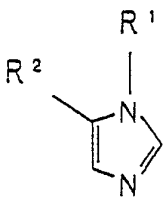


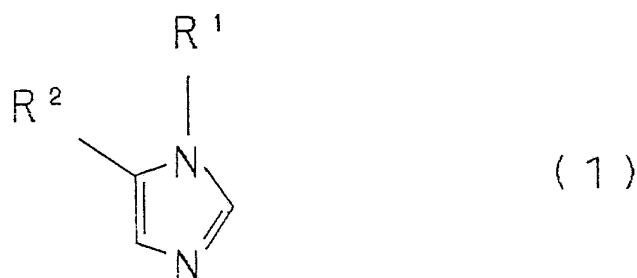


特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類⁴ C07D 233/58 A1 (11) 国際公開番号 WO 87/ 05899	(43) 国際公開日 1987年10月8日 (08.10.87)
(21) 国際出願番号 PCT/JP87/00180 (22) 国際出願日 1987年3月24日 (24. 03. 87) (31) 優先権主張番号 特願昭61-66890 (32) 優先日 1986年3月24日 (24. 03. 86) (33) 優先権主張国 JP (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) アース製薬株式会社 (EARTH CHEMICAL CO., LTD.)(JP/JP) 〒678-01 兵庫県赤穂市坂越3218の12 Hyogo, (JP) (72) 発明者: および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 桑野栄一 (KUWANO, Eiichi)(JP/JP) 〒810 福岡県福岡市中央区赤坂3-4-58 Fukuoka, (JP) 武谷立子 (TAKEYA, Ryuko)(JP/JP) 〒810 福岡県福岡市中央区今泉1-4-21 Fukuoka, (JP) 江藤守範 (ETO, Morifusa)(JP/JP) 〒813 福岡県福岡市東区土井団地H-26 Fukuoka, (JP) 浅野昌司 (ASANO, Shoji)(JP/JP) 〒771-02 徳島県板野郡北島町大字北村字西久保68-6 Tokushima, (JP) (74) 代理人 弁理士 三枝英二, 外(SAEGUSA, Eiiji et al.) 〒541 大阪府大阪市東区平野町2丁目10番地 沢の鶴ビル Osaka, (JP) (81) 指定国 AT (欧州特許), BE (欧州特許), CH (欧州特許), DE (欧州特許), FR (欧州特許), GB (欧州特許), IT (欧州特許), JP, LU (欧州特許), NL (欧州特許), SE (欧州特許), US. 添付公開書類	国際調査報告書
(54) Title: 1,5-DISUBSTITUTED IMIDAZOLES (54) 発明の名称 1, 5 - ジ 置 換 イ ミ ダ ゾ ー ル	
 (I)	
(57) Abstract 1,5-Disubstituted imidazoles represented by general formula (I), (wherein R ¹ represents a lower alkyl group, a cycloalkyl group or a phenyl-substituted lower alkyl group, R ² represents a 2,6-dimethyl-1,5-heptadienyl group or a 2,6-dimethylheptyl group, provided that the case where R ¹ represents a phenyl-substituted lower alkyl group and R ² represents a 2,6-dimethyl-1,5-heptadienyl group is excluded), salts thereof, processes for their preparation, and anti-juvenile hormone activators containing them as effective ingredients.	

(57) 要約

本発明は一般式



(式中 R^1 は低級アルキル基、シクロアルキル基又はフェニル低級アルキル基を示し、 R^2 は 2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル基又は 2, 6-ジメチルペプチル基を示す。但し R^1 がフェニル低級アルキル基で且つ R^2 が 2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル基の場合を除く。)

で表わされる 1, 5-ジ置換イミダゾール及びその塩、之等の製造法並びに之等を有効成分とする抗幼若ホルモン活性剤を提供するものである。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AT	オーストリア	FR	フランス	MR	モーリタニア
AU	オーストラリア	GA	ガボン	MW	マラウイ
BB	バルバドス	GB	イギリス	NL	オランダ
BE	ベルギー	HU	ハンガリー	NO	ノルウエー
BG	ブルガリア	IT	イタリア	RO	ルーマニア
BJ	ベナン	JP	日本	SD	スーダン
BR	ブラジル	KP	朝鮮民主主義人民共和国	SE	スウェーデン
CF	中央アフリカ共和国	KR	大韓民国	SN	セネガル
CG	コンゴ	LI	リヒテンシュタイン	SU	ソビエト連邦
CH	スイス	LK	スリランカ	TD	チャード
CM	カメルーン	LU	ルクセンブルグ	TG	トーゴ
DE	西ドイツ	MC	モナコ	US	米国
DK	デンマーク	MG	マダガスカル		
FI	フィンランド	ML	マリ		

- 1 -

明 細 書

1, 5-ジ置換イミダゾール

技 術 分 野

本発明は1, 5-ジ置換イミダゾール及びその塩、之
5 等の製造法及び抗幼若ホルモン活性剤に関する。

背 景 技 術

各種昆虫を始めとする節足動物の発育及び生殖はホル
モンにより支配されており、例えば発育途上に見られる
幼虫の脱皮及び変態は主に幼若ホルモン (Juvenile
10 hormone, JH) 及び脱皮ホルモン (Moulting hormone,
MH) の二つのホルモンが関与している。之等昆虫ホル
モンの生体内の相対的バランスを乱すことができれば、
昆虫等の正常な生育は阻害される。従つてこの作用を利用
すれば、人間や他の動物に影響を与えることなく、目
15 的とする害虫だけを選択的に死に至らしめることができ
るとの観点により、之等ホルモン及び之等と同様な作用
を有する物質が新しい低毒性害虫防除剤として種々研究
開発され且つ注目を集めつつある。また上記JHは昆虫
の生育、生殖、休眠等に関係するホルモンであり、例え
20 ば該JHを分泌するアラタ体を切除すると正常な幼虫脱
皮を繰返すことができず蛹もしくは成虫になる (早熟変
態) ことが知られ、このJH活性を阻害する作用を有す
る物質 (抗JH活性物質) が見い出せれば、これも亦同

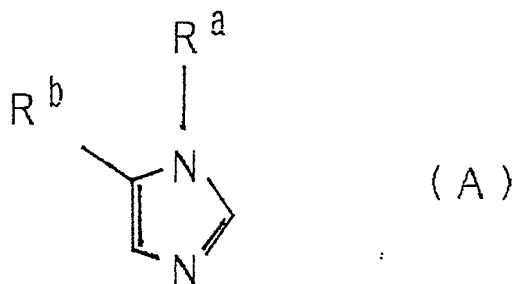
- 2 -

様に、害虫の正常な発育を阻害し、幼虫を早熟変態させ、また成虫の生殖能阻害や殺卵作用を有し、また早熟変態により幼虫の小型化、幼虫期間の短縮がおきるので、幼虫による作物被害を軽減させたり、個体数を減少させることができる。

発 明 の 目 的

本発明者らは、かかる観点より新しいホルモン系害虫防除剤として利用できる抗JH活性物質を提供することを目的として鋭意研究を重ねた結果、先に下記一般式

10 (A) で表わされる1, 5-ジ置換イミダゾール類の合成に成功し、之等化合物及びその塩が上記目的に合致することを見出し、この知見に係る発明を完成し、特許出願した(特願昭59-186015号)。



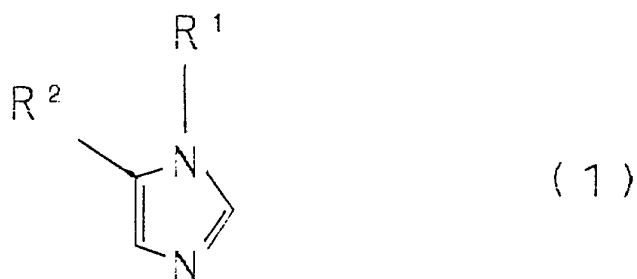
[式中R^a はフェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルキル基又は低級アルコキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基又はシトロネリール基を示す。R^b は2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル基、フェニル基又はスチリル基を示す。但しR^a がシトロネリール基を示す場合、R^b はフェニル

- 3 -

基であつてはならない。]

発 明 の 構 成

本発明は、上記発明に引き続く研究の結果完成されたものであり、下記一般式(1)で表わされる1,5-ジ置換イミダゾール及びその塩、それらの製造方法並びに之等化合物を含む抗幼若ホルモン活性剤に係る。

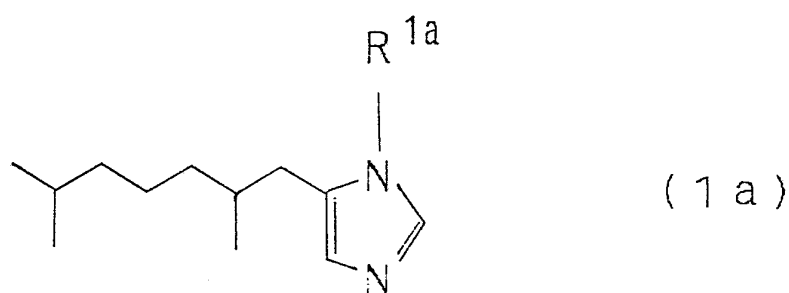


(式中R¹は低級アルキル基、シクロアルキル基又はフェニル低級アルキル基を示し、R²は2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル基又は2,6-ジメチルペプチル基を示す。但しR¹がフェニル低級アルキル基で且つR²が2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル基の場合を除く。)

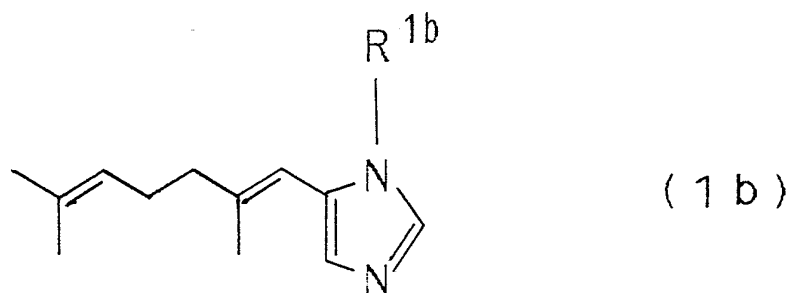
本明細書において、「低級アルキル基」なる語は炭素数1～6の直鎖状又は分枝鎖状アルキル基を意味する。上記低級アルキル基の具体例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、アミル、イソアミル、ヘキシル基等を例示できる。またフェニル低級アルキル基には、

ベンジル、フェネチル、フェニルプロピル、フェニルブチル、フェニルヘキシル基等のアルキル部分が炭素数 1 ～ 6 の直鎖状又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基が包含される。更に、シクロアルキル基は炭素数 3 ～ 8 のものを指称し、このうちでは、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が好ましい。

上記一般式 (1) で表わされる本発明の 1, 5 - ジ置換イミダゾールを細分類し、好ましいものを一般式で示せば次の通りである。



(式中 R^{1a} はフェニル低級アルキル基を示す。)



(式中 R^{1b} は低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。)

上記一般式 (1 a) に属する化合物の代表例としては、1 - ベンジル - 5 - (2, 6 - ジメチルヘプチル) イミダゾールを例示できる。

また、上記一般式(1b)に属する化合物としては、以下のものを例示でき、之等は特に各種の衛生害虫、例えば後記するゴキブリ類の他、ハエ、カ、ノミ、ダニ類(ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、ツメダニ等)等

5 の防除効果の点で優れており好ましい。

○ 1-メチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

○ 1-エチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

10 ○ 1-プロピル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

○ 1-ブチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

15 ○ 1-アミル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

○ 1-ヘキシル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

○ 1-イソプロピル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

20 ○ 1-イソブチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

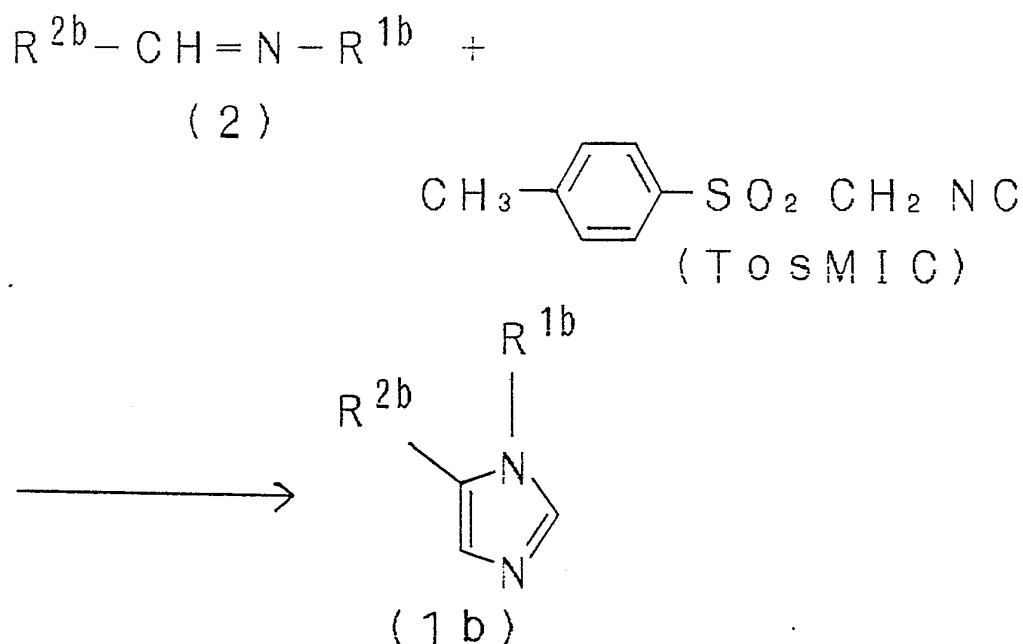
○ 1-sec-ブチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール

- 1-イソアミル-5-(2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル)イミダゾール
- 1-シクロペンチル-5-(2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル)イミダゾール
- 1-シクロヘキシル-5-(2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル)イミダゾール

以下、本発明化合物の製造法につき詳述する。

上記一般式(1b)で表わされる本発明化合物は、例えば次の反応式に示す方法より製造することができる。

<反応式1>



(式中 R^{1b} は上記に同じ。 R^{2b} は2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル基を示す。)

