

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2015 年 10 月 1 日(01.10.2015)



(10) 国際公開番号

WO 2015/147022 A1

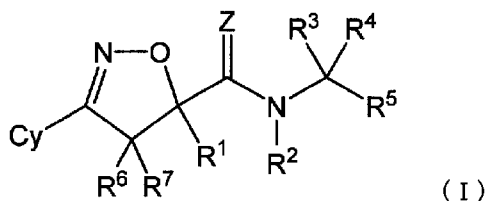
- (51) 国際特許分類:
C07D 413/04 (2006.01) A61K 31/444 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01) A61K 31/506 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01) A61P 33/14 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2015/059029
- (22) 国際出願日: 2015 年 3 月 25 日(25.03.2015)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2014-065460 2014 年 3 月 27 日(27.03.2014) JP
- (71) 出願人: 日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1008165 東京都千代田区大手町二丁目 2 番 1 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 古川 裕紀(FURUKAWA Hironori); 〒2500280 神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 花井大輔(HANAI Daisuke); 〒4210412 静岡県牧之原市坂部 6 2 - 1 日本曹達株式会社 小田原研究所 榛原フィールドリサーチセンター内 Shizuoka (JP).
- (74) 代理人: 志賀 正武, 外(SHIGA Masatake et al.); 〒1006620 東京都千代田区丸の内一丁目 9 番 2 号 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, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

(54) Title: ISOXAZOLIN-5-CARBOXAMIDE COMPOUND AND PESTICIDE

(54) 発明の名称: イソオキサゾリン-5-カルボキサミド化合物および有害生物防除剤



(57) Abstract: An isoxazolin-5-carboxamide compound represented by formula (I) or a salt thereof, and a pesticide, miticide, or insecticide containing at least one selected from these compounds. In formula (I), Cy indicates a pyridyl group or the like having no substituents or having 1-4 substituents X. Substituent X indicates a halogeno group, optionally substituted alkyl group, or the like. R¹, R³, and R⁴ each independently indicate an optionally substituted alkyl group or the like. R², R⁶, and R⁷ indicate a hydrogen atom or the like. R⁵ indicates an optionally substituted alkyl group, optionally substituted pyridyl group, or the like.

(57) 要約: 式 (I) で表されるイソオキサゾリン-5-カルボキサミド化合物またはその塩、および前記化合物から選ばれる少なくとも一つを含有してなる有害生物防除剤、殺ダニ剤または殺虫剤。式 (I) 中、Cy は無置換のもしくは置換基 X を 1 ~ 4 個有するピリジル基などを示す。置換基 X はハロゲノ基や無置換のもしくは置換基を有するアルキル基などを示す。R¹、R³ および R⁴ はそれぞれ独立に無置換のもしくは置換基を有するアルキル基などを示す。R²、R⁶、および R⁷ は、水素原子などを示す。R⁵ は無置換のもしくは置換基を有するアルキル基や無置換のもしくは置換基を有するピリジル基などを示す。



WO 2015/147022 A1

明 細 書

発明の名称：

イソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物および有害生物防除剤

技術分野

[0001] 本発明は、イソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物および有害生物防除剤に関する。より詳細に、本発明は、優れた殺ダニ活性および／または殺虫活性を有し、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物、ならびにこれを有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

本願は、２０１４年３月２７日に、日本に出願された特願２０１４－０６５４６０号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

背景技術

[0002] 本発明の化合物に構造上関連する化合物として、特許文献１に３－フェニルイソオキサゾリンー５－カルボキサミド類が開示されている。これらの化合物は、除草活性および殺菌活性を有する。

先行技術文献

特許文献

[0003] 特許文献１：WO 2012／130798A

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 本発明の課題は、有害生物防除活性、その中でも特に殺ダニ活性および／または殺虫活性に優れ、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物またはその塩を提供すること、ならびにこれを有効成分として含有する有害生物防除剤を提供することである。

課題を解決するための手段

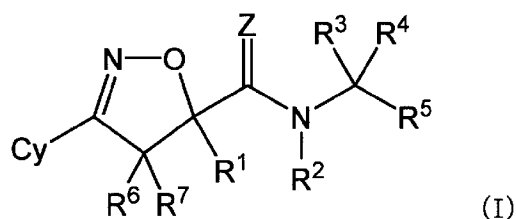
[0005] 本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意検討した結果、特定の構造を有するイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物またはその塩は、有害生物防除剤の有効成分として、優れた殺ダニ活性および／または殺虫活性を有し、且つ良好な特性と高い安全性を示すことを見出した。

本発明は、これらの知見に基づいて完成するに至った。

[0006] すなわち、本発明は、以下のものを含む。

〔１〕 式（Ｉ）で表されるイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物またはその塩。

[0007] [化1]



[0008] 式（Ｉ）中、

Cyは、無置換のもしくは置換基Xを１～４個有するヘテロアリール基を示す。置換基Xを２個以上有するときXは互いに同一でも異なってもよい。

置換基Xは、ハロゲノ基、無置換のもしくは置換基を有するC１～６アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC２～６アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC２～６アルキニル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC１～６アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するアミノ基、無置換のもしくは置換基を有するC１～７アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC１～６アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するC１～６アルキルチオ基、無置換のもしくは置換基を有するC１～６アルキルスルフィニル基、無置換のもしくは置換基を有するC１～６アルキルスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC１～６アルコキシスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC３～８シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC６～１０アリール基、無置換のもし

くは置換基を有するヘテロアリール基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

R¹は、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基を示す。

[0009] Zは、酸素原子または硫黄原子を示す。

R²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

R³およびR⁴は、それぞれ独立に、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、またはシアノ基を示す。ここで、R³とR⁴は相互に繋がってR³およびR⁴が結合する炭素原子とともに環を形成してもよい。

[0010] R⁵は、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～7 アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するアミノカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するヒドロキシイミノC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 6～10 アリール基、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、またはシアノ基を示す。

R⁶およびR⁷は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基を示す。

[0011] [2] 式 (I) 中のC_yが、無置換のもしくは置換基Xを1～4個有するピリジル基である、[1]に記載のイソオキサゾリン-5-カルボキサミド化

合物またはその塩。

〔３〕 前記〔１〕または〔２〕に記載のイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物またはその塩から選ばれる少なくとも１つを有効成分として含有する有害生物防除剤。

〔４〕 前記〔１〕または〔２〕に記載のイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物またはその塩から選ばれる少なくとも１つを有効成分として含有する殺ダニ剤または殺虫剤。

発明の効果

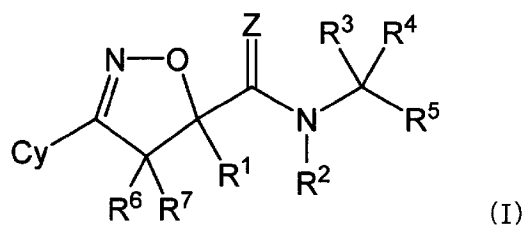
[0012] 本発明のイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物またはその塩は、農作物や衛生面で問題となる有害生物を防除することができる。特にダニ類および害虫を効果的に防除することができる。

発明を実施するための形態

[0013] 〔イソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物〕

本発明のイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物は、式（Ⅰ）で表される化合物（以下、化合物（Ⅰ）と表記することがある。）である。

[0014] [化2]



[0015] まず、本発明において、「無置換の」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。「置換基を有する」との記載がなく母核となる基の名称のみで記載しているときは、別段の断りがない限り「無置換の」の意味である。

一方、「置換基を有する」の用語は、母核となる基のいずれかの水素原子が、母核と同一または異なる構造の基で置換されていることを意味する。従って、「置換基」は、母核となる基に結合した他の基である。置換基は１個

であってもよいし、2個以上であってもよい。2個以上の置換基は同一であってもよいし、異なるものであってもよい。

「C 1～6」などの用語は、母核となる基の炭素原子数が1～6個などであることを表している。この炭素原子数には、置換基の中に在る炭素原子の数を含まない。例えば、置換基としてエトキシ基を有するブチル基は、C 2 アルコキシC 4 アルキル基に分類する。

[0016] 「置換基」は化学的に許容され、本発明の効果を有する限りにおいて特に制限されない。

「置換基」となり得る基としては、具体的には以下の基を挙げることができる。

フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などのハロゲノ基；

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、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基などのC 1～6 アルキル基；

シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基などのC 3～8シクロアルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などのC 2～6 アルケニル基；

[0017] 2-シクロプロペニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロヘキセニル基、4-シクロオクテニル基などのC 3～8シクロアルケニル基；

エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-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、2-メチル-3-

ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などのC 2～6 アルキニル基；

フェニル基、ナフチル基などのC 6～10 アリール基；

ベンジル基、フェネチル基などのC 7～11 アラルキル基；

ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などの5員環のヘテロアリール基；

ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；

インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、キノキサリニル基などの縮合環のヘテロアリール基；

[0018] 水酸基； オキシ基；

メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、s-ブトキシ基、i-ブトキシ基、t-ブトキシ基などのC 1～6 アルコキシ基；

ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのC 2～6 アルケニルオキシ基；

エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのC 2～6 アルキニルオキシ基；

フェノキシ基、1-ナフトキシ基などのC 6～10 アリールオキシ基；

ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC 7～11 アラルキルオキシ基；

オキシラニル基、テトラヒドロフリル基、ジオキサラニル基、ジオキラニル基などの環状エーテル基；

[0019] ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基、シクロヘキシルカルボニル基などのC 1～7 アシル基；

ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、シクロヘキシルカルボニルオキシ基などのC 1～7 アシルオキシ基；

メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基などのC 1～6 アルコキシカルボニル基；

カルボキシ基；

[0020] クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1, 2-ジクロロ-n-プロピル基、1-フルオロ-n-ブチル基、パーフルオロ-n-ペンチル基などのC 1～6 ハロアルキル基；

2-クロロ-1-プロペニル基、2-フルオロ-1-ブテニル基などのC 2～6 ハロアルケニル基；

4, 4-ジクロロ-1-ブチニル基、4-フルオロ-1-ペンチニル基、5-ブロモ-2-ペンチニル基などのC 2～6 ハロアルキニル基；

2-クロロ-n-プロポキシ基、2, 3-ジクロロブトキシ基などのC 1～6 ハロアルコキシ基；

2-クロロプロペニルオキシ基、3-ブロモブテニルオキシ基などのC 2～6 ハロアルケニルオキシ基；

4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基などのC 6～10 ハロアリール基；

4-フルオロフェニルオキシ基、4-クロロ-1-ナフトキシ基などのC 6～10 ハロアリールオキシ基；

クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのC 1～7 ハロアシル基；

[0021] シアノ基； ニトロ基； アミノ基；

メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのC 1～6 アルキルアミノ基；

アニリノ基、ナフチルアミノ基などのC 6～10 アリールアミノ基；

ベンジルアミノ基、フェニルエチルアミノ基などのC 7～11 アラルキルアミノ基；

アジリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基などの環状アミノ基；

ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチリルアミノ基、*i*-プロピルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などのC 1～7 アシルアミノ基；

メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、*n*-プロポキシカルボニルアミノ基、*i*-プロポキシカルボニルアミノ基などのC 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基；

[0022] アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、*N*-フェニル-*N*-メチルアミノカルボニル基などの無置換のもしくは置換基を有するアミノカルボニル基；

イミノメチル基、(1-イミノ)エチル基、(1-イミノ)-*n*-プロピル基などのイミノC 1～6 アルキル基；

ヒドロキシイミノメチル基、(1-ヒドロキシイミノ)エチル基、(1-ヒドロキシイミノ)プロピル基などのヒドロキシイミノC 1～6 アルキル基；メトキシイミノメチル基、(1-メトキシイミノ)エチル基；

[0023] メルカプト基；

メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*i*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*i*-ブチルチオ基、*s*-ブチルチオ基、*t*-ブチルチオ基などのC 1～6 アルキルチオ基；

ビニルチオ基、アリルチオ基などのC 2～6 アルケニルチオ基；

エチニルチオ基、プロパルギルチオ基などのC 2～6 アルキニルチオ基；

フェニルチオ基、ナフチルチオ基などのC 6～10 アリールチオ基；

チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などのヘテロアリールチオ基；

ベンジルチオ基、フェネチルチオ基などのC 7～11 アラルキルチオ基；

(メチルチオ)カルボニル基、(エチルチオ)カルボニル基、(*n*-プロ

ピルチオ)カルボニル基、(i-プロピルチオ)カルボニル基、(n-ブチルチオ)カルボニル基、(i-ブチルチオ)カルボニル基、(s-ブチルチオ)カルボニル基、(t-ブチルチオ)カルボニル基などの(C1~6アルキルチオ)カルボニル基；

[0024] メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、t-ブチルスルフィニル基などのC1~6アルキルスルフィニル基；

アリルスルフィニル基などのC2~6アルケニルスルフィニル基；

プロパルギルスルフィニル基などのC2~6アルキニルスルフィニル基；

フェニルスルフィニル基などのC6~10アリールスルフィニル基；

チアゾリルスルフィニル基、ピリジルスルフィニル基などのヘテロアリールスルフィニル基；

ベンジルスルフィニル基、フェネチルスルフィニル基などのC7~11アラールキルスルフィニル基；

メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基などのC1~6アルキルスルホニル基；

アリルスルホニル基などのC2~6アルケニルスルホニル基；

プロパルギルスルホニル基などのC2~6アルキニルスルホニル基；

フェニルスルホニル基などのC6~10アリールスルホニル基；

チアゾリルスルホニル基、ピリジルスルホニル基などのヘテロアリールスルホニル基；

ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基などのC7~11アラールキルスルホニル基；

[0025] トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、t-ブチルジメチルシリル基などのトリC1~6アルキルシリル基；

トリフェニルシリル基などのトリC6~10アリールシリル基；

S, S-ジメチルスルホキシイミノ基など置換基を有するスルホキシイミノ基；

また、これらの「置換基」は、前記置換基中のいずれかの水素原子が、異

なる構造の基で置換されていてもよい。

[0026] [C_y]

式 (I) 中、C_yは、無置換のもしくは置換基Xを1～4個有するヘテロアリール基を示す。置換基Xを2個以上有するときXは互いに同一でも異なってもよい。

「ヘテロアリール基」は、環を構成する原子として炭素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる1～4個の複素原子を含む5～10員のアリール基であることが好ましい。ヘテロアリール基は、単環および多環のいずれであってもよい。多環ヘテロアリール基は、少なくとも一個の環がヘテロアリールであれば、残りの環が飽和脂環、不飽和脂環または芳香環のいずれであってもよい。

[0027] 「ヘテロアリール基」としては、前記の「置換基」で例示した5員環のヘテロアリール基、6員環のヘテロアリール基、縮合環のヘテロアリール基などを挙げることができる。これらのうち、ヘテロアリール基としては、ピリジル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、キノキサリニル基であることが好ましい。

特に、本発明においては、C_yがピリジル基である化合物がより好ましい。

[0028] [置換基X]

置換基Xは、ハロゲン基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC₂～6アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC₂～6アルキニル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するアミノ基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～7アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルキルチオ基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルキルスルフィニル基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6

アルキルスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6アルコキシスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

[0029] Xにおける「ハロゲノ基」としては、フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などを挙げることができる。これらのうち、ブロモ基が好ましい。

[0030] Xにおける「C 1～6アルキル基」は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。アルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、i-プロピル基、i-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、i-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、2,2-ジメチルプロピル基、i-ヘキシル基などを挙げることができる。

[0031] 「置換基を有するC 1～6アルキル基」としては、

フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、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、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、3,3,3-トリフルオロプロピル基、2,2,2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル基、パーフロロヘキシル基、パークロロヘキシル基、2,4,6-トリクロロヘキシル基などのC 1～6ハロアルキル基；

シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、2-シクロオクチルエチル基などのC 3～8シクロアルキルC 1～6アルキル基；

[0032] ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基などのヒドロキシC 1～6アルキル基；

メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メトキシ-n-プロピル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、

n-プロポキシメチル基、i-プロポキシエチル基、s-ブトキシメチル基、t-ブトキシエチル基などのC1～6アルコキシC1～6アルキル基；

ビニルオキシメチル基、アリルオキシメチル基、プロペニルオキシメチル基、ブテニルオキシメチル基などのC2～6アルケニルオキシC1～6アルキル基；

フェノキシメチル基などのC6～10アリールオキシC1～6アルキル基；

ピリジン-2-イルオキシメチル基などのヘテロアリールオキシC1～6アルキル基；

ホルミルメチル基、アセチルメチル基、プロピオニルメチル基などのC1～7アシルC1～6アルキル基；

ホルミルオキシメチル基、アセトキシメチル基、2-アセトキシエチル基、プロピオニルオキシメチル基、プロピオニルオキシエチル基などのC1～7アシルオキシC1～6アルキル基；

カルボキシルメチル基、カルボキシルエチル基などのカルボキシルC1～6アルキル基；

[0033] メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、n-プロポキシカルボニルメチル基、i-プロポキシカルボニルメチル基などのC1～6アルコキシカルボニルC1～6アルキル基；

ホルムアミドメチル基、アセトアミドメチル基、2-アセトアミドエチル基、プロピオニルアミノメチル基、プロピオニルアミノエチル基などのC1～7アシルアミノC1～6アルキル基；

メチルアミノカルボニルメチル基、エチルアミノカルボニルメチル基、i-プロピルアミノカルボニルメチル基、t-ブチルアミノカルボニルメチル基、s-ブチルアミノカルボニルメチル基、n-ペンチルアミノカルボニルメチル基などのC1～6アルキルアミノカルボニルC1～6アルキル基；

メトキシカルボニルアミノメチル基、エトキシカルボニルアミノメチル基、i-プロポキシカルボニルアミノメチル基、t-ブトキシカルボニルアミ

ノメチル基、s-ブチルオキシカルボニルアミノメチル基、n-ペンチルオキシカルボニルアミノメチル基などのC 1～6アルコキシカルボニルアミノC 1～6アルキル基；

ベンジル基、フェネチル基などのC 7～11アラルキル基；

ベンゾイルアミノメチル基などのC 6～10アリアルカルボニルアミノC 1～6アルキル基；

などを挙げることができる。

[0034] Xにおける「C 2～6アルケニル基」としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などを挙げるすることができる。

「置換基を有するC 2～6アルケニル基」としては、2-クロロ-1-プロペニル基、2-フルオロ-1-ブテニル基などのC 2～6ハロアルケニル基などを挙げるすることができる。

[0035] Xにおける「C 2～6アルキニル基」としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-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、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などを挙げるすることができる。

「置換基を有するC 2～6アルキニル基」としては、4, 4-ジクロロ-1-ブチニル基、4-フルオロ-1-ペンチニル基、5-ブロモ-2-ペンチニル基などのC 2～6ハロアルキニル基などを挙げるすることができる。

[0036] Xにおける「C 1～6アルコキシ基」としては、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシ

ルオキシ基、i-プロポキシ基、i-ブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、i-ヘキシルオキシ基などを挙げることができる。これらのうち、メトキシ基が好ましい。

「置換基を有するC 1～6 アルコキシ基」としては、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、1-フルオロエトキシ基、1, 1-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基などのC 1～6 ハロアルコキシ基などを挙げることができる。

[0037] Xにおける「置換基を有するアミノ基」としては、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのC 1～6 アルキル置換アミノ基を挙げることができる。

[0038] Xにおける「C 1～7 アシル基」としては、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基などを挙げることができる。

「置換基を有するC 1～7 アシル基」としては、クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのC 1～7 ハロアシル基などを挙げることができる。

[0039] Xにおける「C 1～6 アルコキシカルボニル基」としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基などを挙げることができる。

「置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基」としては、

シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、2-メチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2, 3-ジメチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-クロロシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-シクロプロピルエトキシカルボニル基などのC 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルコキシカルボニル基；

[0040] フルオロメトキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、ブロモメトキシカルボニル基、ジフルオロメトキシカルボニル基、ジクロロメトキシ

カルボニル基、ジブロモメトキシカルボニル基、トリフルオロメトキシカルボニル基、トリクロロメトキシカルボニル基、トリブロモメトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル基、ペンタフルオロエトキシカルボニル基、4-フルオロブトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエトキシカルボニル基、パーフロロヘキシルオキシカルボニル基などのC 1～6ハロアルコキシカルボニル基；

などを挙げることができる。

[0041] Xにおける「C 1～6アルキルチオ基」は、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基、i-プロピルチオ基などを挙げることができる。

「置換基を有するC 1～6アルキルチオ基」としては、トリフルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基などのC 1～6ハロアルキルチオ基などを挙げることができる。

[0042] Xにおける「C 1～6アルキルスルフィニル基」は、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基などを挙げることができる。

「置換基を有するC 1～6アルキルスルフィニル基」としては、トリフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル基などのC 1～6ハロアルキルスルフィニル基などを挙げることができる。

[0043] Xにおける「C 1～6アルキルスルホニル基」としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基などを挙げることができる。

「置換基を有するC 1～6アルキルスルホニル基」としては、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル基などのC 1～6ハロアルキルスルホニル基などを挙げることができる。

[0044] Xにおける「C 1～6アルコキシスルホニル基」としては、メトキシスルホニル基、エトキシスルホニル基、t-ブトキシスルホニル基などを挙げる

ことができる。

[0045] Xにおける「C 3～8シクロアルキル基」としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基などを挙げることができる。

[0046] Xにおける「C 6～10アリール基」としては、フェニル基、ナフチル基、アズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げるすることができる。

