMe ₂	2	
2-178	SCF ₃	H	Me	0	
2-179	SCF ₃	H	Me	1	
2-180	SCF ₃	H	Me	2	

[0094]

[表19]

第19表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-181	SCF ₃	H	CF ₃	0	
2-182	SCF ₃	H	CF ₃	1	
2-183	SCF ₃	H	CF ₃	2	
2-184	SCF ₃	H	Cl	0	
2-185	SCF ₃	H	Cl	1	
2-186	SCF ₃	H	Cl	2	
2-187	SCF ₃	H	I	0	
2-188	SCF ₃	H	I	1	
2-189	SCF ₃	H	I	2	
2-190	SCF ₃	H	OMe	0	
2-191	SCF ₃	H	OMe	1	
2-192	SCF ₃	H	OMe	2	
2-193	SCF ₃	H	OCHF ₂	0	
2-194	SCF ₃	H	OCHF ₂	1	
2-195	SCF ₃	H	OCHF ₂	2	
2-196	SCF ₃	H	SMe	0	
2-197	SCF ₃	H	SMe	1	
2-198	SCF ₃	H	SMe	2	
2-199	SCF ₃	H	SOMe	0	
2-200	SCF ₃	H	SOMe	1	
2-201	SCF ₃	H	SOMe	2	
2-202	SCF ₃	H	SO ₂ Me	0	
2-203	SCF ₃	H	SO ₂ Me	1	
2-204	SCF ₃	H	SO ₂ Me	2	
2-205	SCF ₃	H	SCF ₃	0	
2-206	SCF ₃	H	SCF ₃	1	
2-207	SCF ₃	H	SCF ₃	2	
2-208	SCF ₃	H	SOCF ₃	0	
2-209	SCF ₃	H	SOCF ₃	1	
2-210	SCF ₃	H	SOCF ₃	2	

[0095]

[表20]

第20表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-211	SCF ₃	H	NHi-Pr	0	
2-212	SCF ₃	H	NHi-Pr	1	
2-213	SCF ₃	H	NHi-Pr	2	
2-214	SCF ₃	H	N(Me)Et	0	
2-215	SCF ₃	H	N(Me)Et	1	
2-216	SCF ₃	H	N(Me)Et	2	
2-217	SCF ₃	H	NHAc	0	
2-218	SCF ₃	H	NHAc	1	
2-219	SCF ₃	H	NHAc	2	
2-220	SCF ₃	H	N(Me)Ac	0	
2-221	SCF ₃	H	N(Me)Ac	1	
2-222	SCF ₃	H	N(Me)Ac	2	
2-223	SCF ₃	H	CN	0	
2-224	SCF ₃	H	CN	1	
2-225	SCF ₃	H	CN	2	
2-226	SCF ₃	H	CO ₂ Et	0	
2-227	SCF ₃	H	CO ₂ Et	1	
2-228	SCF ₃	H	CO ₂ Et	2	
2-229	SCF ₃	H	CONHMe	0	
2-230	SCF ₃	H	CONHMe	1	
2-231	SCF ₃	H	CONHMe	2	
2-232	SCF ₃	H	CONMe ₂	0	
2-233	SCF ₃	H	CONMe ₂	1	
2-234	SCF ₃	H	CONMe ₂	2	
2-235	CF ₃	c-Pr	H	0	185-188
2-236	CF ₃	c-Pr	H	1	
2-237	CF ₃	c-Pr	H	2	203-205
2-238	CF ₃	Br	H	0	260-261
2-239	CF ₃	Br	H	1	
2-240	CF ₃	Br	H	2	242-243

[0096]

[表21]

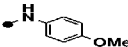
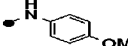
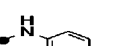
第21表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-241	CF ₃	H	c-Pr	0	
2-242	CF ₃	H	c-Pr	1	
2-243	CF ₃	H	c-Pr	2	169-171
2-244	CF ₃	H	Br	0	206-208
2-245	CF ₃	H	Br	1	NMR
2-246	CF ₃	H	Br	2	224-226
2-247	CF ₃	H	Ph	0	
2-248	CF ₃	H	Ph	1	
2-249	CF ₃	H	Ph	2	NMR
2-250	CF ₃	F	H	0	211-213
2-251	CF ₃	F	H	1	
2-252	CF ₃	F	H	2	164-166
2-253	CF ₃	SEt	H	0	
2-254	CF ₃	SEt	H	1	
2-255	CF ₃	SEt	H	2	197-199
2-256	CF ₃	SEt	H	0	
2-257	CF ₃	SEt	H	1	
2-258	CF ₃	SEt	H	2	185-186
2-259	CF ₃	H	NH ₂	0	
2-260	CF ₃	H	NH ₂	1	
2-261	CF ₃	H	NH ₂	2	171-175
2-262	CF ₃	H	St-Bu	0	
2-263	CF ₃	H	St-Bu	1	
2-264	CF ₃	H	St-Bu	2	58-61
2-265	CF ₃	H	Sc-Hex	0	
2-266	CF ₃	H	Sc-Hex	1	
2-267	CF ₃	H	Sc-Hex	2	63-66

[0097]

[表22]

第22表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-268	CF ₃	H		0	
2-269	CF ₃	H		1	
2-270	CF ₃	H		2	63-66
2-271	CF ₃	H	NHCH ₂ c-Pr	0	
2-272	CF ₃	H	NHCH ₂ c-Pr	1	
2-273	CF ₃	H	NHCH ₂ c-Pr	2	105-108
2-274	CF ₃	H	NHCH ₂ CHF ₂	0	
2-275	CF ₃	H	NHCH ₂ CHF ₂	1	
2-276	CF ₃	H	NHCH ₂ CHF ₂	2	110-112
2-277	CF ₃	H	SEt	0	
2-278	CF ₃	H	SEt	1	
2-279	CF ₃	H	SEt	2	175-178
2-280	CF ₃	H	SCHF ₂	0	
2-281	CF ₃	H	SCHF ₂	1	
2-282	CF ₃	H	SCHF ₂	2	169-171
2-283	CF ₃	H		0	
2-284	CF ₃	H		1	
2-285	CF ₃	H		2	NMR
2-286	CF ₃	Et	H	0	
2-287	CF ₃	Et	H	1	
2-288	CF ₃	Et	H	2	
2-289	CF ₃	n-Pr	H	0	
2-290	CF ₃	n-Pr	H	1	

[0098]

[表23]

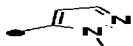
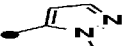
第23表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-291	CF ₃	n-Pr	H	2	
2-292	CF ₃	SCH ₂ CF ₃	H	0	
2-293	CF ₃	SCH ₂ CF ₃	H	1	
2-294	CF ₃	SCH ₂ CF ₃	H	2	
2-295	CF ₃	SOCH ₂ CF ₃	H	0	
2-296	CF ₃	SOCH ₂ CF ₃	H	1	
2-297	CF ₃	SOCH ₂ CF ₃	H	2	
2-298	CF ₃	SCH ₂ OCH ₃	H	0	
2-299	CF ₃	SCH ₂ OCH ₃	H	1	
2-300	CF ₃	SCH ₂ OCH ₃	H	2	
2-301	CF ₃	SCH ₂ Ph	H	0	
2-302	CF ₃	SCH ₂ Ph	H	1	
2-303	CF ₃	SCH ₂ Ph	H	2	
2-304	CF ₃		H	0	
2-305	CF ₃		H	1	
2-306	CF ₃		H	2	
2-307	CF ₃	S(NCN)CH ₃	H	0	
2-308	CF ₃	S(NCN)CH ₃	H	1	
2-309	CF ₃	S(NCN)CH ₃	H	2	
2-310	CF ₃	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	0	
2-311	CF ₃	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	1	
2-312	CF ₃	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	2	
2-313	CF ₃	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	0	
2-314	CF ₃	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	1	
2-315	CF ₃	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	2	
2-316	CF ₃	CO ₂ H	H	0	
2-317	CF ₃	CO ₂ H	H	1	
2-318	CF ₃	CO ₂ H	H	2	
2-319	CF ₃	CH=CH ₂	H	0	
2-320	CF ₃	CH=CH ₂	H	1	

[0099]

[表24]

第24表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-321	CF ₃	CH=CH ₂	H	2	
2-322	CF ₃	C≡CPh	H	0	
2-323	CF ₃	C≡CPh	H	1	
2-324	CF ₃	C≡CPh	H	2	
2-325	CF ₃	CH=NOH	H	0	
2-326	CF ₃	CH=NOH	H	1	
2-327	CF ₃	CH=NOH	H	2	
2-328	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	0	
2-329	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	1	
2-330	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	2	
2-331	CF ₃	CH=NOEt	H	0	
2-332	CF ₃	CH=NOEt	H	1	
2-333	CF ₃	CH=NOEt	H	2	
2-334	CF ₃	C(NH ₂)=NOCH ₂ CF ₃	H	0	
2-335	CF ₃	C(NH ₂)=NOCH ₂ CF ₃	H	1	
2-336	CF ₃	C(NH ₂)=NOCH ₂ CF ₃	H	2	
2-337	CF ₃	NO ₂	H	0	
2-338	CF ₃	NO ₂	H	1	
2-339	CF ₃	NO ₂	H	2	
2-340	CF ₃	2-thienyl	H	0	
2-341	CF ₃	2-thienyl	H	1	
2-342	CF ₃	2-thienyl	H	2	
2-343	CF ₃		H	0	
2-344	CF ₃		H	1	
2-345	CF ₃		H	2	
2-346	CF ₃	H	Et	0	
2-347	CF ₃	H	Et	1	
2-348	CF ₃	H	Et	2	
2-349	CF ₃	H	n-Pr	0	
2-350	CF ₃	H	n-Pr	1	

[0100]

[表25]

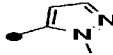
第25表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-351	CF ₃	H	n-Pr	2	
2-352	CF ₃	H	SCH ₂ CF ₃	0	
2-353	CF ₃	H	SCH ₂ CF ₃	1	
2-354	CF ₃	H	SCH ₂ CF ₃	2	249-251
2-355	CF ₃	H	SOCH ₂ CF ₃	0	
2-356	CF ₃	H	SOCH ₂ CF ₃	1	
2-357	CF ₃	H	SOCH ₂ CF ₃	2	241-243
2-358	CF ₃	H	SCH ₂ OCH ₃	0	
2-359	CF ₃	H	SCH ₂ OCH ₃	1	
2-360	CF ₃	H	SCH ₂ OCH ₃	2	
2-361	CF ₃	H	SCH ₂ Ph	0	
2-362	CF ₃	H	SCH ₂ Ph	1	
2-363	CF ₃	H	SCH ₂ Ph	2	
2-364	CF ₃	H		0	
2-365	CF ₃	H		1	
2-366	CF ₃	H		2	
2-367	CF ₃	H	S(NCN)CH ₃	0	
2-368	CF ₃	H	S(NCN)CH ₃	1	
2-369	CF ₃	H	S(NCN)CH ₃	2	136-139
2-370	CF ₃	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	0	
2-371	CF ₃	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	1	
2-372	CF ₃	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	2	
2-373	CF ₃	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	0	
2-374	CF ₃	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	1	
2-375	CF ₃	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	2	
2-376	CF ₃	H	CO ₂ H	0	
2-377	CF ₃	H	CO ₂ H	1	
2-378	CF ₃	H	CO ₂ H	2	NMR
2-379	CF ₃	H	CH=CH ₂	0	
2-380	CF ₃	H	CH=CH ₂	1	

[0101]

[表26]

第26表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
2-381	CF ₃	H	CH=CH ₂	2	195-197
2-382	CF ₃	H	C≡CPh	0	
2-383	CF ₃	H	C≡CPh	1	
2-384	CF ₃	H	C≡CPh	2	
2-385	CF ₃	H	CH=NOH	0	
2-386	CF ₃	H	CH=NOH	1	
2-387	CF ₃	H	CH=NOH	2	
2-388	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	0	
2-389	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	1	
2-390	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	2	235-237(E体)
2-391	CF ₃	H	CH=NOEt	0	
2-392	CF ₃	H	CH=NOEt	1	
2-393	CF ₃	H	CH=NOEt	2	221-223(E体)
2-394	CF ₃	H	CH=NOEt	2	193-196(Z体)
2-395	CF ₃	H	C(NH ₂)=NOCH ₂ CF ₃	0	
2-396	CF ₃	H	C(NH ₂)=NOCH ₂ CF ₃	1	
2-397	CF ₃	H	C(NH ₂)=NOCH ₂ CF ₃	2	
2-398	CF ₃	H	NO ₂	0	
2-399	CF ₃	H	NO ₂	1	
2-400	CF ₃	H	NO ₂	2	
2-401	CF ₃	H	2-thienyl	0	
2-402	CF ₃	H	2-thienyl	1	
2-403	CF ₃	H	2-thienyl	2	216-219
2-404	CF ₃	H		0	
2-405	CF ₃	H		1	
2-406	CF ₃	H		2	NMR
2-407	CF ₃	H	NHCOOEt	0	
2-408	CF ₃	H	NHCOOEt	1	
2-409	CF ₃	H	NHCOOEt	2	195-198

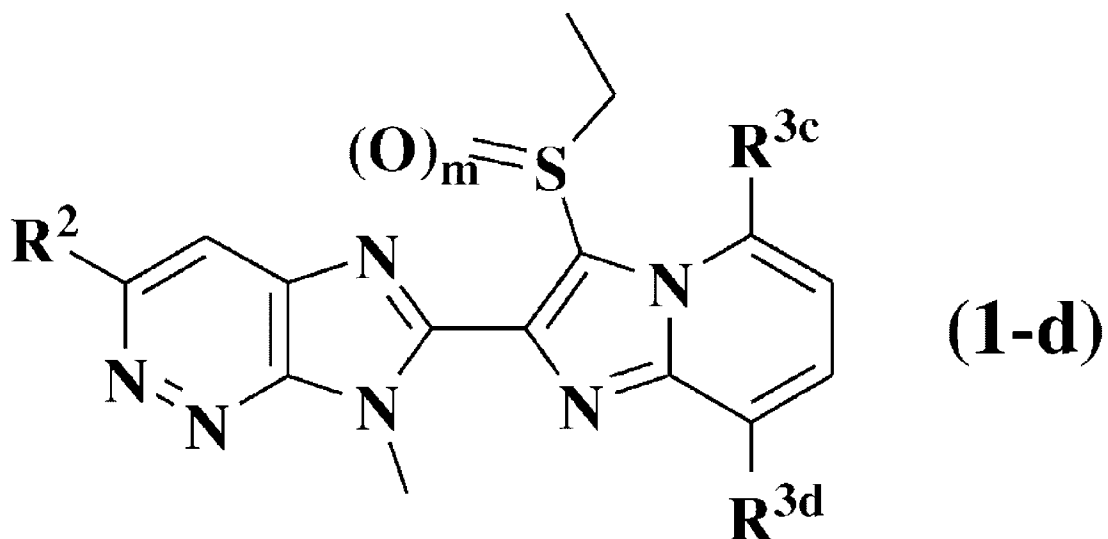
[0102]

[表27]