上記反応式1によれば、イミン化合物(2)とトシル

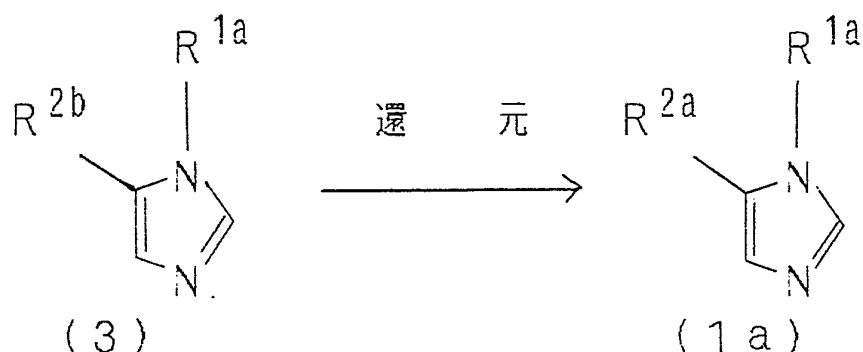
メチルイソシアニド (T O S M I C) とを反応させることにより、化合物 (1 b) を製造できる。上記反応は例えばメタノール等のアルコール類やジメトキシエタン等のエーテル類等の溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基又はイソプロピルアミン、*t*-ブチルアミン等の有機塩基の存在下に、好ましくは室温又はその付近の温度条件下に行なわれる。原料化合物の使用割合は限定的ではないが、通常イミン化合物 (2) に対して、トシルメチルイソシアニド (T O S M I C) を少なくとも等モル量、好ましくは約 1 ~ 1.5 倍モル量及び塩基性化合物を少なくとも等モル量、好ましくは約 2 ~ 3 倍モル量用いるのがよい。

尚原料とするイミン化合物 (2) は、対応するアルデヒド類とアミン類との反応により得られる。

上記方法によれば、異性体副生のおそれがなく、目的物を比較的高収率で収得できる利点がある。

また、一般式 (1 a) で表わされる本発明化合物は、上記反応式 1 に示す方法と同様にして得られる下記一般式 (3) で表わされる化合物を原料として、次の反応式 2 に示す方法により製造できる。

< 反応式 2 >



(式中 R^{1a} 及び R^{2b} は上記に同じ。 R^{2a} は 2, 6-ジメチルヘプチル基を示す。)

上記反応式 2 によれば、一般式 (3) で表わされる化合物の接触還元反応により一般式 (1a) で表わされる本発明化合物を収得できる。上記接触還元は、通常の方法に従い、例えばパラジウム-炭素等の慣用される接触還元用触媒を利用して実施できる。その詳細は後記実施例において述べる。

上記反応式 1 及び反応式 2 に示す各反応終了後、目的物は通常分離、精製手段例えばエーテル抽出、蒸留、カラムクロマトグラフィー等により単離精製できる。

またかくして得られる本発明化合物は、これに常法に従い適当な酸性化合物を付加反応させることにより、容易に酸付加塩とすることができる。上記酸付加塩を形成する酸性化合物としては、例えば塩酸、硫酸、リン酸、臭化水素酸等の無機酸及びマレイン酸、フマル酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、安息香酸、ベンゼンスルホ

ン酸等の有機酸を例示できる。

かくして得られる本発明化合物及びその塩は、いずれも抗幼若ホルモン活性（抗ＪＨ活性、早熟活性）作用を有しており、人体等に対する有害作用も少なく安全性が高く、抗ＪＨ活性剤として、殊に前述したようにホルモン系害虫防除剤として有用である。また、本発明化合物は殺虫剤の協力剤としても有用であり、殺虫効果の持続作用を奏し得る。

本発明化合物及びその塩は、これを上記抗ＪＨ活性剤乃至害虫防除剤として用いるに当つては、そのままで又は適当な製剤形態、例えば溶液、乳液、懸濁液、粉末、ペースト、カプセル、顆粒等に賦形後、通常の方法例えば噴霧、スプレー、撒布等により、防除を要求される害虫、それらの生息地、防除を要求される農作物やその栽培地等に適用される。

上記製剤は公知の方法、例えば本発明化合物又はその塩を、増量剤即ち液体又は固体キャリアー及び必要に応じ液化ガス（ＬＰＧ、ＤＭＥ等）、フロン等の噴射剤、表面活性剤（乳化剤、発泡剤、分散剤等）等と混合して調製される。液体キャリアーとしては、キシレン、トルエン、ベンゼン、アルキルナフタレン等の芳香族炭化水素；クロロベンゼン、クロロエチレン、塩化メチレン等の塩素化芳香族又は脂肪族炭化水素；鉱油留分；ブタノ

- ール、グリコール等のアルコールとそれらのエーテル及びエステル；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキサイド、アセトニトリル、水等の極性溶媒を例示できる。固体キヤーリヤーとしては、カオリン、粘土、タルク、チヨーク、石英、アタバルジヤイト、モンモリロナイト、珪藻土等の天然鉱物粉末、ケイ酸、アルミナ、ケイ酸塩等の合成鉱物粉末等を例示できる。
- 10 乳化剤、発泡剤及び分散剤としては、ポリオキシエチレンー脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンー脂肪アルコールエーテル、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルサルファート、アリアルスルホネート、アルブミン加水分解生成物、リ
- 15 グニン、スルフイツト廃液、メチルセルロース等を例示できる。

本発明化合物及びその塩は、また他の殺虫剤等の活性化化合物と併用できる。かかる活性化化合物としては例えば次に示すものが含まれる。

- 20 ○ 3-アリル-2-メチルシクロペンタ-2-エン-4-オン-1-イル d,l-シス/トランス-クリサンテマート（一般名アレスリン）
- 3-アリル-2-メチルシクロペンタ-2-エン-4

- 11 -

ーオンー１－イル d－シス／トランス－クリサンテ
マート（商品名ピナミンフォルテ：住友化学工業株式
会社製）

5 ○ d－3－アリル－2－メチルシクロペンター－2－エン
ー4－オンー１－イル d－シス／トランス－クリサ
ンテマート（商品名エキスリン：住友化学工業株式会
社製）

10 ○ 3－アリル－2－メチルシクロペンター－2－エン－4
ーオンー１－イル d－トランス－クリサンテマート
（一般名バイオアレスリン）

○ N－（3，4，5，6－テトラヒドロフタリミド）－
メチル d－シス／トランス－クリサンテマート
（一般名フタルスリン）

15 ○ 5－ベンジル－3－フリルメチル d－シス／トラン
ス－クリサンテマート（一般名レスメトリン）

○ 2－メチル－5－（2－プロパギル）－3－フリルメ
チル クリサンテマート（一般名フラメトリン）

20 ○ 3－フェノキシベンジル 2，2－ジメチル－3－
（2'，2'－ジクロロ）ビニルシクロプロパンカル
ボキシレート（一般名ペルメトリン）

○ 3－フェノキシベンジル d－シス／トランス－クリ
サンテマート（一般名フェノトリン）

○ α－シアノー－3'－フェノキシベンジル α－イソブ

- 12 -

ロピル-4-クロロフェニルアセテート（一般名フェンバレレート）

○ 0, 0-ジメチル 0-（2, 2-ジクロロ）ビニル
ホスフエート（DDVP）

5 ○ 0, 0-ジメチル 0-（3-メチル-4-ニトロフ
エニル）チオノフオスフエート（スミチオン）

○ 0, 0-ジエチル 0-2-イソプロピル-4-メチ
ル-ピリミジル-（6）-チオフオスフエート（ダイ
アジノン）

10 ○ 0, 0-ジメチル S-（1, 2-ジカルボエトキシ
エチル）-ジチオフオスフエート（マラソン）

○ 0-イソプロポキシフェニル メチルカーバメート
（バイゴン）

○ 0-（4-ブromo-2, 5-ジクロロフェニル） 0,

15 0-ジメチルホスホロチオエート（ブromo fos）

一般に製剤は0.1～95%（重量%、以下同じ）、
好ましくは0.1～90%の本発明化合物及び／又はそ
の塩を含有している。この製剤は、実際の適用に当つて
は更に希釈することができる。有効成分とする本発明化
20 合物又はその塩の濃度は、広い範囲にわたつて変化させ
ることができ、一般的には、0.0001～10%、好
ましくは0.01～1%とすることができる。

本発明化合物を適用され、これにより防除等を行ない

得る処理対象昆虫は、ホルモンによりその発育及び生殖を支配されるものである限り何ら限定はなく、各種の昆虫類、ダニ類、線虫類の他、人畜に害を与える節足動物の全てを含んでいる。上記害虫の代表例を以下に挙げる。

- 5 鱗翅目 (*Lepidoptera*) の害虫にはコナガ (*Plutella maculipennis*)、コーヒーモンシロモリガ (*Leucoptera coffeella*)、リンゴスガ (*Hyponomeuta malinellus*)、リンゴヒメシンク (*Argyresthia conjugella*)、パクガ (*Sitotroga erealella*)、フト
- 10 リマエア オペルキユレラ (*Phthorimaea operculella*)、アミメナミシヤ (*Capua reticulana*)、テングハマキ (*Sparganohis pilleriana*)、カコエイア ムリナーナ (*Cacoecia murinana*)、トルトリツクス ビリナ (*Tortrix viridana*)、ブドウホソハマキ (*Clysia*
- 15 *ambiguella*)、エセトリア ブオリアナ (*Evotria buoliana*)、ポリクロシス ボトラナ (*Polychrosis botrana*)、シイデア ポモネーラ (*Cydia pomonella*)、ラスペイレシア モレスタ (*Laspeyresia molesta*)、ラスペイレシア フネブラネ (*L. funebrana*)、アワノ
- 20 メイガ (*Ostrinia nubilalis*)、ロクソステゲ ステイクテイカリス (*Loxostege sticticalis*)、エフエステイア ヒューニエラ (*Ephestia kuehniella*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、ハチノスツツリガ

- (*Galleriamellonella*)、オビカレハ (*Malacosoma neustria*)、デンドロリムス ピニ (*Dendrolimus Pini*)、サマトポニア ピティオカンパ (*Thaumtopoea pityocampa*)、アトモンヒロズコガ
- 5 (*Phalera bucephala*)、ナミスジフユナミシヤク (*Cheimatobia brumata*)、ヒペルニア デホリアリア (*Hibernia defoliara*)、ブパルス ピニアラス (*Bupalus piniarius*)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、カブラヤガ (*Agrotis*
- 10 *segetum*)、ヒトテンケンモン (*Agrotis ypsilon*)、ヨトウガ (*Barathra brassicae*)、ムラサキミツボシキリガ (*Cirphis unipuncta*)、ハスモンヨトウ (*Prodenia litura*)、シロイチモンジヨトウ (*Laphygma exigua*)、パノリス フランメーア
- 15 (*Panolis flammea*)、ベニモンアオリンガ (*Earias insulana*)、キンウワバ (*Plusia gamma*)、アラパマアルギラセア (*Alabama argillacea*)、カシワマイマイガ (*Lymantriadispar*)、マイマイガ (*Lymantria monacha*)、モンシロチョウ (*Pieris brassicae*)、
- 20 エゾシロチョウ (*Aporia crataegi*)、ヤママユ (*Antheraea yamamai*)、ヒメヤママユ、サクサン等が属する。

鞘翅目 (*Coleoptera*) の目にはセマダラコガネ

- (*Blitophaga undata*)、メラノタス コムニス
(*Melanotus communis*)、ルモニウム カリフォルニカ
ス (*Limorius californicus*)、コメツキ (*Agriotes*
lineatus)、カバイロコメツキ (*Agriotes obscurus*)、
5 ナガタムシ (*Agilus sinuatus*)、マリゲテス アネメ
ース (*Maligethes aneneus*)、アトマリア リネアリス
(*Atomaria linearis*)、ニジュウヤホシテントウ
(*Epilachna varivestris*)、ウスチャコガネ
(*Phyllopertha horticola*)、マメコガネ (*Popillia*
10 *japonica*)、コフキコガネ (*Melolontha melolontha*)、
メロロンタ ヒポカスタニ (*Melolontha hippocastani*)、
アミフィマラス ソルスティティアリス (*Amphimallus*
solstitialis)、クビナガハムシ (*Crioceris asparagi*)、
クボホソハムシ (*Lama malanopus*)、レプティオナルサ
15 デセンリネアータ (*Leptinotarsa decemlineata*)、
ダイコンハムシ (*Phaedon cochleariae*)、ノミハムシ
(*Phyllotreta memorum*)、トビハムシ (*Chaetocnema*
tibialis)、ナスノミハムシ (*Psylliodes*
chrysocephala)、ディアプロチカ 12 パンクラタ
20 (*Diabrotica 12 punctata*)、ヒメジンガサ
(*Cassida nebulosa*)、ダイズゾウムシ (*Bruchus*
lentis)、ソラマメゾウムシ (*Bruchus pisorum*)、チ
ビコフキゾウムシ (*Sitona lineatus*)、オチオリンカ

- 16 -

- ス サルタス (*Otiorrtynchus sulcatus*)、オテイオリ
ンカス オバタス (*Otiorrtynchus ovatus*)、ヒロピエ
ス アピエティス (*Hylobies abietis*)、ビイクティカ
ス ペチュラエ (*Byctiscus betulae*)、アンソノムス
5 ポモラム (*Anthonomus pomorum*)、オオフタオビキヨ
トウ (*Anthonomus grandis*)、アオキノコヨトウ
(*Ceuthorrhynchus assimillis*)、ソイソリーヌカス
ナピ (*Cauthorrhynchus napi*)、シトフィラス グラ
ナリア (*Sitophilus granaria*)、マイマイガ
10 (*Anisandrus dispar*)、イプス テイポグラフィウス
(*Ips typographus*)、ブラストファガス ピニペルダ
(*Blastophagus piniperda*) 等が属する。
- 双翅目 (*Diptera*) の目にはリコリア ペクトラリス
(*Lycoria pectoralis*)、マイエテイオラデストラクタ
15 ー (*Mayetiola destructor*)、カラマツメタマバエ
(*Dasyneura brassicae*)、マバエ (*Contarinia
tritici*)、イネクダアザミウマ (*Haplodiplosis
squastrie*)、テイブラ パルドサ (*Tipula paludosa*)、
テイブラ オレラセア (*Tipula oleracea*)、ウリミバ
20 エ (*Dacus cucurbitae*)、ミカンバエ (*Dacus oleae*)、
セラティティス カピタタ (*Ceratitis capitata*)、ラ
ゴレティス セラシー (*Rhagoletis cerasi*)、ラゴレ
ティス ポマネラ (*Rhagoletis pomanella*)、アナトレ

