

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2012-116796

(P2012-116796A)

(43) 公開日 平成24年6月21日(2012.6.21)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 401/04 (2006.01)	C O 7 D 401/04 C S P	4 C O 6 3
A O 1 N 43/40 (2006.01)	A O 1 N 43/40 I O 1 M	4 C O 8 6
A O 1 N 43/56 (2006.01)	A O 1 N 43/56 C	4 H O 1 1
A O 1 N 43/653 (2006.01)	A O 1 N 43/653 B	
A O 1 P 7/04 (2006.01)	A O 1 N 43/56 D	
審査請求 未請求 請求項の数 16 O L (全 85 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2010-268859 (P2010-268859)
 (22) 出願日 平成22年12月1日 (2010.12.1)

(71) 出願人 000002093
 住友化学株式会社
 東京都中央区新川二丁目27番1号
 (74) 代理人 110000796
 特許業務法人三枝国際特許事務所
 (72) 発明者 池上 宏
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
 (72) 発明者 伊藤 舞衣
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
 Fターム(参考) 4C063 AA01 BB01 BB02 CC12 CC22
 CC41 CC75 DD12 DD25 EE01

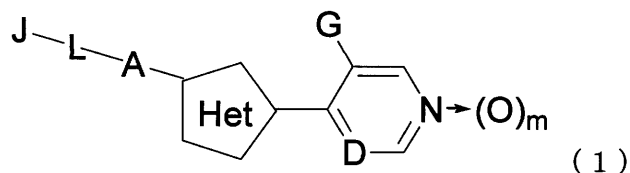
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ヘテロ芳香環化合物およびその有害生物防除用途

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 有害生物に対して防除活性を有する新規な化合物を提供する。

【解決手段】 式(1)



〔式中、Jは、t-ブチル基、トリメチルシリル基等を表し、Lは、単結合またはC1-C3アルキレン基を表し、Aは、単結合等を表し、Gは、水素原子、ハロゲン原子等を表し、Dは-N=または-CH=を表し、mは0または1を表す。〕で示されるヘテロ芳香環化合物。

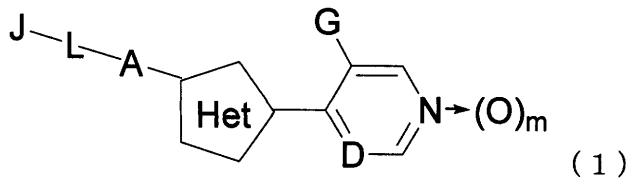
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1)

【化 1】

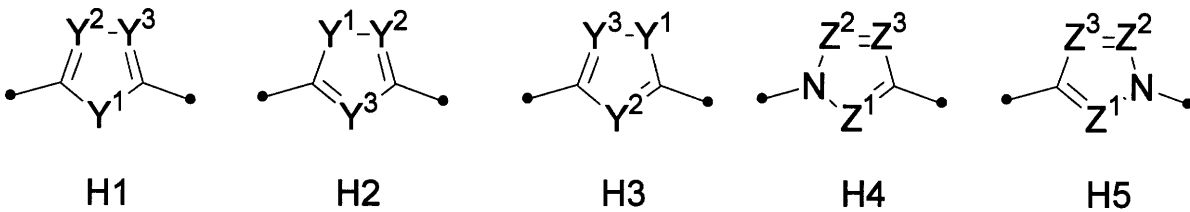


10

〔式中、

H e t は、下式 H 1、H 2、H 3、H 4 または H 5 :

【化 2】



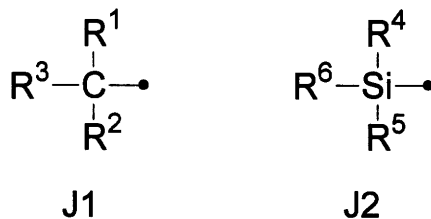
20

{ 式中、

Y¹ は、-O-、-S-または-N E²-を表し、Y² および Y³ は、同一または相異なり、-C E¹=または-N=を表し、Y² および Y³ の少なくとも一方は-C E¹=であり、Z¹、Z² および Z³ は、同一または相異なり、-C E¹=または-N=を表し（ここで E¹ は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1-C 2 アルキル基、水素原子またはハロゲン原子を表し、E² は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1-C 2 アルキル基を表す。）、構造式の左側の「・」印が A と結合する位置を表す。} で示される 5 員ヘテロ環を表し、

J は、下式 J 1 または J 2 :

【化 3】



30

〔式中、

R¹ および R² は、同一または相異なり、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1-C 3 アルキル基を表し、

R³ は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1-C 6 鎖式炭化水素基、ハロゲン原子または水素原子を表し、

R⁴ および R⁵ は、同一または相異なり、メチル基またはエチル基を表し、

R⁶ は、水素原子または C 1-C 6 鎖式炭化水素基を表す。) で示される基を表し、

L は、単結合または 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1-C 3 アルキレン基を表し、

A は、H e t が H 1、H 2、H 3 または H 5 のとき、単結合、-O-、または-S (O)_x-を表し（ここで、x は、0、1 または 2 を表す。）、H e t が H 4 のとき、単結合を表し、

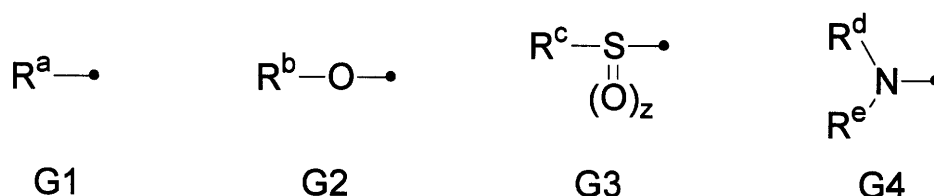
G は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基もしくは

40

50

アミノ基を表すか、または、下式 G 1、G 2、G 3 もしくは G 4 :

【化 4】



(式中、

R^a は、＜群 α＞より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、シクロプロピル基または $-C(O)-T^1$ を表し、

R^b は、＜群 β＞より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、 $-C(O)-T^2$ 、 $-S(O)_2-T^3$ 、C 3－C 9 トリアルキシル基またはシクロプロピル基を表し、

R^c は、＜群 β＞より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、 $-C(O)-T^2$ またはシクロプロピル基を表し、

z は 0、1 または 2 を表し、

R^d は、＜群 β＞より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、 $-C(O)-T^2$ 、 $-S(O)_2-T^3$ またはシクロプロピル基を表し、

R^e は、＜群 β＞より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、水素原子またはシクロプロピル基を表し、

T^1 は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルアミノ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 12 ジアルキルアミノ基、水酸基、アミノ基、水素原子またはシクロプロピル基を表し、

T^2 は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルアミノ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 12 ジアルキルアミノ基、アミノ基、水素原子またはシクロプロピル基を表し、

T^3 は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。) で示される基を表し、

D は $-N=$ または $-CH=$ を表し、

m は 0 または 1 を表す。

＜群 α＞：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルチオ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルスルホニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルアミノ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 8 ジアルキルアミノ基、ハロゲン原子、シアノ基、C 3－C 9 トリアルキシル基およびシクロプロピル基からなる群、

＜群 β＞：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルチオ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルスルホニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 4 アルキルアミノ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 8 ジアルキルアミノ基、フェニル基（該フェニル基は、メチル基、メトキシ基、塩素原子およびニトロ基からなる群より選ばれる 1 個以上の基を有していてもよい。）、ハロゲ

10

20

30

40

50

ン原子、シアノ基、C 3－C 9 トリアルキルシリル基およびシクロプロピル基からなる群。

但し、下記（１）～（６）に該当する化合物を除く：

（１）H e t が H 1 であり、Y ¹ が－S－であり、Y ² および Y ³ が－C H＝であり、A が－O－であり、L が単結合であり、J が J 1 であり、かつ、R ¹、R ² および R ³ がいずれもメチル基であり、G が水素原子であり、D が－C H＝であり、m が 0 である化合物、

（２）H e t が H 1 であり、Y ¹ が－O－であり、Y ² および Y ³ が－C H＝であり、A および L が単結合であり、J が J 2 であり、かつ、R ⁴、R ⁵ および R ⁶ がいずれもメチル基であり、G が水素原子であり、D が－C H＝であり、m が 0 である化合物、

10

（３）H e t が H 3 であり、Y ¹ が－S－であり、Y ² が－N＝であり、Y ³ が－C H＝であり、A および L が単結合であり、J が J 1 であり、かつ、R ⁴、R ⁵ および R ⁶ がいずれもメチル基であり、G が水素原子であり、D が－C H＝であり、m が 0 である化合物、

（４）H e t が H 4 であり、Z ¹ が－C H＝であり、Z ² が－N＝であり、Z ³ が－C I＝であり、（ここで、I はヨウ素原子である。）A および L が単結合であり、J が J 1 であり、R ¹ および R ² がいずれもメチル基であり、かつ、R ³ が水素原子であり、G が水素原子であり、D が－N＝であり、m が 0 である化合物、

（５）H e t が H 4 であり、Z ¹ が－N＝であり、Z ² および Z ³ が－C H＝であり、A および L が単結合であり、J が J 1 であり、R ¹ および R ² がいずれもメチル基であり、かつ、R ³ が水素原子またはメチル基であり、G が水素原子であり、D が－C H＝または－N＝であり、m が 0 である化合物、および

20

（６）H e t が H 5 であり、Z ¹ が－N＝であり、Z ² が－C（C H₃）＝であり、Z ³ が－C H＝であり、A が－O－であり、L が単結合であり、J が J 1 であり、R ¹ および R ² がいずれもメチル基であり、かつ、R ³ が水素原子であり、G が水素原子であり、D が－C H＝であり、m が 0 である化合物。]

で示されるヘテロ芳香環化合物。

【請求項 2】

H e t が H 1 である請求項 1 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 3】

Y ¹ が－S－または－O－である請求項 2 に記載のヘテロ芳香環化合物。

30

【請求項 4】

Y ¹ が－S－である請求項 2 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 5】

H e t が H 1、H 2 または H 3 であり、Y ¹ が－S－である請求項 1 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 6】

H e t が H 4 である請求項 1 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 7】

Z ¹ が－N＝であり、Z ² が－C E ¹＝であり、かつ、Z ³ が－C E ¹＝または－N＝であるか、あるいは、Z ¹ が－C E ¹＝であり、Z ² が－N＝であり、かつ、Z ³ が－C E ¹＝である請求項 6 に記載のヘテロ芳香環化合物。

40

【請求項 8】

Z ¹ が－N＝であり、Z ² および Z ³ が同一または相異なり－C E ¹＝であるか、あるいは、Z ² が－N＝であり、Z ¹ および Z ³ が同一または相異なり－C E ¹＝である請求項 7 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 9】

Z ¹ および Z ³ が－N＝であり、Z ² が－C E ¹＝である請求項 6 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 10】

50

H e t が H 5 である請求項 1 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 1 1】

Z¹ が -N= であり、Z² が -C E¹= であり、かつ、Z³ が -C E¹= または -N= であるか、あるいは、Z¹ が -C E¹= であり、Z² が -N= であり、かつ、Z³ が -C E¹= である請求項 1 0 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 1 2】

Z¹ が -N= であり、Z² および Z³ が同一または相異なり -C E¹= であるか、あるいは、Z² が -N= であり、Z¹ および Z³ が同一または相異なり -C E¹= である請求項 1 1 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 1 3】

Z¹ および Z³ が -N= であり、Z² が -C E¹= である請求項 1 0 に記載のヘテロ芳香環化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 ～請求項 1 3 のいずれか一項に記載のヘテロ芳香環化合物と不活性担体とを含有する有害生物防除剤。

【請求項 1 5】

有害生物を防除するための請求項 1 ～請求項 1 3 のいずれか一項に記載のヘテロ芳香環化合物の使用。

【請求項 1 6】

請求項 1 ～請求項 1 3 のいずれか一項に記載のヘテロ芳香環化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する工程を含む有害生物の防除方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0 0 0 1】

本発明はヘテロ芳香環化合物およびその有害生物防除用途に関する。

【背景技術】

【0 0 0 2】

有害生物に対して防除活性を有する化合物が有害生物防除剤の有効成分として見出され、開発されている。

【0 0 0 3】

特許文献 1 には、分子内にチアゾール環とピリジン環とを有する化合物が記載されている。

【0 0 0 4】

特許文献 2 には、分子内にピラゾール環とピリミジン環とを有する化合物が記載されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0 0 0 5】

【特許文献 1】国際公開 W O 2 0 0 6 / 0 2 4 6 4 2 パンフレット

【特許文献 2】国際公開 W O 2 0 0 9 / 0 1 6 4 6 0 パンフレット

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0 0 0 6】

本発明は、有害生物に対して防除活性を有する新規な化合物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】

