

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6547867号
(P6547867)

(45) 発行日 令和1年7月24日(2019.7.24)

(24) 登録日 令和1年7月5日(2019.7.5)

(51) Int.Cl.	F I
C O 7 D 413/04 (2006.01)	C O 7 D 413/04 C S P
C O 7 D 413/14 (2006.01)	C O 7 D 413/14
C O 7 D 471/04 (2006.01)	C O 7 D 471/04 I O 7 Z
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/444 (2006.01)	A 6 1 K 31/444

請求項の数 16 (全 106 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2018-46351 (P2018-46351)	(73) 特許権者	000002093
(22) 出願日	平成30年3月14日 (2018.3.14)		住友化学株式会社
(62) 分割の表示	特願2015-525247 (P2015-525247) の分割		東京都中央区新川二丁目2番1号
原出願日	平成26年6月25日 (2014.6.25)	(74) 代理人	100113000
(65) 公開番号	特開2018-115176 (P2018-115176A)		弁理士 中山 亨
(43) 公開日	平成30年7月26日 (2018.7.26)	(74) 代理人	100151909
審査請求日	平成30年3月27日 (2018.3.27)		弁理士 坂元 徹
(31) 優先権主張番号	特願2013-137783 (P2013-137783)	(72) 発明者	田邊 貴将
(32) 優先日	平成25年7月1日 (2013.7.1)		兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)	(72) 発明者	水野 肇
			兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内

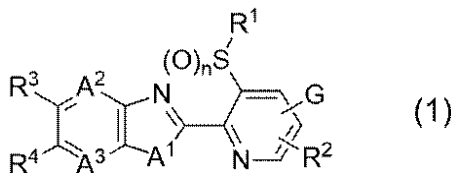
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 縮合複素環化合物及びその有害生物防除用途

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)



[式中、

A¹はNR⁵、酸素原子、又は硫黄原子を表し、

A²は窒素原子、又はCR⁶を表し、

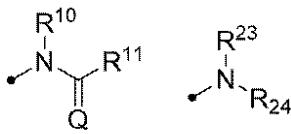
A³は窒素原子、又はCR⁷を表し、

R¹は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基を表し、

R²は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、OR⁸、S(O)_mR⁸、S(O)₂NR⁸R⁹、NR⁸R⁹、NR⁸CO₂R⁹、NR⁸C(O)R⁹、CO₂R⁸、C(O)R⁸、C(O)NR⁸R⁹、SF₅、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原

子、又は水素原子を表し、

Gは下式基G1、又は基G7



(G1)

(G7)

{式中、

Qは酸素原子、又は硫黄原子を表し、

R¹⁰は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、水素原子、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又はC(O)NR⁸R⁹を表し、

R¹¹はR²⁵、R²⁶、OR²⁷、OR²⁸、SR²⁹、NR³⁰R³¹、又はC(O)R³²を表し(ここで、R²⁵は、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表し、R²⁶は、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は水素原子を表し、R²⁷は、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表し、R²⁸は、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は水素原子を表し、R²⁹は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表し、R³⁰及びR³¹は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、SO₂R⁸、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又は水素原子を表し、R³²は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、OR⁸、NR⁸R⁹、又は水素原子を表す。)

10

20

30

40

R¹¹がR²⁵、OR²⁷、SR²⁹、NR³⁰R³¹、もしくはC(O)R³²を表す場合、

R¹⁰は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、水素原子、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又はC(O)NR⁸R⁹を表し、

R¹¹がR²⁶、もしくはOR²⁸を表す場合、

R¹⁰は群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化

50

水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、 CO_2R^8 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、又は $\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ を表し、

R^{23} は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表し、

R^{24} は群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表す。}を表し、

R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、 OR^8 、 $\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 NR^8R^9 、 $\text{NR}^8\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^9$ 、 CO_2R^8 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 SF_5 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、又は水素原子を表すか、又は、

R^3 と R^4 とが、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいベンゼン環、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環、又は群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5、6、7もしくは8員非芳香族環を形成し、

R^5 は群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1つのフェニル基を有するC1 - C6鎖式炭化水素基(ここで、該フェニル基は、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい)、5もしくは6員複素環基を1つ有するC1 - C6鎖式炭化水素基(ここで、該5もしくは6員複素環基は、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい)、 CO_2R^8 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は水素原子を表し、

R^6 及び R^7 は同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、 OR^8 、 $\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ 、 NR^8R^9 、 CO_2R^8 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、又は水素原子を表し、

R^8 及び R^9 は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表し、

mは、それぞれ独立して、0、1、又は2を表し、nは0、1、又は2を表す。ここで、 $\text{S}(\text{O})_m\text{R}^8$ において、mが1、又は2の場合には、 R^8 が水素原子を表すことはない。

群U：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子もしくは1以上のC1 - C3アルキル基を有していてもよいC3 - C9シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群V：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有し

10

20

30

40

50

ていてもよいC 2 - C 6 アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキニルオキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群W：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 8 ジアルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群。

10

群X：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3 - C 9 シクロアルキル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子及びシアノ基からなる群。

20

群Y：群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 3 - C 9 脂環式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルアミノスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 8 ジアルキルアミノスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 8 ジアルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルコキシカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルコキシカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルアミノカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3 - C 10 ジアルキルアミノカルボニル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

30

群Z：群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 8 ジアルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルコキシカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキルアミノカルボニル基、及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3 - C 10 ジアルキルアミノカルボニル基からなる群。]

40

で示される縮合複素環化合物、又はそのN - オキシド。

【請求項2】

R¹がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上のC 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい)、1以上の

50

ハロゲン原子を有していてもよいC₂-C₆アルケニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂-C₆アルキニル基、又は、ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁-C₆アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₃-C₆シクロアルキル基であり、

R²がハロゲン原子、又は水素原子であり、

R³及びR⁴が同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₁-C₆鎖式炭化水素基、OR⁸、S(O)_mR⁸、ハロゲン原子、又は水素原子であり、

R⁵が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₁-C₆鎖式炭化水素基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₃-C₉脂環式炭化水素基、又は水素原子である請求項1記載の化合物。

10

【請求項3】

A¹がNR⁵である請求項1または請求項2記載の化合物。

【請求項4】

A¹が酸素原子である請求項1または請求項2記載の化合物。

【請求項5】

A¹が硫黄原子である請求項1または請求項2記載の化合物。

【請求項6】

A²がCR⁶であり、A³が窒素原子である請求項1～請求項5のいずれかーに記載の化合物。

20

【請求項7】

A²がCR⁶であり、A³がCR⁷である請求項1～請求項5のいずれかーに記載の化合物。

【請求項8】

Gが基G₁である請求項1～請求項7のいずれかーに記載の化合物。

【請求項9】

Gが基G₇である請求項1～請求項7のいずれかーに記載の化合物。

【請求項10】

Gが基G₁であり、

R¹¹がR²⁵、OR²⁷、SR²⁹、NR³⁰R³¹、又はC(O)R³²である請求項1～請求項7のいずれかーに記載の化合物。

30

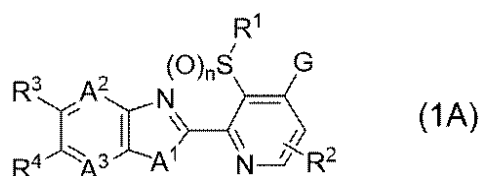
【請求項11】

Gが基G₁であり、

R¹¹がR²⁶、又はOR²⁸である請求項1～請求項7のいずれかーに記載の化合物。

【請求項12】

式(1A)

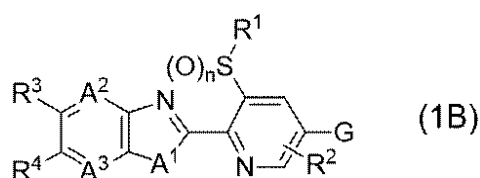


40

[式中、各記号は、請求項1に定義のとおり。]で示される化合物。

【請求項13】

式(1B)

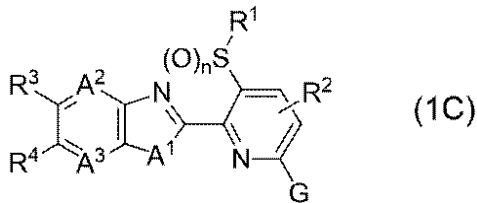


50

[式中、各記号は、請求項 1 に定義のとおり。]
 で示される化合物。

【請求項 1 4】

式 (1 C)



10

[式中、各記号は、請求項 1 に定義のとおり。]
 で示される化合物。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 請求項 1 4 のいずれか一に記載の化合物と不活性担体とを含有する有害生物防除剤。

【請求項 1 6】

請求項 1 ~ 請求項 1 4 いずれか一に記載の化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所 (但し、人体を除く。) に施用する有害生物の防除方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

20

【 0 0 0 1】

本発明は、ある種の縮合複素環化合物及びその有害生物防除用途に関する。

【背景技術】

【 0 0 0 2】

これまでに有害生物の防除を目的として、様々な化合物が検討されており、実用に供されている。

また、ある種の縮合複素環化合物 (例えば特許文献 1 参照) が知られている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【 0 0 0 3】

30

【特許文献 1】国際公開 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8 号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【 0 0 0 4】

本発明は、有害生物に対して優れた防除効力を有する化合物及びその化合物を用いた有害生物の防除方法を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

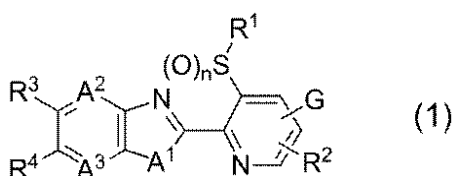
【 0 0 0 5】

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、下記式 (1) で示される縮合複素環化合物が有害生物に対して優れた防除効力を有することを見出し、本発明に至った

40

。即ち、本発明は次の以下の通りである。

[1] 式 (1)



[式中、

A¹ は N R⁵、酸素原子、又は硫黄原子を表し、

50

A^2 は窒素原子、又は CR^6 を表し、

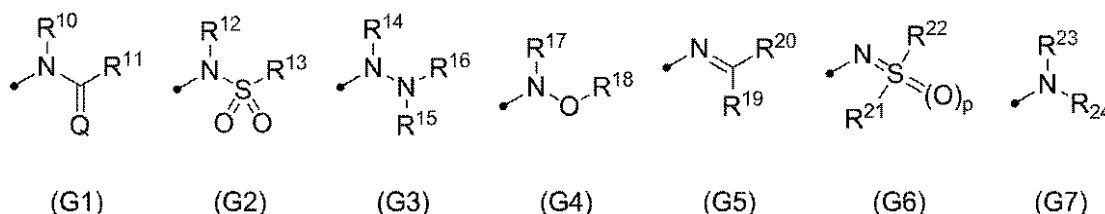
A^3 は窒素原子、又は CR^7 を表し、

R^1 は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基を表し、

R^2 は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、 $S(O)_2NR^8R^9$ 、 NR^8R^9 、 $NR^8CO_2R^9$ 、 $NR^8C(O)R^9$ 、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $C(O)NR^8R^9$ 、 SF_5 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、又は水素原子を表し、

10

Gは下式基G1、基G2、基G3、基G4、基G5、基G6、又は基G7



{ 式中、

Qは酸素原子、又は硫黄原子を表し、

20

pは0、又は1を表し、

R^{10} は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、水素原子、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、又は $C(O)NR^8R^9$ を表し、

R^{11} は R^{25} 、 R^{26} 、 OR^{27} 、 OR^{28} 、 SR^{29} 、 $NR^{30}R^{31}$ 、又は $C(O)R^{32}$ を表し(ここで、 R^{25} は、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表し、 R^{26} は、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は水素原子を表し、 R^{27} は、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表し、 R^{28} は、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は水素原子を表し、 R^{29} は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表し、 R^{30} 及び R^{31} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、 SO_2R^8 、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、又は水素原子を表し、 R^{32} は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、 OR^8 、 NR^8R^9 、又は水素原子を表す。)

30

40

50

R¹¹がR²⁵、OR²⁷、SR²⁹、NR³⁰R³¹、もしくはC(O)R³²を表す場合、

R¹⁰は群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、水素原子、群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又はC(O)NR⁸R⁹を表し、

R¹¹がR²⁶、もしくはOR²⁸を表す場合、

R¹⁰は群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又はC(O)NR⁸R⁹を表し、

R¹²は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、水素原子、SO₂R⁸、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又はC(O)NR⁸R⁹を表し、

R¹³は

R³³（ここで、R³³は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表す。）

OR³⁴（ここで、R³⁴は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。）

又はNR³⁵R³⁶（ここで、R³⁵及びR³⁶は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。）を表し、

R¹⁴及びR¹⁵は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、水素原子、SO₂R⁸、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又はC(O)NR⁸R⁹を表し、

R¹⁶は

R³⁷（ここで、R³⁷は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。）

C(O)R³⁸（ここで、R³⁸は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を

10

20

30

40

50

有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す)、

$C O_2 R^{39}$ (ここで、 R^{39} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す)、

$C(O)SR^{40}$ (ここで、 R^{40} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表す。)、

$C(O)NR^{41}R^{42}$ (ここで、 R^{41} 及び R^{42} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)、

$S O_2 R^{43}$ (ここで、 R^{43} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表す。)、

$S(O)_2OR^{44}$ (ここで、 R^{44} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表す。)、

又は $S(O)_2NR^{45}R^{46}$ (ここで、 R^{45} 及び R^{46} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)を表し、

R^{17} は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、水素原子、 $S O_2 R^8$ 、 $C O_2 R^8$ 、 $C(O)R^8$ 、又は $C(O)NR^8R^9$ を表し、

R^{18} は

R^{47} (ここで、 R^{47} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)、

$C(Q)R^{48}$ (ここで、 R^{48} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)、

10

20

30

40

50

$C(Q)OR^{49}$ (ここで、 R^{49} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)、

又は $C(Q)NR^{50}R^{51}$ (ここで、 R^{50} 及び R^{51} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)を表し、

10

R^{19} は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表し、

R^{20} は

R^{52} (ここで、 R^{52} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)、

20

OR^{53} (ここで、 R^{53} は、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表す。)、

又は $NR^{54}R^{55}$ (ここで、 R^{54} 及び R^{55} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表す。)を表し、

30

R^{21} 及び R^{22} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表し、

R^{23} は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表し、

40

R^{24} は群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基を表す。}を表し、

R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5

50

もしくは6員複素環基、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、 $SO_2NR^8R^9$ 、 NR^8R^9 、 $NR^8CO_2R^9$ 、 $NR^8C(O)R^9$ 、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $C(O)NR^8R^9$ 、 SF_5 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、又は水素原子を表すか、又は、

R^3 と R^4 とが、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいベンゼン環、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環、又は群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5、6、7もしくは8員非芳香族環を形成し、

R^5 は群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1つのフェニル基を有するC1 - C6鎖式炭化水素基(ここで、該フェニル基は、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい)、5もしくは6員複素環基を1つ有するC1 - C6鎖式炭化水素基(ここで、該5もしくは6員複素環基は、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい)、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は水素原子を表し、

R^6 及び R^7 は同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、 NR^8R^9 、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、又は水素原子を表し、

R^8 及び R^9 は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、又は水素原子を表し、

mは、それぞれ独立して、0、1、又は2を表し、nは0、1、又は2を表す。ここで、 $S(O)_mR^8$ において、mが1、又は2の場合には、 R^8 が水素原子を表すことはない。

群U：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基、1以上のハロゲン原子もしくは1以上のC1 - C3アルキル基を有していてもよいC3 - C9シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群V：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニルオキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群W：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C8ジアルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群。

群X：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C9シクロアルキル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよい

10

20

30

40

50

C₂ - C₆アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子及びシアノ基からなる群。

群Y：群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₃ - C₉脂環式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルアミノスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₈ジアルキルアミノスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₈ジアルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキルカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルコキシカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルコキシカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキルアミノカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₃ - C₁₀ジアルキルアミノカルボニル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群Z：群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₈ジアルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキルカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルコキシカルボニルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキルアミノカルボニル基、及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₃ - C₁₀ジアルキルアミノカルボニル基からなる群。]

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

[2] R¹がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₁ - C₆アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上のC₁ - C₃アルキル基を有していてもよい)、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルケニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₂ - C₆アルキニル基、又は、ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₃ - C₆シクロアルキル基であり、

R²がハロゲン原子、又は水素原子であり、

R³及びR⁴が同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₁ - C₆鎖式炭化水素基、OR⁸、S(O)_mR⁸、ハロゲン原子、又は水素原子であり、

R⁵が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₁ - C₆鎖式炭化水素基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC₃ - C₉脂環式炭化水素基、又は水素原子である[1]記載の化合物。

[3] A¹がNR⁵である[1]又は[2]記載の化合物。

[4] A¹が酸素原子である[1]又は[2]記載の化合物。

[5] A¹が硫黄原子である[1]又は[2]記載の化合物。

10

20

30

40

50

[6] A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である [1] ~ [5] のいずれかーに記載の化合物。

[7] A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である [1] ~ [5] のいずれかーに記載の化合物。

[8] G が基 $G1$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[9] G が基 $G2$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[10] G が基 $G3$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[11] G が基 $G4$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[12] G が基 $G5$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[13] G が基 $G6$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

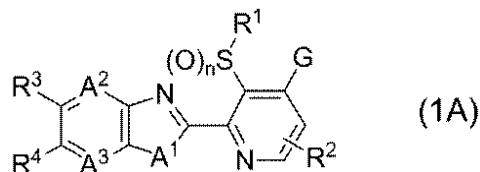
[14] G が基 $G7$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[15] G が基 $G1$ であり、 R^{11} が R^{25} 、 OR^{27} 、 SR^{29} 、 $NR^{30}R^{31}$ 、又は $C(O)R^{32}$ である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[16] G が基 $G1$ であり、 R^{11} が R^{26} 、又は OR^{28} である [1] ~ [7] のいずれかーに記載の化合物。

[17]

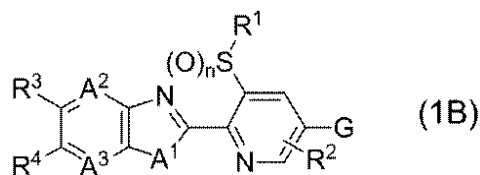
式 (1 A)



[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。] で示される化合物。

[18]

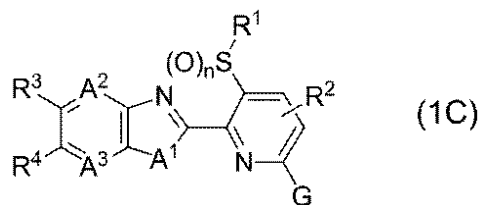
式 (1 B)



[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。] で示される化合物。

[19]

式 (1 C)



[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。] で示される化合物。

[20] [1] ~ [19] のいずれかーに記載の化合物と不活性担体とを含有する有害生物防除剤。

[21] [1] ~ [19] のいずれかーに記載の化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する有害生物の防除方法。

【発明を実施するための形態】

【 0 0 0 6 】

本明細書の記載において用いられる基について、例を挙げて以下に説明する。
本発明において、「ハロゲン原子」とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を意味する。

10

20

30

40

50

本発明において、「C 1 - C 6 鎖式炭化水素基」とは、C 1 - C 6 アルキル基、C 2 - C 6 アルケニル基、およびC 2 - C 6 アルキニル基を表す。

本発明において、「C 1 - C 6 アルキル基」としては、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基等のC 1 - C 6 アルキル基等が挙げられる。

本発明において、「C 2 - C 6 アルケニル基」としては、例えばビニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、1 - メチルビニル基、2 - メチル - 1 - プロペニル基、1 - ブテニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、1 - ペンテニル基、1 - ヘキセニル基等が挙げられる。

本発明において、「C 2 - C 6 アルキニル基」としては、例えばエチニル基、プロパルギル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、1 - ペンチニル基、1 - ヘキシニル基等が挙げられる。

本発明において、「群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群Uより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換された、炭素原子数が1 ~ 6よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、群Uより選ばれる2以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Uより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピルオキシメチル基、ブチルオキシメチル基、*sec*-ブチルオキシメチル基、*tert*-ブチルオキシメチル基、2 - メトキシエチル基、2 - エトキシエチル基、2 - プロピルオキシエチル基、2 - イソプロピルオキシエチル基、2 - ブチルオキシエチル基、2 - *sec*-ブチルオキシエチル基、2 - *tert*-ブチルオキシエチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2 - フルオロエチル基、2, 2 - ジフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2 - (メチルスルファニル)エチル基、2 - (エチルスルファニル)エチル基、2 - (メチルスルフィニル)エチル基、2 - (メチルスルホニル)エチル基、2 - ヒドロキシエチル基、シクロプロピルメチル基、1 - メチルシクロプロピルメチル基、及び2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル基等の群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基；ビニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、1 - メチルビニル基、2 - メチル - 1 - プロペニル基、1 - ブテニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、1 - ペンテニル基、1 - ヘキセニル基、1, 1 - ジフルオロアリル基、及びペンタフルオロアリル基等の群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 2 - C 6 アルケニル基；エチニル基、プロパルギル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、1 - ペンチニル基、1 - ヘキシニル基及び4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - ブチニル基等の群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 2 - C 6 アルキニル基が挙げられる。

本発明において、「群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群Xより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換された、炭素原子数が1 ~ 6よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、群Xより選ばれる2以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Xより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピル

10

20

30

40

50

オキシメチル基、ブチルオキシメチル基、*sec*-ブチルオキシメチル基、*tert*-ブチルオキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-プロピルオキシエチル基、2-イソプロピルオキシエチル基、2-ブチルオキシエチル基、2-*sec*-ブチルオキシエチル基、2-*tert*-ブチルオキシエチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-(メチルスルファニル)エチル基、2-(エチルスルファニル)エチル基、2-(メチルスルフィニル)エチル基、2-(メチルスルホニルエチル)基、2-ヒドロキシエチル基、シクロプロピルメチル基、1-メチルシクロプロピルメチル基、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルメチル基、テトラヒドロフラン-2-イルメチル基、テトラヒドロピラン-2-イルメチル基、テトラヒドロピラン-3-イルメチル基、チアゾール-5-イルメチル基、2-クロロチアゾール-5-イルメチル基、ピリジン-3-イルメチル基、6-クロロピリジン-3-イルメチル基、及び6-トリフルオロメチルピリジン-3-イルメチル基等の群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1,1-ジフルオロアリル基、及びペンタフルオロアリル基等の群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルケニル基；エチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基及び4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基等の群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルキニル基が挙げられる。

本発明において、「群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群Yより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換された、炭素原子数が1-6よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、群Yより選ばれる2以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Yより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピルオキシメチル基、ブチルオキシメチル基、*sec*-ブチルオキシメチル基、*tert*-ブチルオキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-プロピルオキシエチル基、2-イソプロピルオキシエチル基、2-ブチルオキシエチル基、2-*sec*-ブチルオキシエチル基、2-*tert*-ブチルオキシエチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-(メチルスルファニル)エチル基、2-(エチルスルファニル)エチル基、2-(メチルスルフィニル)エチル基、2-(メチルスルホニルエチル)基、2-ヒドロキシエチル基、シクロプロピルメチル基、1-メチルシクロプロピルメチル基、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルメチル基、テトラヒドロフラン-2-イルメチル基、テトラヒドロピラン-2-イルメチル基、テトラヒドロピラン-3-イルメチル基、チアゾール-5-イルメチル基、2-クロロチアゾール-5-イルメチル基、ピリジン-3-イルメチル基、6-クロロピリジン-3-イルメチル基、及び6-トリフルオロメチルピリジン-3-イルメチル基等の群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1,1-ジフルオロアリル基、及びペンタフルオロアリル基等の群

10

20

30

40

50

より選ばれる 1 以上の原子もしくは基を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基 ;
エチニル基、プロパルギル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、1 - ペンチニル基、1
- ヘキシニル基及び 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - ブチニル基等の群 Y より選ばれる 1
以上の原子もしくは基を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基が挙げられる。

本発明において、「群 Z より選ばれる 1 以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 -
C 6 鎖式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群 Z より選ばれる原子も
しくは基によって任意に置換された、炭素原子数が 1 ~ 6 よりなる直鎖状又は分岐鎖状の
炭化水素基を表し、このとき、群 Z より選ばれる 2 以上の原子もしくは基を有している場
合、それらの群 Z より選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっ
ていてもよい。

「群 Z より選ばれる 1 以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素
基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イ
ソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘ
キシル基、シクロプロピルメチル基、1 - メチルシクロプロピルメチル基、2, 2 - ジフ
ルオロシクロプロピルメチル基、フェニルメチル基、4 - クロロフェニルメチル基、4 -
トリフルオロメチルフェニルメチル基、テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル基、テトラ
ヒドロピラン - 2 - イルメチル基、テトラヒドロピラン - 3 - イルメチル基、チアゾール
- 5 - イルメチル基、2 - クロロチアゾール - 5 - イルメチル基、ピリジン - 3 - イルメ
チル基、6 - クロロピリジン - 3 - イルメチル基、6 - トリフルオロメチルピリジン - 3
- イルメチル基、2 - (メチルアミノ)エチル基、2 - (ジメチルアミノ)エチル基、2
- (アセチルアミノカルボニル)エチル基、2 - (メトキシカルボニルアミノ)エチル基
、2 - (メチルアミノカルボニル)エチル基、及び 2 - (ジメチルアミノカルボニル)エ
チル基等の群 Z より選ばれる 1 以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 アル
キル基 ;

ビニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、1 - メチルビニル基、2 - メチル - 1
- プロペニル基、1 - ブテニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、1 - ペンテニル基
、1 - ヘキセニル基、2 - シクロプロピルビニル基、2 - フェニルビニル基、3 - フェニ
ル - 2 - プロペニル基、2 - (ピリジン - 3 - イル)ビニル基、及び 3 - (ジメチルアミ
ノ) - 2 - プロペニル等の群 Z より選ばれる 1 以上の原子もしくは基を有していてもよい
C 2 - C 6 アルケニル基 ;

エチニル基、プロパルギル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、1 - ペンチニル基、1
- ヘキシニル基、2 - フェニルエチニル基、及び 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチニル基
等の群 Z より選ばれる 1 以上の原子もしくは基を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル
基が挙げられる。

本発明において、「1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基
」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソ
ブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキ
シル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、ヨードメチル基、ジフル
オロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、
プロモジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2 - フルオロエチル基、2 - クロロエ
チル基、2 - プロモエチル基、2, 2 - ジフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリフルオロ
エチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソ
プロピル基等の 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基 ;

ビニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、1 - メチルビニル基、2 - メチル - 1
- プロペニル基、1 - ブテニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、1 - ペンテニル基
、1 - ヘキセニル基、1, 1 - ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等の 1 以上
のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基 ;

エチニル基、プロパルギル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、1 - ペンチニル基、1
- ヘキシニル基及び 4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - ブチニル基等の 1 以上のハロゲン原
子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基が挙げられる。

10

20

30

40

50

本発明において、「ハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい)」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブromoジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基及び1-シクロプロピルエチル基等が挙げられる。

10

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブromoジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

20

本発明において、「1つのフェニル基を有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該フェニル基は、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい)」としては、例えばフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基及び4-トリフルオロメチルフェニルメチル基等が挙げられる。このとき、群Wより選ばれる2以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Wより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

本発明において、「5もしくは6員複素環基を1つ有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該5もしくは6員複素環基は、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい)」としては、例えばテトラヒドロフラン-2-イルメチル基、テトラヒドロピラン-2-イルメチル基、テトラヒドロピラン-3-イルメチル基、チアゾール-5-イルメチル基、2-クロロチアゾール-5-イルメチル基、ピリジン-3-イルメチル基、6-クロロピリジン-3-イルメチル基、6-トリフルオロメチルピリジン-3-イルメチル基等が挙げられる。このとき、群Wより選ばれる2以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Wより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

30

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基」としては、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1,1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等が挙げられる。

40

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基」としては、例えばエチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基及び4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基等が挙げられる。

本発明において「群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C9脂環式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群Vより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換された、炭素原子数が3~9個よりなる環状の非芳香族炭化水素基を表し、このとき、群Vより選ばれる2以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Vより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっていて

50

もよい。

「群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基」としては、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、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノナニル基、1 - シクロヘキセニル基、2 - シクロヘキセニル基、3 - シクロヘキセニル基、1 - メチルシクロヘキシル基、2 - メチルシクロヘキシル基、3 - メチルシクロヘキシル基、4 - メチルシクロヘキシル基、2 - メトキシシクロヘキシル基、3 - メトキシシクロヘキシル基、4 - メトキシシクロヘキシル基、1 - フルオロシクロヘキシル基、2 - フルオロシクロヘキシル基、3 - フルオロシクロヘキシル基、4 - フルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

本発明において、「C3 - C6シクロアルキル基」としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

10

本発明において、「ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、1 - メチルシクロプロピル基、2 - メチルシクロプロピル基、1 - フルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジクロロシクロプロピル基、2, 2 - ジブromoシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C9シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、1 - フルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジクロロシクロプロピル基、2, 2 - ジブromoシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

20

本発明において「1以上のハロゲン原子もしくは1以上のC1 - C3アルキル基を有していてもよいC3 - C9シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、1 - メチルシクロプロピル基、2 - ジメチルシクロプロピル基、1 - フルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジクロロシクロプロピル基、2, 2 - ジブromoシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

本発明において、「群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基」の表記は、フェニル基の水素原子が群Wより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換されたフェニル基を表し、このとき、群Wより選ばれる2以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Wより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

30

「群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2 - フルオロフェニル基、3 - フルオロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、2, 3 - ジフルオロフェニル基、2, 4 - ジフルオロフェニル基、2, 5 - ジフルオロフェニル基、2, 6 - ジフルオロフェニル基、3, 4 - ジフルオロフェニル基、3, 5 - ジフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、2 - ブromoフェニル基、3 - ブromoフェニル基、4 - ブromoフェニル基、2 - ヨードフェニル基、3 - ヨードフェニル基、4 - ヨードフェニル基、2 - トリフルオロメチルフェニル基、3 - トリフルオロメチルフェニル基、4 - トリフルオロメチルフェニル基、2 - トリフルオロメチルフェニル基、2 - トリフルオロメトキシフェニル基、3 - トリフルオロメトキシフェニル基、4 - トリフルオロメトキシフェニル基、2 - トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、3 - トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、4 - トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、4 - メトキシカルボニルフェニル基、4 - ニトロフェニル基、4 - シアノフェニル基、4 - メチルアミノフェニル基、4 - ジメチルアミノフェニル基、4 - メチルスルフィニルフェニル基、4 - メチルスルホニルフェニル基、4 - アセチルフェニル基及び4 - メトキシカルボニルフェニル基が挙げられる。

40

本発明において、「複素環基」とは、環構造において、環構成原子として、炭素原子以外に、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1以上含む複素環化合物残基を表す。「複素環基

50

」としては、例えばピロリジン環、テトラヒドロフラン環、テトラヒドロチオフェン環等の5員非芳香族複素環基、ピロール環、ピラゾール環、イミダゾール環、フラン環、チオフェン環、オキサゾール環、チアゾール環等の5員芳香族複素環基、ピペリジン環、テトラヒドロピラン環、テトラヒドロチオピラン環、ピペラジン環、モルホリン環等の6員非芳香族複素環基、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピラジン環等の6員芳香族複素環基が挙げられる。

また、本発明において、5員複素環基とは、5員非芳香族複素環基及び5員芳香族複素環基を意味し、6員複素環基とは、6員非芳香族複素環基及び6員芳香族複素環基を意味する。

本発明において、「群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基」としては、例えばピロリジン-1-イル基、3,3,4,4-テトラフルオロピロリジン-1-イル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、ピペリジル基、モルホリル基及びチオモルホリル基等の群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員非芳香族複素環基；

2-ピロリル基、2-フリル基、3-フリル基、5-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基、1-ピロリル基、1-メチル-2-ピロリル基、2-メチルスルファニル-1-ピロリル基、2-メチルスルフィニル-1-ピロリル基、2-メチルスルホニル-1-ピロリル基、2-メチルアミノ-1-ピロリル基、2-ジメチルアミノ-1-ピロリル基、5-プロモ-2-フリル基、5-ニトロ-2-フリル基、5-シアノ-2-フリル基、5-メトキシ-2-フリル基、5-アセチル-2-フリル基、5-メトキシカルボニル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、2,5-ジメチル-3-フリル基、2,4-ジメチル-3-フリル基、5-メチル-2-チエニル基、3-メチル-2-チエニル基、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル基、5-クロロ-1,3-ジメチル-4-ピラゾリル基、ピラゾール-1-イル基、3-クロロ-ピラゾール-1-イル基、3-プロモピラゾール-1-イル基、4-クロロピラゾール-1-イル基、4-プロモピラゾール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、1,2,4-トリアゾール-1-イル基、3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル基、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル基、1,2,3,5-テトラゾール-1-イル基、2-チエニル基、3-チエニル基、3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イル基、4-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル基、ピラジニル基、4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、2-ピリミジニル基、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、5-トリフルオロメトキシピリジン-2-イル基等の群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員芳香族複素環基が挙げられる。

本発明において、「群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員複素環基」としては、例えばチエタン-3-イル基、ピロリジン-1-イル基、3,3,4,4-テトラフルオロピロリジン-1-イル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、ピペリジル基、モルホリル基及びチオモルホリル基等の群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい4、5もしくは6員非芳香族複素環基；

2-ピロリル基、2-フリル基、3-フリル基、5-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基、1-ピロリル基、1-メチル-2-ピロリル基、2-メチルスルファニル-1-ピロリル基、2-メチルスルフィニル-1-ピロリル基、2-メチルスルホニル-1-ピロリル基、2-メチルアミノ-1-ピロリル基、2-ジメチルアミノ-1-ピロリル基、5-プロモ-2-フリル基、5-ニトロ-2-フリル基、5-シアノ-2-フリル基、5-メトキシ-2-フリル基、5-アセチル-2-フリル基、5-メトキシカルボニル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、2,5-ジメチル-3-フリル基、2,4-ジメチル-3-フリル基、5-メチル-2-チエニル基、3-メチル-2-チエニル基、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル基、5-クロロ-1,3-ジメチル-4-ピ

10

20

30

40

50

ラゾリル基、ピラゾール - 1 - イル基、3 - クロロ - ピラゾール - 1 - イル基、3 - プロモピラゾール - 1 - イル基、4 - クロロピラゾール - 1 - イル基、4 - プロモピラゾール - 1 - イル基、イミダゾール - 1 - イル基、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル基、3 - クロロ - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル基、1, 2, 3, 4 - テトラゾール - 1 - イル基、1, 2, 3, 5 - テトラゾール - 1 - イル基、2 - チエニル基、3 - チエニル基、3 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル基、4 - トリフルオロメチルピラゾール - 1 - イル基、ピラジニル基、4 - ピリミジニル基、5 - ピリミジニル基、2 - ピリジニル基、3 - ピリジニル基、4 - ピリジニル基、3 - フルオロ - 2 - ピリジニル基、4 - フルオロ - 2 - ピリジニル基、5 - フルオロ - 2 - ピリジニル基、6 - フルオロ - 2 - ピリジニル基、2 - ピリミジニル基、3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - イル基、5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - イル基、5 - トリフルオロメトキシピリジン - 2 - イル基等の群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員芳香族複素環基が挙げられる。

10

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基」としては、例えばメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、エトキシ基、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、sec - ブチルオキシ基、tert - ブチルオキシ基、ペンチルオキシ基及びヘキシルオキシ基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルファニル基」としては、例えばメチルスルファニル基、エチルスルファニル基、プロピルスルファニル基、イソプロピルスルファニル基、ブチルスルファニル基、ペンチルスルファニル基、ヘキシルスルファニル基、トリフルオロメチルスルファニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルファニル基及びペンタフルオロエチルスルファニル基が挙げられる。

20

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよい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、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、ペンチルスルフィニル基、ヘキシルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフィニル基及びペンタフルオロエチルスルフィニル基が挙げられる。

30

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよい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、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルホニル基及びペンタフルオロエチルスルホニル基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキルカルボニル基」としては、例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ペンタノイル基、ヘキサノイル基及びトリフルオロアセチル基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基」としては、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、ブチルオキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、tert - ブチルオキシカルボニル基及び2, 2, 2 - トリフルオロエチルオキシカルボニル基が挙げられる。

40

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルアミノ基」としては、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルアミノ基、プロピルアミノ基及びイソプロピルアミノ基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C8ジアルキルアミノ基」としては、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ビス(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)アミノ基及びジプロピルアミノ基が挙げられる。

本発明において「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニルオキシ

50

基」としては、例えば2 - プロペニルオキシ基、2 - メチル - 2 - プロペニルオキシ基、2 - ブテニルオキシ基、3 - ブテニルオキシ基、2 - ペンテニルオキシ基、2 - ヘキセニルオキシ基、3, 3 - ジフルオロアリルオキシ基及び3, 3 - ジクロロアリルオキシ基が挙げられる。

本発明において「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニルオキシ基」としては、例えばプロパルギルオキシ基、2 - ブチニルオキシ基、3 - ブチニルオキシ基、2 - ペンチニルオキシ基、2 - ヘキシニルオキシ基及び4, 4, 4 - トリフルオロ - 2 - ブチニルオキシ基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルアミノスルホニル基」としては、例えばメチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルアミノスルホニル基、プロピルアミノスルホニル基及びイソプロピルアミノスルホニル基が挙げられる。

10

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C8ジアルキルアミノスルホニル基」としては、例えばジメチルアミノスルホニル基、ジエチルアミノスルホニル基、ビス(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)アミノスルホニル基及びジプロピルアミノスルホニル基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキルカルボニルアミノ基」としては、例えばアセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、ペンタノイルアミノ基、ヘキサノイルアミノ基及びトリフルオロアセチルアミノ基が挙げられる。

20

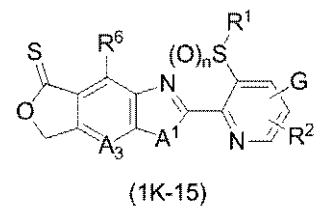
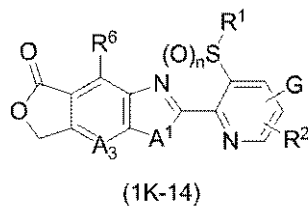
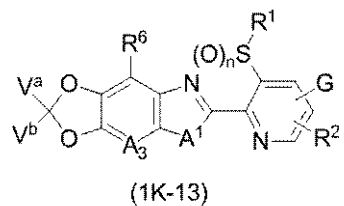
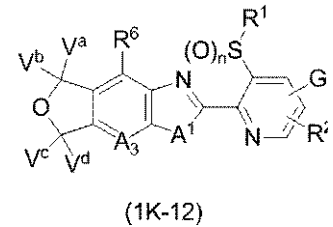
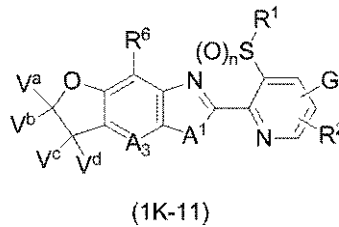
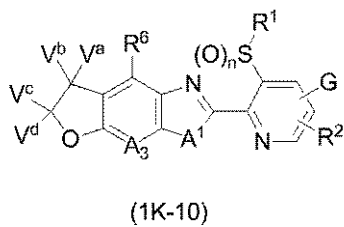
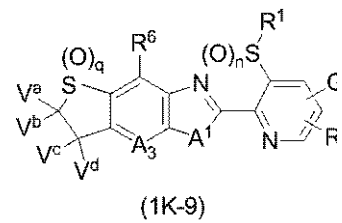
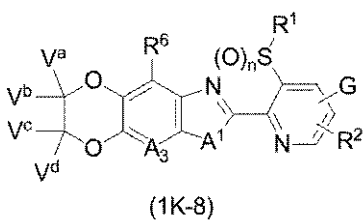
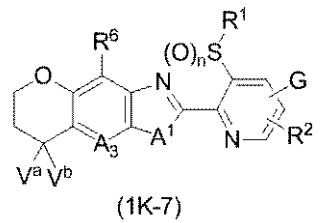
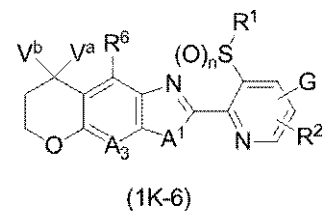
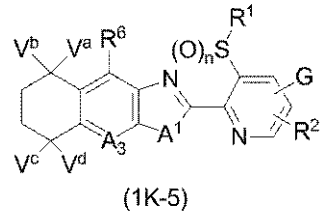
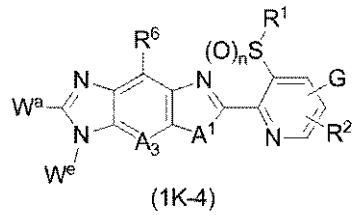
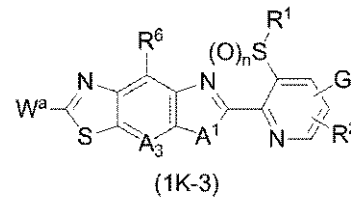
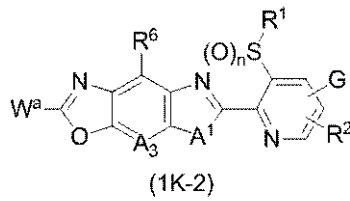
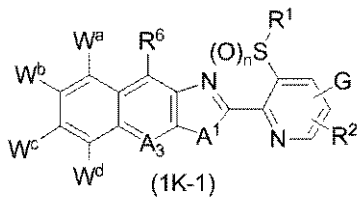
本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルコキシカルボニルアミノ基」としては、例えばメトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、プロピルオキシカルボニルアミノ基、ブチルオキシカルボニルアミノ基、ペンチルオキシカルボニルアミノ基、tert - ブチルオキシカルボニルアミノ基及び2, 2, 2 - トリフルオロエチルオキシカルボニルアミノ基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキルアミノカルボニル基」としては、例えばメチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルアミノカルボニル基、プロピルアミノカルボニル基及びイソプロピルアミノカルボニル基が挙げられる。

本発明において、「1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C10ジアルキルアミノカルボニル基」としては、例えばジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ビス(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)アミノカルボニル基及びジプロピルアミノカルボニル基が挙げられる。

30

本発明において、「R3とR4とが、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいベンゼン環、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環、又は群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5、6、7もしくは8員非芳香族環を形成」する化合物としては、具体的には下式(1K - 1) ~ 式(1K - 15)が挙げられる。



{式中、

W^a、W^b、W^c、及びW^dはそれぞれ同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C8ジアルキルアミノ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキルカルボニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、又は水素原子を表し、W^eは1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又は水素原子を表し、

V^a、V^b、V^c、及びV^dはそれぞれ同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニルオキシ基、ハロゲン原子、又は水素原子を表す。}

10

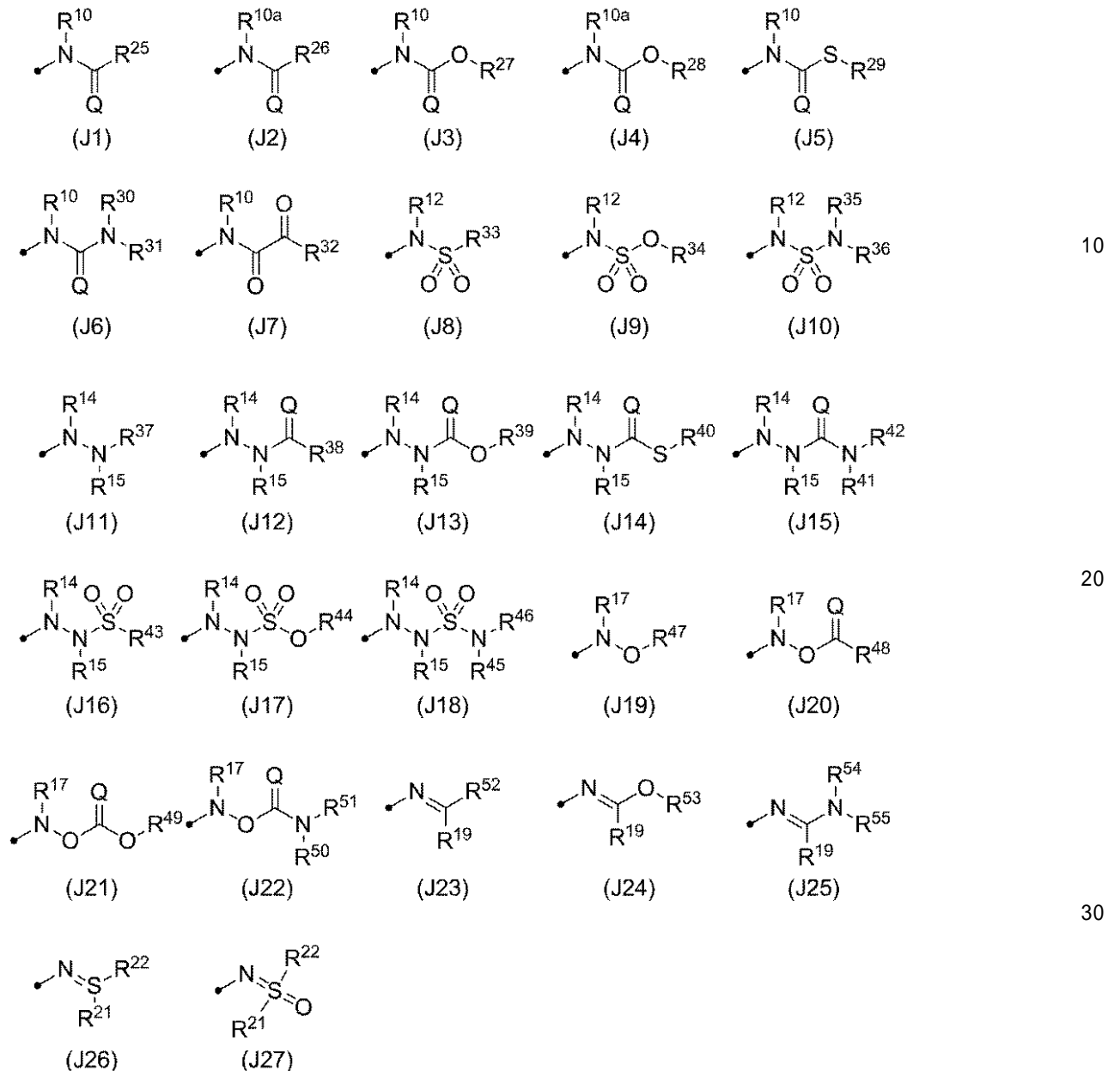
20

30

40

50

本発明において、基 G 1 ~ 基 G 6 としては、具体的には下式基 (J 1) ~ 基 (J 2 7) が挙げられる。



{ 式中、

R^{10a}は群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有してもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有してもよい4、5もしくは6員複素環基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、又はC(O)NR⁸R⁹を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。 }

本発明において、N - オキシドとは、複素環基上の環を構成する窒素原子が酸化された化合物である。N - オキシドを形成しうる複素環基としては、例えばピリジン環が挙げられる。

本発明化合物において、N - オキシドとしては、後記式(1N1) ~ 式(1N3)で示される化合物が挙げられる。

本発明化合物としては、例えば、以下の化合物が挙げられる。

式(1)において、A¹がNR⁵である化合物；

式(1)において、A¹がNR⁵であり、R⁷がメチル基である化合物；

式(1)において、A¹が硫黄原子である化合物；

10

20

30

40

50

- 式(1)において、 A^1 が酸素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^2 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^2 が CR^6 である化合物；
- 式(1)において、 A^2 が CH である化合物；
- 式(1)において、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1)において、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物； 10
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物； 20
- 式(1)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物； 30
- 式(1)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい $C1 - C6$ 鎖式炭化水素基である化合物； 40
- 式(1)において、 R^1 が群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい $C3 - C9$ 脂環式炭化水素基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい $C1 - C6$ アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上の $C1 - C3$ アルキル基を有していてもよい)である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が1以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1 - C6$ 鎖式炭化水素基である化合物；
- 式(1)において、 R^1 が1以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1 - C6$ アルキル 50

基である化合物；

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上のC1 - C3アルキル基を有していてもよい)、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニル基、又は、ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基である化合物；

10

式(1)において、 R^1 がメチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、シクロプロピルメチル基、又はシクロプロピル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がメチル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がエチル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がプロピル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がシクロプロピルメチル基である化合物；

式(1)において、 R^1 がシクロプロピル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基である化合物；

20

式(1)において、 R^2 が群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基である化合物；

式(1)において、 R^2 が群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基である化合物；

式(1)において、 R^2 が OR^8 である化合物；

式(1)において、 R^2 が $S(O)_mR^8$ 、又は $S(O)_2NR^8R^9$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が NR^8R^9 、 $NR^8CO_2R^9$ 、又は $NR^8C(O)R^9$ である化合物；

式(1)において、 R^2 が CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、又は $C(O)NR^8R^9$ である化合物；

30

式(1)において、 R^2 がハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^2 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 がハロゲン原子、又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 OR^8 又は水素原子である化合物；

40

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 $S(O)_mR^8$ 又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 $SO_2NR^8R^9$ 又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 NR^8R^9 又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 $NR^8CO_2R^9$ 又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 $NR^8C(O)R^9$ 又は水素原子である化合物；

50

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 CO_2R^8 又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 $C(O)R^8$ 又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 $C(O)NR^8R^9$ 又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、 R^3 と R^4 とが、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいベンゼン環を形成した化合物；

10

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環を形成した化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5、6、7もしくは8員非芳香族環を形成した化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、ハロゲン原子、又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6鎖式炭化水素基、 OR^8 (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6鎖式炭化水素基を表す)、又は $S(O)_mR^8$ (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6鎖式炭化水素基を表す)、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

