

(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3日(03.12.2020)



(10) 国際公開番号

WO 2020/241606 A1

(51) 国際特許分類:

A61P 33/10 (2006.01) A01N 47/34 (2006.01)  
A61P 33/14 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)  
C07D 471/04 (2006.01) A01N 43/90 (2006.01)  
A01P 7/04 (2006.01) A61K 31/444 (2006.01)  
A01N 47/02 (2006.01) A61K 31/519 (2006.01)  
A01N 47/12 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2020/020643

(22) 国際出願日: 2020年5月26日(26.05.2020)

(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 2019-098298 2019年5月27日(27.05.2019) JP

(71) 出願人: 日本農薬株式会社(NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1048386 東京都中央区京橋1丁目19番8号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 佐野 勇介(SANO, Yusuke); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 米村 樹(YONEMURA, Ikki); 〒5860094 大阪府

河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP).

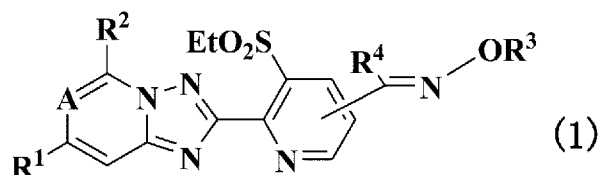
(74) 代理人: 岩谷 龍(IWATANI, Ryo); 〒5300003 大阪府大阪市北区堂島2丁目1番31号 京阪堂島ビル6階 Osaka (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, 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,

(54) Title: CONDENSED HETEROCYCLIC COMPOUND OR SALT THEREOF COMPRISING NITROGEN ATOM IN CROSS-LINK, AND AGRICULTURAL PESTICIDE CONTAINING SAID COMPOUND AND METHOD FOR USING SAME

(54) 発明の名称: 架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



(57) Abstract: The present invention addresses the problem of developing and providing a compound or salt thereof, and a novel agricultural pesticide containing said compound or salt thereof, and of providing a chemical for controlling external parasites or internal parasites of animals. Said problem is solved by: a compound in which a pyridine ring comprising an oxime group represented by general formula (1) is bonded to a condensed heterocyclic compound comprising a nitrogen atom in a cross-link, or a salt thereof; an agricultural pesticide and internal or external parasite control agent, for animals, that utilize said compound or salt as an active ingredient; and a method for using the same.

(57) 要約: 化合物又はその塩類、及び該化合物又はその塩類を含む新規な農園芸用殺虫剤を開発し、提供すること、及び動物の外部寄生虫又は内部寄生虫を駆除する薬剤を提供することを課題とする。下記の一般式(1)で表されるオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物に結合した化合物又はその塩類、これを有効成分とする農園芸用殺虫剤、動物用内部又は外部寄生虫防除剤、並びにその使用方法により、当該課題を解決する。

WO 2020/241606 A1

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)）

## 明 細 書

### 発明の名称：

架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

### 技術分野

[0001] 本発明は、架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びに該使用方法に関する。

### 背景技術

[0002] これまでに農園芸用殺虫剤として様々な化合物が検討されており、ある種の縮合複素環化合物が殺虫剤として有用であることが報告されている（例えば特許文献1～11参照）。かかる文献中には、オキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環と結合した化合物は具体的に開示されていない。

### 先行技術文献

### 特許文献

- [0003] 特許文献1：特開2009-280574号公報  
特許文献2：特開2010-275301号公報  
特許文献3：特開2011-79774号公報  
特許文献4：特開2012-131780号公報  
特許文献5：国際公開第2012/086848号パンフレット  
特許文献6：国際公開第2014/142135号パンフレット  
特許文献7：国際公開第2015/121136号パンフレット  
特許文献8：国際公開第2017/065183号パンフレット  
特許文献9：国際公開第2018/124129号パンフレット  
特許文献10：国際公開第2018/199209号パンフレット  
特許文献11：国際公開第2019/038195号パンフレット

### 発明の概要

## 発明が解決しようとする課題

[0004] 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害が今なお大きいことから、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤を開発し、提供すること、併せて動物の外部寄生虫又は内部寄生虫を駆除することができる薬剤を提供することを課題とする。

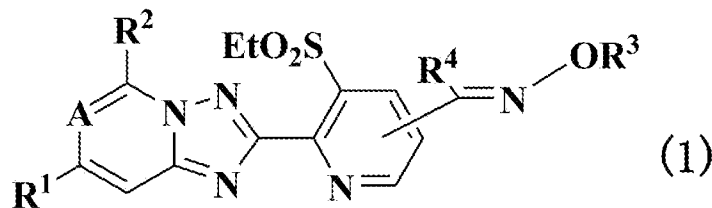
## 課題を解決するための手段

[0005] 本発明者は上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、一般式(1)で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類が農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有するだけでなく、非防除対象生物には影響が少なく、環境中で適度な分解性を有し、併せて動物の外部寄生虫又は内部寄生虫を駆除することができる化合物を見出し、本発明に至った。

即ち、本発明は、以下に関する。

[1] 一般式(1)

[化1]



{式中、R<sup>1</sup>は、(a1)水素原子；(a2) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(a3) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル基又は(a4)ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基を示す。

R<sup>2</sup>は、(b1)水素原子；(b2) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(b3)ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(b4) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル基又は(b5)ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル基を示す。

R<sup>3</sup>は、(c1)水素原子；(c2) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(c3)ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(c4) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル基；(c5) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(c6) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(c7) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；又は(c8) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基

を示す。

R<sup>4</sup>は、(d1)水素原子；(d2)ハロゲン原子；(d3)シアノ基；(d4) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(d5) (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル基；(d6) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル基；(d7) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル基；(d8) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ基；(d9) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；(d10) R<sup>6</sup> (R<sup>7</sup>) N基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は同一又は異なっても良く、水素原子、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル基、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニル基、又は(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルカルボニル基を示す)；(d11) NR<sup>6</sup>CON (R<sup>6</sup>) R<sup>7</sup>基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ。)；(d12)アリール基；(d13)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される1~4の置換基を環上に有するアリール基；(d14)複素環基又は(d15) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される1~3の置換基を環上に有する複素環基を示す。

Aは、窒素原子又はC-R<sup>5</sup> (ここで、R<sup>5</sup>は、(e1)水素原子；(e2) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基又は(e3)ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基を示す。)を示す。}で表されるオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物、

[2] R<sup>1</sup>が、(a1)水素原子又は、(a4)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、  
R<sup>2</sup>が、(b1)水素原子；又は(b2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、  
R<sup>3</sup>が、(c2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；(c3)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基  
；(c6) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；(c7) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)  
アルキルスルフィニル (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；又は(c8) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アル  
キルスルホニル (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、  
R<sup>4</sup>が、(d1)水素原子；(d2)ハロゲン原子；(d3)シアノ基；(d4) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)  
アルキル基；(d5) (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル基；(d6) (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアル  
キル基；(d7) (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル基；(d8  
) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基；(d9) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；(d10) R<sup>6</sup>(  
R<sup>7</sup>)N基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ)；(d11)NR<sup>6</sup>CON(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>  
基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ)；(d12)アリール基；(d13)同一又は異  
なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)  
アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ  
基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)  
ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、  
(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスル  
ホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される 1  
～4 の置換基を環上に有するアリール基；(d14)複素環基又は(d15)同一又は  
異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ  
基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(  
i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基  
、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルス  
ルホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される  
1～3 の置換基を環上に有する複素環基を示し、Aが、窒素原子又はC-R<sup>5</sup>  
(ここで、R<sup>5</sup>は、(e1)水素原子；(e2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は(e3)ハロ  
(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示す。)を示す、[1]に記載のオキシム基を有

するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物、

[3] R<sup>1</sup>が、(a1)水素原子又は(a4)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、R<sup>2</sup>が、(b1)水素原子又は(b2)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、R<sup>3</sup>が、(c2)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基；(c3)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基；(c6)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基又は(c8)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、

R<sup>4</sup>が、(d1)水素原子；(d2)ハロゲン原子；(d6)(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル基；(d8)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基；(d12)アリール基又は(d13)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(e)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(f)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基、(g)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基、(h)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(i)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(j)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基、(k)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基、(l)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基から選択される1~4の置換基を環上に有するアリール基を示し、

Aが、窒素原子又はC-R<sup>5</sup>(ここで、R<sup>5</sup>は、(e1)水素原子又は(e3)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基を示す。)を示す、[1]に記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類、

[4] [1]~[3]の何れかに記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤、

[5] [1]~[3]の何れかに記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を植物又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用法、

[6] [1]~[3]の何れかに記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を有効成分として含有することを特徴とする動物用の外部又は内部寄生虫防除剤、

[7] [1] ~ [3] の何れかに記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を動物に経皮投与する又は経口投与することを特徴とする動物用の外部又は内部寄生虫防除剤の使用法、に関する。

### 発明の効果

[0006] 本発明の架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類は農園芸用殺虫剤として優れた効果を有するだけでなく、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、白蟻等のその他の有害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

[0007] 本発明の架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類の一般式(1)の定義において、「ハロ」とは「ハロゲン原子」を意味し、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はフッ素原子を示す。

[0008] 「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、イソペンチル基、ターシャリーペンチル基、ネオペンチル基、2, 3-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、ノルマルヘキシル基、イソヘキシル基、2-ヘキシル基、3-ヘキシル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、1, 1, 2-トリメチルプロピル基、3, 3-ジメチルブチル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示す。

[0009] 「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル基」とは、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素原子数3~6個の環状のアルキル基を示し、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ターシャリーペンチル

オキシ基、ネオペンチルオキシ基、2, 3-ジメチルプロピルオキシ基、1-エチルプロピルオキシ基、1-メチルブチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、1, 1, 2-トリメチルプロピルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルコキシ基を示し、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルオキシ基」としては、例えば、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基、ペンテニルオキシ基、ヘキセニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルケニルオキシ基を示し、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニルオキシ基」としては、例えば、プロピニルオキシ基、ブチニルオキシ基、ペンチニルオキシ基、ヘキシニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルオキシ基を示す。

[0010] 「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基」としては、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ターシャリーペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、2, 3-ジメチルプロピルチオ基、1-エチルプロピルチオ基、1-メチルブチルチオ基、ノルマルヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、1, 1, 2-トリメチルプロピルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルチオ基を示し、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基」としては、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ノルマルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ターシャリーペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、2, 3-ジメチルプロピルスルフィニル基、1-エチルプロピルスルフィニル基、1-メチルブチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルフィニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルスルフィニル基を示し、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基」としては、

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

[0011] 上記「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル基」、「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル基」、「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキルオキシ基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルオキシ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニルオキシ基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルチオ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニルチオ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルスルフィニル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニルスルフィニル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルスルホニル基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニルスルホニル基」、「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル基」、「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニルオキシ基」、「(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニルオキシ基」、「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ基」、「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキルスルフィニル基」又は「(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキルスルホニル基」の置換し得る位置に1又は2以上のハロゲン原子が置換されていても良く、置換されるハロゲン原子が2以上の場合は、ハロゲン原子は同一又は異なっても良い。

[0012] 上記1又は2以上のハロゲン原子が置換された置換基は、それぞれ、「ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基」、「ハロ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル基」、「ハロ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル基」、「ハロ(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル基」、「ハロ(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキルオキシ基」、「ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ

シ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルケニルオキシ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルキニルオキシ基」、「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ基」、「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルフィニル基」、「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルホニル基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルケニルチオ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルキニルチオ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルケニルスルフィニル基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルキニルスルフィニル基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルケニルスルホニル基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルキニルスルホニル基」、「ハロ ( $C_3-C_6$ ) シクロアルキル基」、「ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルコキシ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルケニルオキシ基」、「ハロ ( $C_2-C_6$ ) アルキニルオキシ基」、「ハロ ( $C_3-C_6$ ) シクロアルキルチオ基」、「ハロ ( $C_3-C_6$ ) シクロアルキルスルフィニル基」又は「ハロ ( $C_3-C_6$ ) シクロアルキルスルホニル基」を示す。本発明における置換基自体の意義及び例示はいずれも、当該技術分野において当業者にとって自明のものである。

[0013] 「( $C_1-C_6$ )」、「( $C_2-C_6$ )」、「( $C_3-C_6$ )」等の表現は各種置換基の炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「( $C_1-C_6$ ) アルコキシ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基」の場合は直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1~6 個のアルコキシ基が直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1~6 個のアルキル基に結合していることを示す。

[0014] 「アリール基」とは、例えば、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の炭素数 6~10 個の芳香族炭化水素基を示す。

[0015] 「複素環基」とは、例えば、フリル、チエニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、トリアジニル等の酸素原子、窒素原子、硫黄原子等のヘテロ原子を 1~5 個有する 5~6 員の単環式芳香族ヘテロ環基；キノリル、イソキノリル、キナゾリル、キノキサリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ベンズイソオ

キサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、インドリル、インダゾリル、ピロロピラジニル、イミダゾピリジニル、イミダゾピラジニル、ピラゾロピリジニル、ピラゾロチエニル、ピラゾロトリアジニル等の酸素原子、窒素原子、硫黄原子等のヘテロ原子を1～5個有する9～18員の芳香族縮合ヘテロ環基等を示す。

[0016] 本発明の一般式(1)で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

[0017] 本発明の一般式(1)で表されるが架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物及びその塩類は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉中心を有する場合があります、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(1)で表される化合物及びその塩類は、その構造式中に炭素-炭素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。本発明の化合物はオキシム基によるシン異性体(Z異性体)とアンチ異性体(E異性体)があるが、本発明はいずれの異性体であってもよく、また、それらの任意の割合の異性体混合物であってもよい。

[0018] 本発明の一般式(1)で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類において、一般式(1)中、R<sup>1</sup>は、(a1)水素原子又は(a4)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基が好ましく、R<sup>2</sup>は、(b1)水素原子又は(b2)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基が好ましく、R<sup>3</sup>は、(c2)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基；(c3)ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基；(c6)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基；(c7)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル

基又は(c8) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基が好ましく、R<sup>4</sup>は、(d1)水素原子；(d2)ハロゲン原子；(d3)シアノ基；(d4) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；(d5) (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルケニル基；(d6) (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル基；(d7) (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) アルキニル基；(d8) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基；(d9) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；(d10) R<sup>6</sup>(R<sup>7</sup>)N基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ。)；(d11) NR<sup>6</sup>CON (R<sup>6</sup>) R<sup>7</sup>基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ。)；(d12)アリール基；(d13) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される1~4の置換基を環上に有するアリール基；(d14)複素環基又は(d15)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される1~3の置換基を環上に有する複素環基を示し、Aは、窒素原子又はC-R<sup>5</sup> (ここで、R<sup>5</sup>は、(e1)水素原子；(e2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基又は(e3)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示す。)が好ましい。

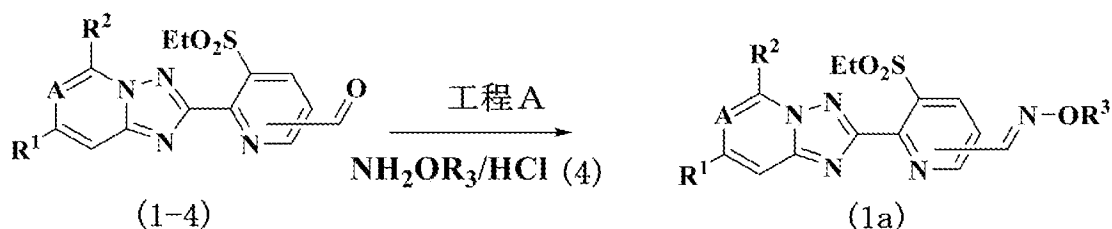
更に、好ましくは、R<sup>1</sup>が、(a1)水素原子又は(a4)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基であり、R<sup>2</sup>が、(b1)水素原子又は(b2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基であり、R<sup>3</sup>が、(c2) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；(c3)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；(c6) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基；又は(c8) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基を示し、R<sup>4</sup>が、(d1)水素原子；

(d2)ハロゲン原子；(d6) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル基；(d8) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ基；(d12)アリール基又は(d13)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される1～4の置換基を環上に有するアリール基であり、Aが、窒素原子又はC-R<sup>5</sup>（ここで、R<sup>5</sup>は、(e1)水素原子又は(e3)ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基を示す。）である。

[0019] 本発明の架橋部に窒素原子を有する架橋部に窒素原子を有する複合複素環化合物又はその塩類は、例えば、国際公開第2017/065183号パンフレット、国際公開第2018/124129号パンフレットに記載された方法、又は下記製造方法によって製造することができるが、本発明はこれらに限定されるものではない。また本発明の製造方法で使用される中間化合物は、市販されているものをそのまま使用することができ、又は市販品から公知の方法により誘導することができる。

[0020] 製造方法1

[化2]



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びAは前記と同じ。)

[0021] 工程 [A] の製造方法

一般式 (1 a) で表される化合物は、後述する製造方法3に記載の方法で製造した一般式 (1 - 4) で表される化合物と一般式 (4) で表される化合物 (NH<sub>2</sub>OR<sub>3</sub>) とを、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることによ

り製造することができる。

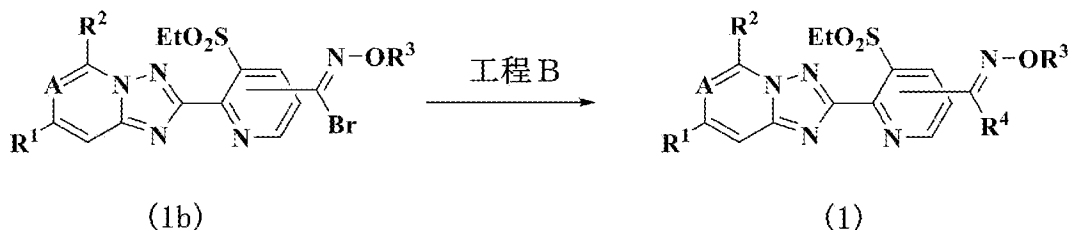
[0022] 本反応で使用することができる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸カリウム等の酢酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8 - ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック - 7 - エン等の第三級アミン類、ピリジン、4 - ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (4) で表される化合物に対して通常 1 倍モル ~ 10 倍モルの範囲で使用される。

[0023] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の非極性溶媒、極性溶媒等又は水等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

[0024] 本反応は等モル反応であるので、各化合物を等モル量使用すれば良いが、いずれかの化合物を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分 ~ 48 時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0025] 製造方法 2

[化3]



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びAは前記と同じ。)

[0026] 工程 [B] の製造方法

一般式 (1) で表される化合物は、後述する製造方法 4 に記載の方法で製造した一般式 (1 b) で表される化合物とナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ジメチルアミノ基、又は 1, 2, 4 - トリアゾール等の求核剤とを反応させることにより製造することができる。

[0027] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の非極性溶媒、極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができる。これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

[0028] 本反応は等モル反応であるので、一般式 (1 b) で表される化合物と求核剤とを等モル使用すれば良いが、求核剤を過剰に使用することもできる。反応温度は - 10 °C から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分 ~ 48 時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製するこ

とにより目的物を製造することができる。

[0029] また、一般式(1)で表される化合物は、一般式(1b)で表される化合物と対応するボロン酸類( $R^4B(OH)_2$ )とを金属触媒及び塩基の存在下、不活性溶媒中にて、クロスカップリング反応を行い、製造することができる。

[0030] 本反応で使用することができる金属触媒としては、例えば、パラジウム触媒、ニッケル触媒、鉄触媒、ルテニウム触媒、白金触媒、ロジウム触媒、イリジウム触媒等を列挙することができる。これらの金属触媒は、金属、担持金属、金属の塩化物、臭化物、ヨウ化物、硝酸塩、硫酸塩、炭酸塩、シュウ酸塩、酢酸塩または酸化物等の金属塩、オレフィン錯体、ホスフィン錯体、アミン錯体、アンミン錯体又はアセチルアセトナート錯体等の錯化合物を用いることができる。好ましくはパラジウム触媒である。

[0031] パラジウム触媒としては、パラジウム黒、パラジウムスポンジ等のパラジウム金属が例示でき、また、パラジウム／アルミナ、パラジウム／炭素、パラジウム／シリカ、パラジウム／Y型ゼオライト等の担持パラジウム金属も例示できる。また、塩化パラジウム、臭化パラジウム、ヨウ化パラジウム、酢酸パラジウム等の金属塩を例示できる。さらに、 $\pi$ -アリルパラジウムクロリドダイマー、パラジウムアセチルアセトナート、ジクロロビス(アセトニトリル)パラジウム、ジクロロビス(ベンゾニトリル)パラジウム、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(クロロホルム付加物)、ジクロロジアミンパラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリシクロヘキシルホスフィン)パラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロ[1, 2-ビス(ジフェニルホスフィノ)エタン]パラジウム、ジクロロ[1, 3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム、ジクロロ[1, 4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム、ジクロロ[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム、ジフェ

