

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2020年12月17日(17.12.2020)



(10) 国際公開番号

WO 2020/251012 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 211/14 (2006.01) C07C 317/22 (2006.01)
A01N 41/10 (2006.01) C07C 317/32 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01) C07C 319/20 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01) C07C 321/28 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01) C07D 211/18 (2006.01)
A01P 5/00 (2006.01) C07D 211/62 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01) C07D 295/092 (2006.01)
C07C 315/04 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2020/023191

(22) 国際出願日: 2020年6月12日(12.06.2020)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願 2019-110237 2019年6月13日(13.06.2019) JP

(71) 出願人: アグロカネショウ株式会社 (AGRO-KANESHO CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1070052 東京都港区赤坂4丁目2番19号 Tokyo (JP).

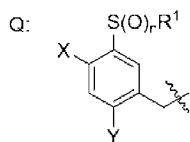
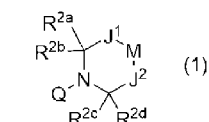
(72) 発明者: 八田 響(HATTA Hibiki); 〒3590024 埼玉県所沢市下安松852 アグロカネショウ株式会社 所沢研究所内 Saitama (JP). 小山 一秋(OYAMA Katsuaki); 〒3590024 埼玉県所沢市下安松852 アグロカネショウ株式会社 所沢研究所内 Saitama (JP). 荒木 恒一(ARAKI Koichi); 〒3590024 埼玉県所沢市下安松852 アグロカネショウ株式会社 所沢研究所内 Saitama (JP). 森下 祥(MORISHITA Saki); 〒3070001 茨城県結城市結城9511-4 アグロカネショウ株式会社 結城研究所内 Ibaraki (JP). 福地 俊樹(FUKUCHI Toshiki); 〒3070001 茨城県結城市結城9511-4 アグロカネショウ株式会社 結城研究所内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 田中 伸一郎, 外(TANAKA Shinichiro et al.); 〒1008355 東京都千代田区丸の内3丁目3番1号 新東京ビル 中村合同特許法律事務所 Tokyo (JP).

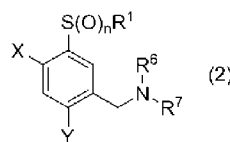
(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ,

(54) Title: NOVEL 1-BENZYLAMINE DERIVATIVE AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL AGENT USING SAME AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: 新規な1-ベンジルアミン誘導体及びこれを有効成分とする農園芸用薬剤



又は
AA



AA or

(57) Abstract: Provided is an agricultural and horticultural agent, in particular a compound which is useful as the active ingredient of an agricultural and horticultural pest control agent, a mite control agent, a nematode control agent or a disease control agent. Specifically, a 1-benzylamine derivative represented by formula (1) or (2), N-oxide thereof, or a salt thereof. In the formula, R¹ is, for example, a C₁₋₆ alkyl group or a halo-C₁₋₆ alkyl group, n is 1, X is, for example, a C₁₋₆ alkyl group, a C₁₋₆ halo-alkyl group, a halogen atom or a cyano group, R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} and R^{2d} are, for example, hydrogen atoms, J¹ and J² are direct bonds or -alkylene groups, M are -alkylene groups or -NR⁵-, -O-, -S-, -S(O)-, or -S(O)₂-, R⁵ is, for example, a C₁₋₆ alkyl group or the like, R⁶ and R⁷ are, for example, hydrogen atoms or C₁₋₆ alkyl groups.

BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 一 国際調査報告 (条約第21条(3))

(57) 要約: 農園芸用薬剤、特に農園芸用害虫防除剤、ダニ防除剤、線虫防除剤又は病害防除剤の有効成分として有用である化合物を提供する。具体的には、下式(1)又は(2)で示されるで表される1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩である。式中、 R^1 は、例えば、 C_{1-6} アルキル基やハロ C_{1-6} アルキル基であり、 n は、1であり、 X は、例えば、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、ハロゲン原子又はシアノ基であり、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^{2d} は、例えば、水素原子であり、 J^1 及び J^2 は、直接結合又は-アルキレン基であり、 M は、-アルキレン基や、- NR^5 -、-O-、-S-、-S(O)-、-S(O)₂-であり、 R^5 は、例えば、 C_{1-6} アルキル基などであり、 R^6 及び R^7 は、例えば、水素原子や、 C_{1-6} アルキル基などである。

明 細 書

発明の名称：

新規な 1-ベンジルアミン誘導体及びこれを有効成分とする農園芸用薬剤
技術分野

[0001] 本発明は、新規な 1-ベンジルアミン誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用害虫防除剤、ダニ防除剤、線虫防除剤、又は農園芸用病害防除剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

[0002] 農園芸分野では、各種病虫害の防除を目的とした植物病虫害防除剤が開発、実用化されている。しかしながら、薬剤抵抗性を獲得した害虫又は病害の出現が問題となっており、新規な剤の開発が切望されている。

特許文献 1 には、1-ベンジルピペリジン誘導体が動物用の殺ダニ剤として有用であることが記載されている。しかしながら、特許文献 1 には、1-ベンジルピペリジン誘導体のフェニル基 5 位の置換基として具体的に本発明のような硫黄置換基を導入した化合物は開示されていない。更に、特許文献 1 に記載された化合物について追試した結果、それらのハダニ類に対する効果は不十分であることが判明した。

また、本発明の化合物類縁化合物として、以下の化合物が開示されている（例えば、特許文献 2～3）。しかしながら、特許文献 2～3 に開示されるこれらの化合物は、いずれも本発明の化合物と化学構造が相違する。

先行技術文献

特許文献

- [0003] 特許文献 1：US 2009/0082389 A1
特許文献 2：特開 2014-108943 号公報
特許文献 3：国際公開第 2018/051252 号

発明の概要

発明が解決しようとする課題

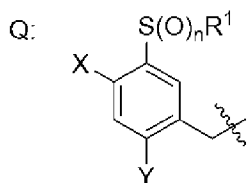
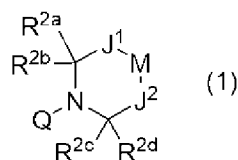
[0004] 農業及び園芸等の作物生産において、害虫、病害による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性病害虫の発生等の要因から新規な農園芸用薬剤の開発が望まれている。

課題を解決するための手段

[0005] 本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意研究を重ねた結果、文献未記載の新規化合物である下式（１）で表される１－ベンジルアミン誘導体が、農園芸用薬剤、特に農園芸用害虫防除剤、ダニ防除剤、線虫防除剤又は病害防除剤として有用であることを見だし、本発明を完成させたものである。

即ち、本発明は、下式（１）～（２）で表される１－ベンジルアミン誘導体、そのＮ－オキシド又はその塩を有効成分とする農園芸用薬剤及びその使用方法並びにその製造方法に関するものである。

式（１）：



[式中、

R¹は、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₆アルキル基又はC₃₋₆ハロシクロアルキルC₁₋₆アルキル基を示し、

nは、0～2の整数を示し、

Xは、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニ

ル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{3-6} ハロシクロアルキル基、 C_{1-6} アルキコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシメチル基、ホルミル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基又は C_{1-6} ハロアルキル基を示し、

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^{2d} は、それぞれ同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基又は C_{1-6} ハロアルキル基を示し、

J^1 は、直接結合、 $C R^{3a} R^{3b}$ -又は $-C R^{3a} R^{3b}-C R^{3c} R^{3d}$ -を示し、

J^2 は、直接結合又は $-C R^{3e} R^{3f}$ -を示し、

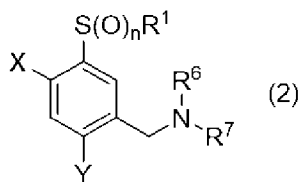
R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 及び R^{3f} は、それぞれ同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基又は C_{1-6} ハロアルキル基を示し、

Mは、 $-C R^{4a} R^{4b}$ -、 $-N R^5$ -、 $-O$ -、 $-S$ -、 $-S(O)$ -又は $-S(O)_2$ -を示し、

R^{4a} 及び R^{4b} は、それぞれ同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、シアノ基又は C_{1-6} アルコキシカルボニル基を示し、

R^5 は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} ハロアルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基又は C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基を示す。]、又は

[0006] 式(2)：



[式中、

R^1 は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} ハロアルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{2-6} ハロアルキニル基、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-6} アルキル基又は C_{3-6} ハロシクロアルキル C_{1-6} アルキル基を示し、

nは、0~2の整数を示し、

Xは、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₃₋₆ハロシクロアルキル基、C₁₋₆アルキコキシカルボニル基、C₁₋₆アルコキシメチル基、ホルミル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

R⁶及びR⁷は、同一又は異なっても良く、水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、シアノ基、シアノC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、R⁸で1個以上置換されていてもよいフェニル基、C₁₋₃アルキルフェニル基（このときフェニル基はR⁹で1個以上置換されていてもよい）又はR¹⁰で1個以上置換されていてもよいC₃₋₆シクロアルキル基を示し、

R⁸は、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

R⁹は、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

R¹⁰は、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示す。】。

発明の効果

[0007] 本発明の化合物は、農園芸用薬剤、特に農園芸用害虫防除剤、ダニ防除剤、線虫防除剤又は病害防除剤として優れた効果を奏する。また、犬や猫といった愛玩動物、又は牛や羊等の家畜に寄生する害虫に対しても効果を有する。

発明を実施するための形態

[0008] 前記式（1）又は（2）で表される本発明の化合物の定義において、「ハロゲン原子」とは、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はフッ素原子を示し、「C₁₋₆アルキル基」とは、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数

1～6個、好ましくは、1～3個のアルキル基を示し、「C₁₋₆ハロアルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「C₃₋₆シクロアルキル」とは、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の環状の炭素原子数3～6個、好ましくは、3～4個のシクロアルキル基を示す。

[0009] C₁₋₆ハロアルキル基としては、例えば、フルオロメチル基、クロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブromジフルオロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、1-フルオロエチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromエチル基、2-ヨードエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2, 2-ジフロロエチル基、1-フルオロイソプロピル基、3-フルオロプロピル基、3-クロロプロピル基、3-ブromプロピル基、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、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル、ノナフルオロブチル基等の1～9個、好ましくは、3～9個のハロゲン原子で置換された炭素数1～6の直鎖状又は分岐鎖状アルキル基が挙げられる。

C₂₋₆アルケニル基としては、例えば、ビニル基、アリル基、イソプロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1, 1-ジメチル-2-プロペニル基、1-エチル-2-プロペニル基、1-メチル-2-ブテニル基、1-メチル-3-ブテニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基、1, 1-ジメチル-2-ブテニル基、1, 1-ジメチル-3-ブテニル基等の任意の位置に少なくとも1つの二重結合を有する炭素数2～6個、好ましくは、2～4個の直鎖状又は分岐鎖状アルケニル基が挙げられる。

C₂₋₆ハロアルケニル基としては、例えば、1-フルオロビニル基、2-フロロビニル基、2, 2-ジフロロビニル基、3-クロロ-2-プロペニル基、

3, 3-ジフルオロ-2-アリル基、3, 3-ジクロロ-2-アリル基、4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブテニル基、4, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテニル基、5-クロロ-3-ペンテニル基、6-フルオロ-2-ヘキセニル基等の任意の位置に少なくとも1つの二重結合を有する1~9個、好ましくは、2個~5個のハロゲン原子で置換された、炭素数2~6の直鎖状又は分岐鎖状アルケニル基が挙げられる。

[0010] C_{2-6} アルキニル基としては、例えば、エチニル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、1, 1-ジメチル-2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、1-メチル-3-ブチニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基、1, 1-ジメチル-3-ブチニル基、1-メチル-3-ペンチニル基、1-メチル-4-ペンチニル基等の任意の位置に少なくとも1つの三重結合を有する炭素数2~6個、好ましくは2~3個の直鎖状又は分岐鎖状アルキニル基が挙げられる。

C_{2-6} ハロアルキニル基としては、フルオロエチニル基、4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基、5,5,5-トリフルオロ-3-ペンチニル基、1-メチル-3,3,3-トリフルオロ-2-ブチニル基、1-メチル-5,5,5-トリフルオロ-2-ペンチニル基等の任意の位置に少なくとも1つの三重結合を有する1~9個、好ましくは2~5個のハロゲン原子で置換された、炭素数2~6の直鎖状又は分岐鎖状アルキニル基が挙げられる。

C_{1-6} アルコキシ基としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、イソプロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、*n*-ペントキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基などの炭素数1~6個、好ましくは、1~3個の直鎖状又は分岐鎖状アルコキシ基が挙げられる。

[0011] C_{1-6} ハロアルコキシ基としては、例えば、フルオロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメ

トキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、ジクロロフルオロメトキシ基、1-フルオロエトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブromoエトキシ基、2-ヨードエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリクロロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、1-フルオロイソプロポキシ基、3-フルオロプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、3-ブromoプロポキシ基、4-フルオロブトキシ基、4-クロロブトキシ基等の、好ましくは、1~9個のハロゲン原子で置換された、炭素数1~6の直鎖状又は分岐鎖状アルコキシ基が挙げられる。

C₃₋₆ハロシクロアルキル基としては、例えば、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、2, 2, 3, 3-テトラフルオロシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、2-クロロシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、2, 2, 3, 3-テトラクロロシクロプロピル、2, 2-ジブromoシクロプロピル、1-フルオロシクロブチル、2-フルオロシクロブチル、3-フルオロシクロブチル、3, 3-ジフルオロシクロブチル、3, 3-ジクロロシクロブチル、1-フルオロシクロペンチル、2-フルオロシクロペンチル、3-フルオロシクロペンチル、2, 2-ジフルオロシクロペンチル、3, 3-ジフルオロシクロペンチル、2, 2-ジクロロシクロペンチル、1-フルオロシクロヘキシル基等の、好ましくは、1~4個のハロゲン原子で置換された、炭素数3~6のシクロアルキル基が挙げられる。

[0012] C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₆アルキル基としては、例えば、シクロプロピルメチル、2-シクロプロピルエチル、3-シクロプロピルプロピル、4-シクロプロピルブチル、5-シクロプロピルペンチル、6-シクロプロピルヘキシル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル等の基が挙げられる。C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₆アルキル基を構成するC₃₋₆シクロアルキル基及びC₁₋₆アルキル基の好ましい炭素数は、上記で規定したものと同様である。

C₃₋₆ハロシクロアルキルC₁₋₆アルキル基としては、例えば、1-フルオロシ

クロプロピルメチル、2-フルオロシクロプロピルメチル、2, 2-ジフルオロシクロプロピルメチル、2-クロロシクロプロピルメチル、2, 2-ジクロロシクロプロピルメチル、2-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)エチル、2-(2, 2-ジクロロシクロプロピル)エチル、3-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)プロピル、4-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)ブチル、5-(2, 2-ジクロロシクロプロピル)ペンチル、6-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)ヘキシル、2, 2-ジフルオロシクロブチルメチル、2, 2-ジクロロシクロブチルメチル、3, 3-ジフルオロシクロペンチルメチル、3, 3-ジクロロシクロペンチルメチル、4, 4-ジフルオロシクロヘキシルメチル又は4, 4-ジクロロシクロヘキシルメチル等の基が挙げられる。 C_{3-6} ハロシクロアルキル C_{1-6} アルキル基を構成する C_{3-6} ハロシクロアルキル基のハロゲン原子の数、及び C_{3-6} ハロシクロアルキル基及び C_{1-6} アルキル基の好ましい炭素数は、上記の通りである。

[0013] C_{1-6} 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、エトキシカルボニル、*n*-プロピルカルボニル、*n*-ブチルカルボニル、*n*-ペンチルカルボニル、*n*-ヘキシルカルボニル、*i*-プロピルカルボニル基等の基が挙げられる。 C_{1-6} アルコキシカルボニル基を構成する C_{1-6} アルコキシ基の好ましい炭素数は、上記の通りである。

C_{1-6} アルコキシメチル基における C_{1-6} アルコキシ基の内容は、上記で説明した通りである。

C_{1-6} アルキルカルボニル基における C_{1-6} アルキル基の内容は、上記で説明した通りである。

C_{1-6} ハロアルキルカルボニル基における C_{1-6} ハロアルキル基の内容は、上記で記載した通りである。

C_{1-6} アルキルスルホニル基における C_{1-6} アルキル基の内容は、上記で説明した通りである。

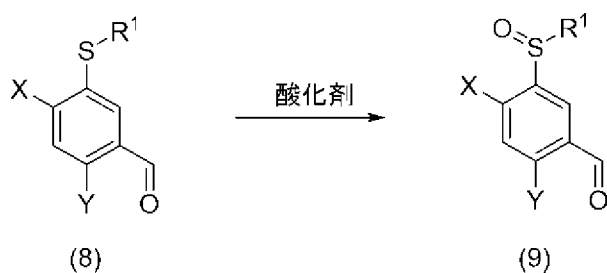
C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基における C_{1-6} ハロアルキル基の内容は、上記で記載した通りである。

[0014] 本発明の前記式（１）又は（２）で表される１－ベンジルアミン誘導体の塩としては、例えば、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、ｐ－トルエンスルホン酸塩等の有機酸塩を例示することができる。

本発明の前記式（１）又は（２）で表される１－ベンジルアミン誘導体は、その構造式中に１つ又は複数個の不斉中心を含む場合があり、２種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の前記式（１）又は（２）で表される１－ベンジルアミン誘導体は、その構造式中に炭素－炭素二重結合に由来する２種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

[0015] 以下に、本発明の前記式（１）又は（２）で表される新規１－ベンジルアミン誘導体の代表的な製造方法を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

反応式１



[式中、X、Y及びR¹は、式（１）で定義した通りである。]

反応式１に示す方法においては、前記式（９）で表される３－スルフィニルベンズアルデヒド誘導体は、前記式（８）で表される３－スルファニルベンズアルデヒド誘導体の酸化反応により製造することができる。

[0016] 前記式（８）で表される３－スルファニルベンズアルデヒド化合物の酸化反応で使用される溶媒は、該反応に対して不活性な溶媒を広く使用することが

できる。例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ヘプタン等の脂肪族もしくは脂環式炭化水素系溶媒、ベンゼン、クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、塩化メチレン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン系溶媒、N, N-ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性極性溶媒等、酢酸等のカルボン酸等、又は水を挙げることができる。これらの溶媒は、1種を単独で使用でき、又は必要に応じて2種以上を混合して使用することができる。

前記式(8)で表される3-スルファニルベンズアルデヒド化合物の酸化反応で使用される酸化剤としては、例えば、m-クロロ過安息香酸、過ヨウ素酸ナトリウム、過酸化水素、次亜塩素酸 tert-ブチル、次亜塩素酸ナトリウム等が挙げられる。

このような酸化剤は、前記式(8)で表される3-スルファニルベンズアルデヒド誘導体に対して、通常1～3当量、好ましくは1～2.5当量となるような量で使用され得る。

該反応は、通常-78℃から使用する溶媒の沸点温度までの範囲内で行うことができ、0℃～室温下で反応を行うのが好ましい。

反応時間は反応温度等により異なり一概には言えないが、通常0.5～24時間程度で該反応は完結する。

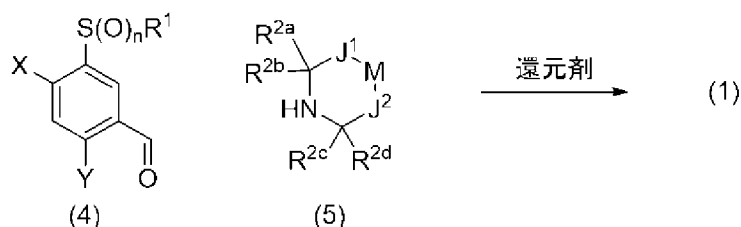
上記各反応で得られる目的化合物は、通常行われている単離手段、例えば有機溶媒抽出法、クロマトグラフィー法、再結晶法、蒸留法等により、反応混合物から容易に単離されることができ、更に通常の精製手段により精製され得る。

[0017] 上記反応に用いられる前記式(8)で表される3-スルファニルベンズアルデヒド誘導体は、例えば特許文献2に記載の方法等により製造することがで

きる。

また、公知の文献、例えば、Molecules, 2015, 20, 5409–5422. 等に記載の方法により製造することもできる。

[0018] 反応式 2



[式中、 X 、 Y 、 n 、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、 M 、 J^1 及び J^2 は、式(1)で定義した通りである。]

反応式 2 に示す反応においては、前記式 (1) で表される 1-ベンジルアミン誘導体は、前記式 (4) で表されるベンズアルデヒド誘導体と前記式 (5) で表されるアミン類とを、還元剤の存在下に不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

[0019] 前記式 (4) の化合物と前記式 (5) の化合物との反応で使用される溶媒は、該反応に対して不活性な溶媒を広く使用することができる。例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ヘプタン等の脂肪族もしくは脂環式炭化水素系溶媒、ベンゼン、クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、塩化メチレン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、酢酸、ギ酸、プロピオン酸等のカルボン酸溶媒、 N , N -ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、 N -メチルピロリドン、 N , N' -ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性極性溶媒等を挙げることができる。これらの溶媒は、1 種を単独で使用でき、又は必要に応じて 2 種以上を混合して使用することができ

る。特に、少量の酢酸とそれ以外の不活性な溶媒とを混合して使用することが好ましい。

前記式（４）の化合物と前記式（５）の化合物との反応で使用される還元剤としては、公知の水素化ホウ素化合物及びその塩、又は水素化アルミニウム化合物を使用できる。水素化ホウ素化合物及びその塩としては、例えば、ボラン、ボラン-テトラヒドロフラン錯体、ボラン-2-メチルピリジン錯体、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、ナトリウムトリアセトキシボロヒドリド等が挙げられる。水素化アルミニウム化合物としては、水素化アルミニウムリチウム、水素化ジイソピロピルアルミニウム等が挙げられる。