第27表

化合物番号	¹ H-NMRデータ(CDCl ₃)
1-9	9.65(s, 1H), 8.23(s, 1H), 8.00(d, 1H), 7.76(d, 1H), 4.38(s, 3H), 4.05(q, 2H), 1.48(t, 3H)
1-10	8.71(s, 1H), 8.23(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.39(d, 1H), 4.54(s, 3H), 3.12(q, 2H), 1.22(t, 3H)
1-12	9.31(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.83(d, 1H), 7.59(d, 1H), 4.36(s, 3H), 4.01(q, 2H), 1.47(t, 3H)
2-9	9.66(s, 1H), 8.77(s, 1H), 8.36(s, 1H), 7.95(d, 1H), 7.72(d, 1H), 4.17(s, 3H), 4.09(q, 2H), 1.47(t, 3H)
2-11	9.54(s, 1H), 8.72(s, 1H), 8.31(s, 1H), 7.72(d, 1H), 7.42(d, 1H), 4.42(s, 3H), 3.75-3.66(m, 1H), 3.59-3.50(m, 1H), 1.56(t, 3H)
2-147	9.49(d, 1H), 8.78(s, 1H), 8.49(s, 1H), 8.37(s, 1H), 7.58(d, 1H), 4.19(s, 3H), 4.14(q, 2H), 3.20(s, 3H), 1.46(t, 3H)
2-162	9.12(d, 1H), 8.74(s, 1H), 8.33(s, 1H), 8.17(s, 1H), 7.45(br, 1H), 7.24(d, 1H), 4.14(s, 3H), 3.97(q, 2H), 2.28(s, 3H), 1.42(t, 3H)
2-168	9.41(d, 1H), 8.78(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.23(s, 1H), 7.23(d, 1H), 4.19(s, 3H), 4.14(q, 2H), 1.46(t, 3H)
2-245	9.35(d, 1H), 8.72(s, 1H), 8.31(s, 1H), 7.97(s, 1H), 7.09(d, 1H), 4.41(s, 3H), 3.73-3.49(m, 2H), 1.53(t, 3H)
2-249	9.23(d, 1H), 8.75(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.02(s, 1H), 7.73(d, 2H), 7.56(t, 2H), 7.51(d, 1H), 7.44(d, 1H), 4.17(s, 3H), 4.02(q, 2H), 1.46(t, 3H)
2-285	9.41(d, 1H), 8.78(s, 1H), 8.77(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.22(s, 1H), 8.13(s, 1H), 7.65(d, 1H), 4.19(s, 3H), 4.10(q, 2H), 1.47(t, 3H)
2-378	9.33(d, 1H), 8.77(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.23(s, 1H), 7.60(d, 1H), 4.16(s, 3H), 4.07(q, 2H), 1.45(t, 3H)
2-406	9.31(d, 1H), 8.77(s, 1H), 8.36(s, 1H), 7.88(s, 1H), 7.61(d, 1H), 7.24(d, 1H), 6.55(d, 1H), 4.17(s, 3H), 4.07(s, 3H), 4.06(q, 2H), 1.47(t, 3H)
3-6	9.08(d, 1H), 8.22(s, 1H), 7.42(d, 1H), 7.12(dd, 1H), 4.36(s, 3H), 3.91(q, 2H), 2.72(s, 3H), 1.43(t, 3H)
8-6	9.28(s, 1H), 8.74(s, 1H), 8.33(s, 1H), 5.24(br, 2H), 4.16(s, 3H), 3.97(q, 2H), 1.43(t, 3H)
8-9	9.14(d, 1H), 8.75(s, 1H), 8.34(s, 1H), 7.31(d, 1H), 4.22(s, 3H), 4.08(q, 2H), 1.43(t, 3H)

[0103] [化12]

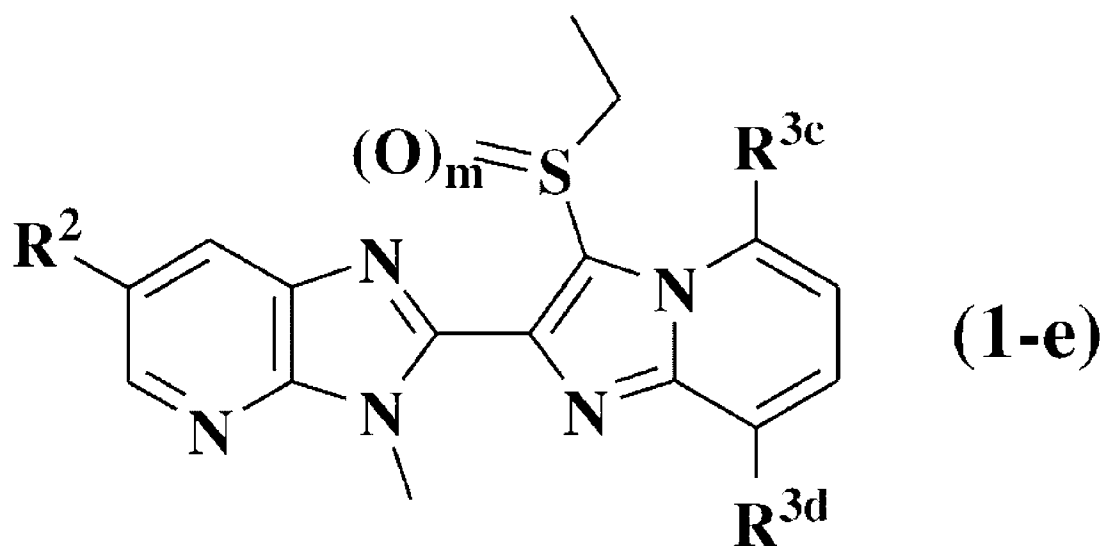


[0104] [表28]

第28表

化合物番号	R ²	R ^{3c}	R ^{3d}	m	物性値
3-1	CF ₂ CF ₃	Cl	H	0	160-163
3-2	CF ₂ CF ₃	Cl	H	1	
3-3	CF ₂ CF ₃	Cl	H	2	93-98
3-4	CF ₂ CF ₃	H	Me	0	136-141
3-5	CF ₂ CF ₃	H	Me	1	
3-6	CF ₂ CF ₃	H	Me	2	NMR

[0105] [化13]



[0106]

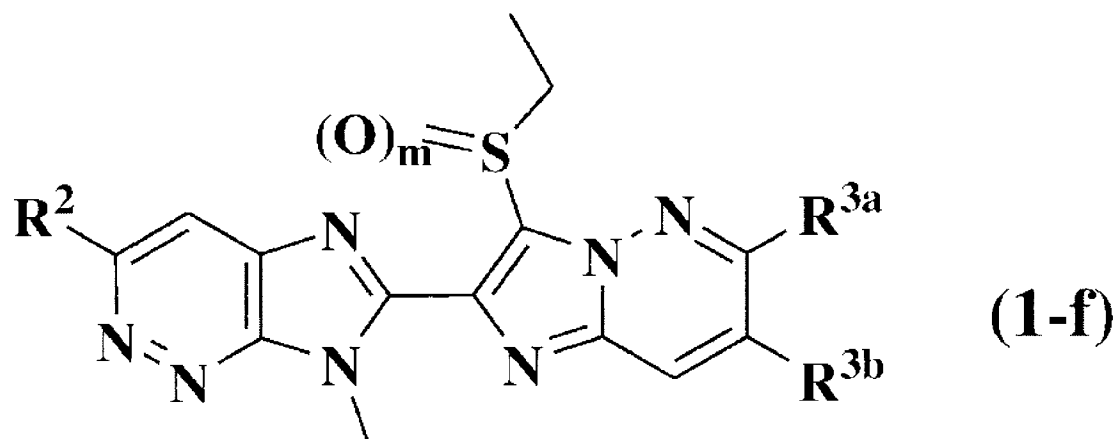
[表29]

第29表

化合物番号	R ²	R ^{3c}	R ^{3d}	m	物性値
4-1	CF ₃	H	Me	0	185-190
4-2	CF ₃	H	Me	1	
4-3	CF ₃	H	Me	2	193-196
4-4	CF ₃	H	Cl	0	
4-5	CF ₃	H	Cl	1	
4-6	CF ₃	H	Cl	2	
4-7	CF ₃	H	Br	0	208-211
4-8	CF ₃	H	Br	1	
4-9	CF ₃	H	Br	2	197-198
4-10	CF ₃	H	OE _t	0	202-205
4-11	CF ₃	H	OE _t	1	
4-12	CF ₃	H	OE _t	2	163-166
4-13	CF ₃	H	c-Pr	0	163-165
4-14	CF ₃	H	c-Pr	1	
4-15	CF ₃	H	c-Pr	2	149-151
4-16	CF ₃	H	SO ₂ Et	0	
4-17	CF ₃	H	SO ₂ Et	1	
4-18	CF ₃	H	SO ₂ Et	2	211-215
4-19	CF ₃	H	SE _t	0	203-206
4-20	CF ₃	H	SE _t	1	
4-21	CF ₃	H	SE _t	2	163-165
4-22	CF ₃	H	CN	0	
4-23	CF ₃	H	CN	1	
4-24	CF ₃	H	CN	2	243-246

[0107]

[化14]

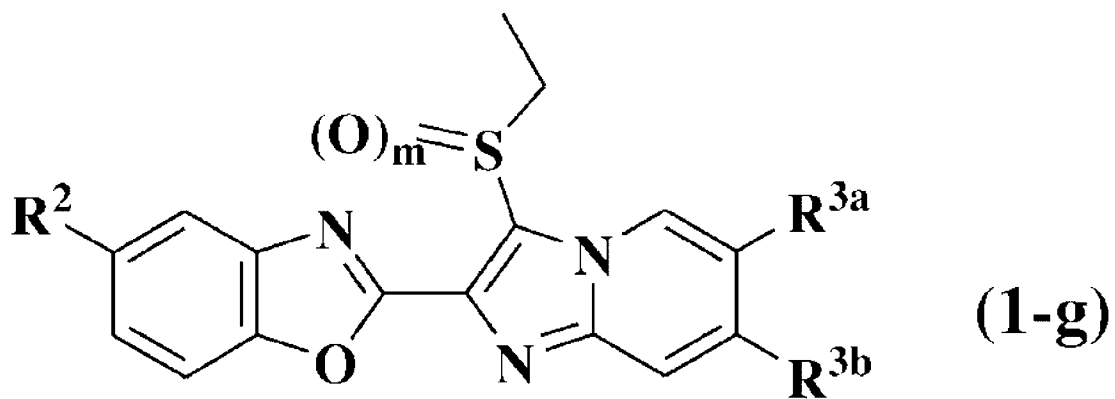


[0108] [表30]

第30表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
5-1	CF ₂ CF ₃	Cl	H	0	176-181
5-2	CF ₂ CF ₃	Cl	H	1	
5-3	CF ₂ CF ₃	Cl	H	2	255-257

[0109] [化15]



[0110]

[表31]

第31表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
6-1	CF ₃	CF ₃	H	0	175-177
6-2	CF ₃	CF ₃	H	1	
6-3	CF ₃	CF ₃	H	2	200-204
6-4	SCF ₃	Cl	H	0	181-184
6-5	SCF ₃	Cl	H	1	
6-6	SCF ₃	Cl	H	2	199-201
6-7	SOCF ₃	Cl	H	0	
6-8	SOCF ₃	Cl	H	1	
6-9	SOCF ₃	Cl	H	2	156-161
6-16	SCF ₃	H	CF ₃	0	146-148
6-17	SCF ₃	H	CF ₃	1	
6-18	SCF ₃	H	CF ₃	2	230-232
6-19	SCF ₃	H	Cl	0	
6-20	SCF ₃	H	Cl	1	
6-21	SCF ₃	H	Cl	2	
6-22	SCF ₃	H	Br	0	
6-23	SCF ₃	H	Br	1	
6-24	SCF ₃	H	Br	2	
6-25	SOCF ₃	H	CF ₃	0	
6-26	SOCF ₃	H	CF ₃	1	
6-27	SOCF ₃	H	CF ₃	2	165-168
6-28	SOCF ₃	H	Cl	0	
6-29	SOCF ₃	H	Cl	1	
6-30	SOCF ₃	H	Cl	2	

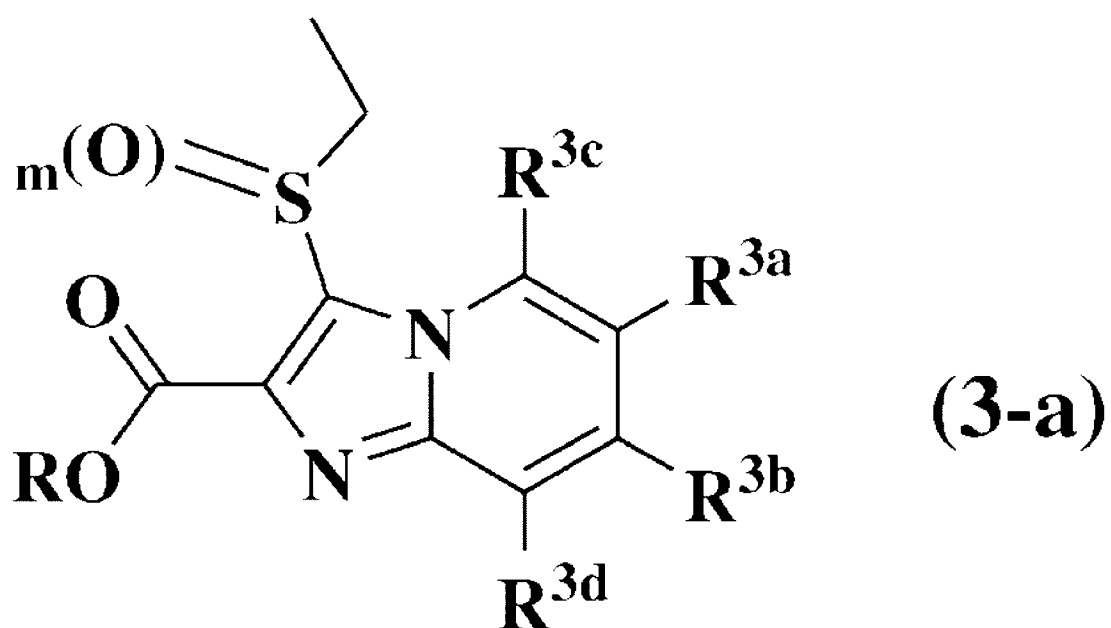
[0111]

[表32]

第32表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
6-31	SOCF ₃	H	Br	0	
6-32	SOCF ₃	H	Br	1	
6-33	SOCF ₃	H	Br	2	
6-34	OCF ₃	H	Cl	0	
6-35	OCF ₃	H	Cl	1	
6-36	OCF ₃	H	Cl	2	
6-37	OCF ₃	H	Br	0	
6-38	OCF ₃	H	Br	1	
6-39	OCF ₃	H	Br	2	
6-40	SO ₂ CF ₃	H	CF ₃	0	
6-41	SO ₂ CF ₃	H	CF ₃	1	
6-42	SO ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
6-43	SO ₂ CF ₃	H	Cl	0	
6-44	SO ₂ CF ₃	H	Cl	1	
6-45	SO ₂ CF ₃	H	Cl	2	
6-46	SO ₂ CF ₃	H	Br	0	
6-47	SO ₂ CF ₃	H	Br	1	
6-48	SO ₂ CF ₃	H	Br	2	

[0112] [化16]



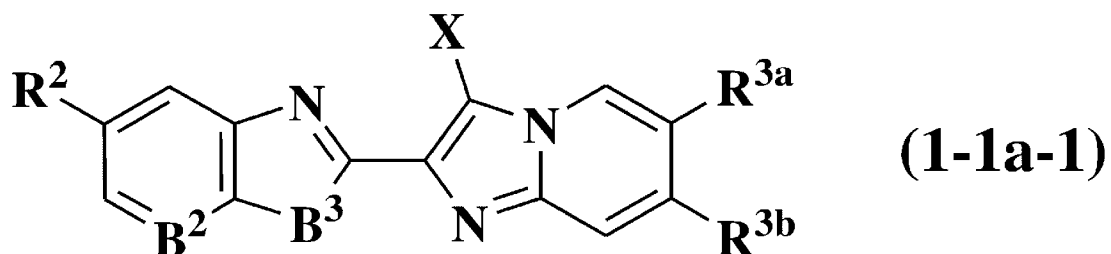
[0113]

[表33]