[0047] Xにおける「ヘテロアリール基」としては、前記C yにおいて例示したそれらと同じものを挙げることができる。

[0048] Xにおける「C 6～10アリール基」および「ヘテロアリール基」上の置換基としては、

フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などのハロゲノ基；

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、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基などのC 1～6アルキル基；

クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1, 2-ジクロロ-n-プロピル基、1-フルオロ-n-ブチル基、パーフルオロ-n-ペンチル基などのC 1～6ハロアルキル基；

ニトロ基、シアノ基；

などを挙げることができる。

[0049] 好ましい置換基Xとしては、ハロゲノ基、C 1～6アルキル基、C 1～6ハロアルキル基、C 3～8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 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 1～6アルキルチオ基、C 1～6ハロアルキルチオ基、C 1～6アルキルスルフィニル基、C 1～6アルキルスルホニル基、C 6～10アリール基、ヘテロアリール基、またはシアノ基を挙げるすることができる。これらのうち、ハロゲノ基、C 1～6アルコキシ基、およびシアノ基がより好ましい。

[0050] [R¹]

式 (I) 中、 R^1 は、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基を示す。

[0051] R^1 における「C 1～6 アルキル基」、「C 2～6 アルケニル基」、および「C 2～6 アルキニル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げることができる。

R^1 としては、C 1～6 アルキル基またはC 1～6 ハロアルキル基が好ましい。

[0052] [Z]

式 (I) 中、Zは、酸素原子または硫黄原子を示す。Zとしては、酸素原子および硫黄原子が好ましい。

[0053] [R^2]

式 (I) 中、 R^2 は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

[0054] R^2 における「C 1～6 アルキル基」、「C 2～6 アルケニル基」、「C 2～6 アルキニル基」、「C 1～7 アシル基」、および「C 1～6 アルコキシカルボニル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げるすることができる。

R^2 としては、水素原子が好ましい。

[0055] [R^3 、 R^4]

式 (I) 中、 R^3 および R^4 は、それぞれ独立に、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、またはシアノ基を示す。ここで、 R^3 と R^4 は相互に繋がってそれらが結合する炭素原子とともに環を形成してもよい。

[0056] R^3 および R^4 における「C 1～6 アルキル基」、「C 2～6 アルケニル基」、および「C 2～6 アルキニル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げることができる。

R^3 および R^4 としては、それぞれC 1～6 アルキル基が好ましい。

[0057] R^3 と R^4 が相互に繋がってそれらが結合する炭素原子とともに形成する「環」としては、シクロプロパン環、シクロブタン環、シクロペンタン環、シクロヘキサン環、オキシラン環などを挙げるすることができる。

[0058] [R^5]

式 (I) 中、 R^5 は、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～7 アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するアミノカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するヒドロキシイミノC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 6～10 アリール基、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、またはシアノ基を示す。

[0059] R^5 における、「C 1～6 アルキル基」、「C 2～6 アルケニル基」、「C 2～6 アルキニル基」、「C 1～7 アシル基」、「C 1～6 アルコキシカルボニル基」、および「C 3～8 シクロアルキル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げるすることができる。

[0060] R^5 における「置換基を有するアミノカルボニル基」としては、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基などの無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキルアミノカルボニル基；などを挙げるすることができる。

R^5 における「ヒドロキシイミノC 1～6 アルキル基」としては、ヒドロキシイミノメチル基、(1-ヒドロキシイミノ)エチル基、(1-ヒドロキシイミノ)プロピル基などを挙げるすることができる。

「置換基を有するヒドロキシミノC 1～6アルキル基」としては、メトキシミノメチル基、（1－メトキシミノ）エチル基、（1－メトキシミノ）プロピル基、エトキシミノメチル基、（1－エトキシミノ）エチル基、（1－エトキシミノ）プロピル基などのC 1～6アルコキシミノC 1～6アルキル基；（1－シクロプロピルメトキシミノ）エチル基などのC 3～8シクロアルキルC 1～6アルコキシミノC 1～6アルキル基；ベンジルオキシミノメチル基、（1－ベンジルオキシミノ）エチル基などのC 7～11アラルキルオキシミノC 1～6アルキル基；などを挙げることができる。

[0061] R⁵における「C 6～10アリール基」としては、フェニル基、ナフチル基、アズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げるすることができる。

R⁵における「ヘテロアリール基」としては、ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などの5員環のヘテロアリール基；

ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；

インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、キノキサリニル基などの縮合環のヘテロアリール基；などを挙げることができる。

これらのうち、R⁵における「ヘテロアリール基」としては、ピリジル基およびピリミジニル基が好ましい。

[0062] R⁵における、前記アリール基および前記ヘテロアリール基上の置換基（以下「置換基X^a」ということがある。）としては、以下の置換基を挙げるることができる。

アミノ基；メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのC 1～6アルキルアミノ基；

アジリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基などの環状アミノ基；

ヒドラジノ基；N-メチルヒドラジノ基、N, N'-ジメチルヒドラジノ基などのC 1～6アルキルヒドラジノ基；

メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、i-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、s-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基などのC 1～6アルキルチオ基；

[0063] トリフルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基などのC 1～6ハロアルキルチオ基；

メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、t-ブチルスルフィニル基などのC 1～6アルキルスルフィニル基；

メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、i-プロピルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基などのC 1～6アルキルスルホニル基；

S, S'-ジメチルスルホキシイミノ基など置換基を有するスルホキシイミノ基；

[0064] フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などのハロゲノ基；

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、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基などのC 1～6アルキル基；

シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基などのC 3～8シクロアルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-

ーヘキセニル基、5ーヘキセニル基などのC 2～6アルケニル基；

[0065] 2ーシクロプロペニル基、2ーシクロペンテニル基、3ーシクロヘキセニル基、4ーシクロオクテニル基などのC 3～8シクロアルケニル基；

エチニル基、1ープロピニル基、2ープロピニル基、1ーブチニル基、2ーブチニル基、3ーブチニル基、1ーメチルー2ープロピニル基、2ーメチルー3ーブチニル基、1ーペンチニル基、2ーペンチニル基、3ーペンチニル基、4ーペンチニル基、1ーメチルー2ーブチニル基、2ーメチルー3ーペンチニル基、1ーヘキシニル基、1, 1ージメチルー2ーブチニル基などのC 2～6アルキニル基；

フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリール基；

ベンジル基、フェネチル基などのC 7～11アラルキル基；

ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などの5員環のヘテロアリール基；

ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員環のヘテロアリール基；

インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、キノキサリニル基などの縮合環のヘテロアリール基；

[0066] 水酸基； オキシ基；

メトキシ基、エトキシ基、nープロポキシ基、iープロポキシ基、nーブトキシ基、sーブトキシ基、iーブトキシ基、tーブトキシ基などのC 1～6アルコキシ基；

ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのC 2～6アルケニルオキシ基；

エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのC 2～6アルキニルオキシ基；

フェノキシ基、1-ナフトキシ基などのC₆~10アリールオキシ基；

ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC₇~11アラルキルオキシ基；

オキシラニル基、テトラヒドロフリル基、ジオキサラニル基、ジオキラニル基などの環状エーテル基；

[0067] ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基、シクロヘキシルカルボニル基などのC₁~7アシル基；

ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、シクロヘキシルカルボニルオキシ基などのC₁~7アシルオキシ基；

メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基などのC₁~6アルコキシカルボニル基；

カルボキシ基；

[0068] クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1, 2-ジクロロ-n-プロピル基、1-フルオロ-n-ブチル基、パーフルオロ-n-ペンチル基などのC₁~6ハロアルキル基；

2-クロロ-n-プロポキシ基、2, 3-ジクロロブトキシ基などのC₁~6ハロアルコキシ基；

クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのC₁~7ハロアシル基；

[0069] シアノ基； ニトロ基；

アニリノ基、ナフチルアミノ基などのC₆~10アリールアミノ基；

ベンジルアミノ基、フェニルエチルアミノ基などのC₇~11アラルキルアミノ基；

ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチリルアミノ基、i-プロピルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などのC₁~7アシルアミノ基；

メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、*n*-プロポキシカルボニルアミノ基、*i*-プロポキシカルボニルアミノ基などのC 1～6アルコキシカルボニルアミノ基；

[0070] アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、*N*-フェニル-*N*-メチルアミノカルボニル基などの無置換のもしくは置換基を有するアミノカルボニル基；

メルカプト基；

トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、*t*-ブチルジメチルシリル基などのトリC 1～6アルキル置換シリル基；

トリフェニルシリル基；

[0071] ここで、好ましい置換基 X^a としては、ハロゲン基、C 1～6アルキル基、C 1～6ハロアルキル基、C 3～8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 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 1～6アルキルチオ基、C 1～6ハロアルキルチオ基、C 1～6アルキルスルフィニル基、C 1～6アルキルスルホニル基、置換基を有するスルホキシイミノ基、C 6～10アリール基、ヘテロアリール基、またはシアノ基を挙げることができる。これらのうち、C 1～6ハロアルコキシ基、C 1～6アルキルチオ基、C 1～6アルキルスルホニル基、置換基を有するスルホキシイミノ基、およびC 6～10アリール基がより好ましい。

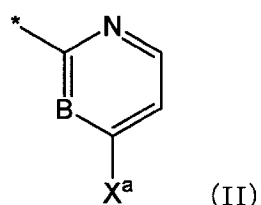
置換基を有するスルホキシイミノ基の置換基としては、C 1～6アルキル基、C 2～6アルケニル基、C 2～6アルキニル基、C 3～8シクロアルキル基を挙げることができる。これらのうち、C 1～6アルキル基が好ましい。

[0072] 好ましい R^5 としては、C 1～6ハロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 6～10アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基を挙げることができる。これらのうち、C 1～6ハロアルキル基および無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基がより好ましい。

前記アリール基および前記ヘテロアリール基は、置換基を1～4個有することが好ましい。置換基を2個以上有するとき置換基は互いに同一でも異なってもよい。

[0073] 好ましい R^5 の具体例としては、下記の式(II)で表される基を挙げることができる。

[0074] [化3]



[0075] 式(II)中、Bは炭素原子または窒素原子を示す。*は R^5 としての結合位置を示す。

X^a は、 R^5 における前記アリール基および前記ヘテロアリール基上の置換基(以下「置換基 X^a 」ということがある。)を示す。

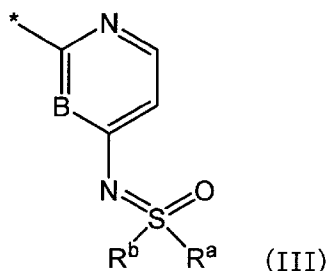
好ましい X^a としては、ハロゲノ基、C1～6アルキル基、C1～6ハロアルキル基、C3～8シクロアルキル基、C2～6アルケニル基、C2～6アルキニル基、C1～6アルコキシ基、C1～6ハロアルコキシ基、C1～6アルキルチオ基、C1～6ハロアルキルチオ基、C1～6アルキルスルフィニル基、C1～6アルキルスルホニル基、置換基を有するスルホキシイミノ基、C6～10アリール基、ヘテロアリール基、またはシアノ基を挙げることができる。これらのうち、C1～6ハロアルコキシ基、C1～6アルキルチオ基、C1～6アルキルスルホニル基、置換基を有するスルホキシイミノ基、およびC6～10アリール基がより好ましい。

