

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5859033号
(P5859033)

(45) 発行日 平成28年2月10日 (2016. 2. 10)

(24) 登録日 平成27年12月25日 (2015. 12. 25)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 213/40 (2006. 01)

A 6 1 K 31/4402 (2006. 01)

C O 7 D 213/68 (2006. 01)

C O 7 D 401/12 (2006. 01)

A 6 1 K 31/4709 (2006. 01)

C O 7 D 213/40 C S P

A 6 1 K 31/4402

C O 7 D 213/68

C O 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4709

請求項の数 5 (全 44 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2013-558689 (P2013-558689)
 (86) (22) 出願日 平成25年2月12日 (2013. 2. 12)
 (86) 国際出願番号 PCT/JP2013/053230
 (87) 国際公開番号 W02013/122041
 (87) 国際公開日 平成25年8月22日 (2013. 8. 22)
 審査請求日 平成26年6月10日 (2014. 6. 10)
 (31) 優先権主張番号 特願2012-29731 (P2012-29731)
 (32) 優先日 平成24年2月14日 (2012. 2. 14)
 (33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(73) 特許権者 000004307
 日本曹達株式会社
 東京都千代田区大手町2丁目2番1号
 (74) 代理人 100064908
 弁理士 志賀 正武
 (74) 代理人 100108578
 弁理士 高橋 詔男
 (74) 代理人 100089037
 弁理士 渡邊 隆
 (74) 代理人 100094400
 弁理士 鈴木 三義
 (74) 代理人 100108453
 弁理士 村山 靖彦

最終頁に続く

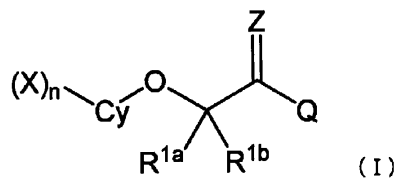
(54) 【発明の名称】 アリールオキシ酢酸アミド化合物および有害生物防除剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) で表されるアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩。

【化 1】



〔式 (I) 中、

Cy は、C 6 ~ 10 アリール基、または窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 ~ 4 個の複素原子を含む 5 ~ 10 員のヘテロアリール基を示す。

X は、Cy 上の置換基であり、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、アミノ基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキルアミノ基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 7 アシル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキルチオ基、無置換のもしくは置換基を有する

C 1～6 アルキルスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルコキシスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 6～10 アリール基、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1～4 個の複素原子を含む 5～10 員の無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、無置換のもしくは置換基を有するヒドロキシイミノ C 1～6 アルキル基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲン原子を示す。

n は、C y 上の X の個数を示しかつ 0～5 のいずれかの整数である。n が 2 以上のとき X は互いに同一でも異なってもよい。また、n が 2 以上のとき X は相互に繋がって X が結合する C y 上の炭素原子または窒素原子とともに環を形成してもよい。

R^{1a} は、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルコキシ基、または無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルキルチオ基を示す。

10

R^{1b} は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルケニル基、または無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルキニル基を示す。

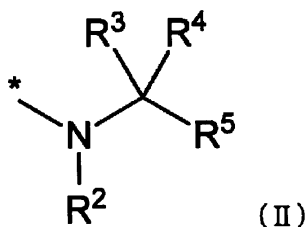
ここで、R^{1a} と R^{1b} は相互に繋がって R^{1a} および R^{1b} が結合する炭素原子とともに環を形成してもよい。又は、R^{1a} と R^{1b} は一緒になって、無置換のもしくは置換基を有するエキソメチレン基を形成してもよい。

Z は、酸素原子または硫黄原子を示す。

Q は、式 (I I) または式 (I I I) で表される基を示す。

20

【化 2】



(式 (I I) 中、

30

* は結合位置を示す。

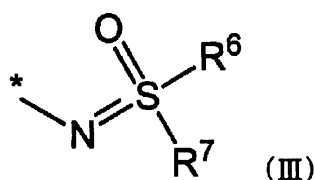
R² は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1～7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

R³ および R⁴ は、それぞれ独立に、無置換の C 1～6 アルキル基、C 1～6 ハロアルキル基、ヒドロキシ C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニルオキシ C 1～6 アルキル基、ヘテロアリールオキシ C 1～6 アルキル基、C 1～7 アシル基、C 1～7 アシルオキシ C 1～6 アルキル基、カルボキシル基 C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニル C 1～6 アルキル基、C 1～7 アシルアミノ C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルキルアミノカルボニル C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ C 1～6 アルキル基、C 7～11 アラルキル基、C 6～10 アリールカルボニルアミノ C 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 6～10 アリール基、又は窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1～4 個の複素原子を含む 5～10 員の無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基を示す。R⁵ は、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、及びキノキサリニル基、からなる群から選択される基である。)

40

50

【化 3】



(式 (I I I) 中、

*は結合位置を示す。

R⁶ および R⁷ は、それぞれ独立に、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ～ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 3 ～ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ～ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ～ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 6 ～ 10 アリール基、または窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 ～ 4 個の複素原子を含む 5 ～ 10 員の無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基を示す。ここで、R⁶ と R⁷ は相互に繋がって R⁶ および R⁷ が結合する硫黄原子とともに環を形成してもよい。)]

【請求項 2】

Cy がフェニル基、R^{1b} が水素原子、且つ Q が式 (II) で表される基である、請求項 1 に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩。

【請求項 3】

請求項 1 または 2 に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物及びその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有する有害生物防除剤。

【請求項 4】

請求項 1 または 2 に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物及びその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有する殺ダニ剤または殺虫剤。

【請求項 5】

請求項 1 または 2 に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物及びその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有する外部寄生虫防除剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規の有害生物防除剤に関する。より詳細には、本発明は、優れた殺ダニ活性および／または殺虫活性を有し、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるアリールオキシ酢酸アミド化合物ならびにこれを有効成分として含有する殺ダニ剤および／または殺虫剤に関する。

本願は、2012年2月14日に、日本に出願された特願2012-29731号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

【背景技術】

【0002】

本発明の化合物に構造上関連する化合物として、特許文献1～3には、式(A)～式(C)で表される化合物が開示されている。

【0003】

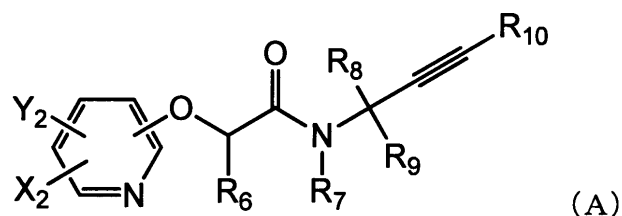
10

20

30

40

【化 1】



【0004】

10

式 (A) 中、 X_2 は、水素原子、ハロゲン原子、C 1～8 アルキル基などを表す。

Y_2 は、水素原子、ハロゲン原子、C 1～8 アルキル基などを表す。

R_6 は、フェニル基、シアノ基、C 1～4 アルキル基などを表す。

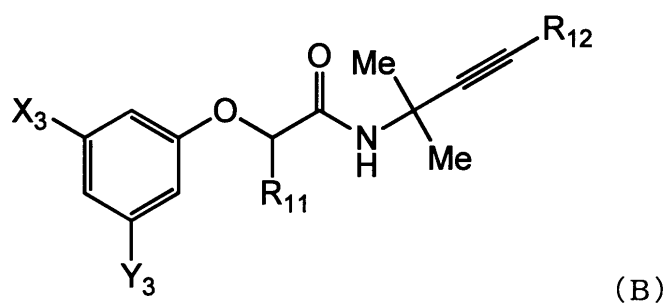
R_7 は、水素原子、C 1～4 アルキル基などを表す。

R_8 及び R_9 は、独立して、水素原子、C 1～3 アルキル基などを表す。

R_{10} は、ハロゲン原子、C 1～4 アルキル基を表す。

【0005】

【化 2】



20

【0006】

30

式 (B) 中、 X_3 は、塩素原子、臭素原子、またはメチル基を表す。

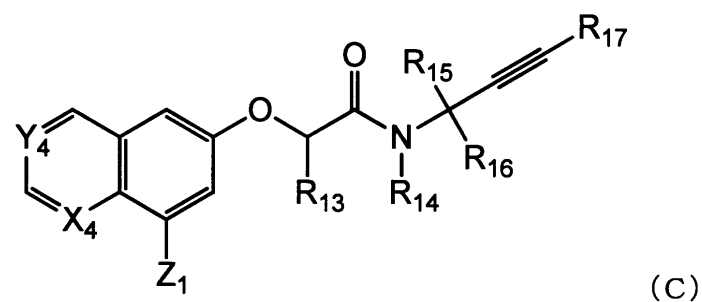
Y_3 は、塩素原子、臭素原子、またはメチル基を表す。

R_{11} は、エチル基、n-プロピル基を表す。

R_{12} は、エチル基を表す。

【0007】

【化 3】



40

【0008】

式 (C) 中、 X_4 及び Y_4 のうちの一方は、窒素原子または窒素酸化物を表し、もう一方は CR (R は、水素原子、ハロゲン原子などを表す) を表す、あるいは、 X_4 及び Y_4 の両方が窒素原子を表す。

Z_1 は、水素原子、ハロゲン原子などを表す。

50

R₁₃は、アルキル基、アルケニル基などを表す。

R₁₄は、ベンジル部分のフェニル環が任意的にC 1～4 アルコキシ基で置換されているベンジルオキシメチル基などを表す。

R₁₅及びR₁₆は、両方ともに水素原子でなく、両方が水素原子以外である場合それらの組合せた炭素原子合計が4を超えないことを条件として、独立して水素原子、C 1～3 アルキル基などを表す。

R₁₇は、C 1～4 アルキル基、C 3～6 シクロアルキル基などを表す。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0009】

【特許文献1】特開2005-517642号公報

【特許文献2】特開2006-507338号公報

【特許文献3】特開2006-507339号公報

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0010】

本発明は、新規の有害生物防除剤、その中でも、優れた殺ダニ活性および／または殺虫活性を有し、安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できるアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩ならびにこれを有効成分として含有する殺ダニ剤および／または殺虫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】

【0011】

本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意検討した結果、特定の構造を有するアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩は、優れた殺ダニ活性および／または殺虫活性を有し、且つ良好な特性と高い安全性を示す殺ダニ剤および／または殺虫剤の有効成分となりうることを見出した。

本発明は、これらの知見に基づいて完成するに至ったものである。

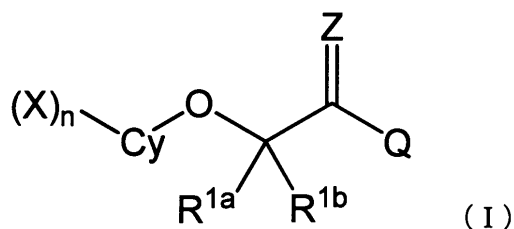
【0012】

すなわち、本発明は、以下のものを含む。

〔1〕 式(I)で表されるアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩。

【0013】

【化4】



〔式(I)中、

Cyは、C 6～10 アリール基、または窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～4個の複素原子を含む5～10員のヘテロアリール基を示す。

Xは、Cy上の置換基であり、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシ基、アミノ基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキルアミノ基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～7 アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキルチオ基、無置換のもしくは置換基を有する

C 1～6 アルキルスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルコキシスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 6～10 アリール基、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1～4 個の複素原子を含む 5～10 員の無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、無置換のもしくは置換基を有するヒドロキシイミノ C 1～6 アルキル基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲン原子を示す。

n は、C y 上の X の個数を示し、かつ 0～5 のいずれかの整数である。n が 2 以上のとき X は互いに同一でも異なってもよい。また、n が 2 以上のとき X は相互に繋がって X が結合する C y 上の炭素原子または窒素原子とともに環を形成してもよい。

R^{1a} は、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルコキシ基、または無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルキルチオ基を示す。

10

R^{1b} は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルケニル基、または無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルキニル基を示す。ここで、R^{1a} と R^{1b} とは相互に繋がって R^{1a} および R^{1b} が結合する炭素原子とともに環を形成してもよい。又は、R^{1a} と R^{1b} は一緒になって、無置換のもしくは置換基を有するエキソメチレン基を形成してもよい。

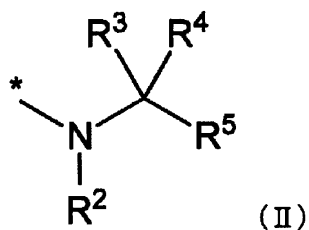
Z は、酸素原子または硫黄原子を示す。

Q は、式 (II) または式 (III) で表される基を示す。

【0014】

20

【化 5】



(式 (I I) 中、

30

* は結合位置を示す。

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

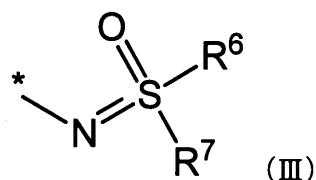
R³ および R⁴ は、それぞれ独立に、無置換の C 1～6 アルキル基、C 1～6 ハロアルキル基、ヒドロキシ C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニルオキシ C 1～6 アルキル基、ヘテロアリールオキシ C 1～6 アルキル基、C 1～7 アシル基、C 1～7 アシルオキシ C 1～6 アルキル基、カルボキシル基 C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニル C 1～6 アルキル基、C 1～7 アシルアミノ C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルキルアミノカルボニル C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ C 1～6 アルキル基、C 7～11 アラルキル基、C 6～10 アリールカルボニルアミノ C 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2～6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 6～10 アリール基、又は窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1～4 個の複素原子を含む 5～10 員の無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基を示す。R⁵ は、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、及びキノキサリニル基、からなる群から選択される基である。)