ニルホスフィノフェロセンジクロロパラジウム・ジクロロメタン錯体等の錯化合物を例示できる。

[0032] これらのパラジウム触媒は単独で使用しても良いが、さらに第三級ホスフィンと組み合わせて使用しても良い。使用することのできる第三級ホスフィンとしては、トリフェニルホスフィン、トリメチルホスフィン、トリエチルホスフィン、トリブチルホスフィン、トリ(*tert*-ブチル)ホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリー-*o*-トリルホスフィン、トリオクチルホスフィン、9,9-ジメチル-4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)キサンテン、2-(ジ-*tert*-ブチルホスフィノ)ビフェニル、2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)ビフェニル、1,2-ビス(ジフェニルホスフィノ)エタン、1,3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン、1,4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン、1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン、(R)-(+) -2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル、(S)-(-) -2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル、(+/-) -2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル等が例示できる。

[0033] 本反応で使用することができるホウ酸化合物としては、フェニルボロン酸、3-カルボキシフェニルボロン酸、4-クロロフェニルボロン酸、4-(4-プロピルシクロヘキシル)フェニルボロン酸、4-フルオロフェニルボロン酸、4-トリフルオロメチルフェニルボロン酸、4-トリフルオロメトキシフェニルボロン酸、(4-プロピルシクロヘキシル)フェニルボロン酸、シクロプロピルボロン酸等を例示することができ、これらは市販されているものを使用することができる。

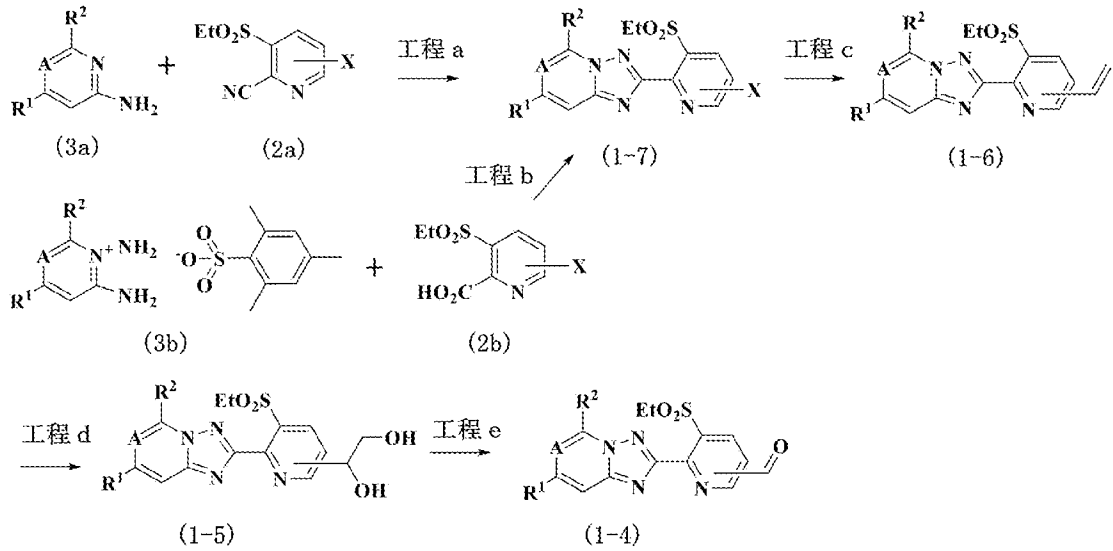
[0034] 本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類が挙げられる。塩基の使用量は一般式(1b)で表される化合物に対して通常約1倍モル~5倍モルの範囲で使用できる。

[0035] 本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン（DME）等の鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1，3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の非極性溶媒、極性溶媒及び水等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0036] 本反応における反応温度は通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0037] 製造方法3

## [化4]



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、及びAは前記と同じ。Xはハロゲン原子を示す。)

## [0038] 工程 [ a ] の製造方法

一般式 ( 1 - 7 ) で表される化合物は、一般式 ( 3 a ) で表される化合物と一般式 ( 2 a ) で表される化合物とを、J. Am. Chem. Soc., 2009, 131, 15080-15081又は国際公開第2013/041472号パンフレットに記載された方法に従って製造することができ、反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

## [0039] 工程 [ b ] の製造方法

また、一般式 ( 1 - 7 ) で表される化合物は、J. Heterocyclic Chem., 1975, 12, 107-110、又は国際公開第2015/000715号パンフレットに記載された方法に従って製造した一般式 ( 3 b ) で表される化合物と一般式 ( 2 b ) で表される化合物とを、前記文献に記載された方法に従って製造することもでき、反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することが

できる。

[0040] 工程 [c] の製造方法

一般式 (1 - 6) で表される化合物は、一般式 (1 - 7) で表される化合物とビニルホウ酸化合物とを金属触媒及び塩基の存在下、不活性溶媒中にて、クロスカップリング反応を行い製造することができる。

[0041] 本反応で使用することができる金属触媒としては、例えば、パラジウム触媒、ニッケル触媒、鉄触媒、ルテニウム触媒、白金触媒、ロジウム触媒、イリジウム触媒等を列挙することができる。これらの金属触媒は、金属、担持金属、金属の塩化物、臭化物、ヨウ化物、硝酸塩、硫酸塩、炭酸塩、シュウ酸塩、酢酸塩または酸化物等の金属塩、オレフィン錯体、ホスフィン錯体、アミン錯体、アンミン錯体又はアセチルアセトナート錯体等の錯化合物を用いることができる。

[0042] パラジウム触媒としては、パラジウム黒、パラジウムスポンジ等のパラジウム金属が例示でき、また、パラジウム／アルミナ、パラジウム／炭素、パラジウム／シリカ、パラジウム／Y型ゼオライト等の担持パラジウム金属も例示できる。また、塩化パラジウム、臭化パラジウム、ヨウ化パラジウム、酢酸パラジウム等の金属塩を例示できる。さらに、 $\pi$ -アリルパラジウムクロリドダイマー、パラジウムアセチルアセトナート、ジクロロビス (アセトニトリル) パラジウム、ジクロロビス (ベンゾニトリル) パラジウム、ビス (ジベンジリデンアセトン) パラジウム、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (クロロホルム付加物)、ジクロロジアミンパラジウム、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム、ジクロロビス (トリシクロヘキシルホスフィン) パラジウム、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム、ジクロロ [1, 2-ビス (ジフェニルホスフィノ) エタン] パラジウム、ジクロロ [1, 3-ビス (ジフェニルホスフィノ) プロパン] パラジウム、ジクロロ [1, 4-ビス (ジフェニルホスフィノ) ブタン] パラジウム、ジクロロ [1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] パラジウム、ジフェ

ニルホスフィノフェロセンジクロロパラジウム・ジクロロメタン錯体等の錯化合物を例示できる。

[0043] これらのパラジウム触媒は単独で使用しても良いが、さらに第三級ホスフィンと組み合わせて使用しても良い。使用することのできる第三級ホスフィンとしては、トリフェニルホスフィン、トリメチルホスフィン、トリエチルホスフィン、トリブチルホスフィン、トリ（*tert*-ブチル）ホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリー-*o*-トリルホスフィン、トリオクチルホスフィン、9,9-ジメチル-4,5-ビス（ジフェニルホスフィノ）キサンテン、2-（ジ-*tert*-ブチルホスフィノ）ビフェニル、2-（ジシクロヘキシルホスフィノ）ビフェニル、1,2-ビス（ジフェニルホスフィノ）エタン、1,3-ビス（ジフェニルホスフィノ）プロパン、1,4-ビス（ジフェニルホスフィノ）ブタン、1,1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン、（*R*）-（+）-2,2'-ビス（ジフェニルホスフィノ）-1,1'-ビナフチル、（*S*）-（-）-2,2'-ビス（ジフェニルホスフィノ）-1,1'-ビナフチル、（+/-）-2,2'-ビス（ジフェニルホスフィノ）-1,1'-ビナフチル等が例示できる。

[0044] 本反応で使用することができるビニルホウ酸化合物としては、臭化ビニルマグネシウム、塩化ビニルマグネシウム、塩化ビニル亜鉛、トリブチルビニルズ、ビニルトリフルオロホウ酸カリウム、ビニルホウ酸、ビニルホウ酸無水物、ビニルホウ酸2-メチル-2,4-ペンタンジオールエステル、ビニルホウ酸ピナコールエステル、トリエトキシビニルシラン等を例示することができる。

[0045] 本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類が挙げられる。塩基の使用量は一般式（1-6）で表される化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用できる。

[0046] 本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないもの

であれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン（DME）等の鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の非極性溶媒、極性溶媒及び水等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0047] 本反応における反応温度は通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0048] 工程 [d] の製造方法

一般式（1-5）で表されるジオール縮合複素環化合物は、一般式（1-6）で表されるビニル縮合複素環化合物を四酸化オスミウムと酸化剤の存在下、第4版実験化学講座23、有機化学V、-酸化反応-（丸善株式会社）に記載してある方法に従って製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。また、精製せずに次工程を行うこともできる。

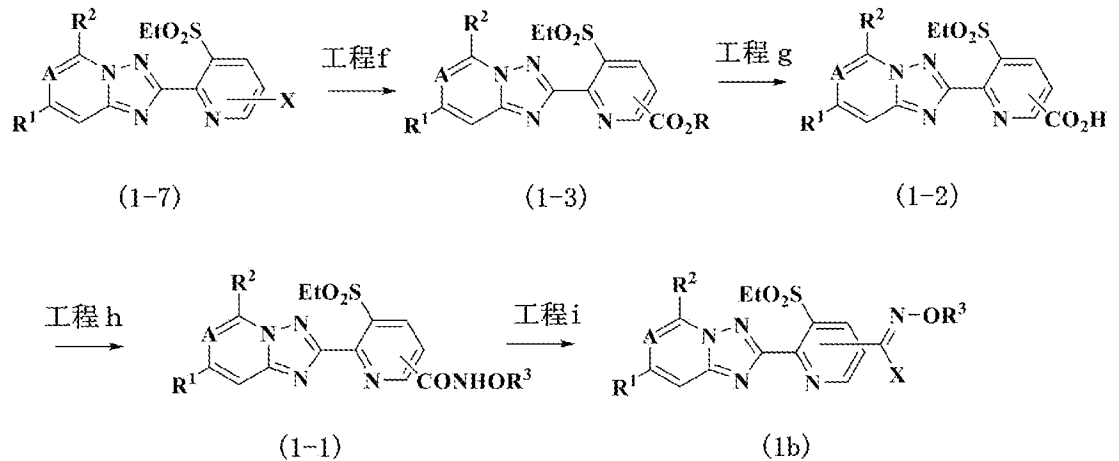
[0049] 工程 [e] の製造方法

一般式（1-4）で表される化合物は、一般式（1-5）で表されるジオ

ール化合物と過ヨウ素酸化合物を、不活性溶媒の存在下、新実験化学講座 15、酸化と還元 1-1 (丸善株式会社) に記載してある方法に従って反応させ製造することかできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0050] 製造方法 4

[化5]



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

[0051] 工程 [ f ] の製造方法

一般式 (1-3) で表される化合物は、上記製造方法 3 に記載の方法で製造した一般式 (1-7) で表される化合物を、特開 2005-272338 号に記載された方法、いわゆる、ヘック反応に従って、製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、所望により再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0052] 工程 [ g ] の製造方法

一般式 (1-2) で表される化合物は、一般式 (1-3) で表される化合物を塩基又は及び不活性溶媒下、加水分解させることにより製造することができる。

[0053] 本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類が挙げられる。

[0054] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒及び水を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0055] 反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0056] 工程 [h] の製造方法

一般式 (1 - 1) で表される化合物は、一般式 (1 - 2) で表される化合物と  $R^3O-NH_2$  ( $R^3$ は、前記と同じ。) で表される化合物とを、縮合剤、及び塩基存在下、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。

[0057] 本反応で使用する縮合剤としては、例えば1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチル塩酸塩 (EDCI)、カルボジイミド塩酸塩シアノリン酸ジエチル (DEPC)、カルボニルジイミダゾール (CDI)、1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウム等を例示することができ、その使用量は一般式 (1 - 2) で表される化合物に対して1倍モル～1.5倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

[0058] 塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類；カリウム *t*-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック-7-エン等の第三級アミン類；ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は (1 - 2) で表される化合物に対して通常 1 倍モル～10 倍モルの範囲で使用される。

[0059] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類；酢酸エチル等のエステル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0060] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

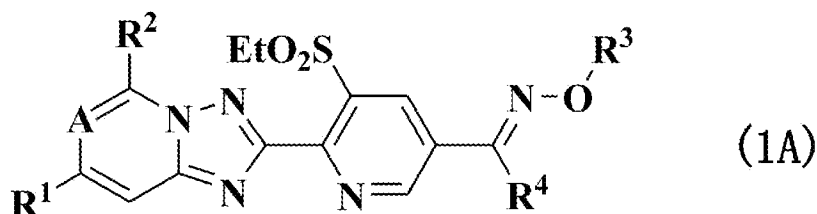
[0061] 工程 [ i ] の製造方法

一般式 (1 b) で表される化合物は、一般式 (1 - 1) で表される化合物

を、トリフェニルホスフィンと四塩化炭素又は四臭化炭素と反応させる、いわゆるアッペル反応 (Org. Synth. 54, 63-63) にて製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0062] 次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。下記の表において、Me はメチル基、Et は、n-Pr はノルマルプロピル基、i-Pr はイソプロピル基、c-Pr はシクロプロピル基、Vinyl はビニル基、Ph はフェニル基、Py はピリジル基、Ac はアセチル基を示す。物性は融点 (°C) 又は<sup>1</sup>H-NMRを示す。第10表に<sup>1</sup>H-NMRデータを示す。

[0063] [化6]



[0064]

[表1]

第1表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	A	物性値
1-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH	
1-2	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	CH	
1-3	CF <sub>3</sub>	Et	H	H	CH	188-189
1-4	CF <sub>3</sub>	n-Pr	H	H	CH	
1-5	CF <sub>3</sub>	i-Pr	H	H	CH	184-185
1-6	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH	191-192
1-7	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH	189-190
1-8	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	CH	171-172
1-9	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH	164-165
1-10	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	CH	
1-11	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	CH	
1-12	CF <sub>3</sub>	Et	Me	H	CH	
1-13	CF <sub>3</sub>	n-Pr	Me	H	CH	
1-14	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	H	CH	
1-15	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	H	CH	210-211
1-16	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	H	CH	169-170
1-17	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me	H	CH	
1-18	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	H	CH	
1-19	H	H	H	H	CCF <sub>3</sub>	
1-20	H	Me	H	H	CCF <sub>3</sub>	
1-21	H	Et	H	H	CCF <sub>3</sub>	
1-22	H	n-Pr	H	H	CCF <sub>3</sub>	
1-23	H	i-Pr	H	H	CCF <sub>3</sub>	
1-24	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	155-156
1-25	H	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	187-188
1-26	H	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	145-146
1-27	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	159-160

[0065]

[表2]

第2表

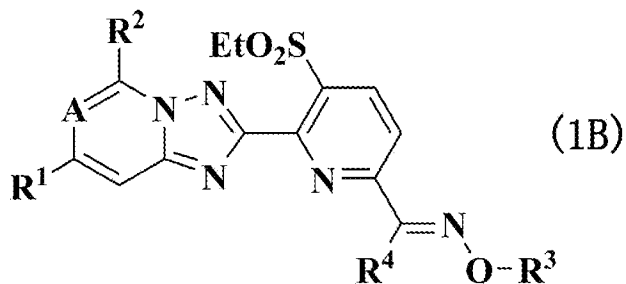
化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	A	物性値
1-28	CF <sub>3</sub>	H	H	H	N	
1-29	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	N	
1-30	CF <sub>3</sub>	Et	H	H	N	
1-31	CF <sub>3</sub>	n-Pr	H	H	N	
1-32	CF <sub>3</sub>	i-Pr	H	H	N	
1-33	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	N	
1-34	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	
1-35	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	N	
1-36	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	
1-37	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	N	
1-38	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	H	H	N	
1-39	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	H	H	N	
1-40	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	n-Pr	H	H	N	
1-41	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	H	H	N	
1-42	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	N	
1-43	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	
1-44	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	N	
1-45	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	
1-46	H	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	151-152
1-47	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	H	CH	162-164 (TLC 上) *1
1-48	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	H	CH	140-141 (TLC 下) *1
1-49	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH	243-245
1-50	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH	148-149 (TLC 上) *2
1-51	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH	82-83 (TLC 下) *2
1-52	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH	223-225

\*1 1-47及び1-48の化合物は異性体 (Z体とE体) である。

\*2 1-50及び1-51の化合物は異性体 (Z体とE体) である。

[0066]

[化7]



[0067] [表3]

第3表

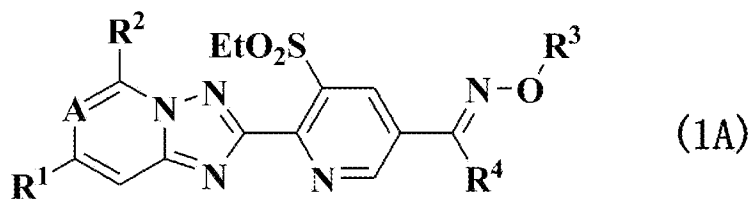
化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	A	物性値
2-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH	
2-2	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	CH	
2-3	CF <sub>3</sub>	Et	H	H	CH	
2-4	CF <sub>3</sub>	n-Pr	H	H	CH	
2-5	CF <sub>3</sub>	i-Pr	H	H	CH	
2-6	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH	135-136
2-7	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH	172-173
2-8	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	CH	53-54
2-9	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CH	
2-10	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	CH	
2-11	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	CH	
2-12	CF <sub>3</sub>	Et	Me	H	CH	
2-13	CF <sub>3</sub>	n-Pr	Me	H	CH	
2-14	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	H	CH	
2-15	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	H	CH	174-175
2-16	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	H	CH	167-168
2-17	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me	H	CH	141-142
2-18	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	H	CH	
2-19	H	H	H	H	CCF <sub>3</sub>	
2-20	H	Me	H	H	CCF <sub>3</sub>	NMR
2-21	H	Et	H	H	CCF <sub>3</sub>	
2-22	H	n-Pr	H	H	CCF <sub>3</sub>	
2-23	H	i-Pr	H	H	CCF <sub>3</sub>	
2-24	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	NMR
2-25	H	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	168-170
2-26	H	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	
2-27	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	CCF <sub>3</sub>	

[0068] [表4]

第4表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	A	物性値
2-28	CF <sub>3</sub>	H	H	H	N	
2-29	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	N	
2-30	CF <sub>3</sub>	Et	H	H	N	
2-31	CF <sub>3</sub>	n-Pr	H	H	N	
2-32	CF <sub>3</sub>	i-Pr	H	H	N	
2-33	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	N	
2-34	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	
2-35	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	N	
2-36	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	
2-37	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	N	
2-38	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	H	H	N	
2-39	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	H	H	N	
2-40	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	n-Pr	H	H	N	
2-41	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	H	H	N	
2-42	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	N	141-142
2-43	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	171-172
2-44	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	H	H	N	
2-45	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	H	H	N	
2-46	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	N	
2-47	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	N	
2-48	CF <sub>3</sub>	Et	Me	H	N	190-191
2-49	CF <sub>3</sub>	n-Pr	Me	H	N	
2-50	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	H	N	
2-51	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	H	N	198-199
2-52	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	H	N	186-187
2-53	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me	H	N	
2-54	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Me	H	N	

[0069] [化8]



[0070]

[表5]

第5表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	A	物性値
3-1	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	OMe	H	CH	165-166
3-2	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	OMe	H	CH	
3-3	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OMe	H	CH	
3-4	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CH	
3-5	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CH	
3-6	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CH	
3-7	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHMe	H	CH	
3-8	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHMe	H	CH	
3-9	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHMe	H	CH	
3-10	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	CH	
3-11	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	CH	
3-12	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	CH	
3-13	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHAc	H	CH	
3-14	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHAc	H	CH	
3-15	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHAc	H	CH	
3-16	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	N(Me)Ac	H	CH	
3-17	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	N(Me)Ac	H	CH	
3-18	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N(Me)Ac	H	CH	
3-19	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Br	H	CH	188-189
3-20	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Br	H	CH	
3-21	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	H	CH	
3-22	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	SMe	H	CH	
3-23	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	SMe	H	CH	
3-24	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SMe	H	CH	
3-25	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol-1-yl	H	CH	
3-26	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol-1-yl	H	CH	
3-27	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol-1-yl	H	CH	

[0071]

[表6]