【0 0 0 7】

本発明者は、有害生物に対して防除活性を有する化合物を見出すべく検討した結果、下記式 (1) で示される化合物が有害生物に対して防除効力を有することを見出し、更に検討を重ねた結果本発明を完成するに至った。

10

20

30

40

50

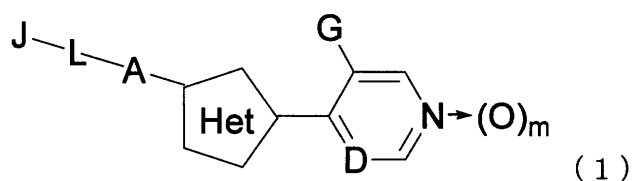
【0008】

即ち、本発明は以下のものである。

[発明1] 式(1)

【0009】

【化1】



10

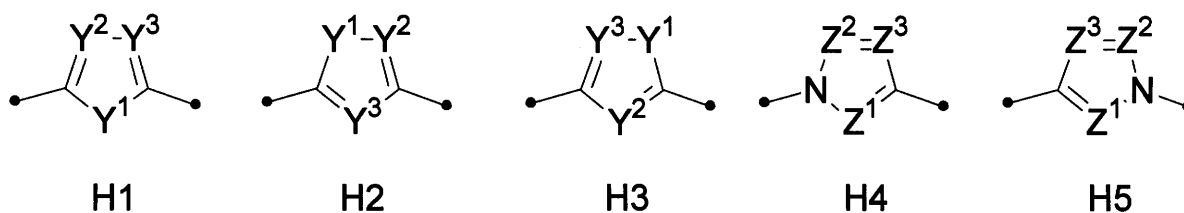
【0010】

[式中、

Hetは、下式H1、H2、H3、H4またはH5：

【0011】

【化2】



20

【0012】

{式中、

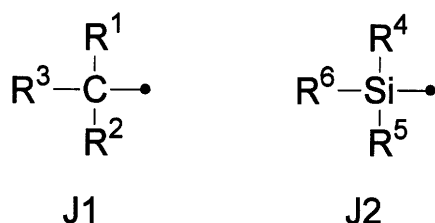
Y^1 は、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NE^2-$ を表し、 Y^2 および Y^3 は、同一または相異なり、 $-CE^1=$ または $-N=$ を表し、 Y^2 および Y^3 の少なくとも一方は $-CE^1=$ であり、 Z^1 、 Z^2 および Z^3 は、同一または相異なり、 $-CE^1=$ または $-N=$ を表し（ここで E^1 は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C2アルキル基、水素原子またはハロゲン原子を表し、 E^2 は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C2アルキル基を表す。）、構造式の左側の「・」印がAと結合する位置を表す。}で示される5員ヘテロ環を表し、

30

Jは、下式J1またはJ2：

【0013】

【化3】



40

【0014】

(式中、

R^1 および R^2 は、同一または相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基を表し、

R^3 は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、ハロゲン原子または水素原子を表し、

R^4 および R^5 は、同一または相異なり、メチル基またはエチル基を表し、

R^6 は、水素原子またはC1-C6鎖式炭化水素基を表す。)で示される基を表し、

Lは、単結合または1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキレン

50

基を表し、

Aは、H e tがH 1、H 2、H 3またはH 5のとき、単結合、 $-O-$ 、または $-S(O)_x-$ を表し（ここで、xは、0、1または2を表す。）、H e tがH 4のとき、単結合を表し、

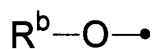
Gは、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基もしくはアミノ基を表すか、または、下式G 1、G 2、G 3もしくはG 4：

【0 0 1 5】

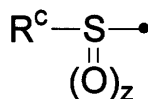
【化 4】



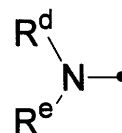
G1



G2



G3



G4

10

【0 0 1 6】

（式中、

R^aは、＜群α＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1－C 6鎖式炭化水素基、シクロプロピル基または $-C(O)-T^1$ を表し、

R^bは、＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1－C 6鎖式炭化水素基、 $-C(O)-T^2$ 、 $-S(O)_2-T^3$ 、C 3－C 9トリアルキルシリル基またはシクロプロピル基を表し、

20

R^cは、＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1－C 6鎖式炭化水素基、 $-C(O)-T^2$ またはシクロプロピル基を表し、

zは0、1または2を表し、

R^dは、＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1－C 6鎖式炭化水素基、 $-C(O)-T^2$ 、 $-S(O)_2-T^3$ またはシクロプロピル基を表し、

R^eは、＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1－C 6鎖式炭化水素基、水素原子またはシクロプロピル基を表し、

30

T¹は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキルアミノ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 12ジアルキルアミノ基、水酸基、アミノ基、水素原子またはシクロプロピル基を表し、

T²は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキルアミノ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 12ジアルキルアミノ基、アミノ基、水素原子またはシクロプロピル基を表し、

T³は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表す。）

40

で示される基を表し、

Dは $-N=$ または $-CH=$ を表し、

mは0または1を表す。

＜群α＞：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキルチオ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキルスルホニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 4アルキルアミノ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 8ジアルキルアミノ基、ハロゲン原子、シアノ基、C 3－C 9トリアルキルシリル基およびシクロプロピル基からなる群、

50

<群β>：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルチオ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルホニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルアミノ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C8ジアルキルアミノ基、フェニル基（該フェニル基は、メチル基、メトキシ基、塩素原子およびニトロ基からなる群より選ばれる1個以上の基を有していてもよい。）、ハロゲン原子、シアノ基、C3-C9トリアルキルシリル基およびシクロプロピル基からなる群。

【0017】

但し、下記(1)～(6)に該当する化合物を除く：

(1) HetがH1であり、Y¹が-S-であり、Y²およびY³が-CH=であり、Aが-O-であり、Lが単結合であり、JがJ1であり、かつ、R¹、R²およびR³がいずれもメチル基であり、Gが水素原子であり、Dが-CH=であり、mが0である化合物、

(2) HetがH1であり、Y¹が-O-であり、Y²およびY³が-CH=であり、AおよびLが単結合であり、JがJ2であり、かつ、R⁴、R⁵およびR⁶がいずれもメチル基であり、Gが水素原子であり、Dが-CH=であり、mが0である化合物、

(3) HetがH3であり、Y¹が-S-であり、Y²が-N=であり、Y³が-CH=であり、AおよびLが単結合であり、JがJ1であり、かつ、R⁴、R⁵およびR⁶がいずれもメチル基であり、Gが水素原子であり、Dが-CH=であり、mが0である化合物、

(4) HetがH4であり、Z¹が-CH=であり、Z²が-N=であり、Z³が-CI=であり（ここで、Iはヨウ素原子である。）、AおよびLが単結合であり、JがJ1であり、R¹およびR²がいずれもメチル基であり、かつ、R³が水素原子であり、Gが水素原子であり、Dが-N=であり、mが0である化合物、

(5) HetがH4であり、Z¹が-N=であり、Z²およびZ³が-CH=であり、AおよびLが単結合であり、JがJ1であり、R¹およびR²がいずれもメチル基であり、かつ、R³が水素原子またはメチル基であり、Gが水素原子であり、Dが-CH=または-N=であり、mが0である化合物、および

(6) HetがH5であり、Z¹が-N=であり、Z²が-C(CH₃)=であり、Z³が-CH=であり、Aが-O-であり、Lが単結合であり、JがJ1であり、R¹およびR²がいずれもメチル基であり、かつ、R³が水素原子であり、Gが水素原子であり、Dが-CH=であり、mが0である化合物。]

で示されるヘテロ芳香環化合物（以下、本発明化合物と記す。）。

[発明2] HetがH1である[発明1]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明3] Y¹が-S-または-O-である[発明2]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明4] Y¹が-S-である[発明2]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明5] HetがH1、H2またはH3であり、Y¹が-S-である[発明1]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明6] HetがH4である[発明1]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明7] Z¹が-N=であり、Z²が-CE¹=であり、かつ、Z³が-CE¹=または-N=であるか、あるいは、Z¹が-CE¹=であり、Z²が-N=であり、かつ、Z³が-CE¹=である[発明6]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明8] Z¹が-N=であり、Z²およびZ³が同一または相異なり-CE¹=であるか、あるいは、Z²が-N=であり、Z¹およびZ³が同一または相異なり-CE¹=である[発明7]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明9] Z¹およびZ³が-N=であり、Z²が-CE¹=である[発明6]に記載のヘテロ芳香環化合物。

[発明10] HetがH5である[発明1]に記載のヘテロ芳香環化合物。

〔発明 1 1〕 Z^1 が $-N=$ であり、 Z^2 が $-CE^1=$ であり、かつ、 Z^3 が $-CE^1=$ または $-N=$ であるか、あるいは、 Z^1 が $-CE^1=$ であり、 Z^2 が $-N=$ であり、かつ、 Z^3 が $-CE^1=$ である〔発明 1 0〕に記載のヘテロ芳香環化合物。

〔発明 1 2〕 Z^1 が $-N=$ であり、 Z^2 および Z^3 が同一または相異なり $-CE^1=$ であるか、あるいは、 Z^2 が $-N=$ であり、 Z^1 および Z^3 が同一または相異なり $-CE^1=$ である〔発明 1 1〕に記載のヘテロ芳香環化合物。

〔発明 1 3〕 Z^1 および Z^3 が $-N=$ であり、 Z^2 が $-CE^1=$ である〔発明 1 0〕に記載のヘテロ芳香環化合物。

〔発明 1 4〕 〔発明 1〕～〔発明 1 3〕のいずれか一項に記載のヘテロ芳香環化合物と不活性担体とを含有する有害生物防除剤。

〔発明 1 5〕 有害生物を防除するための〔発明 1〕～〔発明 1 3〕のいずれか一項に記載のヘテロ芳香環化合物の使用。

〔発明 1 6〕 〔発明 1〕～〔発明 1 3〕のいずれか一項に記載のヘテロ芳香環化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する工程を含む有害生物の防除方法。

【発明の効果】

【0018】

本発明化合物は、有害生物の防除に有用である。

【発明を実施するための形態】

【0019】

本明細書において用いられる用語について、以下に例を挙げて説明する。

【0020】

本発明化合物において「ハロゲン原子」とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子を意味する。

【0021】

本発明化合物において、 E^1 で表される「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C2$ アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、およびジフルオロメチル基等が挙げられる。

【0022】

本発明化合物において、 E^2 で表される「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C2$ アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、および 2, 2-ジフルオロエチル基等が挙げられる。

【0023】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C3$ アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基およびトリフルオロメチル基が挙げられる。

【0024】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい $C1-C6$ アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基およびトリフルオロメチル基が挙げられる。

【0025】

本発明化合物において「 $C1-C6$ 鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、3-メチルブチル基、2, 3-ジメチルブチル基、3, 3-ジメチルブチル基およびヘキシル基等の $C1-C6$ アルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、イソプロペニル基、2-メチル-1-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-ペンテニル基および1-ヘキセニル基等の $C2-C6$ アルケニル基；並びに

エチニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、3,

10

20

30

40

50

3-ジメチル-1-ブチニル基、1-ペンチニル基および1-ヘキシニル基等のC2-C6アルキニル基が挙げられる。

【0026】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、2,2-ジメチルプロピル基、3-メチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、3,3-ジメチルブチル基ヘキシル基およびトリフルオロメチル基等の1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、イソプロペニル基、2-メチル-1-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-ペンテニル基および1-ヘキセニル基等のC2-C6アルケニル基および2,2-ジフルオロビニル基等の1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基；並びにエチニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、3,3-ジメチル-1-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基および2-クロロエチニル基等の1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基が挙げられる。

【0027】

本発明化合物において「＜群α＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基およびtert-ブチル基等のC1-C6アルキル基；

トリフルオロメチル基、シアノメチル基、シクロプロピルメチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1-メトキシエチル基およびメチルチオメチル基等の＜群α＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有するC1-C6アルキル基；

ビニル基、イソプロペニル基、1-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2,2-ジクロロビニル基および2,2-ジフルオロビニル基等の＜群α＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルケニル基；並びに

エチニル基、1-プロピニル基、2-クロロエチニル基、2-フルオロエチニル基および2-(トリメチルシリル)エチニル基等の＜群α＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルキニル基が挙げられる。

【0028】

本発明化合物において「＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基およびtert-ブチル基等のC1-C6アルキル基；

ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、1,1,1-トリフルオロ-2-プロピル基、シアノメチル基、1-シアノエチル基、シクロプロピルメチル基、1-(シクロプロピル)エチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1-メトキシエチル基、2-メトキシエチル基、メチルチオメチル基、メチルスルフィニルメチル基、メチルスルホニルメチル基、2-(メチルチオ)エチル基、2-(メチルスルフィニル)エチル基、2-(メチルスルホニル)エチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、2-(ジメチルアミノ)エチル基、ベンジル基、4-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基および4-ニトロベンジル基等の＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有するC1-C6アルキル基；