40

50

【0015】

【化6】



(式 (III) 中、

10

*は結合位置を示す。

R⁶およびR⁷は、それぞれ独立に、無置換のもしくは置換基を有するC1～6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC3～8シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC2～6アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC2～6アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC6～10アリール基、または窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～4個の複素原子を含む5～10員の無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基を示す。ここで、R⁶とR⁷は相互に繋がってR⁶およびR⁷が結合する硫黄原子とともに環を形成してもよい。)]

【0016】

〔2〕 Cyがフェニル基、R^{1b}が水素原子、且つQが式(II)で表される基である、〔1〕に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩。

20

【0017】

〔3〕 前記〔1〕または〔2〕に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物及びその塩から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有する有害生物防除剤。

〔4〕 前記〔1〕または〔2〕に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物及びその塩から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有する殺ダニ剤または殺虫剤。

〔5〕 前記〔1〕または〔2〕に記載のアリールオキシ酢酸アミド化合物及びその塩から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有する外部寄生虫防除剤。

【発明の効果】

【0018】

30

本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩は、農作物や衛生面で問題となる有害生物を防除することができる。特に、ダニ類を効果的に防除することができる。

【発明を実施するための形態】

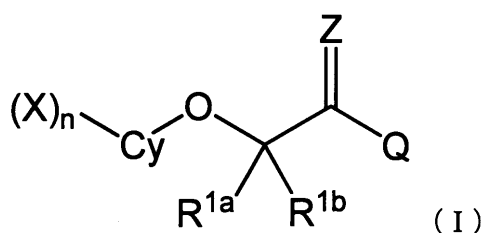
【0019】

〔アリールオキシ酢酸アミド化合物〕

本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物は、式(I)で表される化合物である。

【0020】

【化7】



40

【0021】

〔置換基〕

本発明において、「無置換の」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。なお、本明細書において、「置換基を有する」との記載がなく母核となる基の名称のみで記

50

載しているときは、別段の断りがない限り「無置換の」の意味である。

一方、「置換基を有する」の用語は、母核となる基のいずれかの水素原子が、母核と同一または異なる構造の基で置換されていることを意味する。従って、「置換基」は、母核となる基に結合した他の基である。置換基は1つであってもよいし、2つ以上であってもよい。2つ以上の置換基は同一であってもよいし、異なるものであってもよい。

【0022】

「C1～6」などの用語は、母核となる基の炭素原子数が1～6個などであることを表している。この炭素原子数には、置換基の中に在る炭素原子の数を含まない。例えば、置換基としてエトキシ基を有するブチル基は、C2アルコキシC4アルキル基に分類する。

【0023】

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

「置換基」となり得る基としては、具体的には以下の基を例示することができる。

フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子；

メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基などのC1～6アルキル基；

シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基などのC3～8シクロアルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などのC2～6アルケニル基；

2-シクロプロペニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロヘキセニル基、4-シクロオクテニル基などのC3～8シクロアルケニル基；

エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1,1-ジメチル-2-ブチニル基などのC2～6アルキニル基；

【0024】

メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、s-ブトキシ基、i-ブトキシ基、t-ブトキシ基などのC1～6アルコキシ基；

ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのC2～6アルケニルオキシ基；

エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのC2～6アルキニルオキシ基；

フェニル基、ナフチル基などのC6～10アリール基；

フェノキシ基、1-ナフトキシ基などのC6～10アリールオキシ基；

ベンジル基、フェネチル基などのC7～11アラルキル基；

ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC7～11アラルキルオキシ基；

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

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

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

カルボキシル基；

水酸基；

10

20

30

40

50

【0025】

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

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

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

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

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

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

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

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

【0026】

シアノ基；ニトロ基；アミノ基；

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

アニリノ基、ナフチルアミノ基などのC 6～10 アリアルアミノ基；

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

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

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

【0027】

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

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

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

【0028】

メルカプト基；

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

ビニルチオ基、アリルチオ基などのC 2～6 アルケニルチオ基；

エチニルチオ基、プロパルギルチオ基などのC 2～6 アルキニルチオ基；

フェニルチオ基、ナフチルチオ基などのC 6～10 アリアルチオ基；

チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などのヘテロアリアルチオ基；

ベンジルチオ基、フェネチルチオ基などのC 7～11 アラルキルチオ基；

(メチルチオ)カルボニル基、(エチルチオ)カルボニル基、(n-プロピルチオ)カルボニル基、(i-プロピルチオ)カルボニル基、(n-ブチルチオ)カルボニル基、(i-ブチルチオ)カルボニル基、(s-ブチルチオ)カルボニル基、(t-ブチルチオ)

10

20

30

40

50

カルボニル基などの (C 1～6 アルキルチオ) カルボニル基；

【0029】

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

アリルスルフィニル基などの C 2～6 アルケニルスルフィニル基；

プロパルギルスルフィニル基などの C 2～6 アルキニルスルフィニル基；

フェニルスルフィニル基などの C 6～10 アリールスルフィニル基；

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

ベンジルスルフィニル基、フェネチルスルフィニル基などの C 7～11 アラルキルスルフィニル基； 10

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

アリルスルホニル基などの C 2～6 アルケニルスルホニル基；

プロパルギルスルホニル基などの C 2～6 アルキニルスルホニル基；

フェニルスルホニル基などの C 6～10 アリールスルホニル基；

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

ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基などの C 7～11 アラルキルスルホニル基；

【0030】

20

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

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

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

アジリジニル基、オキシラニル基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基などの飽和ヘテロ環基； 30

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

トリフェニルシリル基；

また、これらの「置換基」はさらに別の「置換基」を有するものであってもよい。

【0031】

〔C y〕

式 (I) 中、C y は、C 6～10 アリール基、またはヘテロアリール基を示す。

【0032】

「C 6～10 アリール基」は、単環、または環同士が結合した多環のいずれであってもよい。多環アリール基は、少なくとも一つの環が芳香環であれば、残りの環が飽和脂環、不飽和脂環または芳香環のいずれであってもよい。C 6～10 アリール基としては、フェニル基、ナフチル基、アズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを例示することができる。 40

【0033】

「ヘテロアリール基」は、環を構成する原子として炭素原子以外に窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～4個の複素原子を含む5～10員のアリール基である。ヘテロアリール基は、単環、または環同士が縮合した多環のいずれであってもよい。

【0034】

ヘテロアリール基としては、前記の「置換基」で例示した5員環のヘテロアリール基、6員環のヘテロアリール基、縮合環のヘテロアリール基などを挙げるることができる。 50

これらのうち、C_yは、フェニル基、ナフチル基、ピリジル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、キノキサリニル基であることが好ましく、フェニル基であることがより好ましい。

【0035】

[X]

式(I)中、Xは、C_y上の置換基である。Xは、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC₃～8シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC₂～6アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC₂～6アルキニル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルコキシ基、アミノ基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルキルアミノ基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～7アシル基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルコキシカルボニル基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルキルチオ基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルキルスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC₁～6アルコキシスルホニル基、無置換のもしくは置換基を有するC₆～10アリール基、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、無置換のもしくは置換基を有するヒドロキシイミノC₁～6アルキル基、ニトロ基、シアノ基、またはハロゲン原子を示す。

nは、C_y上のXの個数を示しかつ0～5のいずれかの整数である。nが2以上のときXは互いに同一でも異なってもよい。また、nが2以上のときXは相互に繋がってXが結合する炭素原子または窒素原子とともに環を形成してもよい。

【0036】

Xにおける「C₁～6アルキル基」は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。アルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、i-プロピル基、i-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、i-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、2,2-ジメチルプロピル基、i-ヘキシル基などを例示することができる。

【0037】

「置換基を有するC₁～6アルキル基」としては、

シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、2-シクロオクチルエチル基などのC₃～8シクロアルキルC₁～6アルキル基；

フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、2,2,2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、3,3,3-トリフルオロプロピル基、2,2,2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル基、パーフロロヘキシル基、パークロロヘキシル基、2,4,6-トリクロロヘキシル基などのC₁～6ハロアルキル基；

【0038】

ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基などのヒドロキシC₁～6アルキル基；
メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メトキシ-n-プロピル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、n-プロポキシメチル基、i-プロポキシエチル基、s-ブトキシメチル基、t-ブトキシエチル基などのC₁～6アルコキシC₁～6アルキル基；

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

ピリジン-2-イルオキシメチル基などのヘテロアリールオキシC₁～6アルキル基；
ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基などのC₁～7アシル基；

ホルミルオキシメチル基、アセトキシメチル基、2-アセトキシエチル基、プロピオニ

10

20

30

40

50

ルオキシメチル基、プロピオニルオキシエチル基などのC 1～7アシルオキシC 1～6アルキル基；

カルボキシルメチル基、カルボキシルエチル基などのカルボキシル基C 1～6アルキル基；

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

ホルムアミドメチル基、アセトアミドメチル基、2-アセトアミドエチル基、プロピオニルアミノメチル基、プロピオニルアミノエチル基などのC 1～7アシルアミノC 1～6アルキル基；

メチルアミノカルボニルメチル基、エチルアミノカルボニルメチル基、i-プロピルアミノカルボニルメチル基、t-ブチルアミノカルボニルメチル基、s-ブチルアミノカルボニルメチル基、n-ペンチルアミノカルボニルメチル基などのC 1～6アルキルアミノカルボニルC 1～6アルキル基；

メトキシカルボニルアミノメチル基、エトキシカルボニルアミノメチル基、i-プロポキシカルボニルアミノメチル基、t-ブトキシカルボニルアミノメチル基、s-ブチルオキシカルボニルアミノメチル基、n-ペンチルオキシカルボニルアミノメチル基などのC 1～6アルコキシカルボニルアミノC 1～6アルキル基；

ベンジル基、フェネチル基などのC 7～11アラルキル基；

ベンゾイルアミノメチル基などのC 6～10アリールカルボニルアミノC 1～6アルキル基；
などを例示することができる。

【0039】

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

【0040】

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

【0041】

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

【0042】

Xにおける「C 2～6アルキニル基」としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などを例示することができる。

【0043】

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

【0044】

Xにおける「C 1～6アルコキシ基」としては、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポ

10

20

30

40

50

キシ基、*n*-ブトキシ基、*n*-ペンチルオキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、*i*-プロポキシ基、*i*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、*i*-ヘキシルオキシ基などを例示することができる。

【0045】

「置換基を有するC1～6アルコキシ基」としては、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、1-フルオロエトキシ基、1, 1-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基などのC1～6ハロアルコキシ基などを例示することができる。

【0046】

Xにおける「C1～6アルキルアミノ基」としては、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などを例示することができる。

【0047】

Xにおける「C1～7アシル基」としては、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基などを例示することができる。

【0048】

「置換基を有するC1～7アシル基」としては、クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのハロゲン置換C1～7アシル基などを例示することができる。

【0049】

Xにおける「C1～6アルコキシカルボニル基」としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、*i*-プロポキシカルボニル基などを例示することができる。

【0050】

「置換基を有するC1～6アルコキシカルボニル基」としては、シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、2-メチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2, 3-ジメチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-クロロシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-シクロプロピルエトキシカルボニル基などのC3～8シクロアルキルC1～6アルコキシカルボニル基；

【0051】

フルオロメトキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、ブロモメトキシカルボニル基、ジフルオロメトキシカルボニル基、ジクロロメトキシカルボニル基、ジブロモメトキシカルボニル基、トリフルオロメトキシカルボニル基、トリクロロメトキシカルボニル基、トリブロモメトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル基、ペンタフルオロエトキシカルボニル基、4-フルオロブトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエトキシカルボニル基、パーフロロヘキシルオキシカルボニル基などのC1～6ハロアルコキシカルボニル基；などを例示することができる。

【0052】

Xにおける「C1～6アルキルチオ基」は、メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*n*-ペンチルチオ基、*n*-ヘキシルチオ基、*i*-プロピルチオ基などを例示することができる。

「置換基を有するC1～6アルキルチオ基」としては、トリフルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基などのC1～6ハロアルキルチオ基などを例示することができる。

【0053】

Xにおける「C1～6アルキルスルホニル基」としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*t*-ブチルスルホニル基などを例示することができる。

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

【0054】

Xにおける「C 1～6アルコキシスルホニル基」としては、メトキシスルホニル基、エトキシスルホニル基、t-ブトキシスルホニル基などを例示することができる。

【0055】

Xにおける「C 6～10アリール基」および「ヘテロアリール基」としては、前記Cyにおいて例示したそれらと同じものを挙げるができる。

【0056】

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

フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子；

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

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

シアノ基；

などを例示することができる。

【0057】

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

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

【0058】

Xにおける「ハロゲン原子」としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などを例示することができる。

【0059】

Xが相互に繋がってそれらが結合する炭素原子または窒素原子とともに形成する環としては、シクロペンテン環、シクロヘキセン環、3, 4-ジヒドロ-2H-ピラン環、3, 4-ジヒドロ-2H-チオピラン環、3, 4-ジヒドロ-2H-チオピラン 1, 1-ジオキシド環などを例示することができる。

【0060】

[R^{1a}]

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

【0061】

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

10

20

30

40

50

R^{1a} としては、C 1～6 アルキル基が好ましい。

【0062】

[R^{1b}]

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

【0063】

R^{1b} における「無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基」、「無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基」、および「無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルキニル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げることができる。

10

【0064】

R^{1a} と R^{1b} が相互に繋がってそれらが結合する炭素原子とともに形成する「環」としては、シクロプロパン環、シクロブタン環、シクロペンタン環、シクロヘキサン環、シクロヘプタン環などを例示することができる。

R^{1a} と R^{1b} が一緒になって、それらが結合する炭素原子とともに形成する「置換基を有するエキソメチレン基」としては、エチリデン基、イソプロピリデン基などのC 1～6 アルキル置換エキソメチレンを例示することができる。