置換基を有するスルホキシイミノ基の置換基としては、C1～6アルキル基、C2～6アルケニル基、C2～6アルキニル基、C3～8シクロアルキル基を挙げることができる。これらのうち、C1～6アルキル基が好ましい。

[0076] 特に好ましい R^5 の具体例としては、下記の式(III)で表される基を挙げ

ることができる。

[0077] [化4]



[0078] 式 (III) 中、Bは炭素原子または窒素原子を示す。これらのうち、窒素原子が好ましい。＊はR⁵としての結合位置を示す。

R^aおよびR^bは、それぞれ独立に、C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニル基、C 2～6 アルキニル基、またはC 3～8シクロアルキル基を示す。これらのうち、C 1～6 アルキル基が好ましい。

[0079] [R⁶、R⁷]

R⁶およびR⁷は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲノ基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基を示す。

R⁶およびR⁷における、「ハロゲノ基」および「C 1～6 アルキル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げるることができる。

R⁶およびR⁷としては、水素原子が好ましい。

[0080] 化合物 (I) は、公知の手法によって得ることができる。たとえば、実施例に記載のようなスキームに従って合成することができる。

[0081] [イソオキサゾリンー5ーカルボキサミド化合物の塩]

本発明のイソオキサゾリンー5ーカルボキサミド化合物の塩は、化合物 (I) の塩である。塩としては、農園芸学的に許容される塩であれば、特に制限されない。例えば、塩酸、硫酸などの無機酸の塩； 酢酸、乳酸などの有機酸の塩； リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属の塩； カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属の塩； 鉄、銅などの遷移金属の塩； アンモニア、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ヒドラジンなどの有機塩基の塩などを挙げるることができる。イソオキサゾ

リンー５－カルボキサミド化合物の塩は、化合物（I）から公知の手法によって得ることができる。

[0082] [有害生物防除剤、殺ダニ剤もしくは殺虫剤]

本発明のイソオキサゾリンー５－カルボキサミド化合物またはその塩（以下「本発明化合物」ということがある。）は、植物の生育に影響する各種のダニ類などの有害生物の防除効果に優れている。また、薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低いため、安全性の高い化合物である。そのため、殺ダニ剤の有効成分として有用である。

さらに、近年は、殺ダニ剤抵抗性系統のダニ類の出現が問題となっている。本発明化合物は感受性系統のみならず、殺ダニ剤抵抗性系統のダニ類にも優れた防除効果を示す化合物である。

本発明の有害生物防除剤の処理の対象となる植物としては、穀物類、野菜類、根菜類、イモ類、樹木類、牧草類、芝類などを挙げることができる。その場合、これら植物類の各部位を対象として処理することもできる。植物類の各部位としては、葉、茎、柄、花、蕾、果実、種子、スプラウト、根、塊茎、塊根、苗条、挿し木などを挙げることができる。また、これら植物類の改良品種・変種、栽培品種、さらには突然変異体、ハイブリッド体、遺伝子組み換え体（GMO）を対象として処理することもできる。

[0083] 本発明の有害生物防除剤は、各種のダニ類および農業害虫を防除するために、種子処理、茎葉散布、土壌施用、水面施用などに使用することができる。

[0084] 本発明の有害生物防除剤によって防除可能な各種のダニ類の具体例を以下に示す。

（１）ダニ類（Acar i）

（A）無気門目（Astigmata）のコナダニ類（Acaridida）

（a）コナダニ科（Acaridae）のダニ、例えば、リゾギルホス属種（*Rhizoglyphus* spp.）の、ネダニ（*Rhizoglyphus echinopus*）、ロビンネダニ（*Rhizoglyphus robini*）； 例えば、ケナガコナダニ属種（*Tyrophagus* spp.）の、オン

シツケナガコナダニ(*Tyrophagus neiswanderi*)、オオケナガコナダニ(*Tyrophagus perniciosus*)、ケナガコナダニ(*Tyrophagus putrescentiae*)、ハウレンソウケナガコナダニ(*Tyrophagus similis*) ; その他、アシフトコナダニ (*Acarus siro*)、ムギコナダニ (*Aleuroglyphus ovatus*)、ニセケナガコナダニ (*Mycetoglyphus fungivorus*) ;

[0085] (B) 前気門目 (Prostigmata) のケダニ類 (Actinedida)

(a) ハダニ科 (Tetranychidae) のダニ、例えば、ブリオビア属種 (*Bryobia* spp.) の、クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*)、ニセクローバーハダニ (*Bryobia rubrioculus*) ; 例えば、エオテトラニクス属種 (*Eotetranychus* spp.) の、コウノシロハダニ (*Eotetranychus asiaticus*)、アンズハダニ (*Eotetranychus boreus*)、エノキハダニ (*Eotetranychus celtis*)、ミチノクハダニ (*Eotetranychus geniculatus*)、ミヤケハダニ (*Eotetranychus kankitus*)、クリハダニ (*Eotetranychus pruni*)、シイノキハダニ (*Eotetranychus shii*)、スミスハダニ (*Eotetranychus smithi*)、スギナミハダニ (*Eotetranychus suginamensis*)、クルミハダニ (*Eotetranychus uncatus*) ; 例えば、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.) の、スギノハダニ (*Oligonychus hondoensis*)、チビコブハダニ (*Oligonychus ilicis*)、カラマツハダニ (*Oligonychus karamatus*)、マンゴーハダニ (*Oligonychus mangiferus*)、サトウキビハダニ (*Oligonychus orthius*)、アボガドハダニ (*Oligonychus perseae*)、エゾスギハダニ (*Oligonychus pustulosus*)、イネハダニ (*Oligonychus shinkajii*)、トドマツハダニ (*Oligonychus ununguis*) ; 例えば、パノニクス属種 (*Panonychus* spp.) の、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、クワオオハダニ (*Panonychus mori*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*) ; 例えば、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.) の、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、アシノワハダニ (*Tetranychus ludeni*)、ミズナラハダニ (*Tetranychus quercivorus*)、サガミハダニ (*Tetranychus phaselus*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*) ; 例えば、アポニクス属

(*Aponychus* spp.) の、イトマキハダニ (*Aponychus corpuzae*)、タイリクハダニ (*Aponychus firmianae*) ; 例え、ミドリハダニ属 (*Sasanychus* spp.) の、ミドリハダニ (*Sasanychus akitanus*)、ヒメミドリハダニ (*Sasanychus pusillus*) ; 例え、シゾテトラニクス属 (*Shizotetranychus* spp.) の、タケスゴモリハダニ (*Shizotetranychus celarius*)、ケナガスゴモリハダニ (*Shizotetranychus longus*)、ススキスゴモリハダニ (*Shizotetranychus miscanthi*)、ヒメササハダニ (*Shizotetranychus recki*)、ヤナギハダニ (*Shizotetranychus schizopus*) ; その他、カタバミハダニ (*Tetranychus china harti*)、ナミケナガハダニ (*Tuckerella pavoniformis*)、ケウスハダニ (*Yezonychus sapporensis*) ;

[0086] (b) ヒメハダニ科 (*Tenuipalpidae*) のダニ、例え、ブレビパルプス属種 (*Brevipalpus* spp.) の、ブドウヒメハダニ (*Brevipalpus lewisi*)、チャノヒメハダニ (*Brevipalpus obovatus*)、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*)、サボテンヒメハダニ (*Brevipalpus russulus*) ; 例え、テナリパルプス属種 (*Tenuipalpus* spp.) の、ランヒメハダニ (*Tenuipalpus pacificus*)、カキヒメハダニ (*Tenuipalpus zhizhilashviliae*) ; その他、パイナップルヒメハダニ (*Dolichotetranychus floridanus*) ;

(c) フシダニ科 (*Eriophyidae*) のダニ、例え、アセリア属種 (*Aceria* spp.) の、カキサビダニ (*Aceria diospyri*)、イチジクモンサビダニ (*Aceria ficus*)、クリフシダニ (*Aceria japonica*)、クコフシダニ (*Aceria kuko*)、カーネーションサビダニ (*Aceria paradianthi*)、クコハモグリダニ (*Aceria tiyingi*)、チューリップサビダニ (*Aceria tulipae*)、シバハマキフシダニ (*Aceria zoysiea*) ; 例え、エリオフィエス属種 (*Eriophyes* spp.) の、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、ウメフシダニ (*Eriophyes emarginatae*) ; 例えアクロプス属種 (*Aculops* spp.) の、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*) ; 例え、アクルス属種 (*Aculus* spp.) の、モモサビダニ (*Aculus fockeui*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*) ; その他、チャノナガサビダニ (*Acaph*

ylla theavagrans)、チャノサビダニ (Calacarus carinatus)、ブドウハモグリダニ (Colomerus vitis)、ブドウサビダニ (Calepitrimerus vitis)、ナシサビダニ (Epitrimerus pyri)、キンモクサビダニ (Paraphytoptus kik us)、マキサビダニ (Paracalacarus podocarpi)、リュウキュウミカンサビダニ (Phyllocotruta citri) ;

(d) ホコリダニ科 (Transonemidae) のダニ、例えば、タルソネムス属種 (Tarsonemus spp.) の、スジブトホコリダニ (Tarsonemus bilobatus)、アシボソホコリダニ (Tarsonemus waitei) ; その他、シクラメンホコリダニ (Phytonemus pallidus)、チャノホコリダニ (Polyphagotarsonemus latus) ;

(e) ハシリダニ科 (Penthaleidae) のダニ、例えば、ペントレウス属種 (Penthaleus spp.) の、ハクサイダニ (Penthaleus erythrocephalus)、ムギダニ (Penthaleus major) ;

[0087] 本発明の有害生物防除剤によって防除可能な各種の農業害虫は、鱗翅目 (Lepidoptera) のチョウまたは蛾、アザミウマ目 (Thysanoptera) 害虫、カメムシ目 (Hemiptera) の害虫、カブトムシ亜目 (Polyphaga) の害虫、ハエ目 (Diptera) の害虫、バッタ目 (Orthoptera) の害虫を挙げることができる。

[0088] 本発明の有害生物防除剤は、殺菌剤、殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤などの他の有効成分 ; 植物調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料などと混用または併用してもよい。

本発明化合物と他の有効成分の組合せは、殺虫・殺ダニ活性に関して相乗効果が期待できる。相乗効果は、定法に従ってコルビーの式 (Colby, S. R. ; Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations ; Weeds 15, 20-22頁, 1967) により確認することができる。

[0089] 本発明の有害生物防除剤と混用または併用することができる、殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、駆虫剤などの具体例を以下に示す。