2-プロペニル基、2-ブテニル基および3-メチル-2-ブテニル基等の＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6アルケニル基；並びにプロパルギル基、2-ブチニル基および3-ブチニル基等の＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルキニル基が挙げられる。

【0029】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキレン基」としては、例えば-CH₂-、-CHCl-、-CHF-、-CF₂-、-CH₂CH₂-および-CH₂CH₂CH₂-が挙げられる。

【0030】

本発明化合物において「C3-C9トリアルキルシリル基」としては、例えばトリメチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基、トリエチルシリル基、イソプロピルジメチルシリル基、トリイソプロピルシリル基が挙げられる。

【0031】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基」としては、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、2,2,2-トリクロロエトキシ基および2,2,2-トリフルオロエトキシ基が挙げられる。

10

【0032】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルアミノ基」としては、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、sec-ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基および2,2,2-トリフルオロエチルアミノ基が挙げられる。

【0033】

20

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C12ジアルキルアミノ基」としては、例えばN,N-ジメチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、N,N-ジプロピルアミノ基、N,N-ジブチルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-tert-ブチル-N-メチルアミノ基およびN-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ基が挙げられる。

【0034】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルコキシ基」としては、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基および2,2,2-トリフルオロエトキシ基が挙げられる。

30

【0035】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルチオ基」としては、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基および2,2,2-トリフルオロエチルチオ基が挙げられる。

【0036】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルフィニル基」としては、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、イソブチルスルフィニル基、sec-ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基および2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル基が挙げられる。

40

【0037】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキルスルホニル基」としては、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基および2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル基が挙げられる。

【0038】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4アルキ

50

ルアミノ基」としては、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、*sec*-ブチルアミノ基、*tert*-ブチルアミノ基および2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基が挙げられる。

【0039】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C8ジアルキルアミノ基」としては、例えばN, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルアミノ基、N, N-ジブチルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-*tert*-ブチル-N-メチルアミノ基およびN-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基が挙げられる。

10

【0040】

本発明化合物において「フェニル基（該フェニル基は、メチル基、メトキシ基、塩素原子およびニトロ基からなる群より選ばれる1個以上の基を有してもよい。）」としては、例えばフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-ニトロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-クロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基および4-メチルフェニル基が挙げられる。

本発明化合物において、Hetで表される前記5員ヘテロ芳香環が-C E¹=を2個以上含む場合に、各E¹基は同一でも相異なってもよい。

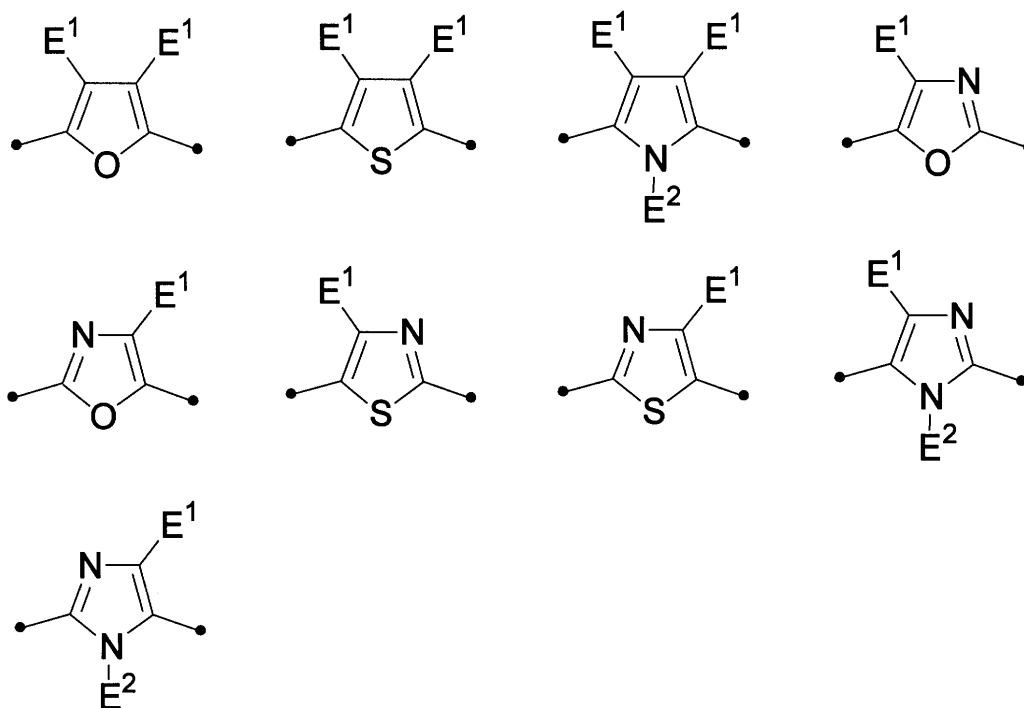
20

【0041】

本発明化合物において、H1で表される5員ヘテロ芳香環の具体例を以下に示す。以下、構造式の左側の「・」印がAと結合する位置を表す。

【0042】

【化5】



30

40

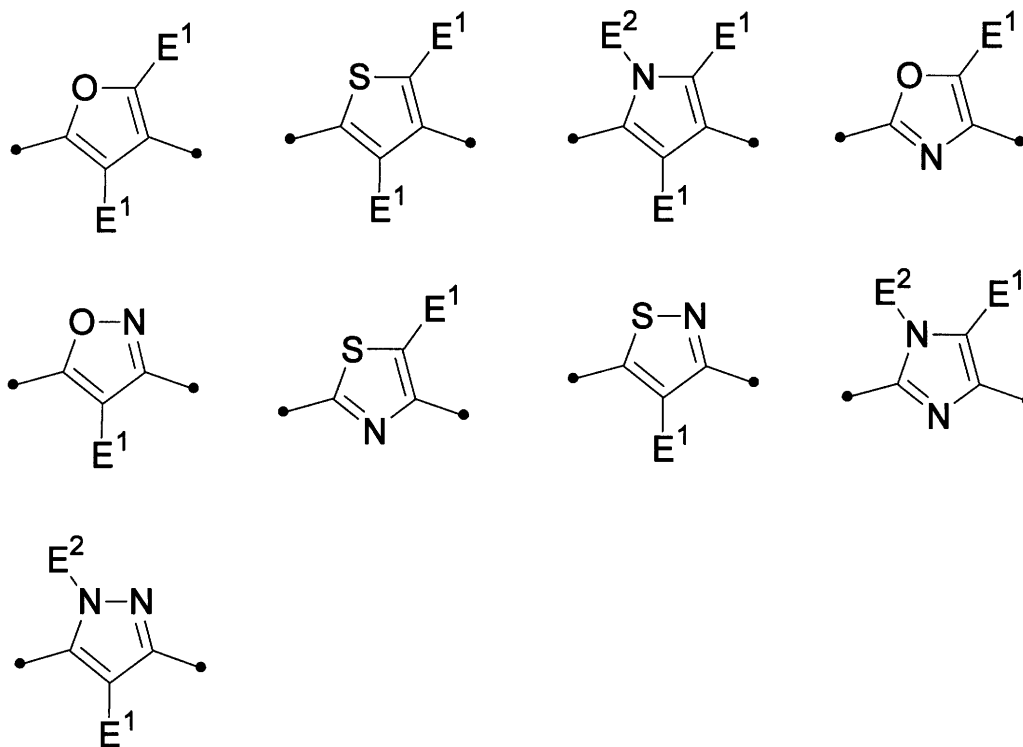
【0043】

(式中、E¹及びE²は前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物において、H2で表される5員ヘテロ芳香環の具体例を以下に示す。

【0044】

【化 6】



10

20

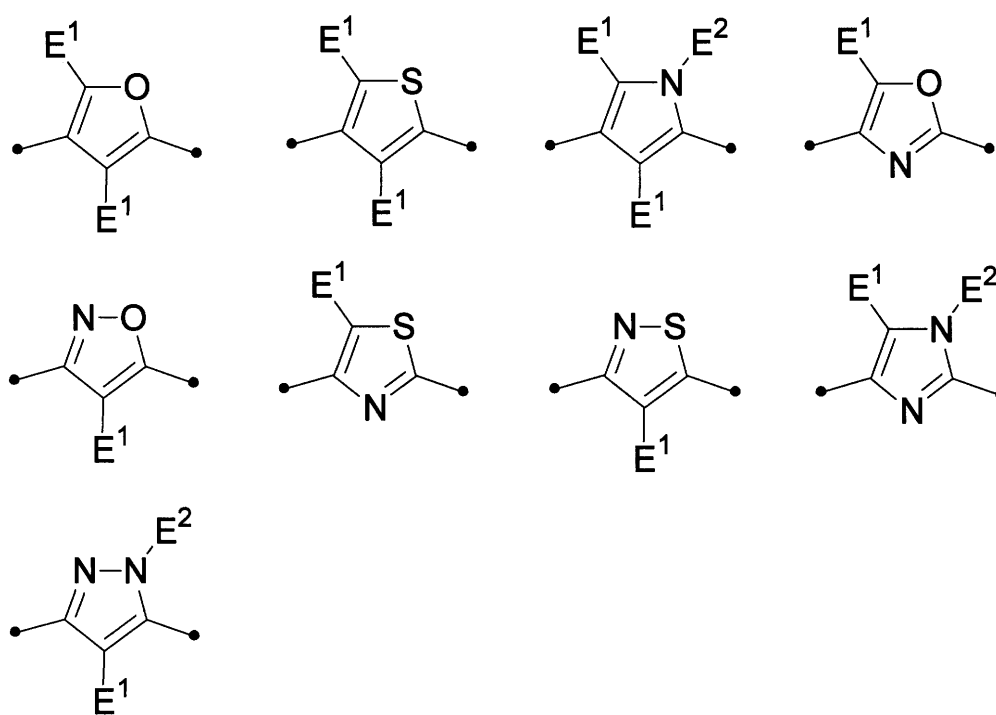
【0045】

(式中、E¹ 及び E² は前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物において、H 3で表される 5員ヘテロ芳香環の具体例を以下に示す。

【0046】

【化 7】



30

40

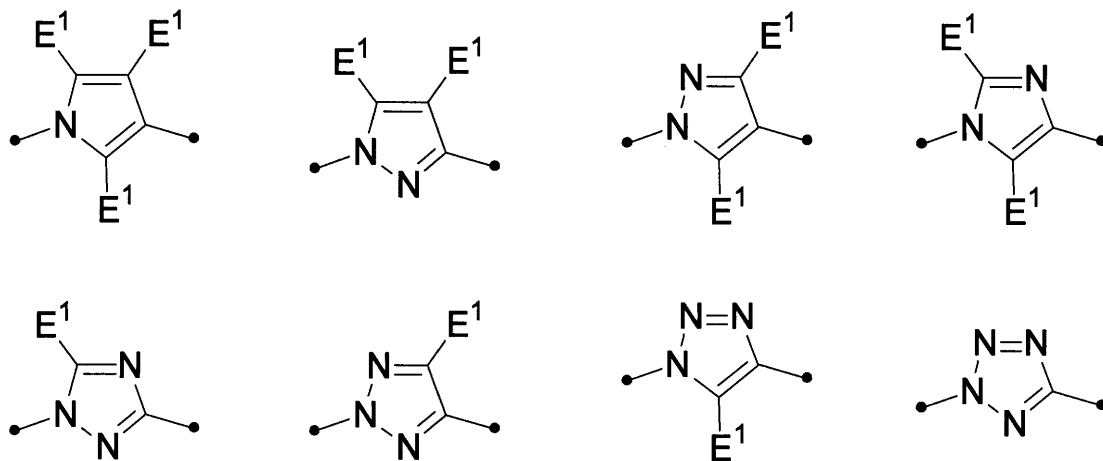
【0047】

(式中、E¹ 及び E² は前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物において、H 4で表される 5員ヘテロ芳香環の具体例を以下に示す。