このような還元剤は、前記式（４）で表されるベンズアルデヒド化合物に対して、通常１～１００当量、好ましくは１～２当量となるような量で使用され得る。

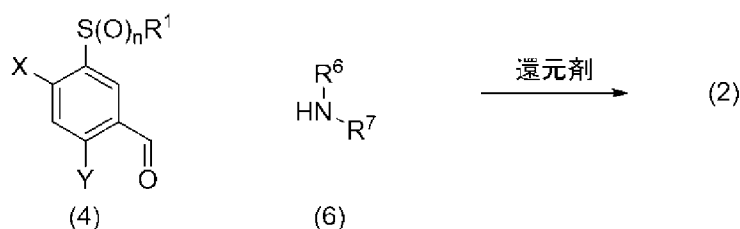
前記式（４）で表されるベンズアルデヒド化合物と前記式（５）で表されるアミン類との使用割合は、（４）に対し（５）を１～２モル使用するのがより好ましい。

該反応は、通常－７８℃から使用する溶媒の沸点温度までの範囲内で行うことができ、室温～１００℃で反応を行うのが好ましい。

反応時間は反応温度等により異なり一概には言えないが、通常０．５～２４時間程度で該反応は完結する。

上記各反応で得られる目的化合物は、通常行われている単離手段、例えば有機溶媒抽出法、クロマトグラフィー法、再結晶法、蒸留法等により、反応混合物から容易に単離されることができ、更に通常の精製手段により精製され得る。

[0020] 反応式３



[式中、X、Y、n、 R^1 、 R^6 及び R^7 は、式(2)で定義した通りである。]

反応式3に示す反応においては、前記式(2)で表される1-ベンジルアミン誘導体は、前記式(4)で表されるベンズアルデヒド誘導体と、前記式(6)で表されるアミン類とを、還元剤の存在下に不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

[0021] 前記式(4)の化合物と、前記式(6)の化合物との反応で使用される溶媒は、該反応に対して不活性な溶媒を広く使用することができる。例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ヘプタン等の脂肪族もしくは脂環式炭化水素系溶媒、ベンゼン、クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、酢酸、ギ酸、プロピオン酸等のカルボン酸溶媒、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性極性溶媒等を挙げることができる。これらの溶媒は、1種を単独で使用でき、又は必要に応じて2種以上を混合して使用することができる。特に、少量の酢酸とそれ以外の不活性な溶媒とを混合して使用することが好ましい。

前記式(4)の化合物と、前記式(6)の化合物との反応で使用される還元剤としては、公知の水素化ホウ素化合物及びその塩、又は水素化アルミニウム化合物を使用できる。水素化ホウ素化合物及びその塩としては、例えば

、ボラン、ボラン-テトラヒドロフラン錯体、ボラン-2-メチルピリジン錯体、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、ナトリウムトリアセトキシボロヒドリド等が挙げられる。水素化アルミニウム化合物としては、水素化アルミニウムリチウム、水素化ジイソピロピルアルミニウム等が挙げられる。

このような還元剤は、前記式(4)で表されるベンズアルデヒド化合物に対して、通常1~100当量、好ましくは1~2当量となるような量で使用される。

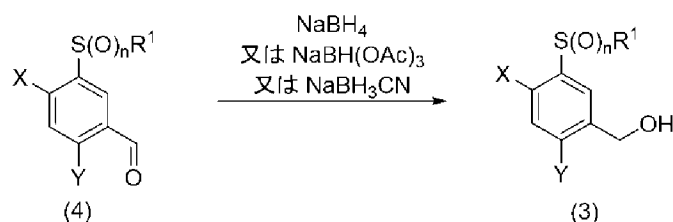
前記式(4)で表されるベンズアルデヒド化合物と、前記式(6)で表されるアミン類との使用割合は、式(4)の化合物に対し、式(6)の化合物を1~2モル使用するのがより好ましい。

該反応は、通常-78℃から使用する溶媒の沸点温度までの範囲内で行うことができ、室温~100℃で反応を行うのが好ましい。

反応時間は反応温度等により異なり一概には言えないが、通常0.5~24時間程度で該反応は完結する。

上記各反応で得られる目的化合物は、通常行われている単離手段、例えば、有機溶媒抽出法、クロマトグラフィー法、再結晶法、蒸留法等により、反応混合物から容易に単離されることができ、更に通常の精製手段により精製され得る。

[0022] 反応式4



[式中、

R¹は、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₃₋₆シクロアルキ

ル C_{1-6} アルキル基又は C_{3-6} ハロシクロアルキル C_{1-6} アルキル基を示し、

n は、0～2の整数を示し、

X は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{2-6} ハロアルケニル基、 C_{2-6} ハロアルキニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{3-6} ハロシクロアルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシメチル基、ホルミル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し、

Y は、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基又は C_{1-6} ハロアルキル基を示す。]

反応式 4 に示す反応においては、前記式 (3) で表される 1-ベンジルアルコール誘導体は、前記式 (4) で表されるベンズアルデヒド誘導体と、 $NaBH_4$ 、 $NaBH(OAc)_3$ 又は $NaBH_3CN$ とを不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

[0023] 前記式 (4) の化合物と、 $NaBH_4$ 、 $NaBH(OAc)_3$ 又は $NaBH_3CN$ との反応で使用される溶媒は、該反応に対して不活性な溶媒を広く使用することができる。例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ヘプタン等の脂肪族もしくは脂環式炭化水素系溶媒、ベンゼン、クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、酢酸、ギ酸、プロピオン酸等のカルボン酸溶媒、 N,N -ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、 N -メチルピロリドン、 N,N' -ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性極性溶媒等を挙げることができる。これらの溶媒は、1種を単独で使用でき、又は必要に応じて2種以上を混合して使用することができる。

該反応に用いられる $NaBH_4$ 、 $NaBH(OAc)_3$ 又は $NaBH_3CN$ は、前記式 (3) で表さ

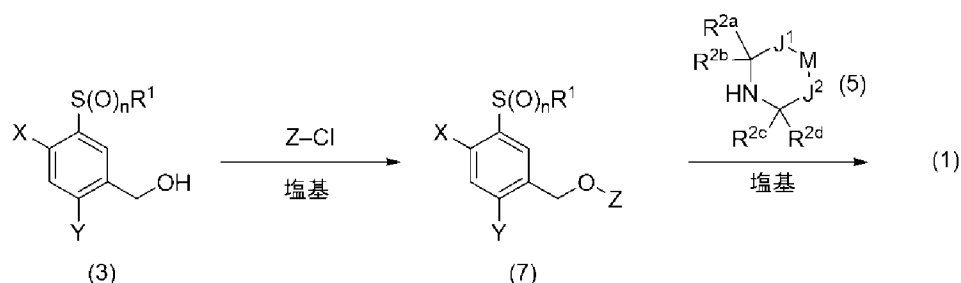
れるベンズアルデヒド化合物に対して、通常1～100当量、好ましくは1～2当量となるような量で使用され得る。

該反応は、通常－78℃から使用する溶媒の沸点温度までの範囲内で行うことができ、室温～100℃で反応を行うのが好ましい。

反応時間は反応温度等により異なり一概には言えないが、通常0.5～24時間程度で該反応は完結する。

上記各反応で得られる目的化合物は、通常行われている単離手段、例えば、有機溶媒抽出法、クロマトグラフィー法、再結晶法、蒸留法等により、反応混合物から容易に単離されることができ、更に通常の精製手段により精製され得る。

[0024] 反応式 5



[式中、X、Y、n、R¹、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、M、J¹及びJ²は、式(1)で定義した通りであり、Zは、メタンスルホニル基又はトリフルオロメタンスルホニル基を示す。]

反応式 5 に示す反応においては、前記式 (7) で表される化合物は、前記式 (3) で表されるベンジルアルコール誘導体と、メタンスルホニルクロリド又はトリフルオロメタンスルホニルクロリドを、トリエチルアミン等の塩基の存在下、ジクロロメタン等の不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

また、前記式 (1) で表されるベンジルアミン誘導体は、前記式 (7) で表される化合物と式 (5) で表されるアミン類とを適切な塩基の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

[0025] 前記式(7)の化合物と、前記式(5)の化合物との反応で使用される溶媒は、該反応に対して不活性な溶媒を広く使用することができる。例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ヘプタン等の脂肪族もしくは脂環式炭化水素系溶媒、ベンゼン、クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、酢酸、ギ酸、プロピオン酸等のカルボン酸溶媒、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性極性溶媒等を挙げることができる。これらの溶媒は、1種を単独で使用でき、又は必要に応じて2種以上を混合して使用することができる。

前記式(7)で表される化合物と前記式(5)で表されるアミン類との反応で使用される塩基としては、例えば、炭酸カリウム、炭酸セシウム、油性水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、トリエチルアミン等が好ましい。

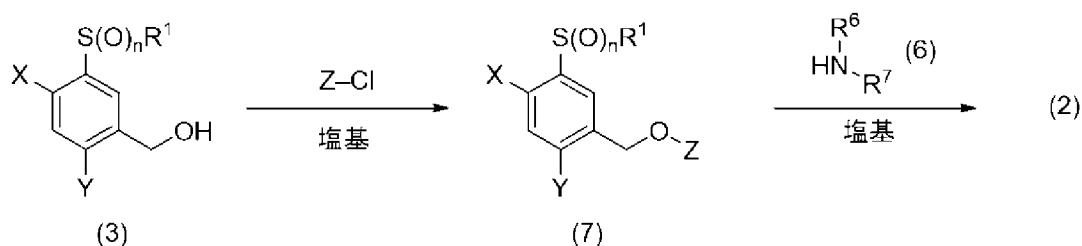
前記式(7)で表される化合物と前記式(5)で表されるアミン類との反応で使用される塩基の使用割合は、式(7)の化合物に対し、塩基を1~2倍モル量使用するのがより好ましい。

該反応は、通常-78℃から使用する溶媒の沸点温度までの範囲内で行うことができ、室温~100℃で反応を行うのが好ましい。

反応時間は反応温度等により異なり一概には言えないが、通常0.5~24時間程度で該反応は完結する。

上記各反応で得られる目的化合物は、通常行われている単離手段、例えば有機溶媒抽出法、クロマトグラフィー法、再結晶法、蒸留法等により、反応混合物から容易に単離されることができ、更に通常の精製手段により精製され得る。

[0026] 反応式 6



[式中、X、Y、n、R¹、R⁶及びR⁷は、式(2)で定義した通りであり、Zは、メタンスルホニル基又はトリフルオロメタンスルホニル基を示す。]

反応式6に示す反応においては、前記式(7)で表される化合物は、前記式(3)で表されるベンジルアルコール誘導体と、メタンスルホニルクロリド又はトリフルオロメタンスルホニルクロリドとを、トリエチルアミン等の塩基の存在下、ジクロロメタン等の不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

また、前記式(2)で表される1-ベンジルアミン誘導体は、前記式(7)で表される化合物と式(6)で表されるアミン類とを適切な塩基の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

[0027] 前記式(7)の化合物と前記式(6)の化合物との反応で使用される溶媒は、該反応に対して不活性な溶媒を広く使用することができる。例えば、ヘキサン、シクロヘキサン、ヘプタン等の脂肪族もしくは脂環式炭化水素系溶媒、ベンゼン、クロロベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、酢酸、ギ酸、プロピオン酸等のカルボン酸溶媒、N、N-ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N、N'-ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性極性溶媒等を挙げることができる。これらの溶媒は、1種を単独で使

用でき、又は必要に応じて2種以上を混合して使用することができる。

前記式(7)で表される化合物と前記式(6)で表されるアミン類との反応で使用される塩基としては、例えば、炭酸カリウム、炭酸セシウム、油性水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム又はトリエチルアミン等が好ましい。

前記式(7)で表される化合物と前記式(6)で表されるアミン類との反応で使用される塩基の使用割合は、式(7)の化合物に対し塩基を1~2倍モル量使用するのがより好ましい。

該反応は、通常-78℃から使用する溶媒の沸点温度までの範囲内で行うことができ、室温~100℃で反応を行うのが好ましい。

反応時間は反応温度等により異なり一概には言えないが、通常0.5~24時間程度で該反応は完結する。

上記各反応で得られる目的化合物は、通常行われている単離手段、例えば、有機溶媒抽出法、クロマトグラフィー法、再結晶法、蒸留法等により、反応混合物から容易に単離されることができ、更に通常の精製手段により精製され得る。

[0028] 前記式(1)及び(2)で表される1-ベンジルアミン誘導体の代表的な化合物を表1~表4に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、表中の物性は性状、融点(℃)を示し、「n-」はノルマルを、「s-」はセカンダリーを、「t-」はターシャリーを、「i-」はイソを示し、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Ph」はフェニル基を示す。

[0029] 一般式(1)

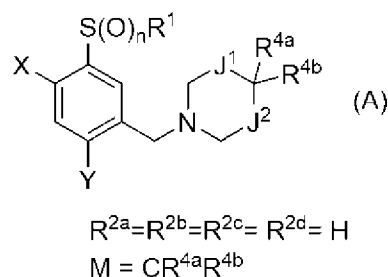


表1

化合物番号	R ¹	X	Y	J ¹	J ²	R ^{4a}	R ^{4b}	n	性状、融点 (°C)
A-1	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	H	H	0	75-78
A-2	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	CF ₃	H	0	oil
A-3	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	CF ₃	H	1	91-92
A-4	n-Pr	Me	F	CH ₂	CH ₂	CF ₃	H	0	oil
A-5	n-Pr	Me	F	CH ₂	CH ₂	CF ₃	H	1	oil
A-6	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂ CH ₂	直接結合	CF ₃	H	1	135-138
A-7	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	F	H	1	81-82
A-8	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	F	F	1	94-95
A-9	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	F	F	0	oil
A-10	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	CN	H	1	115-116
A-11	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	Me	H	1	88-89
A-12	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂ CH ₂	直接結合	Me	H	1	78-91
A-13	-CH ₂ CF ₃	Me	Cl	CH ₂	CH ₂	CF ₃	H	1	115-116
A-14	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	CH ₂	CH ₂	CF ₃	H	1	103-105
A-15	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	CH ₂	CH ₂	Me	H	0	oil
A-16	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	CH ₂	CH ₂	Me	H	1	123-124
A-17	-CH ₂ CF ₃	Me	H	CH ₂	CH ₂	Me	H	1	oil

[0030]

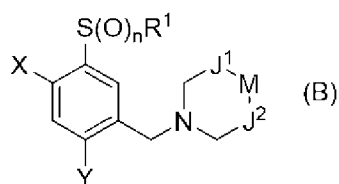


表 2

化合物番号	R ¹	X	Y	J ¹	J ²	M	n	性状、融点 (°C)
B-1	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	-O-	1	106-107
B-2	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	-S-	1	97-98
B-3	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	-SO ₂ -	1	oil
B-4	-CH ₂ CF ₃	Me	H	CH ₂	CH ₂	-SO ₂ -	1	174-175

[0031]

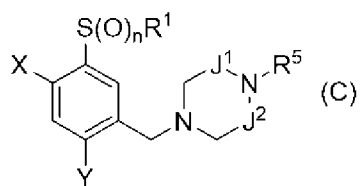


表 3

化合物 番号	R ¹	X	Y	J ¹	J ²	R ⁵	n	性状、融点 (°C)
C-1	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	CH ₂	CH ₂	Me	1	114-115
C-2	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COOC(CH ₃) ₃	1	oil
C-3	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	SO ₂ CF ₃	1	96-97
C-4	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	SO ₂ Me	1	151-153
C-5	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	SO ₂ Et	1	126-129
C-6	-CH ₂ CF ₃	Me	Cl	CH ₂	CH ₂	SO ₂ CF ₃	1	120-122
C-7	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COCF ₃	1	94-96
C-8	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COCF ₂ CF ₃	1	106-107
C-9	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COCF ₂ CF ₂ CF ₃	1	oil
C-10	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COCH ₃	1	oil
C-11	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COCHF ₂	1	oil
C-12	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COCF ₂ Cl	1	oil
C-13	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂	CH ₂	COcycloPr	1	oil
C-14	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	CH ₂	CH ₂	COCF ₂ CF ₂ CF ₃	1	oil
C-15	-CH ₂ CF ₃	Me	Cl	CH ₂	CH ₂	COCF ₂ CF ₂ CF ₃	1	oil
C-16	-CH ₂ CF ₃	Cl	F	CH ₂	CH ₂	COCF ₂ CF ₂ CF ₃	1	oil

[0032] 一般式 (2)

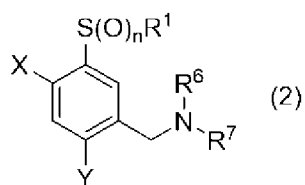


表 4

化合物 番号	R ¹	X	Y	R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	n	性状、融点 (°C)
D-1	-CH ₂ CF ₃	Me	F	Cyclohexyl, H	—	—	4-CF ₃	1	oil
D-2	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂ Ph, H	—	4-CF ₃	—	1	88-89
D-3	-CH ₂ CF ₃	Me	F	CH ₂ Ph, Me	—	4-CF ₃	—	1	oil
D-4	-CH ₂ CF ₃	Me	F	Ph, H	4-CF ₃	—	—	1	122-124

[0033] 前記式（３）で表される1-ベンジルアルコール類の代表的な化合物を表5に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、表中の物性は性状、融点（℃）を示し、「n-」はノルマルを、「Me」はメチル基を、「Pr」はプロピル基を示す。

[0034] 一般式（３）

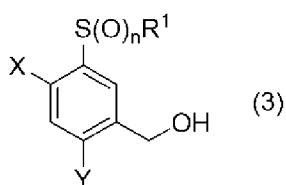


表 5

化合物番号	R ¹	X	Y	n	性状、融点(℃)
E-1	-CH ₂ CF ₃	Me	H	1	67-69
E-2	-CH ₂ CF ₃	Me	F	0	oil
E-3	-CH ₂ CF ₃	Me	F	1	88-91
E-4	n-Pr	Me	F	0	oil
E-5	-CH ₂ CF ₃	Me	Cl	1	114-115
E-6	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	0	69-72
E-7	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	1	120-122

[0035] 前記式（４）で表されるベンズアルデヒド類の代表的な化合物を表6に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、表中の物性は性状、融点（℃）を示し、「n-」はノルマルを、「Me」はメチル基を、「Pr」は、プロピル基を示す。

[0036] 一般式（４）

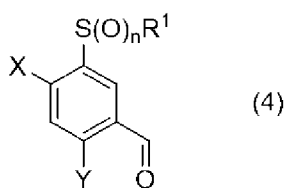


表 6

化合物番号	R 1	X	Y	n	性状、融点(°C)
F-1	-CH ₂ CF ₃	Me	H	1	99-101
F-2	-CH ₂ CF ₃	Me	F	0	oil
F-3	-CH ₂ CF ₃	Me	F	1	94-95
F-4	n-Pr	Me	F	0	43-45
F-5	-CH ₂ CF ₃	Me	Cl	1	134-136
F-6	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	0	41-45
F-7	-CH ₂ CF ₃	Me	Me	1	95-97
F-8	-CH ₂ CF ₃	Me	Cl	0	76-78
F-9	-CH ₂ CF ₃	Cl	F	1	104-105
F-10	-CH ₂ CF ₃	Cl	F	0	45-48

[0037] 本発明の化合物は、農業、屋内もしくは森林において、家畜に対して、又は衛生面などの各種の場面で害を及ぼす生物の予防や駆除に使用され得る。以下に具体的な使用場面、対象害生物、使用方法を示すが、本発明の内容はこれらに限定されるものではない。

本発明の化合物は、農作物、例えば、食用作物（稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦等の麦類、とうもろこし、馬鈴薯、甘藷、里芋、大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、いんげん豆、落花生等の豆類等）、野菜（キャベツ、白菜、大根、蕪、ブロッコリー、カリフラワー、こまつな等のアブラナ科作物、かぼちゃ、きゅうり、すいか、まくわうり、メロン等のうり類、なす、トマト、ピーマン、ペッパー、おくら、ほうれんそう、レタス、れんこん、にんじん、ごぼう、にんにく、たまねぎ、ねぎ等のねぎ類等）、きのこ類（しいたけ、マッシュルーム等）、果樹・果実類（林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、桜桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ、いちご等）、香料等鑑賞用作物（ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、生姜等）、特用作物（たばこ、茶、甜菜、さとうきび、ホップ、綿、麻、オリーブ、ゴム、コーヒー等）、牧草・飼料用作物（チモシー、クローバー、アルファルファ、とうもろこし、ソルガム類、オーチャードグラス、イネ科牧草、豆科牧草等）、芝類（高麗芝、ベントグラス等）、林木（トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧等）や鑑賞用植物（きく、ばら、カーネーション、蘭等の草本・花卉類、いちょう、さくら類、あおき等の庭木等）に損害を与える節

足動物類、軟体動物類、線虫類、ならびに真菌門、変形菌門、細菌門、放線菌門等の真菌類並びに細菌類等の害生物を防除するためにも使用できる。具体的な害生物として、以下のものが挙げられる。