第6表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	A	物性値
3-28	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	c-Pr	H	CH	167-168
3-29	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	c-Pr	H	CH	
3-30	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	c-Pr	H	CH	
3-31	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Vinyl	H	CH	
3-32	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Vinyl	H	CH	
3-33	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Vinyl	H	CH	
3-34	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	H	CH	
3-35	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Me	H	CH	
3-36	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Me	H	CH	
3-37	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	C≡C-c-Pr	H	CH	
3-38	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	C≡C-c-Pr	H	CH	
3-39	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C≡C-c-Pr	H	CH	
3-40	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> Me	H	CH	
3-41	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> Me	H	CH	
3-42	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> Me	H	CH	
3-43	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHCONHMe	H	CH	
3-44	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHCONHMe	H	CH	
3-45	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHCONHMe	H	CH	
3-46	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Ph	H	CH	157-158
3-47	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Ph	H	CH	
3-48	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Ph	H	CH	
3-49	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CN	H	CH	
3-50	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	CN	H	CH	
3-51	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN	H	CH	
3-52	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub> Ph	H	CH	125-127
3-53	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub> Ph	H	CH	
3-54	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub> Ph	H	CH	

[0072]

[表7]

第7表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	A	物性値
3-55	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H	CH	
3-56	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H	CH	
3-57	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H	CH	
3-58	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-4-yl	H	CH	
3-59	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-4-yl	H	CH	
3-60	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-4-yl	H	CH	
3-61	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-5-yl	H	CH	
3-62	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-5-yl	H	CH	
3-63	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-5-yl	H	CH	
3-64	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	OMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-65	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	OMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-66	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-67	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CCF <sub>3</sub>	
3-68	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CCF <sub>3</sub>	
3-69	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CCF <sub>3</sub>	
3-70	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-71	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-72	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-73	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	CCF <sub>3</sub>	
3-74	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	CCF <sub>3</sub>	
3-75	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NMe <sub>2</sub>	H	CCF <sub>3</sub>	
3-76	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHAc	H	CCF <sub>3</sub>	
3-77	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHAc	H	CCF <sub>3</sub>	
3-78	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHAc	H	CCF <sub>3</sub>	
3-79	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	N(Me)Ac	H	CCF <sub>3</sub>	
3-80	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	N(Me)Ac	H	CCF <sub>3</sub>	
3-81	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	N(Me)Ac	H	CCF <sub>3</sub>	

[0073]

[表8]

第8表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	A	物性値
3-82	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Br	H	CCF <sub>3</sub>	151-152
3-83	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Br	H	CCF <sub>3</sub>	
3-84	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	H	CCF <sub>3</sub>	
3-85	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	SMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-86	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	SMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-87	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-88	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol-1-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-89	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol-1-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-90	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1,2,4-Triazol-1-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-91	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	c-Pr	H	CCF <sub>3</sub>	
3-92	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	c-Pr	H	CCF <sub>3</sub>	
3-93	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	c-Pr	H	CCF <sub>3</sub>	
3-94	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Vinyl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-95	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Vinyl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-96	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Vinyl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-97	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	H	CCF <sub>3</sub>	
3-98	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Me	H	CCF <sub>3</sub>	
3-99	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Me	H	CCF <sub>3</sub>	
3-100	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	C≡C-c-Pr	H	CCF <sub>3</sub>	
3-101	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	C≡C-c-Pr	H	CCF <sub>3</sub>	
3-102	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C≡C-c-Pr	H	CCF <sub>3</sub>	
3-103	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> Me	H	CCF <sub>3</sub>	
3-104	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> Me	H	CCF <sub>3</sub>	
3-105	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHCO <sub>2</sub> Me	H	CCF <sub>3</sub>	
3-106	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	NHCONHMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-107	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	NHCONHMe	H	CCF <sub>3</sub>	
3-108	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NHCONHMe	H	CCF <sub>3</sub>	

[0074]

[表9]

第9表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>2</sup>	A	物性値
3-109	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Ph	H	CCF <sub>3</sub>	
3-110	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Ph	H	CCF <sub>3</sub>	
3-111	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Ph	H	CCF <sub>3</sub>	
3-112	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CN	H	CCF <sub>3</sub>	
3-113	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	CN	H	CCF <sub>3</sub>	
3-114	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN	H	CCF <sub>3</sub>	
3-115	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-Py	H	CCF <sub>3</sub>	
3-116	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	3-Py	H	CCF <sub>3</sub>	
3-117	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Py	H	CCF <sub>3</sub>	
3-118	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-119	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-120	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-121	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-4-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-122	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-4-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-123	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-4-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-124	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-5-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-125	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-5-yl	H	CCF <sub>3</sub>	
3-126	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1-Methylpyrazol-5-yl	H	CCF <sub>3</sub>	

[0075] [表10]

第10表 H-NMRデータ

化合物番号	<sup>1</sup> H-NMRデータ(CDCl <sub>3</sub> )
2-20	9.00(s, 1H)、8.58(d, 1H)、8.30(s, 1H)、8.20(d, 1H)、7.94(d, 1H)、7.77(dd, 1H)、4.08(s, 3H)、3.91(q, 2H)、1.40(t, 3H)
2-24	9.01(s, 1H)、8.53(d, 1H)、8.43(s, 1H)、8.20(d, 1H)、7.95(d, 1H)、7.77(dd, 1H)、4.62(q, 2H)、3.92(q, 2H)、1.40(t, 3H)

[0076] 本発明の一般式(1)で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉類を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫、白蟻類等の害虫防除に適している。

[0077] 上記害虫又は線虫類等として以下のものが例示される。

鱗翅目(チョウ目)害虫として例えば、アオイラガ(*Parasa consocia*)、ア

カキリバ(*Anomis mesogona*)、アゲハ(*Papilio xuthus*)、アズキサヤムシガ(*Matsumuraeses azukivora*)、アズキノメイガ(*Ostrinia scapulalis*)、アフリカヨトウ(*Spodoptera exempta*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イガ(*Tinea translucens*)、イグサシンムシガ(*Bactra furfurana*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、イネタテハマキ(*Marasmia exigua*)、イネツトムシ(*Parnara guttata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、イモキバガ(*Brachmia triannulella*)、イラガ(*Monema flavescens*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、ウコンノメイガ(*Pleuroptya ruralis*)、ウメエダシャク(*Cystidia couaggaria*)、ウラナミシジミ(*Lampides boeticus*)、オオスカシバ(*Cephonodes hylas*)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)、オオトビモンシャチホコ(*Phalerodonta manleyi*)、オオミノガ(*Eumeta japonica*)、オオモンシロチョウ(*Pieris brassicae*)、オビカレハ(*Malacosoma neustria testacea*)、カキノヘタムシガ(*Stathmopoda masinissa*)、カキホソガ(*Cuphodes diospyrosella*)、カクモンハマキ(*Archips xylosteanus*)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、カンショシンクイハマキ(*Tetramoera schistaceana*)、キアゲハ(*Papilio machaon hippocrates*)、キマダラコウモリ(*Endoclyta sinensis*)、ギンモンハモグリガ(*Lyonetia prunifoliella*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoneella*)、クリミガ(*Cydia kurokoi*)、クリミドリシンクイガ(*Eucoenogenes aestuosa*)、グレープベリーモス(*Lobesia botrana*)、クロシタアオイラガ(*Latoia sinica*)、クロフタモンマダラメイガ(*Euzophera batangensis*)、クワイホソハマキ(*Phalonidia mesotypa*)、クワゴマダラヒトリ(*Spilosoma imparilis*)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、クワヒメハマキ(*Olethreutes mori*)、コイガ(*Tineola bisselliella*)、コウモリガ(*Endoclyta excrescens*)、コクガ(*Nemapogon granellus*)、コスカシバ(*Synanthedon hector*)、コドリリング(*Cydia pomonella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、サザンピンクボーラー(*Sesamia calamistis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、シバツトガ(*Pediasia teter*

rellus)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、シャチホコガ (*Stauropus fagi persimilis*)、シロイチモジマダラメイガ (*Etiella zinckenella*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、シロテンコウモリ (*Palpifer sexnotata*)、シロナヨトウ (*Spodoptera mauritia*)、イネシロオオメイガ (*Scirpophaga innotata*)、シロモンヤガ (*Xestia c-nigrum*)、スジキリヨトウ (*Spodoptera depravata*)、スジコナマダラメイガ (*Ephestia kuehniella*)、スモモエダシャク (*Angerona prunaria*)、セグロシャチホコ (*Clostera anastomosis*)、ソイビーンルーパー (*Pseudoplusia includens*)、ダイズサヤムシガ (*Matsumuraeses falcana*)、タバコガ (*Helicoverpa assulta*)、タマナギンウワバ (*Autographa nigrisigna*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*)、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、チャマダラメイガ (*Ephestia elutella*)、チャミノガ (*Eumeta minuscula*)、ツマアカシャチホコ (*Clostera anachoreta*)、ツメクサガ (*Heliothis maritima*)、テングハマキ (*Sparganothis pilleriana*)、トウモロコシメイガ (*Busseola fusca*)、ドクガ (*Euproctis subflava*)、トビモンオオエダシャク (*Biston robustum*)、トマトフルーツワーム (*Heliothis zea*)、ナカジロシタバ (*Aedia leucomelas*)、ナシイラガ (*Narosoideus flavidorsalis*)、ナシケンモン (*Viminia runcis*)、ナシチビガ (*Bucculatrix pyrivorella*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、ナシホソガ (*Spulerina astaurota*)、ナシマダラメイガ (*Ectomyelois pyrivorella*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、ネギコガ (*Acrolepiopsis sapporensis*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、バクガ (*Sitotroga cerealella*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、ハマキガの一種 (*Eucosma aporema*)、バラハマキ (*Acleris comariana*)、ヒメクロイラガ (*Scopelodes contractus*)、ヒメシロモンドクガ (*Orgyia thyellina*)、フォールアーミーワーム (*Spodoptera frugiperda*)、フキノメイガ (*Ostrinia zaguliaevi*)、フタオビコヤガ (*Naranga aenescens*)、フタテンカギバモドキ (*Andraca bipunctata*)、ブドウス

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

s virescens)、及びワタリング(*Earias cupreoviridis*)等が挙げられる。

[0078] 半翅目(カメムシ目)害虫として例えば、アオクサカメムシ(*Nezara antennata*)、アカスジカスミカメ(*Stenotus rubrovittatus*)、アカスジカメムシ(*Graphosoma rubrolineatum*)、アカヒゲホソミドリカスミカメ(*Trigonotylus coelestialium*)等、アカヒメヘリカメムシ(*Aeschynteles maculatus*)、アカホシカスミカメ(*Creontiades pallidifer*)、アカホシカメムシ(*Dysdercus cingulatus*)、アカホシマルカイアガラムシ(*Chrysomphalus ficus*)、アカマルカイガラムシ(*Aonidiella aurantii*)、アブラゼミ(*Graptopsaltria nigrofuscata*)、アメリカコバネナガカメムシ(*Blissus leucopterus*)、イセリヤカイガラムシ(*Icerya purchasi*)、イチモンジカメムシ(*Piezodorus hybneri*)、イネカメムシ(*Lagynotomus elongatus*)、イネキイロヒメヨコバイ(*Thaia subrufa*)、イネクロカメムシ(*Scotinophara lurida*)、イバラヒゲナガアブラムシ(*Sitobion ibarae*)、イワサキカメムシ(*Stariodes iwasakii*)、ウスイロマルカイガラムシ(*Aspidiotus destructor*)、ウスモンミドリカスミカメ(*Taylorilygus pallidulus*)、ウメコブアブラムシ(*Myzuspumecola*)、ウメシロカイガラムシ(*Pseudaulacaspis prunicola*)、エンドウヒゲナガアブラムシ(*Acyrtosiphon pisum*)、オオクモヘリカメムシ(*Anacanthocoris stricornis*)、オオクロトビカスミカメ(*Ectometopterus micantulus*)、オオトゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris lewisi*)、オオヘリカメムシ(*Molipteryx fuliginosa*)、オオヨコバイ(*Cicadella viridis*)、オカボノアカアブラムシ(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、オリーブカタカイガラムシ(*Saissetia oleae*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、カシヒメヨコバイ(*Aguriahana quercus*)、カスミカメムシ類(*Lygus* spp.)、カバワタフキマダラアブラムシ(*Euceraphis punctipennis*)、カンキツカイガラムシ(*Andaspis kashicola*)、カンキツカタカイガラムシ(*Coccus pseudomagnoliae*)、カンシャコバネナガカメムシ(*Cavelerius saccharivorus*)、キクグンバイ(*Galeatus spinifrons*)、キクヒメヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphoniella sanborni*)、キマルカイガラムシ(*Aonidiella citrina*)、クサギカメム

シ(*Halyomorpha mista*)、クスグンバイ(*Stephanitis fasciicarina*)、クストガリキジラミ (*Trioza camphorae*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、クリトガリキジラミ (*Trioza quercicola*)、クルミグンバイ(*Uhlertites latius*)、グレープリーフホッパー(*Erythroneura comes*)、クロアシホソナガカメムシ(*Paromius exiguus*)、クロカタマルカイガラムシ (*Duplaspidiotus claviger*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、クロトビカスミカメ(*Halticicellus insularis*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、クロリンゴキジラミ (*Psylla malivorella*)、クワキジラミ (*Anomomeura mori*)、クワコナカイガラムシ(*Pseudococcus longispinis*)、クワシロカイガラムシ(*Pseudaulacaspis pentagona*)、クワワタカイガラムシ (*Pulvinaria kuwacola*)、コアオカスミカメ(*Apolygus lucorum*)、コバネヒヨウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*)、サトウキビコナカイガラムシ(*Saccharicoccus sacchari*)、サトウキビネワタムシ (*Geoica lucifuga*)、サトウノウスイロウンカ (*Numata muiri*)、サンホーゼカイガラムシ(*Comstockaspis perniciososa*)、シトラススノースケール(*Unaspis citri*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、シルバーリーフコナジラミ(*Bemisia argentifolii*)、シロオオヨコバイ(*Cicadella spectra*)、シロマルカイガラムシ (*Aspidiotus hederae*)、スカシヒメヘリカメムシ(*Liorhyssus hyalinus*)、セグロヒメキジラミ (*Calophya nigridorsalis*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ (*Megoura crassicauda*)、ダイコンアブラムシ(*Brevicoryne brassicae*)、ダイズアブラムシ(*Aphis glycines*)、タイワンクモヘリカメムシ (*Leptocorisa oratorius*)、タイワンツマグロヨコバイ(*Nephotettix virescens*)、タイワンヒゲナガアブラムシ (*Uroeucon formosanum*)、タバコカスミカメ (*Cyrtopeltis tenuis*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、チャノカタカイガラムシ (*Lecanium persicae*)、チャノクロホシカイガラムシ (*Parlatoria theae*)、チャノマルカイガラムシ (*Pseudaonidia paeoniae*)、チャノミド

リヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、チャバネアオカメムシ(*Plautia stali*)、チューリップネアブラムシ (*Dysaphis tulipae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum euphorbiae*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ツバキクロホシカイガラムシ (*Parlatoria camelliae*)、ツマグロアオカスミカメ(*Apolygus spinolai*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、ツヤアオカメムシ(*Glaucias subpunctatus*)、テンサイカスミカメ(*Orthotylus flavosparsus*)、トウモロコシアブラムシ(*Rhopalosiphum maidis*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、トゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris parvus*)、トコジラミ(*Cimex lectularius*)、トドキジラミ (*Psylla abietis*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、トベラキジラミ (*Psylla tobirae*)、ナガメ (*Eurydema rugosum*)、ナシアブラムシ (*Schizaphis piricola*)、ナシキジラミ (*Psylla pyricola*)、ナシクロホシカイガラムシ (*Parlatoreopsis pyri*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ナシコナカイガラムシ (*Dysmicoccus wistariae*)、ナシシロナガカイガラムシ (*Lepholeucaspis japonica*)、ナシマルアブラムシ (*Sappaphis piri*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ネギアブラムシ (*Neotoxoptera formosana*)、ハスクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum nymphaeae*)、バラヒメヨコバイ (*Edwardsianarosae*)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspis aspidistrae*)、ハンノキジラミ (*Psylla alni*)、ハンノナガヨコバイ (*Speusotettix subfuscus*)、ハンノヒメヨコバイ (*Alnetoidia alneti*)、ヒエウンカ (*Sogatella panicicola*)、ヒゲナガカスミカメ (*Adelphocoris lineolatus*)、ヒメアカホシカメムシ (*Dysdercus poecilus*)、ヒメクロカイガラムシ (*Parlatoria ziziphi*)、ヒメグンバイ(*Uhlerites debile*)、ヒメトビウンカ(*Laodelphax striatella*)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、ヒメハリカメムシ(*Cletus trigonus*)、ヒメフタテンナガアワフキ (*Clovium punctata*)、ヒメヨコバイ類(*Empoasca sp.*)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ヒラタヒョウタンナガカメムシ(*Pachybrachius luridus*)、フジコナカイガラムシ(*Planococcus kraunhi*)

ae)、フタスジカスミカメ (*Stenotus binotatus*)、フタテンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、フタテンヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ブチヒゲカメムシ (*Dolycoris baccarum*)、ブチヒゲクロカスミカメ (*Adelphocoris triannulatus*)、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*)、ホオズキカメムシ (*Acanthocoris sordidus*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisa acuta*)、ホソコバネナガカメムシ (*Macropes obnubilus*)、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ポテトピシリド (*Paratrioza cockerelli*)、マエキアワフキ (*Aphrophora costalis*)、マキバカスミカメ (*Lygus disponisi*)、マダラカスミカメ (*Lygus saundersi*)、マツコナカイガラムシ (*Crisicoccus pini*)、マツヒメヨコバイ (*Empoasca abietis*)、マツモトコナカイガラムシ (*Crisicoccus matsumotoi*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、マルカメムシ (*Megacopta punctatissimum*)、マルシラホシカメムシ (*Eysarcoris guttiger*)、ミカンカキカイガラムシ (*Lepidosaphes beckii*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、ミカンヒメコナカイガラムシ (*Pseudococcus citriculus*)、ミカンヒメヨコバイ (*Zyginella citri*)、ミカンヒメワタカイガラムシ (*Pulvinaria citricola*)、ミカンヒラタカイガラムシ (*Coccus discrepans*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、ムギカスミカメ (*Stenodema calcaratum*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ムギヒゲナガアブラムシ (*Sitobion akebiae*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*)、ムギヨコバイ (*Sorhoanus tritici*)、ムギワラギクオマルアブラムシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ムラサキカメムシ (*Carpocoris purpureipennis*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*)、ヤナギアブラムシ (*Aphis farinose yanagicola*)

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

[0079] 鞘翅目 (コウチュウ目) 害虫として例えば、アオスジカミキリ (*Xystrocera globosa*)、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*)、アオハナムグリ (*Eucetonia roelofsi*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、アリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、イネネクイハムシ (*Donacia provosti*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、イモサルハムシ (*Colasposoma dauricum*)、イモゾウムシ (*Euscepes postfasciatus*)、インゲンテントウ (*Epilachna varivestis*)、インゲンマメゾウムシ (*Acanthoscelides obtectus*)、ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ウメチョッキリゾウムシ (*Involvulus cupreus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、エンドウゾウムシ (*Bruchus pisorum*)、オオニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctomaculata*)、ガイマイデオキスイ (*Carpophilus dimidiatus*)、カメノコハムシ (*Cassida nebulosa*)、キアシノミハムシ (*Luperomorpha tenebrosa*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、キボシカミキリ (*Psacotheta hilaris*)、キマダラカミキリ (*Aeolesthes chrysothrix*)、クリシギゾウムシ (*Curculio sikkimensis*)、クリヤケシキスイ (*Carpophilus hemipterus*)、コアオハナムグリ (*Oxycetonia jucunda*)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica* spp.)、コガネムシ (*Mimela splendens*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeae*)

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

bius armatus)、リンゴハナゾウムシ(*Anthonomus pomorum*)、ルリハムシ(*Lineidea aenea*)、及びワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)等が挙げられる。

[0080] 双翅目(ハエ目)害虫として例えば、アカイエカ(*Culex pipiens pallens*)、アカザモグリハナバエ(*Pegomya hyoscyami*)、アシグロハモグリバエ(*Liriomyza huidobrensis*)、イエバエ(*Musca domestica*)、イネキモグリバエ(*Chlorops oryzae*)、イネクキミギワバエ(*Hydrellia sasakii*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、イネヒメハモグリバエ(*Hydrellia griseola*)、イネミギワバエ(*Hydrellia griseola*)、インゲンモグリバエ(*Ophiomyia phaseoli*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オウトウショウジョウバエ(*Drosophila suzukii*)、オウトウハマダラミバエ(*Rhacochlaena japonica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、オオキモンノミバエ(*Megaselia spiracularis*)等のノミバエ類、オオチョウバエ(*Clogmia albipunctata*)、キリウジガガンボ(*Tipula aino*)、クロキンバエ(*Phormia regina*)、コガタアカイエカ(*Culex tritaeniorhynchus*)、シナハマダラカ(*Anopheles sinensis*)、ダイコンバエ(*Hylemya brassicae*)、ダイズサヤタマバエ(*Asphondylia* sp.)、タネバエ(*Delia platura*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、ヨーロッパオウトウミバエ(*Rhagoletis cerasi*)、チカイエカ(*Culex pipiens molestus* Forskal)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、チビクロバネキノコバエ(*Bradysia agrestis*)、テンサイモグリハナバエ(*Pegomya cunicularia*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ナスハモグリバエ(*Liriomyza bryoniae*)、ナモグリバエ(*Chromatomyia horticola*)、ネギハモグリバエ(*Liriomyza chinensis*)、ネッタイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ミカンコミバエ(*Dacus dorsalis*)、ミカンバエ(*Dacus tsuneonis*)、ムギアカタマバエ(*Sitodiplosis mosellana*)、ムギキモグリバエ(*Meromyza nigriventris*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、及びリンゴミバエ(*Rhagoletis pomonella*)等が挙げられる。