- フア ルーデンス (*Anatrepha ludens*)、オツシネラ
フリット (*Oscinella frit*)、フォルビア コアラクタ
タ (*Phorbia coaractata*)、フォルビア アンティカ
(*Phorbia antiqua*)、ハコペモグリハナバエ
5 (*Phorbia brassti*)、アカザモグリハナバエ
(*Pegomya hyoscyami*)、アノフエレス マクリペニス
(*Anopheles maculipennis*)、キュレツクス ピピエ
ンス (*Culex pipiens*)、アエデス アエジプテイー
(*Aedes aegypti*)、アエデス ベクサンス (*Aedes*
10 *vexans*)、タバナス ボビヌス (*Tabanus bovinus*)、
テプラ パルドサ (*Tipula paludosa*)、イエバエ
(*Musca domestica*)、フアニア カリキュラリス
(*Fannia canicularis*)、ムツシナ スタビユランス
(*Muscina stabulans*)、グロシナ モルシタンス
15 (*Glossina morsitans*)、エストラス オシス
(*Oestrus ovis*)、クリソミヤ マセラリア
(*Cyrysomya macellaria*)、クリソミヤ ホミニボラ
ツクス (*Chrysomya hominivorax*)、ルシリア キュプ
リナ (*Lucilia cuprina*)、ルシリア セリカータ
20 (*Lucilia sericata*)及びヒポデルマ リネアータ
(*Hypoderma lineata*)等が属する。

膜翅目 (*Hymenoptera*) の目にはカブラハバチ
(*Athalia rosae*)、ハプロカンパ ミヌタ

(*Haplocampa minuta*)、ヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、ソレノプシス ジエミナータ (*Solenopsis geminata*)、アタ アテクスデンス (*Atta sexdens*) 等が属する。

- 5 異翅亜目 (*Heteroptera*) の目にはミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、チャイロカメムシ (*Eurygaster integriceps*)、ビリソウス ロイコプテラス (*Blissus leucopterus*)、アカホシカメムシ (*Dysdercus cingulatus*)、デイスデルカス ンター
10 メディアス (*Dysdercus intermedius*)、ピエズマ カドラータ (*Piesma quadrata*)、メクラガメ (*Lygus pratensis*) 等が属する。

- 同翅亜目 (*Homoptera*) の目にはウシウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、トビイロウンカ
15 (*Nilaparvata lugens*)、マツヒメヨコバイ (*Empoasca fabae*)、リンゴキジラミ (*Psylla mali*)、ナミキジ ラミ (*Psylla piri*)、トリアロイロデスバポラリオラム (*Trialeurodes vaporariorum*)、アフェイス ファベア (*Aphis fabas*)、リンゴアブラムシ
20 (*Aphis pomi*)、ニワトコアブラムシ (*Aphis samouci*)、アフイジユラ ナステイユルラウス (*Aphidula nasturlaus*)、セロシア ゴシイピア (*Cerosipha gossypii*)、サパフィス マリ

(*Sappaphis mali*)、サパフィス マラ (*Sappaphis mala*)、ネアブラムシ (*Dysaphis radicola*)、ブラ
キカンドス カルドイ (*Brachycaudus cardui*)、ダイ
コンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ホツブイ
5 ポアブラムシ (*Phorodon humuli*)、ムギクビレアブラ
ムシ (*Rhopalomyzus ascalonicus*)、ミゾデス ペルシ
サエ (*Myzodes persicae*)、ミズス セラシー (*Myzus
cerasi*)、シサウラコルサム プソイドソラミ
10 (*Dysaulacorthm pseudosolami*)、ビゲナガアブラムシ
(*Acyrtosiphon onobrychis*)、マクロシフォン ロ
ザエ (*Macrosiphon rosae*)、ソラマメヒゲナガアブラ
ムシ (*Megoura viciae*)、シゾネウラ ラヌギノサ
(*Schizoneura lanuginosa*)、ペンフィグス ブルサリ
15 ウス (*Pemphigus bursarius*)、ドレイフシア ノルド
マニアネア (*Dreyfusia nordmannianae*)、ドレイフシ
ア ピセア (*Dreyfusia piceae*)、ミキカサアブラムシ
(*Adelges laricis*)、ブドウネアブラムシ (*Viteus
vitifolii*) 等が属する。

20 等翅目 (*Isoptera*) の目にはレテイキュテルメス
ルシフガス (*Reticulitermes lucifugus*)、カロテルメ
ス フラビコリス (*Calotermes flavicollis*)、ロイコ
テルミス フラビペス (*Leucotermes flavipes*)、テル
メス ナタレンシス (*Termes natalensis*) 等が属する。

- 20 -

直翅目 (Orthoptera) の目にはフオルフィキューラ
オウリキュラリア (*Porficula auricularia*)、アチ
タ ドメスチカ (*Acheta domestica*)、グリーロタブラ
5 グリーロタブラ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、タツ
キシネス アシナモラス (*Tachycines asynamorus*)、
ロカスタミグラトリア (*Locusta migratoria*)、スタウ
ロノタス マロツカナス (*Stauronotus maroccanus*)、
シストセルカ ペレグリナ (*Schistocerca peregrina*)、
10 ノマダクリス セプテンファツシアータ (*Nomadacris*
septemfasciata)、メラノプラス スプレタス
(*Melanoplus spretus*)、メラノプラス フェムール
ールブラム (*Melanoplus femur-rubrum*)、ブラタ オ
リエンタリス (*Blatta orientalis*)、チャバネゴキブ
15 リ (*Blattella germanica*)、ペリプラネタ アメリカ
ーナ (*Periplaneta americana*)、ブラベラ ジガンテ
ア (*Blabera gigantea*) 等が属する。

ダニ目 (Acarina) にはイエダニ (*Ornithonyssus*
bacoti)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、トリサシ
20 ダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、ハエダニ
(*Macrocheles muscaedomesticae*)、ホシカダニ
(*Hoshikadania konoi*)、サトウダニ (*Carpoglyphus*
lactis)、アカツツガムシ (*Trombicula akamushi*)、
タテツツガムシ (*Trombicula scutellaris*)、ケナガコ

- 21 -

- ナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、コナヒヨウヒダニ (*Dermatophagoides farinae*)、ロシアヒヨウダニ (*Dermatophagoides schemetewskyi*)の他、ツメダニ類、ハダニ類、ホコリダニ類、シラミダニ類、ニクダニ類、
- 5 ササラダニ類、ヒワダニ類、ツツハラダニ類等が属する。
- 円虫類としては根状虫線虫、即ちメロイドギネ インコグニイタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギネ パプラ (*M. hapla*)、メロイドギネ ジャパニカ (*M. javanica*)、包囊形成線虫即ちヘテロデラ ロストキエ
- 10 ンシス (*Heterodera rostochiensis*)、ヘテロデラ サツチイー (*H. schachtii*)、ヘテロデラ アベナ (*H. avenae*)、ヘテロデラ グリシネス (*H. glycines*)、ヘテロデラ トリフォリー (*H. trifolii*)、幹及び葉線虫即ちジチレンカス デイプサシ (*Ditylenchus*
- 15 *dipsaci*)、ジチレンカス デストラクター (*D. destructor*)、プラチレンカス ネグレクタス (*Pratylenchus neglectus*)、プラチレンカス ペネトランス (*P. pnetrans*)、プラチレンカス グツデイー (*P. goodeyi*)、プラチレンカス クルビタタス (*P.*
- 20 *curvatus*)、チレンコーリンカス ドビウス (*Tylenchorhynchus dubius*)、チレンコーリンカス クレイトニ (*T. claytoni*)、ロチレンカス ロブスタス (*Rotylenchus robustus*)、ヘリロコチレンカス ム

- 22 -

- ルチシントス (*Helicotylenchus multicinctus*)、ラ
ドフォラス シミリス (*Rodopholus similis*)、ペロ
ノライムス ロンジカウダタス (*Belonolaimus*
longicaudatus)、ロンジドラス エロンガタス
5 (*Longidorus elongatus*)、トリコドラス プリミテ
イブス (*Trichodorus primitivus*) 等が属する。

実 施 例

- 以下本発明を更に詳細に説明するため、本発明化合物
の製造のための原料化合物の製造例を参考例として挙げ、
10 次いで本発明化合物の製造例を実施例として挙げる。

各例において、参照される図面は次の通りである。

- 第1図及び第2図は参考例1で得た原料化合物の核磁
気共鳴スペクトル分析図であり、第3図～第15図は、
それぞれ実施例1～13で得た本発明化合物の核磁気共
15 鳴スペクトル分析図である。

参考例 1

- 1-ベンジル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,
5-ヘプタジエニル]イミダゾール(化合物1)及び1
-ベンジル-5-[(Z)-2,6-ジメチル-1,5
20 -ヘプタジエニル]イミダゾール(化合物2)の製造

ベンジルアミン3.2gとシトラール4.5gとをジ
クロロメタン30mlに溶解し、無水硫酸マグネシウム
1.5gを加えて、3時間加熱還流する。硫酸マグネシウ

- 23 -

ムを汙去後、汙液を減圧濃縮する。得られたイミン化合物を乾燥メタノール30mlに溶解し、該溶液に無水炭酸カリウム15gを加え、次いでp-トルエンスルホニルメチルイソシアニド(TosMIC)7.5gを加え、
 5 3時間加熱還流する。冷却後、反応混合物より溶媒を減圧留去し、残渣をエーテル抽出する。エーテル層を食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製する。溶出は最初ヘキサン-エーテル(1:
 10 1)で行ない、続いてエーテルで行なう。化合物2はヘキサン-エーテル(1:1)で溶出され、化合物1はエーテルで溶出される。之等各液より夫々溶媒を減圧留去して各目的化合物を得る。

<化合物1>

15 収 率 25%

元素分析値 (C₁₉H₂₄N₂として)

	C	H	N
理論値(%)	81.43	8.57	10.00
実測値(%)	81.23	8.67	10.02

20 紫外線吸収スペクトル(UV)分析結果

$\lambda_{\max}$ (CH₃OH) 253nm

(ϵ 14500)

核磁気共鳴スペクトル(¹H-NMR)分析結果

- 24 -

CDC ℓ_3 中、TMSを内部標準物質として用いた
結果を第1図に示す。

<化合物2>

収 率 10%

5 元素分析値 (C₁₉ H₂₄ N₂ として)

	C	H	N
理論値 (%)	81.43	8.57	10.00
実測値 (%)	81.38	8.61	10.03

UV分析結果

10 $\lambda_{\max}$ (CH₃ OH) 251 nm

(ϵ 11,700)

¹H-NMR分析結果 (CDC ℓ_3 , TMS)

第2図に示す。

実施例 1

15 1-ベンジル-5-(2,6-ジメチルヘプチル)イミ
ダゾールの製造

参考例1で得た1-ベンジル-5-[(E)-2,6-
ジメチル-1,5-ヘプタジエニル]イミダゾール
0.6gをエタノール10mlに溶解し、10%パラジウ
ム-炭素0.1gを加え、常圧で接触還元を行なう。理
20 論量の水素が消費された後、触媒を濾別し、濾液を減圧
濃縮後、残渣をヘキサンから再結晶して標記化合物を収
率95%で得る。

- 25 -

融 点 61 ~ 62 °C

核磁気共鳴スペクトル ($^1\text{H-NMR}$) 分析結果

CDCl_3 中、TMSを内部標準物質として用いた結果を第3図に示す。

- 5 また参考例1で得た1-ベンジル-5-[(Z)-2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル]イミダゾールを用いて同様にしても、標記化合物を収得できる。

実施例 2

- 1-メチル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル]イミダゾールの製造

- メチルアミン塩酸塩 1 g、トリエチルアミン 1.5 g 及びシトラール 1.1 g をジクロロメタン 15 ml に溶解し、無水硫酸マグネシウム 5 g を加えて、3 時間加熱還流する。硫酸マグネシウムを濾去後、濾液を減圧濃縮する。
- 15 得られたイミン化合物を乾燥メタノール 15 ml に溶解し、これに無水炭酸カリウム 5 g 次いで TosMIC 2.5 g を順次加え、3 時間加熱還流する。冷却後、反応混合物より溶媒を減圧留去し、残渣をエーテル抽出する。エーテル層を食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム
- 20 で乾燥し、減圧下に溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製する。溶出は最初ヘキサン-酢酸エチル (3:1) で行ない、続いてヘキサン-酢酸エチル (1:1) で行ない、目的物はヘキサン

—酢酸エチル（１：１）で溶出される。溶出液より溶媒を減圧留去して目的化合物を得る（収率１２％）。

¹H-NMR分析結果

CDCl₃中、TMSを内部標準物質として用いた結果を第４図に示す。

実施例 3

１－エチル－５－〔（Ｅ）－２，６－ジメチル－１，５－ヘプタジエニル〕イミダゾールの製造

実施例２において、メチルアミン塩酸塩に代えてエチルアミン塩酸塩を用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR分析結果

CDCl₃中、TMSを内部標準物質として用いた結果を第５図に示す。

実施例 4

１－プロピル－５－〔（Ｅ）－２，６－ジメチル－１，５－ヘプタジエニル〕イミダゾールの製造

実施例２において、メチルアミン塩酸塩に代えてｎ－プロピルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR分析結果

CDCl₃中、TMSを内部標準物質として用いた結果を第６図に示す。

実施例 5

１－ブチル－５－〔（Ｅ）－２，６－ジメチル－１，５

ーヘプタジエニル]イミダゾールの製造

実施例 2 において、メチルアミン塩酸塩に代えて n-ブチルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR 分析結果

5 CDCl₃ 中、TMS を内部標準物質として用いた結果を第 7 図に示す。

実施例 6

1-アミル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,5-
ーヘプタジエニル]イミダゾールの製造

10 実施例 2 において、メチルアミン塩酸塩に代えて n-アミルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR 分析結果

CDCl₃ 中、TMS を内部標準物質として用いた結果を第 8 図に示す。

15 実施例 7

1-ヘキシル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,
5-
ーヘプタジエニル]イミダゾールの製造

20 実施例 2 において、メチルアミン塩酸塩に代えて n-ヘキシルアミン塩酸塩を用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR 分析結果