[0038] 節足動物門昆虫綱のチョウ目(Lepidoptera)、例えば、ヤガ科のオオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)、ヘリオチス種(*Heliothis* spp.)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、タマナギンウワバ(*Autographa nigrisigna*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)等、スガ科のコナガ(*Plutella xylostella*)等、ハマキガ科の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*)、ミダレカクモンハマキ(*Archips fuscocupreanus*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)、チャノホソガ(*Caloptilia theivora*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)等、ミノガ科のチャミノガ(*Eumeta minuscula*)等、ハモグリガ科のギンモンハモグリガ(*Lyonetia prunifoliella malinella*)、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)等、コハモグリガ科のミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)等、ホソガ科のキンモンホソガ(*Phyllonorycter ringonella*)等、アトヒゲコガ科のネギコガ(*Acrolepiopsis sapporensis*)等、スカシバガ科のコスカジバ(*Synanthedon hector*)等、ニセマイコガ科のカキノヘタムシガ(*Stathmopoda masinissa*)等、キバガ科のワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)等、シンクイガ科のモモシンクイガ(*Carposina niponensis*)等、ボクトウガ科のボクトウガ(*Cossus jezoensis*)等、ヒロズコガ科のコクガ(*Nemapogon granella*)等、イラガ科のイラガ(*Monema flavecens*)、ヒロヘリアオイラガ(*Parasa lepida*)、ヒメクロイラガ(*Scopelodes conotractus*)等、ツトガ科のニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、ハイマダラノメイガ(*Hellula undalis*)、モモゴマダラメイガ(*Conogethes punctiferlis*)、ワタヘリクロノメイガ(*Diaphania indica*)、シバツトガ(*Parapediasia teterrella*)等、メイガ科のトサカフトメイガ(*Locastra muscosal*

is) 等、

[0039] セセリチョウ科のイチモンジセセリ (*Parnara guttata*) 等、アゲハチョウ科のナミアゲハ(*Papilio xuthus*)等、シロチョウ科のモンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)等、シジミチョウ科のウラナミシジミ (*Lampides boeticus*) 等、シャクガ科のヨモギエダシャク(*Ascotis selenaria*)等、スズメガ科のエビガラスズメ (*Agrius convolvuli*) 等、シャチホコガ科のモンクロシャチホコ (*Phalera flavescens*) 等、カレハガ科のオビカレハ (*Malacosoma neustria testaceum*) 等、ヤママユガ科のクスサン (*Saturnia japonica*) 等、ドクガ科のチャドクガ (*Euproctis pseudoconsersa*) ヒメシロモンドクガ (*Orgyia thyellina*)、アカモンドクガ (*Telochurus recens approximans*) 等、ヒトリガ科のクワゴマダラヒトリ (*Spilosoma imparilis*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)等、グレイプベリーモス(*Endopiza viteana*)、コドリंगा(*Laspeyresia pomonella*)等の成虫、幼虫及び卵；

[0040] コウチュウ目(Coleoptera)、例えば、コガネムシ科のドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、コアオハナムグリ (*Oxycetonia jucunda*)、サクラコガネ (*Anomala geniculata*) 等、タマムシ科のミカンナガタマムシ (*Agrilus auriventris*) 等、コメツキムシ科のマルクビクシコメツキ (*Melanotus fortnumi*) 等、テントウムシ科のニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintioctopunctata*)等、カミキリムシ科のゴマダラカミキリ(*Anoplophora malasiaca*)、ブドウトラカミキリ (*Xylotrechus pyrrhoderus*) 等、ハムシ科のウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、ルートワーム種 (*Diabrotica* spp.)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、カメノコハムシ (*Cassida nebulosa*)、ダイコンハムシ (*Phaedon brassicae*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、メキシカンビートル (*Epilachna varivestis*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)等、オトシブミ科のモモチョッキリゾウムシ (*Rhynchites heros*) 等、ミツギリゾウムシ科のアリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*) 等、ゾウムシ科のクリシギゾウムシ (*Curculio sikkimensis*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ワタ

ミゾウムシ(*Anthonomus grandis grandis*)、シバオサゾウムシ(*Sphenophrus venatus vestitus*)等、ケシキスイ科のヒメヒラタケシキスイ (*Epuraea domina*) 等の成虫、幼虫及び卵；

[0041] カメムシ目(Hemiptera)の異翅類(Heteroptera)、例えば、カメムシ科のナガメ (*Eurydema rugosum*)、オオトゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris lewisi*)、トゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris parvus*)、ミナミアオカメムシ(*Nezara viridula*)、チャバネアオカメムシ(*Plautia stali*)、クサギカメムシ (*Halymorpha mista*) 等、クヌギカメムシ科のナシカメムシ (*Urochela luteovoria*) 等、ナガカメムシ科のコバネヒョウタンナガカメムシ(*Togo hemipterus*)等、ヘリカメムシ科のホソヘリカメムシ(*Riptortus clavatus*)、ホソハリカメムシ(*Cletus punctiger*)等、ホソヘリカメムシ科のクモヘリカメムシ(*Leptocoris chinensis*)等、ホシカメムシ科のアカホシカメムシ (*Dysdeercus cingulatus*) 等、グンバイムシ科のナシグンバイ(*Stephanitis nashi*)、ツツジグンバイ(*Stephanitis pyrioides*)等、カスミカメムシ科のウスミドリカスミカメ (*Apolygus spinolai*)、アカスジカスミカメ(*Stenotus rubrovittatus*)、アカヒゲホソミドリカスミカメ(*Trigonotylus coelestialium*)等、マメカメムシ科のマルカメムシ(*Megacopta punctatissima*) 等の成虫、幼虫及び卵；

[0042] カメムシ目(Hemiptera)の同翅類(Homoptera)、例えば、セミ科のニイニイゼミ (*Platypleura kaempferi*) 等、ヨコバイ科のフタテンヒメヨコバイ(*Arboridia apicalis*)、チャノミドリヒメヨコバイ(*Empoasca onukii*)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、タイワンツマグロヨコバイ(*Nephotettix virescens*)等、ウンカ科のヒメトビウンカ(*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)等、アオバハゴロモ科のアオバハゴロモ (*Geisha distinctissima*) 等、キジラミ科のナシキジラミ (*Psylla pyrisuga*)、ミカンキジラミ(*Diaphorina citri*) 等、コナジラミ科のミカントゲコナジラミ(*Aleurocanthus spiniferus*)、シルバーリーフコナジラミ(*Bemisia argentifolii*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)の各種バイオタイプ、ミカンコナジラミ(*Dialeurodes citri*)、オ

ンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)等、フィロキセラ科のブドウ
ネアブラムシ(*Viteus vitifolii*)等、

[0043] アブラムシ科のユキヤナギアブラムシ(*Aphis citricola*)、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、ジャガイモヒゲナガ
アブラムシ(*Aulacorthum solani*)、ダイコンアブラムシ(*Brevicoryne brassicae*)、コミカンアブラムシ(*Toxoptera aurantii*)、ミカンクロアブラムシ
(*Toxoptera citricidus*)、ニワトコヒゲナガアブラムシ(*Aulacorthum magnoliae*)、ナシアブラムシ(*Schizaphis piricola*)、ナシミドリオオアブラ
ムシ(*Nippolachnus piri*)、ニセダイコンアブラムシ(*Lipaphis erysimi*)
、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus pruni*)、キククギケアブラムシ(*Pleotrichophorus chrysanthemi*)、キクヒメヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphoniella sanborni*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ(*Megoura crassicauda*)
、イバラヒゲナガアブラムシ(*Sitobion ibarae*)、チューリップヒゲナガア
ブラムシ(*Macrosiphum euphorbiae*)、カワリコブアブラムシ(*Myzus varians*)
、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、オカボノアカアブラムシ(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、ムギクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum padi*)、ム
ギヒゲナガアブラムシ(*Sitobion akebiae*)、リンゴワタムシ(*Eriosoma lanigerum*)等、ワタフキカイガラムシ科のイセリアカイガラムシ(*Icerya purchasi*)等、コナカイガラムシ科のクワコナカイガラムシ(*Pseudococcus comstocki*)、ミカンコナカイガラムシ(*Phenacoccus viburnae*)、フジコナカイガラ
ム(*Phenacoccus kraunhiae*)等、カタカイガラムシ科のツノロウムシ(*Ceroplastes ceriferus*)、ルビーロウムシ(*Ceroplastes rubens*)等、マルカイガ
ラムシ科のアカマルカイガラムシ(*Aonidiella aurantii*)、ナシマルカイガラ
ムシ(*Comstockaspis perniciosus*)、クワシロカイガラムシ(*Pseudaulacaspis pentagona*)、ヤノネカイガラムシ(*Unaspis yanonensis*)等の成虫、幼虫及び
卵；

[0044] アザミウマ目(*Thysanoptera*)、例えば、アザミウマ科のチャノキイロアザミ
ウマ(*Scirtothrips dorsalis*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)、ネ

ギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ダイズウスイロアザミウマ(*Thrips setosus*)、ヒラズハナアザミウマ(*Frankliniella intonsa*)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)、クロトンアザミウマ(*Heliothrips haemorrhoidalis*)、等、クダアザミウマ科のカキクダアザミウマ(*Ponticulothrips diospyrosi*)、イネクダアザミウマ(*Haplothrips aculeatus*)等の成虫、幼虫及び卵；

[0045] ハチ目 (Hymenoptera)、例えば、ハバチ科のカブラハバチ(*Athalia rosae ruficornis*)、チュウレンジハバチ(*Arge pagana*)等、ミフシハバチ科のリンゴハバチ(*Arge mali*)等、タマバチ科のクリタマバチ(*Dryocsmus kuriphilus*)等、ハキリバチ科のバラハキリバチ(*Megachile nipponica nipponica*)等、アリ科のクロヤマアリ(*Formica japonica*)、ミカドオオアリ(*Camponotus kiusiuensis*)、クロクサアリ(*Lasius fuliginosus*)、ファイヤーアント(*Solenopsis richteri*、*S. invicta*、*S. geminata*)等の成虫、幼虫及び卵；ハエ目 (Diptera)、例えば、タマバエ科のダイズサヤタマバエ(*Asphondylia yushimai*)等、ミバエ科のオウトウハマダラミバエ(*Rhacochlaena japonica*)、ウリミバエ(*Bactrocera cucurbitae*)等、ミギワバエ科のイネミギワバエ(*Hydrellia griseola*)等、ショウジョウバエ科のオウトウショウジョウバエ(*Drosophila suzukii*)等、ハモグリバエ科のマメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ナモグリバエ(*Chromatomyia horticola*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、ナスハモグリバエ(*Liriomyza bryoniae*)等、ハナバエ科のタネバエ(*Delia platura*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)等の成虫、幼虫及び卵；

[0046] バッタ目 (Orthoptera)、例えば、バッタ科のトノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、キリギリス科のクサキリ(*Ruspolia lineosa*)等、コオロギ科のエンマコオロギ(*Teleogryllus emma*)、アオマツムシ(*Truljalia hibinonis*)等、ケラ科のケラ(*Gryllotalpa orientalis*)等、バッタ科のコバネイナゴ(*Oxya yezoensis*)等の成虫、幼虫及び卵；

シロアリ目 (Isoptera)、例えば、シロアリ科のタイワンシロアリ (*Odontot*

ermes formosanus) 等の成虫、幼虫及び卵；

ハサミムシ目 (Dermaptera)、例えば、オオハサミムシ科のオオハサミムシ (*Labidura riparia*) 等の成虫、幼虫及び卵；

[0047] 節足動物門側昆虫綱のトビムシ目 (Collembola)、例えば、マルトビムシ科のキマルトビムシ (*Sminthurus viridis*) 等、シロトビムシ科のマツモトシロトビムシ (*Onychiurus matsumotoi*) 等の成虫、幼虫及び卵；節足動物門軟甲綱の等脚目 (Isopoda)、例えば、ダンゴムシ科のオカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*) 等の成虫、幼虫及び卵；

節足動物門クモ綱のダニ目 (Acarı)、例えば、ホコリダニ科のチャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)、シクラメンホコリダニ (*Phytonemus pallidus*) 等、ハシリダニ科のムギダニ (*Penthaleus major*) 等、ヒメハダニ科のブドウヒメハダニ (*Brevipalpus lewisi*)、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*) 等、ハダニ科のミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、オウトウハダニ (*Amphitetranynchus viennensis*)、トトマツノハダニ (*Oligonychus ununguis*)、キクビラハダニ (*Bryobia eharaı*)、ミヤケアケハダニ (*Eotetranychus kankitus*)、クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*) 等、フシダニ科のリンゴサビダニ (*Aculus Schlechtendali*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、リュウキュウミカンサビダニ (*Phyllocoptruta citri*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、チューリップサビダニ (*Aceria tulipae*)、ブドウハモグリダニ (*Colomerus vitis*)、モモサビダニ (*Aculus fockeui*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*) 等、コナダニ科のケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ロビンネダニ (*Rhizoglyphus robini*) 等の成虫、幼虫及び卵；

[0048] 軟体動物門腹足綱の原始紐舌目 (Architaenioglossa)、例えば、タニシモドキ科のスクミリンゴガイ (*Pomacea canaliculata*) 等、有肺目 (Plumonata)、例えば、アフリカマイマイ科のアフリカマイマイ (*Achatina fulica*)、ナメクジ科のナメクジ (*Meghimatium bilineatum*)、ニワコウラナメクジ科の

ニワコウラナメクジ (*Milax gagates*)、コウラナメクジ科のチャコウラナメクジ (*Lehmannina valentiana*)、オナジマイマイ科のウスカワマイマイ (*Acusta despecta sieboldiana*) 等；

線形動物門幻器綱のティレンクス目 (*Tylenchida*)、例えば、アングイナ科のイモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*) 等、ティレンコリンクス科のナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*) 等、プラティレンクス科のキタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*) 等、ホプロライムス科のナミラセンチュウ (*Helicotylenchus dihystera*) 等、ヘテロデラ科のジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 等、メロイドギネ科のサツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 等、クリコネマ科のワセンチュウ (*Criconeema jaejuense*) 等、アングイナ科のイチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*) 等、アフエレンコイデス科のイチゴセンチュウ (*Aphellecthoides fragariae*) 等；尾腺綱のドリライムス目、例えば、ロンギドルス科のオオハリセンチュウ (*Xiphinema* sp.)、トリコドルス科のユミハリセンチュウ (*Trichodorus* sp.) 等；

真菌門 (*Eumycota*)、変形菌門 (*Myxomycota*)、細菌門 (*Bacteriomycota*)、放線菌門 (*Actinomycota*) 等の真菌類ならびに細菌類。

[0049] 本発明の化合物を適用し得る病害としては、具体的には、稲のいもち病 (*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、内穎褐変病 (*Pantoea ananatis*)、褐条病 (*Acidovorax avenae* subsp. *avenae*)、葉鞘褐変病 (*Pseudomonas fuscovaginae*)、白葉枯病 (*Xanthomonas oryzae* pv. *oryzae*)、立枯細菌病 (*Burkholderia plantarii*) 等；麦類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*)、赤かび病 (*Gibberella zeae*)、赤さび病 (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪腐病 (*Typhula* sp., *Micronectriella nivalis*)、裸黒穂病 (*Ustilago tritici*, *U. nuda*)、なまぐさ黒穂病 (*Tilletia caries*)、眼紋病 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病 (*Sept*

oria tritici)、ふ枯病(*Leptosphaeria nodorum*)、網斑病(*Pyrenophora teres*)、ひょうもん病(*Helminthosporium zonatum* Ikata)、黒節病 (*Pseudomonas syringae* pv. *japonica*) 等 ; かんきつ類の黒点病(*Diaporthe citri*)、そうか病(*Elsinoe fawcetti*)、果実腐敗病(*Penicillium digitatum*, *P. italicum*)、褐色腐敗病(*Phytophthora citrophthora*, *P. nicotianae*)、黒星病(*Phyllosticta citricarpa*)等 ; りんごのモニリア病(*Monilinia mali*)、腐らん病(*Valsa mali*)、うどんこ病(*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病(*Alternaria mali*)、黒星病(*Venturia inaequalis*)、黒点病(*Mycosphaerella pomi*)、炭そ病(*Colletotrichum acutatum*)、輪紋病(*Botryosphaeria berengeriana*)、赤星病(*Gymnosporangium yamadae*)、灰星病(*Monilinia fructicola*)等 ;

[0050] なしの黒星病(*Venturia nashicola*, *V. pirina*)、黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、赤星病(*Gymnosporangium haraeaeum*)、灰星病(*Monilinia fructigena*)等 ; ももの灰星病(*Monilinia fructicola*)、黒星病(*Cladosporium carpophilum*)、フォモプシス腐敗病(*Phomopsis* sp.)穿孔細菌病 (*Brenneria nigrifluens*) 等 ; ぶどうの黒とう病(*Elsinoe ampelina*)、晩腐病(*Colletotrichum acutatum*)、うどんこ病(*Uncinula necator*)、さび病(*Phakopsora ampelopsidis*)、ブラックロット病(*Guignardia bidwellii*)、べと病(*Plasmopara viticola*)、灰星病(*Monilinia fructigena*)、黒星病(*Cladosporium viticolum*)、灰色かび病(*Botrytis cinerea*)、根頭がんしゅ細菌病 (*Agrobacterium vitis*) 等 ; かきの炭そ病(*Gloeosporium kaki*)、落葉病(*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*)等 ; うり類の炭そ病(*Colletotrichum lagenarium*)、うどんこ病(*Sphaerotheca fuliginea*, *Oidiopsis taurica*)、つる枯病(*Didymella bryoniae*)、つる割病(*Fusarium oxysporum*)、べと病(*Pseudoperonospora cubensis*)、疫病(*Phytophthora* sp.)、苗立枯病(*Pythium* sp.)等 ; きゅうりの斑点細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *lochrymans*)、縁枯細菌病 (*Pseudomonas viridiflava*)、褐斑細菌病 (*Xanthomonas campestris* pv. *cucurbitae*) 等 ; メロンの褐斑細菌病 (*Xanthomonas campestris* pv. *cucurbitae*)、毛根病 (*Agrobacterium rhizogens*)、がんしゅ病 (*Streptomyces* sp.) 等 ; すい

かの果実汚斑細菌病 (*Acidovorax avenae* pv. *citrulli*) 等 ;

[0051] なす科野菜の青枯病 (*Ralstonia solanacearum*) 等 ; トマトの輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉かび病 (*Cladosporium fulvum*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、かいよう病 (*Clavibacter michiganense* subsp. *michiganense*)、茎えそ病 (*Pseudomonas corrugata*)、軟腐病 (*Pectobacterium carotovorum* subsp. *carotovorum*) 等 ; なすの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*) 等 ; アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cercospora brassicae*) 軟腐病 (*Pectobacterium carotovorum* subsp. *carotovorum*) 等 ; きゃべつの腐敗病 (*Pseudomonas syringae* pv. *marginalis*)、黒腐病 (*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*) 等 ; レタスの腐敗病 (*Pseudomonas cichorii*、*Pseudomonas viridiflava*)、斑点細菌病 (*Xanthomonas campestris* pv. *vitians*) ネギのさび病 (*Puccinia allii*) 等 ; ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒点病 (*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*) 等 ; いんげんまめの炭そ病 (*Colletotrichum lindemthianum*) 等 ; らっかせいの黒渋病 (*Cercospora personata*)、褐斑病 (*Cercospora arachidicola*) 等 ; えんどうまめのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*) 等 ; ばれいしょの夏疫病 (*Alternaria solani*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、葉腐病菌 (*Rhizoctonia solani*) 等 ; いちごのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*) 等 ; 茶の網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)、赤焼病 (*Pseudomonas syringae* pv. *theae*)、かいよう病 (*Xanthomonas campestris* pv. *theicola*) 等 ;

[0052] たばこの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、べと病 (*Peronospora tabacina*)、疫病 (*Phytophthora nicotianae*)、立枯病 (*Ralstonia solanacearum*)、空洞病 (*Pectobacterium carotovorum* subsp. *carotovorum*) 等 ; てんさいの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、苗立枯れ病 (*Aphanomyces cochliodes*) 等 ; ばらの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*) 等 ; きくの褐斑病 (*Septoria chrysanthemi-indici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、根

頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*) 等 ; なす、きゅうり及びレタス等の各種作物の灰色かび病(*Botrytis cinerea*)、菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) ; 芝類の雪腐病 (*Pythium iwayamai*, *Typhula incarnate*, *Fusarium nivale*, *Sclerotinia borealis*)、うどんこ病 (*Erysiphe graminis*)、フアリーリング病 (*Lycoperdon perlatum*, *Lepista subnudo*, *Marasmius oreades*)、擬似葉腐病 (*Ceratobasidium* spp.)、立枯病 (*Gaeumannomyces graminis*)、カーブラリア葉枯病 (*Curvularia geniculata*)、葉腐病 (*Rhizoctonia solani*)、ピシウム病 (*Pythium periplocum*, *Pythium vanterpoolii*)、さび病 (*Puccinia* spp.)、ダラースポット病 (*Sclerotinia homoeocarpa*) 等 ; ベントグラスの赤焼病 (*Pythium aphanidermatum*)、炭そ病 (*Colletotrichum* sp.) が挙げられる。

[0053] 本発明の化合物は、一般家屋を含む建築物の屋内で活動し、木材とその加工品である木製家具類、貯蔵食品、衣類、書籍等を加害あるは腐敗し、われわれの生活に損害を与える節足動物類や菌類を防除するためにも使用できる。具体的な害生物として、以下のものが挙げられる。

[0054] 節足動物門昆虫綱のシロアリ目、例えば、ミゾガシラシロアリ科のイエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、その他のレチクリテルメス属のシロアリ (*Reticulitermes hesperus*, *R. tibialis*, *R. flavipes*, *R. lucifugus*, *R. santonensis*等)、アメリカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、シロアリ科のタイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*)、オオシロアリ科の *Hodotermopsis jzponica*、レイビシロアリ科のダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*) の成虫、幼虫及び卵 ;

コウチュウ目、例えば、オサゾウムシ科のコクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ココクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*) 等、マメゾウムシ科のアズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、エンドウゾウムシ (*Bruchus pisorum*)、ソラマメゾウムシ (*Bruchus rufimanus*) 等、ゴミムシダマシ科のコクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、ヒラタコクヌストモドキ (*Tribolium con*

fusum)等、ホソヒラタムシ科のノコギリヒラタムシ (*Oryzaephilus surinamensis*)、カクムネチビヒラタムシ (*Cryptolestes pusillus*) 等、シバンムシ科のタバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ジンサンシバンムシ (*Stegobium paniceum*) 等、カツオブシムシ科のヒメカツオブシムシ (*Attagenus unicolor japonicus*)、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、ヒョウホンムシ科のニセセマルヒョウホンムシ (*Gibbium aequinoctiale*) 等、ナガシנקイムシ科のチビタケナガシנקイムシ (*Dinoderus minutus*)、コナナガシנקイムシ (*Rhizopertha dominica*) 等、ヒラタキクイムシ科のヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)等の成虫、幼虫及び卵；