第33表

中間体番号	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	R	m	物性値
11-1	H	H	H	H	Et	0	141-145
11-2	H	H	H	H	Et	1	
11-3	H	H	H	H	Et	2	102-104
11-4	CF ₃	H	H	H	Et	0	95-97
11-5	NO ₂	H	H	H	Et	0	106-108
11-6	Cl	H	H	H	Et	0	78-80
11-7	Br	H	H	H	Et	0	81-82
11-8	Me	H	H	H	Et	0	NMR
11-9	H	CF ₃	H	H	Et	0	53-55
11-10	H	CF ₃	H	H	H	0	214-215
11-11	H	Cl	H	H	Et	0	85-87
11-12	H	Cl	H	H	Et	1	
11-13	H	Cl	H	H	Et	2	
11-14	H	Cl	H	H	H	0	224-226
11-15	H	Cl	H	H	H	1	
11-16	H	Cl	H	H	H	2	
11-17	H	Br	H	H	Et	0	68-70
11-18	H	Br	H	H	Et	1	
11-19	H	Br	H	H	Et	2	
11-20	H	Br	H	H	H	0	199-202
11-21	H	Br	H	H	H	1	
11-22	H	Br	H	H	H	2	
11-23	H	SEt	H	H	Et	0	51-53
11-24	H	H	Cl	H	Et	0	NMR
11-25	H	H	H	Me	Et	0	NMR

[0114] [化17]



[0115]

[表34]

第34表

中間体番号	R ²	B ²	B ³	X	R ^{3a}	R ^{3b}	物性値
12-1	CF ₃	N	NMe	H	CF ₃	H	
12-2	CF ₃	N	NMe	Cl	CF ₃	H	
12-3	CF ₃	N	NMe	Br	CF ₃	H	
12-4	CF ₃	N	NMe	I	CF ₃	H	
12-5	CF ₃	N	NMe	H	Cl	H	
12-6	CF ₃	N	NMe	Cl	Cl	H	
12-7	CF ₃	N	NMe	Br	Cl	H	
12-8	CF ₃	N	NMe	I	Cl	H	
12-9	CF ₃	N	NMe	H	Br	H	
12-10	CF ₃	N	NMe	Cl	Br	H	
12-11	CF ₃	N	NMe	Br	Br	H	
12-12	CF ₃	N	NMe	I	Br	H	
12-13	CF ₃	N	NMe	H	I	H	
12-14	CF ₃	N	NMe	Cl	I	H	NMR
12-15	CF ₃	N	NMe	Br	I	H	
12-16	CF ₃	N	NMe	I	I	H	
12-17	CF ₃	N	NMe	H	H	CF ₃	
12-18	CF ₃	N	NMe	Cl	H	CF ₃	
12-19	CF ₃	N	NMe	Br	H	CF ₃	
12-20	CF ₃	N	NMe	I	H	CF ₃	
12-21	CF ₃	N	NMe	H	H	Cl	
12-22	CF ₃	N	NMe	Cl	H	Cl	
12-23	CF ₃	N	NMe	Br	H	Cl	
12-24	CF ₃	N	NMe	I	H	Cl	
12-25	CF ₃	N	NMe	H	H	Br	NMR
12-26	CF ₃	N	NMe	Cl	H	Br	
12-27	CF ₃	N	NMe	Br	H	Br	
12-28	CF ₃	N	NMe	I	H	Br	
12-29	CF ₃	N	NMe	H	H	I	
12-30	CF ₃	N	NMe	Cl	H	I	
12-31	CF ₃	N	NMe	Br	H	I	
12-32	CF ₃	N	NMe	I	H	I	
12-33	SCF ₃	CH	O	H	CF ₃	H	
12-34	SCF ₃	CH	O	Cl	CF ₃	H	

[0116]

[表35]

第35表

中間体番号	R ²	B ²	B ³	X	R ^{3a}	R ^{3b}	物性値
12-35	SCF ₃	CH	O	Br	CF ₃	H	
12-36	SCF ₃	CH	O	I	CF ₃	H	
12-37	SCF ₃	CH	O	H	Cl	H	
12-38	SCF ₃	CH	O	Cl	Cl	H	
12-39	SCF ₃	CH	O	Br	Cl	H	
12-40	SCF ₃	CH	O	I	Cl	H	
12-41	SCF ₃	CH	O	H	Br	H	
12-42	SCF ₃	CH	O	Cl	Br	H	
12-43	SCF ₃	CH	O	Br	Br	H	
12-44	SCF ₃	CH	O	I	Br	H	
12-45	SCF ₃	CH	O	H	I	H	
12-46	SCF ₃	CH	O	Cl	I	H	
12-47	SCF ₃	CH	O	Br	I	H	
12-48	SCF ₃	CH	O	I	I	H	
12-49	SCF ₃	CH	O	H	H	CF ₃	
12-50	SCF ₃	CH	O	Cl	H	CF ₃	
12-51	SCF ₃	CH	O	Br	H	CF ₃	
12-52	SCF ₃	CH	O	I	H	CF ₃	
12-53	SCF ₃	CH	O	H	H	Cl	
12-54	SCF ₃	CH	O	Cl	H	Cl	
12-55	SCF ₃	CH	O	Br	H	Cl	
12-56	SCF ₃	CH	O	I	H	Cl	
12-57	SCF ₃	CH	O	H	H	Br	
12-58	SCF ₃	CH	O	Cl	H	Br	
12-59	SCF ₃	CH	O	Br	H	Br	
12-60	SCF ₃	CH	O	I	H	Br	
12-61	SCF ₃	CH	O	H	H	I	
12-62	SCF ₃	CH	O	Cl	H	I	
12-63	SCF ₃	CH	O	Br	H	I	
12-64	SCF ₃	CH	O	I	H	I	
12-65	CF ₃	N	NMe	H	OMe	H	246-247
12-66	CF ₃	N	NMe	Cl	OMe	H	
12-67	CF ₃	N	NMe	Br	OMe	H	
12-68	CF ₃	N	NMe	I	OMe	H	262-264

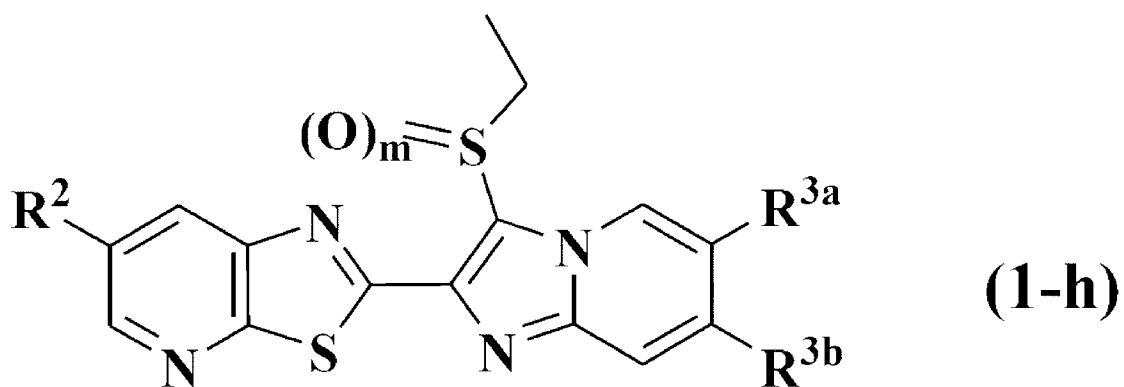
[0117]

[表36]

第36表

中間体番号	$^1\text{H-NMR}$ データ(CDCl_3)
11-8	8.33(s, 1H), 7.62(d, 1H), 7.18(d, 1H), 4.45(q, 2H), 2.92(q, 2H), 2.40(s, 3H), 1.47(t, 3H), 1.19(t, 3H)
11-24	7.69(d, 1H), 7.25(dd, 1H), 6.45(d, 1H), 4.50(q, 2H), 2.98(q, 2H), 1.46(t, 3H), 1.25(t, 3H)
11-25	8.43(s, 1H), 7.13(d, 1H), 6.90(dd, 1H), 4.52(q, 2H), 2.91(q, 2H), 2.67(s, 3H), 1.47(t, 3H), 1.17(t, 3H)
12-14	8.71(s, 1H), 8.51(s, 1H), 8.39(s, 1H), 7.54(d, 1H), 7.49(d, 1H), 4.38(s, 3H)
12-25	8.68(s, 1H), 8.46(s, 1H), 8.24(s, 1H), 8.13(d, 1H), 7.90(s, 1H), 7.04(d, 1H), 4.44(s, 3H)

[0118] [化18]



[0119]

[表37]

第37表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
7-1	CF ₃	CF ₃	H	0	
7-2	CF ₃	CF ₃	H	1	
7-3	CF ₃	CF ₃	H	2	
7-4	SCF ₃	Cl	H	0	
7-5	SCF ₃	Cl	H	1	
7-6	SCF ₃	Cl	H	2	
7-7	SOCF ₃	Cl	H	0	
7-8	SOCF ₃	Cl	H	1	
7-9	SOCF ₃	Cl	H	2	
7-10	SCF ₃	H	CF ₃	0	
7-11	SCF ₃	H	CF ₃	1	
7-12	SCF ₃	H	CF ₃	2	
7-13	SCF ₃	H	Cl	0	
7-14	SCF ₃	H	Cl	1	
7-15	SCF ₃	H	Cl	2	
7-16	SCF ₃	H	Br	0	
7-17	SCF ₃	H	Br	1	
7-18	SCF ₃	H	Br	2	
7-19	SOCF ₃	H	CF ₃	0	
7-20	SOCF ₃	H	CF ₃	1	
7-21	SOCF ₃	H	CF ₃	2	
7-22	SOCF ₃	H	Cl	0	
7-23	SOCF ₃	H	Cl	1	
7-24	SOCF ₃	H	Cl	2	

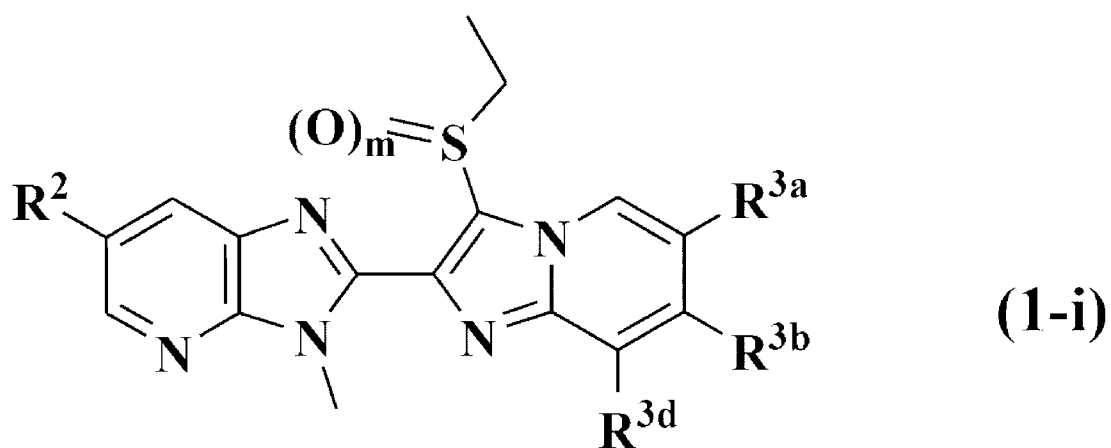
[0120]

[表38]

第38表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
7-25	SOCF ₃	H	Br	0	
7-26	SOCF ₃	H	Br	1	
7-27	SOCF ₃	H	Br	2	
7-28	OCF ₃	H	Cl	0	
7-29	OCF ₃	H	Cl	1	
7-30	OCF ₃	H	Cl	2	
7-31	OCF ₃	H	Br	0	
7-32	OCF ₃	H	Br	1	
7-33	OCF ₃	H	Br	2	
7-34	CF ₃	H	Cl	0	
7-35	CF ₃	H	Cl	1	
7-36	CF ₃	H	Cl	2	
7-37	CF ₃	H	Br	0	241-242
7-38	CF ₃	H	Br	1	
7-39	CF ₃	H	Br	2	260-261
7-40	CF ₃	H	CF ₃	0	
7-41	CF ₃	H	CF ₃	1	
7-42	CF ₃	H	CF ₃	2	

[0121] [化19]



[0122]

[表39]

第39表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3d}	m	物性値
8-1	CF ₃	H	NH ₂	Br	0	
8-2	CF ₃	H	NH ₂	Br	1	
8-3	CF ₃	H	NH ₂	Br	2	131-135
8-4	CF ₃	Br	NH ₂	Br	0	
8-5	CF ₃	Br	NH ₂	Br	1	
8-6	CF ₃	Br	NH ₂	Br	2	NMR
8-7	CF ₃	H	Br	I	0	
8-8	CF ₃	H	Br	I	1	
8-9	CF ₃	H	Br	I	2	NMR
8-10	CF ₃	NH ₂	Cl	H	0	
8-11	CF ₃	NH ₂	Cl	H	1	
8-12	CF ₃	NH ₂	Cl	H	2	
8-13	CF ₃	NH ₂	Br	H	0	
8-14	CF ₃	NH ₂	Br	H	1	
8-15	CF ₃	NH ₂	Br	H	2	
8-16	CF ₃	NH ₂	I	H	0	
8-17	CF ₃	NH ₂	I	H	1	
8-18	CF ₃	NH ₂	I	H	2	
8-19	CF ₃	NHAc	Cl	H	0	
8-20	CF ₃	NHAc	Cl	H	1	
8-21	CF ₃	NHAc	Cl	H	2	
8-22	CF ₃	NHAc	Br	H	0	
8-23	CF ₃	NHAc	Br	H	1	
8-24	CF ₃	NHAc	Br	H	2	
8-25	CF ₃	NHAc	I	H	0	
8-26	CF ₃	NHAc	I	H	1	
8-27	CF ₃	NHAc	I	H	2	
8-28	CF ₃	Cl	Me	H	0	
8-29	CF ₃	Cl	Me	H	1	
8-30	CF ₃	Cl	Me	H	2	

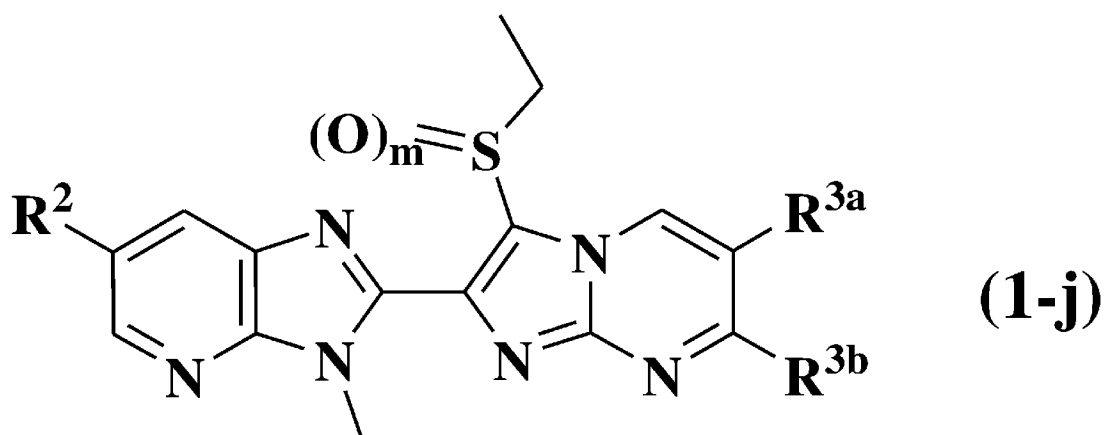
[0123]

[表40]