CDCl₃ 中、TMS を内部標準物質として用いた結果を第 9 図に示す。

実施例 8

1-イソプロピル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル]イミダゾールの製造

実施例 2 において、メチルアミン塩酸塩に代えてイソ
5 プロピルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR 分析結果

CDCl₃ 中、TMS を内部標準物質として用いた
結果を第 10 図に示す。

実施例 9

10 1-イソブチル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,
5-ヘプタジエニル]イミダゾールの製造

実施例 2 において、メチルアミン塩酸塩に代えてイソ
ブチルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR 分析結果

15 CDCl₃ 中、TMS を内部標準物質として用いた
結果を第 11 図に示す。

実施例 10

1-sec-ブチル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,
5-ヘプタジエニル]イミダゾールの製造

20 実施例 2 において、メチルアミン塩酸塩に代えて sec-
ブチルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR 分析結果

CDCl₃ 中、TMS を内部標準物質として用いた

結果を第12図に示す。

実施例 11

1-イソアミル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル]イミダゾールの製造

- 5 実施例2において、メチルアミン塩酸塩に代えてイソアミルアミン塩酸塩を用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR分析結果

- CDCl₃中、TMSを内部標準物質として用いた
10 結果を第13図に示す。

実施例 12

1-シクロペンチル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル]イミダゾールの製造

- 実施例2において、メチルアミン塩酸塩に代えてシク
15 ロペンチルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR分析結果

CDCl₃中、TMSを内部標準物質として用いた
結果を第14図に示す。

20 実施例 13

1-シクロヘキシル-5-[(E)-2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル]イミダゾールの製造

実施例2において、メチルアミン塩酸塩に代えてシク

- 30 -

ロヘキシルアミンを用いて、同様にして標記化合物を得る。

¹H-NMR分析結果

5 CDCℓ₃中、TMSを内部標準物質として用いた結果を第15図に示す。

尚、上記実施例3～13に示す方法による目的化合物の収率は、いずれも10～30%の範囲であった。

以下、本発明化合物を用いて行なわれた生物活性及び害虫防除の試験例を挙げる。

10 [抗JH活性試験I]

桑葉を与えて室内飼育した家蚕 (*Bombyx mori*) の3令又は4令起蚕幼虫 (それぞれ脱皮後0～8時間以内のもの) に、アセトンで所定濃度に希釈した本発明化合物 (供試薬液) を、個体当たり1～4μℓあて腹部背面に滴
15 下処理した。処理後直ちに各幼虫をプラスチックケースに移し、桑葉を与えて営繭するまで飼育した。抗JH活性は、5令脱皮を経ずに、4令幼虫期で営繭を開始する個体 (早熟幼虫) の出現率 (%) で評価した。尚各供試薬液当りの試験個体数は20とした。また供試薬液に代
20 えアセトンを用いた対照区は、全て5令脱皮後営繭した。

供試薬液として実施例1で得た本発明化合物を用いて実施した上記試験の結果を第1表に示す。

- 31 -

第 1 表

	早熟変態誘起活性 (%)					
	3 令起幼虫			4 令起幼虫		
投 与 量 (μ g / 幼虫)	2	1	0.5	10	2	1
本発明化合物	100	70	10	100	100	20

上記第 1 表より、実施例 1 で得た本発明化合物は、抗 JH 活性を有していることが判る。

また上記本発明化合物の活性が、JH 作用物質であるメソプレンにより抑制されるか否かを検討した所、該メソプレンにより完全に抑制された。

〔抗 JH 活性試験 II〕

上記抗 JH 活性試験 I と同様にして、家蚕 4 令起蚕幼虫に、所定濃度に希釈した供試薬液を滴下処理後、営繭するまで飼育し、同様にして 5 令脱皮を経ずに 4 令幼虫期で営繭を開始する個体（早熟幼虫）の出現率（%）を求め、該出現率が 50 % となる供試薬液濃度を求め、これを抗 JH 活性値（ED₅₀）とした。

前記実施例 1 ～ 13 で得た各本発明化合物を用いて得られた結果を第 2 表に示す。

- 32 -

第 2 表

供 試 化 合 物	ED ₅₀ (μ g/個体)
実施例 1 で得た化合物	1.4
実施例 2 で得た化合物	17.5
実施例 3 で得た化合物	5.8
実施例 4 で得た化合物	3.5
実施例 5 で得た化合物	3.1
実施例 6 で得た化合物	2.4
実施例 7 で得た化合物	4.2
実施例 8 で得た化合物	6.4
実施例 9 で得た化合物	1.8
実施例 10 で得た化合物	1.9
実施例 11 で得た化合物	3.5
実施例 12 で得た化合物	3.6
実施例 13 で得た化合物	6.6

上記第 2 表より、実施例 1 ~ 13 で得た本発明化合物は、いずれも抗 JH 活性を有しており、抗 JH 活性剤として有用であることが判る。

[害虫防除試験]

直径 30 mm のプラスチックシャーレに培地を 2 ml 入れ、これにエタノールで所定濃度 (1000 ~ 0.0001

- 33 -

ppm) に希釈した本発明化合物液を入れる。尚、培地中のエタノール濃度は最終的に 1 % 以下となるようにする。

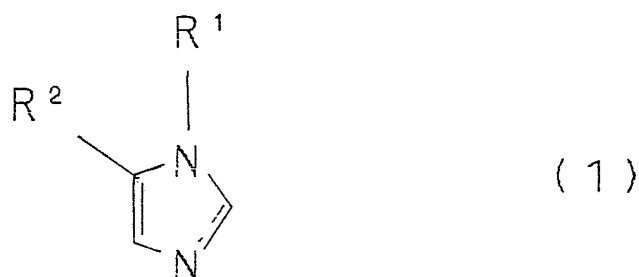
次いで上記シャーレに線虫成虫を 1 シャーレ当たり各 5 匹ずつ入れ、24 時間後の供試虫の生死、苦悶、異常
5 及び正常個体数を計数する。また、その後の生存個体を正常飼育器に移し、4 日後の生存産仔数を調べる。各試験はすべて室温下に実施する。

上記試験の結果、前記実施例 1 ~ 13 で得られた本発明化合物は、いずれも 100 ppm 以上の高濃度でも、殆
10 んど速効的致死作用は認められないが、苦悶乃至行動異常は、1000 ppm ~ 0.001 ppm の濃度で認められた。また 4 日後の産仔数は、上記各本発明化合物につき、いずれも 10 ppm 程度以上の濃度で明らかに減少し、このことから本発明化合物は、害虫防除に有効であること
15 が判った。

- 34 -

請 求 の 範 囲

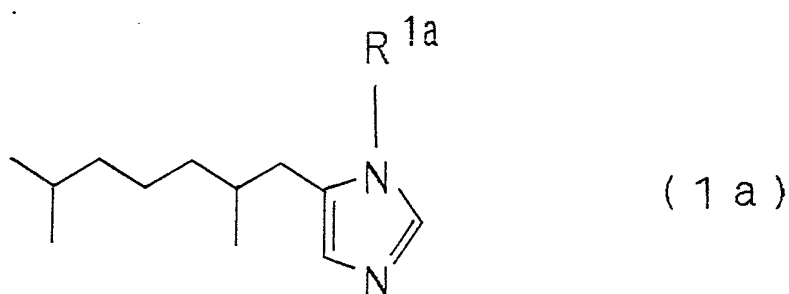
① 一般式



(式中 R^1 は低級アルキル基、シクロアルキル基又はフェニル低級アルキル基を示し、 R^2 は2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル基又は2, 6-ジメチルヘプチル基を示す。但し R^1 がフェニル低級アルキル基で且つ R^2 が2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル基の場合を除く。)

で表わされる1, 5-ジ置換イミダゾール及びその塩。

② 一般式



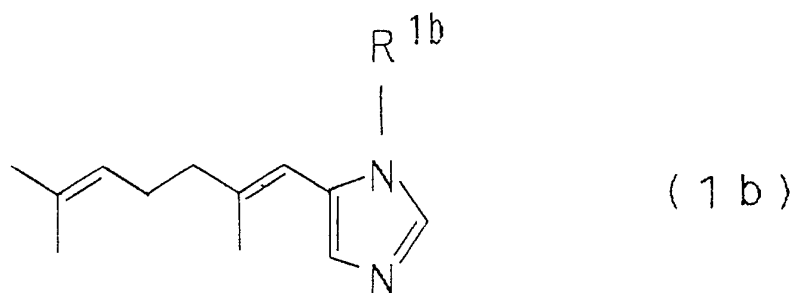
(式中 R^{1a} はフェニル低級アルキル基を示す。)

で表わされる化合物及びその塩である請求の範囲第1項に記載の1, 5-ジ置換イミダゾール及びその塩。

③ 1-ベンジル-5-(2, 6-ジメチルヘプチル)

イミダゾール及びその塩である請求の範囲第2項に記載の1, 5-ジ置換イミダゾール及びその塩。

④ 一般式



(式中R^{1b}は低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。)

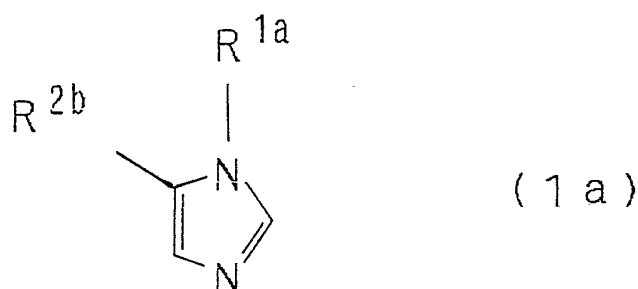
で表わされる化合物及びその塩である請求の範囲第1項に記載の1, 5-ジ置換イミダゾール及びその塩。

- ⑤ 1-メチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-エチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-プロピル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-ブチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-アミル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-ヘキシル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-イソプロピル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-イソブチル-5-(2, 6-ジメチル-1, 5-ヘ

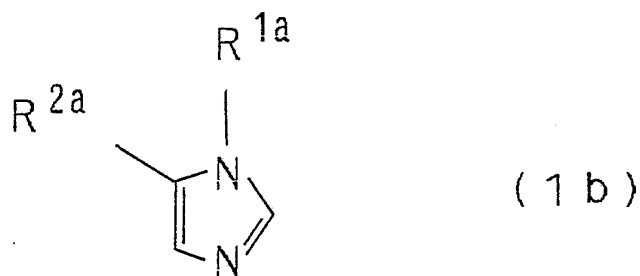
- 36 -

プタジエニル)イミダゾール、1-sec-ブチル-5-(2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-イソアミル-5-(2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル)イミダゾール、1-シクロペンチル-5-(2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル)イミダゾール及び1-シクロヘキシル-5-(2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル)イミダゾール並びに之等の塩からなる群から選択される請求の範囲載第4項に記載の1,5-ジ置換イミダゾール及びその塩。

⑥ 一般式



(式中R^{1a}はフェニル低級アルキル基及びR^{2b}は2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル基を示す。)
で表わされる化合物を接触還元することを特徴とする一般式

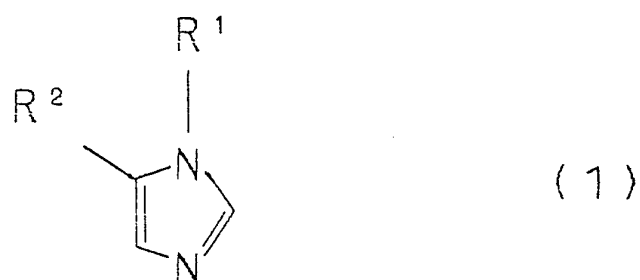


- 37 -

(式中 R^{1a} は上記に同じ。 R^{2a} は2,6-ジメチルヘプチル基を示す。)

で表わされる1,5-ジ置換イミダゾールの製造方法。

⑦ 一般式

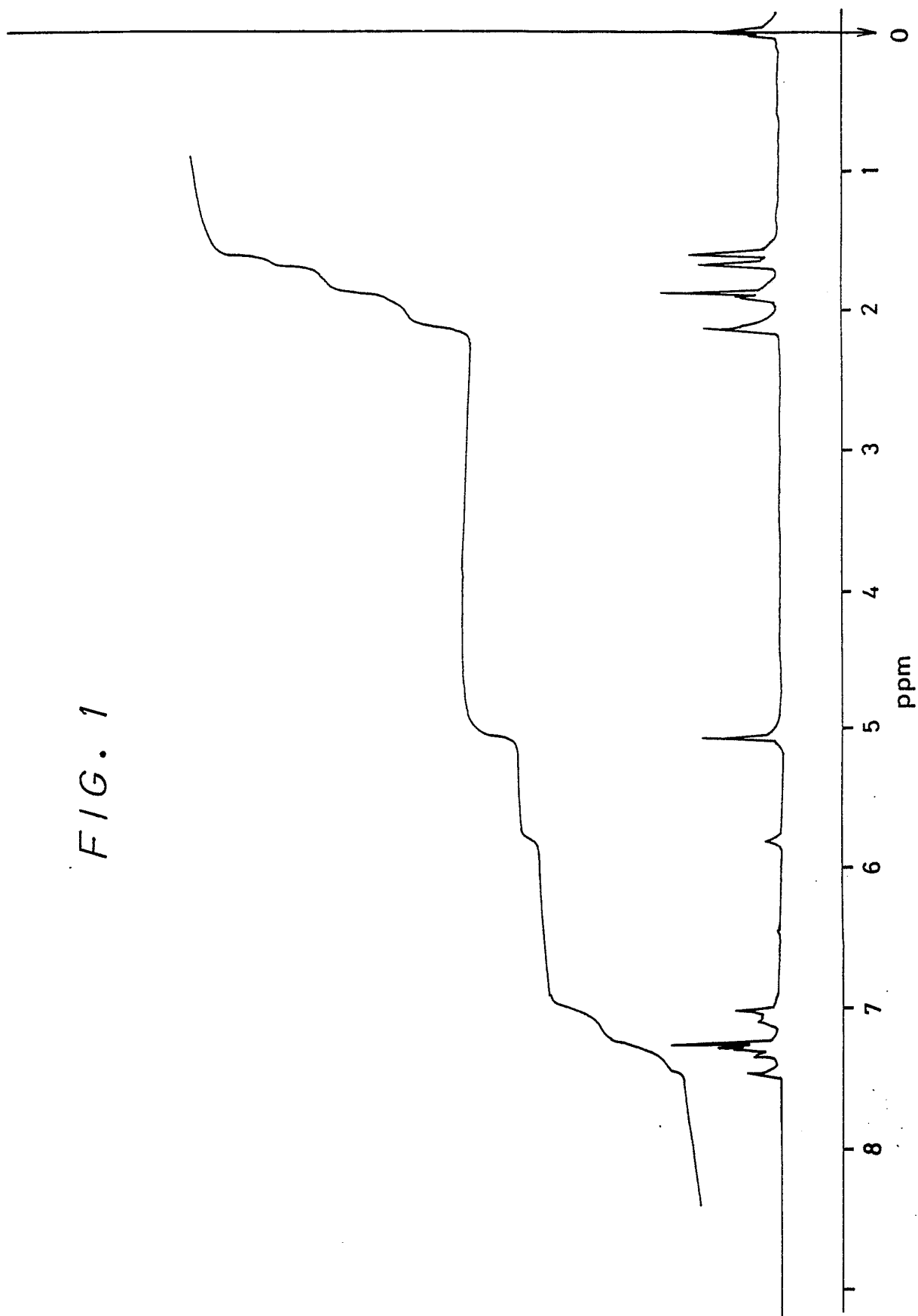


(式中 R^1 及び R^2 は前記に同じ。)