【0048】

【化 8】



10

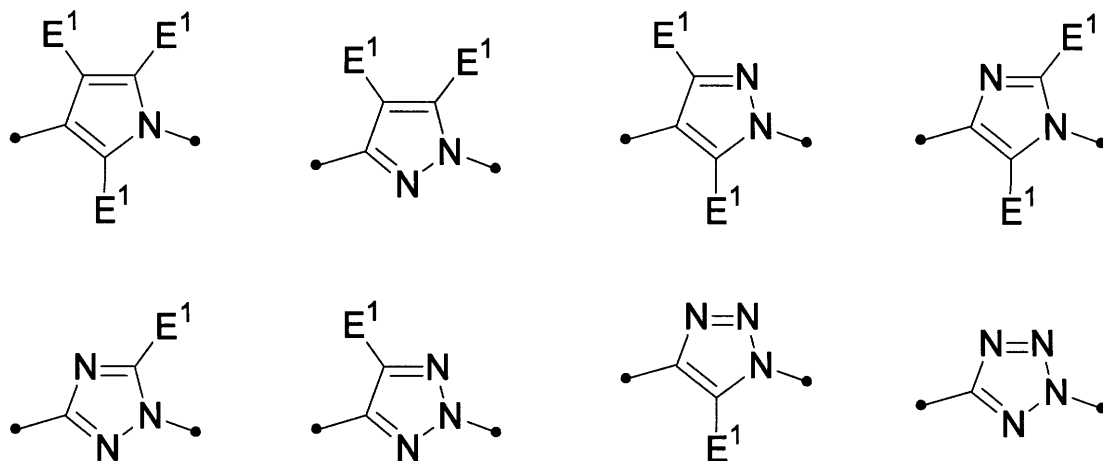
【0049】

(式中、 E^1 は前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物において、H 5で表される 5 員ヘテロ芳香環の具体例を以下に示す。

【0050】

【化 9】



20

30

【0051】

(式中、 E^1 は前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物としては、例えば以下のヘテロ芳香環化合物が挙げられる。

[態様 A]

式(1)において、Het が H 1、H 2 または H 3 である化合物。

[態様 B]

式(1)において、Het が H 1、H 2 または H 3 であり、 Y^1 が $-O-$ または $-S-$ である化合物。

40

[態様 C]

式(1)において、Het が H 1、H 2 または H 3 であり、 Y^1 が $-S-$ である化合物。

[態様 D]

式(1)において、Het が H 1 である化合物。

[態様 E]

式(1)において、Het が H 1 であり、 Y^1 が $-O-$ または $-S-$ である化合物。

[態様 F]

式(1)において、Het が H 1 であり、 Y^1 が $-S-$ である化合物。

[態様 G]

50

式(1)において、HetがH1であり、Y¹が-S-であり、Y²およびY³が-C E¹=である化合物。

[態様H]

式(1)において、HetがH4である化合物。

[態様I]

式(J)において、HetがH4であり、Z¹、Z²およびZ³のうちの1つまたは2つが-N=であり、それ以外が-C E¹=である化合物。

[態様J]

式(1)において、HetがH4であり、Z¹、Z²およびZ³のうちの1つが-N=であり、それ以外が-C E¹=である化合物。

10

[態様K]

式(1)において、HetがH4であり、Z¹が-N=であり、Z²が-C E¹=であり、かつ、Z³が-C E¹=または-N=であるか、あるいは、Z¹が-C E¹=であり、Z²が-N=であり、かつ、Z³が-C E¹=である化合物。

[態様L]

式(1)において、HetがH4であり、Z¹が-N=であり、Z²が-C E¹=であり、Z³が-C E¹=または-N=である化合物。

[態様M]

式(1)において、HetがH4であり、Z¹およびZ²のいずれか一方が-N=であり、他方が-C E¹=であり、Z³が-C E¹=である化合物。

20

[態様N]

式(1)において、HetがH4であり、Z¹が-N=であり、Z²およびZ³が同一または相異なりC E¹=である化合物。

[態様O]

式(1)において、HetがH4であり、Z²が-N=であり、Z¹およびZ³が同一または相異なりC E¹=である化合物。

[態様P]

式(1)において、HetがH5である化合物。

[態様Q]

式(1)において、HetがH5であり、Z¹、Z²およびZ³のうちの1つまたは2つが-N=であり、それ以外が-C E¹=である化合物。

30

[態様R]

式(1)において、HetがH5であり、Z¹、Z²およびZ³のうちの1つが-N=であり、それ以外が-C E¹=である化合物。

[態様S]

式(1)において、HetがH5であり、Z¹が-N=であり、Z²が-C E¹=であり、かつ、Z³が-C E¹=または-N=であるか、あるいは、Z¹が-C E¹=であり、Z²が-N=であり、かつ、Z³が-C E¹=である化合物。

[態様T]

式(1)において、HetがH5であり、Z¹が-N=であり、Z²が-C E¹=であり、Z³が-C E¹=または-N=である化合物。

40

[態様U]

式(1)において、HetがH5であり、Z¹およびZ²のいずれか一方が-N=であり、他方が-C E¹=であり、Z³が-C E¹=である化合物。

[態様V]

式(1)において、HetがH5であり、Z¹が-N=であり、Z²およびZ³が同一または相異なりC E¹=である化合物。

[態様W]

式(1)において、HetがH5であり、Z²が-N=であり、Z¹およびZ³が同一または相異なりC E¹=である化合物。

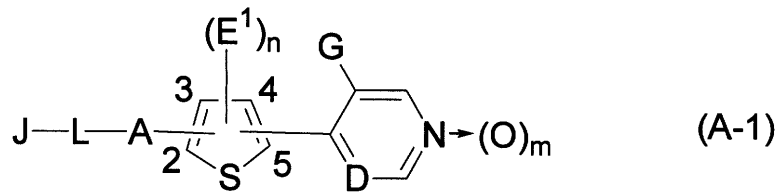
50

[態様 X]

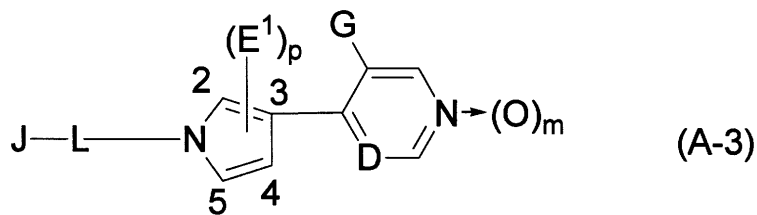
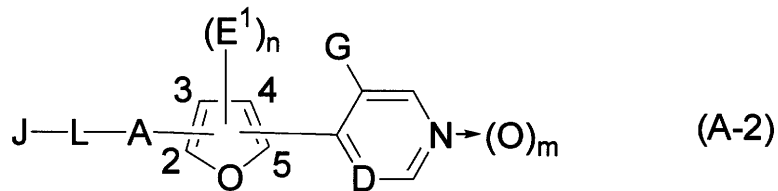
下式で示される [発明 1] 記載のヘテロ芳香環化合物。

【0052】

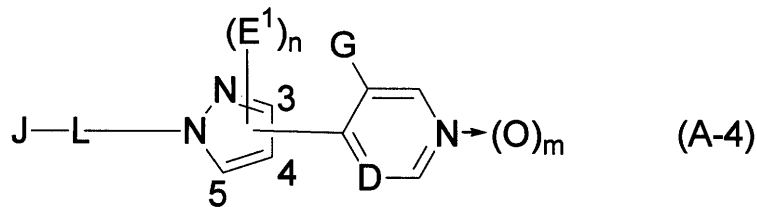
【化10】



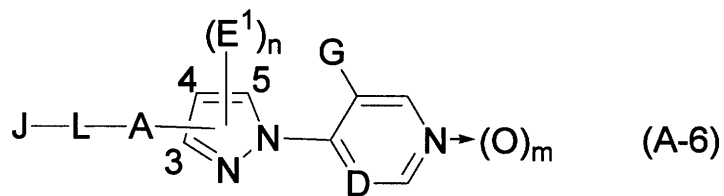
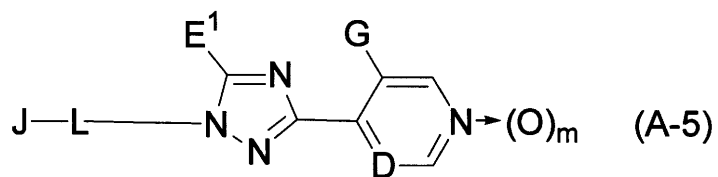
10



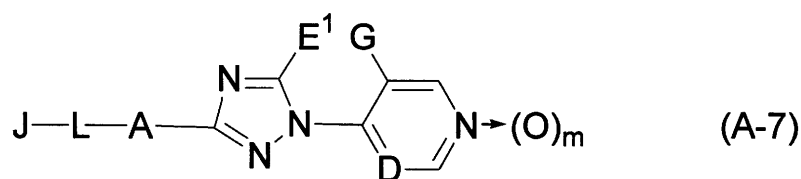
20



30



40



【0053】

(式中、nは0、1または2を表し、pは0、1、2または3を表し、他の記号は前記と同じ意味を表す。)

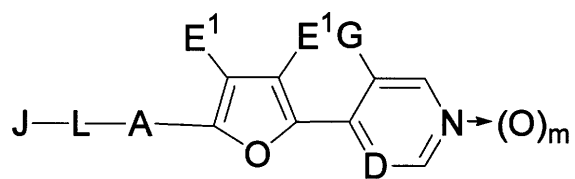
50

〔態様 Y〕

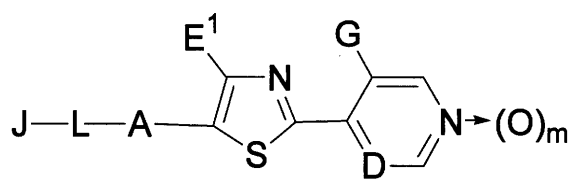
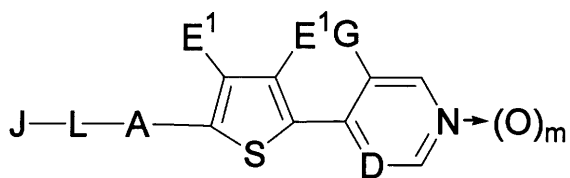
下式で示される〔発明 1〕記載のヘテロ芳香環化合物。

【 0 0 5 4 】

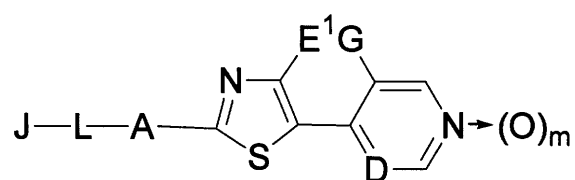
【 化 1 1 - 1 】



10

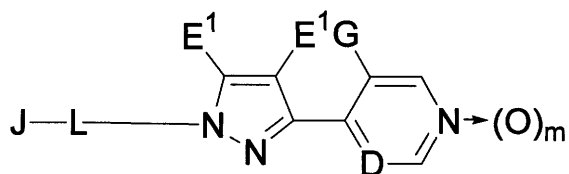
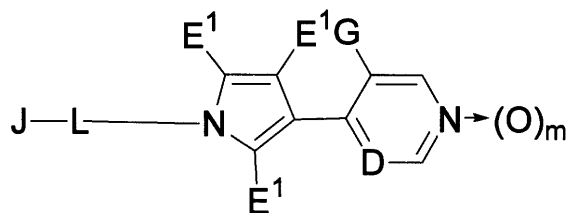


20

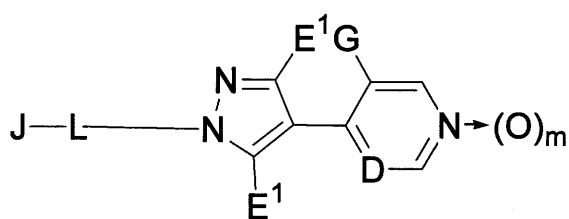


【 0 0 5 5 】

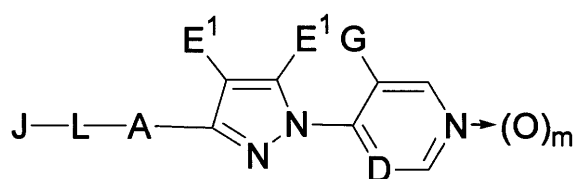
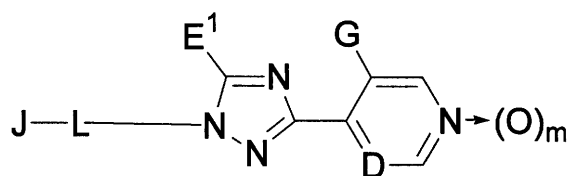
【化 1 1 - 2】



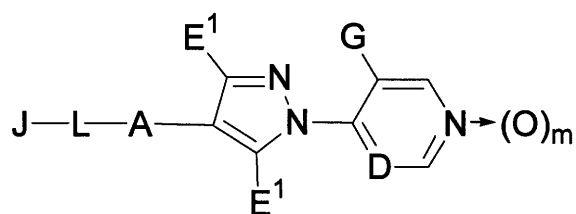
10



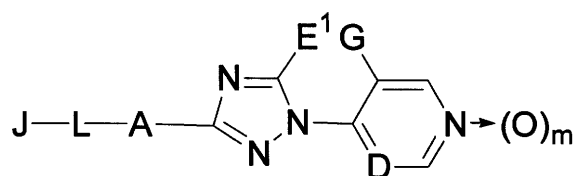
20



30



40



【 0 0 5 6】

(式中、各記号は前記と同じ意味を表す。)