[0090] (1) アセチルコリンエステラーゼ阻害剤 :

(a) カーバメート系 : アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、

カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキサール、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ；フェノチオカルブ、MIPC、MPMC、MTMC、アルドキシカルブ、アリキシカルブ、アミノカルブ、ブフェンカルブ、クロエトカルブ、メタム・ナトリウム、プロメカルブ；

[0091] (b) 有機リン系： アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソカルボホス、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン-メチル、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリンホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン； プロモホス・エチル、BRP、カルボフェノチオン、シアノフェンホス、CYAP、ジメトン-S-メチルスルホン、ジアリホス、ジクロフェンチオン、ジオキサベンゾホス、エトリムホス、フェンスルホチオン、フルピラゾホス、ホノホス、ホルモチオン、ホスメチラン、イサゾホス、ヨードフェンホス、メタクリホス、ピリミホス-エチル、ホスホカルブ、プロパホス、プロトエート、スルプロホス；

[0092] (2) GABA-作動性塩素イオンチャネルアンタゴニスト： クロルデン、エン

ドスルファン、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロール； カンフェクロル、ヘプタクロル；

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター： アクリナトリン、d-シストランス アレスリン、d-トランスアレスリン、ビフェンスリン、バイオアレスリン、バイオアレスリンS-シクロペンチル異性体、バイオレスメスリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、ガンマ-シハロトリン、シペルメトリン、アルファ-シペルメトリン、ベータ-シペルメトリン、シータ-シペルメトリン、ゼータ-シペルメトリン、シフェノトリン [(1R)-トランス異性体]、デルタメトリン、エンペントリン [(EZ)-(1R)-異性体]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ-フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプリトリン、カデスリン、ペルメトリン、フェノトリン [(1R)-トランス異性体]、プラレトリン、ピレスラム、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルスリン、テトラメスリン、テトラメトリン [(1R)-異性体]、トラロメトリン、トランスフルトリン； アレスリン、ピレトリン、ピレトリンI、ピレトリンII、プロフルトリン、ジメフルトリン、バイオエタノメトリン、バイオペルメトリン、トランスペルメトリン、フェンフルトリン、フェンピリトリン、フルプロシトリネート、フルフェンプロックス、メトフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、テラレトリン；

[0093] (4) ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト： アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ニチアジン、チアクロプリド、チアメトキサム、スルフォキサフロール、ニコチン；
フルピラジフロル；

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体アロステリックモジュレーター：
スピネトラム、スピノサド；

(6) クロライドチャンネル活性化剤： アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、ミルベメクチン； イベルメクチン、セラメクチン

、ドラメクチン、エプリノメクチン、モキシデクチン、ミルベマイシン、ミルベマイシンオキシム；

(7) 幼若ホルモン様物質： ヒドロプレン、キノプレン、メソプレン、フェノキシカルブ、ピリプロキシフェン； ジオフェノラン、エポフェノナン、トリプレン；

(8) その他非特異的阻害剤： 臭化メチル、クロルピクリン、フッ化スルフリル、ホウ砂、吐酒石；

(9) 同翅目選択的摂食阻害剤： フロニカミド、ピメトロジン；

[0094] (10) ダニ類生育阻害剤： クロフェンテジン、ジフロビダジン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール；

(11) 微生物由来昆虫中腸内膜破壊剤： バチルス・チューリングエンシス亜種イスラエレンシ、バチルス・スファエリクス、バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキ、バチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス、Bt作物タンパク質： Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1；

(12) ミトコンドリアATP生合成酵素阻害剤： ジアフェンチウロン、アゾシクロチン、サイヘキサチン、酸化フェンブタスズ、プロパルギット、テトラジホン；

(13) 酸化的リン酸化脱共役剤： クロルフェナピル、スルフラミド、DNO₂C；ピナパクリル、ジノブトン、ジノカップ；

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネルブロッカー： ベンシルタップ、カルタップ塩酸塩； ネライストキシン； チオシルタップナトリウム塩、チオシクラム；

(15) キチン合成阻害剤： ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ブプロフェジン；

- (16) 双翅目脱皮かく乱剤： シロマジン；
- (17) 脱皮ホルモン受容体アゴニスト： クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；
- (18) オクトパミン受容体アゴニスト： アミトラズ；
- (19) ミトコンドリア電子伝達系複合体III阻害剤： アセキノシル、フルアクリピリム、ヒドラメチルノン；
- (20) ミトコンドリア電子伝達系複合体I阻害剤： フェナザキン、フェンプロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、ロテノン；
- [0095] (21) 電位依存性ナトリウムチャネルブロッカー： インドキサカルブ、メタフルミゾン；
- (22) アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤： スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト；
- (23) ミトコンドリア電子伝達系複合体IV阻害剤： リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、リン化亜鉛、シアニド；
- (24) ミトコンドリア電子伝達系複合体II阻害剤： シエノピラフェン、シフルメトフェン；
- (25) リアノジン受容体モジュレーター： クロラントラニリプロール、シアントラニプロール、フルベンジアミド；
- (26) 混合機能オキシダーゼ阻害剤化合物： ピペロニルブトキシド；
- (27) ラトロフィリン受容体作用薬： デブシペプチド、環状デブシペプチド、24員環状デブシペプチド、エモデブシド；
- (28) その他の剤（作用機構が未知）： アザジラクチン、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオネート、クリオライト、ジコホル、ピリダリル、ピリフルキナゾン； ベンクロチアズ、硫黄、アミドフルメット、クロルジメホルム、1,3-ジクロロプロペン、DCIP、フェニソブプロモレート、ベンゾメート、メタアルデヒド、クロルベンジレート、クロチアゾベン、ジシクラニル、フェノキサクリム、フェントリファニル

、フルベンジミン、フルフェナジン、ゴシップルア、ジャポニルア、メトキサジアゾン、石油、オレイン酸カリウム、テトラスル、トリアラセン；アフィドピロペン (afidopyropen)、ピフルブミド (pyflubumide)、フロメトキン、フルフィプロル (flufiprole)、フルエンスルフォン、メペルフルスリン、テトラメチルフルスリン、トラロピリル、ジメフルスリン、メチルネオデカンアミド；フルララナー、5-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロ-4,5-ジヒドロイソオキサール-3-イル]-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ベンゾニトリル (CAS:943137-49-3)、2'-ブromo-2-フルオロ-4'-(ヘプタフルオロプロパン-2-イル)-3-(N-メチルベンズアミド)-6'-(トリフルオロメチル)ベンズアニリド (CAS:1207727-04-5)、その他のメタジアミド類；

[0096] (29) 駆虫剤：

(a) ベンズイミダゾール系：フェンベンダゾール、アルベンダゾール、トリクラベンダゾール、オキシベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、パーベンダゾール、フルベンダゾール；フェバンテル、ネトビミン、チオファネート；チアベンダゾール、カンベンダゾール；

(b) サリチルアニリド系：クロサンテル、オキシクロザニド、ラフォキサニド、ニクロサミド；

(c) 置換フェノール系：ニトロキシニル、ニトロスカネイト；

(d) ピリミジン系：ピランテル、モランテル；

(e) イミダゾチアゾール系：レバミソール、テトラミソール；

(f) テトラヒドロピリミジン：プラジカンテル、エプシプランテル；

(g) その他の駆虫薬：シクロジエン、リアニア、クロルスロン、メトロニダゾール、デミジトラズ；ピペラジン、ジエチルカルバマジン、ジクロロフェン、モネパンテル、トリベンジミジン、アミダンテル；チアセタルサミド、メロルサミン、アルセナマイド；

[0097] 以下に、殺菌剤の具体例を示す。

(1) 核酸生合成阻害剤：

(a) RNAポリメラーゼI阻害剤： ベナラキシル、ベナラキシル-M、フララキシル、メタラキシル、メタラキシル-M； オキサジキシル； クロジラコン、オフレース；

(b) アデノシンデアミラーゼ阻害剤： ブピリメート、ジメチリモール、エチリモール；

(c) DNA/RNA合成阻害剤： ハイメキサゾール、オクチリノン；

(d) DNAトポイソメラーゼII阻害剤： オキシリン酸；

[0098] (2) 有糸核分裂阻害剤および細胞分裂阻害剤：

(a) β -チューブリン重合阻害剤： ベノミル、カルベンダジム、クロルフエナゾール、フベリダゾール、チアベンダゾール； チオファネート、チオファネート-メチル； ジエトフェンカルブ； ゾキサミド； エタボキサム；

(b) 細胞分裂阻害剤： ペンシクロン；

(c) スペクトリン様タンパク質の非局在化阻害剤： フルオピコリド；

[0099] (3) 呼吸阻害剤：

(a) 複合体I NADH酸化還元酵素阻害剤： ジフルメトリム；

(b) 複合体IIコハク酸脱水素酵素： ベノダニル、フルトラニル、メプロニル； イソフェタミド； フルオピラム； フェンフラム、フルメシクロックス； カルボキシシン、オキシカルボキシシン； チフルザミド； ベンゾビンジフルピル、ピキサフェン、フルキサピロキサド、フラメトピル、イソピラザム、ペンフルフェン、ペンチオピラド、セダキサン； ボスカリド；

(c) 複合体IIIユビキノールオキシダーゼQo阻害剤： アゾキシストロビン、クモキシストロビン、クメトキシストロビン、エノキサストロビン、フルフェノキシストロビン、ピコキシストロビン、ピラオキシストロビン； ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、トリクロピリカルブ； クレソキシム-メチル、トリフロキシストロビン； ジモキシストロビン、フェナミンストロビン、メトミノストロビン、オリサストロビン； ファモキサドン； フルオキサストロビン； フェンアミドン； ピリベンカルブ；

(d) 複合体IIIユビキノール還元酵素Q_i阻害剤： シアゾファミド；アミスルブロム；

(e) 酸化リン酸化の脱共役剤： ビナパクリル、メプチルジノカップ、ジノカップ；フルアジナム； フェリムゾン；

(f) 酸化リン酸化阻害剤（ATP 合成酵素の阻害剤）： フェンチンアセテート、塩化フェンチン、水酸化フェンチン；

(g) ATP生産阻害剤： シルチオフアム；

(h) 複合体III： チロクローム bc₁(ユビキノール還元酵素)のQ_x(未知)阻害剤： アメトクトラジン；

[0100] (4) アミノ酸およびタンパク質合成阻害剤：

(a) メチオニン生合成阻害剤： アンドプリム、シプロジニル、メパニプリム、ピリメタニル；

(b) タンパク質合成阻害剤： ブラストサイジン-S； カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩； ストレプトマイシン； オキシテトラサイクリン；

[0101] (5) シグナル伝達阻害剤：

(a) シグナル伝達阻害剤： キノキシフェン、プロキナジド；

(b) 浸透圧シグナル伝達におけるMAP・ヒスチジンキナーゼ阻害剤： フェンピクロニル、フルジオキソニル； クロゾリメート、イプロジオン、プロシミドン、ビンクロゾリン；