[0055] チョウ目、例えば、メイガ科のスジマダラメイガ (*Cadra cautella*)、スジコナマダラメイガ (*Ephestia kuehniella*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*) 等、キバガ科のバクガ (*Sitotroga cerealella*) 等、ヒロズコガ科のイガ (*Tinea translucens*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 等の成虫、幼虫及び卵；チャタテムシ目、例えば、コチャタテ科のツヤコチャタテ (*Lepinotus reticulatus*) 等、コナチャタテ科のヒラタチャタテ (*Liposcelis bostrychophilus*)等の成虫、幼虫及び卵；

ゴキブリ目、例えば、チャバネゴキブリ科のチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)等、ゴキブリ科のクロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*) 等の成虫、幼虫及び卵；ハチ目、例えば、アリ科のイエヒメアリ (*Monomorium pharaoni*)、ヒメアリ (*Monomorium nipponense*) 等の成虫、幼虫及び卵；

[0056] シミ目、例えば、シミ科のヤマトシミ (*Ctenolepisma villosa*)、セイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) 等の成虫、幼虫及び卵；

ハエ目、例えば、ショウジョウバエ科のキロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*) 等、チーズバエ科のチーズバエ (*Piophilidae casei*) 等の成虫、幼虫及び卵；

節足動物門クモ綱のダニ目、例えば、コナダニ科のケナガコナダニ (*Tyrophagus*

us putrescentiae)、コウノホシカダニ (*Lardoglyphus konoi*) 等、サトウダニ科のサトウダニ (*Carpoglyphus lactis*) 等の成虫、幼虫及び卵；

菌類の木材腐朽菌類である *Tyromyces palustris*、*Coriolus versicolor* 等；

資材の劣化微生物類である *Aspergillus niger*、*Aspergillus terreus*、*Aureo basidium pullulans*、*Chaetomium globosum*、*Cladosporium cladosporioides*、*Eurotium tonophilus*、*Fusarium moniliforme*、*Gliocladium virens*、*Myrothecium verrucaria*、*Penicillium citrinum*、*Penicillium funiculosum*、*Rhizopus oryzae* 等。

[0057] 本発明の化合物は、天然林、人工林ならびに都市緑地の樹木を加害するあるいは樹勢を弱らせる害生物を防除するためにも使用できる。具体的な害生物として、以下のものが挙げられる。

[0058] 節足動物門昆虫綱のチョウ目、例えば、ドクガ科のスギドクガ (*Calliteara argentata*)、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*)、ヒメシロモンドクガ (*Orygia recens approximans*)、ドクガ (*Euproctis subflava*)、マイマイガ (*Lymantria dispar*) 等、カレハガ科のオビカレハ (*Malacosoma neustria testacea*)、マツカレハ (*Dendrolimus spectabilis*)、ツガカレハ (*Dendrolimus superans*) 等、メイガ科のカラマツマダラメイガ (*Cryptoblabes loxiella*) 等、ヤガ科のカブラヤガ (*Agrotis segetum*) 等、ハマキガ科のカラマツイトヒキハマキ (*Ptycholoma lecheana circumclusana*)、クリミガ (*Cydia kurokoi*)、スギカサガ (*Cydia cryptomeriae*) 等、ヒトリガ科のクワゴマダラヒトリ (*Spilosoma imparilis*)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等、モグリチビガ科のシイモグリチビガ (*Stigmella castanopsiella*) 等、イラガ科のヒロヘリアオイラガ (*Parasa lepida*)、ヒメクロイラガ (*Scopelodes contracus*)、テングイラガ (*Microleon longipalpis*) 等の成虫、幼虫及び卵；コウチュウ目、例えば、コガネムシ科のヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*) 等、タマムシ科のケヤキナガタマムシ (*Agrilus spinipennis*) 等、カミキリムシ科のマツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*) 等、ハムシ科のスギハムシ (*Basilepta pall*

idula) 等、ゾウムシ科のサビヒョウタンゾウムシ (*Scepticus griseus*)、マツノシラホシゾウムシ (*Shirahoshizo insidiosus*) 等、オサゾウムシ科のオオゾウムシ (*Sipalinus gigas*) 等、キクイムシ科のマツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、イタヤノキクイムシ (*Indocryphalus aceris*) 等、ナガシंकイムシ科のコナナガシंकイムシ (*Rhizopertha dominica*) 等の成虫、幼虫及び卵；

[0059] カメムシ目、例えば、アブラムシ科のトドマツオオアブラムシ (*Cinara todo cola*) 等、カサアブラムシ科のエゾマツカサアブラ (*Adelges japonicus*) 等、マルカイガラムシ科のスギマルカイガラムシ (*Aspidiotus cryptomeriae*) 等、カタカイガラムシ科のツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*) 等の成虫、幼虫及び卵；

ハチ目、例えば、ハバチ科のカラマツアカハバチ (*Pachynematus itoi*) 等、マツハバチ科のマツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) 等、タマバチ科のクリタマバチ (*Dryocosmus kuriohilus*) 等の成虫、幼虫及び卵；ハエ目、例えば、ガガンボ科のキリウジガガンボ (*Tipula aino*) 等、ハナバエ科のカラマツタネバエ (*Strobilomyia laricicola*) 等、タマバエ科のスギタマバエ (*Contarinia inouyei*)、マツシントメタマバエ (*Contarinia matsusintome*) 等の成虫、幼虫及び卵；

節足動物門クモ綱のダニ目、例えば、スギノハダニ (*Oligonichus hondoensis*)、トドマツノハダニ (*Oligonichus ununguis*) 等の成虫、幼虫及び卵；

線形動物門幻器綱ティレンクス目、例えば、パラシタフェレンクス科のマツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 等。

[0060] 本発明の化合物は、脊椎動物、特に温血脊椎動物である牛、羊、山羊、馬、豚、家禽、犬、猫、魚等の家畜やペットに内的にあるいは外的に寄生する節足動物類、線虫類、吸虫類、条虫類、原生動物類の予防・治療あるいは防除するためにも使用できる。また、対象とする動物種として上記の他、マウス、ラット、ハムスター、リス等の齧歯類、フェレット等の食肉目、アヒル、ハト等のトリ類のペットや実験動物等も含まれる。具体的な害生物として

、以下のものが挙げられる。

- [0061] 節足動物門昆虫綱のハエ目、例えば、アブ科のヤマトアブ (*Tabanus rufidens*)、アカウシアブ (*Tabanus chrysurus*) 等、イエバエ科のクロイエバエ (*Musca bezzii*)、イエバエ (*Musca domestica*)、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*) 等、ウマバエ科のウマバエ (*Gasterophilus intestinalis*) 等、ウシバエ科のウシバエ (*Hypoderma bovis*) 等、ヒツジバエ科のヒツジバエ (*Oestrus ovis*) 等、クロバエ科のクロバエ (*Aldrichina grahami*) 等、ノミバエ科のオオキモンノミバエ (*Megaselia spiracularis*) 等、ツヤホソバエ科のヒトテンツヤホソバエ (*Sepsis punctum*) 等、チョウバエ科のオオチョウバエ (*Telmatoscopus albipunctatus*)、ホシチョウバエ (*Psychoda alternata*) 等、カ科のチカイエカ (*Culex pipiens molestus*)、アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、コガタアカイエカ (*Culex pipiens triaeniorhynchus summosus*)、ヒトスジシマカ (*Ades albopictus*) 等、ブユ科のツメトゲブユ (*Simulium iwataense*)、キアシオオブユ (*Prosimulium yezoense*) 等、ヌカカ科のウシヌカカ (*Culicoides schulzei*)、ニワトリヌカカ (*Culicoides arakawae*) 等の成虫、幼虫及び卵；
- ノミ目、例えば、ヒトノミ科のネコノミ (*Pulex irritans*)、イヌノミ等 (*Ctenocephalides canis*) の成虫、幼虫及び卵；
- [0062] シラミ目、例えば、カイジュウジラミ科のブタジラミ (*Haematopinidae suis*)、ウシジラミ (*Haematopinidae eurytarnus*) 等、ケモノハジラミ科のウマハジラミ (*Damalinia bovis*) 等、ケモノホソジラミ科のウシホソジラミ (*Linognathus vituli*) 等、タンカクハジラミ科のニワトリハジラミ (*Menopon gallinae*) 等の成虫、幼虫及び卵；
- 節足動物門クモ綱のダニ目、例えば、ヘギイタダニ科のミツバチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*)、マダニ科のフタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*) 等、オオサシダニ科のトリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*) 等、ワクモ科のワクモ

(*Dermanyssus gallinae*) 等、ニキビダニ科のブタニキビダニ (*Demodex phylloides*) 等、

[0063] ヒゼンダニ科のウシセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei bovis*)、トリアシヒゼンダニ (*Knemidocoptes mutans*) 等、キュウセンダニ科のミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ウシキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes communis*) 等の成虫、幼虫及び卵；

線形動物門双線綱の円虫目、例えば、牛鉤虫、豚腎虫、豚肺虫、毛様線虫、牛腸結節虫等；

回虫目例えば、豚回虫、鶏回虫等；

扁形動物門吸虫綱、例えば、日本住血吸虫、肝テツ、鹿双口吸虫、ウエステルマン肺吸虫、日本鶏卵吸虫等；

条虫綱、例えば、葉状条虫、拡張条虫、ベネデン条虫、方形条虫、刺溝条虫、有輪条虫等；

原生動物門鞭毛虫綱の根鞭毛虫目、例えば、*Histomonas*等、原鞭毛虫目、例えば、*Leishmania*、*Trypanosoma*等、多鞭毛虫目、例えば、*Giardia*等トリコモナス目、例えば、*Trichomonas*等；

肉質綱のアメーバ目、例えば、*Entamoeba*等；

孢子虫綱のピロプラズマ亜綱、例えば、*Theilaria*、*Babesia*等、晩生孢子虫亜綱、例えば、*Eimeria*、*Plasmodium*、*Toxoplasma*等。

[0064] 本発明の化合物は、人体に直接の危害あるいは不快感を与える害生物を駆除するため、あるいは病原体の運搬や媒介をする害生物に対する公衆衛生状態を維持するためにも使用できる。具体的な害生物として、以下のものが挙げられる。

[0065] 節足動物門昆虫綱のチョウ目、例えば、ドクガ科のモンシロドクガ (*Sphragidus similis*) 等、カレハガ科のクヌギカレハ (*Kunugia undans*) 等、イラガ科のアオイラガ (*Parasa consocia*) 等、マダラガ科のタケノホソクロバ (*Artana martini*) 等の成虫、幼虫及び卵；

コウチュウ目、例えば、カミキリモドキ科のアオカミキリモドキ (*Xanthochr*

oa waterhousei) 等、ツチハンミョウ科のマメハンミョウ (*Epicauta gorhami*) 等、ハネカクシ科のアオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) 等の成虫、幼虫及び卵；

ハチ目、例えば、スズメバチ科のキロスズメバチ (*Vespa simillima xanthoptera*) 等、アリ科のオオハリアリ (*Brachyponera chinensis*) 等、ベッコウバチ科のキオビベッコウ (*Batozonellus annulatus*) 等の成虫、幼虫及び卵；

ハエ目、例えば、カ科のオオクロヤブカ (*Armigeres subalbatus*) 等、ヌカカ科のニッポンヌカカ (*Culicoides nipponensis*) 等、ユスリカ科のセスジユスリカ (*Chironomus yoshimatsui*) 等、ブユ科のオオアシマダラブユ (*Simulium nikkoense*) 等、アブ科のアオコアブ (*Hirosia humilis*) 等、イエバエ科のイエバエ (*Musca domestica*) 等、ヒメバエ科のヒメイエバエ (*Fannia canicularis*) 等、クロバエ科のクロキンバエ (*Phormia regina*) 等、ニクバエ科のセンチクバエ (*Sarcophaga peregrina*) 等の成虫、幼虫及び卵；

[0066] ノミ目、例えば、ヒトノミ科のヒトノミ (*Pulex irritans*) 等の成虫、幼虫及び卵；

ゴキブリ目、例えば、チャバネゴキブリ科のチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 等、ゴキブリ科のワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*) 等の成虫、幼虫及び卵；

バッタ目 (Orthoptera)、例えば、コロギス科のマダラカマドウマ (*Diestrammena japonica*)、カマドウマ (*Diestrammena apicalis*) 等の成虫、幼虫及び卵；

シラミ目、例えば、ヒトジラミ科のアタマジラミ (*Pediculus humanus humanus*) 等、ケジラミ科のケジラミ (*Phthirus pubis*) 等の成虫、幼虫及び卵；

カメムシ目、例えば、トコジラミ科のトコジラミ (*Cimex lectularius*) 等、サシガメ科のオオトビサシガメ (*Isyndus obscurus*) の成虫、幼虫及び卵；

[0067] 節足動物門側昆虫綱のトビムシ目 (Collembola)、例えば、ムラサキトビム

シ科のムラサキトビムシ (*Hypogastrura communis*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;
節足動物門クモ綱のダニ目、例えば、マダニ科のシュルツェマダニ (*Ixodes persulcatus*) 等、オオサシダニ科のイエダニ (*Ornithonyssus bacoti*) 等、ツメダニ科のミナミツメダニ (*Chelacaropsis moorei*) 等、シラミダニ科のシラミダニ (*Pyemotes ventricosus*) 等、ニキビダニ科のニキビダニ (*Demodex folliculorum*) 等、チリダニ科のヤケヒョウヒダニ (*Dermatophagoides pteronyssinus*) 等、ヒゼンダニ科のヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*) 等、ツツガムシ科のアカツツガムシ (*Trombicula akamushi*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;

真正クモ目、例えば、フクログモ科のカバキコマチグモ (*Chiracanthium japonicum*) 等、アシダカグモ科のアシダカグモ (*Heteropoda venatoria*) 等、ユウレイグモ科のシモングモ (*Spermophora senoculata*)、イエユウレイグモ (*Pholcus phalangioides*) 等、ヒラタグモ科のヒラタグモ (*Uroctea compactilis*) 等、ハエトリグモ科のチャスジハエトリ (*Plexippus paykulli*)、ミスジハエトリ (*Plexippus adansonii*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;

[0068] サソリ目、例えば、キョクトウサソリ科のマダラサソリ (*Isometrus europaeus*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;

節足動物門唇脚綱のオオムカデ目、例えば、オオムカデ科のトビズムカデ (*Scolopendra subspinipes mutilans*)、アオズムカデ (*Scolopendra subspinipes japonica*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;

ゲジ目、例えば、ゲジ科のゲジ (*Thereuronema hilgendorfi*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;

節足動物門倍脚綱のオビヤスデ目、例えば、ヤケヤスデ科のヤケヤスデ (*Oxidus gracilis*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;

節足動物門甲殻綱の等脚目、例えば、ワラジムシ科のワラジムシ (*Porcellio scaber*) 等の成虫、幼虫及び卵 ;

環形動物門蛭綱の顎蛭目、例えば、ヤマビル科のヤマビル (*Haemadipsa zeylanica japonica*) 等 ;

白癬菌類である*Trichophyton rubrum*、*Trichophyton mentagrophytes*等、カンジタ菌類である*Candida albicans*等、アスペルギルス菌類である*Aspergillus fumigatus*等の真菌類、大腸菌*Escherichia coli*、緑膿菌*Pseudomonas aeruginosa*などのグラム陰性細菌類、黄色ブドウ球菌*Staphylococcus aureus*等のグラム陽性細菌類等。

[0069] 本発明の化合物は、農作物や天然林、人工林ならびに都市緑地の樹木や鑑賞用植物に損害を与える害生物、例えば節足動物類、腹足類、線虫類、菌類を防除することに特に価値がある。このような場面では、本発明の化合物は、それらの商業上有用な製剤及びそれらの製剤によって調製された使用形態で、他の活性化合物、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、共力剤、植物調整剤、毒餌又は除草剤との混合剤として、存在することもできる。

使用形態としては、水和剤、顆粒水和剤、ドライフロアブル剤、水溶剤、乳剤、液剤、油剤、水中懸濁剤・水中乳濁剤等のフロアブル剤、カプセル剤、粉剤、粒剤、細粒剤、ベイト、錠剤、噴霧剤、煙霧剤、エアゾール剤等を取りうる。これらの剤型とするためには、適宜、農園芸用薬剤の技術分野において、従来より使用されている各種の農薬補助剤を使用することができる。このような農薬補助剤は、例えば、農園芸用薬剤の効果の向上、安定化、分散性の向上等の目的で使用することができる。

[0070] 農薬補助剤としては、例えば、担体（希釈剤）や、乳化剤、湿展剤、分散剤、崩壊剤等が挙げられる。液体担体としては、水や、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素、メタノール、ブタノール、グリコール等のアルコール類、アセトン等のケトン類、ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、メチルナフタレン、シクロヘキサン、動植物油、脂肪酸等を挙げることができる。また、固体担体としては、クレーや、カオリン、タルク、珪藻土、シリカ、炭酸カルシウム、モンモリロナイト、ベントナイト、長石、石英、アルミナ、鋸屑、ニトロセルロース、デンプン、アラビアゴム等を用いることができる。

乳化剤や、分散剤としては、通常の界面活性剤を使用することが出来、例

例えば、高級アルコール硫酸ナトリウムや、ステアリルトリメチルアンモニウムクロライド、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ラウリルベタイン等の陰イオン系界面活性剤、陽イオン界面活性剤、非イオン系界面活性剤、両イオン系界面活性剤等を用いることが出来る。

また、ジアルキルスルホサクシネート等の湿展剤；カルボキシメチルセルロース、ポリビニルアルコール等の固着剤；リグニンスルホン酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウム等の崩壊剤等を用いることが出来る。

勿論、本発明の化合物を、1種又は2種以上組合せて、有効成分として配合することもできる。これらの製剤中には有効成分としての本発明の化合物の含有量は、例えば、0.01～99.5質量%であり、好ましくは、0.5～90質量%の範囲から選ばれ、製剤形態、施用方法等の種々の条件により適宜決定すればよいが、例えば、粉剤では、約0.5～20質量%程度、好ましくは、1～10質量%、水和剤では、約1～90質量%程度、好ましくは、10～80質量%、乳剤では、約1～90質量%程度、好ましくは、10～40質量%の有効成分を含有するように製造できる。

[0071] 節足動物類、腹足類、線虫類、菌類を防除するには、通常これらの害生物による被害が発生している場所、ないしは被害が発生する可能性がある場所に対して、植物の茎葉部に散布する他に、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。また、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、養液（水耕）栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。使用する場合、害生物の種類や発生量及び対象とする作物・樹木の種類や栽培形態・生育状態により異なるが、一般に10アール当たり有効成分量で0.1～1000 gを、好ましくは1～100 gを施用する。これを処理するには、水和剤、顆粒水和剤、ドライフロアブル剤、水溶剤、乳剤、液剤、水中懸濁剤・水中乳濁剤等のフロアブル剤、カプセル剤等では水で希釈し、対象とする植物の種類や栽培形態・生育状態により異なるが、一般に10アール当たり10～1

000リットルの施用量で作物等に散布すればよい。また、粉剤、噴霧剤又はエアゾール剤では、その製剤の状態で作物等に処理すればよい。

対象とする害生物が主として土壌中で植物を加害する場合や、薬剤を根部から吸収させて対象とする害生物を防除する場合の施用方法としては、例えば、製剤を水に希釈又は希釈せずに植物体の株元又は育苗用苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の株元又は育苗のための苗床等に散布する方法、播種前又は移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壌全体と混和する方法、播種前又は植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、細粒剤、等を散布する方法等が挙げられる。水和剤、顆粒水和剤、水溶剤、乳剤、液剤、水中懸濁剤・水中乳濁剤等のフロアブル剤、カプセル剤等では水で希釈し、一般に10アール当たり5～500リットルの施用量で、処理する区域全体に均等となるように土壌表面に散布あるいは土壌中に灌注すればよく、粉剤、粒剤、細粒剤又はベイト等ではその製剤の状態、処理する区域全体に均等となるように土壌表面に散布すればよい。散布あるいは灌注は、加害から保護したい種子又は作物・樹木の周囲にしてもよい。また、散布中又は散布後に耕耘し、有効成分を機械的に分散させることもできる。

[0072] 水稻の育苗箱への施用方法としては、剤型は、播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、例えば、粉剤、顆粒水和剤、粒剤、細粒剤等の剤型で施用すれば良い。培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤、粒剤又は細粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。また、単に、培土と各種製剤を交互に層状にして施用しても良い。

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

給に伴い省力的に施用することもできる。

種子処理の方法としては、例えば、液状又は固形の製剤を希釈して又は希釈せずに液体状態にて種子を浸漬して薬剤を付着・浸透させる方法、固形製剤又は液状製剤を種子と混和、粉衣処理して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の担体と混和して種子にコーティングする方法、植え付けと同時に種子付近に散布する方法等が挙げられる。当該種子処理を行う「種子」とは、植物の繁殖に用いられる栽培初期の植物体を意味し、例えば、種子の他、球根、塊茎、種芋、株芽、むかご、鱗茎又は挿し木栽培用の栄養繁殖用の植物体を挙げることができる。また、施用する場合の植物の「土壌」又は「栽培担体」とは、作物を栽培するための支持体、特に根を生えさせる支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、いわゆる土壌、育苗マット、水等であっても良く、具体的な素材としては、例えば、砂、軽石、バーミキュライト、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、バーク等が挙げられる。

移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接処理の他、育苗用苗床への、液状とした薬剤の灌注処理又は粒剤の散布処理が好ましい。また、定植時に粒剤を植え穴に処理する、あるいは移植場所近辺の栽培担体に混和することも好ましい処理である。

[0073] 本発明の化合物は、木材（立木、倒木、加工木材、貯蔵木材又は構造木材）を、シロアリ類又はコウチュウ類などの昆虫類や菌類等の加害から保護するのに価値がある。このような場面では、木材あるいはその周囲の土壌等に対して油剤、乳剤、水和剤、ゾル剤の散布・注入・灌注・塗布、粉剤、粒剤等の散布等の方法で防除することができる。また、本場面で使用される油剤、乳剤、水和剤、粉剤等は、他の活性化合物、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、忌避剤又は共力剤との混合剤として存在することもでき、これらの製剤中には有効成分化合物が合計量で0.0001～95質量%、好ましくは油剤、粉剤や粒剤では0.005～10質量%、乳剤や水和剤及びゾル剤では0.