20

式(1)において、 R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6パーフルオロアルキル基、 OR^8 (ここで、 R^8 はC1-C6パーフルオロアルキル基を表す)、又は $S(O)_mR^8$ (ここで、 R^8 はC1-C6パーフルオロアルキル基を表す)、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

30

式(1)において、 R^3 が群Wより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が OR^8 であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が $S(O)_mR^8$ であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が $SO_2NR^8R^9$ であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が NR^8R^9 であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が $NR^8CO_2R^9$ であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が $NR^8C(O)R^9$ であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が CO_2R^8 であり、 R^4 が水素原子である化合物；

40

式(1)において、 R^3 が $C(O)R^8$ であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が $C(O)NR^8R^9$ であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がハロゲン原子であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6鎖式炭化水素基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6アルキル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がC1-C6パーフルオロアルキル基であり、 R^4 が水素原子であ

50

る化合物；

式(1)において、 R^3 が OR^8 (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基を表す)であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が OR^8 (ここで、 R^8 はC1 - C6パーフルオロアルキル基を表す)であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が $S(O)_mR^8$ (ここで、 R^8 はC1 - C6パーフルオロアルキル基を表す)であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が OR^8 (ここで、 R^8 はC1 - C6パーフルオロアルキル基を表す)であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、トリフルオロメトキシ基、トリフルオロメチルスルファニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、又はトリフルオロメチルスルホニル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチルスルファニル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチルスルフィニル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 R^4 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、 R^5 が CO_2R^8 である化合物；

式(1)において、 R^5 が $C(O)R^8$ である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基である化合物；

式(1)において、 R^5 が群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基である化合物；

式(1)において、 R^5 が水素原子である化合物；

式(1)において、 R^6 及び R^7 が同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^6 及び R^7 が同一又は相異なり、ハロゲン原子、又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^6 及び R^7 が同一又は相異なり、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、 NR^8R^9 、ハロゲン原子、又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^6 及び R^7 が水素原子である化合物；

式(1)において、

R^1 がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上のC1 - C3アルキル基を有していてもよい)、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニル基、又は、ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基であり、

R^2 がハロゲン原子、又は水素原子であり、

R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していて

10

20

30

40

50

もよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、ハロゲン原子、又は水素原子であり、

R^5 が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 3 - C 9 脂環式炭化水素基、又は水素原子である化合物；

(1)において、

A^1 が NR^5 であり、

A^2 が CR^6 であり、

A^3 が窒素原子であり、

R^1 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基であり、 R^2 が水素原子であり、

Gが基G 1、基G 2、または基G 5であり、Qが酸素原子であり、

R^{10} が水素原子であり、

R^{11} が群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 3 - C 9 脂環式炭化水素基、 OR^{25} (ここで、 R^{25} は群Zより選ばれる1以上の原子もしくは基を有しているC 1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)、 $NR^{30}R^{31}$ (ここで、 R^{30} 及び R^{31} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)、または $C(O)R^{32}$ (ここで、 R^{32} は OR^8 を表し、 R^8 は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)であり、

R^{12} が水素原子、又は SO_2R^{33} (ここで、 R^{33} は群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)であり、

R^{13} が群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基であり、

R^{19} が水素原子であり、

R^{20} が $NR^{54}R^{55}$ (ここで、 R^{54} 及び R^{55} は同一又は相異なり、群Yより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)であり、

R^3 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基であり、

R^4 が水素原子であり、

R^5 が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基であり、

R^6 が水素原子である化合物；

(1)において、

A^1 が NR^5 であり、

A^2 が CR^6 であり、

A^3 が窒素原子であり、

R^1 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基であり、

R^2 が水素原子であり、

Gが基G 1、基G 2、または基G 5であり、Qが酸素原子であり、

R^{10} が水素原子であり、

R^{11} が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3 - C 9 シクロアルキル基、 OR^{25} (ここで、 R^{25} は1以上のハロゲン原子を有していてもよいフェニル基を1つ有しているC 1 - C 6 アルキル基を表す)、 $NR^{30}R^{31}$ (ここで、 R^{30} 及び R^{31} は同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表す)、または $C(O)R^{32}$ (ここで、 R^{32} は OR^8 を表し、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表す)であり、

R^{12} が水素原子、又は SO_2R^{33} (ここで、 R^{33} は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表す)であり、

10

20

30

40

50

R^{13} が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基であり、
 R^{19} が水素原子であり、
 R^{20} が $NR^{54}R^{55}$ (R^{54} 及び R^{55} は同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基を表す)であり、
 R^3 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基であり、
 R^4 が水素原子であり、
 R^5 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基であり、
 R^6 が水素原子である化合物；

式(1)において、

R^1 がメチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、シクロプロピルメチル基、又はシクロプロピル基であり、

10

R^2 が水素原子であり、

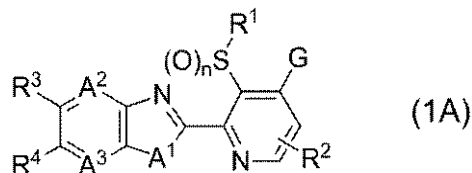
R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、 OR^8 (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基を表す)、又は $S(O)_mR^8$ (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基を表す)、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^5 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又は水素原子であり、

R^6 及び R^7 が水素原子である化合物；

式(1A)

20



(1A)

[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]で示される化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物

30

；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物；

40

式(1A)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；

式(1A)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

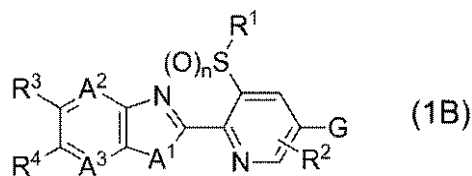
式(1A)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；

式(1A)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(1A)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物

50

- ;
- 式(1A)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 がCHである化合物
- ;
- 式(1A)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物
- ;
- 式(1A)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物
- ;
- 式(1A)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が窒素原子である化合物
- ;
- 式(1A)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が CR^7 である化合物 10
- ;
- 式(1A)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 がCHである化合物
- ;
- 式(1B)



- [式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。] で示される化合物 ; 20
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が窒素原子である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が CR^7 である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 がCHであり、 A^3 がCHである化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物 ; 30
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物 ; 30
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が窒素原子である化合物 ; 30
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が CR^7 である化合物 ; 30
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 がCHであり、 A^3 がCHである化合物 ; 30
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物 40
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が窒素原子である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が CR^7 である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 がCHである化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物
- ;
- 式(1B)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物 50

物；

式(1B)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(1B)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 が CR^7 である化合物；

式(1B)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 がCHであり、 A^3 がCHである化合物；

式(1B)において、 A^1 が NR^5 又は酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 又は窒素原子である化合物；

式(1B)において、

A^1 が NR^5 又は酸素原子あり、

A^2 が CR^6 であり、

A^3 が CR^7 又は窒素原子であり、

R^1 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基であり、

R^2 が水素原子であり、

R^3 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は $S(O)_mR^8$ であり、

R^4 が水素原子である化合物；

式(1B)において、

A^1 が NR^5 又は酸素原子あり、 R^5 がメチル基であり、

A^2 がCHであり、

A^3 がCH又は窒素原子であり、

R^1 がC1 - C6アルキル基であり、

R^2 が水素原子であり、

R^3 が1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキル基、1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキルスルフィニル基、又は1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキルスルホニル基であり、

R^4 が水素原子である化合物；

式(1B)において、

A^1 が NR^5 又は酸素原子あり、 R^5 がメチル基であり、

A^2 がCHであり、

A^3 がCH又は窒素原子であり、

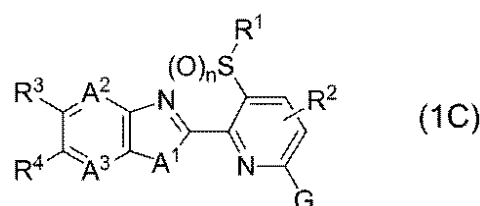
R^1 がエチル基であり、

R^2 が水素原子であり、

R^3 がC1 - C3パーフルオロアルキル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルファニル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルフィニル基、又はC1 - C3パーフルオロアルキルスルホニル基であり、

R^4 が水素原子である化合物；

式(1C)



[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。] で示される化合物；

式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

10

20

30

40

50

- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 であり、 R^5 がメチル基であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CR^7 である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が CH であり、 A^3 が CH である化合物；
- 式(1C)において、 A^1 が NR^5 又は酸素原子であり、 A^2 が CR^6 であり、 A^3 が CR^7 又は窒素原子である化合物；
- 式(1C)において、
 A^1 が NR^5 又は酸素原子あり、
 A^2 が CR^6 であり、
 A^3 が CR^7 又は窒素原子であり、
 R^1 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基であり、
 R^2 が水素原子であり、
 R^3 が群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は $S(O)_mR^8$ であり、
 R^4 が水素原子である化合物；
- 式(1C)において、
 A^1 が NR^5 又は酸素原子あり、 R^5 がメチル基であり、
 A^2 が CH であり、

10

20

30

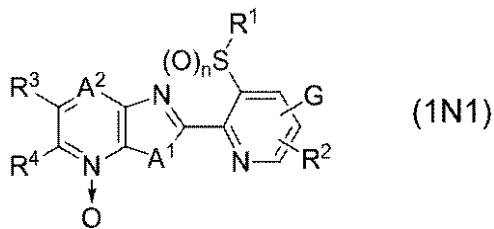
40

50

A^3 がCH又は窒素原子であり、
 R^1 がC1 - C6アルキル基であり、
 R^2 が水素原子であり、
 R^3 が1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキル基、1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキルスルフィニル基、又は1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6アルキルスルホニル基であり、
 R^4 が水素原子である化合物；
 式(1C)において、

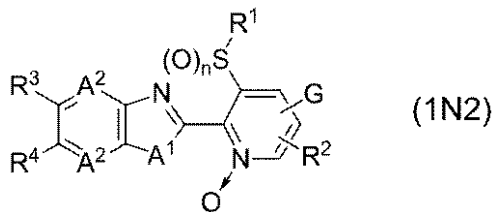
A^1 がNR⁵又は酸素原子あり、 R^5 がメチル基であり、
 A^2 がCHであり、
 A^3 がCH又は窒素原子であり、
 R^1 がエチル基であり、
 R^2 が水素原子であり、
 R^3 がC1 - C3パーフルオロアルキル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルファニル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルフィニル基、又はC1 - C3パーフルオロアルキルスルホニル基であり、
 R^4 が水素原子である化合物；
 式(1N1)

10



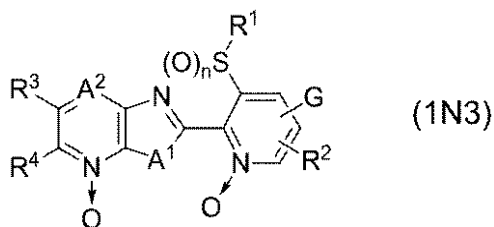
20

[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]で示される化合物；
 式(1N2)



30

[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]で示される化合物；
 式(1N3)



40

[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]で示される化合物；
 式(1)において、Gが基G1である化合物；
 式(1)において、Gが基G2である化合物；
 式(1)において、Gが基G3である化合物；
 式(1)において、Gが基G4である化合物；
 式(1)において、Gが基G5である化合物；
 式(1)において、Gが基G6である化合物；

50

- 式(1)において、Gが基G7である化合物；
 式(1)において、Gが基G2、基G3、基G4、基G5、又は基G6である化合物；
 式(1)において、Gが基G1であり、R¹¹がR²⁵、OR²⁷、SR²⁹、NR³⁰R³¹、又はC(O)R³²である化合物；
 式(1)において、Gが基G1であり、R¹¹がR²⁵、又はOR²⁷である化合物；
 式(1)において、Gが基G1であり、R¹¹がR²⁶、又はOR²⁸である化合物；
 式(1)において、Gが基G1であり、R¹¹がR²⁵、OR²⁷、SR²⁹、NR³⁰R³¹、又はC(O)R³²である化合物；
 式(1)において、Gが基G1であり、R¹¹がSR²⁹、NR³⁰R³¹、又はC(O)R³²である化合物；
 式(1A)において、A¹、A²、A³、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物(態様1～態様243)；
 なお、例えば、態様1は、「式(1A)において、A¹がNR⁵であり、A²がCR⁶であり、A³がCR⁷であり、GがG¹である化合物；」を表す。

〔表1〕

態様	A ¹	A ²	A ³	G
1	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G1
2	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G2
3	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G3
4	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G4
5	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G5
6	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G6
7	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G7
8	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G1,G7
9	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	G2,G3,G4,G5,G6
10	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J1,J2,J3,J4,G7
11	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J1
12	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J2
13	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J3
14	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J4
15	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J5
16	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J6
17	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J7
18	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J8
19	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J9
20	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J10
21	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J11
22	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J12
23	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J13
24	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J14
25	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J15

〔表2〕

態様	A ¹	A ²	A ³	G
26	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J16
27	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J17
28	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J18
29	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J10
30	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J20
31	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J21
32	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J22
33	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J23
34	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J24
35	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J25
36	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J26
37	NR ⁵	CR ⁶	CR ⁷	J27
38	NR ⁵	CR ⁶	N	G1
39	NR ⁵	CR ⁶	N	G2
40	NR ⁵	CR ⁶	N	G3
41	NR ⁵	CR ⁶	N	G4
42	NR ⁵	CR ⁶	N	G5
43	NR ⁵	CR ⁶	N	G6
44	NR ⁵	CR ⁶	N	G7
45	NR ⁵	CR ⁶	N	G1,G7
46	NR ⁵	CR ⁶	N	G2,G3,G4,G5,G6
47	NR ⁵	CR ⁶	N	J1,J2,J3,J4,G7
48	NR ⁵	CR ⁶	N	J1
49	NR ⁵	CR ⁶	N	J2
50	NR ⁵	CR ⁶	N	J3

10

20

30

[表 3]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
51	NR ⁵	CR ⁶	N	J4
52	NR ⁵	CR ⁶	N	J5
53	NR ⁵	CR ⁶	N	J6
54	NR ⁵	CR ⁶	N	J7
55	NR ⁵	CR ⁶	N	J8
56	NR ⁵	CR ⁶	N	J9
57	NR ⁵	CR ⁶	N	J10
58	NR ⁵	CR ⁶	N	J11
59	NR ⁵	CR ⁶	N	J12
60	NR ⁵	CR ⁶	N	J13
61	NR ⁵	CR ⁶	N	J14
62	NR ⁵	CR ⁶	N	J15
63	NR ⁵	CR ⁶	N	J16
64	NR ⁵	CR ⁶	N	J17
65	NR ⁵	CR ⁶	N	J18
66	NR ⁵	CR ⁶	N	J10
67	NR ⁵	CR ⁶	N	J20
68	NR ⁵	CR ⁶	N	J21
69	NR ⁵	CR ⁶	N	J22
70	NR ⁵	CR ⁶	N	J23
71	NR ⁵	CR ⁶	N	J24
72	NR ⁵	CR ⁶	N	J25
73	NR ⁵	CR ⁶	N	J26
74	NR ⁵	CR ⁶	N	J27
75	O	CR ⁶	CR ⁷	G1

10

20

30

[表 4]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
76	O	CR ⁶	CR ⁷	G2
77	O	CR ⁶	CR ⁷	G3
78	O	CR ⁶	CR ⁷	G4
79	O	CR ⁶	CR ⁷	G5
80	O	CR ⁶	CR ⁷	G6
81	O	CR ⁶	CR ⁷	G7
82	O	CR ⁶	CR ⁷	G1,G7
83	O	CR ⁶	CR ⁷	G2,G3,G4,G5,G6
84	O	CR ⁶	CR ⁷	J1,J2,J3,J4,G7
85	O	CR ⁶	CR ⁷	J1
86	O	CR ⁶	CR ⁷	J2
87	O	CR ⁶	CR ⁷	J3
88	O	CR ⁶	CR ⁷	J4
89	O	CR ⁶	CR ⁷	J5
90	O	CR ⁶	CR ⁷	J6
91	O	CR ⁶	CR ⁷	J7
92	O	CR ⁶	CR ⁷	J8
93	O	CR ⁶	CR ⁷	J9
94	O	CR ⁶	CR ⁷	J10
95	O	CR ⁶	CR ⁷	J11
96	O	CR ⁶	CR ⁷	J12
97	O	CR ⁶	CR ⁷	J13
98	O	CR ⁶	CR ⁷	J14
99	O	CR ⁶	CR ⁷	J15
100	O	CR ⁶	CR ⁷	J16

10

20

30

[表 5]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
101	O	CR ⁶	CR ⁷	J17
102	O	CR ⁶	CR ⁷	J18
103	O	CR ⁶	CR ⁷	J10
104	O	CR ⁶	CR ⁷	J20
105	O	CR ⁶	CR ⁷	J21
106	O	CR ⁶	CR ⁷	J22
107	O	CR ⁶	CR ⁷	J23
108	O	CR ⁶	CR ⁷	J24
109	O	CR ⁶	CR ⁷	J25
110	O	CR ⁶	CR ⁷	J26
111	O	CR ⁶	CR ⁷	J27
112	O	CR ⁶	N	G1
113	O	CR ⁶	N	G2
114	O	CR ⁶	N	G3
115	O	CR ⁶	N	G4
116	O	CR ⁶	N	G5
117	O	CR ⁶	N	G6
118	O	CR ⁶	N	G7
119	O	CR ⁶	N	G1,G7
120	O	CR ⁶	N	G2,G3,G4,G5,G6
121	O	CR ⁶	N	J1,J2,J3,J4,G7
122	O	CR ⁶	N	J1
123	O	CR ⁶	N	J2
124	O	CR ⁶	N	J3
125	O	CR ⁶	N	J4

10

20

30

[表 6]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
126	O	CR ⁶	N	J5
127	O	CR ⁶	N	J6
128	O	CR ⁶	N	J7
129	O	CR ⁶	N	J8
130	O	CR ⁶	N	J9
131	O	CR ⁶	N	J10
132	O	CR ⁶	N	J11
133	O	CR ⁶	N	J12
134	O	CR ⁶	N	J13
135	O	CR ⁶	N	J14
136	O	CR ⁶	N	J15
137	O	CR ⁶	N	J16
138	O	CR ⁶	N	J17
139	O	CR ⁶	N	J18
140	O	CR ⁶	N	J10
141	O	CR ⁶	N	J20
142	O	CR ⁶	N	J21
143	O	CR ⁶	N	J22
144	O	CR ⁶	N	J23
145	O	CR ⁶	N	J24
146	O	CR ⁶	N	J25
147	O	CR ⁶	N	J26
148	O	CR ⁶	N	J27
149	S	CR ⁶	CR ⁷	G1
150	S	CR ⁶	CR ⁷	G2

10

20

30

[表 7]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
151	S	CR ⁶	CR ⁷	G3
152	S	CR ⁶	CR ⁷	G4
153	S	CR ⁶	CR ⁷	G5
154	S	CR ⁶	CR ⁷	G6
155	S	CR ⁶	CR ⁷	G7
156	S	CR ⁶	CR ⁷	G1,G7
157	S	CR ⁶	CR ⁷	G2,G3,G4,G5,G6
158	S	CR ⁶	CR ⁷	J1,J2,J3,J4,G7
159	S	CR ⁶	CR ⁷	J1
160	S	CR ⁶	CR ⁷	J2
161	S	CR ⁶	CR ⁷	J3
162	S	CR ⁶	CR ⁷	J4
163	S	CR ⁶	CR ⁷	J5
164	S	CR ⁶	CR ⁷	J6
165	S	CR ⁶	CR ⁷	J7
166	S	CR ⁶	CR ⁷	J8
167	S	CR ⁶	CR ⁷	J9
168	S	CR ⁶	CR ⁷	J10
169	S	CR ⁶	CR ⁷	J11
170	S	CR ⁶	CR ⁷	J12
171	S	CR ⁶	CR ⁷	J13
172	S	CR ⁶	CR ⁷	J14
173	S	CR ⁶	CR ⁷	J15
174	S	CR ⁶	CR ⁷	J16
175	S	CR ⁶	CR ⁷	J17

10

20

30

[表 8]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
176	S	CR ⁶	CR ⁷	J18
177	S	CR ⁶	CR ⁷	J10
178	S	CR ⁶	CR ⁷	J20
179	S	CR ⁶	CR ⁷	J21
180	S	CR ⁶	CR ⁷	J22
181	S	CR ⁶	CR ⁷	J23
182	S	CR ⁶	CR ⁷	J24
183	S	CR ⁶	CR ⁷	J25
184	S	CR ⁶	CR ⁷	J26
185	S	CR ⁶	CR ⁷	J27
186	S	CR ⁶	N	G1
187	S	CR ⁶	N	G2
188	S	CR ⁶	N	G3
189	S	CR ⁶	N	G4
190	S	CR ⁶	N	G5
191	S	CR ⁶	N	G6
192	S	CR ⁶	N	G7
193	S	CR ⁶	N	G1,G7
194	S	CR ⁶	N	G2,G3,G4,G5,G6
195	S	CR ⁶	N	J1,J2,J3,J4,G7
196	S	CR ⁶	N	J1
197	S	CR ⁶	N	J2
198	S	CR ⁶	N	J3
199	S	CR ⁶	N	J4
200	S	CR ⁶	N	J5

10

20

30

[表 9]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
201	S	CR ⁶	N	J6
202	S	CR ⁶	N	J7
203	S	CR ⁶	N	J8
204	S	CR ⁶	N	J9
205	S	CR ⁶	N	J10
206	S	CR ⁶	N	J11
207	S	CR ⁶	N	J12
208	S	CR ⁶	N	J13
209	S	CR ⁶	N	J14
210	S	CR ⁶	N	J15
211	S	CR ⁶	N	J16
212	S	CR ⁶	N	J17
213	S	CR ⁶	N	J18
214	S	CR ⁶	N	J10
215	S	CR ⁶	N	J20
216	S	CR ⁶	N	J21
217	S	CR ⁶	N	J22
218	S	CR ⁶	N	J23
219	S	CR ⁶	N	J24
220	S	CR ⁶	N	J25
221	S	CR ⁶	N	J26
222	S	CR ⁶	N	J27
223	NR ⁵	N	CR ⁷	G1
224	NR ⁵	N	CR ⁷	G2
225	NR ⁵	N	CR ⁷	G3

10

20

30

[表 1 0]

態様	A ¹	A ²	A ³	G
226	NR ⁵	N	CR ⁷	G4
227	NR ⁵	N	CR ⁷	G5
228	NR ⁵	N	CR ⁷	G6
229	NR ⁵	N	CR ⁷	G7
230	O	N	CR ⁷	G1
231	O	N	CR ⁷	G2
232	O	N	CR ⁷	G3
233	O	N	CR ⁷	G4
234	O	N	CR ⁷	G5
235	O	N	CR ⁷	G6
236	O	N	CR ⁷	G7
237	S	N	CR ⁷	G1
238	S	N	CR ⁷	G2
239	S	N	CR ⁷	G3
240	S	N	CR ⁷	G4
241	S	N	CR ⁷	G5
242	S	N	CR ⁷	G6
243	S	N	CR ⁷	G7

10

20

式(1A)において、R⁵がメチル基であり、R⁶及びR⁷が水素原子であり、A¹、A²、A³、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

式(1A)において、

R¹がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい)、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、又は、ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、

30

R²がハロゲン原子、又は水素原子であり、

R³及びR⁴が同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、OR⁸、S(O)_mR⁸、ハロゲン原子、又は水素原子であり、

R⁵が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、CO₂R⁸、C(O)R⁸、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C9脂環式炭化水素基、又は水素原子であり、

40

A¹、A²、A³、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

式(1A)において、

R¹がメチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、シクロプロピルメチル基、又はシクロプロピル基であり、

R²が水素原子であり、

R³及びR⁴が同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6鎖式炭化水素基、OR⁸(ここで、R⁸は1以上のハロゲン原子を有しているC1-C6鎖式炭化水素基を表す)、又はS(O)_mR⁸(ここで、R⁸は1以上のハロゲン原子を有しているC

50

1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)、ハロゲン原子又は水素原子であり、
 R^5 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、又は水素原子であり、
 R^6 及び R^7 が水素原子であり、
 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；
式(1A)において、
 R^1 がエチル基であり、
 R^2 が水素原子であり、
 R^3 がC 1 - C 3 パーフルオロアルキル基、C 1 - C 3 パーフルオロアルキルスルファニル基、C 1 - C 3 パーフルオロアルキルスルフィニル基、又はC 1 - C 3 パーフルオロアルキルスルホニル基であり、
 R^4 が水素原子であり、
 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；
式(1B)において、 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物
式(1B)において、 R^5 がメチル基であり、 R^6 及び R^7 が水素原子である A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；
式(1B)において、 R^5 がメチル基であり、 R^6 及び R^7 が水素原子であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；
式(1B)において、
 R^1 がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上のC 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい)、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルケニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 6 アルキニル基、又は、ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基であり、
 R^2 がハロゲン原子、又は水素原子であり、
 R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、ハロゲン原子、又は水素原子であり、
 R^5 が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、 CO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC 3 - C 9 脂環式炭化水素基、又は水素原子であり、
 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；
式(1B)において、
 R^1 がメチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、シクロプロピルメチル基、又はシクロプロピル基であり、
 R^2 が水素原子であり、
 R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有しているC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、 OR^8 (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC 1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)、又は $S(O)_mR^8$ (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC 1 - C 6 鎖式炭化水素基を表す)、ハロゲン原子又は水素原子であり、
 R^5 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、又は水素原子であり、
 R^6 及び R^7 が水素原子であり、
 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；
式(1B)において、
 R^1 がエチル基であり、
 R^2 が水素原子であり、