【0065】

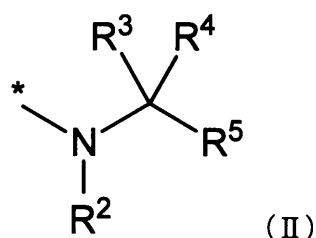
20

[Q]

式 (I) 中、Qは、式 (II) 、または式 (III) で表される基を示す。

【0066】

【化8】



30

【0067】

式 (II) 中、*は結合位置を示す。

【0068】

[R^2]

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

40

【0069】

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

【0070】

[R^3 、 R^4]

式 (II) 中、 R^3 および R^4 は、それぞれ独立に、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6 アルケニル基、無置換のもし

50

くは置換基を有するC 2～6アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基、またはシアノ基を示す。ここで、R³とR⁴は相互に繋がってそれらが結合する炭素原子とともに環を形成してもよい。

【0071】

R³およびR⁴における「無置換のもしくは置換基を有するC 1～6アルキル基」、「無置換のもしくは置換基を有するC 2～6アルケニル基」、および「無置換のもしくは置換基を有するC 2～6アルキニル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げることができる。

R³およびR⁴における「無置換のもしくは置換基を有するC 6～10アリール基」および「無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基」としては、前記Cyにおいて例示したそれらと同じものを挙げることができる。

R³およびR⁴としては、C 1～6アルキル基が好ましい。

【0072】

R³とR⁴が相互に繋がってそれらが結合する炭素原子とともに形成する「環」としては、シクロプロパン環、シクロブタン環、シクロペンタン環、シクロヘキサン環、オキシラン環などを例示することができる。

【0073】

[R⁵]

R⁵は、無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基を示す。

【0074】

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

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

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

ピロリニル基、イミダゾリニル基、ピラゾリニル基、オキサゾリニル基、チアゾリニル基などの部分不飽和5員ヘテロ環；などを例示することができる。

R⁵における「ヘテロアリール基」としては、ピリジル基が好ましい。

【0075】

R⁵における、「置換基を有するヘテロアリール基」上の置換基としては、以下の置換基を例示することができる。

フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子；

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

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

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

エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-

10

20

30

40

50

2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などのC 2～6アルキニル基；

【0076】

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

フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリール基；

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

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

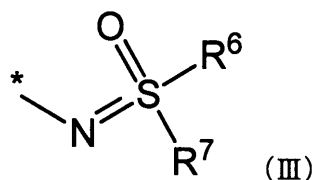
シアノ基；ニトロ基；

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

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

【0077】

【化9】



【0078】

式(III)中、*は結合位置を示す。

【0079】

[R⁶、R⁷]

式(III)中、R⁶およびR⁷は、それぞれ独立に、無置換のもしくは置換基を有するC 1～6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2～6アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 6～10アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基を示す。ここで、R⁶とR⁷は相互に繋がってそれらが結合する硫黄原子とともに環を形成してもよい。

【0080】

R⁶およびR⁷における「無置換のもしくは置換基を有するC 1～6アルキル基」、「C 無置換のもしくは置換基を有する3～8シクロアルキル基」、「無置換のもしくは置換基を有するC 2～6アルケニル基」、および「無置換のもしくは置換基を有するC 2～6アルキニル基」としては、前記Xにおいて例示したそれらと同じものを挙げる事ができる。

R⁶およびR⁷における「無置換のもしくは置換基を有するC 6～10アリール基」および「無置換のもしくは置換基を有するヘテロアリール基」としては、前記Cyにおいて例示したそれらと同じものを挙げる事ができる。

【0081】

R⁶およびR⁷における「置換基を有するC 6～10アリール基」および「置換基を有するヘテロアリール基」上の置換基としては、

フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子；

メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基

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

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

シアノ基；

などを例示することができる。

【0082】

R⁶とR⁷が相互に繋がってそれらが結合する硫黄原子とともに形成する「環」としては、テトラヒドロチオフェン環、テトラヒドロチオピラン環、オキサチアン環などを例示することができる。

10

【0083】

[Z]

式(I)中、Zは、酸素原子または硫黄原子を示す。好ましくは、酸素原子である。

【0084】

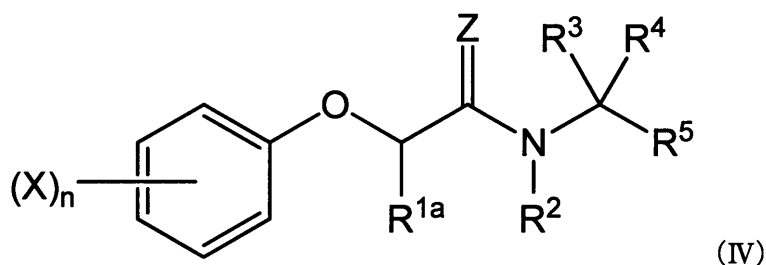
[式(IV)で表されるアリールオキシ酢酸アミド化合物]

本発明に係るアリールオキシ酢酸アミド化合物のうち、式(I)中のC_yがフェニル基でありR^{1b}が水素原子であり且つQが式(II)で表される基である化合物、すなわち、式(IV)で表されるアリールオキシ酢酸アミド化合物が好ましい。

【0085】

【化10】

20



30

式(IV)中、R^{1a}、R²～R⁵、X、n、およびZは、式(I)および式(II)におけるものと同じ意味を示す。

【0086】

[アリールオキシ酢酸アミド化合物の塩]

本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物の塩は、農園芸学的に許容される塩であれば、特に制限されない。例えば、塩酸、硫酸などの無機酸の塩；酢酸、乳酸などの有機酸の塩；リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属の塩；カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属の塩；鉄、銅などの遷移金属の塩；アンモニア、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ヒドラジンなどの有機塩基の塩などが挙げられる。アリールオキシ酢酸アミド化合物の塩は、公知の手法によって得ることができる。

40

【0087】

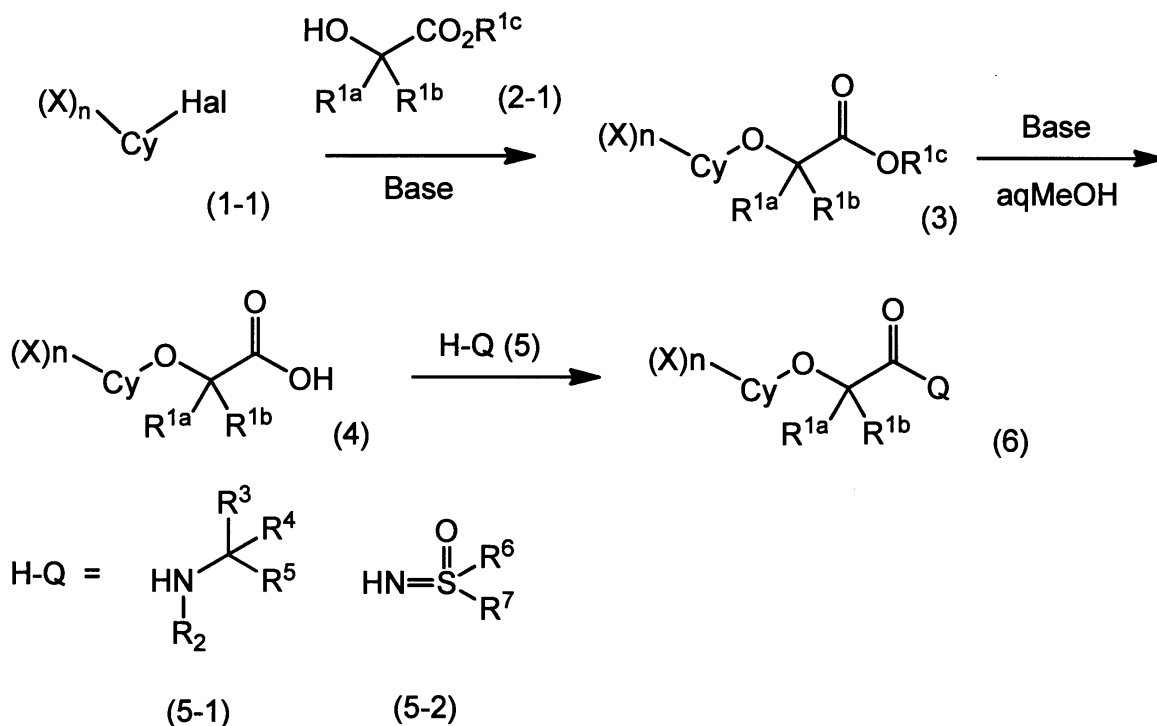
[製造方法]

次に、本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物の製造方法について説明する。

1) 製造方法の一つとしては、以下の反応スキームを例示することができる。

【0088】

【化 1 1】



10

20

【0089】

a) 式(1-1)で表されるハロアリール化合物(以下、「化合物(1-1)」ということがある。)に、塩基存在下、式(2-1)で表されるエステル化合物(以下、「化合物(2-1)」ということがある。)を反応させ、式(3)で表されるアリールオキシ酢酸エステル化合物(以下、「化合物(3)」ということがある。)を得る。次いで、これを加水分解させて、式(4)で表されるアリールオキシ酢酸化合物(以下、「化合物(4)」ということがある。)を製造する。

なお、式(1-1)、式(2-1)、式(3)および式(4)中、X、n、R^{1a}、R^{1b}およびCyは前記と同じ意味である。式(1-1)中、Halはハロゲン原子を表す。式(2-1)中、R^{1c}はC1~6アルキル基を表す。

30

【0090】

化合物(2-1)の使用量は、化合物(1-1)1モルに対して、通常1~2モル、好ましくは1.0~1.2モルである。

この反応は塩基の不存在下で行うこともできるが、塩基の存在下に行うことが好ましい。塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン、水酸化カリウムなどを挙げることができる。塩基の使用量は、化合物(1-1)1モルに対して、通常1~2モルである。

【0091】

この反応は溶媒中で行うことができる。溶媒は、反応に不活性なものであれば特に制限されない。例えば、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフランなどのエーテル系溶媒；トルエン、ベンゼン、キシレンなどの芳香族炭化水素系溶媒；n-ペンタン、n-ヘキサン、n-ヘプタンなどの脂肪族炭化水素系溶媒；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセタミド、N-メチルピロリドンなどのアミド系溶媒；アセトニトリル、ベンゾニトリルなどのニトリル系溶媒；およびこれらの二種以上からなる混合溶媒；などを挙げることができる。溶媒の使用量は、特に限定されないが、化合物(1-1)1gに対して、通常、1~100mlである。

40

【0092】

反応温度は、-20℃から用いる溶媒の沸点までの温度範囲である。反応時間は、反応

50

規模にもよるが、通常、数分間～数十時間である。

【0093】

続く、加水分解は常法に従って行うことができるが、塩基存在下で行うことが好ましい。用いる塩基としては、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、炭酸カリウムなどの金属水酸化物などを挙げることができる。塩基の使用量は、化合物(3) 1モルに対して、通常1～20モルである。

【0094】

この反応は、溶媒中で行われる。用いる溶媒は、水と混合できる溶媒であって、反応に不活性なものであれば特に制限されない。化合物(2)の製造に用いるものとして例示した溶媒と同様のものを挙げることができる。溶媒の使用量は、特に限定されないが、化合物(3) 1gに対して、通常、1～100mlである。

10

【0095】

反応温度は、室温から用いる溶媒の沸点までの温度範囲である。反応時間は、反応規模にもよるが、通常、数分間から数十時間である。

【0096】

b) 化合物(4)に、式(5)で表される化合物(以下、「化合物(5)」ということがある。)を反応させ、式(6)で表されるアリールオキシ酢酸アミド化合物(以下、「化合物(6)」ということがある。)を製造する。ここで、化合物(5)は、式(5-1)で表されるアミン化合物(以下、「化合物(5-1)」ということがある。)、または式(5-2)で表されるスルホキシイミン化合物(以下、「化合物(5-2)」ということがある。)のいずれか一つである。

20

なお、式(5)中、Qは前記と同じ意味である。式(6)中、X、n、R^{1a}、R^{1b}およびCyは前記と同じ意味である。式(5-1)、および式(5-2)中、R²～R⁸は前記と同じ意味である。

【0097】

化合物(5)の使用量は、化合物(4) 1モルに対して、通常1～2モル、好ましくは1.0～1.2モルである。

この反応は、溶媒中で行われる。用いる溶媒は、反応に不活性なものであれば特に制限されない。化合物(2)の製造に用いるものとして例示した溶媒と同様のものを挙げることができる。溶媒の使用量は、特に限定されないが、化合物(4) 1gに対して、通常、1～100mlである。

30

なお、化合物(5-2)を反応させる場合は、塩基の存在下に行うことが好ましい。塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン、水酸化カリウムなどを挙げることができる。塩基の使用量は、化合物(4) 1モルに対して、通常1～2モルである。