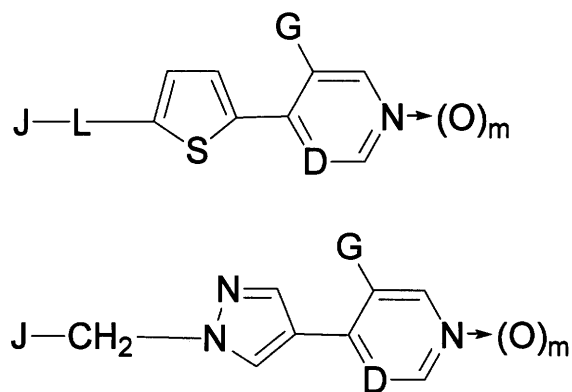
〔態様 Z〕

下式で示される〔発明 1〕記載のヘテロ芳香環化合物。

【 0 0 5 7】

50

【化 1 2】



10

【0058】

(式中、各記号は前記と同じ意味を表す。)

また、本発明化合物としては、例えば以下のヘテロ芳香環化合物も挙げられる。

〔態様 1〕～〔態様 23〕

Gが〔表 1〕に記載された〔態様 1〕～〔態様 23〕である、〔発明 1〕および〔態様 A〕～〔態様 Z〕のいずれかに記載のヘテロ芳香環化合物。

なお、例えば、〔態様 1〕は、「式 (1) において、Gが水素原子、ハロゲン原子、G 1、G 2、G 3、または G 4である〔発明 1〕および〔態様 A〕～〔態様 Z〕のいずれかに記載のヘテロ芳香環化合物。」を表す。

20

【0059】

【表 1】

態様	G
1	水素原子、ハロゲン原子 G1、G2、G3、G4
2	ハロゲン原子、G1、G2、G3、G4
3	G1、G2、G3、G4
4	G2、G3、G4
5	G2、G3
6	水素原子、ハロゲン原子、G1、G4
7	ハロゲン原子、G1、G4
8	G1、G4
9	シアノ基、G1
10	水酸基、G2
11	メルカプト基、G3
12	アミノ基、G4
13	G1
14	G2
15	G3
16	G4
17	水素原子
18	ハロゲン原子
19	ニトロ基
20	シアノ基
21	水酸基
22	メルカプト基
23	アミノ基

10

20

30

【0060】

また、本発明化合物として、例えば、以下のヘテロ芳香環化合物も挙げられる。

【0061】

40

式(1)において、Dが $-CH=$ である[発明1]、[態様A]～[態様Z]、および[態様1]～[態様23]のいずれかに記載の化合物；

式(1)において、Dが $-N=$ である[発明1]、[態様A]～[態様Z]および[態様1]～[態様23]のいずれかに記載の化合物；

式(1)において、Lが単結合または $-CH_2-$ であり、Aが単結合または $-O-$ であり、JがJ1またはJ2である、[発明1]、[態様A]～[態様Z]および[態様1]～[態様23]のいずれかに記載の化合物；

式(1)において、Lが単結合または $-CH_2-$ であり、Aが単結合または $-O-$ であり、JがJ1(JがJ1の場合に、 R^1 および R^2 はいずれもメチル基であり、 R^3 は水素原子、メチル基、またはエチル基である。)またはJ2(JがJ2の場合に、 R^4 、 R^5 お

50

よび R^6 はいずれもメチル基である。) である、[発明 1]、[態様 A] ~ [態様 Z] および [態様 1] ~ [態様 2 3] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、L が $-CH_2-$ であり、A が単結合であり、J が J 1 (J が J 1 の場合に、 R^1 および R^2 はいずれもメチル基であり、 R^3 は水素原子、メチル基、またはエチル基である。) または J 2 (J が J 2 の場合に、 R^4 、 R^5 および R^6 はいずれもメチル基である。) である、[発明 1]、[態様 A] ~ [態様 Z] および [態様 1] ~ [態様 2 3] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、J-L-A がネオペンチル基である、[発明 1]、[態様 A] ~ [態様 Z] および [態様 1] ~ [態様 2 3] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G が水素原子またはハロゲン原子であるか、
G が G 1 であり、かつ、 R^a が < 群 α > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、
G が G 2 であり、かつ、 R^b が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、
G が G 3 であり、かつ、 R^c が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、あるいは、
G が G 4 であり、 R^d が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であり、かつ、 R^e が、< 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基または水素原子である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G がハロゲン原子であるか、
G が G 1 であり、かつ、 R^a が < 群 α > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、
G が G 2 であり、かつ、 R^b が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、
G が G 3 であり、かつ、 R^c が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、あるいは、
G が G 4 であり、 R^d が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であり、かつ、 R^e が、< 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基または水素原子である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G が G 1 であり、かつ、 R^a が < 群 α > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、
G が G 2 であり、かつ、 R^b が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、
G が G 3 であり、かつ、 R^c が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であるか、あるいは、
G が G 4 であり、 R^d が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基であり、かつ、 R^e が、< 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基または水素原子である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G が、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基または N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基である [発明 1] および [態様

A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基またはN-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

10

式 (1) において、G が、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基またはN-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

20

式 (1) において、G が G² であり、かつ、R^b が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C₁-C₆ 鎖式炭化水素基であるか、あるいは G が G³ であり、かつ、R^c が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C₁-C₆ 鎖式炭化水素基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載のヘテロ環化合物；

式 (1) において、G が、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基または2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G が G¹ であり、かつ、R^a が < 群 α > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C₁-C₆ 鎖式炭化水素基であるか、あるいは、G が G⁴ であり、R^d が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C₁-C₆ 鎖式炭化水素基であり、かつ、R^e が、< 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C₁-C₆ 鎖式炭化水素基または水素原子である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

30

式 (1) において、G が、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基またはN-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

40

式 (1) において、G が G¹ であり、かつ、R^a が < 群 α > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C₁-C₆ 鎖式炭化水素基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G が、メチル基、エチル基、プロピル基またはイソプロピル基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

式 (1) において、G が G² であり、かつ、R^b が < 群 β > より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C₁-C₆ 鎖式炭化水素基である [発明 1] および [態様 A] ~ [態様 Z] のいずれかに記載の化合物；

50

式(1)において、Gが、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基または2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基である〔発明1〕および〔態様A〕～〔態様Z〕のいずれかに記載の化合物；

式(1)において、GがG3であり、かつ、R^eが<群β>より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基である〔発明1〕および〔態様A〕～〔態様Z〕のいずれかに記載の化合物；

式(1)において、Gが、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基または2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基である〔発明1〕および〔態様A〕～〔態様Z〕のいずれかに記載の化合物；

式(1)において、GがG4であり、R^dが<群β>より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基であり、かつ、R^eが、<群β>より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基または水素原子である〔発明1〕および〔態様A〕～〔態様Z〕のいずれかに記載の化合物；

式(1)において、Gが、N、N-ジメチルアミノ基、N、N-ジエチルアミノ基、N、N-ジプロピルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基またはN-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ基である〔発明1〕および〔態様A〕～〔態様Z〕のいずれかに記載の化合物。

【0062】

次に本発明化合物の製造法について説明する。

【0063】

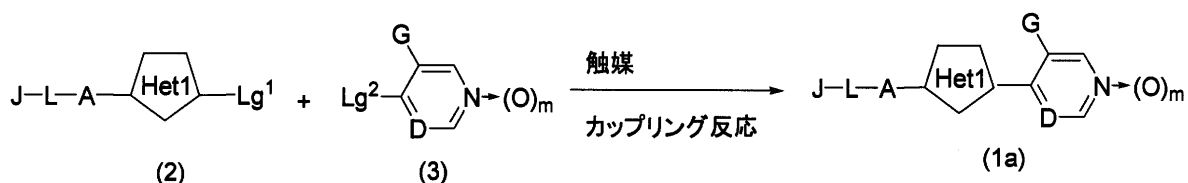
本発明化合物は、例えば、以下の(製造法1)～(製造法9)にしたがって製造することができる。

(製造法1)

本発明化合物のうち、HetがH1、H2、H3およびH4である化合物は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【0064】

【化13】



【0065】

〔式中、J、L、A、DおよびGおよびmは前記と同じ意味を表し、Het1はH1、H2、H3またはH4を表し、Lg¹は、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、または、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表し、Lg²はB(OH)₂基またはB(OR^f)₂基(式中、R^fは同一または相異なっているいてもよく、C1-C6のアルキル基を示し、2つのR^fが結合して-CH₂CH₂-基または-C(CH₃)₂C(CH₃)₂-基を形成することもある。)を表す。〕

・(1a)の製造

本発明化合物は化合物(2)と一般式(3)で表される化合物とを溶媒、触媒および塩基の存在下で反応させることにより化合物(1a)を製造することができる。

【0066】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N、N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類、

ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

【0067】

該反応で用いられる触媒としては、例えば、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、[1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン]ジクロロパラジウム塩化メチレン錯体等のパラジウム触媒が挙げられる。触媒の使用量は化合物（2）1モルに対して0.0001から0.1倍モルの範囲で使用される。

【0068】

該反応で用いられる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウムtert-ブトキシド、リン酸カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の有機酸塩類等が挙げられる。塩基の使用量は化合物（2）1モルに対して0.5から10倍モルの範囲で使用される。

10

【0069】

化合物（2）1モルに対して化合物（3）は通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

【0070】

該反応における反応温度は通常20℃から溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は0.1時間から24時間の範囲である。

【0071】

また該反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うほうが良い。

20

【0072】

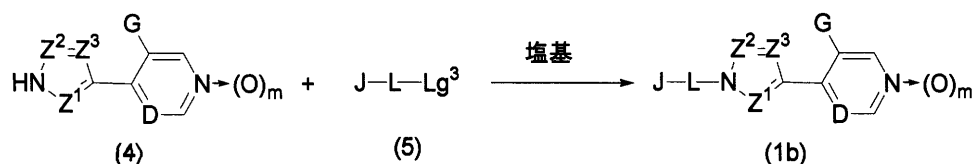
反応終了後は、通常の後処理操作をすることにより、化合物（1a）を単離することができる。

（製造法2）

本発明化合物のうち、HetがH4である化合物は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【0073】

【化14】



30

【0074】

〔式中、J、L、D、G、Z¹、Z²、Z³およびmは前記と同じ意味を表し、Lg³は、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メタンスルホニルオキシ基、パラトルエンスルホニルオキシ基、または、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表す。〕

・（1b）の製造

本発明化合物（1b）は化合物（4）と化合物（5）とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

40

【0075】

該反応は、通常溶媒の存在下で行われ、該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【0076】

該反応において用いられる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウムtert-ブトキシド等が挙げられ

50

る。化合物（４）に対して、塩基は通常１モルから１０モルの割合で用いられる。

【００７７】

化合物（４）１モルに対して化合物（５）は通常１モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

【００７８】

化合物（４）と化合物（５）との反応における反応温度は通常０℃から溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は０．１時間から２４時間の範囲である。

【００７９】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（１ｂ）を単離することができる。

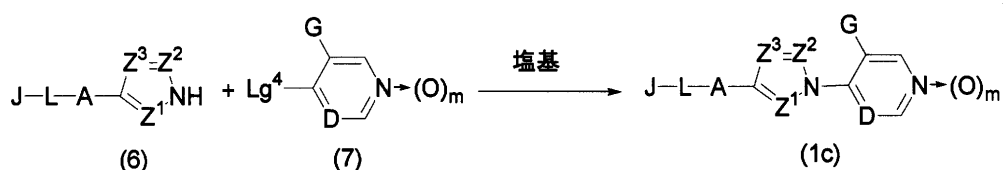
10

（製造法３）

本発明化合物のうち、HetがH5である化合物は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【００８０】

【化１５】



20

【００８１】

〔式中、J、L、A、D、G、Z¹、Z²、Z³およびmは前記と同じ意味を表し、Lg⁴は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等の脱離基を表す。〕

・（１ｃ）の製造

本発明化合物（１ｃ）は化合物（６）と化合物（７）とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

【００８２】

該反応は、通常溶媒の存在下で行われ、該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、１，４－ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N，N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

30

【００８３】

該反応において用いられる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウムtert－ブトキシド等が挙げられる。化合物（６）に対して、塩基は通常１モルから１０モルの割合で用いられる。

【００８４】

化合物（６）１モルに対して化合物（７）は通常１モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

40

【００８５】

化合物（６）と化合物（７）との反応における反応温度は通常０℃から溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は０．１時間から２４時間の範囲である。