01～50質量%含有しうる。節足動物類又は菌類等を防除する場合は、1m²当たり有効成分化合物量にして0.01～100gを土壌あるいは木材表面に散布する。

[0074] 本発明の化合物は、穀類、果実、木の実、香辛料及びタバコ等の製品をそのままの状態、粉末化した状態あるいは製品中に混入した状態で貯蔵する際に、チョウ目類、コウチュウ類、ダニ類及び菌類などの加害から保護することに利用できる。また、動物製品（皮、毛、羊毛及び羽毛等）や植物製品（綿、紙等）を天然あるいは転化した状態で貯蔵する際にもチョウ目類、コウチュウ類、シミ類やゴキブリ類の攻撃から保護でき、更に肉や魚等の食品等を貯蔵する際のチョウ目類、コウチュウ類、ハエ類やダニ類の攻撃から保護できる。このような場面では、油剤、乳剤、水和剤、粉剤等の散布、樹脂蒸散剤等の設置、燻煙剤や煙霧剤の処理、顆粒、錠剤及び毒餌の設置、エアロゾルの噴霧等の方法で防除することができる。また、これらの製剤は、他の活性化合物、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、忌避剤又は共力剤との混合剤として存在することもでき、これらの製剤中には有効成分化合物が合計量で0.0001～95質量%含有しうる。

[0075] 本発明の化合物は、人間及び家畜の体表に寄生して皮膚の摂食又は吸血等の直接の危害を与える節足動物類や菌類、人間及び家畜の病気を蔓延せたり、そのような病気の媒介者である節足動物類、線虫類、吸虫類、条虫類、原生動物類、人間に不快感を与える節足動物類の駆除あるいは予防に価値がある。このような場面では、本発明の化合物を少量食事又は飼料等に混入したり、適切な経口摂取可能な調合薬剤組成物等、例えば薬剤上許容しうる担体やコーティング物質を含む錠剤、丸剤、カプセル剤、ペースト、ゲル、飲料、薬用飼料、薬用飲料水、薬用追餌、除放性大粒丸薬、その他胃腸管内に保留されるようにした除放性デバイス等として経口投与、あるいはスプレー、粉末、グリース、クリーム、軟膏、乳剤、ローション、スポットオン、ポアオン、シャンプー等として経皮投与することができる。この様な用途で効果を達成するためには、製剤中一般に有効成分化合物で0.0001～0.1質量%、好ましくは0.001～0.01質量%を含有させる。なお、経皮投与や局所投与の方

法として、局部的又は全身的に節足動物を防除するように動物に取り付けたデバイス（例えば首輪、メダリオンやイヤータグ等）を利用することもできる。

[0076] 本発明の化合物を家畜やペット等の動物あるいは人間に対する駆虫剤として使用する場合の具体的な経口投与方法及び経皮投与方法を示すが、必ずしもこれらに限定されるものではない。

薬用飲料水として経口的に投与する場合、飲料は普通ベントナイトのような懸濁剤あるいは湿潤剤又はその他の賦形剤と共に適当な非毒性の溶剤又は水での溶解、懸濁液又は分散液である。一般に飲料はまた消泡剤を含有する。飲料処方是一般に有効成分化合物を0.01～1.0質量%、好ましくは0.01～0.1質量%を含有する。

乾燥した個体の単位使用形態で経口的に投与することが望ましい場合は、通常所定量の有効成分を含有するカプセル、丸薬又は錠剤を用いる。これらの使用形態は、活性成分を適当に細粉碎した希釈剤、充填剤、崩壊剤及び／又は結合剤、例えばデンプン、乳糖、タルク、ステアリン酸マグネシウム、植物性ゴム等と均質に混和することによって製造される。このような単位使用処方は、治療される宿主動物の種類、感染の程度及び寄生虫の種類及び宿主の体重によって駆虫剤の質量及び含量を広く変化させることができる。

[0077] 動物飼料によって投与する場合は、それを飼料に均質に分散させるか、トップドレッシングとして使用されるかペレットの形態として使用できる。普通望ましい抗寄生虫効果を達成するためには、最終飼料中に有効成分化合物を0.0001～0.05質量%、好ましくは0.0005～0.01質量%を含有させる。

液体担体賦形剤に溶解あるいは分散させたものは、前胃内、筋肉内、気管内又は皮下注射によって非経口的に動物に投与できる。非経口投与のために、活性化合物は好適には落花生油、綿実油のような適当な植物油と混合する。このような処方は、一般に有効成分化合物を0.05～50質量%、好ましくは0.1～5.0質量%を含有させる。

また、ジメチルスルホキシドあるいは炭化水素溶剤のような適当な担体と

混合することによって局所的に投与しうる。この製剤はスプレー又は直接的注加によって動物の外部表面に直接適用される。

また、本発明の化合物は、直接の危害を与える節足動物類あるいは病気の媒介者である節足動物類等の駆虫剤として、それらの害生物が潜在しうる周囲の環境に対して、油剤、乳剤、水和剤等の散布・注入・灌注・塗布、粉剤等の散布、薫蒸剤、蚊取線香・自己燃焼型燻煙剤・化学反応型煙霧剤等の加熱煙霧剤、フォグging等の燻煙剤、ULV剤等の処理、顆粒、錠剤及び毒餌の設置、又はフローティング粉剤、粒剤等の水路、井戸、貯水池、貯水槽及びその他の流水もしくは停留水中への滴下する添加等の方法で利用することもできる。更に、農業、森林害虫でもあるドクガ類等に対しては、前記した方法と同様に防除することが可能であり、又はハエ類等に対しては家畜の飼料中に混入して糞に混じるようにする方法、カ類等に対しては電気蚊取器等で空中へ揮散させる方法等も有効である。なお、これらの使用形態である製剤は、他の活性化合物、例えば害虫防除剤、ダニ防除剤、線虫防除剤、病害防除剤、忌避剤又は共力剤との混合剤として存在することもでき、これらの製剤中には有効成分化合物が合計量で0.0001～95質量%含有される。

[0078] 本発明の化合物は、他の活性化合物との混合剤として存在することもできる。特に害虫防除活性、ダニ防除活性又は線虫防除活性を有する化合物（殺虫剤）と混合して使用することにより植物に損害を与える節足動物類、腹足類、線虫類等の害生物の防除に対して、防除対象病虫害の拡大が可能となり、薬量の低減等の相乗効果等も期待できる。その具体例な活性化合物として、以下のものが挙げられる。

[0079] 有機燐剤、例えば、アセフェート (acephate)、アジンホスメチル (azinphos-methyl)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、ダイアジノン (daizinin)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジメトン-Sメチル (dimeton-S-methyl)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジスルフォトン (disulfoton)、エチオン (ethion)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェンチオン (fenthion)、イソキサチオン (isoxathion)、マ

ラチオン (malathion)、メタミドホス (methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、モノクロトホス (monocrotophos)、ナレド (naled)、オキシデプロホス (oxideprofos)、パラチオン (parathion)、フェンソエート (phenthoate)、ホサロン (phosalone)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、ピリダフェンチオン (piridafenthion)、プロフェノホス (profenofos)、プロチオホス (prothiofos)、プロパホス (propaphos)、ピラクロホス (pyraclofos)、サリチオン (salithion)、スルプロホス (sulprofos)、チオメトン (thiometon)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinfos)、トリクロルホン (trichlorphon)、バミドチン (vamidothion) 等；

カーバメイト剤、例えば、アラニカルブ (alanycarb)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、エチオフエンカルブ (ethiofencarb)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フラチオカルブ (furathiocarb)、イソプロカルブ (isoproc carb)、メソミル (methomyl)、メトルカルブ (metolcarb)、ピリミカルブ (pirimicarb)、プロポクスル (propoxur)、チオジカルブ (thiodicarb) 等；

有機塩素剤、例えば、アルドリン (aldrin)、クロルデン (chlordane)、DDT (p, p' -DDT)、エンドサルファン (endosulfan)、リンデン (lindane)、等；

[0080] ピレスロイド剤、例えば、アクリナトリン (acrinathrin)、アレスリン (allethrin)、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)、シフェノトリン (cyphenothrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、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 (flufenprox)、フルバリネート (fluvalinate)、フラメトリン (furamethrin)、ハロフェンプロックス (halfenprox)、イミプロトリン (imiprothrin)、ペルメトリン (permethrin) 等；

ethrin)、フェノトリン (phenothrin)、プラレトリン (prallethrin)、ピレトリン (pyrethrins)、レスメトリン (resmethrin)、シラフルオフエン (silaf luofen)、テフルトリン (tefluthrin)、トラロメトリン (tralomet hrin)、トランスフルスリン (transfluthrin)、等；

[0081] ネオニコチノイド剤、例えば、アセタミプリド (acetamiprid)、クロチアニジン (clothianidin)、ジノテフラン (dinotefran)、イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、チアクロプリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam) 等；

ジアミド剤、例えば、クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、シクラニリプロール (cyclaniliprole)、フルベンジアミド (flubenziamid)、テトラニリプロール (tetraniliprole) 等；

フェニルピラゾール剤、例えば、エチプロール (ethiprole)、フィプロニル (fipronil)、アセトプロール (acetoprole)、ピラフルオプロール (pyrafluoprole)、ピリプロール (pyriprole) 等；

[0082] ネライストキシシン剤、例えば、ベンスルタップ (bensultap)、カルタップ (cartap)、チオシクラム (thiocyclam)、チオスルタップ (thiosultap) 等；

フェニルベンゾイルウレア剤やジアシルヒドラジン類等の昆虫成長制御剤、例えば、クロロフルアズロン (chlorfluazuron)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフエヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、トリフルムロン (triflumuron)、ブプロフェジン (buprofezin)、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)、テブフェノジド (tebufenozide)、シロマジン (cyromazine) 等；

幼若ホルモン剤、例えば、ジオフェノラン (diofenolan)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、ヒドロプレン (hydroprene)、メソプレン (methoprene)

）、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen) 等；

[0083] 微生物により生産される殺虫性物質等、例えば、アバメクチン (abamectin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、イベルメクチン (ivermectin)、レピメクチン (lepimectin)、ミルベメクチン (milbemectin)、ネマデクチン (nemadectin)、ニッコーマイシン (Nikkomycin)、ポリオキシン複合体 (polioxin)、スピネトラム (spinetram)、スピノサドー (spinosad)、BT剤等；

天然物由来の殺虫性物質等、例えば、アナバシン (anabasin)、アザジラクチン (azadirachtin)、デグエリン (deguelin)、脂肪酸グリセリド (decano lyoctanoylglycerol)、ヒドロキシプロピルデンプン (hydroxy propyl starch)、大豆レシチン (lecithin)、ニコチン (nicotine)、ノルニコチン (nornicotine)、オレイン酸ナトリウム (oleic acid sodium salt)、マシ油 (petroleum oil)、プロピレングリコールモノ脂肪酸エステル (propylene glycol monolaurate)、なたね油 (rape oil)、ロテノン (rotenone)、ソルビタン脂肪酸エステル (Sorbitan fattyacid ester)、デンプン (starch) 等；

[0084] その他の殺虫剤として、例えば、アフィドピロペン (afidpyropen)、ベンズピリモキサシ (benzpyrimoxan)、ブロフラニリド (broflanilide)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、ジンプロピリダズ (dimpropyridaz)、DBEDC (Dodecylbenzenesulphonic acidbisethylenediamine copper [II] salt)、フロニカミド (flonicamid)、フロメトキン (flometoquin)、フルフェネリム (flufenerim)、フルピラジフロン (flupyradifurone)、フルピリミン (flupyrimin)、フルララネル (fluralaner)、フルヘキサホン (fluhexafon)、フルキサメタミド (fluxametamide)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、インドキサカルブ (indoxacarb)、イソシクロセラム (isocycloseram)、メタフルミゾン (metaflumizone)、メタアルデヒド (metaldehyde)、硫酸ニコチン (nicotin sulfate)、オキサゾスルフィル (oxazosul

fyl)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazon)、スピロテトラマト (spirotetramat)、スルホキサフロル (sulfoxaflor)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トリアザメート (triazamate)、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim)、チクロピラゾフロル (tyclopiazoflor) 等；

[0085] 殺ダニ剤、例えば、アセキノシル (acequinocyl)、アシノナピル (acynonapyr)、アミドフルメット (amidoflumet)、アミトラズ (amitraz)、アゾシクロチン (azocyclotin)、ベンゾメート (benzoximate)、ビフェナゼート (bifenazate)、ビナパクリル (binapacryl)、フェニソブプロモレート (bromopropylate)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロフェンテジン (clofentezine)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、水酸化トリシクロヘキシルスズ (cyhexatin)、ジコホル (dicofol)、ジエノクロル (dienochlor)、エトキサゾール (ethoxazole)、フェナザフロル (fenazaflor)、フェナザキン (fenazaquin)、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)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、ピリミジフェン (pirimidifen)、ポリナクチン複合体 (polynactins)、プロパルギル (propargite)、ピフルブミド (pyflubumide)、ピリダベン (pyridaben)、スピロジクロフェン (spirodiclofen)、スピロピジオン (spiropidion)、スピロメシフェン (spiromesifen)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テトラジホン (tetradifon) 及びKUI-1821 (試験名) 等；

[0086] 殺線虫剤、例えば、リン化アルミニウム (aluminium phosphide)、ベנקロチアズ (benclothiaz)、カズサホス (cadusafos)、エトプロホス (ethoprophos)、フルアザインドリジン (fluazaindolizine) フルエンスルフォン (fluensulfone)、ホスチアゼート (fosthiazate)、フルフラル (furfural)、イミシアホス (imicyafos)、塩酸レバミゾール (levamisol hydrochloride)、メスルフェンホス (mesulfenfos)、カーバム (metam-ammonium)、メ

チルイソシアネート (methyl isothiocyanate)、酒石酸モランテル (morant eltartarate)、オキサミル (oxamyl)、チオキサザフェン (thioxazafen) 等；

毒餌、例えば、クロロファシノン (chlorphacinone)、クマテトラリル (coumatetralyl)、ダイファシン (diphacinone)、モノフルオル酢酸塩 (sodium fluoracetate)、ワルファリン (warfarin) 等を挙げることができる。

[0087] 本発明の化合物は、害虫防除活性、ダニ防除活性又は線虫防除活性を有する化合物以外の他の活性化合物との混合剤として存在することもできる。使用時期に同時に発生する病害及び／又は雑草を防除するために、殺菌活性、除草活性又は植物成長調整活性を有する化合物と混合して使用することにより、防除労力の低減と共に薬量の低減等の相乗効果等も期待できる。また、忌避剤や共力剤等と混合して使用することにより、相乗効果等のより有効な防除効果が期待できる。

[0088] その具体例な活性化合物として、病害防除剤、例えば、D-D (1,3-dichloropropene)、アシベンゾラルSメチル (acibenzolar-S-methyl)、アルジモルフ (aldimorph)、アメトクトラジン (ametoctradin)、アミスルブロム (amisulbrom)、アンドプリム (andoprim)、トリアジン (anilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、塩基性硫酸銅 (basic copper sulfate)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ベンチアバリカルブイソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、ベンチアゾール (benthiazole)、ビテルタノール (bitertanol)、ビキサフェン (bixafen)、ブラストサイジンS (blasticidin S)、ボスカリド (boscalid)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、炭酸カルシウム (calcium carbonate)、ブチオベート (buthiobate)、石灰硫黄合剤 (calcium polysulfide)、キャプタフォル (captafol)、キャプタン (captan)、カルベンダゾール (carbendazim)、カルボキシシン (carboxin)、カルプロパミド (carpropamid)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロルフェナゾール (chlorfenazole)、クロロネブ (chloroneb) クロルピクリ

ン (chloropicrin)、クロロタロニル (chlorothalonil)、クロゾリネート (chlozolate)、DBEDC (complex of bis (ethylenediamine) copper-bis-(dodecylbenzenesulfonic acid))、水酸化第二銅 (copper hydroxide)、

[0089] ノニルフェノールスルホン酸銅 (copper nonylphenol sulfonate)、塩基性塩化銅 (copper oxychloride)、シアゾファミド (cyazofamid)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、シモキサニル (cymoxanil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、ダゾメット (dazomet)、ジクロブトラゾール (diclobutrazol)、ジクロフルアニド (dichlofluandid)、ジクロン (dichlone)、ジクロシメット (diclocymet)、ジクロメジン (diclomezine)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジフルメトリム (diflumetorim)、ジメトモルフ (dimethomorph)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジニコナゾールM (diniconazole-M)、ダイセンステンレス (dithane-stainless)、ジチアノン (dithianon)、ドジン (dodine)、エクロメゾール (echlomezole)、エディフェンホス (edifenphos)、エネストロビン (enestrobin)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、エタボキサム (ethaboxam)、シイタケ菌糸体抽出物 (extract from mushroom)、ファミキサドン (famoxadone)、フェナミドン (fenamidone)、フェナリモル (fenarimol)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラン (fenfuram)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェノキサニル (fenoxanol)、フェンピクロニル (feniclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)、フェリムゾン (ferimzone)、フルアジナム (fluazinam)、フルメットーバー (flumetover)、フルモルフ (flumorph)、フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピラム (fluopyram)、フルオルイミド (fluoroimide)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、

[0090] フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、

ホルペット (folpet)、ホセチル・アルミニウム (fosetyl-AL)、フサライド (fthalide)、フベリダゾール (fuberidazole)、フルジオキシニル (fludioxonil)、フルジラゾール (flusilazole)、フルチアニル (flutianil)、フルトリアフォル (flutriafol)、フラメトピル (furametpyr)、フルコナゾール (furconazole)、グアザチン (guazatine)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヒドロキシイソキサゾール (hydroxyioxazole)、ヒメキサゾール (hymexazol)、イマザリル (imazalil)、イマザリルサルフェート (imazalil sulfate)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン酢酸塩 (iminooctadine acetate)、イミノクタジン・アルベシル酸塩 (iminooctadine-DBS)、イプコナゾール (ipconazole)、I B P (iprobenfos)、イプロジオン (iprodione)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、イソフェタミド (isofetamid)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イソピラザム (isopyrazam)、イソチアニル (isotianil)、カスガマイシン (kasugamycin)、クレソキシムーメチル (kresoxim-methyl)、マンコゼブ (mancozeb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、マンネブ (maneb)、

[0091] マンゼブ (manzeb)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepronil)、メタラキシル (metalaxyl)、カーバム (metam-ammonium)、カーバムナトリウム (metam-sodium)、メトコナゾール (metconazole)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、臭化メチル (methyl bromide)、メチルイソチオシアネート (methylothiocyanate)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、ミルディオマイシン (mildiomycin)、ミクロブタニル (myclobutanil)、有機硫黄ニッケル塩 (nickel dimethyldithiocarbamate)、ヌアリモル (nuarimol)、オリサストロビン (orysastrobin)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキサチアピプロリン (oxathiapirolin)、有機銅 (oxine-copper)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オキスポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、ペブレート (pebulate)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (pe

nconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、ペンフルフェン (penflufen)、ペンチオピラド (penthiopyrad)、ピカルブトラゾックス (picarbutrazox)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピペラリン (piperalin)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ポリオキシシンB (polyoxin-B)、ポリオキシシン複合体 (polyoxins)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、

[0092] プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ (propamocarb)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、プロキナジド (proquinazid)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、ピリジニトリル (pyridinitril)、ピリフェノック (pyrifenoxy)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピリオフェノン (pyriofenone)、ピロキロン (pyroquilon)、キノキシフェン (quinoxifen)、キントゼン (quintozene)、セダキサネ (sedaxane)、銀 (silver)、シメコナゾール (simeconazole)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、スピロキサミン (spiroxamine)、ストレプトマイシン (streptomycin)、硫黄 (sulfur)、テブフロキン (tebufloquin)、テブコナゾール (tebuconazole)、テクロフタラム (tecloftalam)、テルビナフィン (terbinafine)、テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チアジアジン (thiadiazin)、チフルザミド (thifluzamide)、チオファネート (thiophanate)、

[0093] チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、チウラム (thiram)、チアジニル (tiadinil)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、トルクロカルブ (tolprocarb)、トリルフルアニド (tolylfluanid)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリクロピリカルブ (tricyclopyricarb)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ

(tridemorph)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリホリン (triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、ユニコナゾールP (uniconazole-P)、バリダマイシン (validamycin (-A))、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ザリラミド (zarilamid)、硫酸亜鉛 (zinc sulfate)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram)、ゾキサミド (zoxamide) 等を例示することができる。

[0094] 除草活性を有する化合物として、例えば、

アクロニフェン (aclonifen)、アシフルオフエン (acifluofen-sodium)、アラクロール (alachlor)、アロキシジム (alloxydim)、アミカルバゾン (amicarbazone)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アニロホス (anilofos)、アシュラム (asulam)、アトラジン (atrazine)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、ベンフレセート (benfuresate)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、ベントゾン (bentazone)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ビアラホス (bialaphos)、ビフェノックス (bifenox)、ブロモブチド (bromobutide)、ブロモキシニル (bromoxynil)、ブタミホス (butamifos)、カフェンストロール (cafenstrole)、過酸化カルシウム (calcium peroxide)、カルベタミド (carbetamide)、シノスルフロン (cinosulfuron)、クロメプロップ (clomeprop)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamuron)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ダイムロン (daimuron)、デスメディファム (desmedipham)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、ジフルフェニカン (diflufenican)、