反応温度は、室温から用いる溶媒の沸点までの温度範囲である。反応時間は、反応規模にもよるが、通常、数分間～数十時間である。

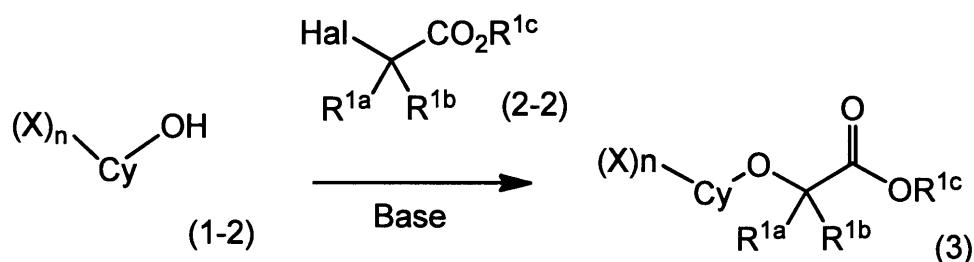
【0098】

2) 化合物(3)の製造方法の別の例としては、以下の反応スキームを示すことができる。

【0099】

40

【化12】



50

【0100】

a) 式(1-2)で表されるヒドロキシアリール化合物(以下、「化合物(1-2)」ということがある。)に、塩基存在下、式(2-2)で表されるエステル化合物(以下、「化合物(2-2)」ということがある。)を反応させ、化合物(3)を得る。
なお、式(1-2)、式(2-2)中、X、n、R^{1a}、R^{1b}およびC_yは前記と同じ意味である。式(2-2)中、Halはハロゲン原子を表し、R^{1c}はC1~6アルキル基を表す。

【0101】

化合物(2-2)の使用量は、化合物(1-2)1モルに対して、通常1~2モル、好ましくは1.0~1.2モルである。

この反応は塩基の不存在下で行うこともできるが、塩基の存在下に行うことが好ましい。塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン、水酸化カリウムなどを挙げることができる。塩基の使用量は、化合物(1-2)1モルに対して、通常1~2モルである。

【0102】

この反応は溶媒中で行うことができる。溶媒は、反応に不活性なものであれば特に制限されない。例えば、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフランなどのエーテル系溶媒；トルエン、ベンゼン、キシレンなどの芳香族炭化水素系溶媒；n-ペンタン、n-ヘキサン、n-ヘプタンなどの脂肪族炭化水素系溶媒；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセタミド、N-メチルピロリドンなどのアミド系溶媒；アセトニトリル、ベンゾニトリルなどのニトリル系溶媒；およびこれらの二種以上からなる混合溶媒；などを挙げることができる。溶媒の使用量は、特に限定されないが、化合物(1-2)1gに対して、通常、1~100mlである。

【0103】

反応温度は、-20℃から用いる溶媒の沸点までの温度範囲である。反応時間は、反応規模にもよるが、通常、数分間~数十時間である。

【0104】

上記いずれの反応においても、反応終了後は、通常の後処理操作、および所望により蒸留、再結晶、カラムクロマトグラフィーなどの公知慣用の精製手段により精製して、目的物を単離することができる。

目的物の構造は、IRスペクトル、NMRスペクトル、マススペクトル、元素分析などの公知の分析手段により、同定、確認することができる。

【0105】

〔有害生物防除剤〕

本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩(以下「本発明化合物」ということがある)は、各種の害虫(ダニ類を含む)の防除に有効である。特に、殺ダニ剤として有効である。

【0106】

〔殺ダニ剤〕

次に、本発明化合物を有効成分とする殺ダニ剤について説明する。本発明化合物は、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、および殺卵などの作用を有することから、農作物に付くダニ類などの有害生物の防除に使用できる。特に農作物、果樹、花卉、樹木に付くダニ類に対する防除効果に優れる。

【0107】

防除の対象となるダニ類(Acari)の例を以下に示す。

(1) 無気門目(Astigmata)のコナダニ類(Acaridida)：

(a) コナダニ科(Acaridae)のダニ、例えばリゾギルホス属種(Rhizoglyphus spp.)の、ネダニ(Rhizoglyphus echinopus)、ロビンネダニ(Rhizoglyphus robini)；ケナガコナダニ属種(Tyrophagus spp.)の、ケナガコナダニ(Tyrophagus putrescentiae)、オンシツケナガコナダニ(Tyrophagus neiswanderi)、オオケナガコナダニ(Tyrophagus perniciosus)

10

20

30

40

50

s)、ホウレンソウケナガコナダニ(*Tyrophagus similis*) ; その他、アシブトコナダニ (*Acarus siro*)、ムギコナダニ (*Aleuroglyphus ovatus*)、ニセケナガコナダニ (*Mycetoglyphus fungivorus*) ;

【0108】

(2) 前気門目 (Prostigmata) のケダニ類 (Actinedida)

(a) ハダニ科 (Tetranychidae) のダニ、例えばブリオビア属種 (*Bryobia* spp.) の、クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*)、ニセクローバーハダニ (*Bryobia rubrioculus*) ; 例えばエオテトラニクス属種 (*Eotetranychus* spp.) の、アンズハダニ (*Eotetranychus boreus*)、ミチノクハダニ (*Eotetranychus geniculatus*)、クリハダニ (*Eotetranychus pruni*)、クルミハダニ (*Eotetranychus uncatus*)、シイノキハダニ (*Eotetranychus shii*)、スギナミハダニ (*Eotetranychus suginamensis*)、エノキハダニ (*Eotetranychus celtis*)、スミスハダニ (*Eotetranychus smithi*)、コウノシロハダニ (*Eotetranychus asiaticus*)、ミヤケハダニ (*Eotetranychus kankitus*) ; 例えばオリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.) の、マンゴーハダニ (*Oligonychus mangiferus*)、アボガドハダニ (*Oligonychus perseae*)、エゾスギハダニ (*Oligonychus pustulosus*)、カラマツハダニ (*Oligonychus karamatus*)、スギノハダニ (*Oligonychus hondoensis*)、チビコブハダニ (*Oligonychus ilicis*)、トドマツハダニ (*Oligonychus ununguis*)、イネハダニ (*Oligonychus shinkajii*)、サトウキビハダニ (*Oligonychus orthius*) ; 例えばパロニクス属種 (*Panonychus* spp.) の、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、クワオオハダニ (*Panonychus mori*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*) ; 例えばテトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.) の、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*)、ミズナラハダニ (*Tetranychus quercivorus*)、アシノワハダニ (*Tetranychus ludeni*)、サガミハダニ (*Tetranychus phaselus*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) ; 例えばアポニクス属 (*Aponychus* spp.) の、イトマキハダニ (*Aponychus corpuzae*)、タイリクハダニ (*Aponychus firmianae*) ; 例えばミドリハダニ属 (*Sasanychus* spp.) の、ミドリハダニ (*Sasanychus akitanus*)、ヒメミドリハダニ (*Sasanychus pusillus*) ; 例えばシゾテトラニクス属 (*Shizotetranychus* spp.) の、タケスゴモリハダニ (*Shizotetranychus celarius*)、ススキスゴモリハダニ (*Shizotetranychus miscanthi*)、ケナガスゴモリハダニ (*Shizotetranychus longus*)、ヤナギハダニ (*Shizotetranychus schizopus*)、ヒメササハダニ (*Shizotetranychus recki*) ; その他、ナミケナガハダニ (*Tuckerella pavoniformis*)、カタバミハダニ (*Tetranychina harti*)、ケウスハダニ (*Yezonychus sapporensis*) ;

【0109】

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

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

arpi)、チャノサビダニ (Calacarus carinatus)、チャノナガサビダニ (Acaphylla thea vagrans)、キンモクサビダニ (Paraphytoptus kikus)、ナシサビダニ (Epitrimerus pyri) ;

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

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

【0110】

本発明化合物を有効成分とする殺ダニ剤は、動物に寄生するダニ類に対する防除効果にも優れている (外部寄生虫防除)。動物に寄生するダニ類は、宿主となる動物 (宿主動物) の背、脇下、下腹部、内股部などに寄生して動物から血液やフケなどの栄養源を得て生息するもの、および宿主動物の背、臀部などに飛来して動物から血液やフケなどの栄養源を得て生息するものを包含する。対象となる宿主動物としては、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ハムスター、モルモット、リス、ウサギ、フェレット ; 愛玩鳥 (例えば、ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリア) ; ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ ; 家禽 (例えば、アヒル、ニワトリ、ウズラ、ガチョウ) ; ミツバチ (例えば、セイヨウミツバチ、ニホンミツバチ) ; などが挙げられる。

【0111】

防除の対象となるダニ類 (Acari) の例を以下に示す。

(1) 中気門目 (Mesostigmata) のダニ類 (mite)

(a)ワクモ科 (Dermanyssidae) のダニ、例えばワクモ (Dermanyssus gallinae) ;

(b)オオサシダニ科 (Macronyssidae) のダニ、例えばイエダニ属種 (Ornithonyssus spp.) の、トリサシダニ (Ornithonyssus sylviarum)、ネッタイトリサシダニ (Ornithonyssus bursa)、イエダニ (Ornithonyssus bacoti) ;

(c)トゲダニ科 (Laelapidae) のダニ、例えばトゲダニ属種 (Laelaps spp.) の、ネズミトゲダニ (Laelaps echidninus)、ホクマントゲダニ (Laelaps jettmari) ; ミツバチトゲダニ (Tropilaelaps clareae)

(d)ヘギダニ科 (Varroidae) のダニ、例えばヘギダニ属種 (Varroa spp.) の、ミツバチヘギイタダニ (Varroa destructor)、バロアジャコブソニ (Varroa jacobsoni)、バロアアンデルウッディ (Varroa underwoodi) ;

【0112】

(2) 後気門目 (Metastigmata) のマダニ類 (tick)

(a)ヒメダニ科 (Argasidae) のダニ、例えばナガヒメダニ属種 (Argas spp.) の、ナガヒメダニ (Argas persicus)、アルガス・リフレクサス (Argas reflexus) ; 例えばヒメダニ属種 (Ornithodoros spp.) の、オルニトドラス・モウバータ (Ornithodoros moubata) ;

(b)マダニ科 (Ixodidae) のダニ、例えばチマダニ属種 (Haemaphysalis spp.) の、ヘマフィサリス・コンシナ (Haemaphysalis concinna)、ヘマフィサリス・パンクタータ (Haemaphysalis punctata)、ヘマフィサリス・シンアバリナ (Haemaphysalis cinnabarina)、ヘマフィサリス・オトフィラ (Haemaphysalis otophila)、ヘマフィサリス・レアチ (Haemaphysalis leachi)、フタトゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis)、マゲシマチマダニ (Haemaphysalis mageshimaensis)、イエンチマダニ (Haemaphysalis yeni)、ツリガネチマダニ (Haemaphysalis campanulata)、クロウサギチマダニ (Haemaphysalis pentagonalis)、キチマダニ (Haemaphysalis flava)、オオトゲチマダニ (Haemaphysalis megaspinosa)、ヤマトチマダニ (Haemaphysalis japonica)、ダグラスチマダニ (Haemaphysalis douglasi) ; 例えばキララマダニ属種 (Amblyomma spp.) の、アンブリオマ・アメリカナム (Amblyomma americanum)、アンブリオマ・バリエガタム (Amblyomma variegatum)、アンブリオマ・マキュラタム (Amblyomma maculatum)、アンブリオマ・ヘ

10

20

30

40

50

ブラエウム (*Amblyomma hebraeum*)、アンブリオマ・カジェネンス (*Amblyomma cajennense*)、タカサゴキラマダニ (*Amblyomma testudinarium*)；例えばマダニ属種 (*Ixodes* spp.) の、マダニ (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ヘキサゴナス (*Ixodes hexagonus*)、イクソデス・キャニスガ (*Ixodes canisuga*)、イクソデス・ピロサス (*Ixodes pilosus*)、イクソデス・ルビキュンダス (*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカプラリス (*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス (*Ixodes holocyclus*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツェマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)；例えばウシマダニ亜属種 (*Boophilus* spp.) の、オウシマダニ (*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*)、リピセファラス (ブーフィラス)・デコロラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus*)、リピセファラス (ブーフィラス)・アニ
 ユラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) annulatus*)、リピセファラス (ブーフィラス)
 ・カルセラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) calceratus*)；例えばコイタマダニ属種 (*Rhipicephalus* spp.) の、リピセファラス・エベルトシ (*Rhipicephalus evertsi*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファラス・ブルサ (*Rhipicephalus bursa*)、リピセファラス・アッペンディキュラタス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファラス・キャペンシス (*Rhipicephalus capensis*)、リピセファラス・ツラニカス (*Rhipicephalus turanicus*)、リピセファラス・ザンベジエンシス (*Rhipicephalus zambeziensis*)；例えばカクマダニ属種 (*Dermacentor* spp.) の、デルマセントール・マルギナタス (*Dermacentor marginatus*)、デルマセントール・レティキュラタス (*Dermacentor reticulatus*)、デルマセントール・ピクタス (*Dermacentor pictus*)、
 デルマセントール・アルビピクタス (*Dermacentor albipictus*)、デルマセントール・アンデルソニ (*Dermacentor andersoni*)、デルマセントール・バリアビリス (*Dermacentor variabilis*)；

10

20

【0113】

(3) 無気門目 (Astigmata) のコナダニ類 (Acaridida)

(a) キュウセンヒゼンダニ科 (Psoroptidae) のダニ、例えばキュウセンヒゼンダニ属種 (*Psoroptes* spp.) の、ヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*)、ウサギキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウマキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes equi*)；例えばショクヒゼンダニ属種 (*Chorioptes* spp.) の、ショクヒゼンダニ (*Chorioptes bovis*)；オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.) の、ミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)；

30

(b) ヒゼンダニ科 (Sarcoptidae) のダニ、例えばヒゼンダニ属種 (*Sarcoptes* spp.) の、センコウヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、イヌセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes canis*)、ウシセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes bovis*)、ヒツジセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes ovis*)、サルコプテス・ルピカプラエ (*Sarcoptes rupicaprae*)、ウマセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes equi*)、ブタセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes suis*)；例えば、ノトエドス属種 (*Notoedres* spp.)、ネコショウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*)；

(c) トリヒゼンダニ科 (Knemidokoptidae) のダニ、例えばトリアシヒゼンダニ属種 (*Knemidokoptes* spp.) のトリアシヒゼンダニ (*Knemidokoptes mutans*)；