10

20

30

40

50

R^3 がC1 - C3パーフルオロアルキル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルファニル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルフィニル基、又はC1 - C3パーフルオロアルキルスルホニル基であり、

R^4 が水素原子であり、

A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

式(1C)において、 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

式(1C)において、 R^5 がメチル基であり、 R^6 及び R^7 が水素原子であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

式(1C)において、

R^1 がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1以上のハロゲン原子、もしくは1以上のC1 - C3アルキル基を有していてもよい)、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルケニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC2 - C6アルキニル基、又は、ハロゲン原子及び1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基からなる群より選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基であり、

R^2 がハロゲン原子、又は水素原子であり、

R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、群Uより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、 OR^8 、 $S(O)_mR^8$ 、ハロゲン原子、又は水素原子であり、

R^5 が群Xより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(O)R^8$ 、群Vより選ばれる1以上の原子もしくは基を有していてもよいC3 - C9脂環式炭化水素基、又は水素原子であり、

A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

式(1C)において、

R^1 がメチル基、エチル基、プロピル基、トリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、シクロプロピルメチル基、又はシクロプロピル基であり、

R^2 が水素原子であり、

R^3 及び R^4 が同一又は相異なり、1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基、 OR^8 (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基を表す)、又は $S(O)_mR^8$ (ここで、 R^8 は1以上のハロゲン原子を有しているC1 - C6鎖式炭化水素基を表す)、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^5 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又は水素原子であり、

R^6 及び R^7 が水素原子であり、

A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

式(1C)において、

R^1 がエチル基であり、

R^2 が水素原子であり、

R^3 がC1 - C3パーフルオロアルキル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルファニル基、C1 - C3パーフルオロアルキルスルフィニル基、又はC1 - C3パーフルオロアルキルスルホニル基であり、

R^4 が水素原子であり、

A^1 、 A^2 、 A^3 、及びGが、〔表1〕～〔表10〕の組み合わせである化合物；

【0007】

次に、本発明化合物の製造法について説明する。

本発明化合物及び中間体化合物は、例えば以下の(製造法1)～(製造法7)により製造することができる。

(製造法1)

10

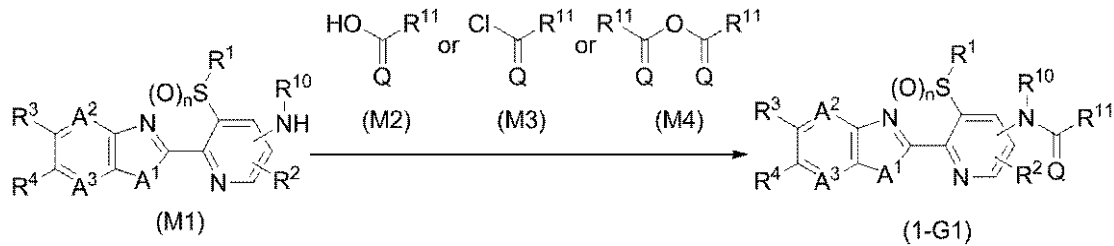
20

30

40

50

中間体化合物 (M1) と、化合物 (M2)、化合物 (M3) 又は化合物 (M4) とを反応させることにより、式 (1) において G が G1 である本発明化合物 (1-G1) を製造することができる。



10

[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

中間体化合物 (M1) と化合物 (M2) とを反応させることにより、本発明化合物 (1-G1) を製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン (以下、THFと記す)、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド (以下、DMFと記す)、N-メチルピロリドン (以下、NMPと記す)、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド (以下、DMSOと記す) 等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

20

反応に用いられる縮合剤としては、例えば1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (以下、EDCI塩酸塩と記す)、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類が挙げられる。

該反応は、必要に応じて触媒を加えて行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えば1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (以下、HOBtと記す) が挙げられる。

該反応には、中間体化合物 (M1) 1モルに対して、化合物 (M2) が通常1~2モルの割合、縮合剤が通常1~5モルの割合、触媒が通常0.01~1モルの割合で用いられる。

30

該反応の反応温度は、通常、0~120の範囲である。該反応の反応時間は、通常、0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒で抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；又は、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより本発明化合物 (1-G1) を単離することができる。単離された本発明化合物 (1-G1) は、再結晶、クロマトグラフィ - 等により更に精製することもできる。

中間体化合物 (M1) と、化合物 (M3) 又は化合物 (M4) とを反応させることにより、本発明化合物 (1-G1) を製造することができる。

40

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及び

50

ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

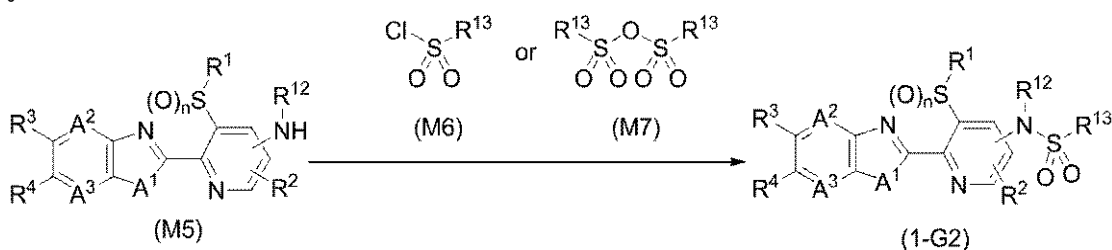
該反応には、中間体化合物(M1)1モルに対して、化合物(M3)又は化合物(M4)が通常1~2モルの割合、塩基が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-20~100の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-G1)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-G1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造法2)

中間体化合物(M5)と、化合物(M6)又は化合物(M7)とを反応させることにより、式(1)においてGがG2である本発明化合物(1-G2)を製造することができる。



[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M5)1モルに対して、化合物(M6)又は化合物(M7)が通常1~2モルの割合、塩基が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-20~100の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-G2)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-G2)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造法3)

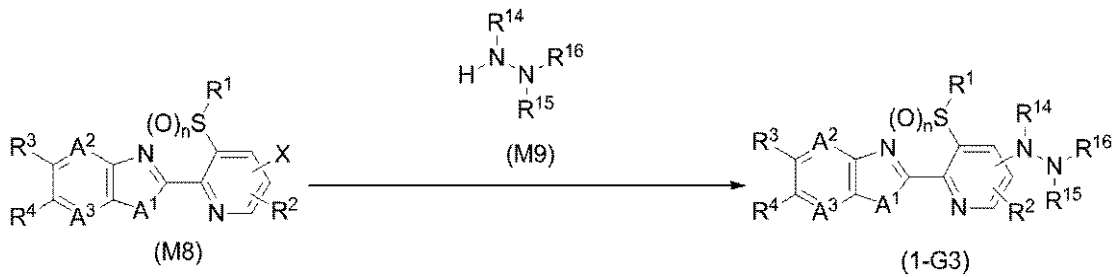
中間体化合物(M8)と化合物(M9)とを反応させることにより、式(1)においてGがG3である本発明化合物(1-G3)を製造することができる。

10

20

30

40



[式中、X はフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表し、その他の記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、リン酸三カリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

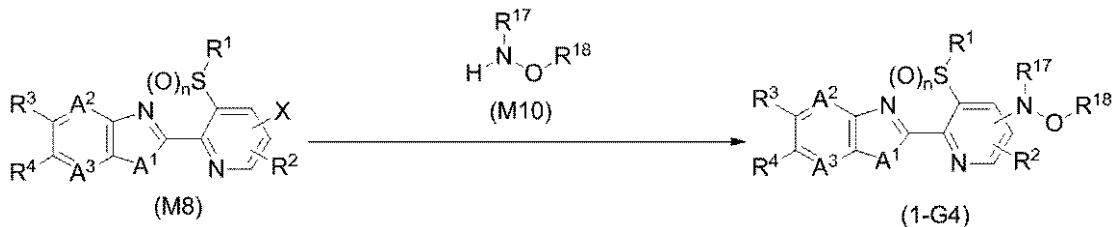
該反応には、中間体化合物 (M 8) 1 モルに対して、化合物 (M 9) が通常 1 ~ 5 モルの割合、塩基が通常 1 ~ 5 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 150 の範囲である。該反応の反応時間は通常 0 . 1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物 (1 - G 3) を単離することができる。単離された本発明化合物 (1 - G 3) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造法 4)

中間体化合物 (M 8) と化合物 (M 1 0) とを反応させることにより、式 (1) において G が G 4 である本発明化合物 (1 - G 4) を製造することができる。



[式中、記号は前記と同じ意味を表す。]

化合物 (M 9) に代えて、化合物 (M 1 0) を用い、製造法 3 に記載の方法に準じて、本発明化合物 (1 - G 4) を製造することができる。

(製造法 5)

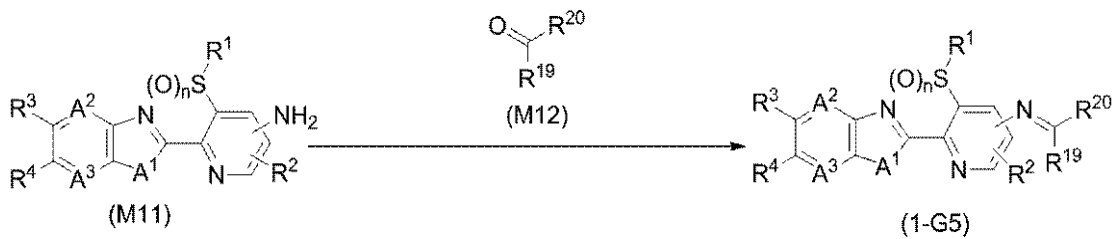
中間体化合物 (M 1 1) と化合物 (M 1 2) とを反応させることにより、式 (1) において G が G 5 である本発明化合物 (1 - G 5) を製造することができる。

10

20

30

40



[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

該反応は、溶媒の存在下で行われるか、または化合物 (M 1 2) を溶媒として用いることもできる。

10

反応に用いられる溶媒としては、例えば T H F、エチレングリコールジメチルエーテル、tert - ブチルメチルエーテル、1, 4 - ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて脱水剤を加えて行うこともできる。

反応に用いられる脱水剤としては、塩酸等の鉱酸類、パラトルエンスルホン酸等のスルホン酸類が挙げられる。

該反応には、中間体化合物 (M 1 1) 1 モルに対して、化合物 (M 1 2) が通常 1 ~ 5

20

モルの割合、脱水剤が通常 0 . 1 ~ 2 モルの割合で用いられる。

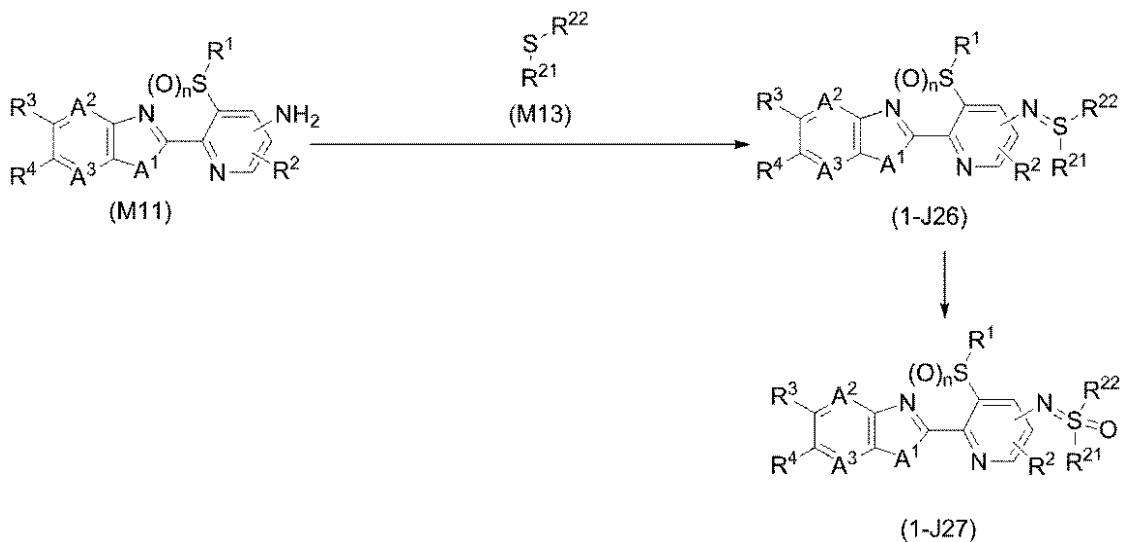
該反応の反応温度は、通常 0 ~ 1 5 0 の範囲である。該反応の反応時間は通常 0 . 1 ~ 2 4 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物 (1 - G 5) を単離することができる。単離された本発明化合物 (1 - G 5) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造法 6)

中間体化合物 (M 1 1) と化合物 (M 1 3) とを酸化剤存在下で反応させることにより、式 (1) において G が G 6 であり、p が 0 である本発明化合物 (1 - J 2 6) を製造

30



40

[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

中間体化合物 (M 1 1) と化合物 (M 1 3) とを酸化剤存在下で反応させることにより、本発明化合物 (1 - J 2 6) を製造することができる。

50

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール等のアルコール類、水、及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、N-クロロスクシンイミド等のハロゲン化剤、ヨードベンゼンジアセタート等の超原子化ヨウ素化合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M11)1モルに対して、化合物(M13)が通常1~5モルの割合、酸化剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~150の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-J26)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-J26)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

本発明化合物(1-J26)を酸化することにより、式(1)においてGがG6であり、pが1である本発明化合物(1-J27)を製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

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

反応に用いられる酸化剤としては、例えば過ヨウ素酸ナトリウム又はm-クロロ過安息香酸が挙げられる。

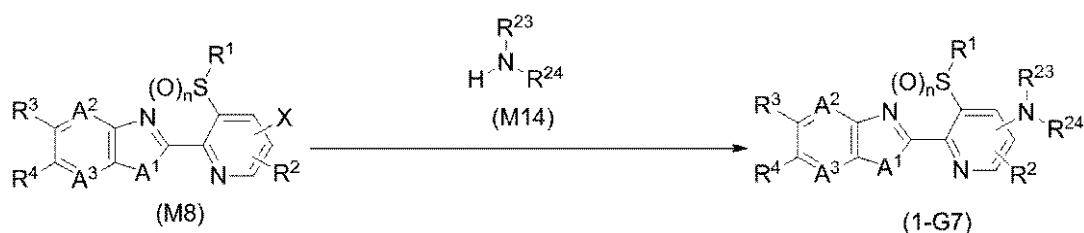
該反応には、本発明化合物(1-J26)1モルに対して、酸化剤が通常1~3モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-50~50の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~12時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1-J27)を単離することができる。単離された本発明化合物(1-J27)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

(製造法7)

中間体化合物(M8)と化合物(M14)とを反応させることにより、式(1)においてGがG7である本発明化合物(1-G7)を製造することができる。



[式中、記号は前記と同じ意味を表す。]

化合物(M9)に代えて、化合物(M14)を用い、製造法3に記載の方法に準じて、本発明化合物(1-G7)を製造することができる。

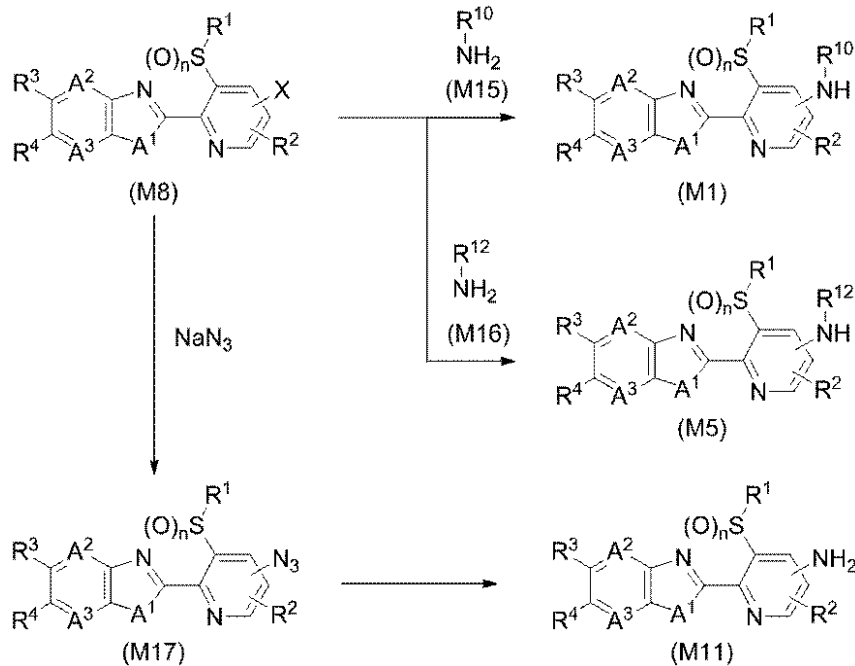
(製造法8)

中間体化合物(M8)は、例えば、特許文献1(国際公開2013/018928号)記載の方法で合成することができる。

中間体化合物 (M1) は、中間体化合物 (M8) と化合物 (M15) とを反応させることにより製造することができる。

中間体化合物 (M5) は、中間体化合物 (M8) と化合物 (M16) とを反応させることにより製造することができる。

中間体化合物 (M11) は、中間体化合物 (M8) とアジ化ナトリウムと反応させ中間体化合物 (M17) を製造した後に還元することにより製造することができる。



10

20

[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

化合物 (M9) に代えて、化合物 (M15) を用い、製造法 3 に記載の方法に準じて、中間体化合物 (M1) を製造することができる。

化合物 (M9) に代えて、化合物 (M16) を用い、製造法 3 に記載の方法に準じて、中間体化合物 (M5) を製造することができる。

中間体化合物 (M8) とアジ化ナトリウムと反応させることにより、中間体化合物 (M17) を製造することができる。

30

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、DMF、NMP、DMSO 等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール等のアルコール類、水、及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物 (M8) 1 モルに対して、アジ化ナトリウムが通常 1 ~ 5 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 150 の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

40

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物 (M17) を単離することができる。

中間体化合物 (M17) を還元することにより中間体化合物 (M11) を製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセ

50

トニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる還元剤としては、トリフェニルホスフィン、トリブチルホスフィン等のホスフィン化合物、塩化スズ(II)、亜鉛等が挙げられる。

該反応は、必要に応じて酸を加えて行うこともできる。

反応に用いられる酸としては、塩酸等の鉱酸類、酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M17)1モルに対して、還元剤が通常1~5モルの割合、酸が通常0.01~1モルの割合で用いられる。

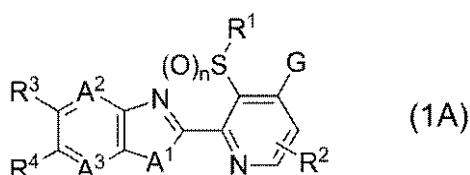
該反応の反応温度は、通常0~150の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M11)を単離することができる。単離された中間体化合物(M11)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0008】

次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。

式(1A)



において、R¹がエチル基であり、R²及びR⁴が水素原子であり、R³がトリフルオロメチル基であり、nが0であり、A¹、A²、A³及びGが、〔表11〕~〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

[表11]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
1	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)CH ₂ Ph
2	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)CycPr
3	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)Ph
4	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)(2-furyl)
5	NCH ₃	CH	CH	N(CycPr)C(O)CH ₃
6	NCH ₃	CH	CH	N{C(O)CH ₃ } ₂
7	NCH ₃	CH	CH	NHCO ₂ CH ₂ CycPr
8	NCH ₃	CH	CH	N(CycPr)CO ₂ CH ₃
9	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
10	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂
11	NCH ₃	CH	CH	NCH ₃ C(O)N(CH ₃) ₂
12	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)C(O)OCH ₃
13	NCH ₃	CH	CH	NHC(O)CO ₂ CH ₂ CH ₃
14	NCH ₃	CH	CH	NHSO ₂ CH ₃
15	NCH ₃	CH	CH	NHSO ₃ CH ₃
16	NCH ₃	CH	CH	NHNHC(O)CH ₃
17	NCH ₃	CH	CH	NHNHCO ₂ CH ₃
18	NCH ₃	CH	CH	NHNHCO ₂ CH ₂ CH ₃
19	NCH ₃	CH	CH	N(CH ₃)N(CH ₃)CO ₂ CH ₃
20	NCH ₃	CH	CH	NHNHC(O)N(CH ₃) ₂
21	NCH ₃	CH	CH	NHNHSO ₂ CH ₃
22	NCH ₃	CH	CH	N(CH ₃)OCH ₃
23	NCH ₃	CH	CH	N(H)OCH ₃
24	NCH ₃	CH	CH	NHOC(O)CH ₃
25	NCH ₃	CH	CH	NHOCO ₂ CH ₃

10

20

30

[表 1 2]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
26	NCH ₃	CH	CH	N=C(CH ₃) ₂
27	NCH ₃	CH	CH	N=C(H)OCH ₃
28	NCH ₃	CH	CH	N=C(H)N(CH ₃) ₂
29	NCH ₃	CH	CH	N=S(CH ₃) ₂
30	NCH ₃	CH	CH	N=S(O)(CH ₃) ₂
31	NCH ₃	CH	CH	NHBn
32	NCH ₃	CH	CH	NHCH ₂ (2-furyl)
33	NCH ₃	CH	CH	NHCycPr
34	NCH ₃	CH	CH	N(CH ₃)CycPr
35	NCH ₃	CH	N	NHC(O)CH ₂ Ph
36	NCH ₃	CH	N	NHC(O)CycPr
37	NCH ₃	CH	N	NHC(O)Ph
38	NCH ₃	CH	N	NHC(O)(2-furyl)
39	NCH ₃	CH	N	N(CycPr)C(O)CH ₃
40	NCH ₃	CH	N	N{C(O)CH ₃ } ₂
41	NCH ₃	CH	N	NHCO ₂ CH ₂ CycPr
42	NCH ₃	CH	N	N(CycPr)CO ₂ CH ₃
43	NCH ₃	CH	N	NHC(O)N(CH ₃) ₂
44	NCH ₃	CH	N	NHC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂
45	NCH ₃	CH	N	NCH ₃ C(O)N(CH ₃) ₂
46	NCH ₃	CH	N	NHC(O)C(O)OCH ₃
47	NCH ₃	CH	N	NHC(O)CO ₂ CH ₂ CH ₃
48	NCH ₃	CH	N	NHSO ₂ CH ₃
49	NCH ₃	CH	N	NHSO ₃ CH ₃
50	NCH ₃	CH	N	NHNHC(O)CH ₃

10

20

30

[表 1 3]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
51	NCH ₃	CH	N	NHNHCO ₂ CH ₃
52	NCH ₃	CH	N	NHNHCO ₂ CH ₂ CH ₃
53	NCH ₃	CH	N	N(CH ₃)N(CH ₃)CO ₂ CH ₃
54	NCH ₃	CH	N	NHNHC(O)N(CH ₃) ₂
55	NCH ₃	CH	N	NHNHSO ₂ CH ₃
56	NCH ₃	CH	N	N(CH ₃)OCH ₃
57	NCH ₃	CH	N	N(H)OCH ₃
58	NCH ₃	CH	N	NHOC(O)CH ₃
59	NCH ₃	CH	N	NHOCO ₂ CH ₃
60	NCH ₃	CH	N	N=C(CH ₃) ₂
61	NCH ₃	CH	N	N=C(H)OCH ₃
62	NCH ₃	CH	N	N=C(H)N(CH ₃) ₂
63	NCH ₃	CH	N	N=S(CH ₃) ₂
64	NCH ₃	CH	N	N=S(O)(CH ₃) ₂
65	NCH ₃	CH	N	NHBn
66	NCH ₃	CH	N	NHCH ₂ (2-furyl)
67	NCH ₃	CH	N	NHCycPr
68	NCH ₃	CH	N	N(CH ₃)CycPr
69	O	CH	CH	NHC(O)CH ₂ Ph
70	O	CH	CH	NHC(O)CycPr
71	O	CH	CH	NHC(O)Ph
72	O	CH	CH	NHC(O)(2-furyl)
73	O	CH	CH	N(CycPr)C(O)CH ₃
74	O	CH	CH	N{C(O)CH ₃ } ₂
75	O	CH	CH	NHCO ₂ CH ₂ CycPr