第40表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3d}	m	物性値
8-31	CF ₃	Br	Me	H	0	242-245
8-32	CF ₃	Br	Me	H	1	
8-33	CF ₃	Br	Me	H	2	217-219
8-34	CF ₃	I	Me	H	0	
8-35	CF ₃	I	Me	H	1	
8-36	CF ₃	I	Me	H	2	
8-37	CF ₃	Br	Cl	H	0	
8-38	CF ₃	Br	Cl	H	1	
8-39	CF ₃	Br	Cl	H	2	
8-40	CF ₃	Br	SMe	H	0	
8-41	CF ₃	Br	SMe	H	1	
8-42	CF ₃	Br	SMe	H	2	
8-43	CF ₃	c-Pr	Cl	H	0	
8-44	CF ₃	c-Pr	Cl	H	1	
8-45	CF ₃	c-Pr	Cl	H	2	
8-46	CF ₃	c-Pr	Me	H	0	
8-47	CF ₃	c-Pr	Me	H	1	
8-48	CF ₃	c-Pr	Me	H	2	
8-49	CF ₃	Cl	H	Br	0	
8-50	CF ₃	Cl	H	Br	1	
8-51	CF ₃	Cl	H	Br	2	
8-52	CF ₃	Cl	H	c-Pr	0	
8-53	CF ₃	Cl	H	c-Pr	1	
8-54	CF ₃	Cl	H	c-Pr	2	

[0124] [化20]



[0127] [表42]

第42表

化合物番号	R ²	B ³	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
10-1	CF ₃	NMe	CF ₃	H	0	
10-2	CF ₃	NMe	CF ₃	H	1	
10-3	CF ₃	NMe	CF ₃	H	2	
10-4	CF ₃	NMe	Cl	H	0	
10-5	CF ₃	NMe	Cl	H	1	
10-6	CF ₃	NMe	Cl	H	2	
10-7	CF ₃	NMe	Br	H	0	
10-8	CF ₃	NMe	Br	H	1	
10-9	CF ₃	NMe	Br	H	2	
10-10	CF ₃	NMe	H	CF ₃	0	
10-11	CF ₃	NMe	H	CF ₃	1	
10-12	CF ₃	NMe	H	CF ₃	2	
10-13	CF ₃	NMe	H	Cl	0	
10-14	CF ₃	NMe	H	Cl	1	
10-15	CF ₃	NMe	H	Cl	2	
10-16	CF ₃	NMe	H	Br	0	
10-17	CF ₃	NMe	H	Br	1	
10-18	CF ₃	NMe	H	Br	2	
10-19	CF ₃	S	CF ₃	H	0	
10-20	CF ₃	S	CF ₃	H	1	
10-21	CF ₃	S	CF ₃	H	2	
10-22	CF ₃	S	Cl	H	0	
10-23	CF ₃	S	Cl	H	1	
10-24	CF ₃	S	Cl	H	2	
10-25	CF ₃	S	Br	H	0	
10-26	CF ₃	S	Br	H	1	
10-27	CF ₃	S	Br	H	2	
10-28	CF ₃	S	H	CF ₃	0	
10-29	CF ₃	S	H	CF ₃	1	
10-30	CF ₃	S	H	CF ₃	2	

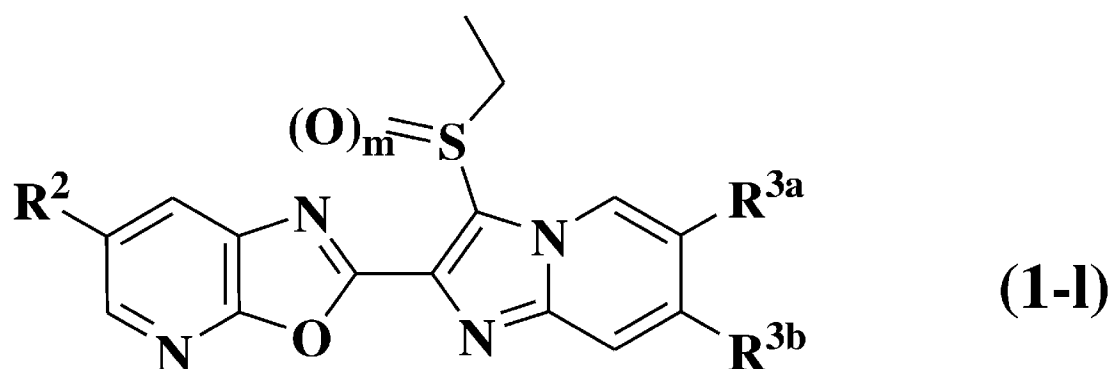
[0128]

[表43]

第43表

化合物番号	R ²	B ³	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
10-31	CF ₃	S	H	Cl	0	
10-32	CF ₃	S	H	Cl	1	
10-33	CF ₃	S	H	Cl	2	
10-34	CF ₃	S	H	Br	0	
10-35	CF ₃	S	H	Br	1	
10-36	CF ₃	S	H	Br	2	
10-37	CF ₃	O	CF ₃	H	0	
10-38	CF ₃	O	CF ₃	H	1	
10-39	CF ₃	O	CF ₃	H	2	
10-40	CF ₃	O	Cl	H	0	
10-41	CF ₃	O	Cl	H	1	
10-42	CF ₃	O	Cl	H	2	
10-43	CF ₃	O	Br	H	0	
10-44	CF ₃	O	Br	H	1	
10-45	CF ₃	O	Br	H	2	
10-46	CF ₃	O	H	CF ₃	0	
10-47	CF ₃	O	H	CF ₃	1	
10-48	CF ₃	O	H	CF ₃	2	
10-49	CF ₃	O	H	Cl	0	
10-50	CF ₃	O	H	Cl	1	
10-51	CF ₃	O	H	Cl	2	
10-52	CF ₃	O	H	Br	0	
10-53	CF ₃	O	H	Br	1	
10-54	CF ₃	O	H	Br	2	

[0129] [化22]



[0130]

[表44]

第44表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
13-1	CF ₃	CF ₃	H	0	
13-2	CF ₃	CF ₃	H	1	
13-3	CF ₃	CF ₃	H	2	
13-4	SCF ₃	Cl	H	0	
13-5	SCF ₃	Cl	H	1	
13-6	SCF ₃	Cl	H	2	
13-7	SOCF ₃	Cl	H	0	
13-8	SOCF ₃	Cl	H	1	
13-9	SOCF ₃	Cl	H	2	
13-10	SCF ₃	H	CF ₃	0	
13-11	SCF ₃	H	CF ₃	1	
13-12	SCF ₃	H	CF ₃	2	
13-13	SCF ₃	H	Cl	0	
13-14	SCF ₃	H	Cl	1	
13-15	SCF ₃	H	Cl	2	
13-16	SCF ₃	H	Br	0	
13-17	SCF ₃	H	Br	1	
13-18	SCF ₃	H	Br	2	
13-19	SOCF ₃	H	CF ₃	0	
13-20	SOCF ₃	H	CF ₃	1	
13-21	SOCF ₃	H	CF ₃	2	
13-22	SOCF ₃	H	Cl	0	
13-23	SOCF ₃	H	Cl	1	
13-24	SOCF ₃	H	Cl	2	

[0131]

[表45]

第45表

化合物番号	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	m	物性値
13-25	SO CF ₃	H	Br	0	
13-26	SO CF ₃	H	Br	1	
13-27	SO CF ₃	H	Br	2	
13-28	OC F ₃	H	Cl	0	
13-29	OC F ₃	H	Cl	1	
13-30	OC F ₃	H	Cl	2	
13-31	OC F ₃	H	Br	0	
13-32	OC F ₃	H	Br	1	
13-33	OC F ₃	H	Br	2	
13-34	CF ₃	H	Cl	0	
13-35	CF ₃	H	Cl	1	
13-36	CF ₃	H	Cl	2	
13-37	CF ₃	H	Br	0	
13-38	CF ₃	H	Br	1	
13-39	CF ₃	H	Br	2	
13-40	CF ₃	H	CF ₃	0	
13-41	CF ₃	H	CF ₃	1	
13-42	CF ₃	H	CF ₃	2	
13-43	CF ₃	CF ₃	H	0	
13-44	CF ₃	CF ₃	H	1	
13-45	CF ₃	CF ₃	H	2	

[0132] 本発明の一般式(1)で表される縮合複素環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。

[0133] 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 furfuryla*)、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*)、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 granellus*)、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 sexnotata*)、シロナヨトウ(*Spodoptera mauritia*)、イネシロオオメイガ(*Sci*

rpophaga 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*)、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(*Euprocotis 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 ruminis*)、ナシチビガ(*Bucculatrix pyrivorella*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、ナシホソガ(*Spulerina astaurola*)、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 aeneas*)、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 cinereipala*)

lpana)、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(*Acanthopplusia 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*)、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*)、及びワタリングア(*Earias cupreoviridis*)等が挙げられる。

- [0134] 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 antennata*)、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 c*

oelestialium)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 iwasakii*)、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(*Cavalerius 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 chinensis*)、クリトガリキジラミ(*Trioza quercicola*)、クルミグンバイ(*Uhlrites 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*)、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*)、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 muiri*)、サンホーゼカイガラムシ(*Comstockaspis pernicios*)、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 nigridorsalis*)、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 (*Leptocoris 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*)、トドキシラミ (*Psylla abietis*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、トベラキシラミ (*Psylla tobirae*)、ナガメ (*Eurydema rugosum*)、ナシアブラムシ (*Schizaphis piricola*)、ナシキシラミ (*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 (*Edwardsianarosae*)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspis aspidistrae*)、ハンノキシラミ (*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 trigonus*)、ヒメフタテンナガアワフキ (*Clovium punctata*)、ヒメヨコバイ類 (*Empoasca* sp.)、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 obnubilis*)、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*)、マエキアワフキ (*Aphrophora costalis*)、マキバカスミカメ (*Lygus disponi*)、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 malicollens*)、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。

- [0135] 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*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、イネネクイハムシ (*Donaia 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 zeamais*)、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*)、ジウシホシクビナガハムシ (*Crioceris quatuordecimpunctata*)、スモモゾウムシ (*Conotrachelus nenuphar*)、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*)、ニジユウヤホシテントウ (*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* spp.)、ヒメカツオブシムシ (*Attageus 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 nigrolineata*)、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*)、マメハンミョウ (*Epicauta gorhami*)、メイズウィービル (*Sitophilus zeamais*)、モモチョッキリゾウムシ (*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。

[0136] 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 nigritris*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、及びリンゴミバエ(*Rhagoletis pomonella*)等が挙げられる。

[0137] 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 nodi*)、カブラハバチ(*Athalia rosae*)、クリタマバチ (*Dryocosmus ku*

riphilus)、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。

[0138] 直翅目(バッタ目)害虫として例えば、クサキリ(*Homorocoryphus lineosus*)、ケラ(*Gryllotalpa* 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。

[0139] 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。

[0140] 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*)、タイワンカクマダニ(*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 pteromyssus*)、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。

[0141] 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 guangzhoensis*)、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。

[0142] 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。

[0143] 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。

[0144] 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 semipenetrans*)等が挙げられる。

[0145] 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

ヤコウラナメクジ(*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。

[0146] 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。

[0147] 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。

[0148] 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 (Ceratephyllus) 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。

[0149] さらに他の防除対象である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。

[0150] 本発明の一般式 (1) で表される縮合複素環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。

[0151] 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。

[0152] 上記「植物」には、イソキサフルトール等のHPPD阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のALS阻害剤、グリホサート等のEPSP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CoA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、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。

[0153] 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ALS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Clearfield（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ALS阻害型除草剤に耐性のダイズがあり、STS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、アリー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CoA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SRコーン等がある。

またアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物はProceedings of the National Academy of Sciences of the United States of America (Proc. Natl. Acad. Sci. USA) 87巻、7175～7179頁（1990年）等に記載されている。またアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルCoAカルボキシラーゼがWeed Science 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CoA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もしくは抵抗性付与に関わる変異を植物アセチルCoAカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルCoA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。

[0154] 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 δ -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、ルフィン、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；ナトリウムチャネル、カルシウムチャネル阻害剤等のイオンチャネル阻害剤；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；ビ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。

[0155] 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 δ -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事ができる組換え植物は、EP

- A - 0 3 7 4 7 5 3、WO 9 3 / 0 7 2 7 8、WO 9 5 / 3 4 6 5 6、
EP - A - 0 4 2 7 5 2 9、EP - A - 4 5 1 8 7 8、WO 0 3 / 0 5 2
0 7 3等に記載されている。

[0156] 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
。

[0157] 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。

[0158] 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。

[0159] 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。

[0160] 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。

[0161] 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したりすることも好ましい処理である。

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）で表される縮合複素環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。

[0162] 本発明の組成物（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。

[0163] 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。

[0164] 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、 γ -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、ナタネ油、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。

[0165] 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。

[0166] 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、磷脂質（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。

[0167] 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。

[0168] 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。

[0169] 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。

[0170] 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。

[0171] 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。

[0172] 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。

[0173] 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（農園芸用殺虫剤全体の重量に対して0.01～50重量%）が適当である。

[0174] 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、防除対象病害虫、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。

[0175] 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-xylyl methylcarbamate(XMC)、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*、*Bacillus thuringiensis*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、CPCBS(chlorfenson)、DCIP(dichlorodiisopropyl ether)、D-D(1, 3-Dichloropropene)、DDT、NAC、0-4-dimethylsulfamoylphenyl 0, 0-diethyl phosphorothioate(DSP)、0-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphorothioate(EPN)、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(allethrin)、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(isoprocarb: 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(e

ndosulfan)、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)、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(carbofuryl)、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(chlorobenzate)、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(diafenthion)、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(dinotefuryl)、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(dimet

hylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメフルスリン (dimefluthrin)、シラフルオフエン(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)、ナレッド(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)、ハイドロプレネ(hydroprene)、バニリプロール(vaniliprole)、バミドチオン(vamidothion)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、ハルフェンプロックス(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)、フェニソブプロモレート(bromopropylate)、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: PAP)、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(flusulfone)、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(flupyrzofos)、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)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルプロキシフェン(fluproxyfen)、フルブロシスリネート(flubrocylthrin)、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(protrifenbute)、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romo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)、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)、馬拉チオン(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)、メトールカルブ(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(levamisole hydrochloride)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、酒石酸モランテル(morantel tartrate)、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。

[0176] 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)、アムプロピルホス (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 (iprodione)、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 (iminoctadine)、イミノクタジンアルベシル酸塩 (iminoctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩 (iminoctadine-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 (carboxin)、カルボン (carv

one)、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)、クロルキノックス (chlorquinox)、クロルピクリン (chloropicrin)、クロルフェナゾール (chlorfenazole)、クロロジニトロナフタレン (chlorodinitronaphthalene)、クロロタロニル (chlorothalonil)、クロロネブ (chloroneb)、ザリラミド (zarilamid)、サリチルアニリド (salicylanilide)、シアゾファミド (cyazofamid)、ジエチルピロパカーボナート (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 (dipyrrithione)、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)、シルチオフアム (silthiof am)、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)、セダキサン (sedaxane)、ゾキサミド (zo xamide)、ダゾメット (dazomet)、チアジアジン(thiadiazin)、チアジニル (tiadinil)、チアジフルオル (thiadifluor)、チアベンダゾール (thia bendazole)、チオキシミド (tioxymid)、チオクロルフェンフィム (thioch lorfenphim)、チオファネート (thiophanate)、チオファネートメチル (th iophanate-methyl)、チシオフエン (thicyofen)、チノキノックス (thioqu inox)、キノメチオネート (chinomethionat)、チオフルザミド(thifluzami de)、チラム (thiram)、デカフェンチン (decafentin)、テクナゼン (tec nazene)、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 (de hydroacetic acid)、テブコナゾール (tebuconazole)、テブフロキン (teb ufloquin)、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 (II) (DBEDC)、ドデモルフ (dodemor ph)、ドラゾキシロン (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 (tri arimol)、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 (triflumi zole)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリホリン (trifor ine)、トリルフルアラニド (tolylfluanid)、トルクロホスメチル (tolclo fos-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)、ニトロスチレン (nitrostyrene)