で表わされる1,5-ジ置換イミダゾール又はその塩を有効成分として含有する抗幼若ホルモン活性剤。

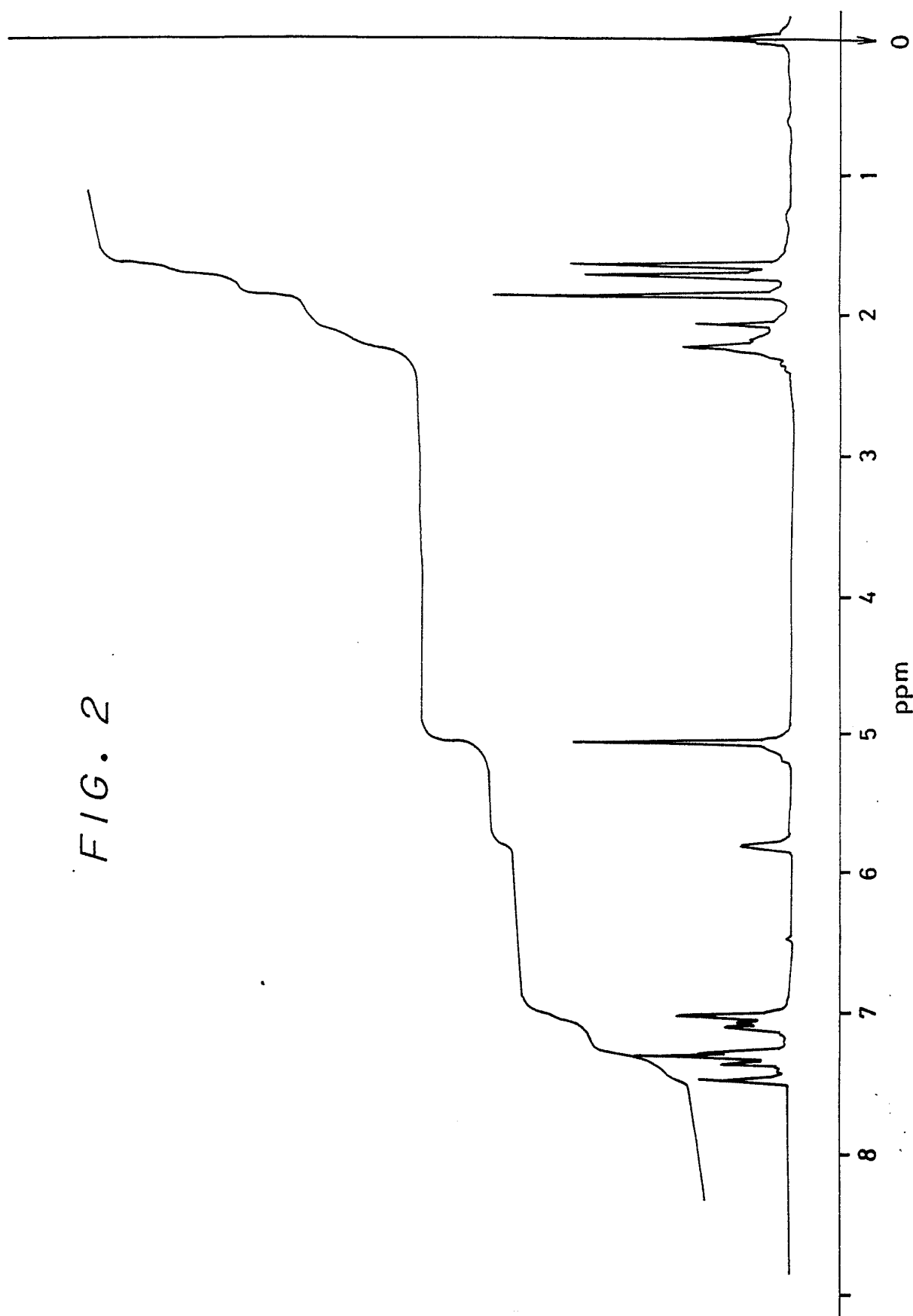
$\frac{1}{15}$

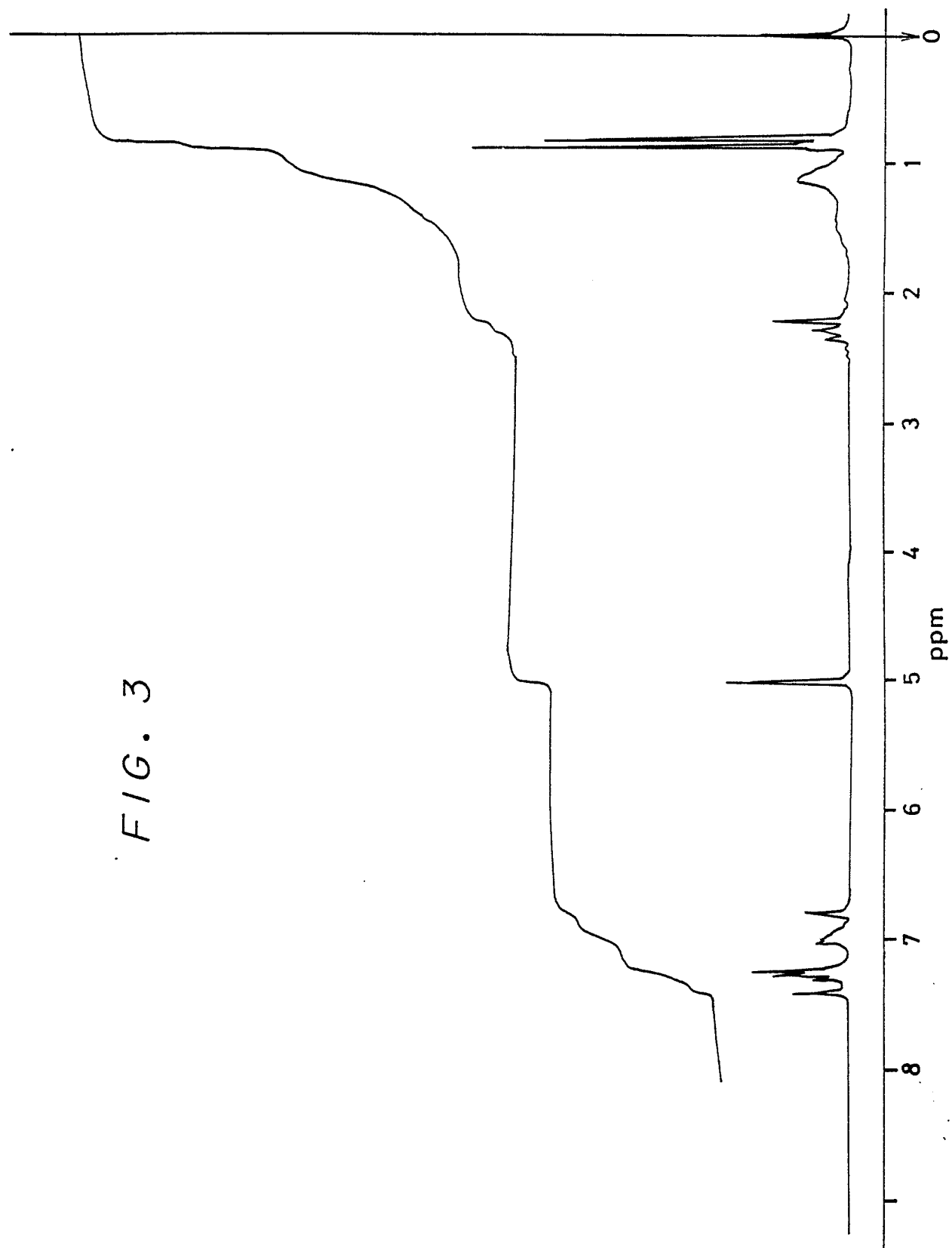
FIG. 1



$\frac{2}{15}$

FIG. 2



$\frac{3}{15}$ 

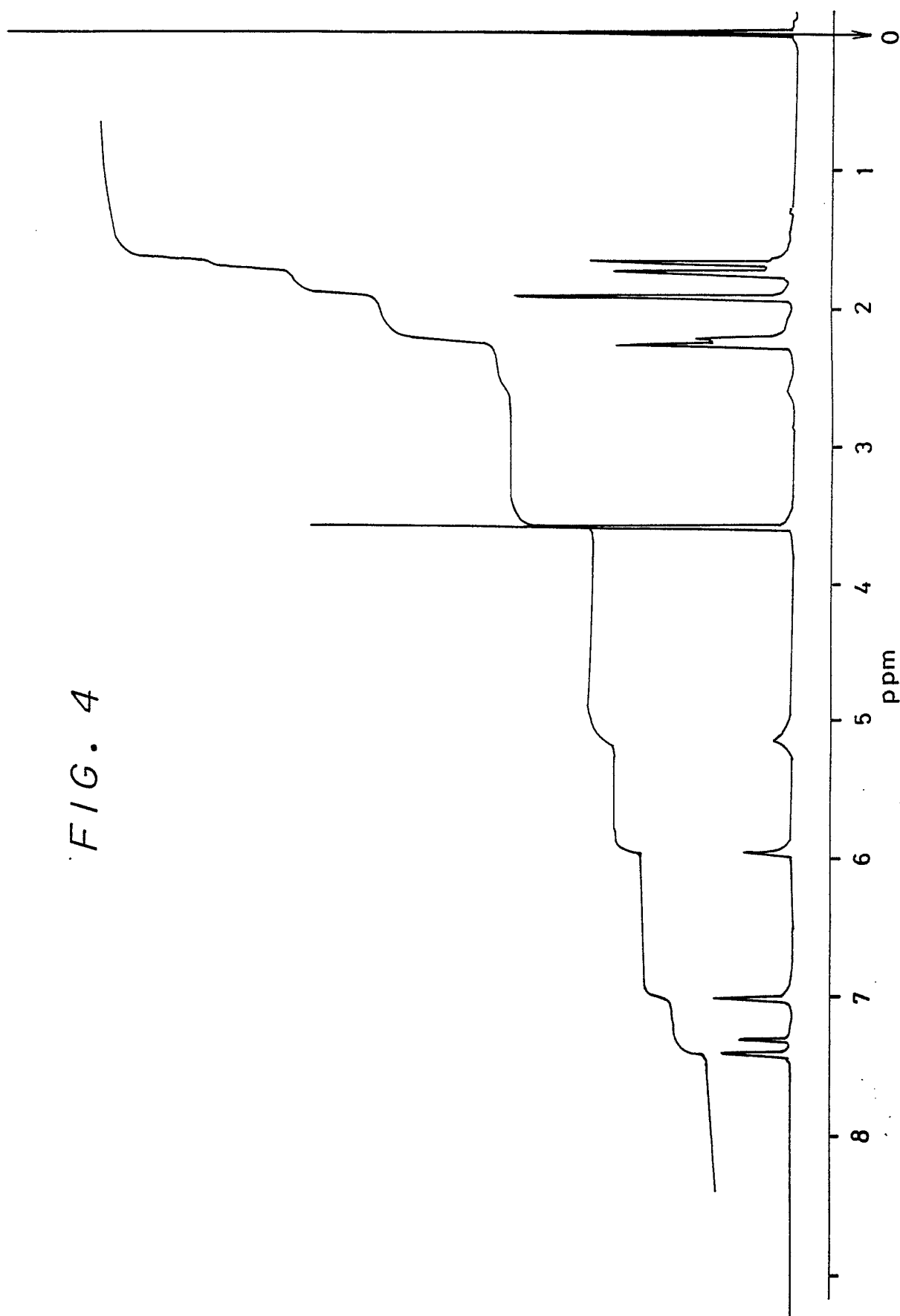
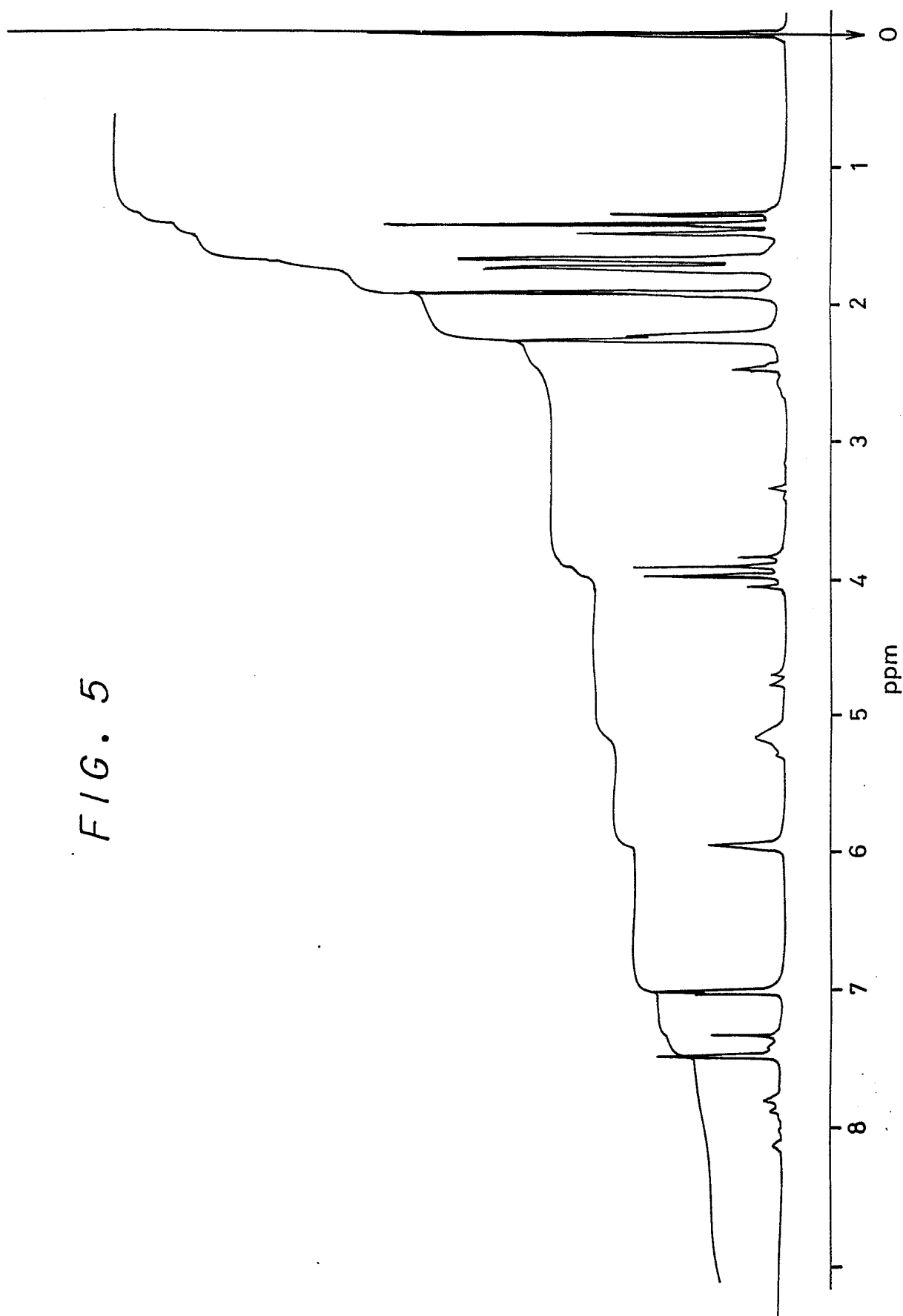
$\frac{4}{15}$ 