10

20

30

[表 1 4]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
76	O	CH	CH	N(CycPr)CO ₂ CH ₃
77	O	CH	CH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
78	O	CH	CH	NHC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂
79	O	CH	CH	NCH ₃ C(O)N(CH ₃) ₂
80	O	CH	CH	NHC(O)C(O)OCH ₃
81	O	CH	CH	NHC(O)CO ₂ CH ₂ CH ₃
82	O	CH	CH	NHSO ₂ CH ₃
83	O	CH	CH	NHSO ₃ CH ₃
84	O	CH	CH	NHNHC(O)CH ₃
85	O	CH	CH	NHNHCO ₂ CH ₃
86	O	CH	CH	NHNHCO ₂ CH ₂ CH ₃
87	O	CH	CH	N(CH ₃)N(CH ₃)CO ₂ CH ₃
88	O	CH	CH	NHNHC(O)N(CH ₃) ₂
89	O	CH	CH	NHNHSO ₂ CH ₃
90	O	CH	CH	N(CH ₃)OCH ₃
91	O	CH	CH	N(H)OCH ₃
92	O	CH	CH	NHOC(O)CH ₃
93	O	CH	CH	NHOCO ₂ CH ₃
94	O	CH	CH	N=C(CH ₃) ₂
95	O	CH	CH	N=C(H)OCH ₃
96	O	CH	CH	N=C(H)N(CH ₃) ₂
97	O	CH	CH	N=S(CH ₃) ₂
98	O	CH	CH	N=S(O)(CH ₃) ₂
99	O	CH	CH	NHBn
100	O	CH	CH	NHCH ₂ (2-furyl)

10

20

30

[表 1 5]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
101	O	CH	CH	NHCycPr
102	O	CH	CH	N(CH ₃)CycPr
103	O	CH	N	NHC(O)CH ₂ Ph
104	O	CH	N	NHC(O)CycPr
105	O	CH	N	NHC(O)Ph
106	O	CH	N	NHC(O)(2-furyl)
107	O	CH	N	N(CycPr)C(O)CH ₃
108	O	CH	N	N{C(O)CH ₃ } ₂
109	O	CH	N	NHCO ₂ CH ₂ CycPr
110	O	CH	N	N(CycPr)CO ₂ CH ₃
111	O	CH	N	NHC(O)N(CH ₃) ₂
112	O	CH	N	NHC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂
113	O	CH	N	NCH ₃ C(O)N(CH ₃) ₂
114	O	CH	N	NHC(O)C(O)OCH ₃
115	O	CH	N	NHC(O)CO ₂ CH ₂ CH ₃
116	O	CH	N	NHSO ₂ CH ₃
117	O	CH	N	NHSO ₃ CH ₃
118	O	CH	N	NHNHC(O)CH ₃
119	O	CH	N	NHNHCO ₂ CH ₃
120	O	CH	N	NHNHCO ₂ CH ₂ CH ₃
121	O	CH	N	N(CH ₃)N(CH ₃)CO ₂ CH ₃
122	O	CH	N	NHNHC(O)N(CH ₃) ₂
123	O	CH	N	NHNHSO ₂ CH ₃
124	O	CH	N	N(CH ₃)OCH ₃
125	O	CH	N	N(H)OCH ₃

10

20

30

[表 1 6]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
126	O	CH	N	NHOC(O)CH ₃
127	O	CH	N	NHOCO ₂ CH ₃
128	O	CH	N	N=C(CH ₃) ₂
129	O	CH	N	N=C(H)OCH ₃
130	O	CH	N	N=C(H)N(CH ₃) ₂
131	O	CH	N	N=S(CH ₃) ₂
132	O	CH	N	N=S(O)(CH ₃) ₂
133	O	CH	N	NHBn
134	O	CH	N	NHCH ₂ (2-furyl)
135	O	CH	N	NHCycPr
136	O	CH	N	N(CH ₃)CycPr
137	S	CH	CH	NHC(O)CH ₂ Ph
138	S	CH	CH	NHC(O)CycPr
139	S	CH	CH	NHC(O)Ph
140	S	CH	CH	NHC(O)(2-furyl)
141	S	CH	CH	N(CycPr)C(O)CH ₃
142	S	CH	CH	N{C(O)CH ₃ } ₂
143	S	CH	CH	NHCO ₂ CH ₂ CycPr
144	S	CH	CH	N(CycPr)CO ₂ CH ₃
145	S	CH	CH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
146	S	CH	CH	NHC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂
147	S	CH	CH	NCH ₃ C(O)N(CH ₃) ₂
148	S	CH	CH	NHC(O)C(O)OCH ₃
149	S	CH	CH	NHC(O)CO ₂ CH ₂ CH ₃
150	S	CH	CH	NHSO ₂ CH ₃

10

20

30

[表 1 7]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
151	S	CH	CH	NHSO ₃ CH ₃
152	S	CH	CH	NHNHC(O)CH ₃
153	S	CH	CH	NHNHCO ₂ CH ₃
154	S	CH	CH	NHNHCO ₂ CH ₂ CH ₃
155	S	CH	CH	N(CH ₃)N(CH ₃)CO ₂ CH ₃
156	S	CH	CH	NHNHC(O)N(CH ₃) ₂
157	S	CH	CH	NHNHSO ₂ CH ₃
158	S	CH	CH	N(CH ₃)OCH ₃
159	S	CH	CH	N(H)OCH ₃
160	S	CH	CH	NHOC(O)CH ₃
161	S	CH	CH	NHOCO ₂ CH ₃
162	S	CH	CH	N=C(CH ₃) ₂
163	S	CH	CH	N=C(H)OCH ₃
164	S	CH	CH	N=C(H)N(CH ₃) ₂
165	S	CH	CH	N=S(CH ₃) ₂
166	S	CH	CH	N=S(O)(CH ₃) ₂
167	S	CH	CH	NHBn
168	S	CH	CH	NHCH ₂ (2-furyl)
169	S	CH	CH	NHCycPr
170	S	CH	CH	N(CH ₃)CycPr
171	S	CH	N	NHC(O)CH ₂ Ph
172	S	CH	N	NHC(O)CycPr
173	S	CH	N	NHC(O)Ph
174	S	CH	N	NHC(O)(2-furyl)
175	S	CH	N	N(CycPr)C(O)CH ₃

10

20

30

[表 1 8]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
176	S	CH	N	N{C(O)CH ₃ } ₂
177	S	CH	N	NHCO ₂ CH ₂ CycPr
178	S	CH	N	N(CycPr)CO ₂ CH ₃
179	S	CH	N	NHC(O)N(CH ₃) ₂
180	S	CH	N	NHC(O)N(CH ₂ CH ₃) ₂
181	S	CH	N	NCH ₃ C(O)N(CH ₃) ₂
182	S	CH	N	NHC(O)C(O)OCH ₃
183	S	CH	N	NHC(O)CO ₂ CH ₂ CH ₃
184	S	CH	N	NHSO ₂ CH ₃
185	S	CH	N	NHSO ₃ CH ₃
186	S	CH	N	NHNHC(O)CH ₃
187	S	CH	N	NHNHCO ₂ CH ₃
188	S	CH	N	NHNHCO ₂ CH ₂ CH ₃
189	S	CH	N	N(CH ₃)N(CH ₃)CO ₂ CH ₃
190	S	CH	N	NHNHC(O)N(CH ₃) ₂
191	S	CH	N	NHNHSO ₂ CH ₃
192	S	CH	N	N(CH ₃)OCH ₃
193	S	CH	N	N(H)OCH ₃
194	S	CH	N	NHOC(O)CH ₃
195	S	CH	N	NHOCO ₂ CH ₃
196	S	CH	N	N=C(CH ₃) ₂
197	S	CH	N	N=C(H)OCH ₃
198	S	CH	N	N=C(H)N(CH ₃) ₂
199	S	CH	N	N=S(CH ₃) ₂
200	S	CH	N	N=S(O)(CH ₃) ₂

10

20

30

[表 1 9]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
201	S	CH	N	NHBn
202	S	CH	N	NHCH ₂ (2-furyl)
203	S	CH	N	NHCycPr
204	S	CH	N	N(CH ₃)CycPr
205	NCH ₃	CH	CH	NHCH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
206	NCH ₃	CH	CH	NHCH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
207	NCH ₃	CH	CH	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
208	NCH ₃	CH	CH	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
209	NCH ₃	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
210	NCH ₃	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
211	NCH ₃	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
212	NCH ₃	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
213	NCH ₃	CH	N	NHCH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
214	NCH ₃	CH	N	NHCH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
215	NCH ₃	CH	N	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
216	NCH ₃	CH	N	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
217	NCH ₃	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
218	NCH ₃	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
219	NCH ₃	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
220	NCH ₃	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
221	O	CH	CH	NHCH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
222	O	CH	CH	NHCH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
223	O	CH	CH	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
224	O	CH	CH	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
225	O	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)

10

20

30

[表 2 0]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
226	O	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
227	O	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
228	O	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
229	O	CH	N	NHCH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
230	O	CH	N	NHCH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
231	O	CH	N	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
232	O	CH	N	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
233	O	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
234	O	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
235	O	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
236	O	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
237	S	CH	CH	NHCH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
238	S	CH	CH	NHCH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
239	S	CH	CH	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
240	S	CH	CH	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
241	S	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
242	S	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
243	S	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
244	S	CH	CH	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
245	S	CH	N	NHCH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
246	S	CH	N	NHCH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)
247	S	CH	N	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
248	S	CH	N	NHCH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
249	S	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (2-chloro-thiazol-5-yl)
250	S	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (6-chloro-pyridin-3-yl)

10

20

30

[表 2 1]

例示	A ¹	A ²	A ³	G
251	S	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)
252	S	CH	N	N(CH ₃)CH ₂ (tetrahydrofuran-2-yl)

40

(上記の〔表 1 1〕～〔表 2 1〕において、C y c P r はシクロプロピル基を表し、P h はフェニル基を表し、2 - f u r y l はフリル - 2 - イル基を表し、B n はベンジル基を表す。)

式(1A)において、R¹がエチル基であり、R²及びR⁴が水素原子であり、R³がトリフルオロメチル基であり、nが1であり、A¹、A²、A³及びGが、〔表 1 1〕～〔表 2 1〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

式(1A)において、R¹がエチル基であり、R²及びR⁴が水素原子であり、R³がトリフルオロメチル基であり、nが2であり、A¹、A²、A³及びGが、〔表 1 1〕～〔表 2 1〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

50

ルオロメチルスルファニル基であり、 n が0であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルファニル基であり、 n が1であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルファニル基であり、 n が2であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルフィニル基であり、 n が0であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

10

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルフィニル基であり、 n が1であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルフィニル基であり、 n が2であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 n が0であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

20

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 n が1であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

式(1C)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 n が2であり、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び G が、〔表11〕～〔表21〕に記載の組み合わせである本発明化合物；

【0009】

本発明化合物が効力を有する有害生物としては、例えば、昆虫綱類、クモ綱類、唇脚綱類、倍脚綱類、軟甲綱類、腹足綱類等の有害節足動物及び線虫等の有害線形動物が挙げられる。有害昆虫綱類としては、例えば半翅目害虫、鱗翅目害虫、アザミウマ目害虫、双翅目害虫、鞘翅目害虫、直翅目害虫、隠翅目害虫、シラミ目害虫、ハジラミ目害虫、膜翅目害虫、ゴキブリ目害虫、シロアリ目害虫等が挙げられる。クモ綱類としては、例えばクモ目害虫、ダニ目害虫等が挙げられる。かかる有害生物としては、具体的には例えば、以下のものが挙げられる。

30

半翅目害虫：ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) 等のウンカ類、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*) 等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*) 等のアブラムシ類、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavetus*)、クモヘリカメムシ (*Leptocoris chinensis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*) 等の

40

50

カメムシ類、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*) 等のコナジラミ類、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、シトラススノースケール (*Unaspis citri*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinus*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*) 等のカイガラムシ類、グンバイムシ類、トコジラミ (*Cimex lectularius*) 等のトコジラミ類、及びキジラミ類。

10

鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、サンカメイガ (*Tryporyza incertulas*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ワタノメイガ (*Notarcha derogata*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*) 等のメイガ類、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、タマナギンウバ (*Plusia nigrisigna*)、トリコプルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、アドキシソフィエス属、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、アズキサヤムシ (*Matsumuraesia azukivora*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、コドリガ (*Cydia pomonella*) 等のハマキガ類、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoneella*) のホソガ類、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*) 等のシンクイガ類、リオネティア属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユープロクティス属等のドクガ類、コナガ (*Plutella xylostella*) 等のスガ類、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*) ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*) 等のキバガ類、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ類、及びイガ (*Tinea translucens*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 等のヒロズコガ類。

20

30

アザミウマ目害虫：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips parmi*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*) 等のアザミウマ類。

40

双翅目害虫：アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*) 等のイエカ類、ネッタيشマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*) 等のエーデス属、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*) 等のアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ (*Musca domestica*)、オオイエバエ (*Musc*

50

ina stabulans)等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ(Delia platura)、タマネギバエ(Delia antiqua)等のハナバエ類、イネハモグリバエ(Agromyza oryzae)、イネヒメハモグリバエ(Hydrellia griseola)、トマトハモグリバエ、(Liriomyza sativae)、マメハモグリバエ(Liriomyza trifolii)、ナモグリバエ(Chromatomyia horticola)等のハモグリバエ類、イネキモグリバエ(Chlorops oryzae)等のキモグリバエ類、ウリミバエ(Dacus cucurbitae)、チチュウカイミバエ(Ceratititis capitata)等のミバエ類、ショウジョウバエ類、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)等のチョウバエ類、クロバネキノコバエ類、ブコ類、ウシアブ(Tabanus trigonus)等のアブ類、シラミバエ類及びサシバエ類。

10

鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム(Diabrotica virgifera virgifera)、サザンコーンルートワーム(Diabrotica undecimpunctata howardi)等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ(Anomala cuprea)、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、マメコガネ(Popillia japonica)等のコガネムシ類、メイズウィービル(Sitophilus zeamais)、イネミズゾウムシ(Lissorhopterus oryzophilus)、アズキゾウムシ(Callosobruchus chienensis)、イネゾウムシ(Echinocnemus squameus)、ワタミゾウムシ(Anthonomus grandis)、シバオサゾウムシ(Sphenophorus venatus)等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ(Tenebrio molitor)、コクヌストモドキ(Tribolium castaneum)等のゴミムシダマシ類、

20

イネドロオイムシ(Oulema oryzae)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、キスジノミハムシ(Phyllotreta striolata)、コロラドハムシ(Leptinotarsa decemlineata)等のハムシ類、ヒメマルカツオブシムシ(Anthrenus verbasci)、ハラジロカツオブシムシ(Dermestes maculatus)等のカツオブシムシ類、タバコシバンムシ(Lasioderma serricorne)等のシバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintioctopunctata)等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、マツノキクイムシ(Tomicus piniperda)等のキクイムシ類、ナガシクイムシ類、ヒョウホンムシ類、ゴマダラカミキリ(Anoplophora malasiaca)等のカミキリムシ類、コメツキムシ類(Agriotes spp.、Limoniusspp.)、及びアオバアリガタハネカクシ(Paederus fuscipes)。

30

直翅目害虫：トノサマバッタ(Locusta migratoria)、ケラ(Gryllotalpa africana)、コバネイナゴ(Oxya yezoensis)、ハネナガイナゴ(Oxya japonica)、及びコオロギ類。

40

隠翅目害虫：ネコノミ(Ctenocephalides felis)、イヌノミ(Ctenocephalides canis)、ヒトノミ(Pulex irritans)、ケオプスネズミノミ(Xenopsylla cheopis)等。

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

50

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

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

10

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

20

ゴキブリ目害虫：チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)。

シロアリ目害虫：ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、アメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*)、コウシュンシロアリ (*Neotermes koshunensis*)、サツマシロアリ (*Glyptotermes satsumensis*)、

30

ナカジマシロアリ (*Glyptotermes nakajimai*)、カタンシロアリ (*Glyptotermes fuscus*)、コダマシロアリ (*Glyptotermes kodamai*)、クシモトシロアリ (*Glyptotermes kushimensis*)、オオシロアリ (*Hodotermopsis japonica*)、コウシュウイエシロアリ (*Coptotermes guangzhoensis*)、アマミシロアリ (*Reticulitermes miyatakei*)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、カンモンシロアリ (*Reticulitermes* sp.)、タカサゴシロアリ (*Nasutitermes takasagoensis*)、ニトベシロアリ (*Pericapritermes nitobei*)、ムシャシロアリ (*Sinocapritermes m*

40

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

50

lyphagotarsonemus latus)等のホコリダニ類、ミナミヒメハダニ(Brevipalpus phoenicis)等のヒメハダニ類、ケナガハダニ類、フタトゲチマダニ(Haemaphysalis longicornis)、ヤマトチマダニ(Haemaphysalis flava)、タイワンカクマダニ(Dermacentor taiwanicus)、アメリカンイヌカクマダニ(Dermacentor variabilis)、ヤマトマダニ(Ixodes ovatus)、シュルツマダニ(Ixodes persulcatus)、ブラックレグドチック(Ixodes scapularis)、アメリカキララマダニ(Amblyomma americanum)、オウシマダニ(Boophilus microplus)、クリイロコイタマダニ(Rhipicephalus sanguineus)等のマダニ類、ケナガコナダニ(Tyrophagus putrescentiae)、ハウレンソウケナガコナダニ(Tyrophagus similis)等のコナダニ類、コナヒョウヒダニ(Dermatophagoidea farinae)、ヤケヒョウヒダニ(Dermatophagoidea ptrenyssus)等のヒョウヒダニ類、ホソツメダニ(Cheyletus eruditus)、クワガタツメダニ(Cheyletus malaccensis)、ミナミツメダニ(Cheyletus moorei)、イヌツメダニ(Cheyletiella yasguri)等のツメダニ類、ミミヒゼンダニ(Octodectes cynotis)、ヒゼンダニ(Sarcoptes scabiei)等のヒゼンダニ類、イヌニキビダニ(Demodex canis)等のニキビダニ類、ズツキダニ類、ササラダニ類、イエダニ(Ornithonyssus bacoti)、トリサシダニ(Ornithonyssus sylvarium)、ワクモ(Dermanyssus gallinae)等のワクモ類、アオツツガムシ(Leptotrombidium akamushi)等のツツガムシ類等。

10

20

クモ目害虫：カバキコマチグモ(Chiracanthium japonicum)、セアカゴケグモ(Latrodectus hasseltii)等。
 唇脚綱類、ゲジ目害虫：ゲジ(Thereuonema hilgendorfi)、トビズムカデ(Scolopendra subspinipes)等。
 倍脚綱類、オビヤスデ目害虫：ヤケヤスデ(Oxidus gracilis)、アカヤスデ(Nedyopus tambanus)等。
 軟甲綱類、等脚目類：オカダンゴムシ(Armadillidium vulgare)等。
 腹足綱類、柄眼目害虫：チャコウラナメクジ(Limax marginatus)、キイロコウラナメクジ(Limax flavus)等。

30

【0010】

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

40

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物を通常0.01~95重量%含有する。

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類(カオリンクレー、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等)、合成含水酸化珪素、タルク、セラミック、その他の無機鉱物(セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等)、化学肥料(硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等)等の微粉末及び粒状物等、並びに合成樹脂(ポリプロピレン、ポリアクリロニトリル、ポリメタクリル酸メチル、ポリエチレンテレフタレート等のポリエステル樹脂、ナイロン-6、ナイロン-11、ナイロン-66等のナイロン樹脂、ポリアミド樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、塩化ビニル

50

- プロピレン共重合体等)があげられる。

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

10

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

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤、及びアルキルスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキル硫酸塩等の陰イオン界面活性剤が挙げられる。

20

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤、着色剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼイン、ゼラチン、糖類(でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等)、リグニン誘導体、ペントナイト、合成水溶性高分子(ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等)、PAP(酸性りん酸イソプロピル)、BHT(2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール)、BHA(2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物)が挙げられる。

30

樹脂製剤の基材としては、例えば塩化ビニル系重合体、ポリウレタン等を挙げることができ、これらの基材には必要によりフタル酸エステル類(フタル酸ジメチル、フタル酸ジオクチル等)、アジピン酸エステル類、ステアリン酸等の可塑剤が添加されていてもよい。樹脂製剤は該基材中に化合物を通常の混練装置を用いて混練した後、射出成型、押出成型、プレス成型等により成型することにより得られ、必要により更に成型、裁断等の工程を経て、板状、フィルム状、テープ状、網状、ひも状等の樹脂製剤に加工できる。これらの樹脂製剤は、例えば動物用首輪、動物用イヤータッグ、シート製剤、誘引ひも、園芸用支柱として加工される。

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等が挙げられ、更に必要に応じて、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料等が添加される。

40

【0011】

本発明の有害生物防除方法は、本発明化合物の有効量を有害生物に直接、及び/又は、有害生物の生息場所(植物、土壌、家屋内、動物体等)に施用することにより行われる。本発明の有害生物防除方法には、通常、本発明の有害生物防除剤の形態で用いられる。

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

50

そのまま施用する。

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

また、シート状やひも状に加工した樹脂製剤を作物に巻き付ける、作物近傍に張り渡す、株元土壤に敷く等の方法により処理することもできる。

本発明の有害生物防除剤を家屋内に生息する有害生物の防除に用いる場合、その施用量は、面上に処理する場合は処理面積 1 m^2 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01 \sim 1000 \text{ mg}$ であり、空間に処理する場合は処理空間 1 m^3 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01 \sim 500 \text{ mg}$ である。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常有効成分濃度が $0.1 \sim 10000 \text{ ppm}$ となるように水で希釈して施用し、油剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤等はそのまま施用する。

10

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

20

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

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

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

30

果樹：仁果類（リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等）、液果類（ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等）、ブドウ、カキ、オリーブ、ピワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ、アブラヤシ等。

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

40

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

50

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

「作物」には、遺伝子組換え作物も含まれる。

【0012】

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

殺虫剤の有効成分

(1) 有機リン化合物

アセフェート (acephate)、りん化アルミニウム (Aluminium phosphide)、ブタチオホス (butathiofos)、キャドサホス (cadusafos)、クロルエトキシホス (chloroethoxyfos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl)、シアノホス (cyanophos: CYAP)、ダイアジノン (diazinon)、DCIP (dichlorodiisopropyl ether)、ジクロフェンチオン (dichlofenthion: ECP)、ジクロルボス (dichlorvos: DDVP)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジスルホトン (disulfoton)、EPN、エチオン (ethion)、エトプロホス (ethoprophos)、エトリムホス (etrimfos)、フェンチオン (fenthion: MPP)、フェニトロチオン (fenitrothion: MEP)、ホスチアゼート (fosthiazate)、ホルモチオン (formothion)、りん化水素 (Hydrogen phosphide)、イソフェンホス (isofenphos)、イソキサチオン (isoxathion)、マラチオン (malathion)、メスルフェンホス (mesulfenfos)、メチダチオン (methidathion: DMTP)、モノクロトホス (monocrotophos)、ナレド (naled: BRP)、オキシデプロホス (oxydeprofos: ESP)、パラチオン (parathion)、ホサロン (phosalone)、ホスメット (phosmet: PMP)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、ピリダフェンチオン (pyridafenthion)、キナルホス (quinalphos)、フェントエート (phenthoate: PAP)、プロフェノホス (profenofos)、プロパホス (propaphos)、プロチオホス (prothiofos)、ピラクロホス (pyraclofos)、サリチオン (salithion)、スルプロホス (sulprofos)、テブピリムホス (tebupirimfos)、テムホス (temephos)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、テルブホス (terbufos)、チオメトン (thiometon)、トリクロルホン (trichlorphon: DEP)、バミドチオン (vamidothion)、フォレート (phorate)、及びカズサホス (cadusafos)。

(2) カーバメート化合物

アラニカルブ (alanycarb)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、BPMC、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、クロエトカルブ (cloethocarb)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フェノチオカルブ (fen

10

20

30

40

50

othiocarb)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb: MIPC)、メトルカルブ(metolcarb)、メソミル(methomyl)、メチオカルブ(methiocarb)、NAC、オキサミル(oxamyl)、ピリミカーブ(pirimicarb)、プロボキスル(propoxur: PHC)、XMC、チオジカルブ(thiodicarb)、キシリルカルブ(xyllylcarb)、及びアルジカルブ(aldicarb)。

(3) ピレスロイド化合物

アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、ベンフルスリン(benfluthrin)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、10
 ビフェントリン(bifenthrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルメスリン(flumethrin)、フルバリネート(flualinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、イミプロトリン(imiprothrin)、ペルメトリン(permethrin)、プラレトリン(prallethrin)、20
 ピレトリン(pyrethrins)、レスメトリン(resmethrin)、シグマ-サイパーメスリン(sigma-cypermethrin)、シラフルオフエン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、フェノトリン(phenothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、ゼータシペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ラムダシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、フラメトリン(furamethrin)、30
 タウフルバリネート(tau-flualinate)、メトフルトリン(metofluthrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ジメフルトリン(dimefluthrin)、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル(EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、及び2,3,5,6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-ジメチル-3-(2-メチル-1-プロペニル)シクロプロパンカルボキシレート、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル(EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-ジメチル-3-(2-シアノ-1-プロペニル)シクロプロパンカルボキシレート。40