、ヌアリモール (nuarimol)、ノニルフェノールスルホン酸銅(copper nonyl phenol sulfonate)、ハラクリネート (halacrinat)、バリダマイシン (validamycin)、バリフェナラート (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 (pyrifenox)、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 (fencpiclonil)、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)、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 (fluoastrobin)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルオピコリド (f

luopicolide)、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)、フルジオキシニル(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)、フルトリアホルム(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)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、ペンフルフェン(penflufen)、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)、ポリオキシリン(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(mildiomycin)、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)、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)、金属銀(silver)等の無機殺菌剤、次亜塩素酸ナトリウム(sodium hypochlorite)、水酸化第二銅(cupric hydroxide)、水和硫黄剤(wettable 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)、無水硫酸銅(copper sulfate anhydride)、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル(nickel dimethyldithiocarbamate)、8-ヒドロキシキノリン銅(oxine copper)のような銅系化合物、硫酸亜鉛(zinc sulfate)、硫酸銅五水塩(copper sulfate pentahydrate)等を例示することができる。

[0177] 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-TBA、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 (alloxydim)、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)、オルソスルファムロン (orthosulfamuron)、オルベンカルブ (orbencarb)、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 (clodinate)、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 (chlotoluron)、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)、クロルタール (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)、クロルブファミン (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)、クロルプロファミン (chlorprop ham)、
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)、サフルフェナシル (saflufenacil)、シアナジン (cyanazin e)、
シアナトリン (cyanatryn)、ジアレート (di-allate)、ジウロン (diur on)、
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 (dinos am)、
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 (c yprazine)、
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 (gib berellin)、
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 (dimetham etryn)、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)、スルフエントラゾン (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)、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 (thiencarbazone)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazone-methyl)、チオカルバジル (tiocarbazil)、チオクロリム (tioclorim)、チオベンカルブ (thioben carb)、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)、トリフロキシルスルフロン (trifloxysulfuron)、トリプロピندان (tripropindan)、トリベニユロンメチル (tribenuron-methyl)

ethyl)、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)、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)、ビシクロピロン (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 (pyrifthalid)、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)、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 (butoxydim)、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 (fluothuron)、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 (fluoronitrofen)、フルオロミジン (fluoromidine)、フルカルバゾン (flucarbazon)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazon-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 (proxaan)、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)、ブロモキシニル (bromoxynil)、ブロモフェノキシム (bromofenoxim)、ブロモブチド (bromobutide)、ブロモボニル (bromobonil)、フロラスラム (florasulam)、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 (bensulide)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、ベンゾイルプロップ (benzoylprop)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンゾフルオール (benzofluor)、ベントゾン (bentazone)、ペンタノクロール (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)、ホラムスルフロン (foramsulfuron)、ホルクロルフエニユロン (forchlorfenuron)、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)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メソスルフロンメチル (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)、メトスルフロン (metsulfuron)、メトスルフロンメチル (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)、メフェナセツト (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)、ヨードスルフロン (iodosulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、ヨードボニル (iodobonil)、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 (rhopodethanil)、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。

[0178] 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)、昆虫ボックスウイルス (Entomopoxi virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・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。

[0179] 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*)、ショクガタマバエ (*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、ボーベリア・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。

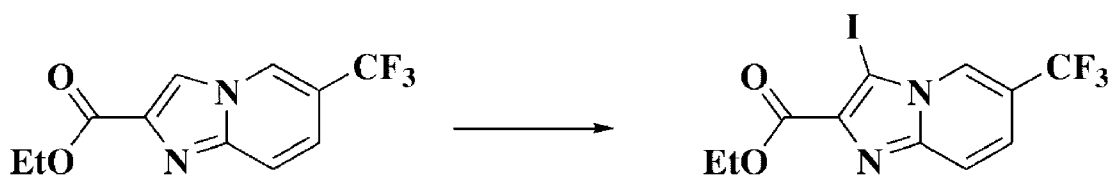
[0180] 以下に本発明の代表的な化合物、及び製造中間体の製造例によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

実施例

[0181] 中間体 (3) の製造例 1

3 - ヨード - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 -
- カルボン酸エチルの製造方法

[化23]



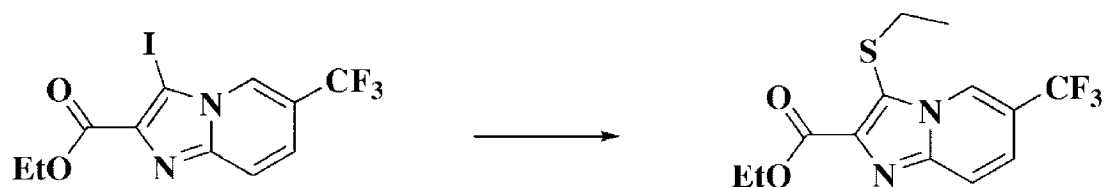
国際公開第2009/115651号パンフレットに記載の方法に従って製造した6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボン酸エチル (109.5 mg、0.424 mmol) に、DIH (96.7 mg、0.255 mmol)、酢酸 (1.5 mL) を加え、90 °Cで1時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、ハイポ水溶液、飽和重曹水でクエンチし、酢酸を減圧留去した。酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、3 - ヨード - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボン酸エチルを定量的な収率で得た。

物性：融点198 - 200 °C

[0182] 中間体 (3) の製造例2

3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボン酸エチルの製造方法

[化24]



前記3 - ヨード - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボン酸エチル (3.06 g、7.97 mmol) に、EtSH (743 mg、12.0 mmol)、Pd₂(dba)₃ (365 mg、0.3

99 mmol)、Xantphos (553 mg、0.956 mmol)、EtNi-Pr₂ (2.05 g、15.9 mmol)、2-MeTHF (80 mL)を加え、アルゴン置換した後、80℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、3-エチルチオ-6-トリフルオロメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル (2.38 g、93%)を得た。なお、dbaはジベンジリデンアセトンを意味する。

物性：融点94 - 96℃

[0183] 中間体 (3) の製造例3

3-エチルチオ-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸の製造方法

[化25]



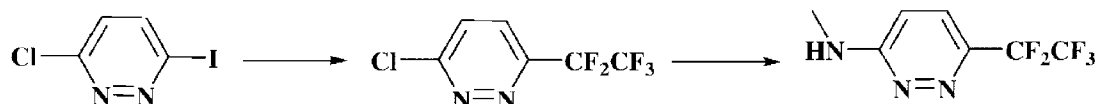
前記製造例1及び2に従って製造した3-エチルチオ-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル (214 mg、0.754 mmol)に、LiOH·H₂O (38.0 mg、0.906 mmol)、THF (8 mL)、H₂O (2 mL)を加え、室温で12時間撹拌した。反応後、減圧濃縮し、MTBEで水層を洗浄した。水層を塩酸水溶液 (2 M)で中和し、析出した固体を濾過、乾燥させることで、3-エチルチオ-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸 (130 mg、0.506 mmol、67%)を得た。

物性：融点224 - 226℃

[0184] 中間体 (4a) の製造例1

3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジンの製造方法

[化26]



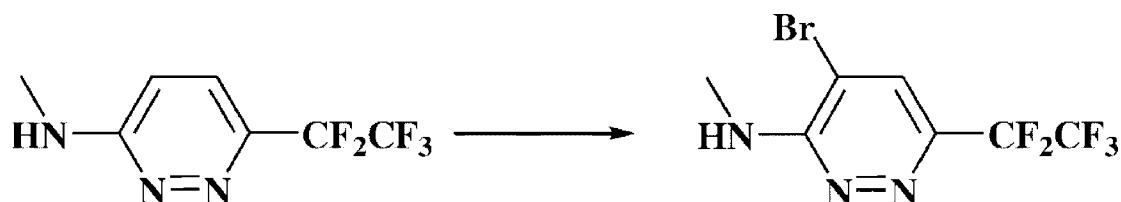
アルゴン下、文献記載の方法に従って合成した3-クロロ-6-ヨードピリダジン(7.2 g)、ヨウ化銅(2.86 g)、1,10-フェナントロリン(2.7 g)、及び日本化学会第94回春季年会要旨集(講演番号2B1-17、1229頁)に記載の方法により調整したビスフルオロアルキル亜鉛試薬のNMP(N-メチル-2-ピロリドン)溶液(ca 0.33 M、80 ml)を加え、90℃で40分攪拌した後、室温まで冷却した。別の容器に用意したTHF(30 ml)、メチルアミン(10 Mの30 mlメタノール溶液)の混合溶液に氷冷下、上述した反応溶液をゆっくりと滴下した。室温まで昇温し、1時間攪拌した。水及び酢酸エチルを加え、5分攪拌した後、混合溶液をセライトでろ過した。ろ液を酢酸エチルで3回抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン(6.36 g)を得た。

物性：融点：141 - 143℃

[0185] 中間体(4a)の製造例2

4-ブロモ-3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジンの製造方法

[化27]



3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン(6.05 g)を酢酸(50 ml)に溶解し、1,3-ジブロモ-5,5-ジメチルヒダントイン(8.4 g)を加え、95℃で3時間加熱攪拌した。反応溶液を濃縮し、水を加えた。炭酸カリウムで中和後、酢酸エチルで3回抽出した。有機相を硫

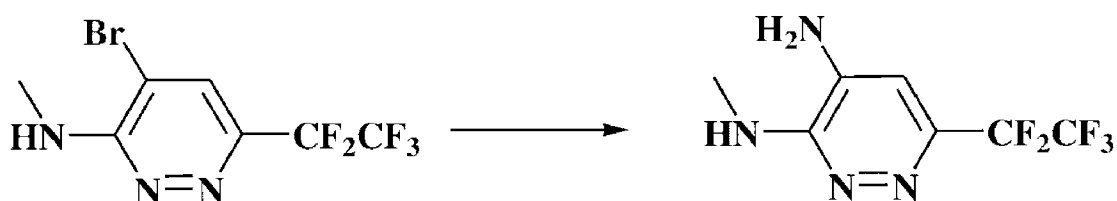
酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の 4 - ブロモ - 3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジン(6. 16 g、76%)を得た。

物性：融点：41 - 43℃

[0186] 中間体 (4 a) の製造例 3

4 - アミノ - 3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジンの製造方法

[化28]



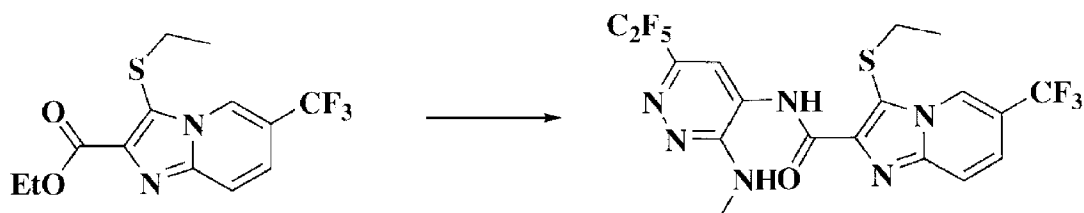
オートクレーブ中に 4 - ブロモ - 3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジン(6. 16 g)、酸化銅(Ⅰ)(1. 44 g)、NMP(30 ml)、28%アンモニア水(30 ml)を順次加え、アルゴンを吹き入れた後に密閉した。80℃で3時間加熱攪拌し、室温まで冷却した。水及び酢酸エチルを加え、5分攪拌した後、混合溶液をセライトでろ過した。ろ液を酢酸エチルで3回抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の 4 - アミノ - 3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジン(3. 39 g、69%)を得た。

物性：¹H - NMR(CDC l₃)：6. 75 (s、1H)、5. 18 (s、1H)、4. 59 (s、2H)、2. 85 (s、3H)

[0187] 参考例 1

N - (3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジン - 4 - イル) - 3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 2 - カルボン酸アミドの製造方法

[化29]



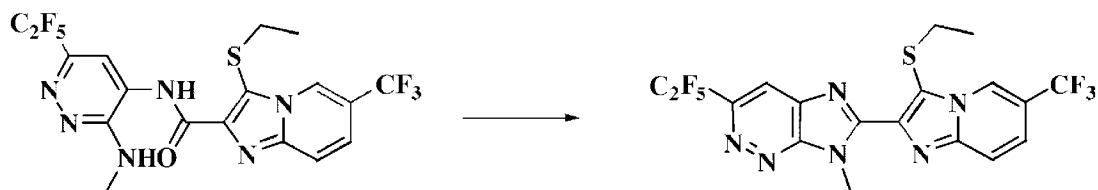
4 - アミノ - 3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジン (229 mg、0.943 mmol) を脱水 THF (10 mL) に溶解させ、NaH (60% in oil、41.5 mg、1.04 mmol) を加え、室温で 10 分間攪拌した。反応混合物に、前段階で得られた 2 - エトキシカルボニル - 3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン (300 mg、0.943 mmol) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、水でクエンチし、水、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、N - (3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジン - 4 - イル) - 3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボン酸アミド (362 mg、75%) を得た。

物性：融点 136 - 142 °C

[0188] 実施例 1

2 - (3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジンの製造方法 (化合物番号 1 - 127)

[化30]

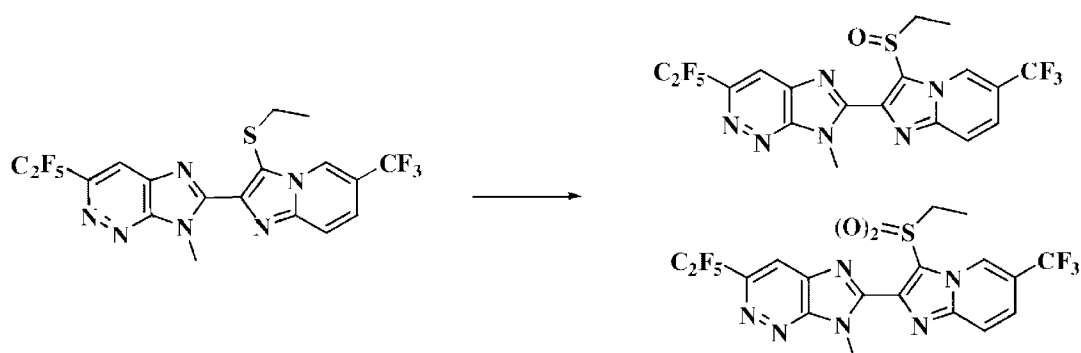


N - (3 - メチルアミノ - 6 - ペンタフルオロエチルピリダジン - 4 - イ

ル) - 3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 2 - カルボン酸アミド (212 mg、0.412 mmol) に、酢酸 (0.25 mL)、トルエン (2.5 mL) を加え、還流条件下で2時間撹拌した。反応後、酢酸およびトルエンを減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2 - (3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリダジン (188 mg、92%) を得た。

[0189] 実施例2

2 - (3 - エチルスルフィニル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリダジン (化合物番号1 - 128) 及び2 - (3 - エチルスルホニル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリダジン (化合物番号1 - 129) の製造方法 [化31]



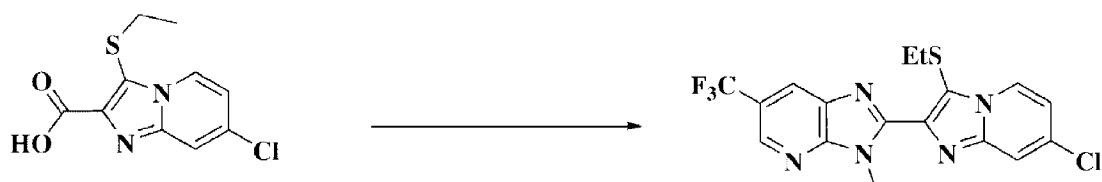
2 - (3 - エチルチオ - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3H - イミダゾ[4, 5 - c]ピリダジン (66 mg、0.133 mmol) を酢酸エチル (1.3 mL) に溶解させ、m - CPBA (ca. 70%、55.7 mg、0.226 mmol) を加え、室温で1時間撹拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、ハイポ水溶液でクエンチし、飽和重曹水、飽和食塩水で