- [0081] 膜翅目（ハチ目）害虫として例えば、アミメアリ (*Pristomyrmex pungens*)、アリガタバチ類、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、オオズアリ (*Pheidole noda*)、カブラハバチ (*Athalia rosae*)、クリタマバチ (*Dryocosmus kuriphilus*)、クロヤマアリ (*Formica fusca japonica*)、スズメバチ類、セグロカブラハバチ (*Athalia infumata infumata*)、チュウレンジハバチ (*Arge pagana*)、ニホンカブラハバチ (*Athalia japonica*)、ハキリアリ (*Acromyrmex* sp.)、ファイヤーアント (*Solenopsis* spp.)、リンゴハバチ (*Arge mali*)、及びルリアリ (*Ochetellus glaber*)等が挙げられる。
- [0082] 直翅目（バッタ目）害虫として例えば、クサキリ (*Homorocoryphus lineosus*)、ケラ (*Grylotalpa* sp.)、コイナゴ (*Oxya hyla intricata*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、ハネナガイナゴ (*Oxya japonica*)、ヒメクサキリ (*Homorocoryphus jezoensis*)、及びエンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)等が挙げられる。
- [0083] アザミウマ目害虫として例えば、アカオビアザミウマ (*Selenothrips rubrocinctus*)、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、イネクダアザミウマ (*Haplothrips aculeatus*)、カキクダアザミウマ (*Ponticulothrips diospyrosi*)、キイロハナアザミウマ (*Thrips flavus*)、クサキイロアザミウマ (*Anaphothrips obscurus*)、クスクダアザミウマ (*Liothrips floridensis*)、グラジオラスアザミウマ (*Thrips simplex*)、クロゲハナアザミウマ (*Thrips nigropilosus*)、クロトンアザミウマ (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、クワアザミウマ (*Pseudodendrothrips mori*)、コスモスアザミウマ (*Microcephalothrips abdominalis*)、シイオナガクダアザミウマ (*Leeuwenia pasanii*)、シイマルクダアザミウマ (*Litotetothrips pasaniae*)、シトラススリップス (*Scirtothrips citri*)、シナクダアザミウマ (*Haplothrips chinensis*)、ダイズアザミウマ (*Mycterothrips glycines*)、ダイズウスイロアザミウマ (*Thrips setosus*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、チャノクロアザミウマ (*Dendrothrips minowai*)、ツメクサクダアザミウマ (*Haplothrips niger*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ネギクロアザミウマ (*Thrips alliorum*)、ハナ

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

[0084] ダニ目害虫として例えば、アオツツガムシ(*Leptotrombidium akamushi*)、アシノワハダニ(*Tetranychus ludeni*)、アメリカンドックチック (*Dermacentor variabilis*)、イシイナミハダニ(*Tetranychus truncatus*)、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、オウトウハダニ(*Tetranychus viennensis*)、カンザワハダニ(*Tetranychus kanzawai*)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)等のマダニ類、クワガタツメダニ(*Cheyletus malaccensis*)、ケナガコナダニ(*Tyrophagus putrescentiae*)、コナヒヨウヒダニ(*Dermatophagoides farinae*)、セアカゴケグモ(*Latrodectus hasseltii*)、台湾ンカクマダニ(*Dermacentor taiwanicus*)、チャノナガサビダニ(*Acaphylla theavagrans*)、チャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*)、トマトサビダニ(*Aculops lycopersici*)、トリサシダニ(*Ornithonyssus sylvarum*)、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)、ニセナシサビダニ(*Eriophyes chibaensis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、フタトゲチマダニ(*Haemaphysalis longicornis*)、ブラックレグドチック(*Ixodes scapularis*)、ホウレンソウケナガコナダニ(*Tyrophagus similis*)、ホソツメダニ(*Cheyletus eruditus*)、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、ミナミツメダニ(*Cheyletus moorei*)、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*)、ミミヒゼンダニ (*Octodectes cynotis*)、ヤケヒヨウヒダニ(*Dermatophagoides pteronyssus*)、ヤマトチマダニ(*Haemaphysalis flava*)、ヤマトマダニ(*Ixodes ovatus*)、リュウキュウミカンサビダニ(*Phyllocoptruta citri*)、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、ローンスターチック (*Amblyomma americanum*)、及びワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、ロビン

ネダニ (*Rhyzoglyphus robini*)、ネダニモドキの一種 (*Sancassania* sp.) 等が挙げられる。

[0085] シロアリ目害虫として例えば、アマミシロアリ (*Reticulitermes miyatakei*)、アメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、オオシロアリ (*Hodotermopsis japonica*)、カンモンシロアリ (*Reticulitermes* sp.)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flaviceps amianus*)、クシモトシロアリ (*Glyptotermes kushimensis*)、コウシュウイエシロアリ (*Coptotermes quangzhoensis*)、コウシュンシロアリ (*Neotermes kos hunensis*)、コダマシロアリ (*Glyptotermes kodamai*)、サツマシロアリ (*Glyptotermes satsumensis*)、ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*)、ナカジマシロアリ (*Glyptotermes nakajimai*)、ニトベシロアリ (*Pericapritermes nitobei*)、及びヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)等が挙げられる。

[0086] ゴキブリ目害虫として例えば、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、ヒメチャバネゴキブリ (*Blattella lituricollis*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*)、及びワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)等が挙げられる。

[0087] ノミ目として例えば、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、及びニワトリノミ (*Ceratophyllus gallinae*)等が挙げられる。

[0088] 線虫類として例えば、イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*)、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、及びミカンネセンチュウ (*Tylenchus semipene*)

trans)等が挙げられる。

- [0089] 軟体動物類として例えば、スクミリンゴガイ (*Pomacea canaliculata*)、アフリカマイマイ (*Achatina fulica*)、ナメクジ (*Meghimatium bilineatum*)、チャコウラナメクジ (*Lehmannina valentiana*)、コウラナメクジ (*Limax flavus*)、及びウスカワマイマイ (*Acusta despecta sieboldiana*)等が挙げられる。
- [0090] また、本発明の農園芸用殺虫剤は、その他の害虫としてトマトキバガ (*Tuta absoluta*) に対しても強い殺虫効果を有するものである。
- [0091] また防除対象の一つである動物寄生性のダニとして例えば、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、イスカチマダニ (*Haemaphysalis concinna*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ヒゲナガチマダニ (*Haemaphysalis kitaokai*)、イヤスチマダニ (*Haemaphysalis ias*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、シュルツエマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、及びタイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanesis*) のようなマダニ類、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、及びミナミトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*) のようなトリサシダニ類、ナンヨウツツガムシ (*Eutrombicula wichmanni*)、アカツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*)、フトゲツツガムシ (*Leptotrombidium pallidum*)、フジツツガムシ (*Leptotrombidium fuji*)、トサツツガムシ (*Leptotrombidium tosa*)、ヨーロッパアキダニ (*Neotrombicula autumnalis*)、アメリカツツガムシ (*Eutrombicula alfreddugesi*)、及びミヤガワタマツツガムシ (*Helenicula miyagawai*) のようなツツガムシ類、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*)、ウサギツメダニ (*Cheyletiella parasitivorax*)、及びネコツメダニ (*Cheyletiella blakei*) のようなツメダニ類、ウサギキュウセンダニ

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

[0092] 他の防除対象であるノミとして例えば、ノミ目 (*Siphonaptera*) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (*Pulicidae*)、及びナガノミ科 (*Ceratophyllus*) などに属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、メクラネズミノミ (*Leptopsylla segnis*)、ヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*)、及びヤマトネズミノミ (*Monopsyllus anisus*) 等が挙げられる。

[0093] さらに他の防除対象である外部寄生生物としては例えば、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ウマジラミ (*Haematopinus asini*)、ヒツジジラミ (*Dalmanella ovis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ケジラミ (*Phthirus pubis*)、及びアタマジラミ (*Pediculus capitis*) のようなシラミ類、並びにイヌハジラミ (*Trichodectes canis*) のようなハジラミ類、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、ウアイヌカカ (*Culicoides schultzei*)、及びツメトゲブユ (*Simulium ornatum*) のような吸血性双翅目害虫などが挙げられる。

[0094] 他の防除対象である内部寄生生物としては、例えば、エノプリダ目 (*Enoplida*) 寄生虫：トリクリス亜属 (鞭虫) (*Trichuris* spp.)、カピラリア亜属 (毛細線虫) (*Capillaria* spp.)、トリコモソイデス亜属 (*Trichomosoides* spp.)、トリキネラ亜属 (旋毛虫属) (*Trichinella* spp.)、桿線虫目 (*Rhabditia*)、例えば、ミクロネマ亜属 (*Micronema* sp

p. )、ストロンギロイデス亜属 (*Strongyloides* spp. )、  
、円虫目 (*Strongylida*)、例えば、ストロニルス亜属 (円虫)  
(*Strongylus* spp. )、トリオドントホルス亜属 (*Triodontophorus* spp. )、エソファゴドンタス亜属 (*Oesophagodontus* spp. )、トリコネマ亜属 (*Trichonema* spp. )、ギアロセファルス亜属 (*Gyalocephalus* spp. )、シリンドロファリンクス亜属 (*Cylindropharynx* spp. )、ポテリオストムム亜属 (*Poteriostomum* spp. )、シクロコセルクス亜属 (*Cyclococercus* spp. )、シリコステファヌス亜属 (*Cylicostephanus* spp. )、エソファゴストムム亜属 (腸結節虫属) (*Oesophagostomum* spp. )、シャベルチア亜属 (*Chabertia* spp. )、ステファヌルス亜属 (豚腎虫) (*Stephanurus* spp. )、アンシロストマ亜属 (ズビニ鉤虫) (*Ancylostoma* spp. )、ウンシナリア亜属 (*Uncinaria* spp. )、ブノストムム亜属 (*Bunostomum* spp. )、グロボセファルス亜属 (*Globocephalus* spp. )、シンガムス亜属 (交合線虫) (*Syngamus* spp. )、シアストーマ亜属 (*Cyathostoma* spp. )、メタストロンギルス亜属 (肺虫) (*Metastrongylus* spp. )、ジクチオカウルス亜属 (*Dictyocaulus* spp. )、ミュエレリウス亜属 (*Muellerius* spp. )、プロトストロンギルス亜属 (*Protostrongylus* spp. )、ネオストロンギルス亜属 (*Neoststrongylus* spp. )、シストカウルス亜属 (*Cystocaulus* spp. )、ニューモストロンギルス亜属 (*Pneumoststrongylus* spp. )、スピコカウルス亜属 (*Spicocaulus* spp. )、エラホストロンギルス亜属 (*Elaphoststrongylus* spp. )、パレラホストロンギルス亜属 (*Parelaphoststrongylus* spp. )、クレノソマ亜属 (*Crenosoma* spp. )、パラクレノソマ亜属 (P

arelastrongylus spp. )、アンギオストロンギルス亜属 (住血線虫) (Angiostromylus spp. )、エルロストギルス亜属 (Aelurosutrongylus spp. )、フィラロイデス亜属 (Filaroides spp. )、パラフィラロイデス亜属 (Parafilaroides spp. )、トリコストロンギルス亜属 (毛様線虫) (Trichostromylus spp. )、ヘモンクス亜属 (捻転胃虫) (Haemonchus spp. )、オステルタジア亜属 (Ostertagia spp. )、マルシャラジア亜属 (Marshallagia spp. )、クーペリア亜属 (Cooperia spp. )、ネマトジルス亜属 (線虫) (Nematodirus spp. )、ヒオストロンギルス亜属 (Hyostromylus spp. )、オベリスコイデス亜属 (Obeliscooides spp. )、アミドストムム亜属 (Amidostomum spp. )、オルラヌス亜属 (Ollulanus spp. ) 等。

[0095] オキシウリダ目 (Oxyurida) 寄生虫: オキシウリス亜属 (ウマギョウチュウ) (Oxyuris spp. )、エンテロビウス亜属 (ギョウチュウ) (Enterobius spp. )、パッサルルス亜属 (Passalurus spp. )、シファシア亜属 (Syphacia spp. )、アスピキュルリス亜属 (Aspiculuris spp. )、ヘテラキス亜属 (Heterakis spp. ) 等。

[0096] 回虫目 (Ascaridia) 寄生虫: アスカリス亜属 (カイチュウ) (Ascaris spp. )、トキソアスカリス亜属 (Toxascaris spp. )、トキソカラ亜属 (イヌ回虫) (Toxocara spp. )、パラスカリス亜属 (ウマ回虫) (Parascaris spp. )、アニサキス亜属 (Anisakis spp. )、アスカリジア亜属 (回虫) (Ascaridia spp. )、スピルリダ目 (旋尾線虫類) (Spirurida)、例えば、グナトストマ亜属 (顎口虫) (Gnathostoma spp. )、フィサロプテラ亜属 (Physaloptera spp. )、

テラジア亜属 (*Thelazia* spp.)、ゴンギロネマ亜属 (*Gongylonema* spp.)、ハブロンネマ亜属 (*Habronema* spp.)、パラブロンネマ亜属 (*Parabronema* spp.)、ドラスキア亜属 (*Draschia* spp.)、ドラクンクルス亜属 (メディナ虫) (*Dracunculus* spp.) 等。

[0097] フィラリイダ目 (*Filariida*) : ステファノフィラリア亜属 (*Stephanofilaria* spp.)、パラフィラリア亜属 (*Parafilaria* spp.)、セタリア亜属 (*Setaria* spp.)、ロア亜属 (*Loa* spp.)、ジロフィラリア亜属 (イヌ糸状虫) (*Dirofilaria* spp.)、リトモソイデス亜属 (*Litomosoides* spp.)、ブルギア亜属 (*Brugia* spp.)、ウケレリア亜属 (糸状虫) (*Wuchereria* spp.)、オンコセルカ亜属 (*Onchocerca* spp.) 等。

[0098] ギガントリンキダ目 (*Gigantorhynchida*) : フィリコリス亜属 (*Filicollis* spp.)、モニリホルミス亜属 (*Moniliformis* spp.)、マクラカントリンクス亜属 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス亜属 (*Prosthenorchis* spp.) 等が挙げられる。

[0099] 本発明の一般式 (1) で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分とする内部寄生虫防除剤は、中間宿主及び終宿主の体内に生息する寄生虫だけでなく、保虫宿主生体内の寄生虫にも効果を発現する。また、本発明の一般式 (1) で表される化合物は、寄生虫のすべての発育段階に於いて効果を発現する。例えば、原虫類では嚢子、前被嚢型、栄養型或いは無性生殖期の分裂体、アメーバ体、有性生殖期の生殖母体、生殖体、融合体、孢子体などである。線虫類では、卵、幼虫、成虫である。更に、本発明に係わる化合物は、生体内の寄生虫を駆除するだけでなく、感染経路となる環境中に施用する事で予防的に寄生虫の感染を防ぐことが可能である。例えば、畑、公園の土壌からの土壌伝播感染、河川、湖沼、湿地、

水田などの水系からの経皮感染、イヌ、ネコ等の動物の糞からの経口的感染、海水魚、淡水魚、甲殻類、貝類、家畜の生肉などからの経口的感染、蚊、アブ、ハエ、ゴキブリ、ダニ、ノミ、シラミ、サシガメ、ツツガムシ等からの感染などを未然に予防することが可能である。

[0100] 家哺乳動物および鳥類の外部又は内部寄生虫の防除に本発明化合物を使用するにあたっては、有効量の本発明化合物を製剤用添加物とともに経口投与、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内）などの非経口投与；浸漬、スプレー、入浴、洗浄、滴下（pouring-on）およびスポッティング（spotting-on）並びにダスティング（dusting）などの経皮投与；経鼻投与により投与することができる。本発明化合物はまた、細片、プレート、バンド、カラー、イヤーマーク（ear mark）、リムバンド（limb band）、標識装置などを用いた成形製品により投与することができる。投与にあたっては本発明化合物を投与経路に適した任意の剤型とすることができる。

[0101] 任意の剤型としては、粉剤、粒剤、水和剤、ペレット、錠剤、大丸薬、カプセル剤、活性化合物を含む成形製品などの固体調製物；注射用液剤、経口用液剤、皮膚上または体腔中に用いる液剤；滴下（Pour-on）剤、点下（Spot-on）剤、フロアブル剤、乳剤などの溶液調製物；軟膏剤、ゲルなどの半固体調製物などが挙げられる。

固体調製物は、主に経口投与又は水などで希釈して経皮投与に、又は環境処理にて用いることができる。固体調製物は、活性化合物を必要ならば補助剤を加えて適当な賦形剤と共に混合し、そして所望の形状に変えることにより調製できる。適当な賦形剤としては、例えば炭酸塩、炭酸水素塩、リン酸塩、酸化アルミニウム、シリカ、粘土などの無機物質、糖、セルロース、粉碎された穀物、澱粉などの有機物質がある。

[0102] 注射用液剤は、静脈内、筋肉内および皮下に投与できる、注射用液剤は、活性化合物を適当な溶媒に溶解させ、そして必要ならば可溶化剤、酸、塩基、緩衝用塩、酸化防止剤および保護剤などの添加剤を加えることにより調製

できる。適当な溶媒としては、水、エタノール、ブタノール、ベンジルアルコール、グリセリン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、N-メチルピロリドン並びにこれらの混合物、生理学的に許容しうる植物油、注射に適する合成油などがあげられる。可溶化剤としては、ポリビニルピロリドン、ポリオキシエチル化されたヒマシ油およびポリオキシエチル化されたソルビタンエステルなどがあげられる。保護剤には、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステルおよびn-ブタノールなどがある。

[0103] 経口液剤は直接または希釈して投与することができる。注射用液剤と同様に調製することができる。

[0104] フロアブル剤、乳剤などは直接または希釈して経皮的に、または環境処理にて投与できる。

[0105] 皮膚上で用いる液剤は、滴下し、広げ、すり込み、噴霧し、散布するか、または浸漬（浸漬、入浴または洗浄）により塗布することにより投与できる。これらの液剤は注射用液剤と同様に調製できる。

[0106] 滴下（P o u r - o n）剤および点下（S p o t - o n）剤は、皮膚の限定された場所に滴下するか、または噴霧し、これにより活性化合物を皮膚に浸漬させそして全身的に作用させることができる。滴下剤および点下剤は、有効成分を適当な皮膚適合性溶媒または溶媒混合物に溶解するか、懸濁させるか又は乳化することにより調製できる。必要ならば、界面活性剤、着色剤、吸収促進物質、酸化防止剤、光安定剤および接着剤などの補助剤を加えてもよく、溶媒としては、水、アルカノール、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン、ベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテル、アセトン、メチルエチルケトン、芳香族および／または脂肪族炭化水素、植物または合成油、DMF、流動パラフィン、軽質流動パラフィン、シリコーン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピ

ロリドンまたは2, 2-ジメチル-4-オキシメチレン-1, 3-ジオキサソランが挙げられる。吸収促進物質には、DMSO（ジメチルスルホキシド）、ミリスチン酸イソプロピル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、シリコーン油、脂肪族エステル、トリグリセリドおよび脂肪アルコールが挙げられる。酸化防止剤には、亜硫酸塩、メタ重亜硫酸塩、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソールおよびトコフェロールが挙げられる。

[0107] 乳剤は、経口投与、経皮投与または注射として投与できる。乳剤は、有効成分を疎水性相または親水性相に溶解させ、このものを適当な乳化剤により、必要ならばさらに着色剤、吸収促進物質、保護剤、酸化防止剤、遮光剤および増粘物質などの補助剤と共に他の相の溶媒と均質化することにより調製できる。

[0108] 疎水性相（油）としては、パラフィン油、シリコーン油、ゴマ油、アーモンド油、ヒマシ油、合成トリグリセリド、ステアリン酸エチル、アジピン酸ジ-n-ブチル、デウリル酸ヘキシル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、分枝鎖状の短鎖脂肪酸とC<sub>16</sub>~C<sub>18</sub>の飽和脂肪酸とのエステル、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、C<sub>12</sub>~C<sub>18</sub>の脂肪族飽和アルコールのカプリル/カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、ワックス状脂肪酸エステル、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、イソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコールが挙げられる。