FIG. 4

5/15

FIG. 5



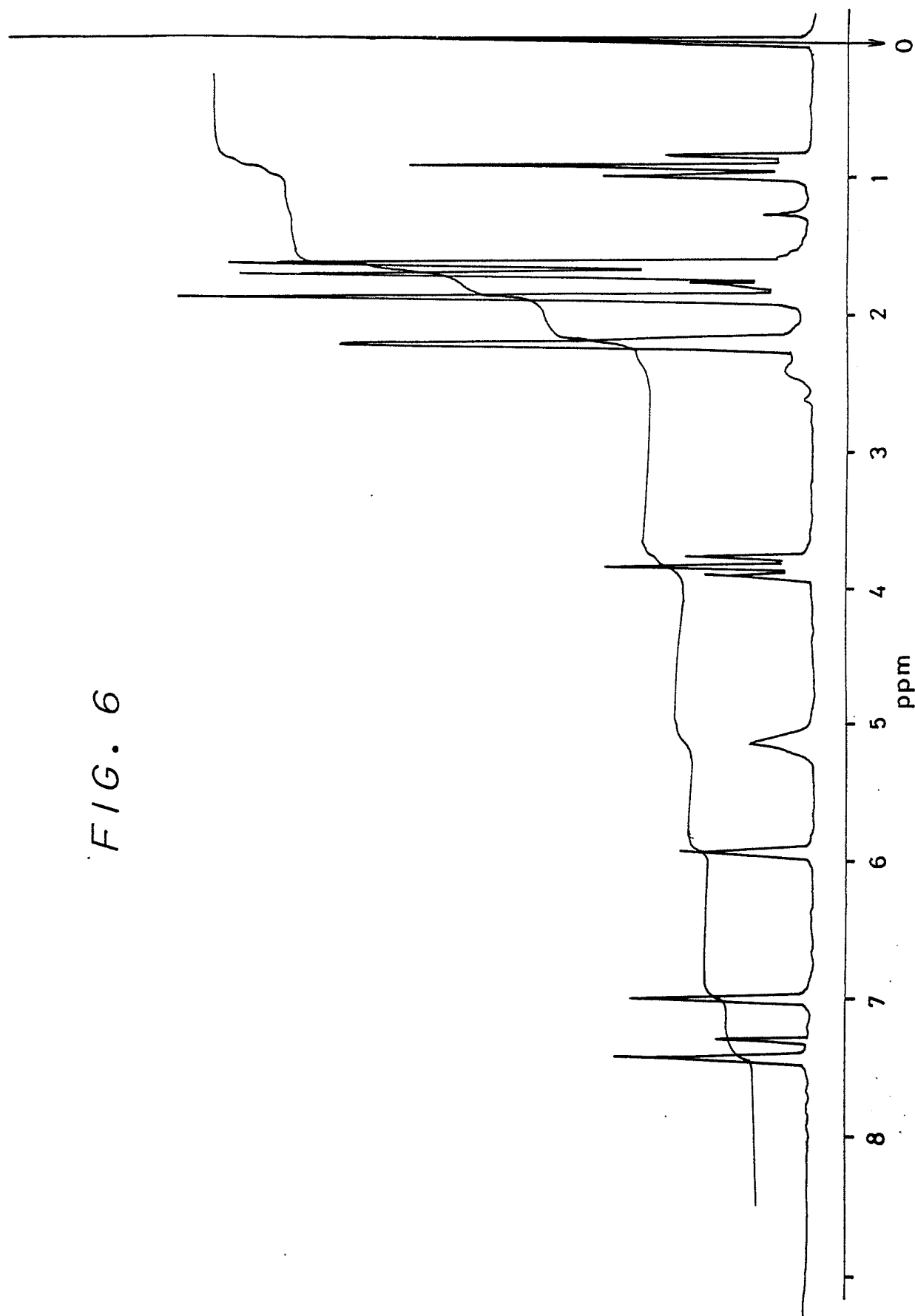
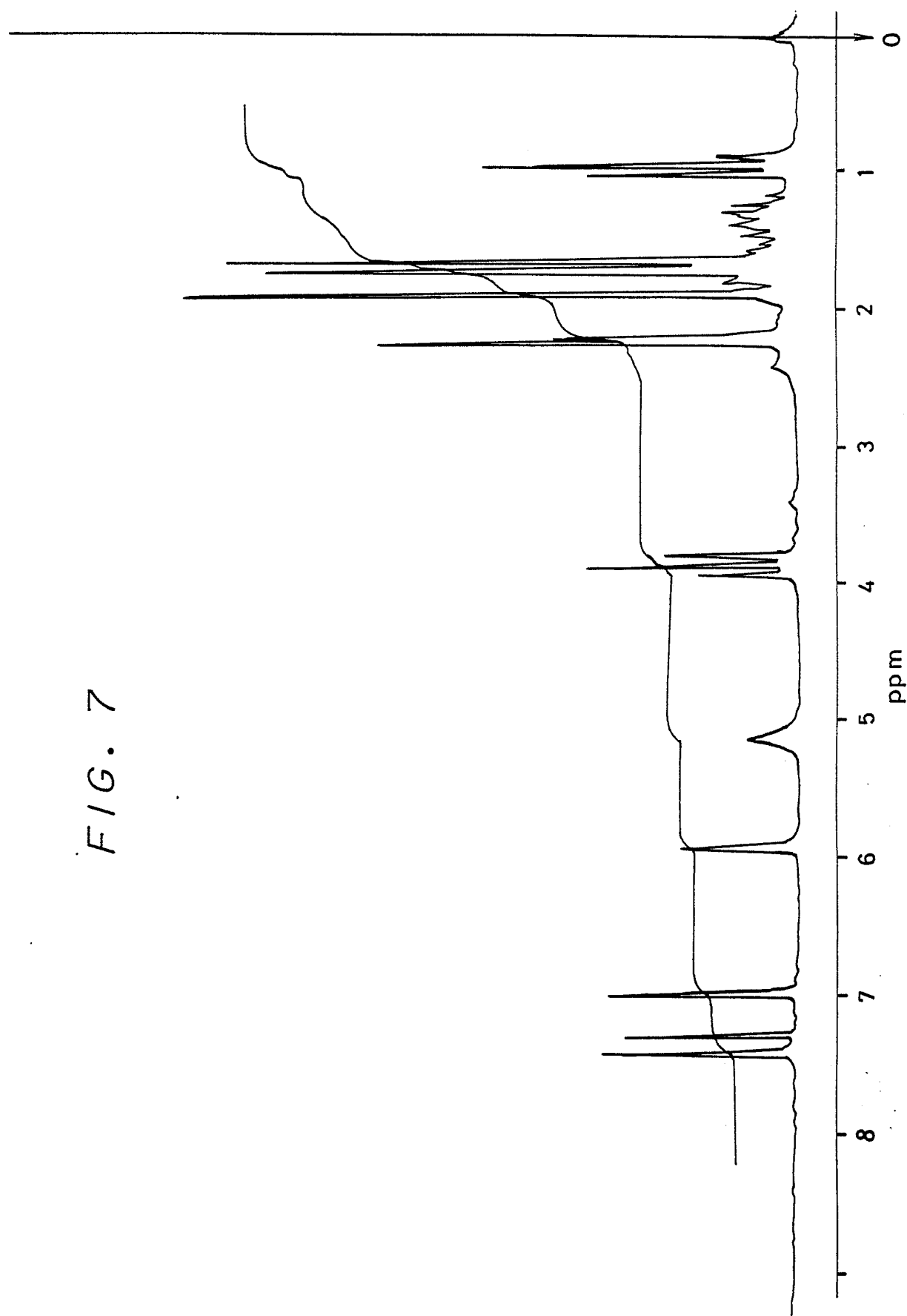
$\frac{6}{15}$ 

FIG. 6

7/15

FIG. 7



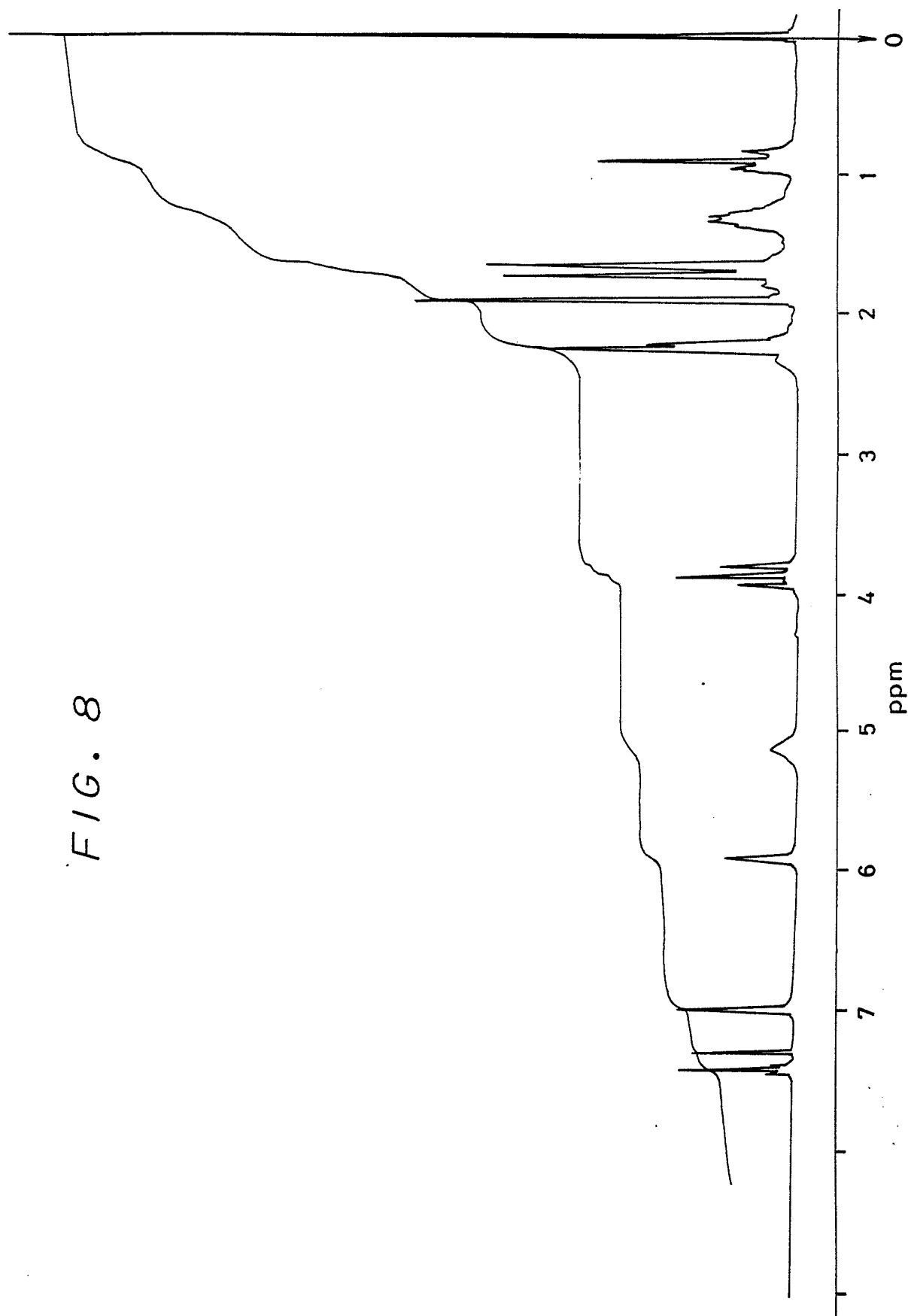
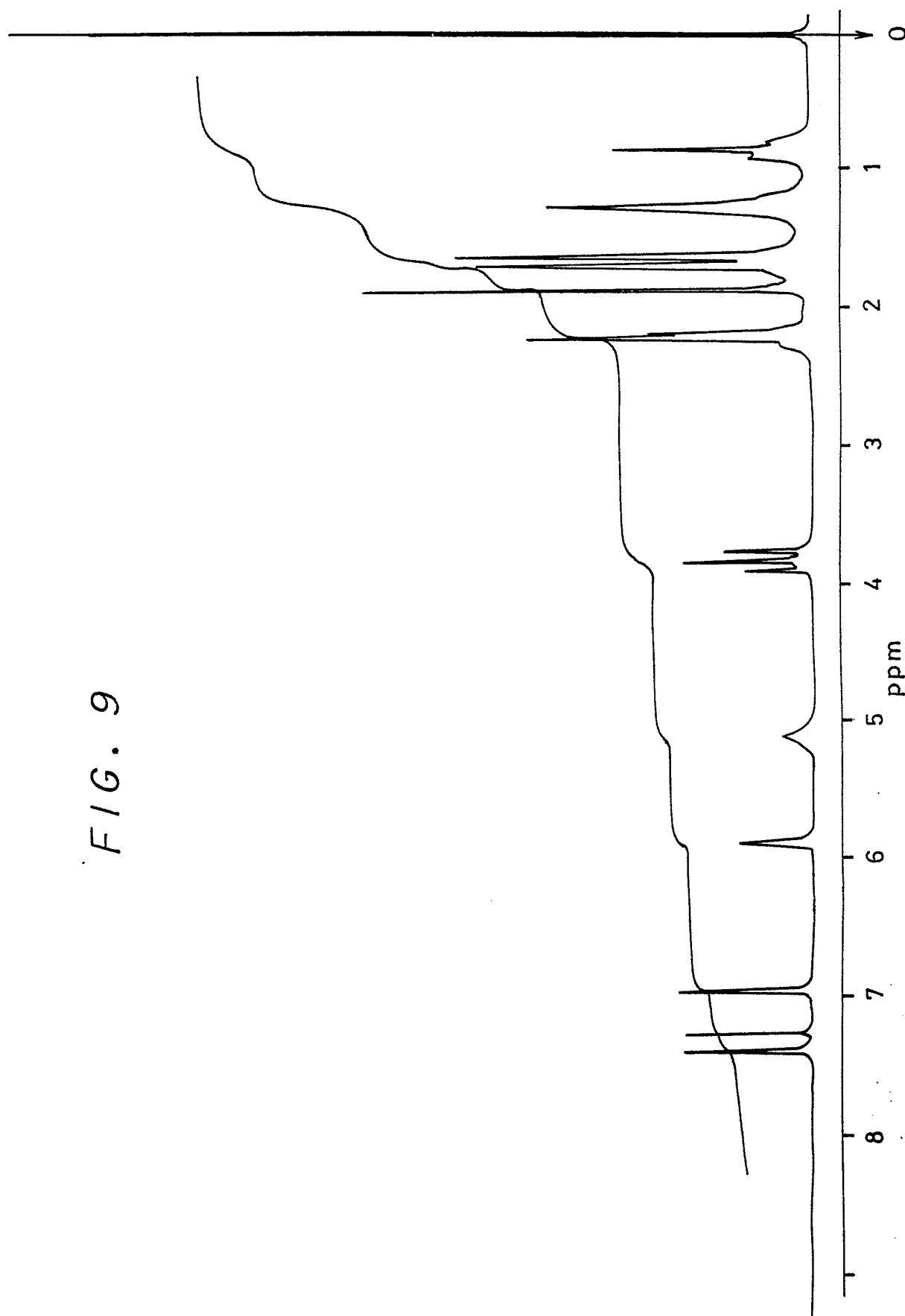
$\frac{8}{15}$ 