(4) ネライストキシン化合物

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

(5) ネオニコチノイド化合物

イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、アセタミプリド(acetamiprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チアクロプリド(thiacloprid)、ジノテフラン(dinotefuran)、及びクロチアニジン(clothianidin)。50

(6) ベンゾイル尿素化合物

クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、ビストリフルロン (bistrifluron)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、フルアズロン (fluazuron)、フルシクロクスロン (flucycloxaduron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフェヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、トリフルムロン (triflumuron)、及びトリアズロン (triazuron)。

(7) フェニルピラゾール化合物

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

(8) Btトキシン

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

(9) ヒドラジン化合物

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

(10) 有機塩素化合物

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

(11) その他の殺虫剤有効成分

マシン油 (machine oil)、硫酸ニコチン (nicotine-sulfate)；アベルメクチン (avermectin-B)、ブロモプロピレート (bromopropylate)、ブプロフェジン (buprofezin)、クロルフェナピル (chlorphenapyr)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、シロマジン (cyromazine)、D-D (1,3-Dichloropropene)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、フェナザキン (fenazaquin)、フルピラゾホス (flupyrazofos)、ヒドロプレネ (hydroprene)、メトプレネ (methoprene)、インドキサカルブ (indoxacarb)、メトキサジアゾン (metoxadiazole)、ミルベマイシンA (milbemycin-A)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、スピノサッド (spinosad)、スルフラミド (sulfluramid)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トリアゼメイト (triazamate)、フルベンジアミド (flubendiamide)、レピメクチン (lepimectin)、亜ひ酸 (Arsenic acid)、ベンクロチアズ (benclotiaz)、石灰窒素 (Calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤 (Calcium polysulfide)、クオルデン (chlorthane)、DDT、DSP、フルフェネリウム (flufenenerim)、フロニカミド (flonicamid)、フルリムフェン (flurimfen)、ホルメタネート (formetanate)、メタム・アンモニウム (metam-ammonium)、メタム・ナトリウム (metam-sodium)、臭化メチル (Methyl bromide)、オレイン酸カリウム (Potassium oleate)、プロトリフェンブート (protrifenbutate)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スルフォキサフルール (sulfoxafloer)、硫黄 (Sulfur)、メタフルミゾン (metaflumizone)、スピロテトラマト (spirotetramat

10

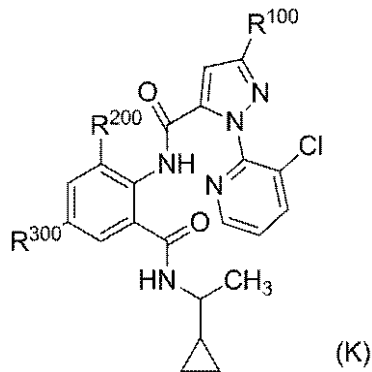
20

30

40

50

)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazone)、スピネトラム (spinetoram)、クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、トラロピリル (tralopyril)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、
下記式 (K)



10

[式中、

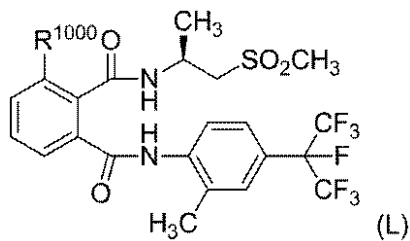
R¹⁰⁰ は塩素、臭素又はトリフルオロメチル基を表し、

R²⁰⁰ は塩素、臭素又はメチル基を表し、

R³⁰⁰ は塩素、臭素又はシアノ基を表す。]

で示される化合物、及び

下記式 (L)



20

[式中、

R¹⁰⁰⁰ は塩素、臭素又はヨウ素を表す。]

で示される化合物。

殺ダニ剤の有効成分

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

30

40

殺線虫剤の有効成分

50

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

殺菌剤の有効成分

プロピコナゾール (propiconazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、プロクロラズ (prochloraz)、ペンコナゾール (penconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、メトコナゾール (metconazole)、トリフルミゾール (triflumizole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、マイクロブタニル (myclobutanil)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、トリティコナゾール (triticonazole)、ビテルタノール (bittertanol)、イマザリル (imazalil)、フルトリアホル (flutriafol) 等のアゾール殺菌化合物；

フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、トリデモルフ (tridemorph)、フェンプロピジン (fenpropidin) 等の環状アミン殺菌化合物；
カルベンダジム (carbendazim)、ベノミル (benomyl)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl) 等のベンズイミダゾール殺菌化合物；

プロシミドン (procymidone)；シプロディニル (cyprodinil)；ピリメタニル (pyrimethanil)；ジエトフェンカルブ (diethofencarb)；チウラム (thiuram)；フルアジナム (fluazinam)；マンコゼブ (mancozeb)；イプロジオン (iprodione)；ビンクロゾリン (vinclozolin)；クロロタロニル (chlorothalonil)；キャプタン (captan)；メパニピリム (mepanipyrim)；フェンピクロニル (fenpiclonil)；フルジオキソニル (fludioxonil)；ジクロフルアニド (dichlofluanid)；フォルペット (folpet)；クレソキシムメチル (kresoxim-methyl)；アゾキシストロビン (azoxystrobin)；トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)；フルオキサストロビン (fluoxastrobin)；ピコキシストロビン (picoxystrobin)；ピラクロストロビン (pyraclostrobin)；ジモキシストロビン (dimoxystrobin)；ピリベンカルブ (pyribencarb)；スピロキサミン (spiroxamine)；キノキシフェン (quinoxifen)；フェンヘキサミド (fenhexamid)；ファミキサドン (famoxadone)；フェナミドン (fenamidone)；ゾキサミド (zoxamide)；エタボキサム (ethaboxam)；アミスルブロム (amisulbrom)；イプロヴァリカルブ (iprovalicarb)；ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb)；シアゾファミド (cyazofamid)；マンジプロパミド (mandipropamid)；ボスカリド (boscalid)；ペンチオピラド (penthopyrad)；メトラフェノン (metrafenone)；フルオピラン (fluopirane)；ビキサフェン (bixafen)；シフルフェナミド (cyflufenamid)；プロキナジド (proquinazid)；イソチアニル (isotianil) 及びチアジニル (tiadinil)。

除草剤の有効成分

(1) フェノキシ脂肪酸除草性化合物

10

20

30

40

50

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

(2) 安息香酸除草性化合物

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

(3) 尿素除草性化合物

ジウロン (diuron)、リニュロン (linuron)、クロルトロン (chlortoluron)、イソプロツロン (isoproturon)、フルオメツロン (fluometuron)、イソウロン (isouron)、テブチウロン (tebuthiuron)、メタバズチアズロン (methabenzthiazuron)、クミルロン (cumyluron)、ダймロン (daimuron)、及びメチルダймロン (methyl-daimuron)。

(4) トリアジン除草性化合物

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

(5) ビピリジニウム除草性化合物

パラコート (paraquat)、及びジクワット (diquat)。

(6) ヒドロキシベンゾニトリル除草性化合物

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

(7) ジニトロアニリン除草性化合物

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

(8) 有機リン除草性化合物

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

(9) カーバメート除草性化合物

ジアレート (di-allate)、トリアレート (tri-allate)、EPTC、ブチレート (butylate)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、エスプロカルブ (esprocarb)、モリネート (molinate)、ジメピペレート (dimepiperate)、SWEP、クロルプロファム (chlorpropham)、フェンメディファム (phenmedipham)、フェニソファム (phenisopham)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、及びアシュラム (asulam)。

(10) 酸アミド除草性化合物

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

(11) クロロアセトアニリド除草性化合物

アセトクロール (acetochlor)、アラクロール (alachlor)、ブタクロール (butachlor)、ジメテナミド (dimethenamid)、プロパクロール (propachlor)、メタザクロール (metazachlor)、メトラ

10

20

30

40

50

クロール (metolachlor)、プレチラクロール (pretilachlor)、テニルクロール (thenylchlor)、及びペトキサミド (pethoxamid)。

(12) ジフェニルエーテル除草性化合物

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

(13) 環状イミド除草性化合物

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

10

(14) ピラゾール除草性化合物

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

20

(15) トリケトン除草性化合物

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

(16) アリールオキシフェノキシプロピオン酸除草性化合物

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

30

(17) トリオンオキシム除草性化合物

アロキシジム (alloxydim-sodium)、セトキシジム (sethoxydim)、ブトロキシジム (butoxydim)、クレソジム (clethodim)、クロプロキシジム (cloproxydim)、シクロキシジム (cycloxydim)、テプラロキシジム (tepraloxym)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、及びプロフォキシジム (profoxydim)。

40

(18) スルホニル尿素除草性化合物

クロルスルフロン (chlorsulfuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、メツスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)、クロリムロンエチル (chlorimuron-ethyl)、トリベニユロンメチル (tribenuron-methyl)、トリアスルフロン (triasulfuron)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、チフェンスルフロンメチル (thifensulfuron-methyl)、ピラズスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、シノスルフロン (ci

50

nosulfuron)、イマゾスルフロン(imazosulfuron)、リムスルフロン(rimsulfuron)、ハロスルフロンメチル(halosulfuron-methyl)、プロスルフロン(prosulfuron)、エタメトスルフロンメチル(ethametsulfuron-methyl)、トリフルスルフロンメチル(triflurosulfuron-methyl)、フラザスルフロン(flazasulfuron)、シクロスルファミロン(cyclosulfamuron)、フルピルスルフロン(flupyrsulfuron)、スルホスルフロン(sulfosulfuron)、アジムスルフロン(azimsulfuron)、エトキシスルフロン(ethoxysulfuron)、オキサスルフロン(oxasulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム(iodosulfuron-methyl-sodium)、フォラムスルフロン(foramsulfuron)、メソスルフロンメチル(mesosulfuron-methyl)、トリフロキシスルフロン(trifloxysulfuron)、トリトスルフロン(tritosulfuron)、オルソスルファミロン(orthosulfamuron)、フルセトスルフロン(flucetosulfuron)、及びプロピリスルフロン(propyrisulfuron)。

10

(19) イミダゾリノン除草性化合物

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

20

(20) スルホンアミド除草性化合物

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

(21) ピリミジニルオキシ安息香酸除草性化合物

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

30

(22) その他の除草性化合物

ベンタゾン(bentazon)、ブロマシル(bromacil)、ターバシル(terbacil)、クロルチアミド(chlorothiamid)、イソキサベン(isoxaben)、ジノセブ(dinoseb)、アミトロール(amitrole)、シンメチリン(cinmethylin)、トリジファン(tridiphane)、ダラボン(dalapon)、ジフルフェンゾピルナトリウム(diflufenzopyr-sodium)、ジチオピル(dithiopyr)、チアゾピル(thiazopyr)、フルカルバゾンナトリウム(flucarbazon-sodium)、プロボキシカルバゾンナトリウム(propoxycarbazon-sodium)、メフェナセット(mefenacet)、フルフェナセット(flufenacet)、フェントラザミド(fentrazamide)、カフェンストロール(cafenstrole)、インダノファン(indanofan)、オキサジクロメホン(oxaziclophone)、ベンフレセート(benfuresate)、ACN、ピリデート(pyridate)、クロリダゾン(chloridazon)、ノルフルラゾン(norflurazon)、フルルタモン(flurtamone)、ジフルフェニカン(diflufenican)、ピコリナフェン(picolinafen)、ベフルブタミド(beflubutamid)、クロマゾン(clomazone)、アミカルバゾン(amicarbazon)、ピノキサデン(pinoxaden)、ピラクロニル(pyraclonil)、ピロキサスルホン(pyroxasulfone)、チエンカル

40

50

バゾンメチル (thiencarbazone-methyl)、アミノシクロピラクロール (aminocyclopyrachlor)、イプフェンカルバゾン (ipfen carbazone)、及びメチオゾリン (methiozolin)。

共力剤の有効成分

ピペロニル ブトキサイド (piperonyl butoxide)、セサメックス (sesamex)、スルホキシド (sulfoxide)、N-(2-エチルヘキシル)-8,9,10-トリノルボルン-5-エン-2,3-ジカルボキシイミド (MGK 264)、N-デクリイミダゾール (N-declylimidazole)、WARF-アンチレジスタント (WARF-antiresistant)、トリブホス (TBPT)、トリフェニルホスファイト (TPP)、イプロベンホス (IBP)、ヨウ化メチル (CH₃I)、t-フェニルブテノン (t-phenylbutenone)、ジエチルマレエート (diethylmaleate)、ビス(p-クロロフェニル)メチルカルビノール (DMC)、及びビス(p-クロロフェニル)トリフルオロメチルカルビノール (FDMC)。

10

【実施例】

【0013】

以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等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。

まず、本発明化合物の製造について、製造例を示す。

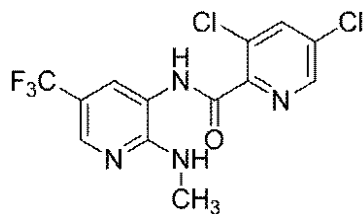
製造例 1(1)

20

N²-メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン (WO2010-125985 に記載の方法で合成した) 9.61 g、3,5-ジクロロ-ピリジン-2-カルボン酸 9.2 g、及びピリジン 48 ml の混合物に、氷冷下 EDCI 塩酸塩 9.64 g、及び HOBt 0.64 g を加え、室温で 6 時間撹拌した。反応混合物に水を注加し、析出した固体をろ取した。得られた固体に酢酸エチル及び水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、3,5-ジクロロ-N-(2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-ピコリンアミド 15.73 g を得た。

3,5-ジクロロ-N-(2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-ピコリンアミド

30



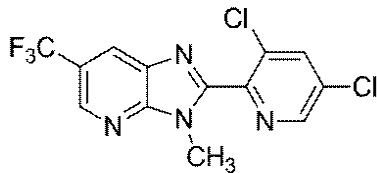
¹H-NMR (CDCl₃) : 9.33 (1H, brs), 8.51 (1H, d), 8.37 (1H, d), 7.95 (1H, d), 7.86 (1H, d), 5.02 (1H, brs), 3.08 (3H, d).

製造例 1(2)

40

3,5-ジクロロ-N-(2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-ピコリンアミド 15.73 g、及び酢酸 43 ml の混合物を、130 で 4 時間加熱撹拌した。放冷した反応混合物を水に注加し、析出した固体をろ取した。得られた固体に酢酸エチル及び飽和炭酸水素ナトリウム水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、2-(3,5-ジクロロピリジン-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 14.47 g を得た。

2-(3,5-ジクロロピリジン-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



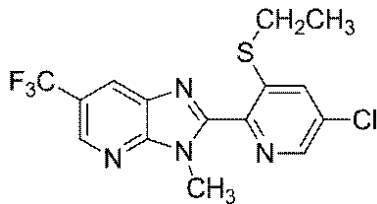
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.76 (1H, dd), 8.67 (1H, d), 8.40 (1H, dd), 8.01 (1H, d), 3.98 (3H, s).

製造例 1 (3)

2-(3,5-ジクロロピリジン-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 5.0 g、60%水素化ナトリウム(油状) 0.63 g、及び THF 30 ml の混合物に、エチルメルカプタン 1.1 ml 及び THF 5 ml の混合物を 30 分間かけて加え、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を水及びヘキサンで洗浄し、減圧下乾燥させることにより、2-(5-クロロ-3-エチルスルファニルピリジン-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 5.19 g を得た。

10

2-(5-クロロ-3-エチルスルファニルピリジン-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



20

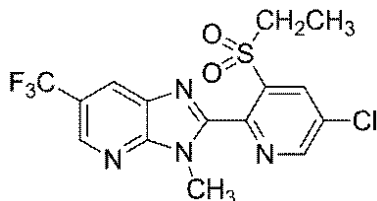
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.74 (1H, dd), 8.45 (1H, d), 8.40 (1H, dd), 7.72 (1H, d), 4.07 (3H, s), 2.98 (2H, q), 1.39 (3H, t).

製造例 1 (4)

2-(5-クロロ-3-エチルスルファニルピリジン-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 15.48 g 及び クロロホルム 208 ml の混合物に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸(純度 65%以上) 21.96 g を添加した後、室温で 6.5 時間攪拌した。反応混合物に 10%チオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で濃縮した。得られた粗生成物に酢酸エチル及びヘキサンを加え、析出した固体をろ取し、減圧下乾燥させることにより、2-(5-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-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 12.94 g を得た。

30

2-(5-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-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



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.95 (1H, dd), 8.77 (1H, dd), 8.53 (1H, dd), 8.32 (1H, dd), 3.94 - 3.86 (5H, m), 1.40 (3H, t).

製造例 1 (5)

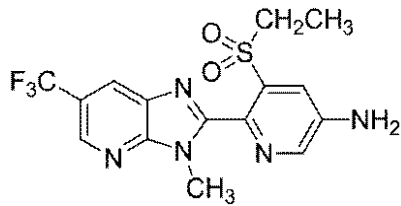
2-(5-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリ

50

フルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7 . 2 5 g 及び N M P 4 0 m l の混合物に、アジ化ナトリウム 1 . 5 2 g を加え、9 0 ° で 4 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、2 - (5 - アジド - 3 - エチルスルホニルピリジン - 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] ピリジンを得た。

上記で得られた 2 - (5 - アジド - 3 - エチルスルホニルピリジン - 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] ピリジンの全量、トリフェニルホスフィン 6 . 1 2 g、T H F 7 3 m l、及び水 7 m l の混合物を、室温で 5 . 5 時間攪拌した。反応混合物に濃塩酸 1 m l を加え、室温で 6 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 - (5 - アミノ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 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 4 . 6 8 g を得た。

2 - (5 - アミノ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 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

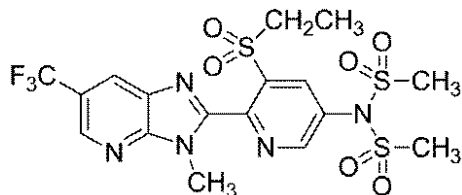


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 7 2 (1 H , d d) , 8 . 3 6 (1 H , d) , 8 . 2 7 (1 H , d d) , 7 . 7 0 (1 H , d) , 4 . 3 6 (2 H , b r s) , 3 . 8 4 (3 H , s) , 3 . 8 1 (2 H , q) , 1 . 3 6 (3 H , t) .

製造例 1 (6)

2 - (5 - アミノ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 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 0 . 1 5 g、クロロホルム 2 m l、及びジイソプロピルエチルアミン 0 . 1 m l の混合物に、氷冷下メタンスルホニルクロリド 0 . 0 3 m l を加え、室温で 4 時間攪拌した。氷冷下反応混合物にジイソプロピルエチルアミン 0 . 0 7 m l、及びメタンスルホニルクロリド 0 . 0 3 m l を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N - [5 - エチルスルホニル - 6 - (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) - ピリジン - 3 - イル] - メチルスルホンイミド (以下、本発明化合物 2 と記す) 0 . 1 8 g を得た。

本発明化合物 2



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 9 5 (1 H , d) , 8 . 7 9 (1 H , d) , 8 . 5 2 (1 H , d) , 8 . 3 3 (1 H , d) , 3 . 9 6 (3 H , s) , 3 . 9 3 (2 H , q) , 3 . 5 1 (6 H , s) , 1 . 4 0 (3 H , t) .

製造例 2

2 - (5 - アミノ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 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 0 . 1 5 g、DMF 2 m l、及

10

20

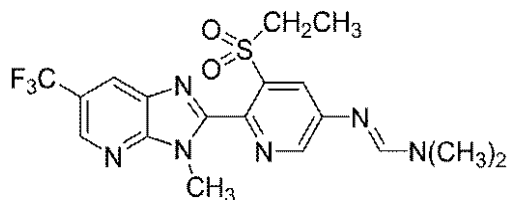
30

40

50

びジイソプロピルエチルアミン 0.2 ml の混合物に、氷冷下クロロギ酸プロパルギル 0.1 ml を加え、室温で 4 日間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N'-[5-エチルスルホニル-6-(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)-ピリジン-3-イル]-N,N-ジメチルホルムアミジン(以下、本発明化合物 3 と記す) 0.08 g を得た。

本発明化合物 3



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.73 (1H, d), 8.60 (1H, d), 8.28 (1H, d), 7.98 (1H, d), 7.76 (1H, s), 3.85 (3H, s), 3.81 (2H, q), 3.17 (3H, s), 3.14 (3H, s), 1.36 (3H, t).

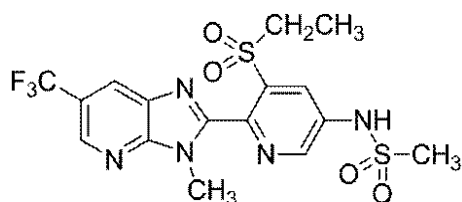
製造例 3

2-(5-アミノ-3-エチルスルホニルピリジン-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 0.15 g、及びクロロホルム 2 ml の混合物に、氷冷下メタンスルホン酸無水物 0.07 ml を加え、室温で 6 時間攪拌した。氷冷下反応混合物にピリジン 0.01 ml、及びメタンスルホニルクロリド 0.04 ml を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で濃縮した。得られた残渣にクロロホルム 2 ml、ピリジン 0.01 ml、及びメタンスルホニルクロリド 0.01 ml を加え、室温で 9 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-[5-エチルスルホニル-6-(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)-ピリジン-3-イル]-メチルスルホンアミド(以下、本発明化合物 4 と記す) 0.08 g を得た。

20

30

本発明化合物 4



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.86 (1H, d), 8.76 (1H, d), 8.32 - 8.30 (2H, m), 3.95 - 3.87 (5H, m), 3.25 (3H, s), 1.39 (3H, t).

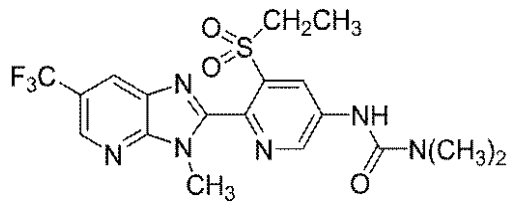
40

製造例 4

2-(5-アミノ-3-エチルスルホニルピリジン-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 0.15 g、及びピリジン 2 ml の混合物に、氷冷下ジメチルカルバモイルクロリド 0.07 ml を加え、加熱還流下 4 時間攪拌した。放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-[5-エチルスルホニル-6-(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)-ピリジン-3-イル]-1,1-ジメチルウレア(以下、本発明化合物 5 と記す) 0.03 g を得た。

50

本発明化合物 5



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.22 (1H, dd), 8.74 (1H, dd), 8.50 (1H, dd), 8.29 (1H, dd), 6.85 (1H, br s), 3.92 - 3.82 (5H, m), 3.12 (6H, s), 1.38 (3H, t).

10

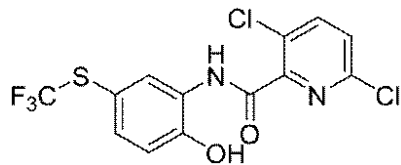
製造例 5 (1)

3,6-ジクロロピコリン酸 5.0 g、DMF 0.1 ml 及びトルエン 52 ml の混合物に、塩化チオニル 3.8 ml を加え、加熱還流下 3 時間撹拌した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮することにより、3,6-ジクロロピコリン酸クロリドを得た。

2-アミノ-4-トリフルオロメチルスルファニルフェノール 5.7 g 及び THF 52 ml の混合物に、氷冷下、上記で得られた 3,6-ジクロロピコリン酸クロリド及び THF 5 ml の混合物を加え、室温で 6 時間撹拌した。反応混合物に水及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3,6-ジクロロ-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]ピコリンアミド 8.94 g を得た。

20

3,6-ジクロロ-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]ピコリンアミド



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.92 (1H, s), 8.95 - 8.88 (1H, m), 7.92 - 7.85 (1H, m), 7.69 - 7.65 (1H, m), 7.53 - 7.48 (1H, m), 7.48 - 7.40 (1H, m), 7.12 - 7.05 (1H, m)

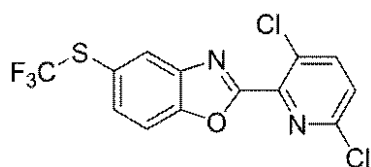
30

製造例 5 (2)

3,6-ジクロロ-N-[2-(trifluoromethylthio)-5-hydroxyphenyl]ピコリンアミド 8.94 g、THF 47 ml 及びトリフェニルホスフィン 7.34 g の混合物に、氷冷下、ジ-2-メトキシエチルアゾジカルボキシレート (以下、DMEDA と記す) 7.10 g を加え、室温で一晩撹拌した。反応混合物に水及び飽和塩化アンモニウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3,6-ジクロロピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズオキサゾール 6.39 g を得た。

40

2-(3,6-ジクロロピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズオキサゾール



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.25 (1H, s), 7.91 (1H, d), 7.79 - 7.72 (2H, m), 7.48 (1H, d).