[0109] 親水性相としては、水、プロピレングリコール、グリセリン、ソルビトールが挙げられる。

[0110] 乳化剤としては、ポリオキシエチル化されたヒマシ油、ポリオキシエチル化されたモノオレフィン酸ソルビタン、モノステアリン酸ソルビタン、モノステアリン酸グリセリン、ステアリン酸ポリオキシエチル、アルキルフェノールポリグリコールエーテルなどの非イオン性界面活性剤；N-ラウリルβ

ーイミノジプロピオン酸二ナトリウム、レシチンなどの両性界面活性剤；ラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコール硫酸エーテル、モノ／ジアルキルポリグリコールオルトリン酸エステルのモノエタノールアミン塩などの陰イオン性界面活性剤；塩化セチルトリメチルアンモニウムなどの陽イオン性界面活性剤などが挙げられる。

[0111] 他の補助剤として、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ポリアクリレート、アルギネート、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテル、無水マレイン酸の共重合体、ポリエチレングリコール、ワックス、コロイド状シリカが挙げられる。

[0112] 半固体調製物は皮膚上に塗布するか、もしくは広げるか、または体腔中に導入することにより投与できる。ゲルは注射用液剤について上記したように調製した溶液に、軟膏状の粘稠性を有する透明な物質を生じさせるに十分なシクナーを加えることにより調製できる。

[0113] 本発明の内部寄生虫防除剤をヒト以外の哺乳類又は鳥類に属する動物の医薬品として使用する場合、有効成分の最適濃度（有効量）は治療または予防の別、感染寄生虫の種類、感染の型及び程度、剤型などにより変化するが、一般に経口投与の場合は、1日当たり約0.0001から10000mg/kg体重の範囲である。非経口投与の場合は、1日当たり約0.0001から10000mg/kg体重の範囲であり、単回或いは分割して投与される。

[0114] 本発明の内部寄生虫防除剤中の有効成分の濃度は、一般に0.001～100質量%、好ましくは0.001～99%、更に好ましくは0.005～20質量%程度である。本発明の内部寄生虫防除剤は、そのまま投与する組成物でもよく、使用時に適当な濃度に希釈して使用される高濃度な組成物でもよい。

[0115] また、本発明の内部寄生虫防除剤の効果を補強又は補完する目的で既存の内部寄生虫防除剤を併用することもできる。併用にあたっては投与前に2種以上の有効成分を混合した製剤でもよく、異なる2種以上の製剤を別々に投

与してもよい。

[0116] 本発明の一般式(1)で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で育苗施設、水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌等の栽培担体等に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。中でも、作物、花卉等の育苗土壌、移植時の植え穴土壌、株元、灌漑水、水耕栽培における栽培水等に処理して、土壌を介し又は介さずして根から本発明化合物を吸収させることによるいわゆる浸透移行性を利用した施用が好ましい使用形態である。

[0117] 本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる有用植物は特に限定されるものではないが、例えば穀類(稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦、とうもろこし等)、豆類(大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、いんげん豆、落花生等)、果樹・果実類(林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、桜桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ等)、葉・果菜類(キャベツ、トマト、ほうれんそう、ブロッコリー、レタス、たまねぎ、ねぎ(あさつき、わけぎ)、ピーマン、なす、いちご、ペッパー、おくら、にら等)、根菜類(にんじん、馬鈴薯、さつまいも、さといも、だいこん、かぶ、れんこん、ごぼう、にんにく、らっきょう等)、加工用作物(棉、麻、ビート、ホップ、さとうきび、てんさい、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等)、ウリ類(かぼちゃ、きゅうり、すいか、まくわうり、メロン等)、牧草類(オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等)、芝類(高麗芝、ベントグラス等)、香料等鑑賞用作物(ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、生姜等)、花卉類(きく、ばら、カーネーション、蘭、チューリップ、ゆり等)、庭木(いちょう、さくら類、あおき等)、林木(トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧、ユウカリ等)等の植物を挙げる

ことができる。

[0118] 上記「植物」には、イソキサフルトール等のHPPD阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のALS阻害剤、グリホサート等のEPSP合成酵素阻害剤、グルホシネート等のグルタミン合成酵素阻害剤、セトキシジム等のアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤、ブロモキシニル、ジカンバ、2,4-D等の除草剤に対する耐性を古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により耐性を付与された植物も含まれる。

[0119] 古典的な育種法により耐性を付与された「植物」の例としては、イマゼタピル等のイミダゾリノン系ALS阻害型除草剤に耐性のナタネ、コムギ、ヒマワリ、イネがありClearfield（登録商標）の商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によるチフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系ALS阻害型除草剤に耐性のダイズがあり、STSダイズの商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によりトリオンオキシム系、アリアルオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤などのアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物の例としてSRコーン等がある。

またアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物はProc. Natl. Acad. Sci. USA 87巻、7175~7179頁（1990年）等に記載されている。またアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルCoAカルボキシラーゼがWeed Science 53巻、728~746頁（2005年）等に報告されており、こうした変異アセチルCoAカルボキシラーゼ遺伝子を遺伝子組換え技術により植物に導入するもしくは抵抗性付与に関わる変異を植物アセチルCoAカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の植物を作出することができ、さらに、キメラプラスティ技術（Gura T. 1999. Repairing the Ge

nome's Spelling Mistakes, Science 285: 316-318.) に代表される塩基置換変異導入核酸を植物細胞内に導入して植物のアセチルCoAカルボキシラーゼ遺伝子やALS遺伝子等に部位特異的アミノ酸置換変異を導入することにより、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤やALS阻害剤等に耐性の植物を作出することができ、これらの植物に対しても本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる。

[0120] 更に遺伝子組換え植物で発現される毒素として、バチルス・セレウスやバチルス・ポピリエ由来の殺虫性タンパク、バチルス・チューリングエンシス由来のCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の $\delta$ -エンドトキシン、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパク、線虫由来の殺虫タンパク、さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素、糸状菌類毒素、植物レクチン、アグルチニン、トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤、リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリン、ブリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク(RIP)、3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素、エクダイソン阻害剤、HMG-CoAリダクターゼ、ナトリウムチャンネル、カルシウムチャンネル阻害剤等のイオンチャンネル阻害剤、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ、グルカナナーゼ等が挙げられる。

[0121] またこの様な遺伝子組換え植物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C、Cry34AbまたはCry35Ab等の $\delta$ -エンドトキシンタンパク、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパクのハイブリッド毒素、一部を欠損した毒素、修飾された

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

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

[0122] これらの組換え植物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、半翅目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫、線虫類への耐性を植物に付与する。本発明の農園芸用殺虫剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることもできる。

[0123] 本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫あるいは線虫防除に有効な量を当該害虫および線虫の発生が予測される植物に使用すればよく、例えば果樹、穀類、野菜等において発生する害虫および線虫に対しては茎葉部に散布する他に、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。加えて、養液（水耕）栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。

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

[0124] 種子処理の方法としては、例えば、液状又は固体状の製剤を希釈又は希釈

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

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

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

[0125] 作物茎葉部又は貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫若しくは森林害虫等への散布方法としては、乳剤、フロアブル剤等の液体製剤又は水和剤もしくは顆粒水和剤等の固形製剤を水で適宜希釈し、散布する方法、粉剤を散布する方法、又はくん煙等が挙げられる。

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

[0126] 水稻の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤型で施用すればよい。培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。単に、培土と各種製剤

を交互に層状にして施用してもよい。

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

[0127] 畑作物においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等へ処理ができる。畑に直接播種する植物においては、種子への直接処理の他、栽培中の植物の株元への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釈あるいは希釈しない薬剤を液状にて灌注処理を行うこと等ができる。粒剤を播種前の栽培担体と混和させた後、播種するのも好ましい処理である。

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

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

即ち、本発明の一般式（１）で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

[0128] 本発明の組成物（農園芸用殺虫剤又は動物の外部又は内部寄生生物防除剤）は、有効成分の他に必要に応じて農薬製剤又は動物寄生生物防除剤に通常用いられる添加成分を含有することができる。この添加成分としては、固体担体、液体担体等の担体、界面活性剤、分散剤、湿潤剤、結合剤、粘着付与

剤、増粘剤、着色剤、拡張剤、展着剤、凍結防止剤、固結防止剤、崩壊剤、分解防止剤等が挙げられる。その他必要に応じ、防腐剤、植物片等を添加成分に用いてもよい。これらの添加成分は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせて用いてもよい。

[0129] 固体担体としては、例えば石英、クレー、カオリナイト、ピロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類、合成ケイ酸、合成ケイ酸塩、デンプン、セルロース、植物粉末（例えばおがくず、ヤシガラ、トウモロコシ穂軸、タバコ茎等）等の有機固体担体、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、尿素、無機中空体、プラスチック中空体、フュームド シリカ (fumed silica, ホワイトカーボン) 等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせて用いてもよい。

[0130] 液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール等の一価アルコール類や、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類のようなアルコール類、プロピレングリコールエーテル等の多価アルコール化合物類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、エチルエーテル、ジオキサン、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ノルマルパラフィン、ナフテン、イソパラフィン、ケロシン、鉱油等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート、アジピン酸ジメチル等のエステル類、 $\gamma$ -ブチロラクトン

等のラクトン類、ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-アルキルピロリジノン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類、大豆油、なたね油、綿実油、ヒマシ油等の植物油、水等を挙げることができる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0131] 分散剤や湿展剤として用いる界面活性剤としては、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸ジエステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンジアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルホルマリン縮合物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリスチレンポリオキシエチレンブロックポリマー、アルキルポリオキシエチレンポリプロピレンブロックコポリマーエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアミン、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脂肪酸ビスフェニルエーテル、ポリアルキレンベンジルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンスチリルフェニルエーテル、アセチレンジオール、ポリオキシアルキレン付加アセチレンジオール、ポリオキシエチレンエーテル型シリコーン、エステル型シリコーン、フッ素系界面活性剤、ポリオキシエチレンひまし油、ポリオキシエチレン硬化ひまし油等の非イオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、ポリアクリル酸塩、N-メチル-脂肪酸サ

ルコシネート、樹脂酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸塩等のアニオン性界面活性剤、ラウリルアミン塩酸塩、ステアリルアミン塩酸塩、オレイルアミン塩酸塩、ステアリルアミン酢酸塩、ステアリルアミノプロピルアミン酢酸塩、アルキルトリメチルアンモニウムクロライド、アルキルジメチルベンザルコニウムクロライド等のアルキルアミン塩等のカチオン界面活性剤、アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤等が挙げられる。これらの界面活性剤は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0132] 結合剤や粘着付与剤としては、例えばカルボキシメチルセルロースやその塩、デキストリン、水溶性デンプン、キサンタンガム、グアーガム、蔗糖、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテート、ポリアクリル酸ナトリウム、平均分子量6000~20000のポリエチレングリコール、平均分子量10万~500万のポリエチレンオキサイド、燐脂質（例えばセファリン、レシチン等）セルロース粉末、デキストリン、加工デンプン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、架橋ポリビニルピロリドン、マレイン酸とスチレン類の共重合体、（メタ）アクリル酸系共重合体、多価アルコールからなるポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリスチレンスルホン酸の水溶性塩、パラフィン、テルペン、ポリアミド樹脂、ポリアクリル酸塩、ポリオキシエチレン、ワックス、ポリビニルアルキルエーテル、アルキルフェノールホルマリン縮合物、合成樹脂エマルジョン等が挙げられる。

[0133] 増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グアーガム、ダイユウタンガム、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、アクリル系ポリマー、デンプン化合物、多糖類のような水溶性高分子、高純度ベントナイト、フュームドシリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)のような無機微粉等が挙げられる。

[0134] 着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーのような無機顔料、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料のような有

機染料等が挙げられる。

[0135] 凍結防止剤としては、例えば、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類等が挙げられる。

[0136] 固結防止や崩壊促進のための補助剤としては、例えばデンプン、アルギン酸、マンノース、ガラクトース等の多糖類、ポリビニルピロリドン、フェームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)、エステルガム、石油樹脂、トリポリリン酸ナトリウム、ヘキサメタリン酸ナトリウム、ステアリン酸金属塩、セルロース粉末、デキストリン、メタクリル酸エステルの共重合体、ポリビニルピロリドン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、スルホン化スチレン・イソブチレン・無水マレイン酸共重合体、デンプン・ポリアクリロニトリルグラフト共重合体等が挙げられる。

[0137] 分解防止剤としては、例えばゼオライト、生石灰、酸化マグネシウムのような乾燥剤、フェノール化合物、アミン化合物、硫黄化合物、リン酸化合物等の酸化防止剤、サリチル酸化合物、ベンゾフェノン化合物等の紫外線吸収剤等が挙げられる。

[0138] 防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、1, 2-ベンゾチアゾリン-3-オン等が挙げられる。

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

[0139] 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、本発明の農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01~90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、粉剤、粒剤、乳剤又は水和剤とする場合は0.01~50重量部（農園芸用殺虫剤全体の重量に対して0.01~50重量%）が適当である。

[0140] 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用

場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g~10kg、好ましくは0.01g~1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

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

[0141] かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤として例えば、

3,5-xyllyl methylcarbamate(XMC)、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*、*Bacillus thuringiensis*が生成する結晶タンパク毒素、BPMC、Btトキシン系殺虫性化合物、CPCBS(chlorfenson)、DCIP(dichlorodiisopropyl ether)、D-D(1,3-Dichloropropene)、DDT、NAC、0-4-dimethylsulfamoylphenyl 0, 0-diethyl phosphorothioate(DSP)、0-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate(EPN)、tripropylisocyanurate (TPIC)、アクリナトリン(acrinathrin)、アザディラクチン(azadirachtin)、アジンホス・メチル(azinphos-methyl)、アセキノシル(acequinocyl)、アセタミプリド(acetamiprid)、アセトプロール(acetoprole)、アセフェート(acephate)、アバメクチン(abamectin)、アベルメクチン(avermectin-B)、アミドフルメット(amidoflumet)、アミトラズ(amtiraz)、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、アルドリン(aldrin)、アルファーエンドスルファン(alpha-endosulfan)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、アルベンダゾール(albendazole)、アレスリン(allethrin)、イサゾホス(isazofos)、イサミドホス(isamidofos)、イソアミドホス(isoamidofos)、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロカルブ(isoprocarb

: MIPC)、イベルメクチン (ivermectin)、イミシアホス(imicyafos)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イミプロトリン(imiprothrin)、インドキサカルブ(indoxacarb)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、エチオン(ethion)、エチプロール(ethiprole)、エトキサゾール(etoxazole)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrimfos)、エマメクチン (emamectin)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、エンドスルファン(endosulfan)、エンペントリン(empenthrin)、オキサミル(oxamyl)、オキシジメトン・メチル(oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス(oxydeprofos: ESP)、オキシベンダゾール(oxibendazole)、オクスフェンダゾール(oxfendazole)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、オレイン酸ナトリウム(sodium oleate)、カズサホス(cadusafos)、カルタップ(cartap)、カルバリル(carbaryl)、カルボスルファン(carbosulfan)、カルボフラン(carbofuran)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、キシリルカルブ(xylylcarb)、キナルホス(quinalphos)、キノプレン(kinoprene)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロエトカルブ(cloethocarb)、クロチアニジン(clothianidin)、クロフェンテジン(clofentazine)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルジメホルム (chlordimeform)、クロルデン(chlordane)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロルフェナピル(chlorphenapyr)、クロルフェンソン(chlorfenson)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロルベンジレート(chlorobenzilate)、クロロベンゾエート (chlorobenzoate)、ケルセン(ジコホル: dicofol)、サリチオン(salithion)、シアノホス(cyanophos: CYAP)、ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、ジアミダホス(diamidafos)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、シーター-シペルメトリン (theta-cypermethrin)、ジエノクロル(dienochlor)、シエノピラフェン(cyenoxyrafen)、ジオキサベンゾホス(dioxabenzofos)、ジオフェノラン(diofenolan

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

チアジン (nithiazine)、ニテンピラム(nitenpyram)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ハイドロプレン(hydroprene)、バニリップロール(vaniliprole)、バミドチオン(vamidothion)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル (parathion-methyl)、ハルフェンプロックス(halfe nprox)、ハロフェノジド(halofenozide)、ビストリフルロン(bistrifluron)、ビスルタップ(bisultap)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、ヒドロキシプロピルデンブレン(hydroxy propyl starch)、ビナパクリル(binapacryl)、ビフェナゼート(bifenazate)、ビフェントリン(bifenthrin)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclorfos)、ピラフルプロール (pyraflupro le)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、ピリダベン(pyridaben)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、ピリプロール(py rriprole)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ピリミカーブ(pirimicarb)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピレトリン(pyrethrins)、フィプロニル(fipronil)、フェナザキン(fenazaqu in)、フェナミフォス(fenamiphos)、フェニソプロモレート(bromopropylate)、フェニトロチオン(fenitrothion: MEP)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノトリン(phenothrin)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェンスルフォチオン(fensulfothion)、フェンチオン(f enthion: MPP)、フェントエート(phenthoate: PAP)、フェンバレレート(fenvalerate)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フェンプロパトリン(fen propathrin)、フェンベンダゾール(fenbendazole)、フォスチアゼート(fosth iazate)、ブタチオホス(butathiofos)、ブプロフェジン(buprofezin)、フラチオカルブ(furathiocarb)、プラレトリン(prallethrin)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルアジナム(fluzinam)、フルアズロン(fluzuron)、フルエンスルホン (fluensulfone)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(flualinate)、フルピラゾホス(flupyrazofos)、フルフェネリム(flufenerim)、フルフェノクスロン( flufenoxuron)、フルフェンジン(flufenzine)、フルフェンプロックス(flufe

noprox)、フルプロキシフェン(fluproxyfen)、フルブロシスリネート(flubrocylthrinate)、フルベンジアミド(flubendiamide)、フルメトリン(flumethrin)、フルリムフェン(flurimfen)、プロチオホス(prothiofos)、プロトリフェンブト(protrifenbute)、フロニカミド(flonicamid)、プロパホス(propaphos)、プロパルギット(propargite: BPPS)、プロフェノホス(profenofos)、プロフルスリン(profluthrin)、プロポキスル(propoxur: PHC)、ブromoプロピレート(bromopropylate)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、ヘプテノホス(heptenophos)、ペルメトリン(permethrin)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ホキシム(phoxim)、ホサロン(phosalone)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホスチエタン(fosthietan)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホスホカルブ(phosphocarb)、ホスメット(phosmet: PMP)、ポリナクチン複合体(polynactins)、ホルメタネート(formetanate)、ホルモチオン(formothion)、ホレート(phorate)、マシン油(machine oil)、マラチオン(malathion)、ミルベマイシン(milbemycin)、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ミルベメクチン(milbemectin)、メカルバム(mecarbam)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メソミル(methomyl)、メタルデヒド(metaldehyde)、メタフルミゾン(metaflumizone)、メタミドホス(methamidophos)、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、メチオカルブ(methiocarb)、メチダチオン(methidathion: DMTP)、メチルイソチオシアネート(methylisothiocyanate)、メチルネオデカナミド(methylneodecanamide)、メチルパラチオン(methylparathion)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、メトキシクロル(methoxychlor)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、メトフルトリン(metofluthrin)、メトプレレン(methoprene)、メトルカルブ(metolcarb)、メルフルスリン(meperfluthrin)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、モノスルタップ(monosultap)、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、リアノジン

(ryanodine)、ルフェヌロン(lufenuron)、レスメトリン(resmethrin)、レピメクチン(lepimectin)、ロテノン(rotenone)、塩酸レバミゾール(levamisole hydrochloride)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、臭化メチル(methyl bromide)、水酸化トリシクロヘキシルスズ(cyhexatin)、石灰窒素(calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(calcium polysulfide)、硫黄(sulfur)、及び硫酸ニコチン(nicotine-sulfate)等を例示することができる。