[0102] (6) 脂質および細胞膜合成阻害剤：

(a) リン脂質生合成、メチルトランスフェラーゼ阻害剤： エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス；イソプロチオラン；

(b) 脂質の過酸化剤： ビフェニル、クロロネブ、ジクロラン、キンドゼン、テクナゼン、トルクロホスメチル；エトリジアゾール；

(c) 細胞膜に作用する剤： ヨードカルブ、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、プロパモカルブホセチレート、プロチオカルブ；

(d) 病原菌細胞膜の微生物攪乱： バチルスズブチリス菌、バチルスズブ

チリスQST713 株、バチルス ズブチリスFZB24 株、バチルス ズブチリスMBI600 株、バチルス ズブチリスD747株；

(e) 細胞膜をかく乱する剤： ゴセイカユプテ(ティーツリー)の抽出物；

[0103] (7) 細胞膜のステロール生合成阻害剤：

(a) ステロール生合成におけるC14位の脱メチル化阻害剤： トリホリン；

ピリフェノックス、ピリイソキサゾール； フェナリモル、フルルプリミドール、ヌアリモル； イマザリル、イマザリル硫酸塩、オキスポコナゾール、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール、ビニコナゾール；

アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジクロブトラゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、フルコナゾール、フルコナゾールーシス、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イプコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、キンコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール；プロチオコナゾール、ポリコナゾール；

(b) ステロール生合成における $\Delta 14$ 還元酵素および $\Delta 8 \rightarrow \Delta 7$ -イソメラーゼの阻害剤： アルジモルフ、ドデモルフ、ドデモルフ酢酸塩、フェンプロピモルフ、トリデモルフ；フェンプロピジン、ピペラリン； スピロキサミン；

(c) ステロール生合成系のC4位脱メチル化における3-ケト還元酵素剤： フェンヘキサミド； フェンピラザミン；

(d) ステロール生合成系のスクワレンエポキシダーゼ阻害剤： ピリブチカルブ； ナフチフェン、テルピナフィン；

[0104] (8) 細胞壁合成阻害：

(a) トレハロース、イノシトール生合成剤： バリダマイシン；

(b) キチン合成酵素阻害剤： ポリオキシシン、ポリオクソリム；

(c) セルロース合成酵素阻害剤： ジメトモルフ、フルモルフ、ピリモルフ； ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、トルプロカルブ、バリフェナレート； マンジプロパミド；

[0105] (9) メラニン生合成阻害剤：

(a) メラニン生合成の還元酵素阻害剤： フサライド； ピロキロン； トリシクラゾール；

(b) メラニン生合成の脱水酵素阻害剤： カルプロパミド； ジクロシメット； フェノキサニル；

[0106] (10) 宿主植物の抵抗性誘導剤：

(a) サリチル酸合成経路に作用する剤： アシベンゾラル-S-メチル；

(b) その他： プロベナゾール； チアジニル； イソチアニル； ラミナリン； オオイタドリ抽出液；

[0107] (11) 作用性が不明な剤： シモキサニル、ホセチルアルミニウム、リン酸（リン酸塩）、テクロフタラム、トリアゾキシド、フルスルファミド、ジクロメジン、メタスルホカルブ、シフルフェナミド、メトラフェノン、ピリオフェノン、ドジン、ドジン遊離塩基、フルチアニル；

[0108] (12) 多作用点を有する剤： 銅（銅塩）、ボルドー液、水酸化銅、銅ナフタレート、酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、硫黄、硫黄製品、多硫化カルシウム； ファーバム、マンコゼブ、マネブ）、マンコッパー、メチラム、ポリカーバメート、プロピネブ、チラム、ジネブ、ジラム； キャプタン、カプタホール、フォルペット； クロロタロニル； ジクロフルアニド、トリルフルアニド； グアザチン、イミノクタジン、イミノクタジンアルベシレート、イミノクタジントリアセテート； アニラジン； ジチアノン； キノメチオネート； フルオルイミド；

[0109] (13) その他の剤： DBEDC、フルオロフォルペット、グアザチンアセテート、ビス（8-キノリノラト）銅（II）、プロパミジン、クロロピクリン、シプロフラム、アグロバクテリウム、ベトキサジン、ジフェニルアミン、メチルイソチアネート（MITC）、ミルデオマイシン、カプサイシン、カルボン、

クフラネブ、シプロスルファミド、ダゾメット、デバカルブ、ジクロロフェン、ジフェンゾクワット、ジフェンゾクワットメチルスルホネート、フルメトベル、ホセチルカルシウム、ホセチルナトリウム、イルママイシン、ナタマイシン、ニトロタールイソプロピル、オキサモカルブ、プロパモシンナトリウム、ピロールニトリン、テブフロキン、トルニファニド、ザリラミド、アルゴフェーズ (Algophase)、アミカルチアゾール (Amicarbazol)、オキサチアピプロリン (Oxathiapiprolin)、メチラム亜鉛、ベンチアゾール、トリクラミド、ユニコナゾール、ミルデオマイシン、オキシフェンチン (Oxyfenthin)、ピカルブトラゾクス (picarbutrazox) ;

[0110] さらに、植物調節剤の具体例を示す。

アブシジン酸、カイネチン、ベンジルアミノプリン、1, 3-ジフェニルウレア、ホルクロルフェヌロン、チジアズロン、クロルフェヌロン、ジヒドロゼアチン、ジベレリンA、ジベレリンA4、ジベレリンA7、ジベレリンA3、1-メチルシクロプロパン、N-アセチルアミノエトキシビニルグリシン (アビグリシン)、アミノオキシ酢酸、硝酸銀、塩化コバルト、IAA、4-CPA、クロプロップ、2, 4-D、MCPB、インドール-3-酪酸、ジクロルプロップ、フェノチオール、1-ナフチルアセトアミド、エチクロゼート、クロキシホナック、マレイン酸ヒドラジド、2, 3, 5-トリヨード安息香酸、サリチル酸、サリチル酸メチル、(-)-ジャスモン酸、ジャスモン酸メチル、(+)-ストリゴール、(+)-デオキシストリゴール、(+)-オロバンコール、(+)-ソルゴラクトン、4-オキソ-4-(2-フェニルエチル)アミノ酪酸；エテホン、クロルメコート、メピコートクロリド、ベンジルアデニン；

[0111] [製剤処方]

本発明の有害生物防除剤、殺虫剤、または殺ダニ剤の製剤処方を若干示すが、添加物および添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤処方中の部は重量部を示す。

[0112] 以下に農園芸用および水稻用の製剤処方を示す。

[0113] (製剤 1 : 水和剤)

本発明化合物	40部
珪藻土	53部
高級アルコール硫酸エステル	4部
アルキルナフタレンスルホン酸塩	3部

以上を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分40%の水和剤を得た。

[0114] (製剤 2 : 乳剤)

本発明化合物	30部
キシレン	33部
ジメチルホルムアミド	30部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	7部

以上を混合溶解して、有効成分30%の乳剤を得た。

[0115] (製剤 3 : 粒剤)

本発明化合物	5部
タルク	40部
クレー	38部
ベントナイト	10部
アルキル硫酸ソーダ	7部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、直径0.5～1.0mmの粒状に造粒して有効成分5%の粒剤を得る。

[0116] (製剤 4 : 粒剤)

本発明化合物	5部
クレー	73部
ベントナイト	20部
ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩	1部
リン酸カリウム	1部

以上をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分5%の粒剤を得る。

[0117] (製剤5：懸濁剤)

本発明化合物	10部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	4部
ポリカルボン酸ナトリウム塩	2部
グリセリン	10部
キサントガム	0.2部
水	73.8部

以上を混合し、粒度が3ミクロン以下になるまで湿式粉碎し、有効成分10%の懸濁剤を得る。

実施例

[0118] 次に、実施例を示し、本発明をより具体的に説明する。ただし、本発明は以下の実施例によって何ら制限されるものではない。本発明の趣旨を逸脱しない範囲で、構成の付加、省略、置換、およびその他の変更が可能である。

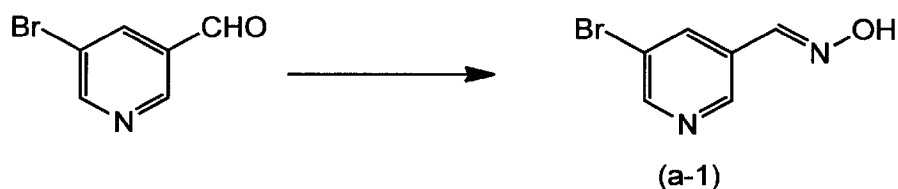
[0119] 実施例1

3-(5-Bromo-3-pyridyl)-5-ethyl-N-[1-methyl-1-(2-pyridyl)ethyl]-4,5-dihydroisoxazole-5-carboxamide (化合物番号1-5) の製造

(工程1)

5-Bromopyridine-3-carbaldehyde oxime (化合物a-1) の製造

[0120] [化5]



[0121] 5-Bromopyridine-3-carbaldehyde (10.0 g) をエタノール (100ml) に溶解し、塩化ヒドロキシルアンモニウム (4.12 g) およびピリジン (5.12 g) を加え、室温にて一晩攪拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水を加えて酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去し、化合物a-1 (10.7 g、収率99%) を得た。化合物

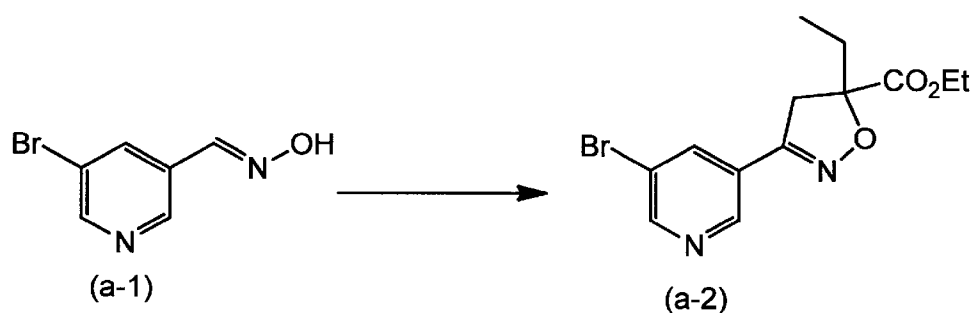
a-1の¹H-NMRの測定結果は下記のとおりであった。

¹H-NMR (CDCl₃/TMS, δ (ppm)) 8.68~8.65(m, 2H), 8.12~8.11(m, 1H), 8.10(s, 1H), 7.74(br, 1H)

[0122] (工程2)

Ethyl 3-(5-bromo-3-pyridyl)-5-ethyl-4,5-dihydroisoxazole-5-carboxylate (化合物a-2) の製造

[0123] [化6]