【００８６】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（１ｃ）を単離することができる。

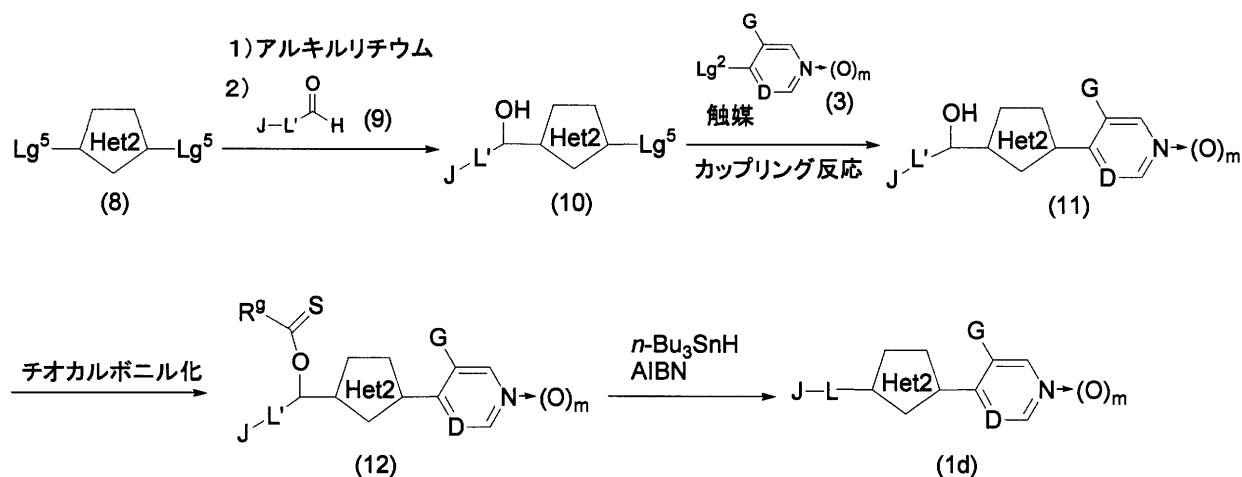
（製造法４）

本発明化合物のうち、HetがH1、H2およびH3である化合物は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【００８７】

50

【化 1 6】



10

【0088】

〔式中、J、L、D、G、Lg² および m は前記と同じ意味を表し、Het2 は H1、H2 または H3 を表し、L' は単結合または 1 個以上のハロゲン原子を有してもよい C1-C2 アルキル基を表し、Lg⁵ は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等の脱離基を表し、R^g は水素原子、メチル基、メチルチオ基、メトキシ基、フェニル基、フェノキシ基またはイミダゾリル基を表す。〕

20

・ (8) → (10)

化合物 (8) をアルキルリチウム化合物と反応させた後に、生成する反応中間体と式 (9) で示されるアルデヒドと反応させることにより、化合物 (10) を製造することができる。

【0089】

化合物 (8) の 2 つの Lg¹ は同一でも相異なってもよい。

【0090】

該反応は、通常溶媒の存在下行われ、該反応に用いられる溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類が挙げられる。

30

【0091】

該反応に用いられるアルキルリチウム化合物としては、例えば、*n*-、*sec*-または *tert*-ブチルリチウムが挙げられ、好ましくは *n*-ブチルリチウムである。化合物 (8) 1 モルに対して、アルキルリチウム化合物は通常 1 モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

【0092】

化合物 (8) とアルキルリチウム化合物との反応における反応温度は、通常 -78 °C から 0 °C の範囲であり、反応時間は、通常瞬時から 1 時間の範囲である。

【0093】

化合物 (8) 1 モルに対して化合物 (9) は通常 1 モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

40

【0094】

該反応中間体と化合物 (8) との反応における反応温度は、通常 -78 °C から 30 °C の範囲であり、反応時間は、通常 0.1 時間から 24 時間の範囲である。

【0095】

反応終了後は、反応混合物に水または塩化アンモニウム水溶液等を注加した後、有機溶媒で抽出し、通常の後処理操作を行うことにより、化合物 (10) を単離することができる。

・ (10) → (11)

該反応は製造方法 1 に記載した化合物 (1a) の製造方法あるいはそれに準じた方法で

50

製造できる。

・ (11) → (12) → (1d)

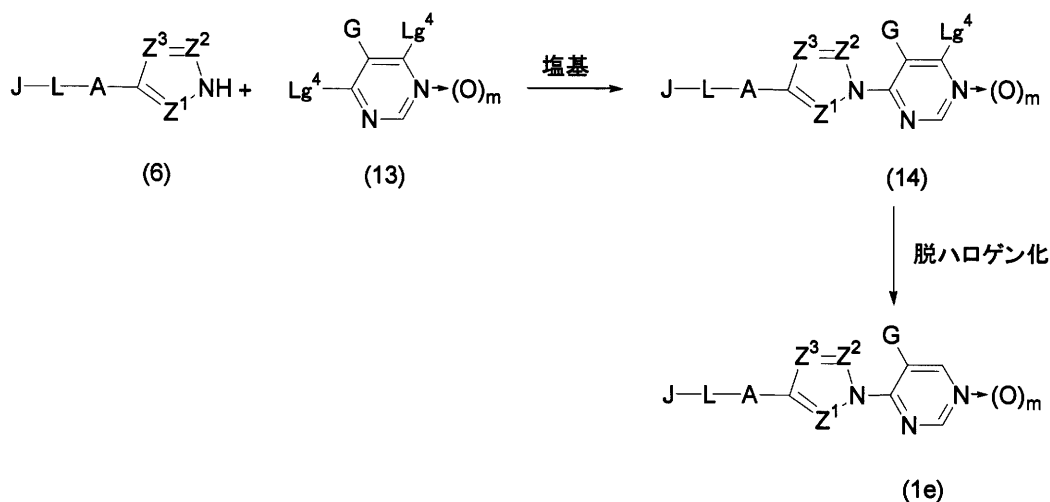
該反応は当業者に知られる Barton-McCombie 脱ヒドロキシ化反応によって製造できる。

(製造法5)

本発明化合物のうち、Het が H5 であり、D が $-N=$ である化合物は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【0096】

【化17】



10

20

【0097】

[式中、J、L、A、G、 Lg^4 、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 および m は前記と同じ意味を表す。]

・ (14) の製造

化合物 (14) は、化合物 (6) とジハロピリミジン化合物 (13) とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

【0098】

化合物 (13) の 2 つの Lg^4 は相異なっているいてもよいが、2 つの Lg^4 がともに塩素原子である化合物が好ましい。

【0099】

該反応は、通常溶媒の存在下行われ、該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【0100】

該反応において用いられる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウム tert-ブトキシド等が挙げられる。化合物 (6) 1 モルに対して、塩基は通常 1 モル ~ 10 モルの割合で用いられる。

【0101】

化合物 (6) 1 モルに対して化合物 (13) は通常 1 モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

【0102】

該反応における反応温度は、通常 20 °C から 200 °C あるいは溶媒の沸点の範囲である。

【0103】

40

50

該反応における反応時間は、通常 0.1 時間から 24 時間の範囲である。

【0104】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、化合物 (14) を単離することができる。

・ (14) → (1e)

本発明化合物 (1e) は、化合物 (14) を脱ハロゲン化することにより製造することができる。脱ハロゲン化の方法としては、例えば、接触水素還元反応などが挙げられる。接触水素還元反応は、溶媒および触媒の存在下、水素と反応させて行う。

【0105】

該反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、酢酸等のカルボン酸類および水が挙げられる。

10

【0106】

また必要に応じて塩基または酸を加えることができる。その場合のモル比は化合物 (14) 1 モルに対して、通常 0.01 モル～10 モルである。

【0107】

該反応に用いられる塩基としては、例えば、酸化マグネシウム、水酸化ナトリウム、酢酸ナトリウム、トリエチルアミンが挙げられる。酸としては、例えば、硫酸、塩酸が挙げられる。

【0108】

該反応に用いられる触媒としては、例えば、パラジウム炭素が挙げられる。

20

【0109】

該反応における、水素圧は通常 1 気圧から 5 気圧である。

【0110】

該反応における反応時間は、通常 0.1 時間から 24 時間の範囲である。

【0111】

反応終了後は、ろ過によって触媒を除去した後、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物 (1e) を単離することができる。

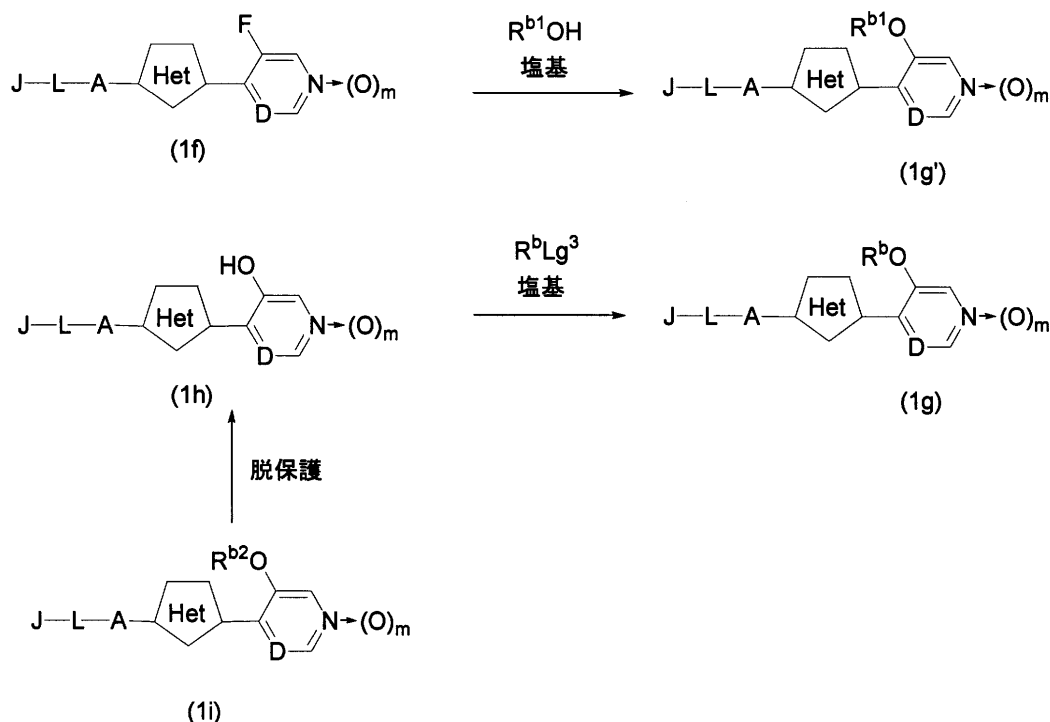
(製造法 6)

本発明化合物のうち、G が G2 である化合物は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

30

【0112】

【化 18】



10

20

【0113】

〔式中、J、L、A、Het、D、 R^{b} 、 Lg^3 および m は前記と同じ意味を表し、 $\text{R}^{\text{b}1}$ は、＜群 β ＞より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい $\text{C}1-\text{C}6$ 鎖式炭化水素基を表し、 $\text{R}^{\text{b}2}$ は、OH 基の保護基（例えば、メチル基、メトキシメチル基、ベンジル基等）を表す。〕

・ (1f) $\rightarrow$ (1g')

本発明化合物 (1g') は、本発明化合物 (1f) と $\text{R}^{\text{b}1}\text{OH}$ とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

【0114】

該反応は、通常溶媒の存在下で行われるが、 $\text{R}^{\text{b}1}\text{OH}$ を溶媒量用いてもよい。

30

【0115】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【0116】

該反応において用いられる塩基としては、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウム *tert*-ブトキシド等が挙げられる。

40

【0117】

本発明化合物 (1f) 1 モルに対して、 $\text{R}^{\text{b}1}\text{OH}$ が通常 1 ~ 10 モルの割合、塩基が通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

【0118】

該反応の反応温度は、通常 0°C ~ 溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は通常 0.1 時間から 24 時間の範囲である。

【0119】

反応終了後は、反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物 (1g') を単離することができる。

・ (1i) $\rightarrow$ (1h)

50

本発明化合物（1 h）は、本発明化合物（1 i）を脱保護することにより製造することができる。

【0120】

保護基である R^b として、例えば、メチル基、メトキシメチル基およびベンジル基が挙げられ、当業者に公知の方法で脱保護することができる。

・（1 h）→（1 g）

本発明化合物（1 g）は、本発明化合物（1 h）と $R^b L g^3$ とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

【0121】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【0122】

該反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム等の炭酸塩類等、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム等が挙げられる。本発明化合物（1 h）1 モルに対して、塩基は通常1モル～10モルの割合で用いられる。

【0123】

本発明化合物（1 h）1 モルに対して、 $R^b L g^3$ は通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

【0124】

該反応の反応温度は、通常0℃～溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は通常0.1時間から24時間である。