[0142] 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤として例えば、アウレオフンギン (aureofungin)、アザコナゾール (azaconazole)、アジチラム (azithiram)、アシペタックス (acypetacs)、アシベンゾラル (acibenzolar)、アシベンゾラルSメチル(acibenzolar-S-methyl)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、アニラジン (anilazine)、アミスルブロム (amisulbrom)、アムプロピルホス (ampropylfos)、アメトクトラジン (ametoctradin)、アリルアルコール (allyl alcohol)、アルジモルフ (aldimorph)、アンバム(amobam)、イソチアニル (isotianil)、イソバレジオン (isovalledione)、イソピラザム (isopyrazam)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イプコナゾール (ipconazole)、イプロジオン (iprodone)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、イプロベンホス (iprobenfos)、イマザリル (imazalil)、イミノクタジン (iminocadine)、イミノクタジンアルベシル酸塩(iminocadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩(iminocadine-triacetate)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、ウニコナゾール (uniconazole)、ウニコナゾールP (uniconazole-P)、エクロメゾール(echlomezole)、エジフェンホス(edifenphos)、エタコナゾール (etaconazole)、エタボキサム (ethaboxam)、エチリモール (ethirimol)、エテム (etem)、エトキシキン (ethoxyquin)、エトリジアゾール(etridiazole)、エネストロブリン (enestroburin)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキシキノリン銅 (copper-8-quinolinolate)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、オキシ銅(

copper-oxinate)、オキスポコナゾール(oxpoconazole)、オキスポコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole-fumarate)、オキシリニック酸(oxolinic acid)、オクチリノン(octhilinone)、オフラセ(ofurace)、オリサストロビン(orysastrobin)、カーバム(metam-sodium)、カスガマイシン(kasugamycin)、カルバモルフ(carbamorph)、カルプロパミド(carpropamid)、カルベンダジム(carbendazim)、カルボキシ(carboxin)、カルボン(carvone)、キナザミド(quinazamid)、キナセトール(quinacetol)、キノキシフェン(quinoxyfen)、キノメチオネート(quinomethionate)、キャプタホール(captafol)、キャプタン(captan)、キララキシル(kiralaxyl)、キンコナゾール(quinconazole)、キントゼン(quintozene)、グアザチン(guazatine)、クフラネブ(cufraneb)、クプロバム(cuprobam)、グリオジン(glyodin)、グリセオフルビン(griseofulvin)、クリムバゾール(climbazole)、クレゾール(cresol)、クレソキシムメチル(kresoxim-methyl)、クロゾリネート(chlozolate)、クロトリマゾール(clotrimazole)、クロベンチアゾン(chlobenthiazole)、クロラニホルメタン(chloraniformethan)、クロラニル(chloranil)、クロルキノックス(chlorquinox)、クロルピクリン(chloropicrin)、クロルフェナゾール(chlorfenazole)、クロロジニトロナフタレン(chlorodinitronaphthalene)、クロロタロニル(chlorothalonil)、クロロネブ(chloroneb)、ザリラミド(zarilamid)、サリチルアニリド(salicylanilide)、シアゾファミド(cyazofamid)、ジエチルピロパカーボナート(diethyl pyrocarbonate)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、シクラフラミド(cyclafuramid)、シクロシメット(diclocymet)、ジクロゾリン(dichlozoline)、ジクロブトラゾール(diclobutrazol)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、シクロヘキシミド(cycloheximide)、ジクロメジン(diclomezine)、ジクロラン(dicloran)、ジクロロフェン(dichlorophen)、ジクロロン(dichlone)、ジスルフィラム(disulfiram)、ジタリムフォス(ditalimfos)、ジチアノン(dithianon)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾールM(diniconazole-M)、ジネブ

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

)、トリチコナゾール (triticonazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリブチルチンオキシド (tributyltin oxide)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリホリン (triforine)、トリルフルアラニド (tolylfluanid)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、ナタマイシン (natamycin)、ナバム (nabam)、ニトロタサルイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ニトロスチレン (nitrostyrene)、ヌアリモール (nuarimol)、ノニルフェノールスルホン酸銅 (copper nonyl phenol sulfonate)、ハラクリネート (halacrinatate)、バリダマイシン (validamycin)、バリフェナラート (valifenalate)、ハルピンタンパク (harpin protein)、ビキサフェン (bixafen)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピコベンザミド (picobenzamide)、ビチオノール (bithionol)、ビテルタノール (bitertanol)、ヒドロキシイソキサゾール (hydroxyisoxazole)、ヒドロキシイソキサゾールカリウム (hydroisoxazole-potassium)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ピペラリン (piperalin)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、ピリオフェノン (pyriofenone)、ピリジニトリル (pyridinitril)、ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキシクロル (pyroxychlor)、ピロキシフル (pyroxyfur)、ピロキロン (pyroquilon)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ファミキサドン (famoxadone)、フェナパニル (fenapanil)、フェナミドン (fenamidone)、フェナミノスルフ (fenaminosulf)、フェナリモール (fenarimol)、フェニトロパン (fenitropan)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェリムゾン (ferimzone)、フェルバム (ferbam)、フェンチン (fentin)、フェンピクロニル (feniclonil)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラム (fenfuram)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェ

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

ボスカリド (boscalid)、ホスジフェン (phosdiphen)、ホセチル (fosetyl)、ホセチルアルミニウム (fosetyl-Al)、ポリオキシシン (polyoxins)、ポリオキシリン (polyoxorim)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ホルペット (folpet)、ホルムアルデヒド (formaldehyde)、マシン油 (machine oil)、マネブ (maneb)、マンコゼブ (mancozeb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、ミクロゾリン (myclozolin)、ミクロブタニル (myclobutanol)、ミルディオマイシン (mildiomycin)、ミルネブ (milneb)、メカルビンジド (mecarbinzid)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メタゾキシロン (metazoxolon)、メタム (metam)、メタムナトリウム塩 (metam-sodium)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルM (metalaxyl-M)、メチラム (metiram)、メチルイソチオシアナート (methyl isothiocyanate)、メチルジノカップ (mepthyldinocap)、メトコナゾール (metconazole)、メトスルホバックス (metsulfovax)、メトフロキサム (methfuroxam)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、メパニピリム (mepanipyrim)、メフェノキサム (mefenoxam)、メプチルジノカップ (meptyldinocap)、メプロニル (mepronil)、メベニル (mebenil)、ヨウ化メチル (iodomethane)、ラベンザゾール (rabenzazole)、塩化ベンザルコニウム (benzalkonium chloride)、塩基性塩化銅 (basic copper chloride)、塩基性硫酸銅 (basic copper sulfate)、金属銀 (silver) 等の無機殺菌剤、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、水酸化第二銅 (cupric hydroxide)、水和硫黄剤 (wetttable sulfur)、石灰硫黄合剤 (calcium polysulfide)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、無機硫黄 (sulfur)、無水硫酸銅 (copper sulfate anhydride)、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル (nickel dimethyldithiocarbamate)、8-ヒドロキシキノリン銅 (oxine copper) のような銅系化合物、硫酸亜鉛 (zinc sulfate)、硫酸銅五水塩 (copper sulfate pentahydrate) 等を例示することができる。

[0143] 同様に除草剤として例えば、1-ナフチルアセトアミド、2,4-PA、2,3,6-TBA

、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、3,4-DA、3,4-DB  
、3,4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、MCPAチオエチル、MCPB、アイ  
オキシニル (ioxynil)、アクロニフェン (aclonifen)、アザフェニジン (a  
zafenidin)、アシフルオルフェン (acifluorfen)、アジプロトリン (azipr  
otryne)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、アシュラム (asulam)、ア  
セトクロール (acetochlor)、アトラジン (atrazine)、アトラトン (atrat  
on)、アニスロン (anisuron)、アニロホス (anilofos)、アビグリシン(av  
iglycine)、アブシジン酸(abscisic acid)、アミカルバゾン (amicarbazone  
)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アミトロール (amitrole)、アミ  
ノシクロピラクロール (aminocyclopyrachlor)、アミノピラリド (aminopyr  
alid)、アミブジン (amibuzin)、アミプロホスメチル (amiprophos-methyl  
)、アメトリジオン (ametridione)、アメトリン (ametryn)、アラクロール  
(alachlor)、アリドクロール (allidochlor)、アロキシジム (alloyydi  
m)、アロラック (alorac)、イソウロン (isouron)、イソカルバミド (iso  
carbamid)、イソキサクロルトール (isoxachlortole)、イソキサピリホッ  
プ (isoxapyrifop)、イソキサフルトール (isoxaflutole)、イソキサベン  
(isoxaben)、イソシル (isocil)、イソノルロン (isonoruron)、イソプ  
ロツロン (isoproturon)、イソプロパリン (isopropalin)、イソポリナー  
ト (isopolinate)、イソメチオジン (isomethiozin)、イナベンフィド(ina  
benfide)、イパジン (ipazine)、イプフェンカルバゾン (ipfencarbazone)  
、イプリミダム (iprymidam)、イマザキン (imazaquin)、イマザピック (i  
mazapic)、イマザピル (imazapyr)、イマザメタピル(imazamethapyr)、イ  
マザメタベンズ (imazamethabenz)、イマザメタベンズメチル(imazamethabe  
nz-methyl)、イマザモックス (imazamox)、イマゼタピル (imazethapyr)、  
イマゾスルフロン (imazosulfuron)、インダジフラム (indaziflam)、イン  
ダノファン (indanofan)、インドール酪酸(indolebutyric acid)、ウニコナ  
ゾール-P(uniconazole-P)、エグリナジン (eglinazine)、エスプロカルブ (e  
sprocarb)、エタメスルフロン (ethametsulfuron)、エタメトスルフロン

メチル(ethametsulfuron-methyl)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、エチオレート (ethiolate)、エチクロゼート-エチル(ethychlozate ethyl)、エチジムロン (ethidimuron)、エチノフェン (etinofen)、エテホン(ethephon)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エトキシフェン (ethoxyfen)、エトニプロミド (etnipromid)、エトフメセート (ethofumesate)、エトベンザニド (etobenzanid)、エプロナズ (epronaz)、エルボン (erbon)、エンドタール (endothal)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、オキサピラゾン (oxapyrazon)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、オリザリン (oryzalin)、オルソスルファミロン (orthosulfamuron)、オルベンカルブ (orbencarb)、カフェンストロール (cafenstrole)、カムベンジクロール (cambendichlor)、カルバスラム (carbasulam)、カルフェントラゾン (carfentrazone)、カルフェントラゾン-エチル(carfentrazone-ethyl)、カルブチレート (karbutilate)、カルベタミド (carbetamide)、カルボキサゾール (carboxazole)、キザロホップ (quizalofop)、キザロホップ-P (quizalofop-P)、キザロホップ-エチル(quizalofop-ethyl)、キシラクロール (xylachlor)、キノクラミン (quinoclamine)、キノナミド (quinonamid)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、クミルロン (cumyluron)、クリオジネート (clodinate)、グリホサート(glyphosate)、グルホシネート (glufosinate)、グルホシネート-P (glufosinate-P)、クレダジン (credazine)、クレトジム (clethodim)、クロキシホナック(cloxyfonac)、クロジナホップ (clodinafop)、クロジナホップ-プロパルギル(clodinafop-propargyl)、クロトルロン (chlorotoluron)、クロピラリド (clopyralid)、クロプロキシジム (cloproxydim)、クロプロップ (cloprop)、クロブロムロン (chlorbromuron)、クロホップ (clofop)、クロマゾン (clomazone)、クロメトキシニル(chlomethoxy ni1)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロメプロップ (clomeprop)、クロラジホップ (chlorazifop)、クロラジン (chlorazine)、クロラス

ラム (cloransulam)、クロラノクリル (chloranocryl)、クロラムベン (chloramben)、クロランスラム-メチル (cloransulam-methyl)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン (chlorimuron)、クロリムロン-エチル (chlorimuron-ethyl)、クオルスルフロン (chlorsulfuron)、クオルタール (chlorthal)、クオルチアミド (chlorthiamid)、クオルトルロン (chlortoluron)、クオルニトロフェン (chlornitrofen)、クオルフェナック (chlorfenac)、クオルフェンプロップ (chlorfenprop)、クオルブファミン (chlorbufam)、クオルフルラゾール (chlorflurazole)、クオルフルレノール (chlorflurenol)、クオルプロカルブ (chlorprocarb)、クオルプロファミン (chlorpropam)、クオルメコート (chlormequat)、クオレットロン (chloreturon)、クオロキシニル (chloroxynil)、クオロクスロン (chloroxuron)、クオロポン (chloropon)、サフルフェナシル (saflufenacil)、シアナジン (cyanazine)、シアナトリン (cyanatryn)、ジアレート (di-allate)、ジウロン (diuron)、ジエタムコート (diethamquat)、ジカンバ (dicamba)、シクルロン (cycluron)、シクロエート (cycloate)、シクロキシジム (cycloxydim)、ジクロスラム (diclosulam)、シクロスルフファミン (cyclosulfamuron)、ジクロプロップ (dichlorprop)、ジクロプロップ-P (dichlorprop-P)、ジクロベニル (dichlobenil)、ジクロホップ (diclofop)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、ジクロメート (dichlormate)、ジクロラルウレア (dichloralurea)、ジクワット (diquat)、シサニリド (cisanilide)、ジスル (disul)、シズロン (siduron)、ジチオピル (dithiopyr)、ジニトラミン (dinitramine)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、ジノサム (dinosam)、シノスルフロン (cinosulfuron)、ジノセブ (dinoseb)、ジノテルブ (dinoterb)、ジノフェナート (dinofenate)、ジノプロップ (dinoprop)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ジフェナミド (diphenamid)、ジフェノクスロン (difenoxuron)、ジフェノペンテン (difenopenten)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、シブトリン (cybutryne)、シプラジン (cyprazine)、シプラゾール (cyprazole)、ジフルフェニカン (diflufenican)

)、ジフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、ジプロペトリン (dipropetryn)、シプロミド (cypromid)、シペルコート (cyperquat)、ジベレリン (gibberellin)、シマジン (simazine)、ジメキサノ (dimexano)、ジメタクロール (dimethachlor)、ジメダゾン (dimidazon)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、シメトリン (simetryn)、シメトン (simeton)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメフロン (dimefuron)、シンメチリン (cinmethylin)、スエップ (swep)、スルグリカピン (sulglycapin)、スルコトリオン (sulcotrione)、スルファレート (sulfallate)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、スルホメツロン (sulfometuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、セクブメトン (sebumeton)、セトキシジム (sethoxydim)、セブチラジン (sebuthylazine)、ターバシル (terbacil)、ダイムロン (damuron)、ダゾメット (dazomet)、ダラポン (dalapon)、チアザフルロン (thiazafluron)、チアゾピル (thiazopyr)、チエンカルバゾン (thiencarbazone)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazone-methyl)、チオカルバジル (tiocarbazil)、チオクロリム (tioclorim)、チオベンカルブ (thioben carb)、チジアジミン (thidiazimin)、チジアズロン (thidiazuron)、チフェンスルフロン (thifensulfuron)、チフェンスルフロンメチル (thifensulfuron-methyl)、デスメディファム (desmedipham)、デスメトリン (desmetryn)、テトラフルロン (tetrafluron)、テニルクロール (thenylchlor)、テブタム (tebutam)、テブチウロン (tebuthiuron)、テルブメトン (terbumeton)、テプラロキシジム (tepraloxymid)、テフリールトリオン (tefuryltrione)、テムボトリオン (tembotrione)、デラクロール (delachlor)、テルバシル (terbacil)、テルブカルブ (terbucarb)、テルブクロール (te rbuchlor)、テルブチラジン (terbuthylazine)、テルブトリン (terbutryn)、トプラメゾン (topramezone)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、トリアジフラム (triaziflam)、トリアスルフロン (triasulfuron)、トリアレート (tri-allate)、トリエタジン (trietazine)、トリカンバ (tricamba

)、トリクロピル (triclopyr)、トリジファン (tridiphane)、トリタック (tritac)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、トリフルスルフロン (triflusulfuron)、トリフルスルフロンメチル(triflusulfuron-methyl)、トリフルラリン (trifluralin)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリプロピンダン (tripropindan)、トリベニューロンメチル(tribenuron-methyl)、トリベヌロン (tribenuron)、トリホップ (trifop)、トリホプシメ (trifopsime)、トリメツロン (trimeturon)、ナプタラム (naptalam)、ナプロアニリド (naproanilide)、ナプロパミド (napropamide)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、ニトラリン (nitralin)、ニトロフェン (nitrofen)、ニトロフルオルフェン (nitrofluorfen)、ニピラクロフェン (nipyraclufen)、ネブロン (neburon)、ノルフルラゾン (norflurazon)、ノルロン (noruron)、バーバン (barban)、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、パラコート (paraquat)、パラフルロン (parafluron)、ハロキシジン (haloxydine)、ハロキシホップ (haloxyfop)、ハロキシホップ-P (haloxyfop-P)、ハロキシホップメチル(haloxyfop-methyl)、ハロサフェン (halosafen)、ハロスルフロン (halosulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ビスクロピロン (bicyclopyrone)、ビスピリバック (bispyribac)、ビスピリバックナトリウム(bispyribac-sodium)、ピダノン (pydanon)、ピノキサデン (pinoxaden)、ピフェノックス (bifenox)、ピペロホス (piperophos)、ヒメキサゾール(hymexazol)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラスルホトール (pyrasulfotole)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピラゾスルフロン (pyrazosulfuron)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラナホス (bilanafos)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、ピリクロール (pyriclor)、ピリダホール (pyridafol)、ピリチオバック (pyrithiobac)、ピリチオバックナトリウム(pyrithiobac-sodium)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyrifthalid)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリベンゾキシム (pyribenzox

im)、ピリミスルファン (pyrimisulfan)、ピリミスルフロン (primisulfuron)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl)、ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、ピロクスラム (pyroxsulam)、フェナスラム (fenasulam)、フェニソファミン (phenisopham)、フェヌロン (fenuron)、フェノキサスルホン (fenoxasulfone)、フェノキサプロップ (fenoxaprop)、フェノキサプロップ-P (fenoxaprop-P)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フェノチオール (phenothio1)、フェノプロップ (fenoprop)、フェノベンズロン (phenobenzuron)、フェンチアプロップ (fenthiaaprop)、フェンテラコール (fenteracol)、フェントラザミド (fentrazamide)、フェンメディファミン (phenmedipham)、フェンメディファミンエチル (phenmedipham-ethyl)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホス (butamifos)、ブチウロン (buthiuron)、ブチダゾール (buthidazole)、ブチレート (butylate)、ブツロン (buturon)、ブテナクロール (butenachlor)、ブトキシジム (butoxydim)、ブトラリン (butralin)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、フラムプロップ (flamprop)、フリロキシフェン (furyloxyfen)、プリナクロール (prynachlor)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、フルアジホップ (fluazifop)、フルアジホップ-P (fluazifop-P)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、フルアゾレート (fluazolate)、フルロキシピル (fluroxypyr)、フルオチウロン (fluothiuron)、フルオメツロン (fluometuron)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen)、フルロクロリドン (flurochloridone)、フルオロジフェン (fluorodifen)、フルオロニトロフェン (fluoronitrofen)、フルオロミジン (fluoromidine)、フルカルバゾン (flucarbazone)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazone-sodium)、フルクロラルイン (fluchloralin)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、フルチアセット (fluthiacet)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェニカン (flufenican)、フルフェンピル (flufenpyr)、フルプロパシル (flupropacil)、フ

ルプロパナート (flupropanate)、フルポキサム (flupoxam)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルミクロラック (flumiclorac)、フルミクロラックペンチル(flumiclorac-pentyl)、フルミプロピン (flumipropyn)、フルメジン (flumezin)、フルオメツロン (fluometuron)、フルメトスラム (flumetsulam)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、フルロキシピル(fluroxypyr)、プレチラクロール (pretilachlor)、プロキサン (proxan)、プログリナジン (proglinazine)、プロシアジン (procyazine)、プロジアミン (prodiamine)、プロスルファリン (prosulfalin)、プロスルフロン (prosulfuron)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、プロパキザホップ (propaquizafoxop)、プロパクロール (propachlor)、プロパジン (propazine)、プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、プロピソクロール (propisochlor)、プロヒドロジャスモン(prohydrojasmon)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron)、プロファム (propham)、プロフルアゾール (profluazol)、プロフルラリン (profluralin)、プロヘキサジオンカルシウム(prohexadione-calcium)、プロポキシカルバゾン (propoxy carbazone)、プロポキシカルバゾンナトリウム(propoxycarbazone-sodium)、プロホキシジム (profoxydim)、ブロマシル (bromacil)、ブロムピラゾン (brompyrazon)、プロメトリン (prometryn)、プロメトン (prometon)、ブロモキシニル (bromoxynil)、ブロモフェノキシム (bromofenoxim)、ブロモブチド (bromobutide)、ブロモボニル (bromobonil)、フロラスラム (florasulam)、ヘキサクロロアセトン (hexachloroacetone)、ヘキサジノン (hexazinone)、ペトキサミド (pethoxamid)、ベナゾリン (benazolin)、ペノクスラム (penoxsulam)、ペブレート (pebulate)、ベフルブタミド (beflubutamid)、ベルノレート (vernolate)、ペルフルイドン (perfluid one)、ベンカルバゾン (bencarbazone)、ベンザドックス (benzadox)、ベンジプラム (benzipram)、ベンジルアミノプリン(benzylaminopurine)、ベンズチアズロン (benzthiazuron)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ベンスリド (bensulide)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)