有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2 - (3 - エチルスルホニル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン (18.7 mg、27%) および、2 - (3 - エチルスルフィニル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリダジン (37.1 mg、55%) を得た。

[0190] 実施例 3

2 - (3 - エチルチオ - 7 - クロロイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (化合物番号 2 - 127) の製造方法

[化32]



3 - エチルチオ - 7 - クロロイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボン酸 (63.0 mg、0.246 mmol) に、DMF (N,N-ジメチルホルムアミド) (0.020 mL)、CHCl₃ (2.5 mL)、塩化オキザリル (62.4 mg、0.492 mmol) を加え、室温で30分間攪拌した。反応後、減圧留去し、残渣にN² - メチル - 5 - トリフルオロメチルピリジン - 2, 3 - ジアミン (50.5 mg、0.246 mmol)、Et₃N (99.6 mg、0.984 mmol)、THF (2.5 mL) 加え、室温で1時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で有機層を洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣に、PTS (パラトルエンスルホン酸・H₂O (140 mg、0.738 mmol)、NMP (1.2 mL) を加え、150℃で2時間攪拌した。反応後、酢酸エチル

で希釈し、水、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2 - (3 - エチルチオ - 7 - クロロイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (45.4 mg、0.102 mmol、42%) を得た。

物性：融点 218 - 220 °C

[0191] 実施例 4

2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - クロロイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (化合物番号 2 - 129) の製造方法

[化33]



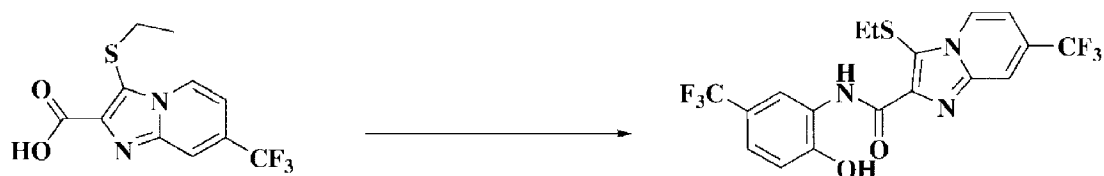
2 - (3 - エチルチオ - 7 - クロロイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (37.3 mg、0.0906 mmol) を AcOEt (0.9 mL) に溶解させ、m-CPBA (ca. 70%、55.9 mg、0.226 mmol) を加え、室温で 12 時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、ハイポ水溶液でクエンチし、飽和重曹水、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - クロロイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (39.2 mg、0.0883 mmol、98%) を得た。

物性：融点 211 - 214 °C

[0192] 参考例 2

3 - エチルチオ - N - (2 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル) - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキサミドの製造方法

[化34]



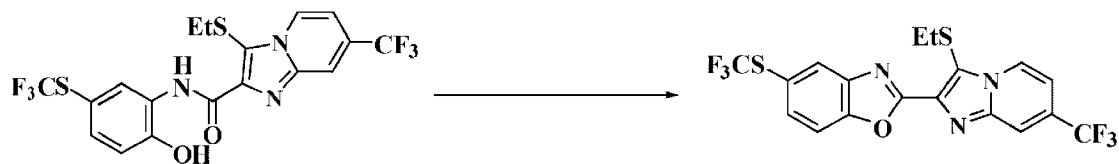
3 - エチルチオ - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボン酸 (151 mg、0.520 mmol) に、DMF (0.040 mL)、CHCl₃ (6.0 mL)、塩化オキサリル (132 mg、1.04 mmol) を加え、室温で30分間攪拌した。反応後、減圧留去し、残渣に2 - アミノ - 4 - (トリフルオロメチルチオ) フェノール (109 mg、0.520 mmol)、Et₃N (210 mg、2.08 mmol)、THF (6.0 mL) 加え、室温で1時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で有機層を洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、3 - エチルチオ - N - (2 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル) - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキサミド (112 mg、0.232 mmol、45%) を得た。

物性：融点 217 - 219℃

[0193] 実施例 5

2 - (3 - エチルチオ - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチルチオベンゾ [d] オキサゾール (化合物番号 6 - 16) の製造方法

[化35]



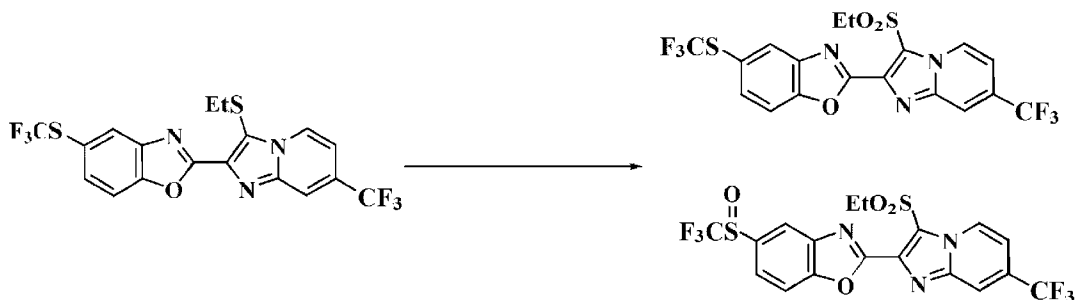
3 - エチルチオ - N - (2 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル) - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキサミド (87.4 mg, 0.182 mmol) に、トリフェニルホスフィン (52.5 mg, 0.200 mmol)、アゾジカルボン酸ジメトキシエチル (DMEAD) (46.8 mg, 0.200 mmol)、THF (2.0 mL) 加え、還流条件下で2時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で有機層を洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2 - (3 - エチルチオ - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチルチオベンゾ [d] オキサゾール (67.3 mg, 0.145 mmol, 80%) を得た。

物性：融点 146 - 148℃

[0194] 実施例 6

2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチルチオベンゾ [d] オキサゾール (化合物番号 6 - 18) および 2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチルスルフィニルベンゾ [d] オキサゾール (化合物番号 6 - 27) の製造方法

[化36]



2 - (3 - エチルチオ - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチルチオベンゾ [d] オキサゾール (50.0 mg、0.104 mmol) を AcOEt (5 mL) に溶解させ、m-CPBA (ca. 70%、121 mg、0.491 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、ハイポ水溶液でクエンチし、飽和重曹水、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチルチオベンゾ [d] オキサゾール (35.5 mg、0.0691 mmol、66%)、および2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - トリフルオロメチルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチルスルフィニルベンゾ [d] オキサゾール (6.0 mg、0.0113 mmol、11%) を得た。

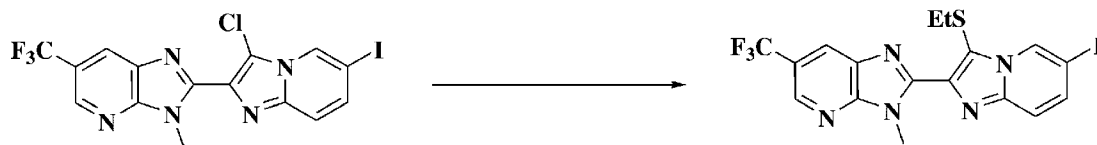
物性：6 - 18 融点 230 - 232℃

物性：6 - 27 融点 165 - 168℃

[0195] 実施例7

2 - (3 - エチルチオ - 6 - ヨードイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (化合物番号2 - 13) の製造方法

[化37]



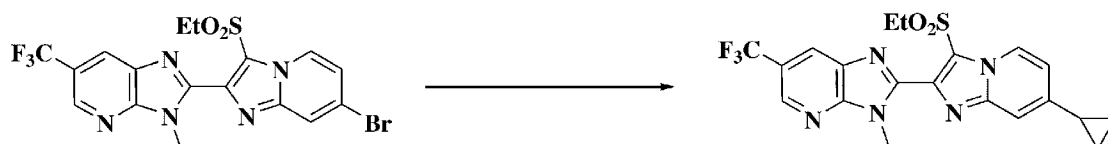
参考例 1 及び実施例 1 の方法により製造した 2 - (3 - クロロ - 6 - ヨードイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (67.0 mg, 0.140 mmol) に、NaSEt (35.3 mg, 0.420 mmol)、DMA (5 mL) を加え、150 °C で 1 時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で有機層を洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2 - (3 - エチルチオ - 6 - ヨードイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (25.0 mg, 36%) を得た。

物性：融点 249 - 251 °C

[0196] 実施例 8

2 - (7 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (化合物番号 2 - 243) の製造方法

[化38]



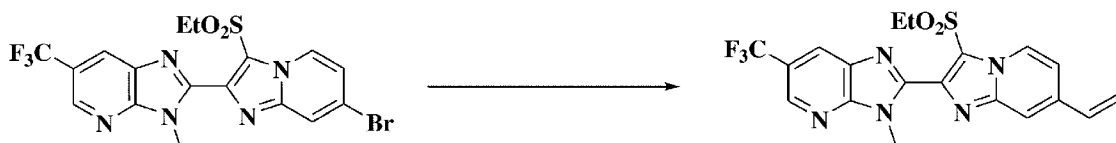
前記実施例 4 に従って製造した 2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - ブロモイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (16.0 mg, 0.0328 mmol) に、シクロプロピルボロン酸 (4.2 mg, 0.0492 mmol)、PdCl₂(dppf)・acetone adduct (5

、2 mg, 0.00656 mmol)、 K_3PO_4 (13.9 mg, 0.0656 mmol)、トルエン (1 mL)、 H_2O (0.25 mL) を加え、90 °C で1時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、セライトろ過し、水、飽和食塩水で有機層を順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2 - (7 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (10.2 mg, 69%) を得た。

物性：融点 169 - 171 °C

[0197] 実施例9

2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - ビニルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (化合物番号2-381) の製造方法
[化39]



実施例4の方法に従って製造した2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - ブロモイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (182 mg, 0.373 mmol) に、 CH_2CHBF_3K (99.9 mg, 0.746 mmol)、 $PdCl_2(dppf) \cdot acetone adduct$ (28.4 mg, 0.0373 mmol)、 Cs_2CO_3 (243 mg, 0.746 mmol)、DME (1, 2 - ジメトキシエタン) (3.2 mL)、 H_2O (0.8 mL) を加え、還流条件下で1時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、セライトろ過し、水、飽和食塩水で有機層を順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した後、残渣をシリカゲルカラム

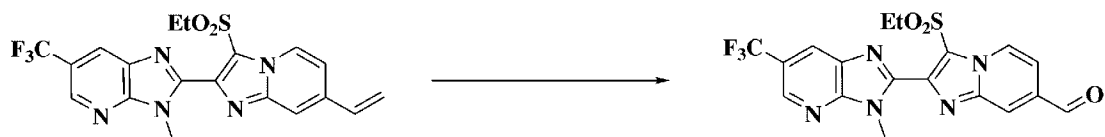
クロマトグラフィーで精製することで、2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - ビニルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (74.9 mg、46%) を得た。

物性：融点 195 - 197 °C

[0198] 実施例 10

3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - カルボキシアルデヒドの製造方法

[化40]



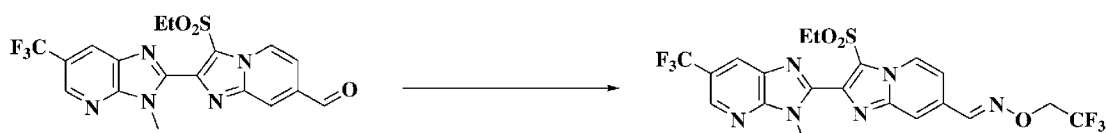
2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - ビニルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (67.0 mg, 0.148 mmol) に、NMO (N-メチルモルホリン N-オキシド) (50% in H₂O, 104 mg, 0.444 mmol)、THF (4 mL)、pH7 buffer 水溶液 (2 mL)、OsO₄ (0.039 min t - BuOH、0.6 mL, 0.0234 mmol) を加え、室温で24時間攪拌した。その後NaIO₄ (38.0 mg, 0.178 mmol) を加え、室温で2時間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、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させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - カルボキシアルデヒド (41.0 mg, 59%) を得た。

物性：融点 184 - 186 °C

[0199] 実施例 1 1

(E) - 3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル)イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - カルボキシアルデヒド O - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) オキシム (化合物番号 2 - 3 9 0) の製造方法

[化41]



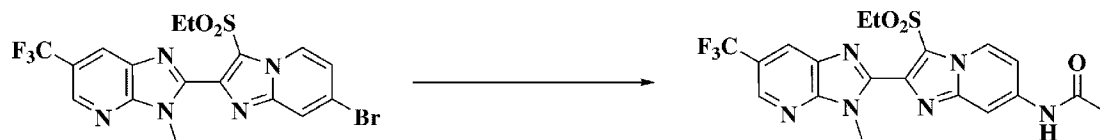
3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - カルボキシアルデヒド (13.0 mg, 0.0297 mmol) に、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{ONH}_2 \cdot \text{HCl}$ (6.3 mg, 0.0416 mmol)、ピリジン (3.4 mg, 0.0416 mmol)、 CHCl_3 (1 mL)、を加え、室温で24時間攪拌した。反応後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、(E) - 3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル)イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - カルボキシアルデヒド O - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) オキシム (14.0 mg、83%) を得た。

物性：融点 235 - 237 °C

[0200] 実施例 1 2

N - (3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル)イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - イル) アセトアミド (化合物番号 2 - 1 6 2) の製造方法

[化42]



前記実施例4の方法に従って製造した2-(3-エチルスルホニル-7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(31.0 mg, 0.0635 mmol)に、アセトアミド(7.5 mg, 0.127 mmol)、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ (5.8 mg, 0.00635 mmol)、Xantphos(8.8 mg, 0.0152 mmol)、 Cs_2CO_3 (41.4 mg, 0.127 mmol)、トルエン(1 mL)を加え、還流条件下で2時間撹拌した。反応後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、N-(3-(エチルスルホニル)-2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)アセトアミド(11.0 mg, 25%)を得た。

物性： $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 9.12 (d, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.45 (br, 1H), 7.24 (d, 1H), 4.14 (s, 3H), 3.97 (q, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)

[0201] 実施例13

3-(エチルスルホニル)-2-(3-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-アミン(化合物番号2-261)の製造

[化43]



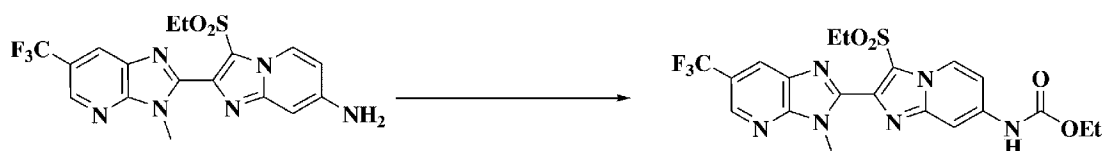
N - (3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - イル) アセトアミド (91.0 mg, 0.213 mmol) に、MeOH (1 mL)、2 M の塩酸水溶液 (1.2 mL)、水 (0.1 mL) を加え、還流条件下で 2 時間撹拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、飽和重曹水で中和し、水、飽和食塩水で有機層を順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - アミン (61.8 mg, 75%) を得た。

物性：融点 171 - 175 °C

[0202] 実施例 14

エチル - (3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - イル) カーバメイト (化合物番号 2-409) の製造方法

[化44]



3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - アミン (23.0 mg, 0.0504 mmol) に、ClCOOEt (27.3 mg, 0.252 mmol)、THF (1.5 mL)、飽和重曹水 (1.5 mL) を加え、室温で 2 時間撹拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で有機層を洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト

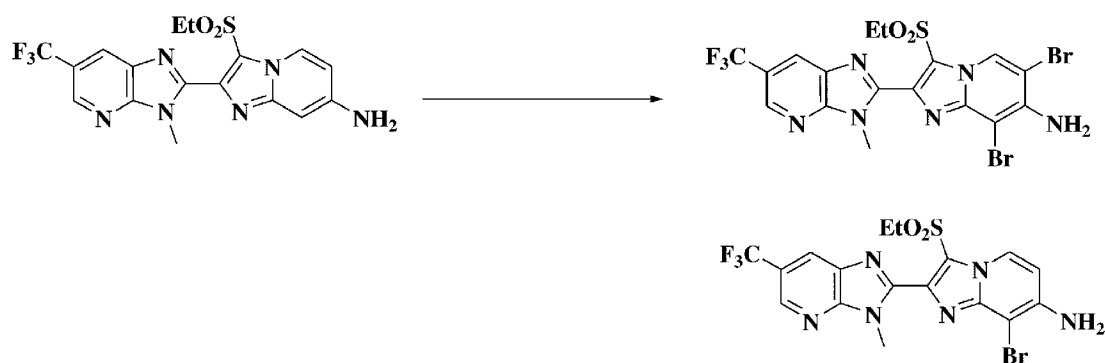
グラフィーで精製することで、エチル（３－（エチルスルホニル）－２－（３－メチル－６－（トリフルオロメチル）－３Ｈ－イミダゾ〔４，５－ｂ〕ピリジン－２－イル）イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－７－イル）カーバメート（５．０ ｍｇ、２０％）を得た。

物性：融点 １９５－１９８℃

[0203] 実施例 １５

８－ブロモ－３－（エチルスルホニル）－２－（３－メチル－６－（トリフルオロメチル）－３Ｈ－イミダゾ〔４，５－ｂ〕ピリジン－２－イル）イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－７－アミン（化合物番号８－３）、及び６，８－ジブロモ－３－（エチルスルホニル）－２－（３－メチル－６－（トリフルオロメチル）－３Ｈ－イミダゾ〔４，５－ｂ〕ピリジン－２－イル）イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－７－アミン（化合物番号８－６）の製造方法

[化45]



前記実施例 １３の方法に従って製造した３－（エチルスルホニル）－２－（３－メチル－６－（トリフルオロメチル）－３Ｈ－イミダゾ〔４，５－ｂ〕ピリジン－２－イル）イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－７－アミン（１８．０ ｍｇ、０．０４２４ ｍｍｏｌ）にＤＢＨ（７．３ ｍｇ、０．０２５４ ｍｍｏｌ）、ＡｃＯＨ（１ ｍＬ）を加え、９０℃で３０分間攪拌した。反応後、酢酸エチルで希釈し、ハイポ水溶液でクエンチし、飽和重曹水、飽和食塩水で有機層を洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、８－

ブロモ - 3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - アミン (3.7 mg, 17%)、および 6, 8 - ジブロモ - 3 - (エチルスルホニル) - 2 - (3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 7 - アミン (1.1 mg, 4%) を得た。

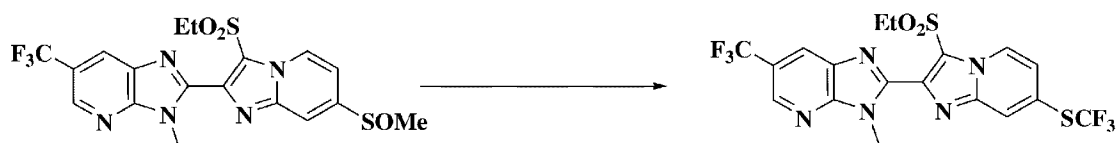
物性：8 - 3 融点 131 - 135 °C

8 - 6 ¹H - NMR (CDCl₃) : 9.28 (s, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 5.24 (br, 2H), 4.16 (s, 3H), 3.97 (q, 2H), 1.43 (t, 3H)

[0204] 実施例 16

2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - (トリフルオロメチルチオ) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (化合物番号 2 - 150) の製造方法

[化46]



2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - (メチルスルフィニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (16.0 mg, 0.0339 mmol) に、THF (1 mL)、TFAA (無水トリフルオロ酢酸) (1 mL) を加え、40 °C で 1 時間攪拌した。反応後、減圧留去し、MeOH (1 mL)、及び Et₃N (1 mL) を加え、室温で 30 分間攪拌した。反応後、減圧留去し、1-Trifluoromethyl-1,2-benziodoxol-3(1H)-one (11.8 mg, 0.0373 mmol)、CHCl₃ (1 mL) を加え、室温で 30 分間攪拌した。反応後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー

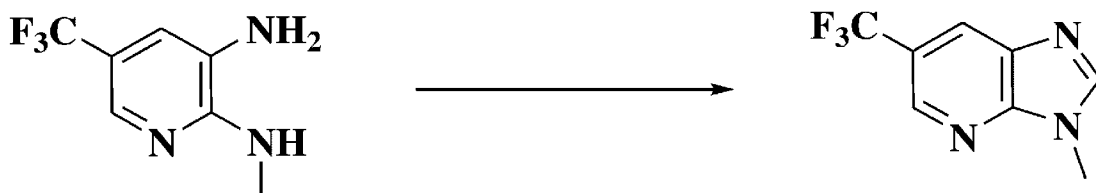
で精製することで、2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - (トリフルオロメチルチオ) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (6. 3 mg, 37%) を得た。

物性：融点 222 - 225 °C

[0205] 参考例 3

6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジンの製造方法

[化47]



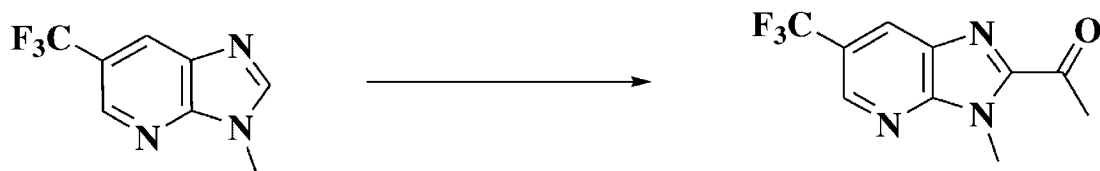
3 - アミノ - 2 - アミノメチル - 5 - トリフルオロメチルピリジン (6. 06 g)、p - トルエンスルホン酸一水和物 (2 g) 及びオルトギ酸トリメチル (20 mL) の混合物を 2 時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却し、飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (2. 7 g) を得た。

物性：¹H - NMR (CDCl₃) : 8. 70 (d、1 H)、8. 32 (d、1 H)、8. 17 (s、1 H)、3. 98 (s、3 H)

[0206] 参考例 4

2 - アセチル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジンの製造方法

[化48]



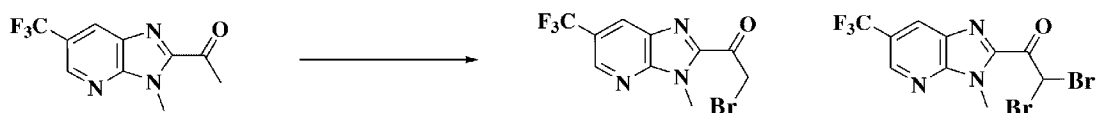
アルゴン下、6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (502 mg) を THF (10 mL) に溶解し、 -78°C に冷却した。1. 13 M リチウムジイソプロピルアミドのテトラヒドロフラン溶液 (2.5 mL) を加え、30 分撹拌した後、ジメチルアセトアミド (0.5 mL) を加え、室温で 30 分撹拌した。反応溶液を濃縮し、ヘキサン - 酢酸エチル (5 : 1) 溶液で洗浄し、目的の 2 - アセチル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (467 mg) を得た。

物性： ^1H -NMR (CDCl_3) : 8.83 (d、1H)、8.43 (d、1H)、4.23 (s、3H)、2.86 (s、3H)

[0207] 参考例 5

2 - (2 - ブロモアセチル) - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、および 2 - (2, 2 - ジブロモアセチル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジンの製造方法

[化49]



2 - アセチル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (74 mg) を酢酸 (1 mL) に溶解し、臭素 (52 mg) を加えた。100 $^{\circ}\text{C}$ で 30 分撹拌した後、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の 2 - (2 - ブロモアセチル) - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (22 mg) 及び 2 - (2, 2 - ジブロモアセチル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (31 mg) をそれぞれ得た。

2 - (2 - ブロモアセチル) - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5 - b] ピリジン : 物性： ^1H -NMR (CDCl_3) : 8.86 (d、1H)、8.46 (d、1H)、4.85 (s、2H)、4.25 (s、3H)

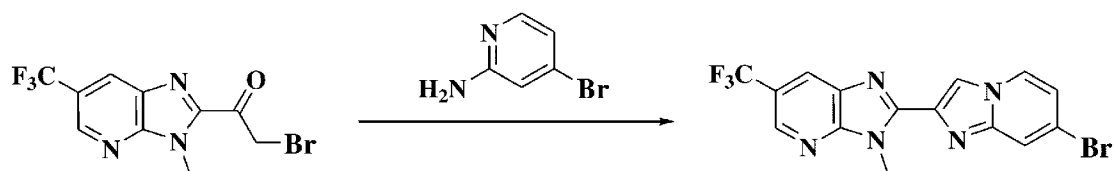
2 - (2, 2 - ジブロモアセチル - 6 - トリフルオロメチルイミダゾ [4, 5

- b]ピリジン：物性： ^1H -NMR(CDCl_3)：8.88 (d、1H)、8.48 (d、1H)、7.52 (s、2H)、4.29 (s、3H)

[0208] 参考例6

2-(7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルイミダゾ[4,5-b]ピリジンの製造方法

[化50]



前記参考例5の方法で製造した2-(2-ブロモアセチル)-6-トリフルオロメチルイミダゾ[4,5-b]ピリジン(200mg)及び2-アミノ-4-ブロモピリジン(124mg)をエタノール(3mL)に溶解した。加え、1時間加熱還流した。沈殿物をろ過し、エタノールで洗浄し、目的の2-(7-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-6-トリフルオロメチルイミダゾ[4,5-b]ピリジン(121mg)を得た。

物性： ^1H -NMR(CDCl_3)：8.68 (s、1H)、8.46 (s、1H)、8.24 (s、1H)、8.13 (d、1H)、7.90 (s、1H)、7.04 (d、1H)、4.44 (s、3H)

[0209] 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。

[0210] 製剤例1.

本発明化合物	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ニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

[0211] 製剤例 2.

本発明化合物	3 部
クレー粉末	8 2 部
珪藻土粉末	1 5 部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。	

[0212] 製剤例 3.

本発明化合物	5 部
ベントナイトとクレーの混合粉末	9 0 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。	

[0213] 製剤例 4.

本発明化合物	2 0 部
カオリンと合成高分散珪酸	7 5 部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5 部
以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。	

[0214] 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。

[0215] 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 c m、高さ 8 c m 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) で表される縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて 5 0 0 p p m 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。

[0216]

[数1]

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

[0217] T_a : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C_a : 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

[0218] 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%

[0219] その結果、本発明化合物の 1-7、1-9、1-10、1-12、1-121、1-123、1-124、1-126、1-127、1-128、1-129、1-130、1-132、1-298、1-300、1-352、1-354、2-1、2-3、2-7、2-9、2-10、2-11、2-12、2-13、2-15、2-16、2-18、2-124、2-126、2-127、2-129、2-132、2-141、2-144、2-162、2-168、2-235、2-237、2-238、2-240、2-243、2-244、2-246、2-249、2-250、2-252、2-255、2-258、2-261、2-264、2-267、2-270、2-273、2-276、2-279、2-282、2-285、2-390、3-1、3-3、3-4、3-6、4-1、4-3、4-7、4-9、4-10、4-12、4-13、4-15、4-18、4-19、4-21、4-24、5-1、5-3、6-1、6-3、6-4、6-6、6-9、6-16、6-18、6-27、7-37、7-39、8-3、8-6、8-9、8-31、及び 8-33 は、A の活性を示した。

[0220] 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) で表される縮合複素環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。

[0221] [数2]

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

[0222] その結果、本発明化合物の1-7、1-9、1-10、1-12、1-121、1-123、1-124、1-126、1-127、1-128、1-129、1-130、1-132、1-298、1-300、1-352、1-354、2-1、2-3、2-7、2-9、2-10、2-11、2-12、2-13、2-15、2-16、2-18、2-124、2-126、2-127、2-129、2-132、2-141、2-144、2-162、2-168、2-235、2-237、2-238、2-240、2-243、2-244、2-246、2-249、2-250、2-252、2-255、2-258、2-261、2-264、2-267、2-270、2-273、2-276、2-279、2-282、2-285、2-390、3-1、3-3、3-4、3-6、4-1、4-3、4-7、4-9、4-10、4-12、4-13、4-15、4-18、4-19、4-21、4-24、5-1、5-3、6-1、6-3、6-4、6-6、6-9、6-16、6-18、6-27、7-37、7-39、8-3、8-6、8-9、8-31、及び8-33は、Aの活性を示した。

[0223] 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)で表される縮合複素環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 1 0 頭 3 連制。

[0224] [数3]

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

[0225] その結果、本発明化合物の 1 - 7、1 - 9、1 - 10、1 - 12、1 - 121、1 - 123、1 - 124、1 - 126、1 - 127、1 - 128、1 - 129、1 - 130、1 - 132、1 - 298、1 - 300、1 - 352、1 - 354、2 - 1、2 - 3、2 - 7、2 - 9、2 - 10、2 - 11、2 - 12、2 - 13、2 - 15、2 - 16、2 - 18、2 - 124、2 - 126、2 - 127、2 - 129、2 - 132、2 - 141、2 - 144、2 - 162、2 - 168、2 - 235、2 - 237、2 - 238、2 - 240、2 - 243、2 - 244、2 - 246、2 - 249、2 - 250、2 - 252、2 - 255、2 - 258、2 - 261、2 - 264、2 - 267、2 - 270、2 - 273、2 - 276、2 - 279、2 - 282、2 - 285、2 - 390、3 - 1、3 - 3、3 - 4、3 - 6、4 - 1、4 - 3、4 - 7、4 - 9、4 - 10、4 - 12、4 - 13、4 - 15、4 - 18、4 - 19、4 - 21、4 - 24、5 - 1、5 - 3、6 - 1、6 - 3、6 - 4、6 - 6、6 - 9、6 - 16、6 - 18、6 - 27、7 - 37、7 - 39、8 - 3、8 - 6、8 - 9、8 - 31、及び 8 - 33 は、A の活性を示した。

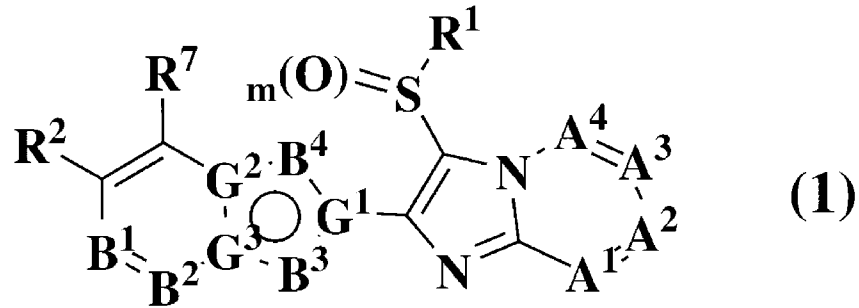
産業上の利用可能性

[0226] 本発明に係る化合物は、幅広い農園芸分野の害虫に対して優れた防除効果を有しており、有用である。

請求の範囲

[請求項1]

[化1]



{式中、 R^1 は、

- (a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；
- (a2) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基；
- (a3) ($C_2 - C_6$) アルケニル基；又は
- (a4) ($C_2 - C_6$) アルキニル基；を示す。