【0125】

反応終了後は、反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1 g）を単離することができる。

【0126】

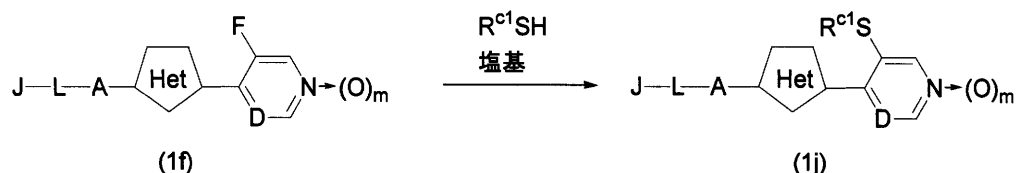
なお、本発明化合物（1 g）は本発明化合物（1 g'）を包含する。

（製造法7）

本発明化合物のうち、GがG3である化合物は、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【0127】

【化19】



【0128】

〔式中、J、L、A、Het、Dおよびmは前記と同じ意味を表し、 $R^{\text{c}1}$ は、＜群β＞より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基を表す。〕

本発明化合物（1 j）は、本発明化合物（1 f）と $R^{\text{c}1} \text{SH}$ とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

【0129】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジ

メチルエーテル、1,4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【0130】

該反応において用いられる塩基としては、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウム *tert*-ブトキシド等が挙げられる。

【0131】

本発明化合物(1f) 1モルに対して、 $R^{c1}SH$ が通常1~10モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

10

【0132】

該反応の反応温度は通常0℃~溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は通常0.1時間から24時間である。

【0133】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1j)を単離することができる。

【0134】

この反応終了後、本発明化合物(1j)に対して、更に当業者に公知の酸化反応を行うことにより、本発明化合物(1j)における $-SR^{c1}$ を $-S(O)_zR^{c1}$ (この場合、 z は1または2を表す)に変換することもできる。

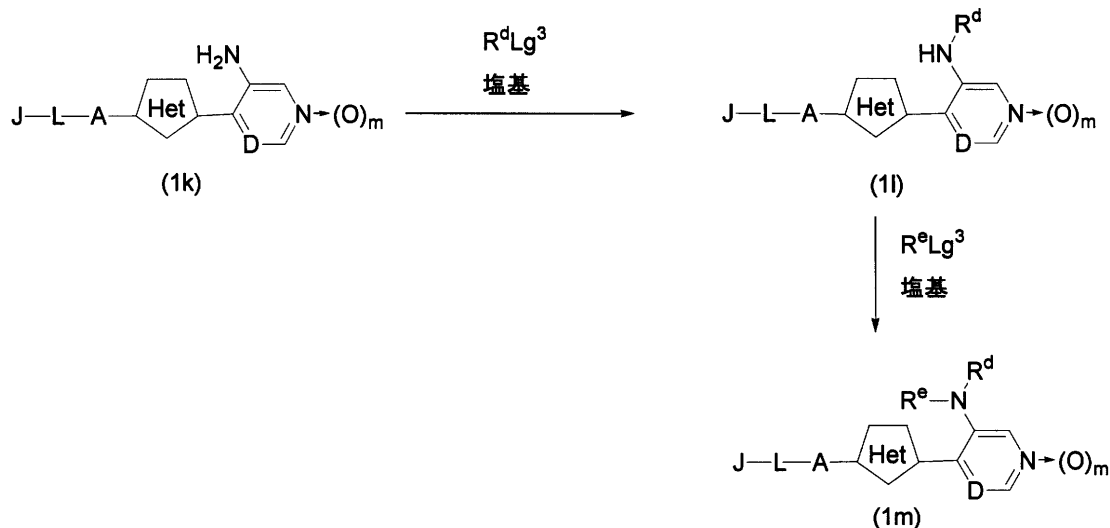
20

(製造法8)

本発明化合物のうち、GがG4である化合物は、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【0135】

【化20】



30

40

【0136】

[式中、J、L、A、Het、D、 Lg^3 、 R^d 、 R^e およびmは前記と同じ意味を表す。]

・(1k) → (1l)

本発明化合物(1l)は、本発明化合物(1k)と R^dLg^3 とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

【0137】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族

50

炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N，N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【0138】

該反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム等の炭酸塩類等、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、ピリジン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム等が挙げられる。本発明化合物（1k）1モルに対して、塩基は通常1モル～2モルの割合で用いられる。

10

【0139】

本発明化合物（1k）1モルに対して、 $R^e L g^3$ が通常1モルの割合で用いられるが適宜変更することができる。

【0140】

該反応の反応温度は通常0℃～溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は通常0.1時間から24時間の範囲である。

【0141】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1l）を単離することができる。

20

・（1l）→（1m）

さらに、本発明化合物（1l）に対して、上記に準じる方法で $R^e L g^2$ を反応させることにより、本発明化合物（1m）を製造することができる。

【0142】

また、 R^d または R^e が1級または2級アルキル基である場合には、上記の方法に代えて、本発明化合物（1k）または本発明化合物（1l）と、アルデヒドまたはケトン化合物とを還元剤の存在下反応させることにより、本発明化合物（1l）または本発明化合物（1m）を製造することもできる。

【0143】

該反応に用いられる還元剤としては、例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムが挙げられる。本発明化合物（1k）または本発明化合物（1l）1モルに対して、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムは1～5モルの割合で用いられる。

30

【0144】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1，4－ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。また、必要に応じて酢酸等のカルボン酸類を加えて反応を行う。

【0145】

本発明化合物（1k）または本発明化合物（1l）1モルに対して、アルデヒドまたはケトン化合物は通常1モルの割合で用いられるが適宜変更することができる。

【0146】

該反応の反応温度は通常0℃～溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は通常0.1時間から24時間の範囲である。

40

【0147】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1l）または本発明化合物（1m）を単離することができる。

（製造法9）

本発明化合物のうち、mが1である化合物は、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【0148】

【化 2 1】



【0149】

〔式中、J、L、A、Het、DおよびGは前記と同じ意味を表す。〕

本発明化合物(1o)は、式(1n)で示されるピリジン化合物を酸化剤と反応させることにより製造することができる。

10

【0150】

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

【0151】

該反応に用いられる溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

【0152】

該反応に用いられる酸化剤としては、例えば3-クロロ過安息香酸等のカルボン酸の過酸化物、過酸化水素水等が挙げられる。

【0153】

化合物(1n)1モルに対して、酸化剤が通常1~3モルの割合で用いられる。

20

【0154】

該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲であり、反応時間は通常0.1時間から24時間の範囲である。

【0155】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(1o)を単離することができる。

【0156】

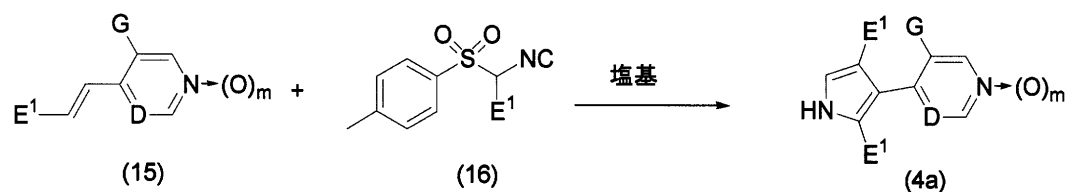
本活性化合物の製造に用いる中間体の一部は、市販されているか、公知の文献等に開示のある化合物である。本発明の中間体は例えば下記の方法により製造することができる。
(中間体製造法1)

30

本発明化合物のうち、HetがH4であり、Z¹、Z²およびZ³が-C E¹=である化合物の中間体(4a)は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【0157】

【化 2 2】



40

【0158】

〔式中、D、G、E¹およびmは前記と同じ意味を表す。〕

化合物(4a)は化合物(15)とパラトルエンスルホニルイソシアニド化合物(16)とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

【0159】

該反応は、通常溶媒の存在下で行われ、該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド、N

50

ーメチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【0160】

該反応において用いられる塩基としては、水素化ナトリウム、ナトリウム *tert*-ブトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド、1, 8-ジアザビシクロ[5, 4, 0]ウンデカー-7-エン、*n*-ブチルリチウム等が挙げられる。化合物(15)に対して、塩基は通常1モルから10モルの割合で用いられる。

【0161】

該反応は必要に応じて添加剤（例えばリチウムブロミド等の金属塩）の存在下に行うことができる。

10

【0162】

化合物(15) 1モルに対してパラトルエンスルホニルイソシアニド化合物(16)は通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

化合物(15)と化合物(16)との反応における反応温度は通常-78℃から30℃の範囲であり、反応時間は0.1時間から24時間の範囲である。

【0163】

反応終了後は、通常の後処理操作を行うことにより、化合物(4a)を単離することができる。

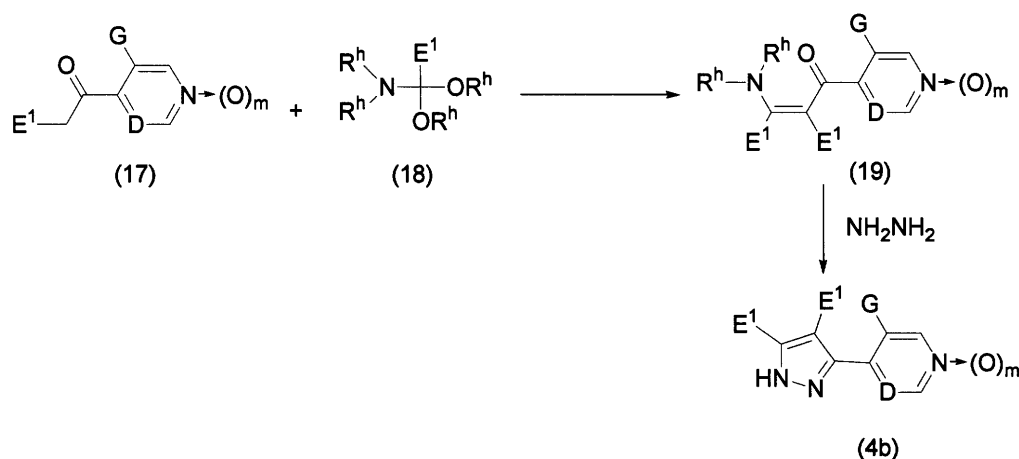
(中間体製造法2)

本発明化合物のうち、HetがH4であり、Z¹が-N=であり、Z²およびZ³が-CE¹=である化合物の中間体(4b)は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

20

【0164】

【化23】



30

【0165】

〔式中、D、G、E¹およびmは前記と同じ意味を表し、R^hは、C1-C6のアルキル基を表し、R^hは同一でも相異なってもよい。〕

40

・(17)→(19)

化合物(19)は化合物(17)と化合物(18)を反応させることにより製造することができる。

【0166】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリジノン等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。また溶媒を使用せずに、式(18)で表されるアセタール化合物を過剰量用いて反応させることもで

50

きる。その使用量は、化合物（１７）１モルに対して通常１．０モルから１０モルの範囲で使用される。

【０１６７】

化合物（１７）と化合物（１８）との反応における反応温度は通常０℃から溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は０．１時間から２４時間の範囲である。

【０１６８】

反応終了後は、通常の後処理操作をすることにより、化合物（１９）を単離することができる。

・（１９）→（４ｂ）

化合物（４ｂ）は化合物（１９）とヒドラジンを反応させることにより製造することができる。

10

【０１６９】

該反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、１，４－ジオキサンなどのエーテル類、トルエン、キシレン等芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

【０１７０】

化合物（１９）１モルに対してヒドラジンは通常１モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

20

【０１７１】

化合物（１９）とヒドラジンとの反応における反応温度は通常０℃から溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は０．１時間から２４時間の範囲である。

【０１７２】

反応終了後は、通常の後処理操作をすることにより、化合物（４ｂ）を単離することができる。

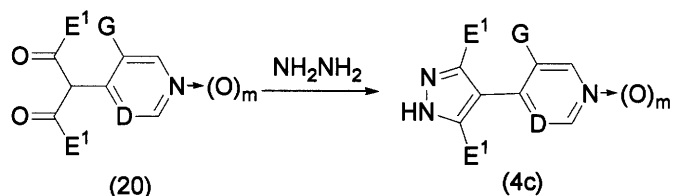
（中間体製造法３）

本発明化合物のうち、HetがH４であり、Z^１およびZ^３が－CE^１＝、Z^２が－N＝である化合物の中間体（４ｃ）は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