【0114】

40

(4) 前気門目 (Prostigmata) のケダニ類 (Actiniedida)

(a) ニキビダニ科 (Demodixidae) のダニ、例えばニキビダニ属種 (*Demodex* spp.) の、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、ウシニキビダニ (*Demodex bovis*)、ヒツジニキビダニ (*Demodex ovis*)、ヤギニキビダニ (*Demodex caprae*)、ウマニキビダニ (*Demodex equi*)、デモデックス・カバリ (*Demodex caballi*)、ブタニキビダニ (*Demodex suis*)、ネコニキビダニ (*Demodex cati*)；

(b) ツツガムシ科 (Trombiculidae) のダニ、例えばツツガムシ属種 (*Trombicula* spp.) の、トロンビキュラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、トロンビキュラ・アカムシ (*Trombicula akamushi*)；

(c) ホコリダニ科 (Tarsonemidae) のダニ、例えばアカラピス属種 (*Acarapis* spp.) の、

50

アカリンダニ (*Acarapis woodi*) ;

【0115】

〔殺虫剤〕

さらに、本発明化合物は、農作物に付くダニ類以外の害虫、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫などの有害生物の防除に使用できる。

防除の対象となる害虫の例を以下に示す。

(1) 鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ypsilon*)、タマナギンウワバ (*Autographa nigrisigna*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、モモシンクイガ (*Carposina sasakii*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholitha molesta*)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、マイマイガ (*Lymantria dispar*)、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*)、ニカメイガ (*C. hilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ヨーロピアンコーンボラー (*Ostrinia nubilalis*)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、スジマダラメイガ (*Cadra cautella*)、ヘリオティス属種 (*Heliothis* spp.)、ヘリオベルパ属種 (*Helioverpa*)、アグロティス属種 (*Agrotis* spp.)、イガ (*Tinea translucens*)、コドリリング (*Cydia pomonella*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*) など；

(2) 半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、アオクサカメムシ (*A. crosternum hilare*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、ナシキジラミ (*Psylla pyricola*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) など；

(3) 甲虫目害虫、例えば、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、ウリハムシ (*Aulacophora indica*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、コクゾウムシ (*Sitophilus oryzae*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、ジアプロティカ属種 (*Diabrotica* spp.)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、マツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*)、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、アグリオティス属 (*Agriotes* spp.)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctomaculata*)、コクヌスト (*Tenebroides mauritanicus*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*) など、；

(4) 双翅目害虫、例えば、ウリミバエ (*Bactrocera cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Bactrocera dorsalis*)、タネバエ (*Delia platura*)、イネハモグリバエ (*Hydrellia griseola*)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*) など；

(5) アザミウマ目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*) など；

(6) 膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、キイロスズメバチ (*Vespa simillima*)、カブラハバチ (*Athalia rosae*) など；

(7) 直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*) など；

(8) ゴキブリ目 (*Blattodea*) 害虫、例えば、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、コワモンゴキブリ (*Periplaneta australasiae*) など；

(9) シロアリ目害虫、例えば、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロ

10

20

30

40

50

アリ (*Reticulitermes speratus*) など、

(10) 植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ネグサレセンチュウ類、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) など；

【0116】

本発明化合物を有効成分とする殺虫剤は、動物に寄生する害虫類に対する防除効果にも優れている (外部寄生虫防除)。

防除の対象となる害虫の例を以下に示す。

(1) シラミ目 (Phthiraptera)

ケモノジラミ科 (*Haematopinidae*) のシラミ、ケモノホソジラミ科 (*Linognathidae*) のシラミ、タンカクハジラミ科 (*Menoponidae*) のハジラミ、チョウカクハジラミ科 (*Philopteridae*) のハジラミ、ケモノハジラミ科 (*Trichodectidae*) のハジラミ；

(2) ノミ目 (Siphonaptera)

ヒトノミ科 (*Pulicidae*) のノミ、例えば、イヌノミ属種 (*Ctenocephalides* spp.) の、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)；

スナノミ科 (*Tungidae*) のノミ、ナガノミ科 (*Ceratophyllidae*) のノミ、ホソノミ科 (*Leptopsyllidae*) のノミ；

(3) カメムシ目 (Hemiptera) の害虫

(4) ハエ目 (Diptera) の害虫

カ科 (*Culicidae*) のカ、ブユ科 (*Simuliidae*) のブユ、ヌカカ科 (*Ceratopogonidae*) のヌカカ、アブ科 (*Tabanidae*) のアブ、イエバエ科 (*Muscidae*) のハエ、ツエツエバエ科 (*Glossinidae*) のシェシェバエ、シラミバエ科 (*Hippoboscidae*) のハエ、クロバエ科 (*Calliphoridae*) のハエ、ヒツジバエ科 (*Oestridae*) のハエ；

【0117】

本発明化合物は、薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、特に安全性の高い化合物である。

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有するものである。

また、本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物のみを含有するものであってもよいが、固体担体、液体担体、ガス状担体などの担体を含有していてもよい。また、本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物を多孔セラミック板や不織布などの基材に含浸させたものであってもよい。さらに、必要に応じて界面活性剤、その他の補助剤を添加したものであってもよい。

【0118】

本発明の有害生物防除剤は、一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、フロアブル、マイクロカプセル、エアゾール、煙霧剤、加熱蒸散剤、燻煙剤、殺ダニ剤の場合はベイト剤などの形態に製剤化することができる。

【0119】

固体の剤型への製剤化において使用される添加剤および担体としては、大豆粉、小麦粉などの植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレーなどの鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝などの有機および無機化合物などを挙げることができる。

【0120】

液体の剤型への製剤化において使用される溶剤としては、ケロシン、キシレンおよび石油系の芳香族炭化水素、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、トリクロロエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水などなどを挙げることができる。

【0121】

噴射剤に製剤化する際に使用されるガス状担体としては、ブタンガス、LPG、ジメチルエーテル、炭酸ガスなどが挙げられる。

【0122】

毒餌の基材としては、穀物粉、植物油、糖、結晶セルロースなどの餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸などの酸化防止剤、デヒドロ酢酸などの保存料、トウガラシ末などの子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料などの害虫誘引性香料などが挙げられる。

【0123】

製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要に応じ界面活性剤を添加することができる。添加することができる界面活性剤は特に制限されない。例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリステチルフェニルエーテルなどの非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、高級アルコールの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレンー無水マレイン酸共重合体などを挙げることができる。

10

【0124】

製剤中における本発明化合物の含有量は、通常、製剤全体に対して、好ましくは0.01～90重量%、より好ましくは0.05～85重量%である。

20

【0125】

このようにして得られた水和剤、乳剤、フロアブル剤、水溶剤、顆粒水和剤は水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液にして、また粉剤・粒剤はそのまま、植物あるいは土壌に散布することができる。

また、防疫用殺ダニ剤として使用する場合には、油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌、防ダニシートなどの形態で供給された製剤をそのまま使用することができる。

【0126】

また、本発明の有害生物防除剤を、ウシ、ブタなどの家畜類、イヌ、ネコなどのペット類の動物に寄生するダニ類の防除用殺ダニ剤とする場合には、宿主動物1kgに対して、本発明化合物が、0.01～1000mgの割合となる量で使用するすることができる。

30

防除用殺ダニ剤は、公知の獣医学的手法で施用することができる。その方法として、例えば、全身の抑制(systemic control)を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射(筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など)などにより動物に投与方法などが挙げられ、非全身的抑制(non-systemic control)を目的とする場合は、油性または水性液剤を噴霧、注ぎかけ(pour-on)、滴下(spot-on)などにより投与方法、樹脂に殺ダニ剤を練り込み、該混練物を首輪、耳札などの適当な形状に成形し、それを動物に装着する方法などが挙げられる。

【0127】

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

40

本発明の有害生物防除剤と混合して使用できる殺菌剤、他の殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、植物生長調節剤の代表例を以下に示す。

【0128】

殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、駆虫剤：

(1)有機(チオ)ホスフェート系：アセフェート、アザメチホス、アジンホス・メチル、アジンホス・エチル、プロモホス・エチル、プロムフェンビンホス、BRP、クロルピリホス、クロルピリホス・メチル、クロルピリホス・エチル、クロルフェンビンホス、カズサホス、カルボフェノチオン、クロルエトキシホス、クロルメホス、クマホス、シアノフェンホス、シアノホス、CYAP、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエー

50

ト、ジスルホトン、ジメトン-S-メチル、ジメチルビンホス、ジメトン-S-メチルスルホ
 ホン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロフェンチオン、ジオキサベンゾホス、ジスルホ
 トン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、EPN、フェナミホス、フェニトロチオン
 、フェンチオン、フェンスルホチオン、フルピラゾホス、ホノホス、ホルモチオン、ホス
 メチラン、ヘプテノホス、イサゾホス、ヨードフェンホス、イソフェンホス、イソキサチ
 オン、イプロベンホス、マラチオン、メビンホス、メタミドホス、メチダチオン、モノク
 ロトホス、メカルバム、メタクリホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン・メチ
 ル、パラオクソン、パラチオン、パラチオン・メチル、フェントエート、ホサロン、ホス
 メット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス・メチル、ピリミホス・エチ
 ル、プロフェノホス、プロチオホス、ホスチアゼート、ホスホカルブ、プロパホス、プロ
 ペタムホス、プロトエート、ピリダフェンチオン、ピラクロホス、キナルホス、サリチオ
 ン、スルプロホス、スルホテップ、テトラクロルビンホス、テルブホス、トリアゾホス、
 トリクロルホン、テブピリムホス、テメホス、チオメトン、バミドチオン；

10

【0129】

(2) カルバメート系：アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカル
 ブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、フェノキシカルブ、フェノチオカル
 ブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ
 、トリアザメート、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、MIPC、MPMC、MTMC、ピリダフ
 ェンチオン、フラチオカルブ、XMC、アルドキシカルブ、アリキシカルブ、アミノカルブ
 、ブフェンカルブ、ブタカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、クロエトカ
 ルブ、ジメチラン、ホルメタネート、イソプロカルブ、メタム・ナトリウム、メトルカル
 ブ、プロメカルブ、チオフアノックス、トリメタカルブ、キシリルカルブ；

20

(3) ピレトロイド系：アレトリン、ピフェントリン、シフルトリン、ベータ・シフルト
 リン、シハロトリン、ラムダ・シハロトリン、シフェノトリン、シペルメトリン、アルフ
 ァ・シペルメトリン、ベータ・シペルメトリン、ゼータ・シペルメトリン、デルタメトリン
 、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレ
 ート、イミプロトリン、ペルメトリン、プラレトリン、ピレトリン、ピレトリンI、ピレト
 リンII、レスメトリン、シラフルオフエン、フルバリネート、テフルトリン、テトラメト
 リン、トラロメトリン、トランスフルトリン、プロフルトリン、ジメフルトリン、アクリ
 ナトリン、シクロプロトリン、ハルフェンプロックス、フルシトリネート、ビオアレスリ
 ン、ビオエタノメトリン、ビオペルメトリン、ビオレスメトリン、トランスペルメトリン
 、エンペントリン、フェンフルトリン、フェンピリトリン、フルプロシトリネート、フル
 フェンプロックス、フルメトリン、メトフルトリン、フェノトリン、プロトリフェンブ
 ト、ピレスメトリン、テラレトリン；

30

【0130】

(4) 成長調節物質：

(a) キチン合成阻害剤：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、
 フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン
 、トリフルムロン、ビストリフルロン、ノビフルムロン、ブプロフェジン、ヘキシチアゾ
 クス、エトキサゾール、クロフェンテジン、フルアズロン、ペンフルロン；

40

(b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド
 、クロマフェノジド、アザジラクチン；

(c) 幼若ホルモン様物質：ピリプロキシフェン、メトプレン、ジオフェノラン、エポフェ
 ノナン、ハイドロプレン、キノプレン、トリプレン；

(d) 脂質生合成阻害剤：スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、フ
 ロニカミド；

【0131】

(5) ニコチン受容体アゴニスト／アンタゴニスト化合物：アセタミプリド、クロチアニ
 ジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、チアメトキサ
 ム、ニチアジン、ニコチン、ベンスルタップ、カルタップ；フルピラジフロノ；

50

(6) GABAアンタゴニスト化合物：

(a) アセトプロール、エチプロール、フィプロニル、パニリプロール、ピラフルプロール、ピリプロール；

(b) 有機塩素系：カンフェクロル、クロルデン、エンドスルファン、HCH、 γ -HCH、ヘプタクロル、メトキシクロル；

(7) 大環状ラクトン殺虫剤：アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、ミルベメクチン、レピメクチン、スピノサド、イベルメクチン、セラメクチン、ドラメクチン、エピノメクチン、モキシデクチン；ミルベマイシン、ミルベマイシンオキシム；

(8) METI I化合物：フェナザキン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、フルフェネリム、ヒドラメチルノン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ジコホル；

(9) METI IIおよびIII化合物：アセキノシル、フルアクリピリム、ロテノン；

(10) 脱共役剤化合物：クロルフェナピル、ビナパクリル、ジノブトン、ジノカップ、DNOC；

【0132】

(11) 酸化的リン酸化阻害剤化合物：シヘキサチン、ジアフェンチウロン、フェンブタチン・オキシド、プロパルギット、アゾシクロチン；

(12) 脱皮かく乱化合物：シロマジン；

(13) 混合機能オキシダーゼ阻害剤化合物：ピペロニルブトキシド；

(14) ナトリウムチャンネル遮断剤化合物：インドキサカルブ、メタフルミゾン；

(15) 微生物農薬：BT剤、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤；バチルス属種、白きょう病菌、黒きょう病菌、ペキロマイセス属種、チューリンギエンシン、パーティシリウム属種；