R^2 は、

- (b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；
- (b2) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；
- (b3) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；
- (b4) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；又は
- (b5) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；を示す。

A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 は、同一又は異なってもよく、窒素原子、又はC - R^3 を示し、 B^1 及び B^2 は、窒素原子、又はC - R^4 を示し、 B^3 及び B^4 は、窒素原子、N - R^5 、C - R^6 、酸素原子、又は硫黄原子を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 は、窒素原子、又は炭素原子を示す。

R^3 は、

- (c1) 水素原子；
- (c2) ハロゲン原子；
- (c3) シアノ基；
- (c4) ニトロ基；

- (c5) ($C_1 - C_6$) アルキル基；
- (c6) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基；
- (c7) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；
- (c8) ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基；
- (c9) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；
- (c10) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；
- (c11) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；
- (c12) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；
- (c13) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；
- (c14) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；
- (c15) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；
- (c16) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基；
- (c17) ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基；
- (c18) R^8 (R^9) N基 (式中、 R^8 及び R^9 は同一又は異なっても良く、水素原子、($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_2 - C_6$) アルケニル基、($C_2 - C_6$) アルキニル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル基、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基、フェニル基、($C_1 - C_6$) アルコキシフェニル基、又はフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。)；
- (c19) $C(R^{10}) = NOR^{11}$ 基 (式中、 R^{10} 及び R^{11} は同一又は異なっても良く、水素原子、($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_2 - C_6$) アルケニル基、($C_2 - C_6$) アルキニル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル

基、フェニル基、又はフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。)

;

(c20) フェニル基 ;

(c21) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) ホルミル基、(e) ($C_1 - C_6$) アルキル基、(f) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(h) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(k) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(n) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基、及び(o) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基からなる群から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基 ;

(c22) フェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;

(c23) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) ホルミル基、(e) ($C_1 - C_6$) アルキル基、(f) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(h) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(k) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(n) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基、及び(o) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基からなる群から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;

(c24) R^8 (R^9) Nカルボニル基 (式中、 R^8 及び R^9 は、前記と同じ。)

(c25) ($C_2 - C_6$) アルケニル基 ;

(c26) フェニル ($C_2 - C_6$) アルキニル基 ;

(c27) (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキルチオ基 ;

(c28) (C₃ - C₆) シクロアルキルチオ基 ;

(c29) フェニル (C₁ - C₆) アルキルチオ基 ;

(c30) カルボキシ基 ;

(c31) C (NH₂) = NOR¹⁰基 (式中、R¹⁰は、水素原子、(C₁ - C₆) アルキル基、(C₂ - C₆) アルケニル基、(C₂ - C₆) アルキニル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基、(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基、フェニル基、又はフェニル (C₁ - C₆) アルキル基を示す。) ;

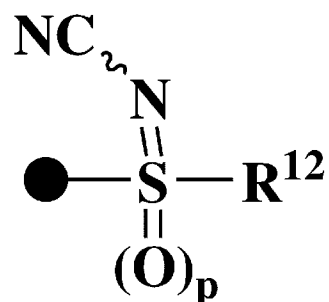
(c32) 複素環基 ;

(c33) 複素環チオ基 ;

(c34) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) ホルミル基、(e) (C₁ - C₆) アルキル基、(f) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(g) (C₁ - C₆) アルコキシ基、(h) ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基、(i) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルコキシ基、(j) (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(k) ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基、及び(o) ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基からなる群から選択される 1 ~ 2 の置換基を環上に有する複素環チオ基 ;

(c35)

[化2]



(式中、 R^{12} は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル基、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基、又はハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基を示し、 p は、0又は1を示す。)；又は(c36)ホルミル基；を示す。

R^5 は、(d1)水素原子；(d2) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；(d3) $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；又は(d4)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；を示す。

R^4 、 R^6 及び R^7 は、同一又は異なってもよく、(e1)水素原子；(e2)ハロゲン原子；(e3)シアノ基；(e4)ニトロ基；(e5) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；又は(e6) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ基；を示す。 m は0、1、又は2を示す。} で表わされる縮合複素環化合物又はその塩。

[請求項2]

A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $\text{C} - \text{R}^3$ (式中、 R^3 は、前記と同じ。)を示し、 B^1 が $\text{C} - \text{R}^4$ (式中、 R^4 は、前記と同じ。)を示し、 B^2 が、窒素原子、 B^3 が $\text{N} - \text{R}^5$ (式中、 R^5 は、前記と同じ。)を示し、 B^4 が、窒素原子を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を示す、請求項1に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

[請求項3]

R^1 が、(a1) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；を示し、

R^3 が、(c1)水素原子；(c2)ハロゲン原子；(c6) $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル基；(c9)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル基；(c10)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ基；(c14)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルチオ基；(c15)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルスルフィニル基；(c16)ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$

アルキルスルホニル基；(c18) R^8 (R^9) N基（式中、 R^8 と R^9 は前記と同じ。））、又は(c19) $C(R^{10})=NOR^{11}$ 基（式中、 R^{10} と R^{11} は前記と同じ。））を示し、 R^5 が、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 R^4 及び R^7 が、(e1)水素原子；を示す、請求項1又は2に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

[請求項4] R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 A^1 、 A^3 及び A^4 が、 $C-H$ を示し、 A^2 が $C - R^3$ （式中、 R^3 は、(c6) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基；を示す。））を示す、請求項1乃至3のいずれか一項に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

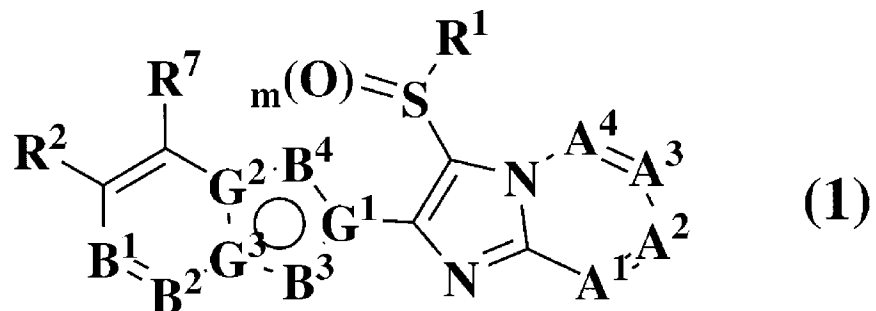
[請求項5] R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 A^1 、 A^3 及び A^4 が、 $C-H$ を示し、 A^2 が $C - R^3$ （式中、 R^3 は、シクロプロピル基；を示す。））を示す、請求項1乃至3のいずれか一項に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

[請求項6] 請求項1乃至5のいずれか一項に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

[請求項7] 請求項6に記載の農園芸用殺虫剤の有効量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。

[請求項8] 請求項1乃至5のいずれか一項に記載の化合物又はその塩の有効量を有効成分として含有することを特徴とする哺乳動物外部寄生虫防除剤。

[請求項9] [化3]



{式中、 R^1 は、(a1) $(C_1 - C_6)$ アルキル基；(a2) $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル基；(a3) $(C_2 - C_6)$ アルケニル基；又は(a4) $(C_2 - C_6)$ アルキニル基；を示す。

R^2 は、(b1) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基；(b2) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基；(b3) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基；(b4) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基；又は(b5) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基；を示す。

A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 は、同一又は異なってもよく、窒素原子、又は $C - R^3$ を示し、 B^1 及び B^2 は、窒素原子、又は $C - R^4$ を示し、 B^3 及び B^4 は、窒素原子、 $N - R^5$ 、又は $C - R^6$ を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 は、窒素原子、又は炭素原子を示す。

R^3 は、(c1)水素原子；(c2)ハロゲン原子；(c3)シアノ基；(c4)ニトロ基；(c5) $(C_1 - C_6)$ アルキル基；(c6) $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル基、(c7) $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基；(c8) $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、(c9)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基；(c10) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基；(c11) $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基；(c12) $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基；(c13) $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基；(c14)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基；(c15)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基；(c16)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基；(c17) $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル基；(c18) $R^8 (R^9) N$ 基（式中、 R^8 及び R^9 は同一又は異なってもよく水素原子、 $(C_1 - C_6)$ アルキル基、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル基、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル基、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル基、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル $(C_1 - C_6)$ アルキル基、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル基、フェニル基、又はフェニル $(C_1 - C_6)$ アルキル基を示す。）；(c19) $C (R^{10}) = N O R^{11}$ 基（式

中、 R^{10} 及び R^{11} は同一又は異なっても良く、水素原子、 $(C_1 - C_6)$ アルキル基、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル基、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル基、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル基、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル $(C_1 - C_6)$ アルキル基、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、フェニル基、又はフェニル $(C_1 - C_6)$ アルキル基を示す。) ; (c20)フェニル基 ; (c21)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) $(C_1 - C_6)$ アルキル基、(f)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、(g) $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、(h)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、(i) $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、(j) $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、(k)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、(l) $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基、(m)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基、(n) $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基、及び(o)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基からなる群から選択される1~5の置換基を環上に有するフェニル基 ; (c22)フェニル $(C_1 - C_6)$ アルキル基 ; (c23)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) $(C_1 - C_6)$ アルキル基、(f)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、(g) $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、(h)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、(i) $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基、(j) $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、(k)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、(l) $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基、(m)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル基、(n) $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基、及び(o)ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル基からなる群から選択される1~5の置換基を環上に有するフェニル $(C_1 - C_6)$ アルキル基 ; 又は(c24) R^8 (R^9) Nカルボニル基 (式中、 R^8 及び R^9 は、前記と同じ。) ; を示す。 R^5 は、(d1)水素原子 ; (d2) $(C_1 - C_6)$ アルキ

ル基；(d3)シクロ ($C_3 - C_6$) アルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基；
 又は(d4) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示す。 R^4 、 R^6 及び R^7
 は同一又は異なってもよく、(e1)水素原子；(e2)ハロゲン原子；(e3)
 シアノ基；(e4)ニトロ基；(e5) ($C_1 - C_6$) アルキル基；又は(e6)
 ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；を示す。 m は0、1、又は2を示す。
 } で表わされるイミダゾピリジン化合物又はその塩。

[請求項10] A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C - R^3$ (式中、 R^3 は、前記と同じ。
)を示し、 B^1 及び B^2 が、窒素原子、又は $C - R^4$ (式中、 R^4 は、
 前記と同じ。)を示し、 B^3 及び B^4 が、窒素原子、又は $N - R^5$ (式
 中、 R^5 は、前記と同じ。)を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を
 示す、請求項9に記載のイミダゾピリジン化合物又はその塩。

[請求項11] R^1 が、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 R^2 が、(b1) ハロ
 ($C_1 - C_6$) アルキル基；を示し、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C -$
 R^3 を示し、 B^1 及び B^2 が、窒素原子、又は $C - R^4$ (式中、 R^4 は、
 水素原子を示す。)を示し、 B^3 及び B^4 が、窒素原子、又は $N - R^5$
 (式中、 R^5 は、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。)を示し、 G
 ^{1} 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を示し、 R^3 が、(c1)水素原子；(c2)ハロ
 ゲン原子；(c3)シアノ基；(c5) ($C_1 - C_6$) アルキル基；(c7) (C_1
 $- C_6$) アルコキシ基；(c9)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基；(c10)ハロ
 ($C_1 - C_6$) アルコキシ基；(c11) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(c
 12) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；(c13) ($C_1 - C_6$) アル
 キルスルホニル基；(c14)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基；(c15)
 ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基；(c16)ハロ ($C_1 - C_6$)
 アルキルスルホニル基；(c17) ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基
 ；(c18) R^8 (R^9) N基 (式中、 R^8 及び R^9 は同一又は異なっても良
 く水素原子、($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_2 - C_6$) アルケニル基
 、($C_2 - C_6$) アルキニル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、(C
 $_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$)

アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル基、フェニル基、又はフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基を示す。) ; 又は(c24) R^8 (R^9) Nカルボニル基(式中、 R^8 及び R^9 は、請求項1に記載された R^8 及び R^9 と同じ。) ; を示し、 R^7 が、(e1)水素原子 ; を示す、請求項9又は10に記載のイミダゾピリジン化合物又はその塩。

[請求項12] R^1 が、(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示し、 R^2 が、(b1) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示し、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 が、 $C - R^3$ を示し、 B^1 及び B^2 が、窒素原子、又は $C - R^4$ を示し、 B^3 及び B^4 が、窒素原子、又は $N - R^5$ を示し、 G^1 、 G^2 及び G^3 が炭素原子を示し、 R^3 が、(c9)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示し、 R^5 が、(d2) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示す。 R^4 、及び R^7 が、(e1)水素原子 ; を示す、請求項9乃至11のいずれか一項に記載のイミダゾピリジン化合物又はその塩。

[請求項13] 請求項9乃至12のいずれか一項に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

[請求項14] 請求項9乃至12のいずれか一項に記載の化合物又はその塩の有効量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方法。

[請求項15] 請求項9乃至12のいずれか一項に記載の化合物又はその塩の有効量を有効成分として含有することを特徴とする哺乳動物外部寄生虫防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2016/079677

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D471/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, A61K31/437
(2006.01)i, A61K31/5025(2006.01)i, A61K31/519(2006.01)i, A61P33/14
(2006.01)i, C07D519/00(2006.01)i

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D471/04, A01N43/90, A01P7/04, A61K31/437, A61K31/5025, A61K31/519,
A61P33/14, C07D519/00

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

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2016
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2016	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2016

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2016/129684 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 18 August 2016 (18.08.2016), claims; pages 333 to 344, 346 (Family: none)	1-3, 6-15
P, A	WO 2016/142327 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG), 15 September 2016 (15.09.2016), claims (Family: none)	1-15
A	JP 2015-3906 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 08 January 2015 (08.01.2015), claims (Family: none)	1-15

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

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
20 October 2016 (20.10.16)

Date of mailing of the international search report
01 November 2016 (01.11.16)

Name and mailing address of the ISA/
Japan Patent Office
3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2016/079677

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 2015/000715 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG), 08 January 2015 (08.01.2015), claims; tables & JP 2016-528189 A & US 2016/0255837 A1 & EP 3016949 A1 & CN 105431433 A & KR 10-2016-0029078 A	1-15
A	WO 2013/180193 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 05 December 2013 (05.12.2013), claims & US 2015/0094329 A1 & EP 2857396 A1 & CN 104334552 A	1-15

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D471/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, A61K31/437(2006.01)i,
A61K31/5025(2006.01)i, A61K31/519(2006.01)i, A61P33/14(2006.01)i, C07D519/00(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D471/04, A01N43/90, A01P7/04, A61K31/437, A61K31/5025, A61K31/519, A61P33/14, C07D519/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2016年
日本国実用新案登録公報	1996-2016年
日本国登録実用新案公報	1994-2016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)

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
P, X	WO 2016/129684 A1 (日産化学工業株式会社) 2016.08.18, 請求の範囲、第 333-344, 346 頁 (ファミリーなし)	1-3, 6-15
P, A	WO 2016/142327 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2016.09.15, claims (ファミリーなし)	1-15

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの	「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
「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	「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
「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)	「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
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献	「&」 同一パテントファミリー文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願	

国際調査を完了した日

20. 10. 2016

国際調査報告の発送日

01. 11. 2016

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

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)

三上 晶子

4 P

4042

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 2015-3906 A (日本農薬株式会社) 2015.01.08, 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-15
A	WO 2015/000715 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2015.01.08, claims、Table & JP 2016-528189 A & US 2016/0255837 A1 & EP 3016949 A1 & CN 105431433 A & KR 10-2016-0029078 A	1-15
A	WO 2013/180193 A1 (住友化学株式会社) 2013.12.05, 請求の範囲 & US 2015/0094329 A1 & EP 2857396 A1 & CN 104334552 A	1-15