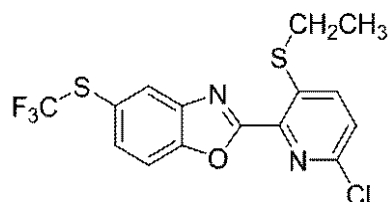
50

製造例 5 (3)

2 - (3 , 6 - ジクロロピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール 6 . 3 9 g 及び T H F 4 5 m l の混合物に、6 0 % 水素化ナトリウム (油状) 0 . 8 4 g を加え、氷冷下、エチルメルカプタン 1 . 2 9 m l 及び T H F 4 m l の混合物を 3 0 分間かけて加え、室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を水及びヘキサンで洗浄し、減圧下乾燥させることにより、2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルファニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール 6 . 0 6 g を得た。

2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルファニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール

10



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 2 6 (1 H , s) , 7 . 7 7 - 7 . 6 9 (3 H , m) , 7 . 4 4 (1 H , d) , 3 . 0 6 (2 H , q) , 1 . 4 7 (3 H , t) .

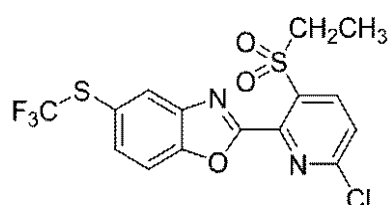
製造例 5 (4)

2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール 6 . 0 6 g 及び クロロホルム 4 5 m l の混合物に、氷冷下、m - クロロ過安息香酸 (純度 6 5 % 以上) 7 . 1 3 g を加え、氷冷下 4 時間攪拌した。反応混合物に 1 0 % チオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール 4 . 2 4 g 及び、2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルフィニル) ベンズオキサゾール 0 . 6 8 g を得た。

20

2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール

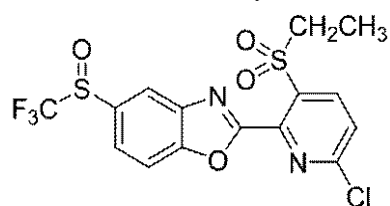
30



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 5 2 (1 H , d) , 8 . 1 8 (1 H , s) , 7 . 8 0 - 7 . 7 2 (3 H , m) , 4 . 0 3 (2 H , d) , 1 . 4 3 (3 H , t) .

2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルフィニル) ベンズオキサゾール

40



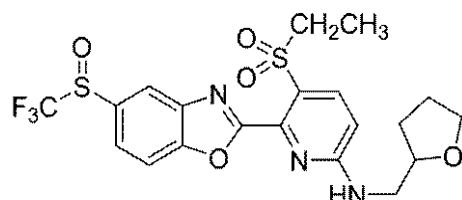
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 5 3 (1 H , d) , 8 . 3 6 (1 H , s) , 7 . 9 4 (1 H , d) , 7 . 8 9 (1 H , d) , 7 . 7 6 (1 H , d) , 4 . 0 1 (2 H , q) , 1 . 4 4 (3 H , t) .

50

製造例 5 (5)

2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール 0.30 g、テトラヒドロフルフリルアミン 0.14 ml、ジイソプロピルエチルアミン 0.24 ml 及び NMP 0.5 ml の混合物を、室温で 1 日間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、[5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - トリフルオロメチルスルフィニルベンズオキサゾール - 2 - イル) - ピリジン - 2 - イル] - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル) - アミン (以下、本発明化合物 36 と記す) 0.28 g を得た。

本発明化合物 36



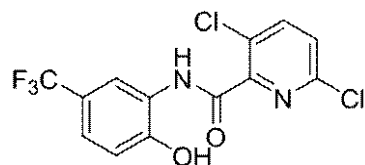
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.30 (1H, s), 8.07 (1H, d), 7.89 - 7.84 (2H, m), 6.65 (1H, d), 5.67 (1H, s), 4.12 - 4.10 (1H, m), 3.91 - 3.88 (1H, m), 3.79 - 3.73 (4H, m), 3.39 - 3.32 (1H, m), 2.06 - 2.01 (1H, m), 1.98 - 1.90 (2H, m), 1.65 - 1.60 (1H, m), 1.38 (3H, t).

製造例 6 (1)

3, 6 - ジクロロピコリン酸 10.0 g、DMF 0.16 ml 及びトルエン 90 ml の混合物に、塩化チオニル 7.20 ml を加え、加熱還流下 2 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮することにより、3, 6 - ジクロロピコリン酸クロリド 10.88 g を得た。

2 - アミノ - 4 - トリフルオロメチルフェノール 8.79 g 及び THF 40 ml の混合物に、氷冷下、上記で得られた 3, 6 - ジクロロピコリン酸クロリド及び THF 60 ml の混合物を加え、室温で 3 時間攪拌した。氷冷下、反応混合物に水及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3, 6 - ジクロロ - N - [2 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] ピコリンアミド 16.22 g を得た。

3, 6 - ジクロロ - N - [2 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] ピコリンアミド



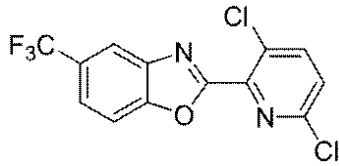
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.96 (1H, s), 8.82 (1H, s), 7.89 (1H, d), 7.62 (1H, d), 7.52 (1H, d), 7.44 (1H, dd), 7.14 (1H, d).

製造例 6 (2)

3, 6 - ジクロロ - N - [2 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] ピコリンアミド 10.0 g、p - トルエンスルホン酸一水和物 1.08 g 及びキシレン 40 ml の混合物を、加熱還流下、ディーン・スターク装置を用いて脱水しながら 3 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に水及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣にイソプロパノール 20 ml を加え、60 度で 2 時間及び室温で 1 時間攪拌した。析出

した固体をろ取することにより、2-(3,6-ジクロロピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール6.19gを得た。

2-(3,6-ジクロロピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール

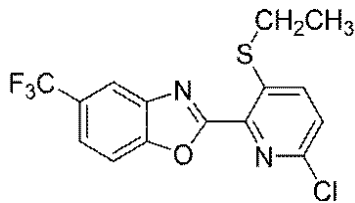


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 8.22 (1H, s), 7.92 (1H, d), 7.81 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.49 (1H, d). 10

製造例6(3)

2-(3,6-ジクロロピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール7.50g及びTHF32mlの混合物に、55%水素化ナトリウム(油状)1.08gを加え、氷冷下、エチルメルカプタン1.67mlを30分間かけて加え、室温で3時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、析出した固体をろ取した。得られた固体を水及びヘキサンで洗浄し、減圧下乾燥させることにより、2-(6-クロロ-3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール6.46gを得た。

2-(6-クロロ-3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール 20

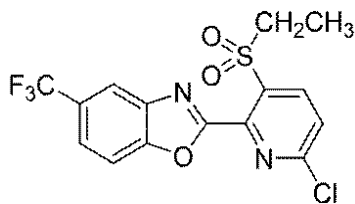


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 8.23 (1H, s), 7.80 (1H, d), 7.74 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.44 (1H, d), 3.06 (2H, q), 1.47 (3H, t). 30

製造例6(4)

2-(6-クロロ-3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール2.0g及びクロロホルム20mlの混合物に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸(純度65%以上)2.82gを加え、室温で一晩攪拌した。反応混合物に10%チオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、2-(6-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール2.04gを得た。

2-(6-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール 40



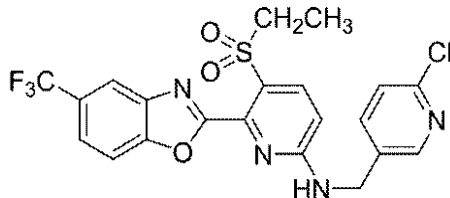
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 8.53 (1H, d), 8.15 (1H, s), 7.83 - 7.72 (3H, m), 4.02 (2H, q), 1.44 (3H, t).

製造例6(5)

2-(6-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメ 50

チル)ベンズオキサゾール0.20g、6-クロロ-3-ピリジンメチルアミン77mg及びNMP2mlの混合物に、ジイソプロピルエチルアミン79mgを加え、室温で5時間攪拌した後、6-クロロ-3-ピリジンメチルアミン90mgを加え、室温で一晩攪拌した。氷冷下、反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、(6-クロロピリジン-3-イル)-[5-エチルスルホニル-6-(5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール-2-イル)-ピリジン-2-イル]アミン(以下、本発明化合物38と記す)0.22gを得た。

本発明化合物38

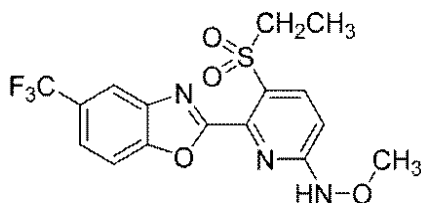


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.42 (1H, d), 8.15 (1H, d), 8.12 (1H, d), 7.78 - 7.67 (3H, m), 7.32 (1H, d), 6.65 (1H, d), 5.61 (1H, s), 4.69 (2H, d), 3.80 (2H, q), 1.39 (3H, t).

製造例7

2-(6-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール0.25g、O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩80mg及びNMP2mlの混合物に、トリエチルアミン194mgを加え、室温で4時間攪拌した後、40度で2時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物に、O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩0.26g及びジイソプロピルエチルアミン0.87gを加え、40度で6時間攪拌した。氷冷下、反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-[5-エチルスルホニル-6-(5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール-2-イル)-ピリジン-2-イル]アミン-O-メチルヒドロキシルアミン(以下、本発明化合物42と記す)0.14gを得た。

本発明化合物42

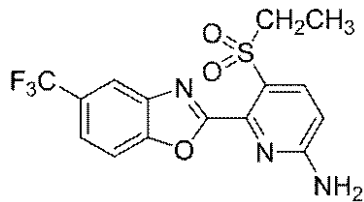


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.39 (1H, dd), 8.12 (1H, d), 7.99 (1H, s), 7.75 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 7.21 (1H, d), 3.89 - 3.83 (5H, m), 1.41 (3H, t).

製造例8(1)

2-(6-クロロ-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズオキサゾール1.0g及びNMP6.5mlの混合物に、28%アンモニア水溶液1.55mlを加え、室温で一日間攪拌した。反応混合物に、28%アンモニア水溶液1.55mlを加え、室温で一日間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した固体をろ取し、減圧下乾燥した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-エチルスルホニル-6-(5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール-2-イル)-ピリジン-2-イルアミン0.14gを得た。

5-エチルスルホニル-6-(5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール-2-イル)-ピリジン-2-イルアミン

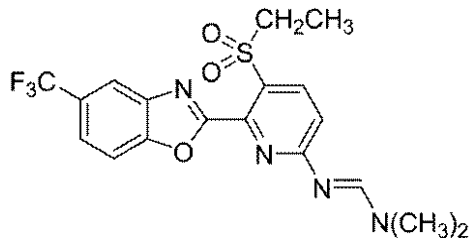


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.18 (1H, d), 8.11 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.71 (1H, d), 6.74 (1H, d), 5.22 (2H, s), 3.82 (2H, q), 1.40 (3H, t).

製造例 8 (2)

5-エチルスルホニル-6-(5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール-2-イル)-ピリジン-2-イルアミン 0.20 g、トルエン 5 ml の混合物に、N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 0.72 ml を加え、加熱還流下 3 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮し、得られた残差を。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N'-[5-エチルスルホニル-6-(5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール-2-イル)]-ピリジン-2-イル]-N,N-ジメチルホルムアミジン(以下、本発明化合物 58 と記す) 0.20 g を得た。

本発明化合物 58

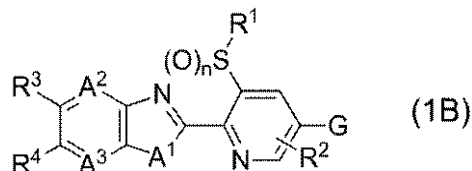


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.64 (1H, s), 8.22 (1H, d), 8.11 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.16 (1H, d), 3.77 (2H, q), 3.16 (6H, s), 1.39 (3H, t).

【0014】

前記の製造例に記載の化合物及び前記の製造例に記載の方法に準じた製造方法により製造される化合物を〔表 20〕～〔表 23〕に示す。

式(1B)で表される本発明化合物。



式中の A¹、A²、A³、R¹、R²、R³、R⁴、G、及び n は、下記の〔表 22〕～〔表 23〕に記載の組み合わせを表す。

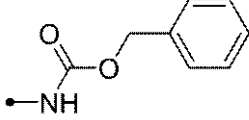
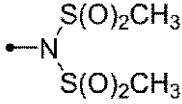
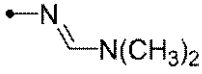
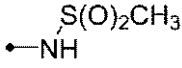
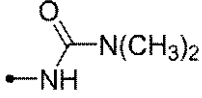
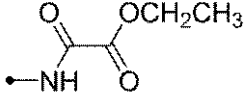
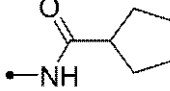
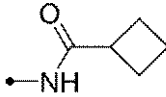
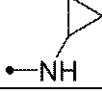
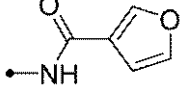
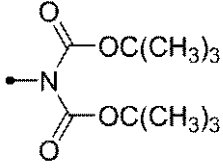
[表 22]

10

20

30

40

本発明化合物	A ¹	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	G	n
1	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
2	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
3	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
4	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
5	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
6	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
7	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
8	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
9	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
10	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
11	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2

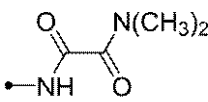
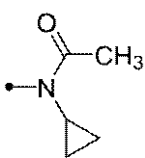
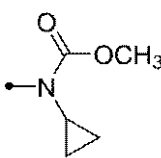
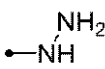
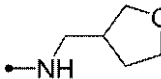
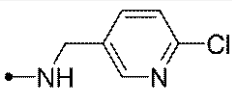
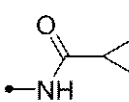
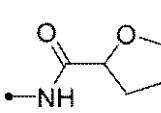
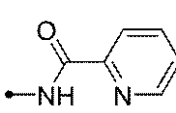
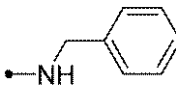
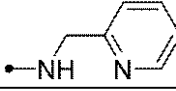
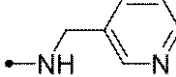
10

20

30

40

[表 2 3]

本発明化合物	A ¹	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	G	n
16	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
17	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
18	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
19	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
20	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
21	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
22	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
23	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
24	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
25	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
26	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
27	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2

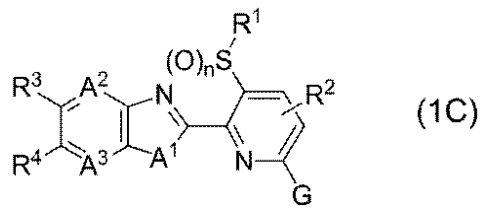
式(1C)で表される本発明化合物。

10

20

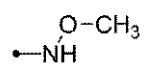


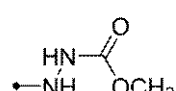
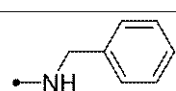
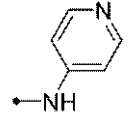
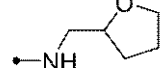
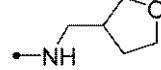
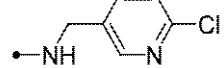
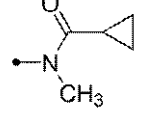
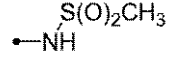
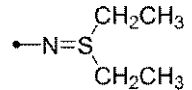
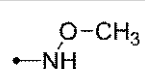
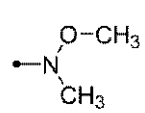
30

40



式中の A¹、A²、A³、R¹、R²、R³、R⁴、G、及び n は、下記の〔表 2 4〕～〔表 2 5〕に記載の組み合わせを表す。

[表 2 4]

本發明化合物	A ¹	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	G	n
30	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
31	NMe	CH	N	Et	H	CF ₃	H		2
32	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
33	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
34	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
35	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S	H		2
36	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
37	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
38	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		2
39	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		2
40	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		2
41	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
42	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		2
43	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		2

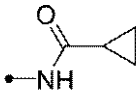

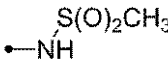
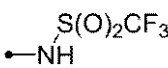
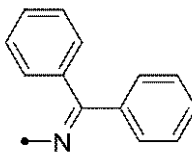
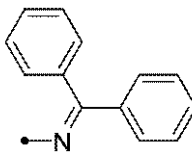
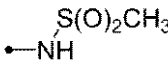
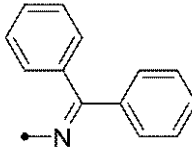
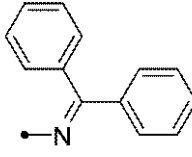
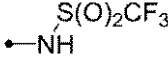
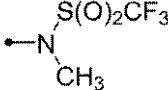
10

20

30

40

[表 2 5]

本発明化合物	A ¹	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	G	n
45	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
46	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
48	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
49	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
50	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S	H		0
51	O	CH	CH	Et	H	CF ₃ S(O)	H		2
52	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		0
53	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		0
54	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		2
55	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		0
56	O	CH	CH	Et	H	CF ₃	H		0

〔表 2 2〕～〔表 2 5〕に記載した本発明化合物の¹H-NMRデータを以下に示す。

本発明化合物 1

¹H-NMR (CDCl₃) : 9.06 (1H, d), 8.74 (1H, d), 8.59 (1H, d), 8.29 (1H, d), 7.46 - 7.37 (5H, m), 7.30 (1H, brs), 5.28 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.83 (2H, q), 1.35 (3H, t).

10

20

30

40

50

本發明化合物 6

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.39 (1H, d), 9.29 (1H, brs), 8.78 - 8.76 (2H, m), 8.31 (1H, dd), 4.50 (2H, q), 3.93 - 3.87 (5H, m), 1.48 (3H, t), 1.40 (3H, t).

本發明化合物 7

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.51 (1H, d), 8.75 (1H, d), 8.59 (1H, d), 8.30 (1H, d), 8.29 (1H, s), 3.94 (2H, q), 3.89 (3H, s), 2.84 - 2.74 (1H, m), 2.02 - 1.87 (4H, m), 1.84 - 1.74 (2H, m), 1.68 - 1.58 (2H, m), 1.40 (3H, t).

10

本發明化合物 8

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.52 (1H, d), 8.76 (1H, d), 8.58 (1H, d), 8.31 (1H, d), 8.09 (1H, s), 3.94 (2H, q), 3.89 (3H, s), 3.31 - 3.20 (1H, m), 2.48 - 2.37 (2H, m), 2.31 - 2.20 (2H, m), 2.07 - 1.92 (2H, m), 1.40 (3H, t).

本發明化合物 9

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.72 (1H, d), 8.42 (1H, d), 8.27 (1H, d), 7.77 (1H, d), 4.83 (1H, brs), 3.85 - 3.78 (5H, m), 2.66 - 2.58 (1H, m), 1.37 (3H, t), 1.00 - 0.92 (2H, m), 0.69 - 0.63 (2H, m).

20

本發明化合物 10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.62 (1H, s), 8.77 (1H, d), 8.67 (1H, d), 8.39 - 8.36 (1H, m), 8.31 (1H, d), 8.18 (1H, d), 7.54 - 7.52 (1H, m), 6.84 (1H, d), 3.96 (2H, q), 3.92 (3H, s), 1.39 (3H, t).

本發明化合物 11

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.80 (1H, d), 8.77 (1H, d), 8.37 (1H, d), 8.32 (1H, d), 3.93 - 3.84 (5H, m), 1.51 (1.8H, s), 1.38 (3H, t).

30

本發明化合物 12

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.59 (1H, d), 8.83 (1H, s), 8.79 - 8.75 (2H, m), 8.31 (1H, d), 7.60 (1H, d), 7.38 (1H, d), 6.63 (1H, dd), 3.93 (2H, q), 3.92 (3H, s), 1.39 (3H, t).

本發明化合物 13

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.05 (1H, d), 8.77 (1H, d), 8.45 (1H, d), 8.31 (1H, d), 3.95 - 3.86 (5H, m), 3.52 (3H, s), 3.05 (3H, s), 1.40 (3H, t).

本發明化合物 14

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.46 (1H, d), 9.44 (1H, brs), 8.78 - 8.75 (2H, m), 8.31 (1H, d), 4.04 (3H, s), 3.93 (2H, q), 3.91 (3H, s), 1.40 (3H, t).

40

本發明化合物 15

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.74 (1H, d), 8.53 (1H, d), 8.28 (1H, d), 7.89 (1H, d), 6.80 (1H, brs), 6.32 (1H, brs), 3.87 - 3.79 (8H, m), 1.36 (3H, t).

本發明化合物 16

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 10.20 (1H, s), 9.31 (1H, d), 8.91 (1H, d), 8.76 (1H, dd), 8.31 (1H, dd), 3.91 - 3.8

50

5 (5 H , m) , 3 . 5 6 (3 H , s) , 3 . 1 7 (3 H , s) , 1 . 3 9 (3 H , t)

本發明化合物 1 7

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9 . 0 0 (1 H , d) , 8 . 7 6 (1 H , d) , 8 . 4 4 (1 H , d) , 8 . 3 0 (1 H , d) , 3 . 9 2 (3 H , s) , 3 . 8 7 (2 H , q) , 3 . 2 8 - 3 . 2 1 (1 H , m) , 2 . 5 1 (3 H , s) , 1 . 4 0 (3 H , t) , 1 . 2 8 - 1 . 2 0 (2 H , m) , 0 . 8 0 - 0 . 7 4 (2 H , m) .

本發明化合物 1 8

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9 . 0 4 (1 H , d) , 8 . 7 6 (1 H , d) , 8 . 4 8 (1 H , d) , 8 . 3 0 (1 H , d) , 3 . 9 1 (3 H , s) , 3 . 8 9 - 3 . 8 2 (5 H , m) , 3 . 1 5 - 3 . 1 2 (1 H , m) , 1 . 3 9 (3 H , t) , 1 . 1 5 - 1 . 0 9 (2 H , m) , 0 . 7 1 - 0 . 6 5 (2 H , m) .

10

本發明化合物 1 9

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 7 2 (1 H , d) , 8 . 4 7 (1 H , d) , 8 . 2 8 (1 H , d) , 7 . 8 8 (1 H , d) , 6 . 1 2 (1 H , b r s) , 3 . 8 6 - 3 . 7 7 (7 H , m) , 1 . 3 6 (3 H , t) .

本發明化合物 2 0

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 7 2 (1 H , d d) , 8 . 2 9 - 8 . 2 6 (2 H , m) , 7 . 5 7 (1 H , d) , 4 . 9 6 (1 H , t) , 4 . 0 1 - 3 . 6 8 (9 H , m) , 3 . 2 8 (2 H , d d) , 2 . 6 7 - 2 . 5 8 (1 H , m) , 2 . 2 2 - 2 . 1 3 (1 H , m) , 1 . 7 7 - 1 . 6 8 (1 H , m) , 1 . 3 6 (3 H , t) .

20

本發明化合物 2 1

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 7 2 (1 H , s) , 8 . 4 2 (1 H , s) , 8 . 3 0 (1 H , d) , 8 . 2 7 (1 H , s) , 7 . 6 9 (1 H , d d) , 7 . 6 1 (1 H , d) , 7 . 3 5 (1 H , d) , 5 . 4 4 (1 H , t) , 4 . 5 1 (2 H , d) , 3 . 8 9 - 3 . 7 7 (5 H , m) , 1 . 2 9 (3 H , t) .

本發明化合物 2 2

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9 . 4 2 (1 H , d) , 9 . 1 9 (1 H , s) , 8 . 7 5 (1 H , d) , 8 . 6 7 (1 H , d) , 8 . 3 0 (1 H , d) , 3 . 9 3 (2 H , q) , 3 . 8 8 (3 H , s) , 1 . 6 9 - 1 . 6 2 (1 H , m) , 1 . 3 9 (3 H , t) , 1 . 1 4 - 1 . 1 0 (2 H , m) , 0 . 9 3 - 0 . 8 7 (2 H , m) .

30

本發明化合物 2 3

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9 . 3 9 (1 H , d) , 9 . 0 3 (1 H , b r s) , 8 . 7 5 (1 H , d) , 8 . 7 1 (1 H , d) , 8 . 3 0 (1 H , d) , 4 . 5 5 (1 H , d d) , 4 . 1 4 - 4 . 0 7 (1 H , m) , 4 . 0 2 - 3 . 9 7 (1 H , m) , 3 . 9 2 - 3 . 8 5 (5 H , m) , 2 . 4 9 - 2 . 3 8 (1 H , m) , 2 . 2 6 - 2 . 1 7 (1 H , m) , 2 . 0 8 - 1 . 9 3 (2 H , m) , 1 . 3 9 (3 H , t) .