(16) ラトロフィリン受容体作用薬：デブシペプチド、環状デブシペプチド、24員環状デブシペプチド、エモデブシド；

(17) オクトパミン性作用薬：アミトラズ；

(18) リアノジン誘導体作用薬：フルベンジアミド、クロラントラニリプロール、シアントラリニプロール；

(19) マグネシウム刺激性ATPアーゼの阻害薬：チオシクラム、チオスルタップ、ネライストキシン；

(20) 摂食阻害薬：ピメトロジン；

(21) ダニ成長阻害薬：クロフェンテジン、エトキサゾール；

(22) その他の化合物：ベンクロチアズ、ビフェナゼート、ピリダリル、硫黄、シエノピラフェン、シフルメトフェン、アミドフルメット、テトラジホン、クロルジメホルム、1,3-ジクロロプロペン、DCIP、フェニソブプロモレート、ベンゾメート、メタアルデヒド、スピネトラム、ピリフルキナゾン、ベンゾキシメート、プロモプロピレート、キノメチオネート、クロルベンジレート、クロルピクリン、クロチアゾベン、ジシクラニル、フェノキサクリム、フェントリファニル、フルベンジミン、フルフェンジン、ゴシップルア、ジャポニルア、メトキサジアゾン、石油、オレイン酸カリウム、スルフルラミド、テトラスル、トリアラセン；アフィドピロペン (afidopyropen)、ピフルブミド (pyflubumide)、フロメトキン、フルフィプロル (flufiprole)、フルエンスルフォン、メペルフルスリン、テトラメチルフルスリン、スルホキサフロール、イミシアホス、トラロピリル、ジフロビダジン、ジメフルスリン、メチルネオデカンアミド；

(23) 駆虫剤

(a) ベンズイミダゾール系：フェンベンダゾール、アルベンダゾール、トリクラベンダゾール、オキシベンダゾール；

(b) サリチルアニリド系：クロサンテル、オキシクロザニド；

(c) 置換フェノール系：ニトロキシニル；

(d) ピリミジン系：ピランテル；

(e) イミダゾチアゾール系：レバミソール；

10

20

30

40

50

(f)テトラヒドロピリミジン：プラジカンテル；

(g)その他の駆虫薬：シクロジエン、リアニア、クロルスロン、メトロニダゾール、デミジトラズ；

【0133】

殺菌剤：

(1)ベンゾイミダゾール系：ペノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファネート メチル；クロルフェナゾール；

(2)ジカルボキシイミド系：クロゾリネート、イプロジオン、プロシミドン、ビンクロゾリン；

(3)DMI-殺菌剤系：イマザリル、オキスポコナゾール、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール、トリホリン、ピリフェノックス、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、エタコナゾール、ファーコナゾールシス；ジクロブトラゾール、ジニコナゾール-M、ドデモルフ・アセテート、フルコナゾール、イマザリル・サルフェート、ナフチフェン、ユニコナゾールP、ビニコナゾール、ポリコナゾール；

10

20

【0134】

(4)フェニルアミド系：ベナラキシル、フララキシル、メタラキシル、メタラキシール-M、オキサジキシル、オフラセ；ベナラキシール-M、クロジラコン；

(5)アミン系：アルジモルフ、ドデモルフ、フェンブプロピモルフ、トリデモルフ、フェンブプロピジン、ピペラリン、スピロキサミン；

(6)ホスホロチオレート系：EDDP、イプロベンホス、ピラゾホス；

(7)ジチオラン系：イソプロチオラン；

(8)カルボキサミド：ベノダニル、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラン、フルトラニル、フラメトピル、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンチオピラド、チフルザミド；ピキサフェン、イソピラザム、ペンフルフェン、フルキサピロキサド、セダキサシ；

30

(9)ヒドロキシ-(2-アミノ)ピリミジン系：ブピリメート、ジメチリモル、エチリモル；

【0135】

(10)AP殺菌剤（アニリノピリミジン）系：シプロジニル、メパニピリム、ピリメタニル等；アンドプリム；

(11)N-フェニルカーバメート系：ジエトフェンカルブ；

(12)QoI-殺菌剤（Qo阻害剤）系：アゾキシストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、クレソキシム-メチル、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、メトミノストロビン、オリザストロビン、ファモキサドン、フルオキサストロビン、フェンアミドン、メトミノフェン；アメトクトラジン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、ピリベンカルブ；クメトキシストロビン、クモキシストロビン、エネストロブリン、フェノキシストロビン、トリクロピリカルブ；

40

(13)PP殺菌剤（フェニルピロール）系：フェンピコニル、フルジオキシソニル；

(14)キノリン系：キノキシフェン；

【0136】

(15)AH殺菌剤（芳香族炭化水素）系：ビフェニル、クロロネブ、ジクロラン、キントゼン、テクナゼン；

(16)MBI-R系：フサライド、ピロキロン、トリシクラゾール；

(17)MBI-D系：カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル；

(18)SBI剤：フェンヘキサミド、ピリブチカルブ、タービナフィン；

50

- (19) フェニルウレア：ペンシクロン；
 (20) QiI-殺菌剤 (Qi阻害剤)：シアゾファミド；アミスルブロム、フルメシクロックス；
 (21) ベンズアミド系：ゾキサミド；
 (22) エノピランウロン系：ブラストサイジン；
 (23) ヘキソピラノシル系：カスガマイシン；カスガマイシン塩酸塩；
 (24) グルコピラノシル系：ストレプトマイシン、バリダマイシン；バリダマイシンA；
 (25) シアノアセトアミド系：シモキサニル；
 (26) カーバメート系：ヨードカルブ、プロパモカルブ、プロチオカルブ、ポリカーバメート；
 (27) 脱共役剤：ビナパクリル、ジノカップ、フェリムゾン、フルアジナム；メプチルジノカップ；
 (28) 有機スズ化合物：酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ；

10

【0137】

- (29) リン酸エステル：亜リン酸、トルクロホスメチル、ホセチル；トルクトフォスメチル；
 (30) フタルアミド酸系：テクロフタラム；
 (31) ベンゾトリアジン系：トリアゾキシド；
 (32) ベンゼンスルフォナミド系：フルスルファミド；
 (33) ピリダジノン：ジクロメジン；
 (34) CAA 殺菌剤 (カルボン酸アミド)系：ジメトモルフ、フルモルフ、ベンチアバリカルブーイソプロピル、イプロバリカルブ、マンジプロパミド；バリフェナレート；
 (35) テトラサイクリン：オキシテトラサイクリン；
 (36) チオカーバメート系：メタスルホカルブ；
 (37) その他の化合物：エトリジアゾール、ポリオキシシン、オキシソリニック酸、ヒドロキシイソキサゾール、オクチリノン、シルチオフアム、ジフルメトリム、アシベンゾラルSメチル、プロベナゾール、チアジニル、エタボキサム、シフルフェナミド、プロキナジド、メトラフェノン、フルオピコリド、水酸化第二銅、有機銅、硫黄、ファーバム、マンゼブ、マンネブ、メチラム、プロピネブ、チウラム、ジネブ、ジラム、キャプタン、カプタホール、フォルペット、クロロタロニル、ジクロフルアニド、トリルフルアニド、ドジン、グアザチン、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンドデシルベンゼンスルホン酸塩、アニラジン、ジチアノン、クロロピクリン、ダゾメット、キノメチオネート、シプロフラム、シルチオフアム、アグロバクテリウム、フルオルイミド)；イソチアニル、ポリオクソリム、ボルドー液、銅ナフタレート、酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、マンコッパー、ビス(8-キノリノラト)銅(II)、多硫化カルシウム、イノミクタジン、イソフェタミド、トルプロカルブ、フェンピラザミン、ピリオフェノン、テブフロキン、フルオピラム、ザリラミド；フルオロフォルペット、プロパミジン、エジフェンホス；ベンチアゾール、ベトキサジン、カプサイシン、カルボン、クフラネブ、マンコゼブ、シプロスルファミド、デバカルブ、ジクロロフェン、ジフェンゾクワット、ジフェンゾクワット・メチルスルホネート、ジフェニルアミン、フルメトベル、フルオロイミド、フルチアニル、ホセチル・アルミニウム、ホセチル・カルシウム、ホセチル・ナトリウム、イルママイシン、メチルイソチアネート (MITC)、ミルデオマイシン、ナタマイシン、ニトロタールイソプロピル、オキサモカルブ、オキシフェンチイン、プロパモカルブ・ホセチレート、プロパモシン・ナトリウム、ピリモルフ、ピロールニトリン、トルニファニド、トリクラミド；

20

30

40

【0138】

植物生長調節剤：

アブシジン酸、インドール酪酸、ウニコナゾール、エチクロゼート、エテホン、クロキシホナック、クロルメコート、クロレラ抽出液、過酸化カルシウム、シアナミド、ジクロルプロップ、ジベレリン、ダミノジッド、デシルアルコール、トリネキサパックエチル、

50

メピコートクロリド、パクロブトラゾール、パラフィンワックス、ピペロニルブトキシド、ピラフルフェンエチル、フルルプリミドール、プロヒドロジャスモン、プロヘキサジオンカルシウム塩、ベンジルアミノプリン、ペンディメタリン、ホルクロルフェニユロン、マレイン酸ヒドラジドカリウム、1-ナフチルアセトアミド、4-CPA、MCPB、コリン、硫酸オキシキノリン、エチクロゼート、ブトルアリン、1-メチルシクロプロペン、アビグリシン塩酸塩；

【実施例】

【0139】

次に、実施例を示し、本発明をより具体的に説明する。ただし、本発明は以下の実施例によって何ら制限されるものではない。

【0140】

実施例1

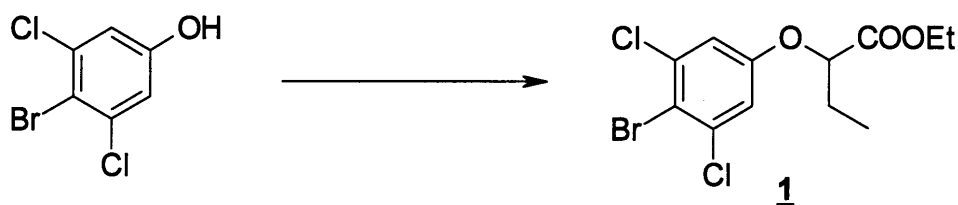
2-(4-ブロモ-3,5-ジクロロフェノキシ)-N-[2-(ピリジン-2-イル)プロパン-2-イル]ブチルアミド [=英名: 2-(4-bromo-3,5-dichlorophenoxy)-N-[2-(pyridine-2-yl)propan-2-yl]butyramide] の製造

【0141】

工程1 化合物1 [2-(4-ブロモ-3,5-ジクロロフェノキシ)酪酸エチル=英名: Ethyl 2-(4-bromo-3,5-dichlorophenoxy)butanoate] の製造

【0142】

【化13】



【0143】

4-ブロモ-3,5-ジクロロフェノール 2.00 g を N, N-ジメチルホルムアミド 40 ml に溶解させた。この溶液に、水素化ナトリウム 0.36 g を加え、室温で 1 時間攪拌した。その後、これに 2-ブロモ酪酸エチル 1.94 g を加え、60℃にて 3 時間攪拌した。これに飽和食塩水を加え、次いで酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥させ、ろ過し、次いで溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、化合物1 2.91 g (収率 99%) を得た。化合物1 の NMR 分析の結果は下記のとおりであった。

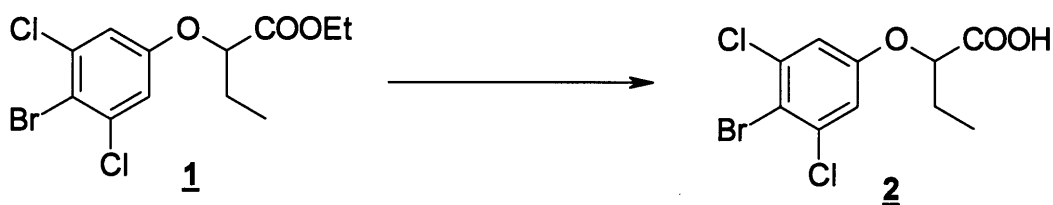
¹H-NMR (CDCl₃/TMS, δ (ppm)) 6.92(s, 2H), 4.49(dd, 1H), 4.23(q, 2H), 2.03~1.95(m, 2H), 1.26(t, 3H), 1.05(t, 3H)

【0144】

工程2 化合物2 [2-(4-ブロモ-3,5-ジクロロフェノキシ)酪酸=英名: 2-(4-bromo-3,5-dichlorophenoxy)butanoic acid] の製造

【0145】

【化14】



10

20

30

40

50

【0146】

化合物1 2.91 gをテトラヒドロフラン40 mlおよび水10 mlに溶解させた。この溶液に水酸化ナトリウム0.49 gを加え、60℃にて3時間攪拌した。その後、これに1%塩酸を加えてpH4に調節し、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥させ、ろ過した。その後、溶媒を減圧留去し、目的とする化合物2 2.52 g (収率94%)を得た。化合物2のNMR分析の結果は下記のとおりであった。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , δ (ppm)) 6.95(s, 2H), 4.58(dd, 1H), 2.05~2.00(m, 2H), 1.09(t, 3H)