[0095] ジメフロン (dimefuron)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジノテルブ (dinoterb)、ジクワット (diquat)、ジウロン (diuron)、エスプロカルブ (esprocarb)、エチオジン (ethiozin)、エトフメセート (ethofumesate)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エトベンザニド (etobenzanid)、フェノキサプロップPエチル (fenoxaprop-P-ethyl)、フェントラザミド (fentrazamide)、フルカルバゾン (flucarbazone)、フルフェナセット (f

lufenacet)、フルルタモン (flurtamone)、フルチアセットメチル (fluthi acet-methyl)、ホラムスルフロン (foramsulfuron)、グルホシネート (glufosinate-ammonium)、グリホサートイソプロピルアミン塩 (glyphosate-isopropyl amine)、グリホサートトリメシウム塩 (glyphosate-trimesium)、イマザピル (imazapyr)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、インダノファン (indanofan)、ヨードスルフロン (iodosulfuron)、アイオキシニル (ioxynil-octanoate)、イソプロツロン (isoproturon)、イソキサジフェン (isoxadifen)、イソキサフルトール (isoxaflutole)、ラクトフェン (lactofen)、リニュロン (linuron)、

[0096] メフェナセット (mefenacet)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メタミトロン (metamitron)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、メトスラム (metosulam)、メトリブジン (metribuzin)、ナプロパミド (napropamide)、ネブロン (neburon)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、パラコート (paraquat)、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペントキサゾン (pentoxazone)、フェンメディファム (phenmedipham)、プレチラクロール (pretilachlor)、プロポキシカルバゾン (propoxycarbazine)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-n-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-n-ethyl)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリミノバック (pyriminobac-methyl)、キザロホップエチル (quizalofop-ethyl)、セトキシジム (sethoxydim)、シマジン (simazine)、スルコトリオン (sulcotrion)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、テニルクロール (thienclozole)、トリアジフラム (triaziflame)、トリブホス (tribufos) 等を例示することができる。

[0097] 又、植物成長調節作用を有する化合物として、例えば、1-ナフチルアセトアミド (1-naphthylacetic acid)、4-CPA (4-chlorophenylacetic acid)、ベンジルアミノプリン (6-benzylaminopurine)、ブトルアリン (butralin)、塩

化カルシウム (calcium chloride)、ギ酸カルシウム (calcium formate)、過酸化カルシウム (calcium peroxide)、硫酸カルシウム (calcium sulfate)、クロルメコート (chlormequat chloride)、コリン (choline)、シアナミド (cyanamide)、シクラニリド (cyclanilide)、ダミノジット (daminozide)、デシルアルコール (decyl alcohol)、ジクロルプロップ (dichloroprop)、エテホン (ethephon)、エチクロゼート (ethychlozate)、フルルプリミドール (flurprimidol)、ホルクロルフェニユロン (forchlorfenuron)、ジベレリン (gibberellic acid)、インドール酪酸 (indolebutyric acid)、マレイン酸ヒドラジドカリウム (maleic hydrazide potassium salt)、メフェンピル (mefenpyr)、メピコートクロリド (mepiquat chloride)、オキシン硫酸塩 (oxine sulfate, 8-hydroxyquinoline sulfate)、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、パラフィン (paraffin)、プロヘキサジオンカルシウム塩 (prohexadione-calcium)、

[0098] プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、チジアズロン (thidiazuron)、トリネキサパックエチル (trinexapac)、ウニコナゾールP (uniconazole-P)、ワックス (wax)、等と混合して使用することもできる。

忌避剤例えば、カプサイシン (capsaicin)、カラナー3, 4-ジオール (carane-3,4-diol)、シトロネラル (citronellal)、ディート (deet)、ジメチルフタレート (dimethyl phthalate)、ヒノキチオール (hinokitiol)、リモネン (limonene)、リナロール (linalool)、メントール (menthol)、メントン (menthone)、ナフタレン (naphthalene)、チウラム (thiram) 等；

共力剤、例えば、メチレンジオキシナフタレン (methylenedioxy naphthalene)、ナフチル・プロピニル・エステル (naphthyl propynyl ether)、ニトロベンジル・チオシアネート (nitrobenzyl thiocyanate)、オクタクロロジプロピル・エステル (octachlorodipropyl ether)、ペンチニル・フタルイミド (pentynyl phthalimide)、フェニル・サリオクソン (phenyl salioxon)、ピペロニルブトキシド (piperonil butoxide)、サフロール (safrole)、

セサメックス (sesamex)、セサミン (sesamin)、スルホキサイド (sulfoxide)、トリフェニル・ホスフェート (triphenyl phosphate)、バルブチン (verbutin) 等を挙げることができる。

[0099] 本発明の化合物は、生物農薬として、例えば、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ポックスウイルス (Entomopox virus、EPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、NPV) 等のウイルス製剤、ボーベリア・バシアーナ (*Beauveria bassiana*)、ボーベリア・ブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*)、モノクロスפורウム・フィマトパガム (*Monacrosporium phymatophagum*)、ペキロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*)、パスツールシア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)、スタイナーネマ・カーポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*)、スタイナーネマ・グラセライ (*Steinernema glaseri*)、スタイナーネマ・クシダエ (*Steinernema kushidai*)、バーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) 等の殺虫又は殺センチュウ剤として利用される微生物農薬、アグロバクテリウム・ラジオバクター (*Agrobacterium radiobactor*)、バチルス・ズブチリス (*Bacillus subtilis*)、非病原性エルビニア・カロトボーラ (*Erwinia carotovora*)、非病原性フザリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxysporum*)、シュードモナス CAB-02 (*Pseudomonas CAB-02*)、シュードモナス・フルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*)、タラロマイセス・フラバス (*Talaromyces flavus*)、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、トリコデルマ・リグノラン (*Trichoderma lignorum*) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (*Xanthomonas campestris*) 等の除草剤として利用される生物農薬等と混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

[0100] 更に、生物農薬として、例えば、ミヤコカブリダニ (*Amblyseius californicus*)、ククメリスカブリダニ (*Amblyseius cucumeris*)、デジェネランスカブリダニ (*Amblyseius degenerans*)、コレマンアブラバチ (*Aphidius col*

emani)、シヨクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*)、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperia carnea*)、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*)、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*)、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*)、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*)、アリガタシマアザミウマ (*Franklinothrips vespiformis*)、ナミテントウ (*Harmonia axyridis*)、カンムリヒメコバチ (*Hemiptarsenus varicornis*)、ハモグリミドリヒメコバチ (*Neochrysocharis formosa*)、ナミヒメハナカメムシ (*Orius sauteri*)、タイリクヒメハナカメムシ (*Orius strigicollis*)、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*)、クロヒョウタンカスミカメ (*Pilophorus typicus*)、オオメカメムシ (*Piocoris varius*)、等の天敵生物、コドレルア (*codlure*)、キュウルア (*cuelure*)、ゲラニオール (*geraniol*)、ジプトール (*gyptol*)、リブルア (*liblure*)、ループルア (*looplure*)、メチルオイゲノール (*methyl eugenol*)、オリフルア (*orfralure*)、ピーチフルア (*peachflure*)、フィシルア (*phycilure*)、ピリマルア (*pyrimalure*)、テレピン油 (*turpentine*)、等のフェロモン剤と併用することも可能である。

実施例

[0101] 以下、本発明について、更に、実施例、製剤例及び試験例を記載して詳しく説明するが、本発明の範囲はこれらの実施例、製剤例及び試験例によって何ら限定されるものではない。

[0102] 実施例 1. 2, 4-ジメチル-1-(1, 1, 1-トリフルオロエチル)チオベンゼンの合成

2, 4-ジメチルベンゼンチオール (14.7 mL) のDMF (200 mL) 溶液を氷浴にて冷却し、炭酸カリウム (18.3 g)、ロンガリット (5.17 g) を加えた。これに対して2, 2, 2-トリフルオロエチルヨード (25.1 g) を25分間かけて滴下し、氷浴にて3時間、反応液を室温まで昇温しながら22時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ヘキサンで3回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒留去することで2, 4-ジメチル-1-(1, 1, 1-トリフルオロエチル)チオベンゼン

ン23.2 gを得た。

[0103] 実施例 2. 2, 4-ジメチル-5-[(1, 1, 1-トリフルオロエチル) チオ]ベンズアルデヒドの合成

滴下ロートを付けた3径フラスコに2, 4-ジメチル-1-(1, 1, 1-トリフルオロエチル) チオベンゼン(10.0 g)を加え、容器内をアルゴンで置換した。これに対して乾燥ジクロロメタン100 mLを加え、氷浴にて冷却した。これに対して四塩化チタン(1.0 Mジクロロメタン溶液) 100 mLを3時間かけて滴下した。氷浴にて13分間攪拌したのち、ジクロロメチルメチルエーテル(4.46 mL)をゆっくりと加え、室温まで昇温しながら2.5時間攪拌し、室温で更に16時間攪拌した。その後、反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、有機層を分離した。水層をヘキサンで2回抽出し、合わせた有機層を0.1 N塩酸で2回、飽和食塩水で1回洗浄した。これを硫酸ナトリウムで乾燥後、有機溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-hexane:EtOAc=10:1/ Rf=0.2)で精製し2, 4-ジメチル-5-[(1, 1, 1-トリフルオロエチル) チオ]ベンズアルデヒドを7.82 g得た。

[0104] 実施例 3. 2, 4-ジメチル-5-[(1, 1, 1-トリフルオロエチル) スルフィニル]ベンズアルデヒドの合成

2, 4-ジメチル-5-[(1, 1, 1-トリフルオロエチル) チオ]ベンズアルデヒド(1.07 g)をメタノール8 mLに溶解し、35%過酸化水素水(0.420 mL)とタングステン酸ナトリウム2水和物とを加え、室温で16時間攪拌した。その後水を加え、析出した固体をろ別し、水で洗浄後乾燥して、2, 4-ジメチル-5-[(1, 1, 1-トリフルオロエチル) スルフィニル]ベンズアルデヒドの白色固体0.860 gを得た。

[0105] 実施例 4. 1-(2, 4-ジメチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルフィニル) ベンジル)-4-(トリフルオロメチル) ピペリジンの合成

2, 4-ジメチル-5-[(1, 1, 1-トリフルオロエチル) スルフィニル]ベンズアルデヒド(341 mg)をジクロロメタン15 mLに溶解し、4-トリフル

オロメチルピペリジン(0.201 mL)、及び酢酸(0.022 mL)を加えて17分間撹拌した。これに対してナトリウムトリアセトキシボロハイドライド(389 mg)を加え、室温で3時間撹拌した。酢酸エチル、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を停止した。有機層を分離し水層を酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水、硫酸ナトリウムで乾燥し減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルにまぶし、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(*n*-hexane:EtOAc=2:1/ *R_f*=0.5)で精製し1-(2, 4-ジメチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルフィニル)ベンジル)-4-(トリフルオロメチル)ピペリジン416 mgを得た。

[0106] 実施例5. (2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)フェニル)メタノールの合成

(2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)ベンズアルデヒド(957 mg)のエタノール13 mL溶液に対して室温でテトラヒドロホウ酸ナトリウム(174 mg)を加え、30分間撹拌した。その後酢酸エチル、水、1N塩酸を順に加え、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去して得た残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(*n*-hexane:EtOAc=4:1/ *R_f*=0.5)で精製し(2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)フェニル)メタノール895 mgを得た。

[0107] 実施例6. 2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)ベンジルメタンスルホネートの合成

(2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)フェニル)メタノール(2.85 g)をジクロロメタン40 mLに溶解し、氷浴にて冷却した。これに対してメタンスルホニルクロリド(2.60 mL)を加え、トリエチルアミン(1.90 mL)のジクロロメタン7 mL溶液を25分間かけて滴下した。これを室温まで昇温しつつ80分間撹拌したのち、水を加えた。有機層を分離し、水層を酢酸エチルで1回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥したのち溶媒を減圧留去した。得られた残渣を

シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-hexane:EtOAc=4:1/ Rf=0.3)で精製し2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)ベンジルメタンスルホネートの無色油状物3.20 gを得た。

[0108] 実施例7. 2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルフィニル)ベンジルメタンスルホネートの合成

2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)チオ)ベンジルメタンスルホネート(208 mg)をクロロホルム8mLに溶解し、m-クロロ過安息香酸(174 mg)を加えた。35分間攪拌したのち、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、攪拌した。有機層を分離したのち、水層をクロロホルムで2回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-hexane:EtOAc= 1:1/ Rf=0.5)で精製し2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルフィニル)ベンジルメタンスルホネートの白色固体180 mgを得た。

[0109] 実施例8. 1-(2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルフィニル)ベンジル)-4-メチルピペリジンの合成

2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルフィニル)ベンジルメタンスルホネート(147 mg)をDMF 5 mLに溶解し、4-メチルピペリジン(0.052 mL)と炭酸カリウム(71.4 mg)とを加え、DMF 5mLを追加して30分間攪拌した。水を加えて反応を停止し、ヘキサン：酢酸エチル=4：1 溶媒で2回抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-hexane:EtOAc= 1:1/ Rf=0.5)で精製し、1-(2-フルオロ-4-メチル-5-((2, 2, 2-トリフルオロエチル)スルフィニル)ベンジル)-4-メチルピペリジン112 mgを得た。

[0110] 上記実施例と同様にして製造した化合物について、その¹H-NMRデータを下記表7に示す。

表7

化合物番号	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS,400MHz]
A-1	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.42(2H,m), 1.58(4H,m), 2.39(3H,s), 2.40(4H,brs), 3.45(2H,m), 3.58(2H,s), 6.95(1H,d), 7.99(1H,d).
A-2	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.64(2H,m), 1.83(2H,m), 1.92-2.03(3H,m), 2.46(3H,s), 2.95(2H,m), 3.31(2H,q), 3.53(2H,s), 6.93(1H,d), 7.55(1H,d).
A-3	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.65(2H,m), 1.82(2H,d), 1.92-2.06(3H,m), 2.40(3H,s), 2.95(2H,d), 3.43(2H,m), 3.61(2H,s), 6.96(1H,d), 7.98(1H,d).
A-4	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.03(3H,t), 1.57-1.69(4H,m), 1.84(2H,d), 1.91-2.04(3H,d), 2.37(3H,s), 2.82(2H,t), 2.97(2H,d), 3.54(2H,s), 6.87(1H,d), 7.30(1H,d).
A-5	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.07(3H,t), 1.56-2.06(9H,m), 2.36(3H,s), 2.73(2H,m), 2.96(2H,m), 3.61(2H,s), 6.91(1H,d), 7.88(1H,d).
A-6	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.27(1H,m), 1.58(1H,m), 1.75(1H,m), 1.69-2.07(3H,m), 2.28-2.43(4H,m), 2.84(1H,m), 3.00(1H,m), 3.43(2H,m), 3.63(2H,m), 6.96(1H,d), 8.00(1H,m).
A-7	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 1.61-1.97(4H,m), 2.39-2.45(5H,m), 2.59(2H,m), 3.44(2H,m), 3.61(2H,s), 4.68(1H,m), 6.96(1H,d), 8.00(1H,d).
A-8	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.00(4H,m), 2.40(3H,s), 2.58(4H,t), 3.44(2H,m), 3.66(2H,s), 6.97(1H,d), 8.00(1H,d).
A-9	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.99 (4H,m), 2.47(3H,s), 2.56(4H,t), 3.30(2H,q), 3.57(2H,s), 6.94(1H,d), 7.55(1H,d).
A-10	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.92(4H, m), 2.33-2.45(5H,m), 2.62-2.72 (3H,m), 3.42(2H,m), 3.61(2H,s), 6.70(1H, d), 7.98(1H,d).
A-11	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 0.91(3H,d), 1.18-1.47(3H,m), 1.59(2H,m), 2.01(2H,m), 2.39(3H,s), 2.83(2H,m), 3.43(2H,m), 3.58(2H,s), 6.94(1H,d), 7.99(1H,d).
A-12	¹ H-NMR(CDCl ₃) δ ppm : 0.81-0.96(4H,m), 1.56-1.87(5H,m), 2.00(1H,m), 2.40(3H,s), 2.83(2H,m), 3.45(2H,m), 3.64(2H,s), 6.95(1H,d), 8.01(1H,m)
A-13	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.65(2H,m), 1.82(2H,m), 1.96-2.14(3H,m), 2.37(3H,s), 2.95(2H,d), 3.44(2H,m), 3.63(2H,s), 7.28(1H,s), 8.05(1H,s).
A-14	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.57(2H,m), 1.81(2H,m), 1.99(3H,m), 2.35(3H,s), 2.39(3H,s), 2.90(2H,t), 3.32-3.52(4H,m), 7.05(1H,s), 7.79(1H,s).
A-15	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 0.91(3H,d), 1.19(2H,m), 1.34(1H,m), 1.57(2H,m), 1.94(2H,td), 2.29(3H,s), 2.41(3H,s), 2.79(2H,m), 3.33(2H,q), 3.35(2H,s), 7.01(1H,s), 7.41(1H,s).
A-16	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 0.90(3H,d), 1.19(2H,m), 1.35(1H,m), 1.57(2,d), 1.97(2H,m), 2.35(3H,s), 2.38(3H,s), 2.76(2H,m), 3.41(2H,m), 3.44(2H,s), 7.03(1H,s), 7.81(1H,s).
A-17	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 0.93(3H,m), 1.25(2H,m), 1.36(1H,m), 1.61(2H,d), 1.96(2H,t), 2.39(3H,s), 2.81(2H,d), 3.42(2H,m), 3.49(2H,s), 7.24(1H,s), 7.43(1H,d), 7.90(1H,dd).

[0111]

化合物番号	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS,400MHz]
B-1	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.40(3H,s), 2.48(4H,m), 3.43(2H,m), 3.61(2H,s), 3.71(4H,t), 6.97(1H,d), 8.01(1H,d).
B-2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.39(3H,s), 2.67(4H,m), 2.73(4H,m), 3.43(2H,m), 3.63(2H,s), 6.96(1H,d), 7.98(1H,d).
B-3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.40(3H,s), 3.00-3.10(8H,m), 3.44(2H,m), 3.78(2H,s), 7.00(1H,d), 7.98(1H,d).
B-4	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.41(3H,s), 2.99(4H,m), 3.08(4H,m), 3.44(2H,m), 3.68(2H,s), 7.22(1H,s), 7.45(1H,m), 7.96(1H,d).

[0112]

化合物番号	$^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, 400\text{MHz}]$
C-1	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.26\text{--}2.68(17\text{H}, \text{m}), 3.31\text{--}3.53(4\text{H}, \text{m}), 7.04(1\text{H}, \text{s}), 7.83(1\text{H}, \text{s})$.
C-2	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 1.30(9\text{H}, \text{s}), 2.38\text{--}2.46(7\text{H}, \text{m}), 3.08\text{--}3.51(6\text{H}, \text{m}), 3.62(2\text{H}, \text{s}), 6.97(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$.
C-3	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.58(4\text{H}, \text{brs}), 3.39\text{--}3.62(4\text{H}, \text{m}), 3.67(2\text{H}, \text{s}), 6.99(1\text{H}, \text{d}), 7.99(1\text{H}, \text{d})$.
C-4	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.60(4\text{H}, \text{t}), 2.78(3\text{H}, \text{s}), 3.25(4\text{H}, \text{t}), 3.43(2\text{H}, \text{m}), 3.67(2\text{H}, \text{s}), 6.98(1\text{H}, \text{d}), 8.01(1\text{H}, \text{d})$.
C-5	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 1.38(3\text{H}, \text{t}), 2.39(3\text{H}, \text{s}), 2.56(4\text{H}, \text{t}), 2.95(2\text{H}, \text{q}), 3.32(4\text{H}, \text{t}), 3.43(2\text{H}, \text{m}), 3.66(2\text{H}, \text{s}), 6.98(1\text{H}, \text{d}), 8.01(1\text{H}, \text{d})$.
C-6	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.37(3\text{H}, \text{s}), 2.61(4\text{H}, \text{brs}), 3.47\text{--}3.60(6\text{H}, \text{m}), 3.71(2\text{H}, \text{m}), 7.31(1\text{H}, \text{d}), 8.05(1\text{H}, \text{d})$.
C-7	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.54(4\text{H}, \text{m}), 3.44(2\text{H}, \text{m}), 3.61(2\text{H}, \text{t}), 3.66(2\text{H}, \text{s}), 3.70(2\text{H}, \text{m}), 6.99(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$.
C-8	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.55(4\text{H}, \text{t}), 3.45(2\text{H}, \text{m}), 3.65\text{--}3.72(6\text{H}, \text{m}), 6.99(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$
C-9	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.55(4\text{H}, \text{m}), 3.44(2\text{H}, \text{m}), 3.64\text{--}3.75(6\text{H}, \text{m}), 6.99(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$
C-10	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.08(3\text{H}, \text{s}), 2.39\text{--}2.49(7\text{H}, \text{m}), 3.42\text{--}3.66(8\text{H}, \text{m}), 6.98(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$
C-11	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.52(4\text{H}, \text{m}), 3.44(2\text{H}, \text{m}), 3.61\text{--}3.67(6\text{H}, \text{m}), 6.09(1\text{H}, \text{t}), 6.99(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$
C-12	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.55(4\text{H}, \text{m}), 3.45(2\text{H}, \text{m}), 3.65\text{--}3.73(6\text{H}, \text{m}), 6.99(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$
C-13	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 0.75(2\text{H}, \text{m}), 0.97(2\text{H}, \text{m}), 1.72(1\text{H}, \text{m}), 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.43\text{--}2.57(4\text{H}, \text{m}), 3.45(2\text{H}, \text{m}), 3.59\text{--}3.73(6\text{H}, \text{m}), 6.98(1\text{H}, \text{d}), 8.01(1\text{H}, \text{d})$
C-14	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.36(3\text{H}, \text{s}), 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.51(4\text{H}, \text{m}), 3.41(2\text{H}, \text{m}), 3.54(2\text{H}, \text{m}), 3.68(4\text{H}, \text{m}), 7.08(1\text{H}, \text{s}), 7.83(1\text{H}, \text{s})$
C-15	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.40(3\text{H}, \text{s}), 2.55(4\text{H}, \text{m}), 3.44(2\text{H}, \text{m}), 3.64\text{--}3.75(6\text{H}, \text{m}), 6.99(1\text{H}, \text{d}), 8.00(1\text{H}, \text{d})$
C-16	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm} : 2.55(4\text{H}, \text{m}), 3.42(1\text{H}, \text{m}), 3.65\text{--}3.81(6\text{H}, \text{m}), 7.23(1\text{H}, \text{d}), 8.05(1\text{H}, \text{d})$

[0113]

化合物番号	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS,400MHz]
D-1	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.47-1.85(10H,m), 2.04(1H,m), 2.39(3H,s), 2.85(1H,m), 3.44(2H,m), 3.85(2H,s), 6.96(1H,d), 7.97(1H,d).
D-2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.39(3H,s), 3.44(2H,m), 3.88(2H,s), 3.90(2H,s), 6.97(1H,d), 7.47(2H,d), 7.59(2H,d), 8.00(1H,d).
D-3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.21(3H,s), 2.39(3H,s), 3.43(2H,m), 3.60(2H,s), 3.64(2H,s), 6.95(1H,d), 7.48(2H,d), 7.57(2H,d), 8.07(1H,d).
D-4	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.38(3H,s), 3.32(2H,m), 4.47(2H,m), 4.56(1H,t), 6.62(2H,d), 7.00(1H,d), 7.38(2H,d), 7.98 (1H,d).