FIG. 8

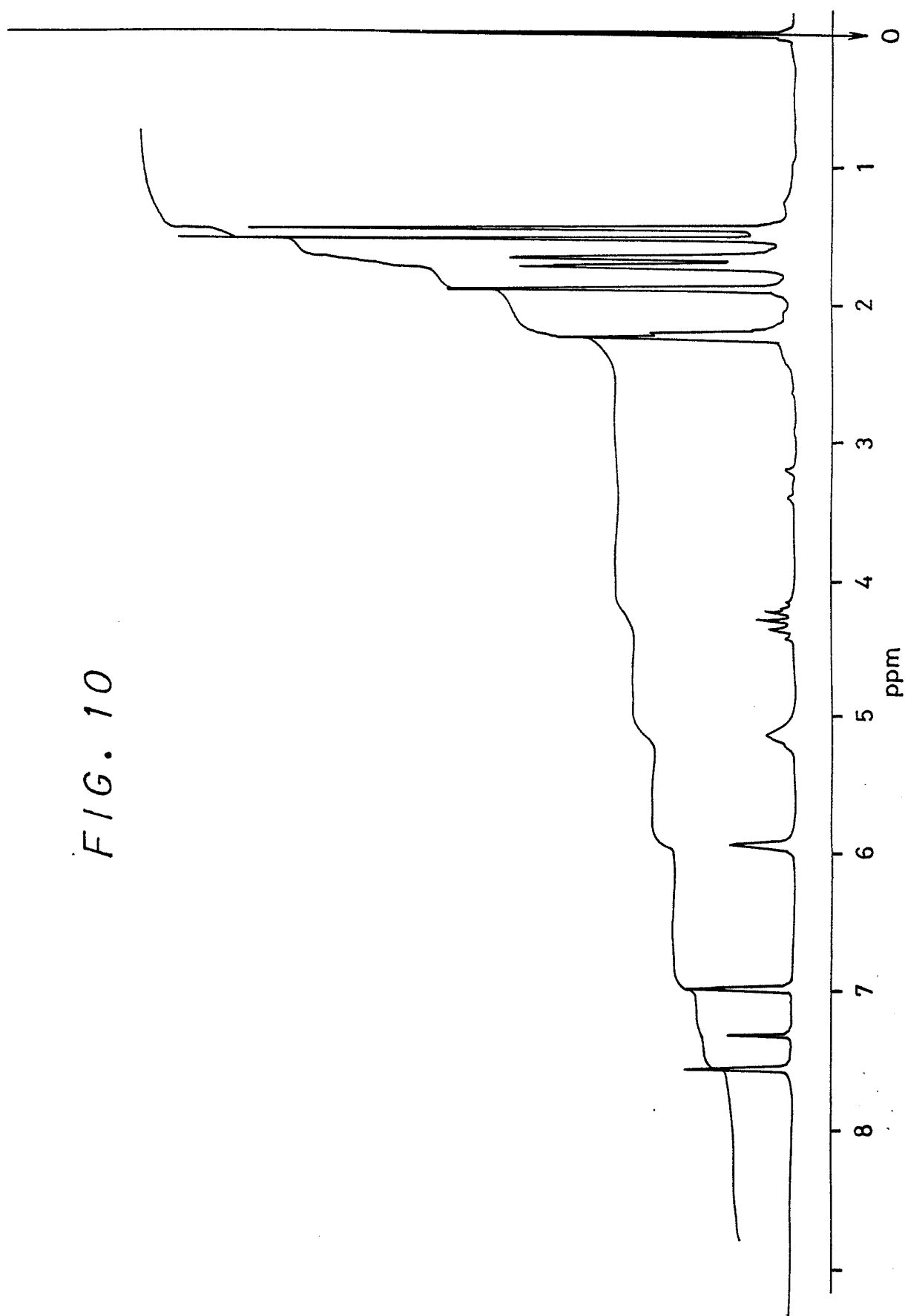
$\frac{9}{15}$

FIG. 9



$\frac{10}{15}$

FIG. 10



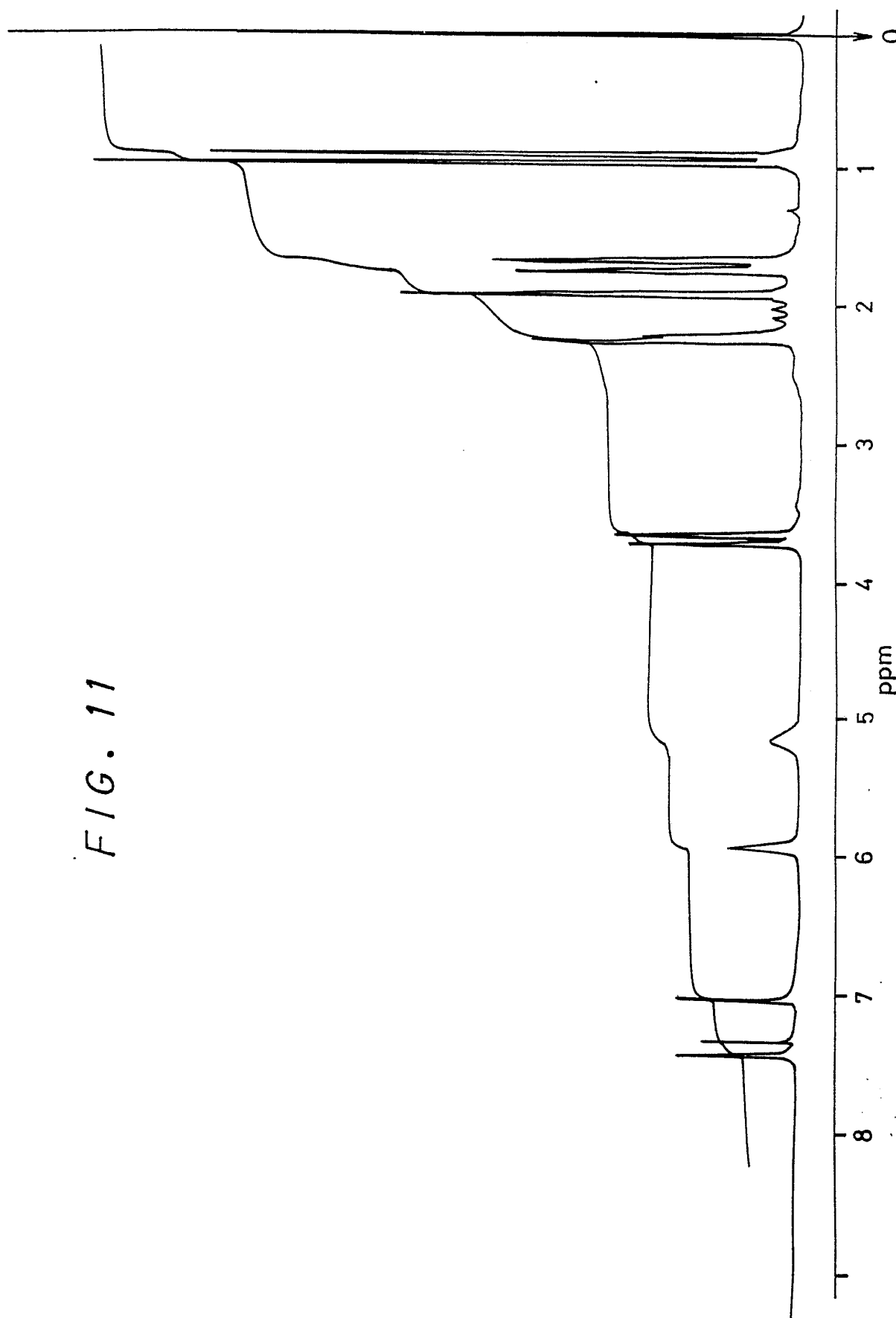
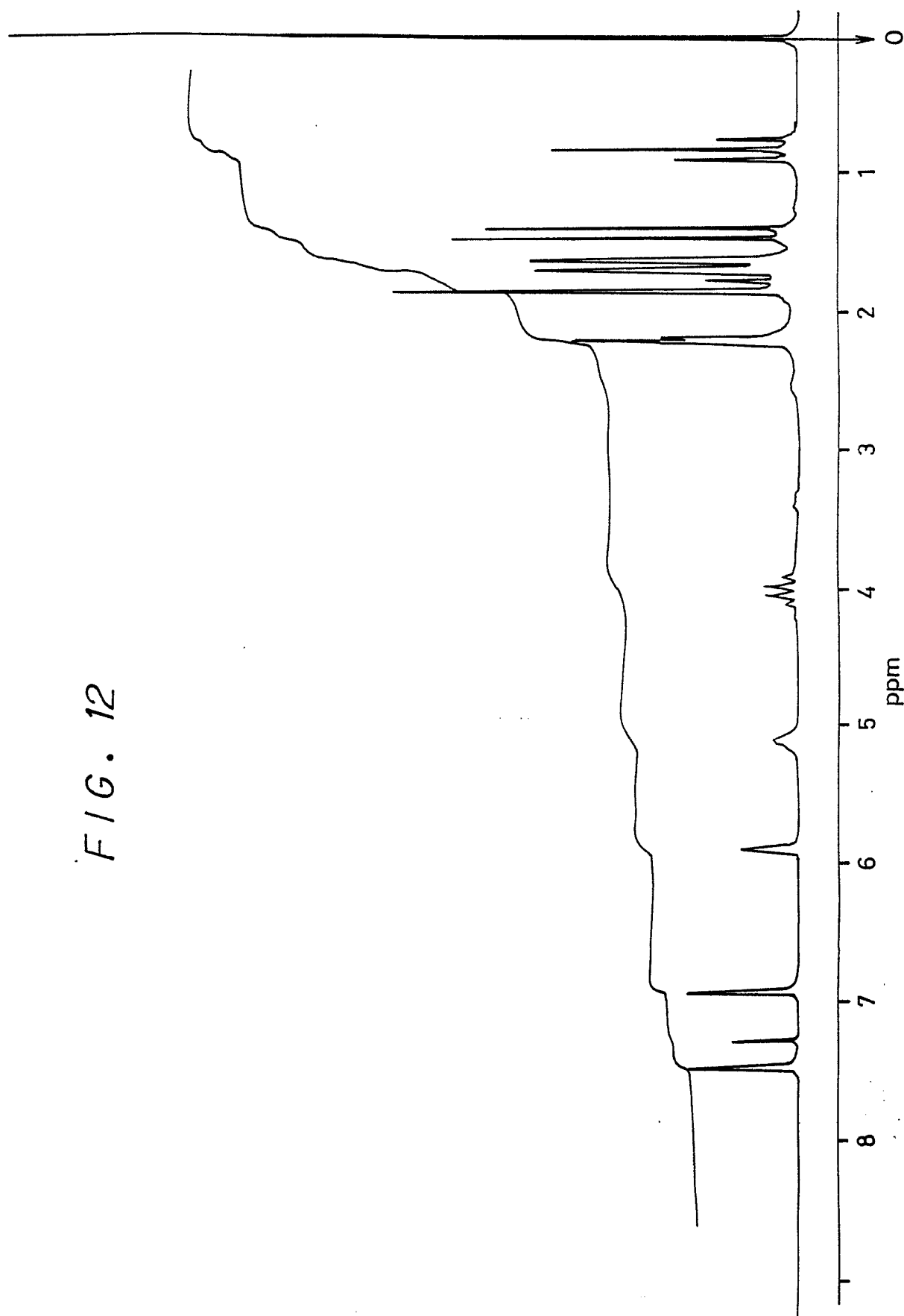
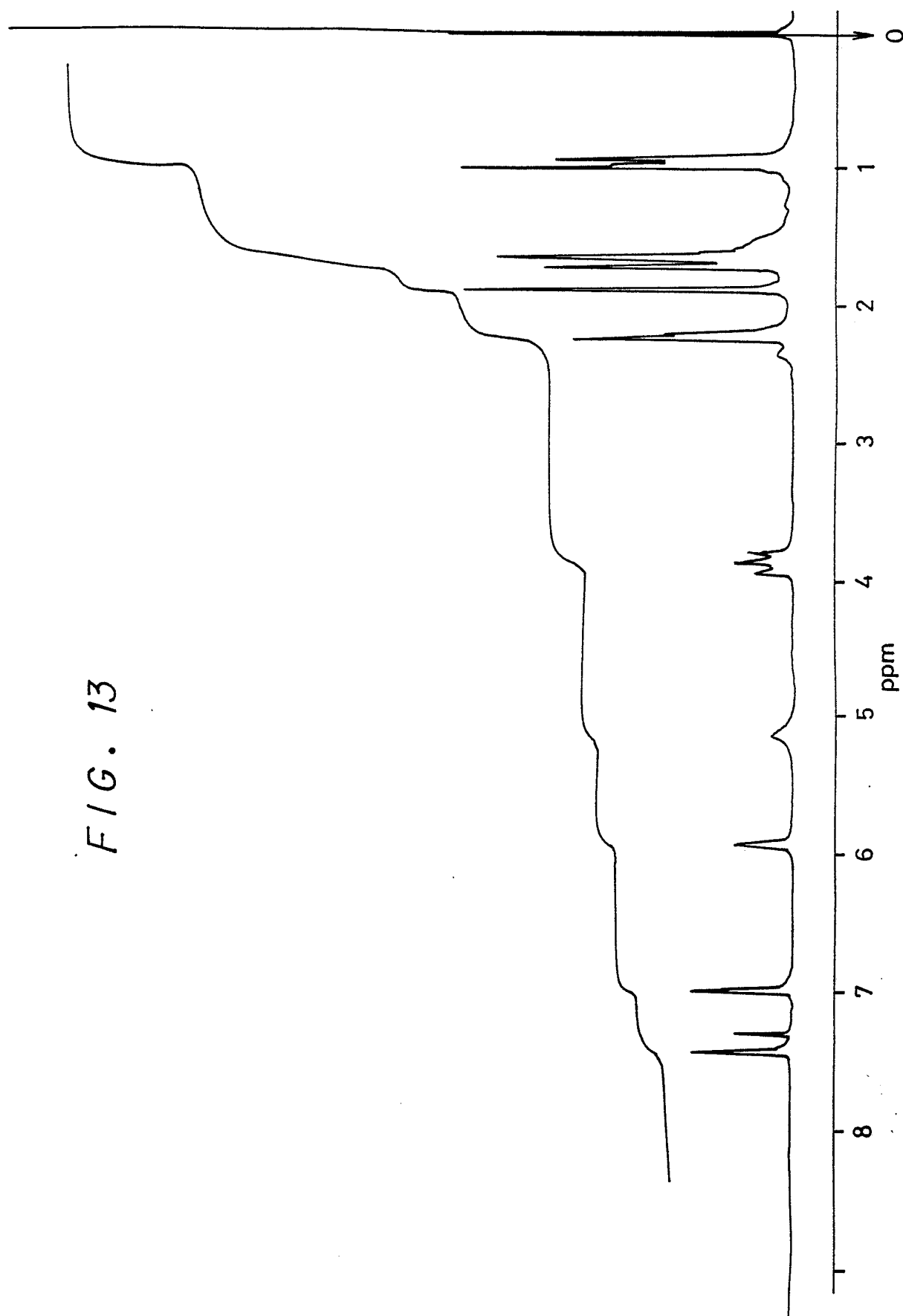
$\frac{11}{15}$ 