、ベンゾイルプロップ (benzoylprop)、ベンゾビスクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンゾフルオール (benzofluor)、ベントゾン (bentazone)、ペントノクロール (pentanochlor)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペントキサゾン (pentoxazone)、ベンフラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ホサミン (fosamine)、ホメサフェン (fomesafen)、ホラムスルフロン (foramsulfuron)、ホルクロルフエニユロン (forchlorfenuron)、マレイン酸ヒドラジド (maleic hydrazide)、メコプロップ (mecoprop)、メコプロップ-P (mecoprop-P)、メジノテルブ (medinoterb)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メソスルフロンメチル (mesosulfuron-methyl)、メソトリオン (mesotrione)、メソプラジン (mesoprazine)、メソプロトリン (methoprotetryne)、メタザクロール (metazachlor)、メタゾール (methazole)、メタゾスルフロン (metazosulfuron)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、メタミトロン (metamitron)、メタミホップ (metamifop)、メタム (metam)、メタルプロパリン (methalpropalin)、メチウロン (methiuron)、メチオゾリン (methiozolin)、メチオベンカルブ (methiobencarb)、メチルダイムロン (methyldymron)、メトクスロン (metoxuron)、メトスラム (metosulam)、メトスルフロン (metsulfuron)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)、メトフラゾン (metflurazon)、メトブロムロン (metobromuron)、メトベンズロン (metobenzuron)、メトメトン (methometon)、メトラクロール (metolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メピコートクロリド (mepiquat-chloride)、メフェナセット (mefenacet)、メフルイジド (mefluidide)、モナリド (monalide)、モニソウロン (monisouron)、モニュヌロン (monuron)、モノクロル酢酸 (monochloroacetic acid)、モノリニュヌロン (monolinuron)、モリネート (molinate)、モルフアムコート (morfamquat)、ヨードスルフロン (iodosulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、ヨードボニル (iodobonil)、ヨードメタン (iodomethane)、ラクトフェン (lactofen)、リヌロン (

linuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、レナシル (lenacil)、ローデタニル (rhodethanil)、過酸化カルシウム (calcium peroxide)、臭化メチル (methyl bromide) 等を例示することができる。

[0144] また、生物農薬として例えば、核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ボックスウイルス (Entomopoxi virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ (Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema kushidai)、パスツーリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオブクター (Agrobacterium radiobactor)、非病原性エルビニア・カロトボーラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

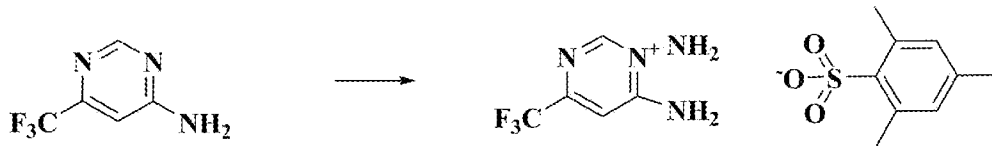
[0145] 更に、生物農薬として例えば、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレマンアブラバチ (Aphidius colemani)、シヨクガタマバエ (Aphidolestes aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメリスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ (Orius sauteri) 等の天敵生物、ポーベリア・ブロンニアティ (Beauveria brongniartii) 等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

[0146] 以下に本発明の代表的な化合物、及び製造中間体の製造例によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

### 実施例

[0147] 参考例 1. 4-トリフルオロメチルピリミジン-1-イウム-1,6-ジアミン、2,4,6-トリメチルベンゼンスルホネート塩の製造方法

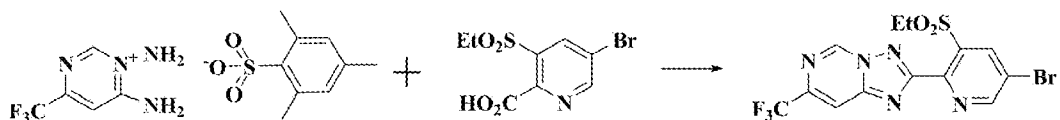
[化9]



磁気攪拌子を備えたマイクロ波チューブに、2,2,2-トリフルオロ酢酸 (4.4 g、2.54 mmol、2.9 mL) を入れ、次いで、(t-ブトキシカルボニルアミノ) 2,4,6-トリメチルベンゼンスルホネート (1 g、2.54 mmol) を 0°C で添加した。反応混合物を 0°C で 2 時間攪拌し、氷水を添加し、沈殿物をろ過により回収した。濡れたケーキを水で洗浄し、ジクロロメタン (5 mL) に溶解し、硫酸ナトリウムで乾燥させた。得られた溶液を、6-トリフルオロメチルピリミジン-4-アミン (0.373 g、国際公開第 2007/113558 号パンフレットに記載に従って調製した) のジクロロメタン (5 mL) 攪拌下に 0°C で滴下した。当該温度で 1 時間及び室温で一晩、経過させた後、白色の懸濁液として得られた反応混合物をジエチルエーテル (8 mL) で希釈し、沈殿物をろ集して目的物 (0.79 g、82%) を得た。

[0148] 参考例 2. 2-(3-エチルスルホニル-5-ブロモ-2-ピリジル)-7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-c]ピリミジンの製造方法

[化10]

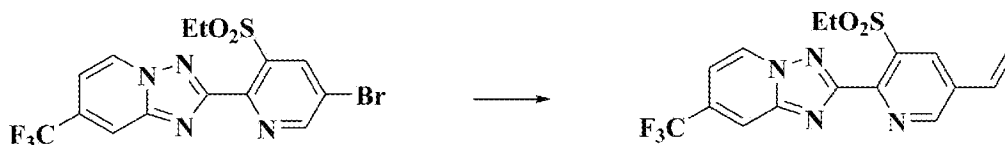


4-トリフルオロメチルピリミジン-1-イウム-1,6-ジアミン、2

, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホネート塩 (0.3 g、0.791 mmol)、3-エチルスルホニル-5-ブロモピリジン-2-カルボン酸 (0.284 g、1.18 mmol) および 3-(エチルイミノメチレンアミノ)-N,N-ジメチルプロパン-1-アミン塩酸塩 (0.18 g、0.94 mmol) をピリジン (2 mL) に溶解し、120°C で3時間加熱した。この後、反応混合物を水中に注ぎ入れ、水性層を EtOAc (酢酸エチル) で3回抽出した。組み合わせた有機層を水および塩水で順次に洗浄し、無水 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> (硫酸ナトリウム) で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮した。粗生成物をジエチルエーテルで洗浄し、ろ過して目的物を白色の粉末 (90 mg、33%) として得た。

[0149] 参考例3. 2-(3-エチルスルホニル-5-ビニル-2-ピリジル)-7-トリフルオロメチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリジンの製造方法

[化11]



参考例1及び2の方法に従って製造した2-(3-エチルスルホニル-5-ブロモ-2-ピリジル)-7-トリフルオロメチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリジン (0.28 g) のDME (ジメチルエーテル) 溶液 (4.0 mL) にカリウム ビニルトリフルオロボレート (0.013 g) とPdCl<sub>2</sub>(dppf)・アセトン (0.024 g) と2MのNa<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>水溶液 (1.0 mL) を加え1時間加熱還流した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、目的物を得た。

[0150] 参考例4. 5-エチルスルホニル-2-(7-トリフルオロメチル-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリジン-2-イル)ニコチンアルデヒドの製造方法

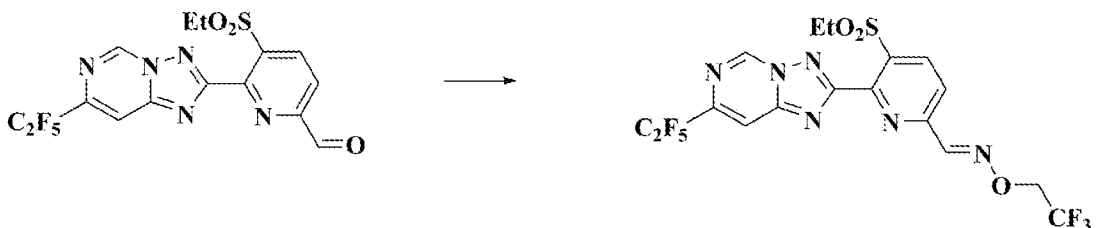
[化12]



2-(3-エチルスルホニル-5-ビニル-2-ピリジル)-7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジンのTHF(テトラヒドロフラン): pH7 buffer水溶液 = 2 : 1溶液(30 mL)にNMO(N-メチルモルホリン N-オキsid)を溶解したNMOの50%水溶液(0.44 g)と0.1 MのOsO<sub>4</sub>を溶解したOsO<sub>4</sub>の50% t-BuOH(t-ブタノール)溶液(0.3 mL)を加え、室温で終夜攪拌した。その後NaIO<sub>4</sub>(0.20 g)を加え、室温で2時間攪拌した。反応終了後、飽和Na<sub>2</sub>S<sub>2</sub>O<sub>3</sub>溶液を加えた後、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、目的物を得た(0.20 g、83%)。

[0151] 製造実施例1. 5-エチルスルホニル-6-(7-ペンタフルオロエチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-c]ピリジン-2-イル)ピコリンアルデヒド O-(2,2,2-トリフルオロエチル)オキシムの製造方法(化合物番号2-42)

[化13]

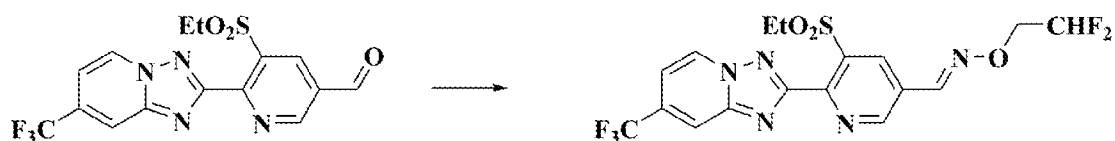


参考例1~4に従って製造した5-エチルスルホニル-6-(7-ペンタフルオロエチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-c]ピリジン-2-イル)ピコリンアルデヒド(0.006 g, 0.013 mmol)のクロロホルム溶液(1 mL)に室温でO-(2,2,2-トリフルオロエチル)ヒ

ドロキシルアミン塩酸塩 (0.003 g, 0.021 mmol) とピリジン (0.002 mL, 0.021 mmol) を加え、1時間攪拌した。反応終了後、1 N 塩酸水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、目的物 (0.006 g, 0.011 mmol, 85%) を得た。

[0152] 製造実施例 2. 5-エチルスルホニル-2-(7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)ニコチンアルデヒド O-(2,2-ジフルオロエチル)オキシムの製造方法 (化合物番号 1-7)

[化14]



参考例 1～4 に従って製造した 5-エチルスルホニル-2-(7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)ニコチンアルデヒド (0.050 g, 0.13 mmol) のクロロホルム溶液 (2 mL) に室温で O-(2,2-ジフルオロエチル)ヒドロキシルアミン塩酸塩 (0.026 g, 0.20 mmol) とピリジン (0.015 mL, 0.20 mmol) を加え、1時間攪拌した。反応終了後、1 N HCl 水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、目的物 (0.044 g, 0.095 mmol, 73%) を得た。

[0153] 参考例 5. 5-エチルスルホニル-6-(7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)ニコチン酸メチルエステルの製造方法

[化15]

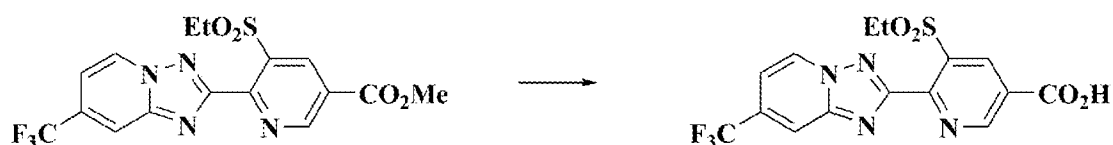


参考例 1 及び 2 と同じ方法で製造した 2- (5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル) -7-トリフルオロメチル- [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン (5.21 g)、ジフェニルホスフィノブタン (102 mg)、ビストリフェニルホスフィンジクロロパラジウム (84 mg)、メタノール (60 mL) 及びトリエチルアミン (1.68 mL) を 200 mL のステンレス製オートクレーブに加えた。反応系を一酸化炭素で置換し、3 MPa の加圧下、110°C で 2 時間攪拌した。室温まで冷却後、脱気し、反応溶液に飽和重曹水を加えた。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。有機層を濃縮後、カラムクロマトグラフィーに付し、目的物 (2.34 g、収率 47%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ : 9.54 (d, 1H)、9.10 (d, 1H)、8.81 (d, 1H)、8.15 (t, 1H)、7.33 (d, 1H)、4.18-4.09 (m, 5H)、1.44 (t, 3H)

[0154] 参考例 6. 5-エチルスルホニル-6- (7-トリフルオロメチル- [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) ニコチン酸の製造方法

[化16]



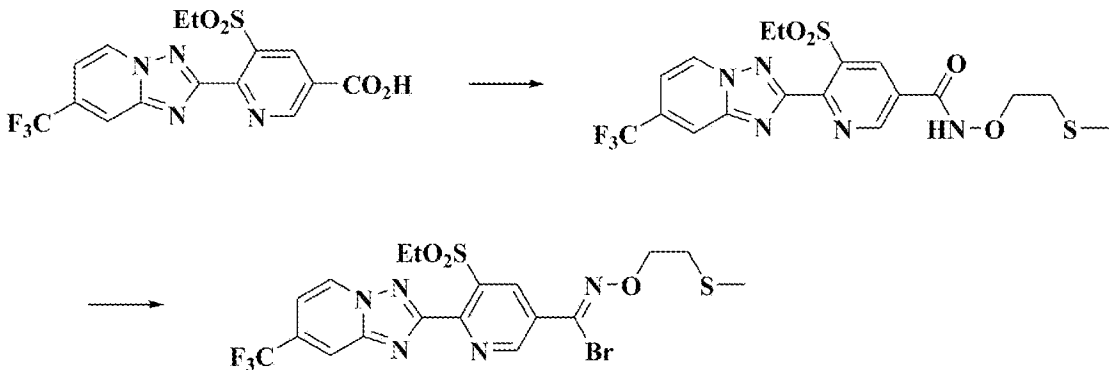
5-エチルスルホニル-6- (7-トリフルオロメチル- [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) ニコチン酸メチルエステル (2.34 g)、メタノール (40 mL)、テトラヒドロフラン (40 mL) の混合物に水酸化リチウム水溶液 (4.0M、2.11 mL) を加えた。室温で 2 時間攪拌後、反応溶液が pH 4 以下になるまで 2N 塩酸を加えた。生じた固体を集め、目的物 (1.97 g、収率 87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ : 9.58 (d, 1H)、9.14 (d, 1H)、8.82 (d, 1H)、8.16 (s, 1H)、7.35 (d, 1H)、4.07 (d,

2 H)、1.45 (t、3 H)

[0155] 製造実施例3. 5-エチルスルホニル-N-(2-メチルチオエトキシ)-6-(7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)ニコチンイミドイルブロミドの製造方法(化合物番号3-19)

[化17]



5-エチルスルホニル-N-(2-メチルチオエトキシ)-6-(7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)ニコチン酸(1 g)、メチルチオエトキシアミン塩酸塩(0.3 M クロロホルム溶液、12.5 mL)、ジメチルアミノピリジン(916 mg)、及びピリジン(592  $\mu$ L)の混合物に1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(718 mg)を加えた。室温で2時間攪拌後、2 N塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を濃縮後、目的の5-エチルスルホニル-N-(2-メチルチオエトキシ)-6-(7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル)ニコチン酸アミド(1.76 g)を得た。

得られた混合物にテトラヒドロフラン(50 mL)、トリフェニルホスフィン(1.96 g)、四臭化炭素(2.5 g)を加え、室温で1時間攪拌した。不溶物をろ別し、ろ液を濃縮した。残渣に重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を濃縮後、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の5-エチルスルホニル-N-(2-メチルチオエトキシ)-6-(7-トリフルオロメチル-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-2-イル

) ニコチンイミドイルブロミド (594 mg、収率43%) を得た。

融点：188℃－189℃

[0156] 製造実施例4. シクロプロピル (5-エチルスルホニル) - 6 - (7-トリフルオロメチル - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) ピリジン-3-イル) メタノン O - (2-メチルチオエチル) オキシムの製造方法 (化合物番号3-28)

[化18]

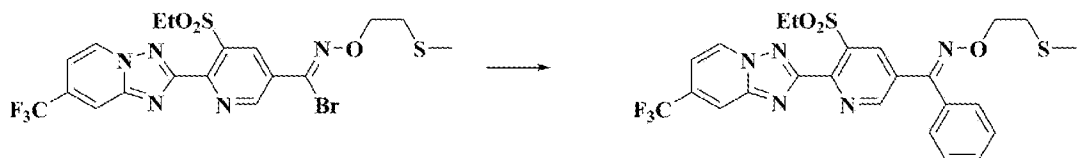


アルゴン下、実施例3の方法に従って製造した5-エチルスルホニル-N-(2-メチルチオエトキシ)-6-(7-トリフルオロメチル-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) ニコチンイミドイルブロミド (91 mg)、シクロプロピルボロン酸 (71 mg)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (36 mg)、トルエン (2 mL)、2 M-炭酸ナトリウム水溶液 (0.8 mL) の混合物を100℃で1時間加熱攪拌した。反応溶液を室温まで冷却後、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、目的物 (49 mg、収率59%) を得た。

融点：167℃－168℃

[0157] 製造実施例5. (5-エチルスルホニル-6-(7-トリフルオロメチル-[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリジン-2-イル) ピリジン-3-イル) フェニルメタノン O-(2-メチルチオエチル) オキシムの製造方法 (化合物番号3-46)

[化19]



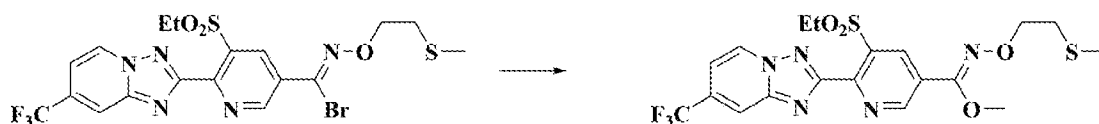
アルゴン下、5-エチルスルホニル-N-(2-メチルチオエトキシ)-

6 - (7 - トリフルオロメチル - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン - 2 - イル) ニコチンイミドイルブロミド (77 mg)、フェニルボロン酸 (51 mg)、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (36 mg)、トルエン (2 mL)、及び 2 M - 炭酸ナトリウム水溶液 (0.4 mL) の混合物を 100°C で 1 時間加熱攪拌した。反応溶液を室温まで冷却後、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、目的物 (64 mg、収率 84%) を得た。

融点：157°C - 158°C

[0158] 製造実施例 6. メチル 5 - エチルスルホニル - N - (2 - メチルチオエトキシ) - 6 - (7 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン - 2 - イル) ニコチンイミデートの製造方法 (化合物番号 3 - 1)

[化20]

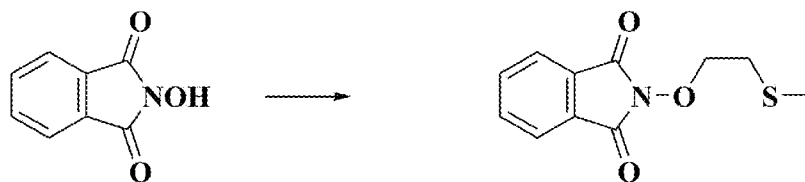


アルゴン下、5 - エチルスルホニル - N - (2 - メチルチオエトキシ) - 6 - (7 - トリフルオロメチル - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン - 2 - イル) ニコチンイミドイルブロミド (107 mg)、炭酸セシウム (189 mg)、Pd Rockphos G3 (5 mg、Sigma-Aldrich)、トルエン (1 mL)、及びメタノール (1 mL) の混合物を 60°C で 1 時間加熱攪拌した。反応溶液を室温まで冷却後、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、目的物 (36 mg、収率 38%) を得た。

融点：165°C - 166°C

[0159] 参考例 7. N - メチルチオエトキシフルイミドの製造方法

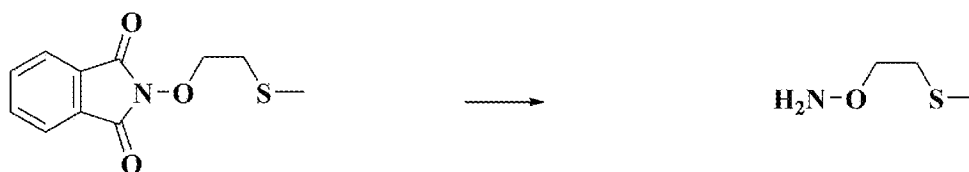
[化21]



N-ヒドロキシフタルイミド（10 g）、トリフェニルホスフィン（19.3 g）、メチルチオエタノール（6.4 mL）、テトラヒドロフラン（120 mL）の混合物にアゾジカルボン酸ジエチル（2.2 Mトルエン溶液、33.4 mL）を加えた。室温で1時間攪拌後、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、目的のN-メチルチオエトキシフタルイミド（15 g、収率100%）を得た。

[0160] 参考例8. メチルチオエトキシアミンの製造方法

[化22]



N-エチルチオエトキシフタルイミド（15 g）、クロロホルム（60 mL）の混合物にヒドラジン-水和物（3 mL）を加えた。室温で4時間攪拌後、不溶物をセライトろ過で除去した。ろ液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、再度ろ過した。得られたろ液を0.3 Mのメチルチオエトキシアミンの溶液として反応に用いた。

[0161] 以下に、製剤例を示すが、これらに限定されるものではない。製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

[0162] 製剤例1.