[0114]

化合物番号	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS,400MHz]
E-1	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.38(3H,s), 3.41(2H,m), 4.73(2H,s), 7.28(1H,s), 7.43(1H,m), 7.88(1H,m).
E-2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.47(3H,s), 3.33(2H,q), 4.70(2H,d), 6.95(1H,d), 7.59(1H,d).
E-3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.40(3H,s), 3.46(2H,m), 4.78(2H,d), 6.95(1H,d), 8.10(1H,d).
E-4	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 1.02(3H,t), 1.63(2H,m), 2.18(1H,m), 2.37(3H,s), 2.82(2H,m), 4.68(2H,d), 6.88(1H,d), 7.34(1H,d).
E-5	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.38(3H,s), 2.78(1H,t), 3.45(2H,m), 4.81(2H,d), 7.27(1H,s), 8.15(1H,s).
E-6	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.31(3H,s), 2.44(3H,s), 3.36(2H,m), 4.66(2H,s), 7.05(1H,s), 7.49(1H,s).
E-7	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm : 2.34-2.38(6H,m), 2.89(1H,t), 3.42(2H,m), 4.71(2H,d), 7.05(1H,s), 7.98(1H,s).

[0115]

化合物番号	$^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , 400MHz]
F-1	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2.48 (3H, s), 3.46 (2H, m), 7.79 (1H, m), 7.99 (1H, m), 8.20 (1H, m), 10.08 (1H, s).
F-2	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2.54 (3H, s), 3.41 (2H, q), 7.09 (1H, d), 7.99 (1H, d), 10.28 (1H, s).
F-3	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2.50 (3H, s), 3.49 (2H, m), 7.14 (1H, d), 8.52 (1H, d), 10.34 (1H, s).
F-4	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 1.05 (3H, t), 1.69 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.91 (2H, t), 7.00 (1H, d), 7.69 (1H, d), 10.29 (1H, s).
F-5	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2.47 (3H, s), 3.49 (2H, m), 7.41 (1H, s), 8.55 (1H, s), 10.45 (1H, s).
F-6	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2.50 (3H, s), 2.62 (3H, s), 3.41 (2H, q), 7.15 (1H, s), 7.90 (1H, s), 10.20 (1H, s).
F-7	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2.45 (3H, s), 2.71 (3H, s), 3.46 (2H, m), 7.20 (1H, s), 8.41 (1H, s), 10.26 (1H, s).
F-8	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2.50 (3H, s), 3.47 (2H, q), 7.34 (1H, d), 7.97 (1H, s), 10.39 (1H, s).
F-9	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 3.59 (2H, m), 7.39 (1H, d), 8.53 (1H, d), 10.35 (1H, s)
F-10	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 3.48 (2H, m), 7.35 (1H, d), 8.07 (1H, d), 10.28 (1H, s)

[0116] 以下に若干の製剤例を挙げて、本発明の化合物を含有する製剤について具体的に説明するが、本発明の化合物、補助成分及びその添加量等は勿論以下の製剤例のみに限定されるものではない。なお、製剤例において部とあるのは全て質量部を表す。

[0117] 製剤例 1 乳剤

本発明の化合物 (10部)、N-メチル-2-ピロリドン (試薬) (10部)、キシレン (試薬) (70部)、ニューカルゲンD-230 (ポリオキシエチレンひまし油、竹本油脂株式会社) (10部) を均一に混合し溶解させて、乳剤を得た。

[0118] 製剤例 2 EW-1

本発明の化合物 (20部) とニューカルゲンD-230 (ポリオキシエチレンひまし油、竹本油脂株式会社) (15部) とを混合し、均一化させた後、攪拌しながら水 (59.8部) を徐々に加え、分散物を得た。この分散物をプロピレングリコール (試薬) (5.0部) に分散させた K E L Z A N (

キサンタンガム、三晶株式会社) (0.2部) を添加しエマルション製剤を得た。

[0119] 製剤例3 EW-2

本発明の化合物(10部)をキシレン(10部)に溶解させ、レオドール430V(テトラオレイン酸ポリオキシエチレンソルビット、花王株式会社)(24部)と混合し分散物を得た。この分散物と水(50.8部)とをホモジナイザーを用いて分散させ、プロピレングリコール(試薬)(5.0部)に分散させたKELZAN(キサンタンガム、三晶株式会社)(0.2部)を添加し、エマルション製剤を得た。

[0120] 製剤例4 マイクロエマルション

本発明の化合物(10部)、キシレン(試薬)(20部)、ニューカルゲンD-230(ポリオキシエチレンひまし油、竹本油脂株式会社)(20部)、エアロールCT-1L(ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、東邦化学工業株式会社)(2.0部)及び水(48部)を均一に混合させて、マイクロエマルションを得た。

[0121] 製剤例5 水溶剤

本発明の化合物(5部)、ルノックスP-65L(アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム、東邦化学工業株式会社)(3部)及び炭酸水素ナトリウム(試薬)(82部)を均一に混合した後に微粉碎機を用いて粉碎し、水溶剤を得た。

[0122] 製剤例6 液剤-1

本発明の化合物(20部)、N-メチル-2-ピロリドン(試薬)(70部)及びニューカルゲンD-230(ポリオキシエチレンひまし油、竹本油脂株式会社)(10部)を均一に混合し溶解させて、液剤を得た。

[0123] 製剤例7 液剤-2

本発明の化合物(0.5部)、N-メチル-2-ピロリドン(試薬)(30部)、ニューカルゲンD-230(ポリオキシエチレンひまし油、竹本油脂株式会社)(10部)及び水(59.5部)を均一に混合し溶解させて、液

剤を得た。

[0124] 製剤例 8 水和剤

本発明の化合物（20部）、トクシールGU-N（ホワイトカーボン、Oriental Silicas Corporation）（20部）、ソルポール5096（ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテルサルフェート、東邦化学工業株式会社）（10部）、及びSSクレー（クレー、昭和KDE株式会社）（50部）を混合した後、微粉砕機を用いて粉砕し、水和剤を得た。

[0125] 製剤例 9 顆粒水和剤

本発明の化合物（50部）、サンエクスP252（リグニンスルホン酸ナトリウム、日本製紙株式会社）（5部）、及びSSクレー（クレー、昭和KDE株式会社）（45部）を混合した後、微粉砕機を用いて粉砕し、粉砕物を得た。この粉砕物に水を加えてよく練り合わせた後、押し出し造粒し、乾燥整粒して顆粒水和剤を得た。

[0126] 製剤例 10 フロアブル剤

本発明の化合物（20部）、ソルポール7948（ポリオキシアルキレントリスチリルフェニルエーテル硫酸ナトリウム、東邦化学工業株式会社）（5部）、プロピレングリコール（試薬）（10部）、及び水（40部）を予め混合しておき、ビーズミルで湿式粉砕し、スラリーを得た。次にKELZAN（キサンタンガム、三晶株式会社）（0.2部）を水（24.8部）によく混合分散させゲル状物を作製し、粉砕したスラリーと十分に混合して、フロアブル剤を得た。

[0127] 製剤例 11 粒剤-1

本発明の化合物（5部）、エアロールCT-1L（ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、東邦化学工業株式会社）（2部）、ベントナイト佐渡（ベントナイト、クニミネ工業株式会社）（30部）、及びNK-300（クレー、昭和KDE株式会社）（63部）、を均一に混合し、水を加えてよく練り合わせた後、押し出し造粒し、乾燥整粒して粒剤を得た。

[0128] 製剤例 1 2 粒剤－2

本発明の化合物（5部）をメタノール（試薬）に溶解させ、石川ライト農2号（95部）に転動型造粒機を用いて吸着させ、乾燥し、粒剤を得た。

[0129] 製剤例 1 3 微粒剤－1

本発明の化合物（2部）をメタノール（試薬）に溶解させ、石川ライト 4号（98部）に転動型造粒機を用いて吸着させ、乾燥し、微粒剤を得た。

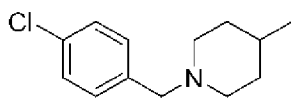
[0130] 製剤例 1 4 微粒剤－2

本発明の化合物（5部）及びトクシールGU-N（5部）を混合した後に微粉碎機を用いて粉碎し、飯豊珪砂（珪砂、JFEミネラル株式会社）（80部）と均一に混合した。この混合物に、トキサノンGR-31A（ポリカルボン酸型界面活性剤、三洋化成工業株式会社）（10部）を希釈した水溶液をスプレーしながら更に混合し、粒状組成物を得た。この粒状組成物を乾燥し、微粒剤を得た。

[0131] 製剤例 1 5 粉剤

本発明の化合物（5部）、トクシールGU-N（5部）及び大盛微粉クレー（クレー、大盛産業株式会社）（90部）を均一に混合した後に微粉碎機を用いて粉碎し、粉剤を得た。

[0132] 次に本発明の化合物の作用効果と有用性を、具体的実施例を挙げて説明する。比較対照に用いた化合物は下記の化合物記号で示す。



比較剤 A （US 2009/0082389 A1記載の13-24）

[0133] 試験例 1：ナミハダニ（*Tetranychus urticae* Koch）に対する殺成虫試験

水を入れた430ml容量のポリエチレンカップに、中央に穴（径約5mm）を開けた蓋をした。径6.5cmの円形の濾紙に、短冊状の濾紙片が形成されるように、幅5mm程度の切れ込みを入れ、下方に垂らした短冊状の濾紙片を蓋の穴からカップ内の水に浸るように差し込み、その濾紙の上に脱

脂綿をのせた。このようにして、カップ内の水が常時補給される状態にした脱脂綿上にいんげん初生葉から作成したリーフ・ディスク（2 cm×5 cm）を2枚のせ、そのリーフ・ディスクにナミハダニ雌成虫10頭を接種した。このカップを高さ50 cm、10 cm径のアクリル製円筒内に置き、製剤例1に準じて調製した乳剤の水希釈液（500 ppm）を1カップ当り2.0 ml、エアブラシを用いて散布した。散布後は25℃の恒温室内に保持した。処理4日後にビノキュラーの下で成虫の生死及び苦悶を調査し、苦悶虫を死として殺虫率（%）を求めた。なお、試験は各区1カップを供試して実施した。

殺虫率（%）＝（死亡幼虫数／供試幼虫数）×100

その結果、化合物番号A-1、A-2、A-3、A-4、A-5、A-6、A-7、A-8、A-9、A-10、A-11、A-13、A-14、A-15、A-16、B-1、B-2、B-3、C-1、C-2、C-3、C-4、C-5、C-6、C-7、D-1、D-2、D-3、D-4の本発明化合物は100%の殺虫率を示した。一方、比較剤Aは0%の殺虫率であった。

[0134] 試験例2：ナミハダニ（Tetranychus urticae Koch）に対する密度抑制試験

水を入れた430 ml容量のポリエチレンカップに、中央に穴（径約5 mm）を開けた蓋をした。径6.5 cmの円形の濾紙に、短冊状の濾紙片が形成されるように、幅5 mm程度の切れ込みを入れ、下方に垂らした短冊状の濾紙片を蓋の穴からカップ内の水に浸るように差し込み、その濾紙の上に脱脂綿をのせた。このようにして、カップ内の水が常時補給される状態にした脱脂綿上にいんげん初生葉から作成したリーフ・ディスク（2 cm×5 cm）を2枚のせ、そのリーフ・ディスクにナミハダニ雌成虫10頭を接種した。このカップを高さ50 cm、10 cm径のアクリル製円筒内に置き、製剤例1に準じて調製した乳剤の水希釈液（500 ppm）を1カップ当り2.0 ml、エアブラシを用いて散布した。散布後は25℃の恒温室内に保持した。処理7日後に成虫が産んだ卵に対する次世代密度抑制効果を100（密度

抑制率：100%）、95（同：99－95%）、80（同：94－80%）、50（同：79－50%）、0（同：50%未満）の5段階で評価し、その結果に基づいて下式にて次世代密度抑制率を算出した。なお、試験は各区1カップを供試して実施した。

次世代密度抑制率＝ $(A \times 100 + B \times 95 + C \times 80 + D \times 50) / (A + B + C + D + E)$

A：100のディスク数、B：95のディスク数、C：80のディスク数、D：50のディスク数、E：0のディスク数

その結果、化合物番号A－1、A－2、A－3、A－4、A－5、A－6、A－7、A－8、A－9、A－10、A－11、A－13、A－14、A－15、A－16、B－1、B－2、B－3、C－2、C－3、C－4、C－5、C－6、C－7、D－1、D－2、D－3、D－4の本発明化合物は100%の密度抑制率を示した。一方、比較剤Aは0%の密度抑制率であった。

[0135] 試験例3：ミカンハダニ (*Panonychus citri* McGregor) に対する殺成虫試験

水を入れた430ml容量のポリエチレンカップに、中央に穴（径約5mm）を開けた蓋をした。径6.5cmの円形の濾紙に、短冊状の濾紙片が形成されるように、幅5mm程度の切れ込みを入れ、下方に垂らした短冊状の濾紙片を蓋の穴からカップ内の水に浸るように差し込み、その濾紙の上に脱脂綿をのせた。このようにして、カップ内の水が常時補給される状態にした脱脂綿上にかんきつ完全展開葉から作成したリーフ・ディスク（2cm×5cm）を2枚のせ、そのリーフ・ディスクにミカンハダニ雌成虫10頭を接種した。このカップを高さ50cm、10cm径のアクリル製円筒内に置き、製剤例1に準じて調製した乳剤の水希釈液（500ppm）を1カップ当たり2.0ml、エアブラシを用いて散布した。散布後は25℃の恒温室内に保持した。処理4日後にビノキュラーの下で成虫の生死及び苦悶を調査し、苦悶虫を死として殺虫率（%）を求めた。なお、試験は各区1カップを供試して実施した。

殺虫率 (%) = (死亡幼虫数 / 供試幼虫数) × 100

その結果、化合物番号 A-1、A-2、A-3、A-4、A-5、A-6、A-7、A-8、A-10、A-11、A-13、A-14、A-15、A-16、B-1、B-2、B-3、C-1、C-2、C-3、C-4、C-5、C-6、C-7、D-1、D-3 の本発明化合物は 100% の殺虫率を示した。一方比較剤 A は 0% の殺虫率であった。

[0136] 試験例 4 : ミカンハダニ (Panonychus citri McGregor) に対する密度抑制試験

水を入れた 430 ml 容量のポリエチレンカップに、中央に穴 (径約 5 mm) を開けた蓋をした。径 6.5 cm の円形の濾紙に、短冊状の濾紙片が形成されるように、幅 5 mm 程度の切れ込みを入れ、下方に垂らした短冊状の濾紙片を蓋の穴からカップ内の水に浸るように差し込み、その濾紙の上に脱脂綿をのせた。このようにして、カップ内の水が常時補給される状態にした脱脂綿上にかんきつ完全展開葉から作成したリーフ・ディスク (2 cm × 5 cm) を 2 枚のせ、そのリーフ・ディスクにミカンハダニ雌成虫 10 頭を接種した。このカップを高さ 50 cm、10 cm 径のアクリル製円筒内に置き、製剤例 1 に準じて調製した乳剤の水希釈液 (500 ppm) を 1 カップ当り 2.0 ml、エアブラシを用いて散布した。散布後は 25℃ の恒温室内に保持した。処理 7 日後に成虫が産んだ卵に対する次世代密度抑制効果を 100 (密度抑制率: 100%)、95 (同: 99-95%)、80 (同: 94-80%)、50 (同: 79-50%)、0 (同: 50% 未満) の 5 段階で評価し、その結果に基づいて下式にて次世代密度抑制率を算出した。なお、試験は各区 1 カップを供試して実施した。

次世代密度抑制率 = (A × 100 + B × 95 + C × 80 + D × 50) / (A + B + C + D + E)

A : 100 のディスク数、B : 95 のディスク数、C : 80 のディスク数、D : 50 のディスク数、E : 0 のディスク数

その結果、化合物番号 A-1、A-2、A-3、A-4、A-5、A-6

、A-7、A-8、A-9、A-10、A-11、A-13、A-14、A-15、A-16、B-1、B-2、B-3、C-1、C-2、C-3、C-4、C-5、C-6、C-7、D-1、D-3、D-4の本発明化合物は100%の密度抑制率を示した。一方、比較剤Aは0%の密度抑制率であった。

[0137] 試験例5：サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita* (Kofoid et White) Chitwood) に対する効果試験

線虫密度を200頭/土壌20gに調整した供試土壌200mlをスチロールカップ（直径9cm、高さ6.5cm）に入れ、製剤例1に準じて調製した乳剤の水希釈液（100ppm）を50ml灌注処理した後、トマトを播種（13粒/ポット）した。播種後温室内で生育させた。播種14日目に各株の根こぶ程度を下記の評価基準に基づき5段階で調査し、下式に基づきネコブ指数、更に防除価を算出した。なお、試験は各区1ポットを供試して実施した。

根こぶ程度（評価基準）：0（根こぶ無い）、1（根こぶが1～2個である）、2（根こぶが3個以上ある）、3（大きな根こぶや繋がった根こぶがある。根全体の50%未満）、4（根全体の50%以上に根こぶがある）

根コブ指数 = Σ （根こぶ程度 × 当該株数） / （4 × 調査株数）

防除価（%） = $[1 - (\text{処理区の根コブ指数} / \text{無処理区の根コブ指数})] \times 100$

その結果、化合物番号A-3、A-7、A-8、A-10、B-1、B-2、B-3、C-3の本発明化合物は80%以上の防除価を示した。一方、比較剤Aは0%の防除価であった。

[0138] 試験例6：タバココナジラミ（バイオタイプB） (*Bemisia tabaci*, Biotype -B) に対する殺卵幼虫試験

水を入れた430ml容量のポリエチレンカップに、中央に穴（径約5mm）を開けた蓋をした。径6.5cmの円形の濾紙に、短冊状の濾紙片が形成されるように、幅5mm程度の切れ込みを入れ、下方に垂らした短冊状の

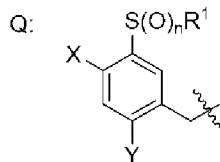
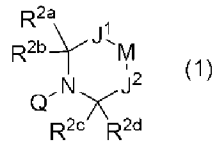
濾紙片を蓋の穴からカップ内の水に浸るように差し込み、その濾紙の上に脱脂綿をのせた。このようにして、カップ内の水が常時補給される状態にした脱脂綿上に産卵させたいんげん初生葉からディスク当たり10卵程度となるように切り抜いたリーフ・ディスク(2cm×2cm)を3枚のせた。なお、産卵はタバココナジラミが発生している温室内にポット植えのいんげんを24時間保持する方法で行った。このカップを高さ50cm、10cm径のアクリル製円筒内に置き、製剤例1に準じて調製した乳剤の水希釈液(500ppm)を1カップ当たり2.0ml、エアブラシを用いて散布した。散布後は25℃の恒温室内に保持した。処理14日後にビノキュラーの下で未孵化卵数、孵化した幼虫の状態を生存、苦悶(歩行不可能な状態)、死亡の3に分け観察した。観察結果に基づき、殺卵+幼虫率(%)を計算した。なお、試験は各区1カップを供試して実施した。

殺卵+幼虫率(%) = (未孵化卵数+異常幼虫数+死亡幼虫数) / 供試卵数 × 100

その結果、化合物番号A-3、A-6、C-2、C-7、C-8、C-9、C-12、C-14、C-15、C-16、D-1、D-3の本発明化合物は90%以上の殺卵+幼虫率を示した。一方、比較剤Aは0%の殺卵+幼虫率であった。

請求の範囲

[請求項1] 下式(1)、



[式中、

R¹は、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₆アルキル基又はC₃₋₆ハロシクロアルキルC₁₋₆アルキル基を示し、

nは、0~2の整数を示し、

Xは、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₃₋₆ハロシクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルコキシメチル基、ホルミル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}及びR^{2d}は、それぞれ同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

J¹は、直接結合、-C R^{3a} R^{3b}-又は-C R^{3a} R^{3b}-C R^{3c} R^{3d}-を示し、

J²は、直接結合又は-C R^{3e}R^{3f}-を示し、

R^{3a}、R^{3b}、R^{3c}、R^{3d}、R^{3e}及びR^{3f}は、それぞれ同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

Mは、-C R^{4a}R^{4b}-、-N R⁵-、-O-、-S-、-S(O)-又は-S(O)₂-を示し、

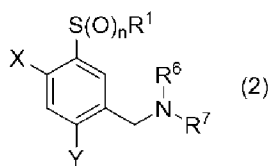
R^{4a}及びR^{4b}は、それぞれ同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、シアノ基又はC₁₋₆アルコキシカルボニル基を示し、