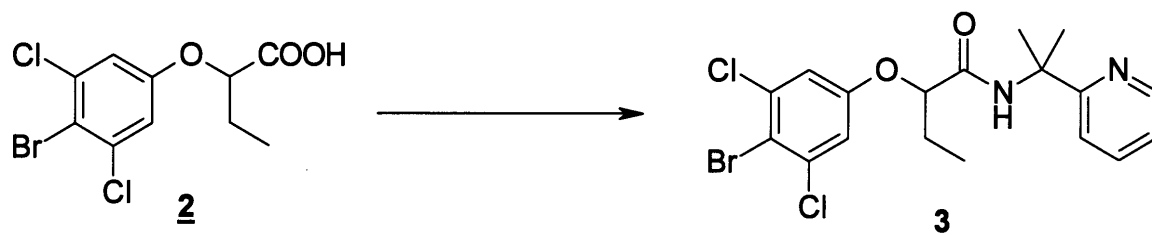
10

【0147】

工程3 化合物3 [2-(4-ブromo-3,5-ジクロロフェノキシ)-N-[2-(ピリジン-2-イル)プロパン-2-イル]ブチルアミド=英名:2-(4-bromo-3,5-dichlorophenoxy)-N-[2-(pyridine-2-yl)propan-2-yl]butyramide]の製造

【0148】

【化15】



20

【0149】

化合物2 0.40 gをアセトニトリル20 mlに溶解させた。この溶液に2-(ピリジン-2-イル)プロパン-2-アミン0.21 g、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩0.33 g、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール0.18 g、およびトリエチルアミン0.25 gを加え、室温にて一晩攪拌した。その後、これに水を加えて、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥させ、ろ過し、次いで溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的とする化合物3 0.14 g (収率26%)を得た。

30

【0150】

実施例2

2-[2-ブromo-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イルオキシ]-N-[2-(ピリジン-2-イル)プロパン-2-イル]ブチルアミド [=英名:2-[2-Bromo-6-(trifluoromethyl)pyridin-4-yloxy]-N-[2-(pyridin-2-yl)propan-2-yl]butyramide]の製造

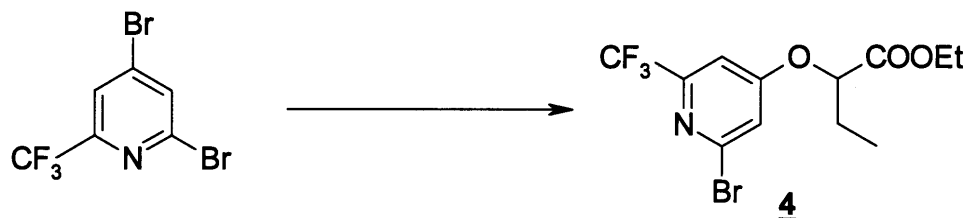
【0151】

工程1 化合物4 (2-[2-ブromo-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イルオキシ]酪酸エチル=英名:Ethyl 2-[2-bromo-6-(trifluoromethyl)pyridin-4-yloxy]butanoate)の製造

40

【0152】

【化 1 6】



【0 1 5 3】

10

2, 4-ジブロモ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン 0.75 g と 2-ヒドロキシ酪酸エチル 0.37 g を N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml に溶解させた。この溶液に、氷冷下にて、55%水素化ナトリウム 0.12 g を加え、室温で 1 時間攪拌した。その後、これに塩化アンモニウム水を加え、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥させ、ろ過し、次いで溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、化合物 4 0.43 g (収率 49%) を得た。化合物 4 の NMR 分析の結果は下記のとおりであった。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , δ (ppm)) 7.15(d, 1H), 7.07(d, 1H), 4.67(dd, 1H), 4.31~4.23(m, 2H), 2.09~2.01(m, 2H), 1.28(t, 3H), 1.08(t, 3H)

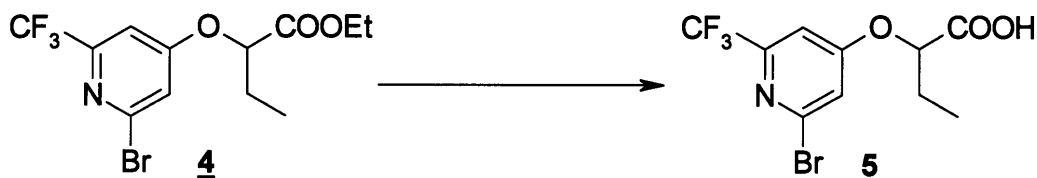
【0 1 5 4】

20

工程 2 化合物 5 [2-[2-ブロモ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イルオキシ]酪酸=英名: 2-[2-Bromo-6-(trifluoromethyl)pyridin-4-yloxy]butanoic acid] の製造

【0 1 5 5】

【化 1 7】



30

【0 1 5 6】

化合物 4 0.43 g をテトラヒドロフラン 12 ml、メタノール 3 ml、および水 3 ml に溶解させた。この溶液に水酸化リチウム一水和物 0.10 g を加え、室温にて一晩攪拌した。その後、これに 1%塩酸を加えて pH 4 に調節し、次いで酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥させ、ろ過し、次いで溶媒を減圧留去し、化合物 5 0.38 g (収率 95%) を得た。化合物 5 の NMR 分析の結果は下記のとおりであった。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , δ (ppm)) 9.34(br, 1H), 7.17(d, 1H), 7.09(d, 1H), 4.76(dd, 1H), 2.19~2.03(m, 2H), 1.12(t, 3H)

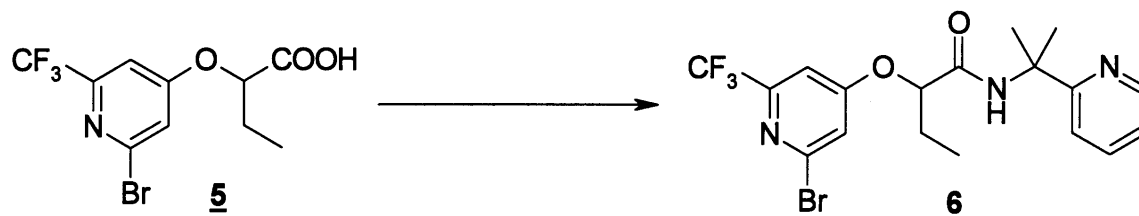
40

【0 1 5 7】

工程 3 化合物 6 [2-[2-ブロモ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イルオキシ]-N-[2-(ピリジン-2-イル)プロパン-2-イル]ブチルアミド=英名: 2-[2-Bromo-6-(trifluoromethyl)pyridin-4-yloxy]-N-[2-(pyridin-2-yl)propan-2-yl]butyramide) の製造

【0 1 5 8】

【化 18】



【0159】

10

化合物5 0.18gをアセトニトリル15mlに溶解させた。この溶液に2-(ピリジン-2-イル)プロパン-2-アミン0.11g、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩0.15g、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール0.08g、およびトリエチルアミン0.11gを加え、室温にて一晩攪拌した。その後、これに水を加えて、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層に硫酸マグネシウムを加えて乾燥させ、ろ過し、次いで溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、融点が123～125℃の化合物6 0.16g(収率67%)を得た。

【0160】

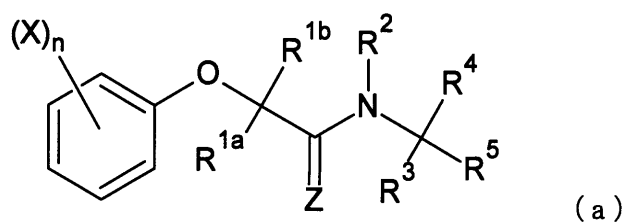
20

前述の方法等によって製造することができる本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物の例を表1～3に示す。表1は式(a)で表される化合物中の置換基を示す。表2は式(b)で表される化合物中の置換基を示す。表3は式(c)で表される化合物中の置換基を示す。なお、表1～3は、前記の方法などで製造できる本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物の一部を示したに過ぎない。本明細書において具体的に示しきれなかった他の化合物、すなわち本発明の趣旨と範囲を逸脱しない種々の基に置換されたものが前記方法などによって製造でき且つ使用できることは本明細書の記載によって当業者において容易に理解できることである。

【0161】

【化 19】

30



【0162】

【表 1】

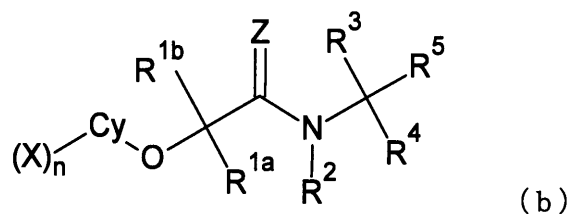
第 1 表									
No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(X) _n	Z	融点℃
1-1	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	108-110
1-2	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3-CH ₂ CH ₂ O-4	O	58-60
1-3	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Me ₂	O	90-92
1-4	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	4-Br-3,5-Cl ₂	O	*
1-5	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,4-Cl ₂	O	78-80
1-6	OMe	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	55-57
1-7	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	4-Br-3,5-Cl ₂	O	109-111
1-8	ⁿ Pr	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	96-98
1-9	SMe	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	133-135
1-10	SMe	H	H	Me	Me	4-Ph-Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	129-131
1-11	Me	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	109-111
1-12	Ph	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	153-155
1-13	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Br ₂ -4-Cl	O	131-133
1-14	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	3,5-Br ₂ -4-Cl	O	121-123
1-15	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	2,4-Cl ₂	O	76-78
1-16	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,4-Br ₂ -5-Cl	O	*
1-17	Et	H	H	Me	Me	4-Ph-Py-2-yl	3,4-Br ₂ -5-Cl	O	*
1-18	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	3,4-Br ₂ -5-Cl	O	144-145
1-19	Me	Me	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	79-81
1-20	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	2,6-Cl ₂	O	*
1-21	-(CH ₂) ₅ -		H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	117-119
1-22	-(CH ₂) ₄ -		H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	113-115

【 0 1 6 3 】

【表 2】

第 1 表 (続き)									
No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(X) _n	Z	融点℃
1-23	Et	H	H	Me	Me	4-Ph-Py-2-yl	4-Br-3,5-Cl ₂	O	*
1-24	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	*
1-25	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3-Br-5-Cl	O	110-112
1-26	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	4-OMe-3,5-Br ₂	O	79-81
1-27	Et	H	H	Me	Me	4-SMe-Py-2-yl	4-Br-3,5-Cl ₂	O	134-136
1-28	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,4,5-Br ₃	O	124-126
1-29	Et	H	H	Me	Me	4-SO ₂ Me-Py-2-yl	4-Cl-3,5-Br ₂	O	136-138
1-30	Et	H	H	Me	Me	5-F-Py-2-yl	4-Cl-3,5-Br ₂	O	112-114
1-31	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,4,5-Cl ₃	O	89-91
1-32	Et	H	H	Me	Me	4- ^t Bu-Py-2-yl	4-Cl-3,5-Br ₂	O	44-46
1-33	H	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	96-98
1-34	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	4-Cl-3,5-Br ₂	S	*
1-35	OPh	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	*
1-36	^c Hex	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	155-157
1-37	Et	H	H	Me	Me	5-SMe-Py-2-yl	4-Cl-3,5-Br ₂	O	128-130
1-38	Et	H	H	Me	Me	5-SO ₂ Me-Py-2-yl	4-Cl-3,5-Br ₂	O	162-164
1-39	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3-Cl-5-CF ₃	O	106-108
1-40	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	3-Cl-5-CF ₃	O	81-83
1-41	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3-Cl-5-CN	O	90-92
1-42	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Br ₂	O	123-125
1-43	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	3-Cl-5-CN	O	86-88
1-44	CH ₃ -CH=		H	Me	Me	Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	110-112
1-45	CH ₃ -CH=		H	Me	Me	4-SMe-Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	*
1-46	CH ₃ -CH=		H	Me	Me	4-SO ₂ Me-Py-2-yl	3,5-Cl ₂	O	96-98
1-47	Et	H	H	Me	Me	4-SMe-Py-2-yl	3-Cl-5-CN	O	108-110
1-48	Et	H	H	Me	Me	4-SO ₂ Me-Py-2-yl	3-Cl-5-CN	O	161-163

【化 2 0】



【 0 1 6 5 】

10

【表 3】

第 2 表									
No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Cy	(X) _n	Z 融点℃
2-1	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Quinolin-6-yl	-	O 111-113
2-2	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Benzothiazol-6-yl	-	O 102-104
2-3	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	Benzothiazol-6-yl	-	O 145-147
2-4	OMe	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Benzothiazol-6-yl	-	O *
2-5	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-2-yl	6-CF ₃	O *
2-6	SMe	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Benzothiazol-6-yl	-	O 91-93
2-7	SMe	H	H	Me	Me	4-Ph-Py-2-yl	Benzothiazol-6-yl	-	O 153-155
2-8	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	Py-4-yl	2-Br-6-CF ₃	O 114-116
2-9	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-4-yl	2-Br-6-CF ₃	O 123-125
2-10	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O 110-111
2-11	Et	H	H	Me	Me	4-Ph-Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O *
2-12	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O 132-133
2-13	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-2-yl	4-CF ₃ -6-Cl	O 116-117
2-14	Et	H	H	Me	Me	4-Ph-Py-2-yl	Py-2-yl	4-CF ₃ -6-Cl	O 114-115
2-15	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	Py-2-yl	4-CF ₃ -6-Cl	O 80-81
2-16	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-4-yl	2-Cl-6-N(Me) ₂	O 123-124