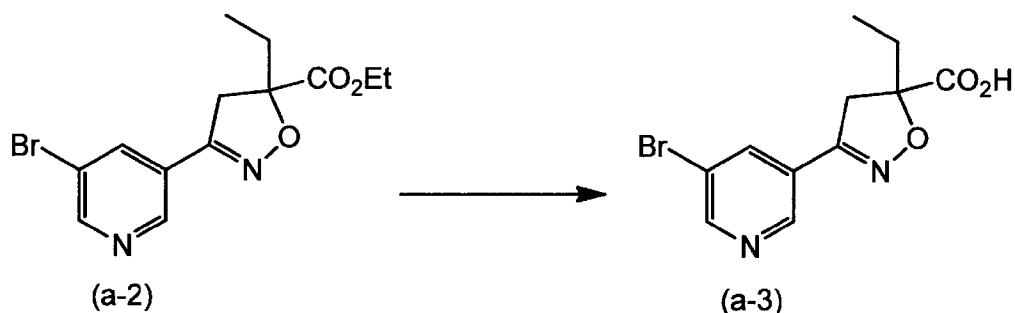
[0124] 化合物a-1 (0.63 g) をN, N-ジメチルホルムアミド (15ml) に溶解し、N-クロロスクシンイミド (0.45 g) を加え、40℃にて8時間攪拌した。反応終了後、反応液をジエチルエーテルにて希釈し、飽和食塩水で3回洗浄し、得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥、ろ過した。ろ液にEthyl 2-methylenebutanoate (0.60 g) を加え、0℃に冷却した後、トリエチルアミン (0.63 g) を滴下し、室温にて一晩攪拌した。反応終了後、反応液をろ過し、減圧留去によって得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、化合物a-2 (0.95 g、収率92%、融点87-88℃) を得た。

[0125] (工程3)

Ethyl 3-(5-bromo-3-pyridyl)-5-ethyl-4,5-dihydroisoxazole-5-carboxylic acid (化合物a-3) の製造

[0126]

[化7]



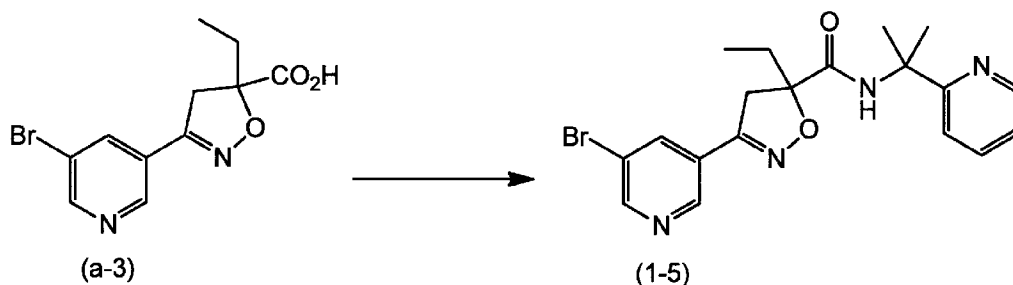
[0127] 化合物a-2 (0.80 g) をテトラヒドロフラン/メタノール/水 (20ml/5ml/5ml) に溶解し、水酸化リチウム水和物 (0.20 g) を加え、室温で一晩攪拌した。反応終了後、7%塩酸にて反応液をpH 3 に調節し、クロロホルムにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥、ろ過後、溶媒を減圧留去し、化合物a-3 (0.68 g、収率93%) を得た。化合物a-3の¹H-NMRの測定結果は下記のとおりであった。

¹H-NMR (CDCl₃/TMS, δ (ppm)) 8.75~8.73(m, 2H), 8.25~8.24(m, 1H), 3.82(d, 1H), 3.30(d, 1H), 2.22~2.04(m, 2H), 1.07(t, 3H)

[0128] (工程4)

3-(5-Bromo-3-pyridyl)-5-ethyl-N-[1-methyl-1-(2-pyridyl)ethyl]-4,5-dihydroisoxazole-5-carboxamide (化合物番号1-5) の製造

[0129] [化8]

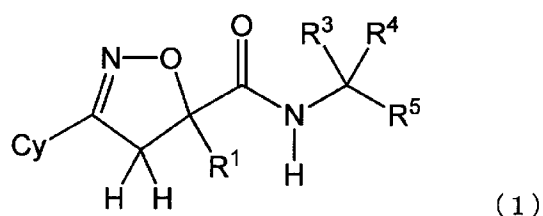


[0130] 化合物a-3 (0.36 g) をアセトニトリル (20ml) に溶解し、2-(2-Pyridyl)propan-2-amine (0.25 g)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.33 g)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (0

.18 g)、トリエチルアミン (0.24 g) を加え、室温にて一晩攪拌した。反応終了後、反応液を酢酸エチルにて希釈し、塩化アンモニウム水溶液で洗浄し、有機層を硫酸マグネシウムにて乾燥、ろ過後、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にて精製し、目的とする化合物1-5 (0.35 g、収率70%、融点108-109℃) を得た。

[0131] 前述の方法などに従って表1に示すイソオキサゾリン-5-カルボキサミド化合物を製造した。表1は式(1)で表される化合物中の置換基を示す。表1は、前記の方法などで製造できる本発明のイソオキサゾリン-5-カルボキサミド化合物の一部を示したに過ぎない。本明細書において具体的に示しきれなかった他の化合物、すなわち本発明の趣旨と範囲を逸脱しない種々の基に置換されたものが前記方法などによって製造でき且つ使用できることは本明細書の記載によって当業者において容易に理解できることである。

[0132] [化9]



[0133]

[表1]

第1表

化合物 番号	Cy	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵
1-1	5-Br-Py-3-yl	Me	Me	Me	Me
1-2	5-Br-Py-3-yl	Me	Me	Me	Py-2-yl
1-3	5-Br-Py-3-yl	Me	Me	Me	Ph
1-4	5-Ethynyl-Py-3-yl	Me	Me	Me	Ph
1-5	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	Py-2-yl
1-6	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	Ph
1-7	Py-3-yl	Et	Me	Me	Py-2-yl
1-8	5-Br-Py-3-yl	CF ₃	Me	Me	Py-2-yl
1-9	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	CH ₂ CF ₃
1-10	2-Br-Py-4-yl	Et	Me	Me	Py-2-yl
1-11	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	Pyrimidin-2-yl
1-12	2-OMe-Py-4-yl	Et	Me	Me	Py-2-yl
1-13	6-Br-Py-2-yl	Et	Me	Me	Py-2-yl
1-14	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-Ph-Py-2-yl
1-15	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-Ph-Pyrimidin-2-yl
1-16	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-SMe-Py-2-yl
1-17	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-SO ₂ Me-Py-2-yl
1-18	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-SEt-Py-2-yl
1-19	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-SO ₂ Et-Py-2-yl

[0134] [表2]

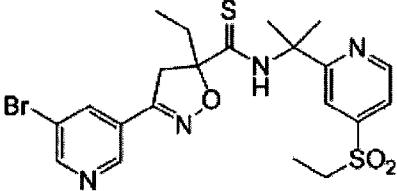
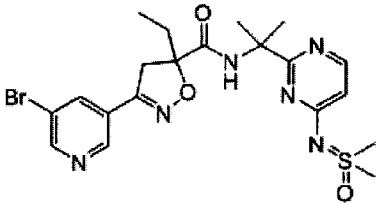
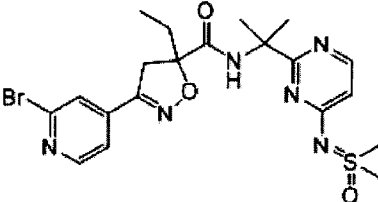
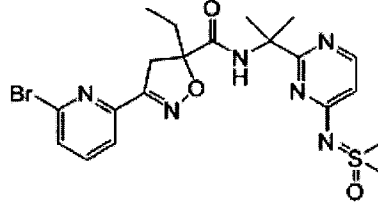
第1表 (続き)

化合物 番号	Cy	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵
1-20	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-OCH ₂ CF ₃ -Py-2-yl
1-21	5-Br-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-OCH ₂ CHF ₂ -Py-2-yl
1-22	5-CN-Py-3-yl	Et	Me	Me	4-OCH ₂ CF ₃ -Py-2-yl

[0135]

[表3]

第1表 (続き)

化合物 番号	構造
1-23	
1-24	
1-25	
1-26	

[0136] 表1に示した化合物のうち、いくつかの化合物について物性を測定した。

測定結果を下記に示す。粘性オイルまたはアモルファスの化合物については¹H-NMR (CDCl₃)または屈折率を測定した。左端の番号は表中の化合物番号に対応する。

[0137] 1-1 : 融点 147-149°C

1-2 : ¹H-NMR (CDCl₃/TMS, δ (ppm)) 8.84(s, 1H), 8.74(d, 1H), 8.70(d, 1H), 8.55(d, 1H), 8.19(dd, 1H), 7.69(ddd, 1H), 7.35(d, 2H), 7.18(dd, 1H), 3.85(d, 1H), 3.19(d, 1H), 1.76(s, 6H), 1.74(s, 3H)

1-3 : 融点 150-151°C

1-4 : 融点 131-132°C

1-5 : 融点 108-109°C

1-6 : 融点 180-181°C

1-7 : 融点 102-103°C

1-8 : 融点 96-99°C

1-9 : 融点 134-137°C

1-10 : 融点 132-133°C

1-11 : 融点 120-123°C

1-12 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , δ (ppm)) 8.78(s, 1H), 8.56~8.55(m, 1H), 8.19(d, 1H), 7.68(ddd, 1H), 7.35(d, 1H), 7.21(dd, 1H), 7.18(ddd, 1H), 6.87(s, 1H), 3.95(s, 3H), 3.71(d, 1H), 3.18(d, 1H), 2.22~2.13(m, 1H), 1.99~1.90(m, 1H), 1.75(s, 3H), 1.74(s, 3H), 1.03(s, 3H)

1-13 : 融点 151-152°C

1-14 : 融点 140-141°C

1-15 : 融点 151-153°C

1-16 : 融点 124-125°C

1-17 : 融点 196-197°C

1-18 : 融点 109-111°C

1-19 : 融点 146-147°C

1-20 : 融点 175-178°C

1-21 : 融点 152-153°C

1-22 : 融点 196-199°C

1-23 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , δ (ppm)) 9.69(s, 1H), 8.80(d, 1H), 8.75(d, 1H), 8.73(d, 1H), 8.18(dd, 1H), 7.74(s, 1H), 7.62(dd, 1H), 4.14(d, 1H), 3.38(d, 1H), 3.10(q, 2H), 1.95(s, 3H), 1.93(s, 3H), 1.25(t, 3H), 1.03(s, 3H)