R⁵は、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆ハロアルキルカルボニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基又はC₁₋₆ハロアルキルスルホニル基を示す。]

で表される1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキッド又はその塩。

[請求項2]

下式(2)、



[式中、

R¹は、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₆アルキル基又はC₃₋₆ハロシクロアルキルC₁₋₆アルキル基を示し、

nは、0~2の整数を示し、

Xは、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、

C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₃₋₆ハロシクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルコキシメチル基、ホルミル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

R⁶及びR⁷は、同一又は異なっても良く、水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、シアノ基、シアノC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、R⁸で1個以上置換されていてもよいフェニル基、C₁₋₃アルキルフェニル基（このときフェニル基は、R⁹で1個以上置換されていてもよい）又はR¹⁰で1個以上置換されていてもよいC₃₋₆シクロアルキル基を示し、

R⁸は、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

R⁹は、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示し、

R¹⁰は、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示す。]

で表される1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩。

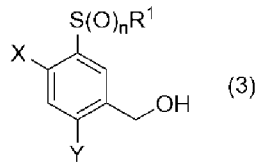
[請求項3] R¹が、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示す、請求項1～2に記載の1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩。

[請求項4] Xが、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、ハロゲン原子又はシアノ基を示す、請求項1～2に記載の1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩。

[請求項5] nが、1を示す、請求項1～4のいずれか1項に記載の1-ベンジル

アミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩。

[請求項6] 下式(3)、



[式中、

R¹は、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₆アルキル基又はC₃₋₆ハロシクロアルキルC₁₋₆アルキル基を示し、

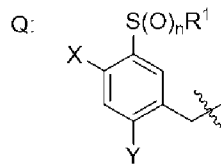
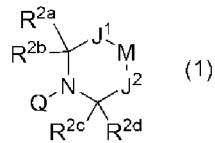
nは、0～2の整数を示し、

Xは、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₃₋₆シクロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₂₋₆ハロアルケニル基、C₂₋₆ハロアルキニル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₃₋₆ハロシクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルコキシメチル基、ホルミル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基又はC₁₋₆ハロアルキル基を示す。]

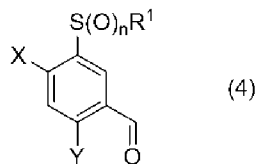
で表される1-ベンジルアルコール誘導体。

[請求項7] 下式(1)、

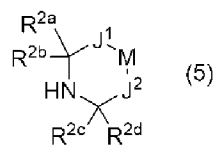


[式中、X、Y、n、R¹、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、M、J¹及びJ²は、請求項1で定義した通りである。]

で表される1-ベンジルアミン誘導体の製造方法であって、
下式(4)、



[式中、X、Y、n及びR¹は、請求項1で定義した通りである。]
で表されるベンズアルデヒド誘導体と、
下式(5)、



[式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、M、J¹及びJ²は、請求項1で定義した通りである。]

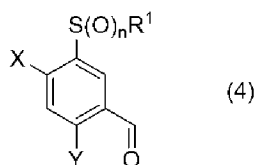
で表されるアミン類又はその塩と、を反応させることを含む、製造方法。

[請求項8] 下式(2)、

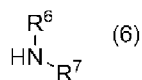


[式中、X、Y、n、R¹、R⁶及びR⁷は、請求項2で定義した通りである。]

で表される1-ベンジルアミン誘導体の製造方法であって、
下式(4)、

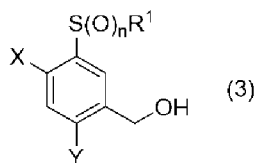


[式中、X、Y、n及びR¹は、請求項2で定義した通りである。]
で表されるベンズアルデヒド誘導体と、
下式(6)、



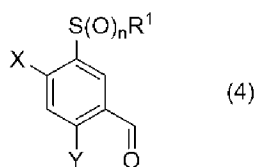
[式中、R⁶及びR⁷は、請求項2で定義した通りである。]
で表されるアミン類又はその塩と、を反応させることを含む、製造方法。

[請求項9] 下式(3)、



[式中、X、Y、n及びR¹は、請求項6で定義した通りである。]

で表される 1-ベンジルアルコール誘導体の製造方法であって、
下式 (4)、

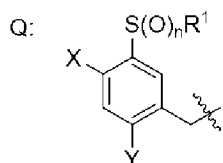
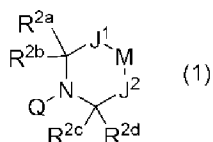


[式中、X、Y、n及びR¹は、請求項1で定義した通りである。]

で表されるベンズアルデヒド誘導体と、

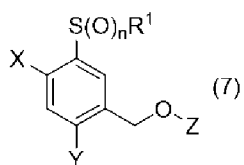
NaBH₄、NaBH(OAc)₃又はNaBH₃CNと、を反応させることを含む、製造方法。

[請求項10] 下式(1)、



[式中、X、Y、n、R¹、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、M、J¹及びJ²は、請求項1で定義した通りである。]

で表される 1-ベンジルアミン誘導体の製造方法であって、
下式(7)、



[式中、

R^1 は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} ハロアルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{2-6} ハロアルキニル基、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-6} アルキル基又は C_{3-6} ハロシクロアルキル C_{1-6} アルキル基を示し、

n は、0～2の整数を示し、

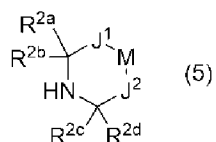
X は、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{3-6} シクロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{2-6} ハロアルケニル基、 C_{2-6} ハロアルキニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{3-6} ハロシクロアルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシメチル基、ホルミル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し、

Y は、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基又は C_{1-6} ハロアルキル基を示し、

Z は、メタンスルホニル基又はトリフルオロメタンスルホニル基を示す。]

で表される化合物と、

下式 (5)、

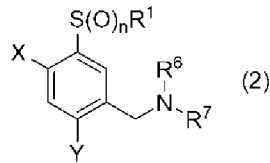


[式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、 M 、 J^1 及び J^2 は、請求項1で定義した通りである。]

で表されるアミン類又はその塩と、を反応させることを含む、製造方法。

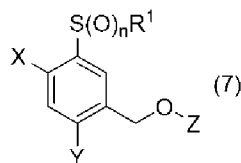
[請求項11]

下式(2)、



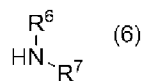
[式中、X、Y、n、R¹、R⁶及びR⁷は、請求項2で定義した通りである。]

で表される1-ベンジルアミン誘導体の製造方法であって、
下式(7)、



[式中、R¹、n、X、Y及びZは、請求項10で定義した通りである。]

で表される化合物と、
下式(6)、



[式中、R⁶及びR⁷は、請求項2で定義した通りである。]

で表されるアミン類又はその塩と、を反応させることを含む、製造方法。

[請求項12] 請求項1～5のいずれか1項に記載の1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩を含有する農園芸用薬剤。

[請求項13] 請求項1～5のいずれか1項に記載の1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩を含有する農園芸用ダニ防除剤。

[請求項14] 請求項1～5のいずれか1項に記載の1-ベンジルアミン誘導体、そ

のN-オキシド又はその塩を含有する農園芸用線虫防除剤。

[請求項15] 請求項1～5のいずれか1項に記載の1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩を含有する農園芸用害虫防除剤。

[請求項16] 請求項1～5のいずれか1項に記載の1-ベンジルアミン誘導体、そのN-オキシド又はその塩を含有する農園芸用病害防止剤。

[請求項17] 有害生物及び／又はそれらの生息環境及び／又は種子及び／又は植物繁殖材料を、請求項12に記載の農園芸用薬剤で処理する工程を含む、植物の有害生物を防除する方法。

[請求項18] 有用作物を生育させようとする場所、あるいは生育させている場所、もしくは生育している作物を、請求項12に記載の農園芸用薬剤で処理する工程を含む、植物の有害生物を防除する方法。

[請求項19] 農薬組成物を調製する方法であって、請求項12に記載の農園芸用薬剤に、増量剤及び／又は界面活性剤を混合する工程を含む、農薬組成物の調製方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2020/023191

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl. C07D211/14(2006.01)i, A01N41/10(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01N43/60(2006.01)i, A01N43/84(2006.01)i, A01P5/00(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, C07C315/04(2006.01)i, C07C317/22(2006.01)i, C07C317/32(2006.01)i, C07C319/20(2006.01)i, C07C321/28(2006.01)i, C07D211/18(2006.01)i, C07D211/62(2006.01)i, C07D295/092(2006.01)i
 FI: C07D211/14CSP, C07D211/18, C07D211/62, C07D295/092, C07C317/32, C07C315/04, C07C317/22, C07C321/28, C07C319/20, A01P7/02, A01P5/00, A01N43/40101P, A01N43/60, A01N41/10A, A01N43/84101, A01N43/84102

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl. C07D211/14, A01N41/10, A01N43/40, A01N43/60, A01N43/84, A01P5/00, A01P7/02, C07C315/04, C07C317/22, C07C317/32, C07C319/20, C07C321/28, C07D211/18, C07D211/62, C07D295/092

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

Published examined utility model applications of Japan	1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan	1971-2020
Registered utility model specifications of Japan	1996-2020
Published registered utility model applications of Japan	1994-2020

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

CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	WO 89/04297 A1 (WARNER-LAMBERT COMPANY) 18.05.1989 (1989-05-18), page 23, line 5 to page 26, line 14	2, 3 1, 4-19
X Y A	JP 2011-514894 A (RENOVIS, INC.) 12.05.2011 (2011-05-12), paragraphs [0395]-[0399]	2-4, 6 9 1, 5, 7, 8, 10-19



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

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

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

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

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

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

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

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

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

“&” document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

28.07.2020

Date of mailing of the international search report

11.08.2020

Name and mailing address of the ISA/

Japan Patent Office
 3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
 Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2020/023191

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y A	JP 2017-521456 A (GLAXOSMITHKLINE INTELLECTUAL PROPERTY DEVELOPMENT LIMITED) 03.08.2017 (2017-08- 03), paragraph [0348]	6, 9 9 1-5, 7, 8, 10- 19
X Y A	JP 2015-519380 A (F HOFFMANN-LA ROCHE AG) 09.07.2015 (2015-07-09), paragraph [0280]	6 9 1-5, 7, 8, 10- 19
X Y A	JP 10-316647 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 02.12.1998 (1998-12-02), paragraph [0127]	6 9 1-5, 7, 8, 10- 19
X Y A	JP 2019-510787 A (IMMUNE SENSOR LIMITED LIABILITY COMPANY) 18.04.2019 (2019-04-18), paragraph [0547]	6 9 1-5, 7, 8, 10- 19
X Y A	JP 2005-536510 A (VICURON PHARMACEUTICALS, INC.) 02.12.2005 (2005-12-02), paragraph [0778]	6 9 1-5, 7, 8, 10- 19
X Y A	BROTIN, T. et al., J. Org. Chem., 2005, vol. 70, pp. 6187-6195, table 1	6 9 1-5, 7, 8, 10- 19
A	JP 2014-1199 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) 09.01.2014 (2014-01-09), claims	1-19
A	JP 2011-42611 A (NIPPON SODA CO., LTD.) 03.03.2011 (2011-03-03), claims	1-19
A	JP 2013-28588 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) 07.02.2013 (2013-02-07), claims	1-19
A	JP 2015-36377 A (HOKKO CHEM IND CO., LTD.) 23.02.2015 (2015-02-23), claims	1-19

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No.

PCT/JP2020/023191

WO 89/04297 A1 18.05.1989 US 4980366 A
column 14, line 10 to column 16,
line 35

JP 2011-514894 A 12.05.2011 US 2015/0266822 A1
paragraphs [0682]-[0686]
US 2011/0065681 A1
CN 104058999 A
CN 104016907 A
CN 101981003 A
CA 2715835 A1

JP 2017-521456 A 03.08.2017 US 2017/0204109 A1
paragraphs [1592]-[1594]
US 2019/0023715 A1
US 2020/0055863 A1
WO 2016/011930 A1
WO 2016/011931 A1
CA 2955910 A1
CN 106536521 A
CN 106536525 A
KR 10-2017-0029516 A
CA 2970537 A1

JP 2015-519380 A 09.07.2015 US 2015/0099734 A1
paragraph [0460]
US 2017/0029425 A1
WO 2013/186159 A1
CA 2872213 A1
CN 104364239 A
KR 10-2015-0023373 A

JP 10-316647 A 02.12.1998 (Family: none)

JP 2019-510787 A 18.04.2019 US 2018/0230115 A1
paragraph [0832]
WO 2017/176812 A1
CA 3020161 A
CN 109475565 A

JP 2005-536510 A 02.12.2005 US 2008/0058304 A1
paragraph [0887]
WO 2004/007444 A2
CA 2492035 A1
KR 10-1011373 B1

JP 2014-1199 A 09.01.2014 WO 2013/111864 A1
claims

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/JP2020/023191

JP 2011-42611 A	03.03.2011	(Family: none)
JP 2013-28588 A	07.02.2013	WO 2012/176856 A2 claims
JP 2015-36377 A	23.02.2015	(Family: none)

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC）） C07D 211/14(2006.01)i; A01N 41/10(2006.01)i; A01N 43/40(2006.01)i; A01N 43/60(2006.01)i; A01N 43/84(2006.01)i; A01P 5/00(2006.01)i; A01P 7/02(2006.01)i; C07C 315/04(2006.01)i; C07C 317/22(2006.01)i; C07C 317/32(2006.01)i; C07C 319/20(2006.01)i; C07C 321/28(2006.01)i; C07D 211/18(2006.01)i; C07D 211/62(2006.01)i; C07D 295/092(2006.01)i FI: C07D211/14 CSP; C07D211/18; C07D211/62; C07D295/092; C07C317/32; C07C315/04; C07C317/22; C07C321/28; C07C319/20; A01P7/02; A01P5/00; A01N43/40 101P; A01N43/60; A01N41/10 A; A01N43/84 101; A01N43/84 102																				
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC）） C07D211/14; A01N41/10; A01N43/40; A01N43/60; A01N43/84; A01P5/00; A01P7/02; C07C315/04; C07C317/22; C07C317/32; C07C319/20; C07C321/28; C07D211/18; C07D211/62; C07D295/092 最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの <table border="0"> <tr> <td>日本国実用新案公報</td> <td>1922-1996年</td> </tr> <tr> <td>日本国公開実用新案公報</td> <td>1971-2020年</td> </tr> <tr> <td>日本国実用新案登録公報</td> <td>1996-2020年</td> </tr> <tr> <td>日本国登録実用新案公報</td> <td>1994-2020年</td> </tr> </table> 国際調査で利用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語） CAplus/REGISTRY (STN)			日本国実用新案公報	1922-1996年	日本国公開実用新案公報	1971-2020年	日本国実用新案登録公報	1996-2020年	日本国登録実用新案公報	1994-2020年										
日本国実用新案公報	1922-1996年																			
日本国公開実用新案公報	1971-2020年																			
日本国実用新案登録公報	1996-2020年																			
日本国登録実用新案公報	1994-2020年																			
C. 関連すると認められる文献 <table border="1"> <thead> <tr> <th>引用文献の カテゴリー*</th> <th>引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示</th> <th>関連する 請求項の番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>X</td> <td>WO 89/04297 A1 (WARNER-LAMBERT COMPANY) 18.05.1989 (1989 - 05 - 18) 第 2 3 頁第 5 行 - 第 2 6 頁第 1 4 行</td> <td>2, 3</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td></td> <td>1, 4-19</td> </tr> <tr> <td>X</td> <td>JP 2011-514894 A (レノビス, インコーポレイテッド) 12.05.2011 (2011 - 05 - 12) [0395]-[0399]</td> <td>2-4, 6</td> </tr> <tr> <td>Y</td> <td>[0395]-[0399]</td> <td>9</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td></td> <td>1, 5, 7, 8, 10-19</td> </tr> </tbody> </table>			引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号	X	WO 89/04297 A1 (WARNER-LAMBERT COMPANY) 18.05.1989 (1989 - 05 - 18) 第 2 3 頁第 5 行 - 第 2 6 頁第 1 4 行	2, 3	A		1, 4-19	X	JP 2011-514894 A (レノビス, インコーポレイテッド) 12.05.2011 (2011 - 05 - 12) [0395]-[0399]	2-4, 6	Y	[0395]-[0399]	9	A		1, 5, 7, 8, 10-19
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号																		
X	WO 89/04297 A1 (WARNER-LAMBERT COMPANY) 18.05.1989 (1989 - 05 - 18) 第 2 3 頁第 5 行 - 第 2 6 頁第 1 4 行	2, 3																		
A		1, 4-19																		
X	JP 2011-514894 A (レノビス, インコーポレイテッド) 12.05.2011 (2011 - 05 - 12) [0395]-[0399]	2-4, 6																		
Y	[0395]-[0399]	9																		
A		1, 5, 7, 8, 10-19																		
☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。 ☒ パテントファミリーに関する別紙を参照。																				
<table border="0"> <tr> <td>* 引用文献のカテゴリー</td> <td>"T" 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と抵触するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの</td> </tr> <tr> <td>"A" 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの</td> <td>"X" 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの</td> </tr> <tr> <td>"E" 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの</td> <td>"Y" 特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの</td> </tr> <tr> <td>"L" 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）</td> <td>"&" 同一パテントファミリー文献</td> </tr> <tr> <td>"O" 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献</td> <td></td> </tr> <tr> <td>"P" 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献</td> <td></td> </tr> </table>			* 引用文献のカテゴリー	"T" 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と抵触するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの	"A" 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの	"X" 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの	"E" 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの	"Y" 特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの	"L" 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）	"&" 同一パテントファミリー文献	"O" 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献		"P" 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献							
* 引用文献のカテゴリー	"T" 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と抵触するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの																			
"A" 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの	"X" 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの																			
"E" 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの	"Y" 特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの																			
"L" 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）	"&" 同一パテントファミリー文献																			
"O" 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献																				
"P" 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献																				
国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日																			
28.07.2020	11.08.2020																			
名称及びあて先	権限のある職員（特許庁審査官）																			
日本国特許庁(ISA/JP) 〒100-8915 日本国 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	松澤 優子 4P 3036 電話番号 03-3581-1101 内線 3492																			

C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	JP 2017-521456 A (グラクソスミスクライン、インテレクチュアル、プロパティ、 ディベロップメント、リミテッド) 03.08.2017 (2017 - 08 - 03)	6, 9
Y	[0348]	9
A	[0348]	1-5, 7, 8, 10-19
X	JP 2015-519380 A (エフ・ホフマン・ラ ロシュ アーゲー) 09.07.2015 (2015 - 07 - 09)	6
Y	[0280]	9
A	[0280]	1-5, 7, 8, 10-19
X	JP 10-316647 A (藤沢薬品工業株式会社) 02.12.1998 (1998 - 12 - 02)	6
Y	[0127]	9
A	[0127]	1-5, 7, 8, 10-19
X	JP 2019-510787 A (イミューン センサー リミテッド ライアビリティ カンパニー) 18.04.2019 (2019 - 04 - 18)	6
Y	[0547]	9
A	[0547]	1-5, 7, 8, 10-19
X	JP 2005-536510 A (ヴァイキュロン ファーマシューティカルズ, インコーポレイ テッド) 02.12.2005 (2005 - 12 - 02)	6
Y	[0778]	9
A	[0778]	1-5, 7, 8, 10-19
X	BROTIN, T. et al., J.Org.Chem., 2005, Vol. 70, pp. 6187-6195	6
Y	TABLE 1	9
A	TABLE 1	1-5, 7, 8, 10-19
A	JP 2014-1199 A (石原産業株式会社) 09.01.2014 (2014 - 01 - 09) 特許請求の範囲	1-19
A	JP 2011-42611 A (日本曹達株式会社) 03.03.2011 (2011 - 03 - 03) 特許請求の範囲	1-19
A	JP 2013-28588 A (石原産業株式会社) 07.02.2013 (2013 - 02 - 07) 特許請求の範囲	1-19
A	JP 2015-36377 A (北興化学工業株式会社) 23.02.2015 (2015 - 02 - 23) 特許請求の範囲	1-19

国際調査報告
 パテントファミリーに関する情報

国際出願番号

PCT/JP2020/023191

引用文献			公表日	パテントファミリー文献			公表日
WO	89/04297	A1	18.05.1989	US	4980366	A	
				第14欄第10行-第16 欄第35行			
JP	2011-514894	A	12.05.2011	US	2015/0266822	A1	
				[0682]-[0686]			
				US	2011/0065681	A1	
				CN	104058999	A	
				CN	104016907	A	
				CN	101981003	A	
				CA	2715835	A1	
JP	2017-521456	A	03.08.2017	US	2017/0204109	A1	
				[1592]-[1594]			
				US	2019/0023715	A1	
				US	2020/0055863	A1	
				WO	2016/011930	A1	
				WO	2016/011931	A1	
				CA	2955910	A1	
				CN	106536521	A	
				CN	106536525	A	
				KR	10-2017-0029516	A	
				CA	2970537	A1	
JP	2015-519380	A	09.07.2015	US	2015/0099734	A1	
				[0460]			
				US	2017/0029425	A1	
				WO	2013/186159	A1	
				CA	2872213	A1	
				CN	104364239	A	
				KR	10-2015-0023373	A	
JP	10-316647	A	02.12.1998	(ファミリーなし)			
JP	2019-510787	A	18.04.2019	US	2018/0230115	A1	
				[0832]			
				WO	2017/176812	A1	
				CA	3020161	A	
				CN	109475565	A	
JP	2005-536510	A	02.12.2005	US	2008/0058304	A1	
				[0887]			
				WO	2004/007444	A2	
				CA	2492035	A1	
				KR	10-1011373	B1	
JP	2014-1199	A	09.01.2014	WO	2013/111864	A1	
				請求の範囲			
JP	2011-42611	A	03.03.2011	(ファミリーなし)			
JP	2013-28588	A	07.02.2013	WO	2012/176856	A2	
				claims			
JP	2015-36377	A	23.02.2015	(ファミリーなし)			