【 0 1 6 6 】

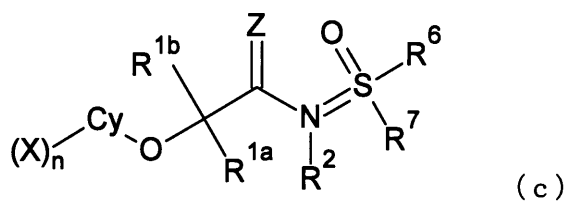
40

【表 4】

第 2 表 (続 き)										
No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Cy	(X) _n	Z	融点℃
2-17	Me	Me	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-2-yl	5-Cl	O	*
2-18	Et	Et	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O	136-138
2-19	Me	Me	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-2-yl	3-Cl-5-CF ₃	O	*
2-20	Et	Me	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O	87-89
2-21	Et	Me	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O	*
2-22	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Br ₂	O	134-135
2-23	Et	H	H	Me	Me	Pyrimidin-2-yl	Py-4-yl	2,6-Br ₂	O	139-140
2-24	Et	H	H	Me	Me	4-SMe-Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O	*
2-25	Et	H	H	Me	Me	4-SO ₂ Me-Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O	179-181
2-26	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Pyrimidin-4-yl	2-Me-6-Cl	O	119-121
2-27	Et	H	H	Me	Me	Py-2-yl	Pyrimidin-2-yl	4,6-Me ₂	O	65-67
2-28	Et	H	H	Me	Me	4-SOMe-Py-2-yl	Py-4-yl	2,6-Cl ₂	O	200-202
2-29	Et	H	H	Me	Me	4-SMe-Py-2-yl	Py-2-yl	4-CF ₃ -6-Cl	O	116-118
2-30	Et	H	H	Me	Me	4-SO ₂ Me-Py-2-yl	Py-2-yl	4-CF ₃ -6-Cl	O	127-129

【 0 1 6 7 】

【化 2 1】



【 0 1 6 8 】

【表 5】

第 3 表								
No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ⁶	R ⁷	Cy	(X) _n	Z	融点℃
3-1	Et	H	Me	Ph	Ph	3,5-Cl ₂	O	72-74
3-2	Et	H	Me	Ph	Quinolin-6-yl	-	O	*
3-3	SMe	H	Me	Ph	Ph	3,5-Cl ₂	O	*

【 0 1 6 9 】

表1～3に示した化合物のうち、いくつかの化合物について融点を測定し表中に併せて記載した。オイル状、アモルファス状の化合物（表中に＊を付した化合物）は、別途、¹H-NMR (CDCl₃)または屈折率を測定した。その測定結果を下記に示す。

【0170】

1-4: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.67(br, 1H), 8.47～8.45(m, 1H), 7.69(dt, 1H), 7.33(d, 1H), 7.17(dd, 1H), 7.08(s, 2H), 4.40(dd, 1H), 2.03～1.98(m, 2H), 1.73(s, 3H), 1.69(s, 3H), 1.04(t, 3H)

1-16: 屈折率20.7℃ 1.5767

1-17: 屈折率20.7℃ 1.5985

1-20: 屈折率20.6℃ 1.5349

10

【0171】

2-4: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.95(br, 1H), 8.72(s, 1H), 8.55(d, 1H), 8.03(d, 1H), 7.78～7.68(m, 2H), 7.38～7.19(m, 3H), 5.42(s, 1H), 3.56(s, 3H), 1.80(s, 3H), 1.75(s, 3H)

2-5: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.46～8.45(m, 2H), 7.77(dd, 1H), 7.68(ddd, 1H), 7.36(d, 1H), 7.27(d, 1H), 7.16(ddd, 1H), 7.36(dd, 1H), 7.10(d, 1H), 5.44(dd, 1H), 2.15～1.99(m, 2H), 1.74(s, 3H), 1.70(s, 3H), 1.04(t, 3H)

2-11: 屈折率20.8℃ 1.5748

【0172】

3-2: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.78(d, 1H), 8.03～8.00(m, 2H), 7.68(d, 1H), 7.60～7.43(m, 4H), 7.33～7.22(m, 2H), 7.10(d, 1H), 4.54(t, 1H), 3.16(s, 3H), 2.11～2.02(m, 2H), 1.13(t, 3H)

20

3-3: ¹H-NMR (CDCl₃) 7.97～7.92(m, 2H), 7.70～7.58(m, 3H), 7.01～6.99(m, 3H), 5.54(s, 1H), 3.38(s, 3H), 2.22(s, 3H)

【0173】

1-23: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.73(br , 1H) , 8.50(d , 1H) , 7.58～7.46(m , 7H) , 7.10(s , 2H) , 4.42(t , 1H) , 2.10～1.98(m , 2H) , 1.79(s , 3H) , 1.75(s , 3H) , 1.06(t , 3H)

1-24: 屈折率20.6℃ 1.5739

1-34: ¹H-NMR (CDCl₃) 9.92(br , 1H) , 8.71(d , 2H) , 7.31(s , 2H) , 7.20(t , 1H) , 4.71(t , 1H) , 2.26～1.91(m , 2H) , 1.94(s , 3H) , 1.92(s , 3H) , 1.05(t , 3H)

30

1-35: ¹H-NMR (CDCl₃) 9.28(br , 1H) , 8.56(d , 1H) , 7.72(dt , 1H) , 7.40～7.06(m , 10H) , 5.91(s , 1H) , 1.74(s , 6H)

1-45: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.64(br , 1H) , 8.22(d , 1H) , 6.95～7.07(m , 5H) , 6.68(q , 1H) , 2.46(s , 3H) , 1.69(d , 3H) , 1.68(s , 6H)

2-17: 屈折率20.7℃ 1.5198

2-19: 屈折率20.4℃ 1.4943

2-21: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.70(d , 2H) , 8.14(br , 1H) , 7.18(t , 1H) , 6.93(s , 2H) , 2.13～1.91(m , 2H) , 1.76(s , 6H) , 1.57(s , 3H) , 0.98(t , 3H)

40

2-24: ¹H-NMR (CDCl₃) 8.65(br , 1H) , 8.23(d , 1H) , 7.10(d , 1H) , 6.98(dd , 1H) , 6.88(s , 2H) , 4.51(t , 1H) , 2.48(s , 3H) , 2.11～1.99(m , 2H) , 1.71(s , 3H) , 1.66(s , 3H) , 1.04(t , 3H)

【0174】

本発明の有害生物防除剤の製剤実施例を若干示すが、添加物および添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。以下に農園芸用の製剤実施例を示す。

【0175】

製剤実施例1 (水和剤)

50

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

以上を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分40%の水和剤を得た。

【0176】

製剤実施例2 (乳剤)

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

10

以上を混合溶解して、有効成分30%の乳剤を得た。

【0177】

以下に防疫用・動物用の製剤実施例を示す。

【0178】

製剤実施例3 (顆粒)

本発明化合物	5部
カオリン	94部
ホワイトカーボン	1部

本発明化合物を有機溶媒中で溶解させ、担体上へ噴霧した後、溶媒を減圧下蒸発させる。
この種の顆粒は動物の餌と混合できる。

20

【0179】

製剤実施例4 (注入剤)

本発明化合物 0.1～1部
ラッカセイ油 バランス
調製後は、滅菌フィルターによりろ過滅菌する。

【0180】

製剤実施例5 (ポアオン剤)

本発明化合物	5部
ミリスチン酸エステル	10部
イソプロパノール	バランス

30

【0181】

製剤実施例6 (スポットオン剤)

本発明化合物	10～15部
パルミチン酸エステル	10部
イソプロパノール	バランス

【0182】

製剤実施例7 (スプレーオン剤)

本発明化合物	1部
プロピレングリコール	10部
イソプロパノール	バランス

40

【0183】

〔生物試験〕

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

【0184】

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

3寸鉢に播種したインゲンの発芽後7～10日を経過した初生葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を10頭接種した。次いで、前記製剤実施例2に示された処方法の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度125ppmになるように水で希釈し、その希釈液を前記インゲンに散布した。該インゲンを、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置いた

50

。散布から3日経過後に成虫の生死を調査した。さらに散布から14日経過後に産下された卵が成虫まで発育し得たか否かを調査した。

化合物番号1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-23、1-24、1-25、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-34、1-37、1-38、1-39、1-40、1-43、2-1、2-2、2-3、2-4、2-6、2-7、2-10、2-11、2-12、2-15、2-16、2-22、2-23、2-24、2-25、および2-28の化合物をそれぞれ含有する乳剤について、前記試験を行った。いずれの化合物も3日経過時の殺虫率または10日経過時の殺虫率が90%以上であった。

【0185】

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

シャーレに入れたミカン葉上に、神奈川県産のミカンハダニ雌成虫を8頭接種した。次いで前記製剤実施例2に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度125 ppmになるように水で希釈し、その希釈液を回転散布塔にて前記ミカンに散布した。該ミカン、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置いた。散布から3日経過後に成虫の生死を調査した。さらに散布から10日経過後に産下された卵が成虫まで発育し得たか否かを調査した。

10

化合物番号1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-11、1-13、1-14、1-16、1-17、1-18、1-25、1-28、1-29、1-30、1-31、1-34、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、2-1、2-2、2-3、2-6、2-7、2-11、2-16、2-24、2-25、および2-28の化合物をそれぞれ含有する乳剤について、前記試験を行った。いずれの化合物も3日経過時の殺虫率または10日経過時の殺虫率が90%以上であった。

20

【0186】

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

シャーレに入れたミカン葉上に、和歌山県産の殺ダニ剤抵抗性のミカンハダニ雌成虫を8頭接種した。次いで前記製剤実施例2に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度125 ppmになるように水で希釈し、その希釈液を回転散布塔にて前記ミカンに散布した。該ミカン、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置いた。散布から3日経過後に成虫の生死を調査した。さらに散布から10日経過後に産下された卵が成虫まで発育し得たか否かを調査した。

化合物番号1-1、1-4、1-7、1-14、1-17、1-18、および1-34の化合物をそれぞれ含有する乳剤について、前記試験を行った。いずれの化合物も3日経過時の殺虫率または10日経過時の殺虫率が90%以上であった。

30

【0187】

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

3寸鉢に播種したインゲンの発芽後7～10日を経過した初生葉上に、岡山県産のカンザワハダニ雌成虫を10頭接種した。次いで、前記製剤実施例2に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度500 ppmまたは125 ppmになるように水で希釈し、その希釈液を前記インゲンに散布した。該インゲン、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置いた。散布から3日経過後に成虫の生死を調査した。さらに散布から14日経過後に、産下された卵が成虫まで発育し得たか否かを調査した。

【0188】

化合物番号1-1の化合物を500 ppm含有する乳剤について、前記試験を行った。3日経過時の殺虫率および14日経過時の殺虫率は90%以上であった。また、化合物番号1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-23、1-24、1-25、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-34、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-45、2-1、2-2、2-5、2-6、2-7、2-8、2-9、2-10、2-11、2-12、2-13、2-15、2-16、2-22、2-23、2-24、2-25、2-28、2-29、および2-30の化合物をそれぞれ125 ppm含有する乳剤について、前記試験を行った。いずれの化合物も3日経過時の殺虫率または14日経過時の殺虫率が90%以上であった。

40

【0189】

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

50

シャーレに入れたミカン葉上に、殺ダニ剤抵抗性ミカンサビダニ成虫を20頭接種した。次いで前記製剤実施例2に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物濃度125 ppmになるように水で希釈し、その希釈液を回転散布塔にて前記ミカンに散布した。該ミカンを、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置いた。散布から3日経過時に成虫の生死を調査した。さらに散布から10日経過時に産下された卵が成虫まで発育し得たか否かを調査した。

化合物番号1-14の化合物を含有する乳剤について、前記試験を行った。3日経過時の殺虫率および10日経過時の殺虫率が90%以上であった。

【産業上の利用可能性】

【0190】

10

本発明のアリールオキシ酢酸アミド化合物またはその塩は、農作物や衛生面で問題となる有害生物を防除することができる。特に、ダニ類を効果的に防除することができるので、産業上有用である。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

A 6 1 K 31/444 (2006.01)	A 6 1 K 31/444	
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439	
C 0 7 D 417/12 (2006.01)	C 0 7 D 417/12	
A 6 1 K 31/506 (2006.01)	A 6 1 K 31/506	
C 0 7 D 215/20 (2006.01)	C 0 7 D 215/20	
A 6 1 K 31/47 (2006.01)	A 6 1 K 31/47	
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
C 0 7 D 239/26 (2006.01)	C 0 7 D 239/26	
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 0 1 N 43/40 (2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 1 C
A 0 1 N 43/54 (2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 1 E
A 0 1 N 43/42 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	C
A 0 1 N 43/78 (2006.01)	A 0 1 N 43/42	1 0 1
C 0 7 C 381/10 (2006.01)	A 0 1 N 43/78	1 0 1
	C 0 7 C 381/10	

(72)発明者 古川 裕紀
 神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内

(72)発明者 花井 大輔
 神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内

(72)発明者 玉伊 徹生
 神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内

(72)発明者 椎木 康介
 神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 特開 2 0 0 1 - 0 8 9 7 5 8 (J P, A)

特開平 0 5 - 0 7 0 4 2 8 (J P, A)

国際公開第 0 2 / 0 5 0 0 5 2 (W O, A 1)

国際公開第 2 0 1 3 / 0 1 0 0 8 9 (W O, A 1)

国際公開第 2 0 1 3 / 0 1 0 0 8 2 (W O, A 1)

STN on the Web, FILE REGISTRY, RN=1326837-92-6, 1326588-62-8, 1326426-26-9, 1326021-57-1, 1324662-77-2, 1322350-66-2, 1301863-03-5, 1301695-46-4, 1301384-01-9, 1301345-44-7, 1301055-68-4, 1301055-52-6, 1299775-54-4, 1299096-28-8, 1298039-49-2, 1297824-67-9, 1296971-56-6, 1295620-85-7, 1294945-70-2, 1288354-70-0, 1278846-71-1, 1241649-93-3, 1197646-81-3, 1119376-70-3, 1026795-21-0, 941383-42-2, 316183-10-5, 316168-88-4, 316163-97-0, 316161-08-7

(58)調査した分野(Int.Cl., D B名)

C 0 7 D

A 0 1 N 4 3

A 6 1 K 3 1

C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)