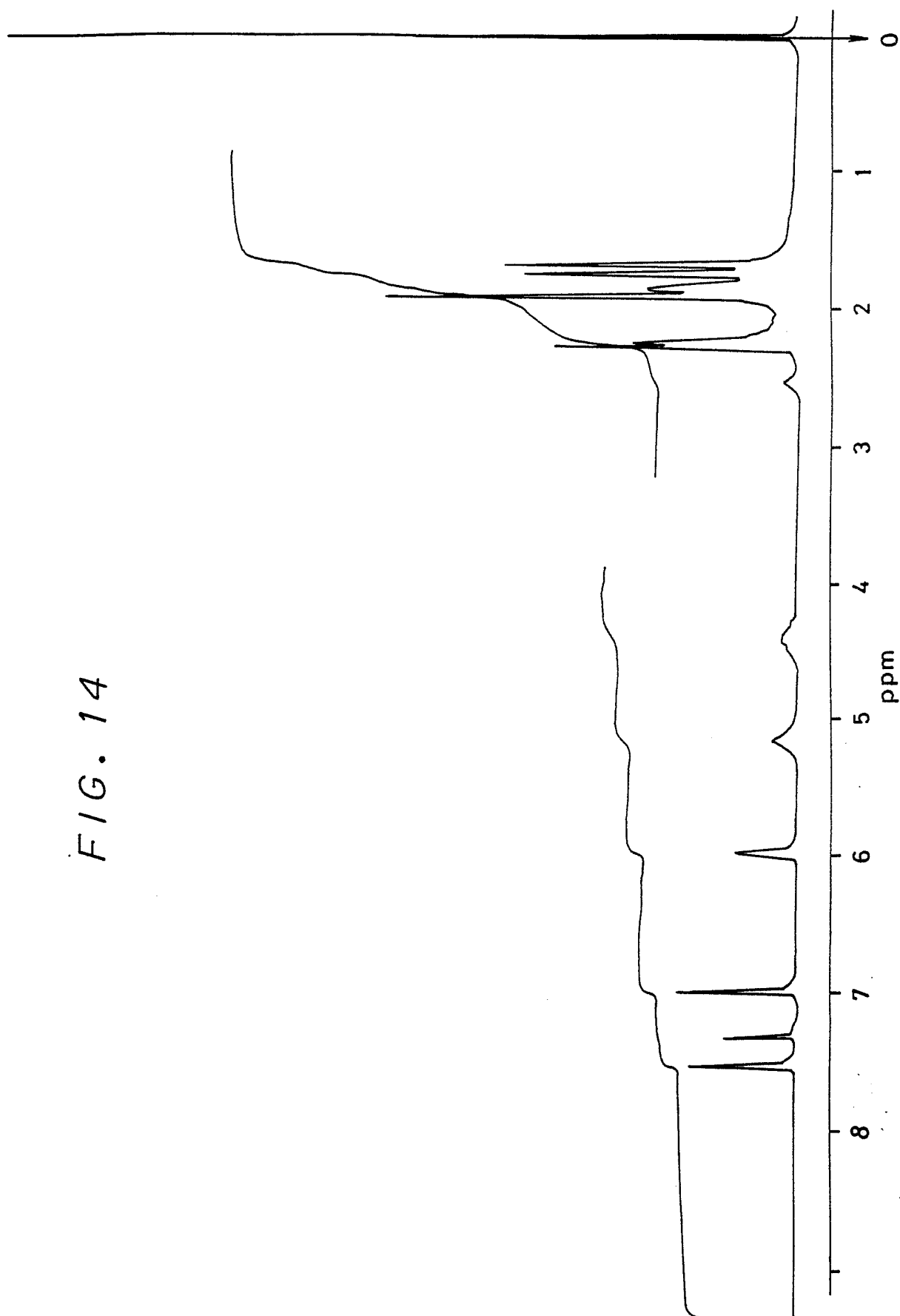
FIG. 11

12/
15

$\frac{13}{15}$ 

$\frac{14}{15}$

FIG. 14



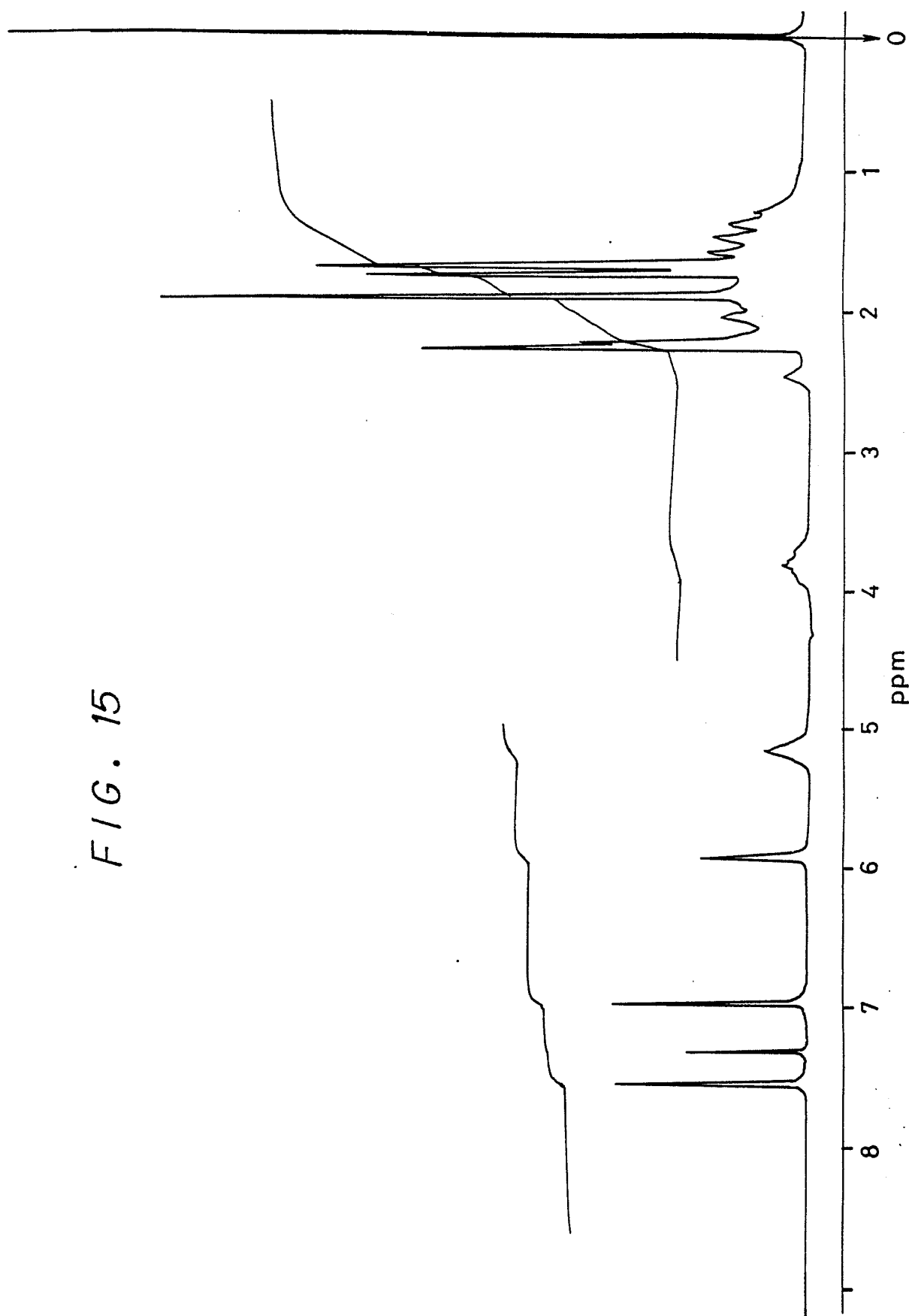
15/
15

FIG. 15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/JP87/00180

I. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER (if several classification symbols apply, indicate all) ¹		
According to International Patent Classification (IPC) or to both National Classification and IPC		
Int.Cl ⁴ C07D233/58		
II. FIELDS SEARCHED		
Minimum Documentation Searched ⁴		
Classification System	Classification Symbols	
IPC	C07D233/58	
Documentation Searched other than Minimum Documentation to the Extent that such Documents are Included in the Fields Searched ⁴		
III. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT ¹⁴		
Category [*]	Citation of Document, ¹⁵ with indication, where appropriate, of the relevant passages ¹⁷	Relevant to Claim No. ¹⁸
A	Agricultural and Biological Chemistry Vol.49, No.2, (1985), P.483-6	1-7
P	JP, A, 61-63660 (Earth Chemical Co., Ltd.) 1 April 1986 (01. 04. 86) (Family: none)	1-7
[*] Special categories of cited documents: ¹⁸ "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document 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 "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		
IV. CERTIFICATION		
Date of the Actual Completion of the International Search ²		Date of Mailing of this International Search Report ²
April 22, 1987 (22. 04. 87)		May 6, 1987 (06. 05. 87)
International Searching Authority ¹		Signature of Authorized Officer ²⁰
Japanese Patent Office		

I. 発明の属する分野の分類		
国際特許分類 (IPC) Int. Cl.⁴ C 0 7 D 2 3 3 / 5 8		
II. 国際調査を行った分野		
調 査 を 行 っ た 最 小 限 資 料		
分 類 体 系	分 類 記 号	
IPC	C 0 7 D 2 3 3 / 5 8	
最小限資料以外の資料で調査を行ったもの		
III. 関連する技術に関する文献		
引用文献の カテゴリー	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	請求の範囲の番号
A	Agricultural and Biological Chemistry 第49巻, 第2号, (1985), P. 483-6	1-7
P	JP, A. 61-63660 (アース製薬株式会社) 1. 4月, 1986 (01. 04. 86) (ファミリーなし)	1-7
※引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日の後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリーの文献		
IV. 認 証		
国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日	
22. 04. 87	06.05.87	
国際調査機関	権限のある職員	4 C 7 6 2 4
日本国特許庁 (ISA/JP)	特許庁審査官	種 村 慈 樹