本發明化合物 2 4

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 1 0 . 5 3 (1 H , s) , 9 . 5 1 (1 H , d) , 8 . 9 4 (1 H , d) , 8 . 7 6 (1 H , d) , 8 . 7 1 - 8 . 6 8 (1 H , m) , 8 . 3 7 - 8 . 3 3 (1 H , m) , 8 . 3 1 (1 H , d) , 8 . 0 3 - 7 . 9 8 (1 H , m) , 7 . 6 2 - 7 . 5 8 (1 H , m) , 3 . 9 2 - 3 . 8 4 (5 H , m) , 1 . 4 2 (3 H , t)

40

本發明化合物 2 5

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 7 1 (1 H , d) , 8 . 3 2 - 8 . 2 9 (1 H , m) , 8 . 2 5 (1 H , d) , 7 . 5 9 - 7 . 5 7 (1 H , m) , 7 . 4 2 - 7 . 3 2 (5 H , m) , 5 . 0 0 - 4 . 8 8 (1 H , m) , 4 . 5 2 - 4 . 4 7 (2 H , m) , 3 . 8 3 (3 H , s) , 3 . 7 6 (2 H , q) , 1 . 2 6 (3 H , t) .

本發明化合物 2 6

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 7 1 (1 H , d) , 8 . 6 5 - 8 . 6 1 (1 H , m)

50

, 8.42 - 8.40 (1H, m), 8.26 (1H, d), 7.78 - 7.72 (1H, m), 7.65 (1H, d), 7.35 (1H, d), 7.31 - 7.27 (1H, m), 6.14 - 6.08 (1H, m), 4.59 (2H, d), 3.86 - 3.76 (5H, m), 1.34 (3H, t).

本發明化合物 27

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.71 (1H, d), 8.67 (1H, d), 8.58 (1H, dd), 8.32 (1H, d), 8.26 (1H, d), 7.74 - 7.70 (1H, m), 7.62 (1H, d), 7.34 (1H, dd), 5.30 (1H, t), 4.53 (2H, d), 3.83 (3H, s), 3.79 (2H, q), 1.28 (3H, t).

10

本發明化合物 28

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) : 11.25 (1H, s), 9.22 (1H, d), 8.89 (1H, d), 8.80 (1H, d), 8.38 (1H, d), 8.31 (1H, dd), 3.96 (2H, q), 1.94 - 1.84 (1H, m), 1.28 (3H, t), 1.02 - 0.88 (4H, m).

本發明化合物 29

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) : 10.83 (1H, brs), 9.13 (1H, d), 8.90 (1H, d), 8.80 (1H, d), 8.38 (1H, d), 8.31 (1H, dd), 3.99 (2H, q), 3.40 - 3.27 (6H, m), 1.32 (3H, t).

20

本發明化合物 30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.73 (1H, dd), 8.29 (1H, dd), 8.14 (1H, d), 6.73 (1H, d), 5.18 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.58 (2H, q), 1.31 (3H, t).

本發明化合物 31

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.72 (1H, s), 8.28 (1H, s), 8.19 (1H, d), 6.97 (1H, d), 5.65 (1H, brs), 3.83 (3H, s), 3.58 (2H, q), 2.70 - 2.62 (1H, m), 1.32 (3H, t), 0.98 - 0.92 (2H, m), 0.70 - 0.64 (2H, m).

本發明化合物 32

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.29 (1H, s), 8.24 (1H, d), 7.91 - 7.81 (2H, m), 7.01 (1H, d), 5.79 (1H, s), 3.78 (2H, q), 2.70 - 2.61 (1H, m), 1.40 (3H, t), 0.98 - 0.90 (2H, m), 0.70 - 0.62 (2H, m).

30

本發明化合物 33

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.31 (1H, s), 8.26 (1H, d), 7.92 - 7.80 (2H, m), 7.32 (1H, s), 7.14 (1H, s), 6.97 (1H, d), 3.85 - 3.65 (5H, m), 1.39 (3H, t).

本發明化合物 34

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.30 (1H, s), 8.11 (1H, d), 7.88 - 7.85 (2H, m), 7.40 - 7.30 (5H, m), 6.62 (1H, d), 5.74 (1H, s), 4.63 (2H, d), 3.77 (2H, q), 1.39 (3H, t).

40

本發明化合物 35

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) : 10.00 (1H, s), 8.38 - 8.36 (3H, m), 8.11 (1H, d), 7.97 - 7.95 (1H, m), 7.87 - 7.84 (3H, m), 7.22 (1H, d), 3.05 (2H, q), 1.27 (3H, t).

本發明化合物 37

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.30 (1H, s), 8.12 (1H, d), 7.93 - 7.84 (2H, m), 6.64 (1H, d), 5.47 (1H, brs), 3.99

50

- 3.91 (1H, m), 3.88 - 3.82 (1H, m), 3.80 - 3.71 (3H, m), 3.68 - 3.62 (1H, m), 3.49 - 3.39 (2H, m), 2.67 - 2.56 (1H, m), 2.18 - 2.07 (1H, m), 1.75 - 1.64 (1H, m), 1.39 (3H, t).

本發明化合物 39

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.44 (1H, d), 8.15 (1H, t), 8.12 (1H, d), 7.78 - 7.75 (2H, m), 3.91 (2H, q), 3.72 (3H, s), 2.01 - 1.99 (1H, m), 1.42 (3H, t), 1.22 - 1.20 (2H, m), 1.00 - 0.98 (2H, m).

本發明化合物 40

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) : 11.78 (1H, s), 8.43 (2H, d), 8.17 (1H, d), 7.95 (1H, d), 7.40 (1H, d), 3.79 (2H, q), 3.42 (3H, s), 1.25 (3H, t).

本發明化合物 41

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.28 (1H, s), 7.89 (1H, d), 7.85 (2H, d), 6.83 (1H, d), 3.67 (2H, q), 3.09 - 3.01 (4H, m), 1.38 - 1.36 (9H, m).

本發明化合物 43

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.25 (1H, d), 8.11 (1H, t), 7.75 (1H, d), 7.71 (1H, dd), 7.21 (1H, d), 3.82 (3H, s), 3.79 (2H, q), 3.44 (3H, s), 1.38 (3H, t).

本發明化合物 44

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.69 (1H, s), 8.56 (1H, d), 8.48 (1H, d), 8.17 (1H, d), 7.76 (1H, dd), 7.69 (1H, d), 3.89 (2H, q), 1.61 - 1.59 (1H, m), 1.41 (3H, t), 1.19 - 1.15 (2H, m), 0.99 - 0.97 (2H, m).

本發明化合物 45

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.07 (1H, s), 8.57 (1H, d), 8.47 (1H, d), 8.32 (1H, s), 7.86 (1H, d), 7.78 (1H, d), 3.86 (2H, q), 1.71 - 1.69 (1H, m), 1.40 (3H, t), 1.18 - 1.14 (2H, m), 0.98 - 0.96 (2H, m).

本發明化合物 46

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.40 (1H, d), 8.31 (1H, s), 8.11 (1H, d), 7.89 (1H, dd), 7.86 (1H, dd), 7.68 (1H, dd), 7.31 (1H, d), 6.66 (1H, d), 5.77 (1H, s), 4.68 (2H, d), 3.79 (2H, q), 1.39 (3H, t).

本發明化合物 47

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) : 9.98 (1H, s), 9.01 (1H, d), 8.88 (1H, d), 8.77 (1H, d), 8.36 (1H, d), 8.30 (1H, d), 3.91 (2H, q), 1.27 (3H, t).

本發明化合物 48

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.49 (1H, d), 8.35 (1H, s), 7.90 (2H, s), 7.48 (1H, d), 3.94 (2H, q), 3.40 (3H, s), 1.43 (3H, t).

本發明化合物 49

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) : 8.47 (1H, d), 8.25 (1H, dd), 8.09 (1H, d), 8.05 (1H, dd), 7.36 (1H, d), 3.66 (2H, q), 1.22 (3H, t).

本發明化合物 50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.24 (1H, s), 7.83 (2H, d), 7.69

10

20

30

40

50

(2 H, d), 7.52 - 7.50 (2 H, m), 7.42 (2 H, t), 7.29 - 7.21 (5 H, m), 6.58 (1 H, d), 2.96 (2 H, q), 1.38 (3 H, t).

本発明化合物 5 1

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.32 (1 H, s), 8.24 (1 H, d), 7.89 - 7.84 (2 H, m), 7.52 - 7.44 (10 H, m), 6.80 (1 H, d), 3.91 (2 H, q), 1.36 (3 H, t).

本発明化合物 5 2

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.23 (1 H, t), 7.82 (1 H, d), 7.78 (1 H, d), 7.72 (1 H, dd), 7.49 (1 H, d), 7.19 (1 H, s), 3.27 (3 H, s), 3.05 (2 H, q), 1.44 (3 H, t).

10

本発明化合物 5 3

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.20 (1 H, t), 7.84 (2 H, d), 7.74 (1 H, d), 7.66 (1 H, dd), 7.52 - 7.51 (2 H, m), 7.42 (2 H, t), 7.30 - 7.22 (5 H, m), 6.59 (1 H, d), 2.96 (2 H, q), 1.37 (3 H, t).

本発明化合物 5 4

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.23 (1 H, d), 8.11 (1 H, t), 7.76 - 7.70 (2 H, m), 7.51 - 7.35 (10 H, m), 6.77 (1 H, d), 3.93 (2 H, q), 1.36 (3 H, t).

20

本発明化合物 5 6

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.24 (1 H, t), 7.80 - 7.78 (2 H, m), 7.72 (1 H, dd), 7.64 (1 H, d), 3.70 (3 H, t), 3.07 (2 H, q), 1.47 (3 H, t).

本発明化合物 5 7

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.56 (1 H, d), 8.16 (1 H, s), 8.00 (1 H, d), 7.79 - 7.78 (2 H, m), 3.96 (2 H, q), 3.72 (3 H, s), 1.44 (3 H, t).

本発明化合物 5 9

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.26 (1 H, s), 7.82 (1 H, d, J = 8.9 Hz), 7.73 (2 H, dd, J = 2.5, 1.1 Hz), 7.48 (1 H, d, J = 8.9 Hz), 3.26 (3 H, s), 3.05 (2 H, q, J = 7.4 Hz), 1.45 (3 H, t, J = 7.4 Hz).

30

本発明化合物 6 0

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) : 8.33 (1 H, d, J = 0.7 Hz), 8.13 (1 H, d, J = 8.8 Hz), 7.91 (1 H, dd, J = 8.6, 0.5 Hz), 7.88 (1 H, dd, J = 8.6, 0.9 Hz), 7.48 (1 H, s), 6.69 (1 H, d, J = 9.1 Hz), 5.77 (1 H, t, J = 6.0 Hz), 4.80 (2 H, d, J = 5.9 Hz), 3.81 (2 H, q, J = 7.5 Hz), 1.40 (3 H, t, J = 7.4 Hz).

40

【0015】

次に本発明化合物の製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

製剤例 1

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 10 部を、キシレン 35 部と N, N - ジメチルホルムアミド 35 部との混合物に溶解し、ポリオキシエチレンステリルフェニルエーテル 14 部及びドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、混合して各々の乳剤を得る。

製剤例 2

ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部及び珪藻土 54 部を混合し、更に本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 2

50

0部を加え、混合して各々の水和剤を得る。

製剤例 3

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 2 部に、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部及びバカオリクレー 65 部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

製剤例 4

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 1 部を適当量のアセトンに溶解し、これに合成含水酸化珪素微粉末 5 部、P A P O . 3 部及びフバサミクレー 93 . 7 部を加え、充分攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の粉剤を得る。

10

製剤例 5

ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩及びホワイトカーボンの混合物（重量比 1 : 1）35 部と、本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 10 部と、水 55 部とを混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々のフロアブル剤を得る。

製剤例 6

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 0 . 1 部をキシレン 5 部及びトリクロロエタン 5 部に溶解し、これを脱臭灯油 89 . 9 部に混合して各々の油剤を得る。

製剤例 7

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 10 mg をアセトン 0 . 5 ml に溶解し、この溶液を、動物用固形飼料粉末（飼育繁殖用固形飼料粉末 C E - 2、日本クレア株式会社商品）5 g に処理し、均一に混合する。ついでアセトンを蒸発乾燥させて各々の毒餌剤を得る。

20

製剤例 8

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 0 . 1 部、ネオチオゾール（中央化成株式会社）49 . 9 部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、ジメチルエーテル 25 部、L P G 25 部を充填し振とうを加え、アクチュエータを装着することで油剤エアゾールを得る。

製剤例 9

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

30

製剤例 10

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 0 . 1 g を、プロピレングリコール 2 ml に溶解させ、4 . 0 x 4 . 0 cm、厚さ 1 . 2 cm の多孔セラミック板に含浸させて、加熱式くん煙剤を得る。

製剤例 11

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 5 部とエチレン-メタクリル酸メチル共重合体（共重合体中のメタクリル酸メチルの割合：10 重量%、アクリフト W D 301、住友化学製）95 部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で熔融混練し、得られた混練物を押し出し成型機から成型ダイスを介して押し出し、長さ 15 cm、直径 3 mm の棒状成型体を得る。

40

製剤例 12

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 5 部と軟質塩化ビニル樹脂 95 部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で熔融混練し、得られた混練物を押し出し成型機から成型ダイスを介して押し出し、長さ 15 cm、直径 3 mm の棒状成型体を得る。

製剤例 13

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 100 mg、ラクトース 68 . 75 mg、トウモ

50

ロコシデンブン 237.5 mg、微結晶性セルロース 43.75 mg、ポリビニルピロリドン 18.75 mg、ナトリウムカルボキシメチルデンブン 28.75 mg、及びステアリン酸マグネシウム 2.5 mg を混合し、得られた混合物を適切な大きさに圧縮して、錠剤を得る。

製剤例 14

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

製剤例 15

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 1000 mg、フマル酸 500 mg、塩化ナトリウム 2000 mg、メチルパラベン 150 mg、プロピルパラベン 50 mg、顆粒糖 25000 mg、ソルビトール (70% 溶液) 13000 mg、Veegum K (Vanderbilt Co.) 100 mg、香料 35 mg、及び着色料 500 mg に、最終容量が 1000 ml となるよう蒸留水を加え、混合して、経口投与用サスペンションを得る。

製剤例 16

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 5 重量%を、ポリソルベート 85 5 重量%、ベンジルアルコール 3 重量%、及びプロピレングリコール 30 重量%に溶解し、この溶液の pH が 6.0 ~ 6.5 となるようにリン酸塩緩衝液を加えた後、最終容量となるまで水を加えて、経口投与用液剤を得る。

製剤例 17

分留ヤシ油 57 重量%およびポリソルベート 85 3 重量%中にジステアリン酸アルミニウム 5 重量%を加熱により分散させる。これを室温に冷却し、その油状ビヒクル中のサッカリン 25 重量%を分散させる。これに本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 10 重量%を配分し、経口投与用ペースト状製剤を得る。

製剤例 18

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 5 重量%を石灰石粉 95 重量%と混合し、湿潤顆粒形成法を使用して経口投与用粒剤を得る。

製剤例 19

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 5 部をジエチレングリコールモノエチルエーテル 80 部に溶解し、これに炭酸プロピレン 15 部を混合して、スポットオン液剤を得る。

製剤例 20

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 10 部をジエチレングリコールモノエチルエーテル 70 部に溶解し、これに 2-オクチルドデカノール 20 部を混合して、ポアオン液剤を得る。

製剤例 21

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

製剤例 22

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 0.15 重量%、動物飼料 95 重量%、並びに、第 2 リン酸カルシウム、珪藻土、Aerosil、及びカーボネート (又はチョーク) からなる混合物 4.85 重量%を充分攪拌混合し、動物用飼料プレミックスを得る。

製剤例 23

本発明化合物 1 ~ 60 のいずれか 1 種 7.2 g、及びホスコ S-55 (丸石製薬株式会社製) 92.8 g を 100 で溶解混和し、坐剤形に注いで、冷却固化して、坐剤を得る。

。

【0016】

試験例 1

10

20

30

40

50

製剤例 5 により得られた本発明化合物 1 ~ 17、19 ~ 27、30 - 34、36 ~ 39、41 ~ 46、48 ~ 49、51、54 及び 57 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたキュウリ幼苗（第 1 本葉展開期）にワタアブラムシ（*Aphis gossypii*）（全ステージ）約 30 頭を接種し、1 日間放置した。この幼苗に、前記試験用薬液 20 ml を散布した。

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

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

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の処理前の虫数

C_{a_i} : 無処理区の観察時の寄生生存虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

T_{a_i} : 処理区の観察時の寄生生存虫数

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

その結果、本発明化合物 1 ~ 17、19 ~ 27、30 - 34、36 ~ 39、41 ~ 46、48 ~ 49、51、54 及び 57 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90 % 以上を示した。

試験例 2

製剤例 5 により得られた本発明化合物 2、4 ~ 5、8 ~ 9、13、15 ~ 16、19、22 ~ 23、30 ~ 33 及び 41 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

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

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

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の処理前の虫数

C_{a_i} : 無処理区の観察時の寄生生存虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

T_{a_i} : 処理区の観察時の寄生生存虫数

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

その結果、本発明化合物 2、4 ~ 5、8 ~ 9、13、15 ~ 16、19、22 ~ 23、30 ~ 33 及び 41 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90 % 以上を示した。

試験例 3

製剤例 5 により得られた本発明化合物 3、15 ~ 16、19、22 ~ 23、30 ~ 34、36 ~ 39、41 ~ 46、48、51 及び 54 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

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

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

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の処理前の虫数

C_{a_i} : 無処理区の観察時の寄生生存虫数

10

20

30

40

50

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の寄生生存虫数

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

その結果、本発明化合物 3、15 ~ 16、19、22 ~ 23、30 ~ 34、36 ~ 39、41 ~ 46、48、51 及び 54 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90 % 以上を示した。

試験例 4

製剤例 5 により得られた本発明化合物 3、5 ~ 6、8、11、15 ~ 16、19 ~ 20、22 ~ 23、30 ~ 34、39、41 ~ 43 及び 45 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたイネ幼苗（播種 2 週間後、第 2 葉展開期）に、前記試験用薬液 5 ml を株元灌注し、7 日間 25 °C 温室内に保った。トビイロウンカ（*Nilaparvata lugens*）の 3 ~ 4 齢幼虫を 20 頭放して、更に 6 日該温室内に保った後に、該イネの葉上に寄生したトビイロウンカ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価}(\%) = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の虫数

C a i : 無処理区の観察時の寄生生存虫数

T b : 処理区の処理前の虫数

T a i : 処理区の観察時の寄生生存虫数

ここで無処理区とは、製剤例 3、5 ~ 6、8、11、15 ~ 16、19 ~ 20、22 ~ 23、30 ~ 34、39、41 ~ 43 及び 45 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 5 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90 % 以上を示した。

試験例 5

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

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

$$\text{防除価}(\%) = \{ 1 - (C b \times T a i) / (C a i \times T b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C b : 無処理区の処理前の幼虫数

C a i : 無処理区の観察時の生存幼虫数

T b : 処理区の処理前の幼虫数

T a i : 処理区の観察時の生存幼虫数

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

その結果、本発明化合物の試験用薬液を用いた処理区は、優れた防除価が得られる。

試験例 6

製剤例 5 により得られた本発明化合物 1、6 ~ 9、11、14 ~ 16、19、22 ~ 24、30 ~ 32、34 ~ 39、41 ~ 43 及び 45 ~ 46 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、ポリエチレンカップに植えた 3 葉期キャベツに、前記試験用薬液を 20 ml / カップの割合で散布した。薬液が乾いた後、茎葉部を切り取って 50 ml カップに収容し、コナガ（*Plutella xylostella*）2 令幼虫 5 頭を放ち、蓋をした。2

10

20

30

40

50

5 で保管し、5日後に死亡虫数を数え、次式より死虫率を求めた。

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

その結果、本発明化合物 1、6～9、11、14～16、19、22～24、30～32、34～39、41～43及び45～46の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率80%以上を示した。

試験例 7

製剤例 5により得られた本発明化合物 1、3、7～9、11、15～17、19～22、24～26及び30～31の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

一方、プラスチックカップにリンゴを植え、第7本葉ないしは第8本葉が展開するまで生育させた。そのリンゴに上記試験用薬液を20mL/カップの割合で散布した。薬液が乾いた後、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*) 初齢幼虫60頭を放ち、底面をくりぬきろ紙を貼ったプラスチックカップを逆さにして被せた。7日後に死亡虫数を数え、次式より死虫率を求めた。

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

その結果、本発明化合物 1、3、7～9、11、15～17、19～22、24～26及び30～31の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率90%以上を示した。

試験例 8

製剤例 5により得られた本発明化合物 1、9、15～16、19、22、24、31～32、34、41及び45～46の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

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

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

その結果、本発明化合物 1、9、15～16、19、22、24、31～32、34、41及び45～46の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率100%を示した。

試験例 9

製剤例 5により得られた本発明化合物 9、15～16、19、22、30～32、34、41及び45～46の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

直径5.5cmのポリエチレンカップの底に同大の濾紙を敷き、上記試験用薬液0.7mlを濾紙上に滴下し、餌としてシヨ糖30mgを均一に入れた。該ポリエチレンカップ内にチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 雄成虫2頭を放ち、蓋をした。6日後にチャバネゴキブリの生死を調査し死亡虫数を数え、次式により死虫率を求めた。

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

その結果、本発明化合物 9、15～16、19、22、30～32、34、41及び45～46の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率100%を示した。

試験例 10

製剤例 5により得られた本発明化合物 1、4、6～12、14～16、19、22～24、30～32、34、36～39、41～43及び45～46の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

上記試験用薬液0.7mlをイオン交換水100mlに加えた(有効成分濃度3.5ppm)。該液中にアカイエカ (*Culex pipiens pallens*) 終令幼虫20頭を放ち、1日後にその生死を調査し死亡虫数を数え、死虫率を求めた。

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

その結果、本発明化合物 1、4、6～12、14～16、19、22～24、30～32、34、36～39、41～43及び45～46の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率

95%以上を示した。

試験例 1 1

本発明化合物 8 ~ 9、20、22 及び 31 ~ 32 の各々 2 mg をスクリー管 (マルエム No. 5; 27 × 55 mm) に量取りアセトン 0.2 mL を加えて蓋をし溶解した。スクリー管を回転・反転させ内壁全体に均一になるよう薬液をコーティングした。蓋を取り約 2 時間風乾させた後、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*) 未吸血若ダニ 1 群 5 頭を放し蓋をした。2 日後に死亡虫数を数え、次式により死虫率を算出した。

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

その結果、本発明化合物 8 ~ 9、20、22 及び 31 ~ 32 の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率 100% を示した。

10

試験例 1 2

製剤例 1 により得られた本発明化合物 3、7、28、32 ~ 34、36 ~ 46、48 ~ 49、51 及び 54 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調整した。

一方、ポリエチレンカップに植えた 3 葉期キュウリに、前述試験用薬液を 30 mL / カップの割合で散布した。薬液が乾いた後、第 2 葉を切り取って 200 mL カップに収容し、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*) 2 令幼虫 10 頭を放ち、蓋をした。25 °C で保管し、5 日後に死亡虫数を数え、次式より死虫率を求めた。

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

20

その結果、本発明化合物 3、7、28、32 ~ 34、36 ~ 46、48 ~ 49、51 及び 54 の試験用薬液を用いた処理区は、各々死虫率 80% 以上を示した。

試験例 1 3

製剤例 1 により得られた本発明化合物の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調整する。

一方、ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*) 用の人工飼料を、Pleauらの手順 (*Entomologia Experimentalis et Applicata* 105: 1 - 11, 2002) に従って準備し、24 穴マイクロプレート (Becton Dickinson 製) の各ウェル内に 2 mL 入れる。人工飼料表面に前述の試験用薬液を 40 μL / ウェルの割合で散布処理し、薬液が乾いた後、ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*) 初齢幼虫を 1 ウェルあたり 5 匹放ち、パラフィルム (Bemis Company 製) を被せ、蓋をする。25 °C で保管し、処理 3 日後に死亡虫数を数え、次式より死虫率を求める。

30

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

その結果、本発明化合物を用いた処理区では、防除効力が認められる。

【産業上の利用可能性】

【0017】

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

40

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 P	33/14 (2006.01)	A 6 1 P	33/14
A 0 1 N	43/90 (2006.01)	A 0 1 N	43/90 1 0 4
A 0 1 N	43/76 (2006.01)	A 0 1 N	43/76 1 0 1
A 0 1 N	47/18 (2006.01)	A 0 1 N	47/18 1 0 1 A
A 0 1 N	47/36 (2006.01)	A 0 1 N	47/36 1 0 1 A
A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 P	7/02
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04

- (72)発明者 田中 綾香
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
- (72)発明者 西村 慎哉
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
- (72)発明者 野倉 吉彦
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内

審査官 谷尾 忍

- (56)参考文献 特許第6350528(JP, B2)
 国際公開第2013/018928(WO, A1)
 特許第6219317(JP, B2)
 特許第6228937(JP, B2)
 特許第6177808(JP, B2)
 特許第6191626(JP, B2)
 特許第6178345(JP, B2)
 国際公開第2012/086848(WO, A1)
 国際公開第2002/002540(WO, A1)
 特表2005-505523(JP, A)
 特開2009-280574(JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D 4 1 3 / 0 4
 A 0 1 N 4 3 / 7 6
 A 0 1 N 4 3 / 9 0
 A 0 1 N 4 7 / 1 8
 A 0 1 N 4 7 / 3 6
 A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9
 A 6 1 K 3 1 / 4 4 4
 C 0 7 D 4 1 3 / 1 4
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4
 C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)