本発明化合物	10部
キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合（重量比 1 : 1） 10 部  
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

[0163] 製剤例 2.

本発明化合物	3 部
クレー粉末	82 部
珪藻土粉末	15 部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

[0164] 製剤例 3.

本発明化合物	5 部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90 部
リグニンスルホン酸カルシウム	5 部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

[0165] 製剤例 4.

本発明化合物	20 部
カオリンと合成高分散珪酸	75 部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合（重量比 1 : 1）	5 部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

[0166] 製剤例 5.

本発明化合物	20 部
ポリオキシエチレンラウリルエーテル	3 部
ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム	3.5 部
ジメチルスルホキシド	37 部
2-プロパノール	36.5 部

以上を均一に混合溶解して水溶性濃厚剤調製物とする。

[0167] 製剤例 6.

本発明化合物	2 部
--------	-----

ジメチルスルホキシド	10部
2-プロパノール	35部
アセトン	53部

以上を均一に混合溶解して噴霧用液剤とする。

[0168] 製剤例 7.

本発明化合物	5部
ヘキシレングリコール	50部
イソプロパノール	45部

以上を均一に混合溶解して経皮投与用液剤とする。

[0169] 製剤例 8.

本発明化合物	5部
プロピレングリコールモノメチルエーテル	50部
ジプロピレングリコール	45部

以上を均一に混合溶解して経皮投与用液剤とする。

[0170] 製剤例 9.

本発明化合物	2部
軽質流動パラフィン	98部

以上を均一に混合溶解して経皮投与（滴下）用液剤とする。

[0171] 製剤例 10.

本発明化合物	2部
軽質流動パラフィン	58部
オリーブ油	30部
ODO-H	9部
信越シリコーン（信越化学株式会社製）	1部

以上を均一に混合溶解して経皮投与（滴下）用液剤とする。

[0172] 次に本発明の試験例を示すが、これらに限定されるものではない。

[0173] 試験例 1. モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) に対する防除価試験

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

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

[0174] [数1]

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

[0175] T<sub>a</sub> : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C<sub>a</sub> : 無処理区の散布前寄生虫数

C : 無処理区の散布後寄生虫数

[0176] 判定基準

A . . . 防除価100%

B . . . 防除価99%~90%

C . . . 防除価89%~80%

D . . . 防除価79%~50%

[0177] その結果、本発明化合物の1-3、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-15、1-16、1-24、1-25、1-26、1-27、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、2-6、2-7、2-8、2-15、2-16、2-17、2-20、2-24、2-25、2-42、2-43、2-48、2-51、2-52、3-1、3-19、3-28、3-46、3-52、及び3-82は、Aの活性を示した。

[0178] 試験例2. ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*) に対する殺虫試験

本発明の一般式（１）で表される架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて500ppmの薬液に希釈し、該薬液にイネ実生（品種：日本晴）を30秒間浸漬し、風乾した後にガラス試験管に

入れ、ヒメトビウンカ3令を各10頭ずつ接種した後に綿栓をし、接種8日後に生死虫数を調査し、補正死虫率を下記の式より算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。

[0179] [数2]

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

[0180] その結果、本発明化合物の1-3、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-15、1-16、1-24、1-25、1-26、1-27、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、2-6、2-7、2-8、2-15、2-16、2-17、2-20、2-24、2-25、2-42、2-43、2-48、2-51、2-52、3-1、3-19、3-28、3-46、3-52、及び3-82は、Aの活性を示した。

[0181] 試験例3. コナガ(*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

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

[0182] [数3]

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

[0183] その結果、本発明化合物の1-3、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-15、1-16、1-24、1-25、1-26、1-27、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、2-6、2-7、2-8、2-15、2-16、2-17、2-20、2-

24、2-25、2-42、2-43、2-48、2-51、2-52、3-1、3-19、3-28、3-46、3-52、及び3-82は、Aの活性を示した。

[0184] 試験例4. ヘモンクス線虫 (*Haemonchus contortus*) の幼虫運動に対する影響評価試験

本発明の化合物のDMSO (ジメチルスルホキシド) 希釈溶液を、所定の調整液含む96穴プレート1穴毎に入れ、最終濃度を50ppmとした。ヘモンクス線虫のL-1ステージ幼虫20頭を放飼し、4日間静置した後、その運動能力を調査した。DMSO溶液のみによる阻害力を基準に各処理区の運動阻害率を補正、算出した。

[0185] その結果、本発明化合物の1-7及び1-50は50%以上の補正運動阻害率を示した。

[0186] 試験例5. 犬糸状虫 (*Dirofilaria immitis*) の幼虫運動に対する影響評価試験

所定の調整液に希釈した犬糸状虫のL-1ステージ幼虫500頭を96穴プレート1穴毎に接種し、本発明の化合物のDMSO希釈溶液を加えて最終濃度を50ppmとした。その後、3日間静置し、その運動能力を調査した。DMSO溶液のみによる阻害力を基準に各処理区の運動阻害率を補正、算出した。

[0187] その結果、本発明化合物の1-7、1-49、及び1-50は50%以上の補正運動阻害率を示した。

[0188] 試験例6. ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) 成虫に対する経口活性評価試験

羽化後のネコノミの新成虫10頭を試験ケージに入れ、本発明の化合物のDMSO希釈溶液を加えて最終濃度50ppmとした牛血液を、供給装置を用いて経口投与した。その1日後にその死亡率を調査した。なお、異常個体は死亡に分類した。

[0189] その結果、本発明化合物の1-7、1-8、1-15、1-26、1-4

7、1-49及び1-50は50%以上の死亡率を示した。

[0190] 試験例7. クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) ニンフに対する経皮活性評価試験

本発明の化合物のDMSO希釈溶液にアセトン/triton (トリトン) 溶液を加えて最終濃度100ppmとした溶液を通気機能を付与したサンプル瓶内に処理した。一晩乾燥した後、クリイロコイタマダニのニンフ10頭を放飼し、2日後にその死亡率を調査した。なお、異常個体は死亡に分類した。

[0191] その結果、本発明化合物の1-47及び1-50は50%以上の死亡率を示した。

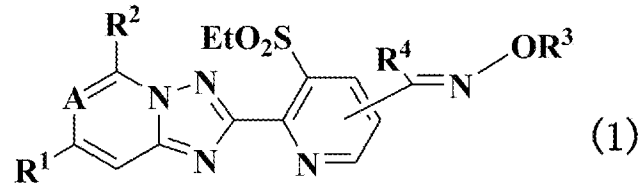
### 産業上の利用可能性

[0192] 本発明に係る化合物は、幅広い農園芸用害虫、動物の内部寄生虫及び外部寄生虫に対して優れた防除効果を有しており有用である。

## 請求の範囲

[請求項1]

[化1]



{式中、

$R^1$ は、(a1)水素原子；(a2) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(a3) ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル基；又は(a4)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基を示す。

$R^2$ は、(b1)水素原子；(b2) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(b3)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(b4) ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル基又は(b5)ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル基を示す。

$R^3$ は、(c1)水素原子；(c2) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(c3)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(c4) ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル基；(c5) ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(c6) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(c7) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルフィニル ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基又は(c8) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニル ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基を示す。

$R^4$ は、(d1)水素原子；(d2)ハロゲン原子；(d3)シアノ基；(d4) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(d5) ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル基；(d6) ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル基；(d7) ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル ( $C_2 - C_6$ ) アルキニル基；(d8) ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ基；(d9) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ基；(d10)  $R^6(R^7)N$ 基 (式中、 $R^6$ 及び $R^7$ は同一又は異なっても良く、水素原子、( $C_1 - C_6$ ) アルキル基、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル基、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニル基又は( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルカルボニル基を示す。)；(d11)  $NR^6CON(R^6)R^7$ 基 (式

中、 $R^6$ 及び $R^7$ は前記に同じ。) ; (d12) アリール基 ; (d13)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) ( $C_1-C_6$ ) アルキル基、(e)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基、(f) ( $C_1-C_6$ ) アルコキシ基、(g)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルコキシ基、(h) ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ基、(i)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ基、(j) ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルフィニル基、(l) ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルホニル基から選択される1~4の置換基を環上に有するアリール基 ; (d14) 複素環基又は(d15) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) ( $C_1-C_6$ ) アルキル基、(e)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基、(f) ( $C_1-C_6$ ) アルコキシ基、(g)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルコキシ基、(h) ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ基、(i)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ基、(j) ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルフィニル基、(l) ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルホニル基から選択される1~3の置換基を環上に有する複素環基を示す。

Aは、窒素原子又は $C-R^5$  (ここで、 $R^5$ は、(e1)水素原子 ; (e2) ( $C_1-C_6$ ) アルキル基又は(e3)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基を示す。) を示す。} で表されるオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類。

[請求項2]

$R^1$ が、(a1)水素原子又は (a4)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基を示し、

$R^2$ が、(b1)水素原子又は(b2) ( $C_1-C_6$ ) アルキル基を示し、

$R^3$ が、(c2) ( $C_1-C_6$ ) アルキル基 ; (c3)ハロ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基 ; (c6) ( $C_1-C_6$ ) アルキルチオ ( $C_1-C_6$ ) アルキル基 ; (c7) ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルフィニル ( $C_1-C_6$ ) アルキル基又は(c8) ( $C_1-C_6$ ) アルキルスルホニル ( $C_1-C_6$ ) アルキル基を示し、

R<sup>4</sup>が、(d1)水素原子；(d2)ハロゲン原子；(d3)シアノ基；(d4) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基；(d5) (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル基；(d6) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル基；(d7) (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル基；(d8) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ基；(d9) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ基；(d10) R<sup>6</sup>(R<sup>7</sup>)N基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ。)；(d11) NR<sup>6</sup>CON (R<sup>6</sup>) R<sup>7</sup>基 (式中、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は前記に同じ。)；(d12)アリール基；(d13)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される1～4の置換基を環上に有するアリール基；(d14)複素環基又は(d15)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(e)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(f) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(g)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基、(h) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(i)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルチオ基、(j) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルフィニル基、(l) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基又は(m)ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基から選択される1～3の置換基を環上に有する複素環基を示し、

Aが、窒素原子又はC-R<sup>5</sup> (ここで、R<sup>5</sup>は、(e1)水素原子；(e2) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基又は(e3)ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基を示す。)を示す、請求項1に記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類。

[請求項3]

R<sup>1</sup>が、(a1)水素原子又は(a4)ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル基を示し

、  
 $R^2$ が、(b1)水素原子又は(b2) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基を示し、  
 $R^3$ が、(c2) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(c3)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；(c6) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基又は(c8) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニル ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基；を示し、

$R^4$ が、(d1)水素原子；(d2)ハロゲン原子；(d6) ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル基；(d8) ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ基；(d12)アリール基又は(d13)同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基、(e)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基、(f) ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ基、(g)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ基、(h) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ基、(i)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ基、(j) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルフィニル基、(k)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルフィニル基、(l) ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニル基、又は(m)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニル基から選択される1～4の置換基を環上に有するアリール基を示し、

Aが、窒素原子又はC-R<sup>5</sup>（ここで、R<sup>5</sup>は、(e1)水素原子又は(e3)ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基を示す。）を示す、請求項1に記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類。

[請求項4] 請求項1～3の何れか一項に記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

[請求項5] 請求項1～3の何れか一項に記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を植物又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。

[請求項6] 請求項1～3の何れか一項に記載のオキシム基を有するピリジン環

が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を有効成分として含有することを特徴とする動物用の外部又は内部寄生虫防除剤。

[請求項7] 請求項1～3の何れか一項に記載のオキシム基を有するピリジン環が架橋部に窒素原子を有する縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を動物に経皮投与する又は経口投与することを特徴とする動物用の外部又は内部寄生虫防除剤の使用方法。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2020/020643

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A61P 33/10(2006.01)i; A61P 33/14(2006.01)i; C07D 471/04(2006.01)i; A01P 7/04(2006.01)i; A01N 47/02(2006.01)i; A01N 47/12(2006.01)i; A01N 47/34(2006.01)i; C07D 487/04(2006.01)i; A01N 43/90(2006.01)i; A61K 31/444(2006.01)i; A61K 31/519(2006.01)i

FI: C07D471/04 101; C07D487/04 146; A61K31/519; A61K31/444; A61P33/14; A61P33/10; A01P7/04; A01N43/90 105; A01N43/90 104; C07D471/04 CSP; A01N47/02; A01N47/12 102; A01N47/34 F

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)

A61P33/10; A61P33/14; C07D471/04; A01P7/04; A01N47/02; A01N47/12; A01N47/34; C07D487/04; A01N43/90; A61K31/444; A61K31/519

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.
A	JP 2016-528189 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 15.09.2016 (2016-09-15)	1-7
A	WO 2018/124129 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 05.07.2018 (2018-07-05)	1-7
A	WO 2018/124128 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 05.07.2018 (2018-07-05)	1-7
A	WO 2018/070502 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 19.04.2018 (2018-04-19)	1-7

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  
05 August 2020 (05.08.2020)

Date of mailing of the international search report  
18 August 2020 (18.08.2020)

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/JP2020/020643

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2017/065183 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 20.04.2017 (2017-04-20)	1-7
P,A	WO 2020/054712 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 19.03.2020 (2020-03-19)	1-7
P,A	WO 2019/131575 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.) 04.07.2019 (2019-07-04)	1-7

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
Information on patent family members

International application No.

PCT/JP2020/020643

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
JP 2016-528189 A	15 Sep. 2016	US 2016/0255837 A1 WO 2015/000715 A1 EP 3016949 A1 TW 201536781 A CA 2917262 A CN 105431433 A KR 10-2016-0029078 A AR 96783 A MX 2015017821 A RU 2016103149 A	
WO 2018/124129 A1	05 Jul. 2018	EP 3564238 A1 CA 3047900 A AU 2017388692 A KR 10-2019-0086578 A CN 110114354 A MX 2019007721 A BR 112019013278 A CL 2019001783 A	
WO 2018/124128 A1	05 Jul. 2018	EP 3564241 A1 CA 3047896 A AU 2017388691 A KR 10-2019-0090006 A CN 110121500 A MX 2019007722 A BR 112019013266 A CL 2019001782 A	
WO 2018/070502 A1	19 Apr. 2018	US 2020/0045975 A1 EP 3527560 A1 CA 3038482 A AU 2017342576 A KR 10-2019-0047067 A CN 109843864 A BR 112019006217 A MX 2019003932 A	
WO 2017/065183 A1	20 Apr. 2017	EP 3372595 A1 CA 3000803 A AU 2016337957 A CN 108137568 A KR 10-2018-0056745 A BR 112018002180 A MX 2018004516 A RU 2018117508 A AR 106324 A CL 2018000949 A	
WO 2020/054712 A1	19 Mar. 2020	(Family: none)	
WO 2019/131575 A1	04 Jul. 2019	(Family: none)	

<p>A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））</p> <p>A61P 33/10(2006.01)i; A61P 33/14(2006.01)i; C07D 471/04(2006.01)i; A01P 7/04(2006.01)i; A01N 47/02(2006.01)i; A01N 47/12(2006.01)i; A01N 47/34(2006.01)i; C07D 487/04(2006.01)i; A01N 43/90(2006.01)i; A61K 31/444(2006.01)i; A61K 31/519(2006.01)i</p> <p>FI: C07D471/04 101; C07D487/04 146; A61K31/519; A61K31/444; A61P33/14; A61P33/10; A01P7/04; A01N43/90 105; A01N43/90 104; C07D471/04 CSP; A01N47/02; A01N47/12 102; A01N47/34 F</p>																										
<p>B. 調査を行った分野</p> <p>調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））</p> <p>A61P33/10; A61P33/14; C07D471/04; A01P7/04; A01N47/02; A01N47/12; A01N47/34; C07D487/04; A01N43/90; A61K31/444; A61K31/519</p> <p>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</p> <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> <p>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）</p> <p>CAplus/REGISTRY (STN)</p>			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																									
<p>C. 関連すると認められる文献</p> <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>A</td> <td>JP 2016-528189 A (シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー) 15.09.2016 (2016 - 09 - 15)</td> <td>1-7</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>WO 2018/124129 A1 (日本農薬株式会社) 05.07.2018 (2018 - 07 - 05)</td> <td>1-7</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>WO 2018/124128 A1 (日本農薬株式会社) 05.07.2018 (2018 - 07 - 05)</td> <td>1-7</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>WO 2018/070502 A1 (日本農薬株式会社) 19.04.2018 (2018 - 04 - 19)</td> <td>1-7</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>WO 2017/065183 A1 (日本農薬株式会社) 20.04.2017 (2017 - 04 - 20)</td> <td>1-7</td> </tr> <tr> <td>P, A</td> <td>WO 2020/054712 A1 (日本化薬株式会社) 19.03.2020 (2020 - 03 - 19)</td> <td>1-7</td> </tr> <tr> <td>P, A</td> <td>WO 2019/131575 A1 (住友化学株式会社) 04.07.2019 (2019 - 07 - 04)</td> <td>1-7</td> </tr> </tbody> </table> <p><input type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input checked="" type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。</p> <p>* 引用文献のカテゴリー</p> <p>“A” 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの</p> <p>“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</p> <p>“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）</p> <p>“O” 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“&amp;” 同一パテントファミリー文献</p>			引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号	A	JP 2016-528189 A (シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー) 15.09.2016 (2016 - 09 - 15)	1-7	A	WO 2018/124129 A1 (日本農薬株式会社) 05.07.2018 (2018 - 07 - 05)	1-7	A	WO 2018/124128 A1 (日本農薬株式会社) 05.07.2018 (2018 - 07 - 05)	1-7	A	WO 2018/070502 A1 (日本農薬株式会社) 19.04.2018 (2018 - 04 - 19)	1-7	A	WO 2017/065183 A1 (日本農薬株式会社) 20.04.2017 (2017 - 04 - 20)	1-7	P, A	WO 2020/054712 A1 (日本化薬株式会社) 19.03.2020 (2020 - 03 - 19)	1-7	P, A	WO 2019/131575 A1 (住友化学株式会社) 04.07.2019 (2019 - 07 - 04)	1-7
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号																								
A	JP 2016-528189 A (シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー) 15.09.2016 (2016 - 09 - 15)	1-7																								
A	WO 2018/124129 A1 (日本農薬株式会社) 05.07.2018 (2018 - 07 - 05)	1-7																								
A	WO 2018/124128 A1 (日本農薬株式会社) 05.07.2018 (2018 - 07 - 05)	1-7																								
A	WO 2018/070502 A1 (日本農薬株式会社) 19.04.2018 (2018 - 04 - 19)	1-7																								
A	WO 2017/065183 A1 (日本農薬株式会社) 20.04.2017 (2017 - 04 - 20)	1-7																								
P, A	WO 2020/054712 A1 (日本化薬株式会社) 19.03.2020 (2020 - 03 - 19)	1-7																								
P, A	WO 2019/131575 A1 (住友化学株式会社) 04.07.2019 (2019 - 07 - 04)	1-7																								
<p>国際調査を完了した日</p> <p>05.08.2020</p>	<p>国際調査報告の発送日</p> <p>18.08.2020</p>																									
<p>名称及びあて先</p> <p>日本国特許庁(ISA/JP)</p> <p>〒100-8915</p> <p>日本国</p> <p>東京都千代田区霞が関三丁目4番3号</p>	<p>権限のある職員（特許庁審査官）</p> <p>伊佐地 公美 4P 5809</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3492</p>																									

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/JP2020/020643

引用文献	公表日	パテントファミリー文献	公表日
JP 2016-528189 A	15.09.2016	US 2016/0255837 A1 WO 2015/000715 A1 EP 3016949 A1 TW 201536781 A CA 2917262 A CN 105431433 A KR 10-2016-0029078 A AR 96783 A MX 2015017821 A RU 2016103149 A	
WO 2018/124129 A1	05.07.2018	EP 3564238 A1 CA 3047900 A AU 2017388692 A KR 10-2019-0086578 A CN 110114354 A MX 2019007721 A BR 112019013278 A CL 2019001783 A	
WO 2018/124128 A1	05.07.2018	EP 3564241 A1 CA 3047896 A AU 2017388691 A KR 10-2019-0090006 A CN 110121500 A MX 2019007722 A BR 112019013266 A CL 2019001782 A	
WO 2018/070502 A1	19.04.2018	US 2020/0045975 A1 EP 3527560 A1 CA 3038482 A AU 2017342576 A KR 10-2019-0047067 A CN 109843864 A BR 112019006217 A MX 2019003932 A	
WO 2017/065183 A1	20.04.2017	EP 3372595 A1 CA 3000803 A AU 2016337957 A CN 108137568 A KR 10-2018-0056745 A BR 112018002180 A MX 2018004516 A RU 2018117508 A AR 106324 A CL 2018000949 A	
WO 2020/054712 A1	19.03.2020	(ファミリーなし)	
WO 2019/131575 A1	04.07.2019	(ファミリーなし)	