1-24 : 融点 177-178°C

1-25 : 融点 210-211°C

1-26：融点 158-159℃

[0138] 〔生物試験〕

本発明化合物が、殺ダニ剤の有効成分として有用であることを以下の試験例で示す。

[0139] 試験例 1 ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)に対する効力試験

先に、本発明化合物 5 部、ジメチルホルムアミド 93.6 部、およびポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル 1.4 部を混合溶解し、有効成分 5 %の乳剤を調製した。

3 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ~ 10 日を経過した初生葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を 10 頭接種した。次いで前記の乳剤を、化合物濃度 125 ppm になるように水で希釈して薬剤を得た。この薬剤を前記インゲンに散布した。前記インゲンを、温度 25℃、湿度 65 %の恒温室内に置いた。散布から 10 日経過時に成虫の生死を調査した。

化合物番号 1-2、1-5、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-21、1-22、および 1-24 の化合物について、前記試験を行った。いずれの化合物も 10 日経過時の殺虫率が 90 %以上であった。

[0140] 試験例 2 ミカンハダニ(*Panonychus citri*)に対する効力試験

シャーレに入れたミカン葉上に、神奈川県産のミカンハダニ雌成虫を 8 頭接種した。次いで実施例 1 に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度 125 ppm になるように水で希釈して薬剤を得た。この薬剤を回転散布塔にて前記ミカンに散布した。前記ミカンを、温度 25℃、湿度 65 %の恒温室内に置いた。散布から 10 日経過時に成虫の生死を調査した。

化合物番号 1-2、1-5、1-7、1-8、1-9、1-11、1-12、1-14、1-17、1-18、1-19、1-21、1-23、および 1-24 の化合物について、前記試験を行った。いずれの化合物も 10 日経過時の殺虫率が 90 %以上であった。

[0141] 試験例 3 ミカンハダニ(*Panonychus citri*)に対する効力試験

シャーレに入れたミカン葉上に、和歌山県産の殺ダニ剤抵抗性のミカンハダニ雌成虫を 8 頭接種した。次いで実施例 1 に示された処方の乳剤を調製し

た。この乳剤を化合物濃度 1 2 5 p p m になるように水で希釈して薬剤を得た。この薬剤を回転散布塔にて前記ミカンに散布した。前記ミカン、温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置いた。散布から 1 0 日経過時に成虫の生死を調査した。

化合物番号 1-2、1-18、1-19、1-21、1-24、1-25、および 1-26 の化合物について、前記試験を行った。いずれの化合物も 1 0 日経過時の殺虫率が 9 0 % 以上であった。

[0142] 試験例 4 カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*) に対する効力試験

3 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ~ 1 0 日を経過した初生葉上に、岡山県産のカンザワハダニ雌成虫を 1 0 頭接種した。次いで実施例 1 に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度 5 0 0 p p m または 1 2 5 p p m になるように水で希釈して薬剤を得た。この薬剤を前記インゲンに散布した。前記インゲンを、温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置いた。散布から 1 0 日経過時に成虫の生死を調査した。

化合物番号 1-5、1-7、1-8、1-10、および 1-11 の化合物について、化合物濃度 5 0 0 p p m にて前記試験を行った。いずれの化合物も 1 0 日経過時の殺虫率は 9 0 % 以上であった。

また、化合物番号 1-2、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-21、1-22、および 1-23 の化合物について、化合物濃度 1 2 5 p p m にて前記試験を行った。いずれの化合物も 1 0 日経過時の殺虫率が 9 0 % 以上であった。

[0143] 試験例 5 ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*) に対する効力試験

シャーレに入れたミカン葉上に、殺ダニ剤抵抗性ミカンサビダニ成虫を 2 0 頭接種した。次いで実施例 1 に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度 1 2 5 p p m になるように水で希釈して薬剤を得た。この薬剤を回転散布塔にて前記ミカンに散布した。前記ミカン、温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置いた。散布から 1 0 日経過時に成虫の生死を調査した。

化合物番号 1-2 の化合物について、前記試験を行った。前記化合物は 1 0 日

経過時の殺虫率が90%以上であった。

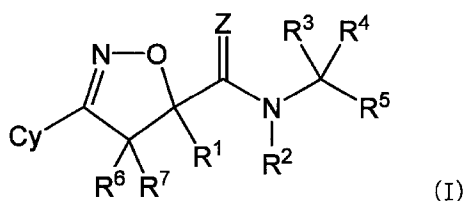
産業上の利用可能性

[0144] 殺ダニ活性および／または殺虫活性に優れ、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるイソオキサゾリン-5-カルボキサミド化合物またはその塩を提供することができる。

請求の範囲

[請求項1] 式 (I) で表されるイソオキサゾリノー 5-カルボキサミド化合物
またはその塩。

[化1]



[式 (I) 中、

Cyは、無置換のもしくは置換基Xを1～4個有するヘテロアリール基を示す。置換基Xを2個以上有するときXは互いに同一でも異なってもよい。

置換基Xは、ハロゲノ基、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC2～6アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC2～6アルキニル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するアミノ基、無置換のもしくは置換基を有するC1～7アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルキルチオ基、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルキルスルフィニル基、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルキルスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルコキシスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC3～8シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC6～10アリール基、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

R1は、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC2～6アルケニル基、または無置換

のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基を示す。

Zは、酸素原子または硫黄原子を示す。

R²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

R³およびR⁴は、それぞれ独立に、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、またはシアノ基を示す。ここで、R³とR⁴は相互に繋がってR³およびR⁴が結合する炭素原子とともに環を形成してもよい。

R⁵は、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～7 アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するアミノカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するヒドロキシイミノC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 6～10 アリール基、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、またはシアノ基を示す。

R⁶およびR⁷は、それぞれ独立に、水素原子、ハロゲン基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基を示す。]

[請求項2] 式 (I) 中のC_yが、無置換のもしくは置換基Xを1～4個有するピリジル基である、請求項1に記載のイソオキサゾリンー5-カルボキサミド化合物またはその塩。

[請求項3] 請求項1または2に記載のイソオキサゾリンー5-カルボキサミド

化合物またはその塩から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する有害生物防除剤。

[請求項4] 請求項1または2に記載のイソオキサゾリン-5-カルボキサミド化合物またはその塩から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する殺ダニ剤または殺虫剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2015/059029

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D413/04(2006.01)i, A01N43/80(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A61K31/4439(2006.01)i, A61K31/444(2006.01)i, A61K31/506(2006.01)i, A61P33/14(2006.01)i, C07D413/14(2006.01)i

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D413/04, A01N43/80, A01P7/02, A61K31/4439, A61K31/444, A61K31/506, A61P33/14, C07D413/14

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

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2015
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2015	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2015

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	JP 2007-503429 A (LG Life Sciences Ltd.), 22 February 2007 (22.02.2007), claims & JP 4503017 B2 & US 2006/0223848 A1 & US 7557133 B2 & WO 2005/021516 A1 & EP 1660464 A1 & KR 10-2005-0022364 A & CN 1842521 A	1-2 3-4
X A	Soni, A. et al, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2013, vol. 23, p. 1482-1485	1-2 3-4
X A	US 2008/0312285 A1 (RANBAXY INC.), 18 December 2008 (18.12.2008), paragraphs [0177] to [0201], example 4 & US 7781460 B2 & WO 2007/029077 A1 & EP 1928866 A1	1 2-4

☒ 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
15 May 2015 (15.05.15)

Date of mailing of the international search report
02 June 2015 (02.06.15)

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/JP2015/059029

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	JP 2008-531551 A (LG Life Sciences Ltd.), 14 August 2008 (14.08.2008), paragraph [0047], preparation example 6 & JP 4961357 B2 & US 2008/0262032 A1 & WO 2006/090997 A1 & EP 1851214 A1 & KR 10-2006-0094868 A & KR 10-0774999 B1	1 2-4
X A	KR 10-2010-0044647 A (LG LIFE SCIENCE LTD.), 30 April 2010 (30.04.2010), page 5, lines 17 to 18; reaction expression 1 (Family: none)	1 2-4
X A	US 2010/0120843 A1 (BIRCH STEWART KOLASCH & BIRCH), 13 May 2010 (13.05.2010), paragraph [0033], Reaction Scheme 1 (Family: none)	1 2-4
P,X P,A	WO 2014/048940 A2 (BAYER CROPSCIENCE AG), 03 April 2014 (03.04.2014), claims; pages 76 to 111, table 1 & TW 201418249 A	1,3 2,4
P,X P,A	WO 2014/048853 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 03 April 2014 (03.04.2014), claims; pages 71 to 97 (Family: none)	1-3 4

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. C07D413/04(2006.01)i, A01N43/80(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A61K31/4439(2006.01)i, A61K31/444(2006.01)i, A61K31/506(2006.01)i, A61P33/14(2006.01)i, C07D413/14(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. C07D413/04, A01N43/80, A01P7/02, A61K31/4439, A61K31/444, A61K31/506, A61P33/14, C07D413/14

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 1 5 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 1 5 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 1 5 年

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

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X A	JP 2007-503429 A (エルジー ライフ サイエンス リミテッド) 2007.02.22, 特許請求の範囲 & JP 4503017 B2 & US 2006/0223848 A1 & US 7557133 B2 & WO 2005/021516 A1 & EP 1660464 A1 & KR 10-2005-0022364 A & CN 1842521 A	1-2 3-4
X A	Soni, A. et al, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2013, vol. 23, p. 1482-1485	1-2 3-4

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

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

の日の後に公表された文献

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

国際調査を完了した日

1 5 . 0 5 . 2 0 1 5

国際調査報告の発送日

0 2 . 0 6 . 2 0 1 5

国際調査機関の名称及びあて先

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

特許庁審査官（権限のある職員）

村守 宏文

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

4 H

5 5 7 7

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X A	US 2008/0312285 A1 (RANBAXY INC.) 2008.12.18, 段落【0177】－【0201】Example 4, & US7781460 B2 & WO 2007/029077 A1 & EP 1928866 A1	1 2-4
X A	JP 2008-531551 A (エルジー・ライフ・サイエンシーズ・リミテッ ド) 2008.08.14, 段落【0047】製造例6 & JP 4961357 B2 & US 2008/0262032 A1 & WO 2006/090997 A1 & EP 1851214 A1 & KR 10-2006-0094868 A & KR 10-0774999 B1	1 2-4
X A	KR 10-2010-0044647 A (LG LIFE SCIENCE LTD) 2010.04.30, 第5頁第17～18行、reaction expression 1 (ファミリーなし)	1 2-4
X A	US 2010/0120843 A1 (BIRCH STEWART KOLASC H & BIRCH) 2010.05.13, 段落【0033】Reaction Scheme 1 (ファミリーなし)	1 2-4
P, X P, A	WO 2014/048940 A2 (BAYER CROPS SCIENCE AG) 2014.04.03, 請求の範囲、第76～111頁 Table 1 & TW 201418249 A	1, 3 2, 4
P, X P, A	WO 2014/048853 A1 (BAYER CROPS SCIENCE AG) 2014.04.03, 請求の範囲、第71～97頁 (ファミリーなし)	1-3 4