30

【０１７３】

【化２４】



【０１７４】

〔式中、D、G、E^１およびmは前記と同じ意味を表す。〕

40

・（４ｃ）の製造

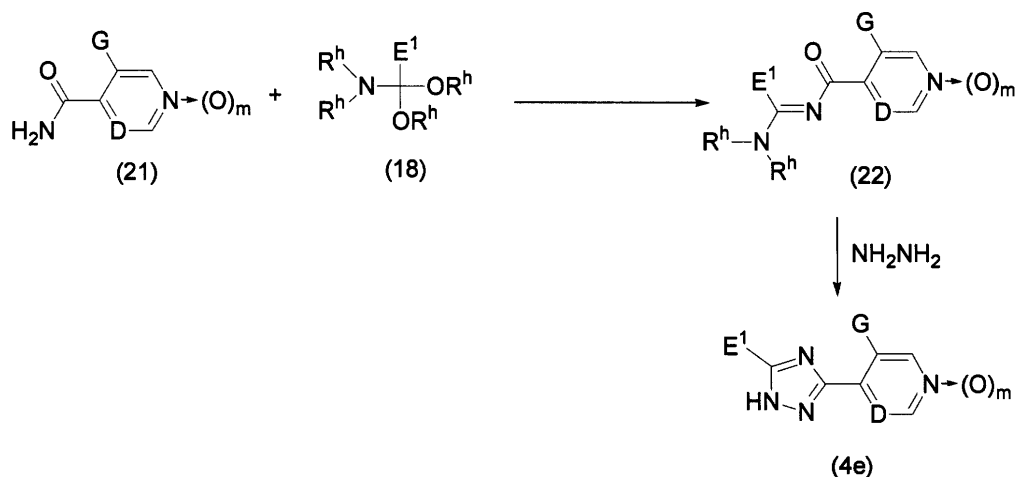
化合物（４ｃ）は中間体製造法２に記載した化合物（１９）から化合物（４ｂ）の製造方法あるいはそれに準じた方法で製造できる。

（中間体製造法４）

本発明化合物のうち、HetがH４であり、Z^１、Z^２およびZ^３が－N＝である化合物の中間体（４ｅ）は、例えば、下記のスキームにしたがって製造することができる。

【０１７５】

【化 2 5】



10

【0176】

〔式中、D、G、E¹、R^jおよびmは前記と同じ意味を表す。〕

・ (21) → (18)

該反応は中間体製造法2に記載した化合物(17)から化合物(18)の製造方法あるいはそれに準じた方法で製造できる。

20

・ (22) → (4e)

化合物(4e)は化合物(22)とヒドラジンを反応させることにより製造することができる。

【0177】

該反応に用いられる溶媒としては、例えば酢酸が挙げられる。

【0178】

化合物(22)1モルに対してヒドラジン化合物は通常1モルの割合で用いられるが、適宜変更することができる。

【0179】

化合物(22)とヒドラジン化合物との反応における反応温度は通常0℃から溶媒の沸点の範囲であり、反応時間は0.1時間から24時間の範囲である。

30

【0180】

反応終了後は、通常の後処理操作をすることにより、化合物(4e)を単離することができる。

【0181】

本発明化合物中には、例えば塩酸塩、硝酸塩、硫酸塩、臭化水素酸塩、リン酸塩、炭酸塩、酢酸塩、乳酸塩、クエン酸塩などの酸付加塩を形成させ得る化合物も存在する。それらの酸付加塩の製造も常法に従うことができ、本発明はこれらの酸付加塩をも包含する。

【0182】

本発明化合物が効力を有する有害生物としては、例えば、有害昆虫類や有害ダニ類等の有害節足動物、線形動物及び軟体動物が挙げられる。かかる有害生物としては、具体的には、例えば、以下のものが挙げられる。

40

【0183】

半翅目害虫：ヒメトビウンカ(Laodelphax striatellus)、トビイロウンカ(Nilaparvata lugens)、セジロウンカ(Sogatella furcifera)等のウンカ類、ツマグロヨコバイ(Nephotettix cincticeps)、タイワンツマグロヨコバイ(Nephotettix virescens)、チャノミドリヒメヨコバイ(Empoasca onukii)等のヨコバイ類、ワタアブラムシ(Aphis gossypii)、モモアカアブラムシ(Myzus persicae)、ダイコンアブラムシ(Brevicoryne brassicae)、ユキヤナギアブラムシ(Aphis spiraeicola)、チ

50

ユーリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterum pruni*) 等のアブラムシ類、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavetus*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*) 等のカメムシ類、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*) 等のコナジラミ類、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis pernicio* *sa*)、シトラススノースケール (*Unaspis citri*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinis*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*) 等のカイガラムシ類、グンバイムシ類、トコジラミ (*Cimex lectularius*) 等のトコジラミ類、及びキジラミ類等。

10

20

【0184】

鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、サンカメイガ (*Tryporyza incertulas*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ワタノメイガ (*Notarcha derogata*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*) 等のメイガ類、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、タマナギンウバ (*Plusia nigrisigna*)、トリコプルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、アドキソフィエス属、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、アズキサヤムシガ (*Matsumuraeses azukivora*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、コドリング (*Cydia pomonella*) 等のハマキガ類、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoneella*) のホソガ類、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*) 等のシンクイガ類、リオネティス属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユーブロクティス属等のドクガ類、コナガ (*Plutella xylostella*) 等のスガ類、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*) ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*) 等のキバガ類、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ類、及びイガ (*Tinea translucens*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 等のヒロズコガ類等。

30

40

【0185】

アザミウマ目害虫：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occi*

50

dentalis)、ミナミキイロアザミウマ(Thrips parmi)、チャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalis)、ネギアザミウマ(Thrips tabaci)、ヒラズハナアザミウマ(Frankliniella intonsa)などのアザミウマ類等。

【0186】

双翅目害虫：アカイエカ(Culex pipiens pallens)、コガタアカイエカ(Culex tritaeniorhynchus)、ネッタイエカ(Culex quinquefasciatus)等のイエカ類、ネッタイシマカ(Aedes aegypti)、ヒトスジシマカ(Aedes albopictus)等のエーデス属、シナハマダラカ(Anopheles sinensis)等のアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ(Musca domestica)、オオイエバエ(Musca stabulans)等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ(Delia platura)、タマネギバエ(Delia antiqua)等のハナバエ類、イネハモグリバエ(Agromyza oryzae)、イネヒメハモグリバエ(Hydrellia griseola)、トマトハモグリバエ、(Liriomyza sativae)、マメハモグリバエ(Liriomyza trifolii)、ナモグリバエ(Chromatomyia horticola)等のハモグリバエ類、イネキモグリバエ(Chlorops oryzae)等のキモグリバエ類、ウリミバエ(Dacus cucurbitae)、チチュウカイミバエ(Ceratitidis capitata)等のミバエ類、ショウジョウバエ類、オオキモンノミバエ(Megaselia spiracularis)等のノミバエ類、オオチョウバエ(Clogmia albipunctata)等のチョウバエ類、ブユ類、ウシアブ(Tabanus trigonus)等のアブ類、及びサシバエ類等。

【0187】

鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム(Diabrotica virgifera virgifera)、サザンコーンルートワーム(Diabrotica undecimpunctata howardi)等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ(Anomala cuprea)、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、マメコガネ(Popillia japonica)等のコガネムシ類、メイヅウィービル(Sitophilus zeamais)、イネミズゾウムシ(Lissorhoptrus oryzophilus)、アズキゾウムシ(Callosobruchus chinenensis)、イネゾウムシ(Echinocnemus squameus)、ワタミゾウムシ(Anthrenus grandis)、シバオサゾウムシ(Sphenophorus venatus)等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ(Tenebrio molitor)、コクヌストモドキ(Tribolium castaneum)等のゴミムシダマシ類、イネドロオイムシ(Oulema oryzae)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、キスジノミハムシ(Phyllotreta striolata)、コロラドハムシ(Leptinotarsa decemlineata)等のハムシ類、ヒメマルカツオブシムシ(Anthrenus verbasci)、ハラジロカツオブシムシ(Dermestes maculatus)等のカツオブシムシ類、タバコシバンムシ(Lasioderma serricorne)等のシバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintioctopunctata)等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、マツノキクイムシ(Tomicus piniperda)等のキクイムシ類、ナガシンクイムシ類、ヒョウホンムシ類、ゴマダラカミキリ(Anoplophora malasiaca)等のカミキリムシ類、コメツキムシ類(Agriontes spp.)、及びアオバアリガタハネカクシ(Paederus fuscipes)等。

【0188】

直翅目害虫：トノサマバッタ(Locusta migratoria)、ケラ(Gr

10

20

30

40

50

yllotalpa africana)、コバネイナゴ (Oxya yezoensis)、ハネナガイナゴ (Oxya japonica)、及びコオロギ類等。

【0189】

隠翅目害虫：ネコノミ (Ctenocephalides felis)、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、ヒトノミ (Pulex irritans)、ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis) 等。

【0190】

シラミ目害虫：コロモジラミ (Pediculus humanus corporis)、ケジラミ (Phthirus pubis)、ウシジラミ (Haematopinus eurysternus)、ヒツジジラミ (Dalmalinia ovis)、ブタジラミ (Haematopinus suis) 等。

【0191】

膜翅目害虫：イエヒメアリ (Monomorium pharaonis)、クロヤマアリ (Formica fusca japonica)、ルリアリ (Ochetellus glaber)、アミメアリ (Pristomyrmex pungens)、オオズアリ (Pheidole noda)、ハキリアリ (Acromyrmex spp.)、ファイヤーアント (Solenopsis spp.) 等のアリ類、スズメバチ類、アリガタバチ類、カブラハバチ (Athalia rosae)、ニホンカブラバチ (Athalia japonica) 等のハバチ類等。

【0192】

ゴキブリ目害虫：チャバネゴキブリ (Blattella germanica)、クロゴキブリ (Periplaneta fuliginosa)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、トビイロゴキブリ (Periplaneta brunnea)、トウヨウゴキブリ (Blatta orientalis) 等。

【0193】

シロアリ目害虫：ヤマトシロアリ (Reticulitermes speratus)、イエシロアリ (Coptotermes formosanus)、アメリカカンザイシロアリ (Incisitermes minor)、ダイコクシロアリ (Cryptotermes domesticus)、タイワンシロアリ (Odontotermes formosanus)、コウシュンシロアリ (Neotermes koshunensis)、サツマシロアリ (Glyptotermes satsumensis)、ナカジマシロアリ (Glyptotermes nakajimai)、カタンシロアリ (Glyptotermes fuscus)、コダマシロアリ (Glyptotermes kodamai)、クシモトシロアリ (Glyptotermes kushimensis)、オオシロアリ (Hodotermopsis japonica)、コウシュウイエシロアリ (Coptotermes guangzhouensis)、アマミシロアリ (Reticulitermes miyatakei)、キアシシロアリ (Reticulitermes flaviceps amamianus)、カンモンシロアリ (Reticulitermes sp.)、タカサゴシロアリ (Nasutitermes takasagoensis)、ニトベシロアリ (Pericapritermes nitobei)、ムシャシロアリ (Sinocapritermes mushae)、Reticulitermes flavipes、Reticulitermes hesperus、Reticulitermes virginicus、Reticulitermes tibialis、Heterotermes aureus、Zootermopsis nevadensis 等。

【0194】

ダニ目害虫：ナミハダニ (Tetranychus urticae)、カンザワハダニ (Tetranychus kanzawai)、ミカンハダニ (Panonychus citri)、リンゴハダニ (Panonychus ulmi)、オリゴニカス属等のハダニ類、ミカンサビダニ (Aculops pelekassi)、リュウキュウミ

10

20

30

40

50

カンサビダニ (*Phyllocoptiruta citri*)、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、チャノサビダニ (*Calacar carinatus*)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、リングサビダニ (*Aculus schlechtendali*) 等のフシダニ類、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) 等のホコリダニ類、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*) 等のヒメハダニ類、ケナガハダニ類、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanicus*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、ブラックレグドチック (*Ixodes scapularis*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) 等のマダニ類、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ハウレンソウケナガコナダニ (*Tyrophagus similis*) 等のコナダニ類、コナヒョウヒダニ (*Dermatophagoidea farinae*)、ヤケヒョウヒダニ (*Dermatophagoidea pteromyssus*) 等のヒョウヒダニ類、ホソツメダニ (*Cheyletus eruditus*)、クワガタツメダニ (*Cheyletus malaccensis*)、ミナミツメダニ (*Cheyletus moorei*) 等のツメダニ類、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylvarum*)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等のワクモ類、アオツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*) 等のツツガムシ類、及びカバキコマチグモ (*Chiracanthium japonicum*)、セアカゴケグモ (*Latrodectus hasselti*) 等のクモ類等。

【0195】

唇脚綱類：ゲジ (*Thereuonema hilgendorfi*)、トビズムカデ (*Scolopendra subspinipes*) 等。

【0196】

倍脚綱類：ヤケヤスデ (*Oxidus gracilis*)、アカヤスデ (*Nedyopus tambanus*) 等。

【0197】

等脚目類：オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*) 等。

【0198】

腹足綱類：チャコウラナメクジ (*Limax marginatus*)、キイロコウラナメクジ (*Limax flavus*) 等。

【0199】

線虫類：イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*) 等。

【0200】

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物と不活性担体とを含有する。本発明の有害生物防除剤は、通常、本発明化合物と固体担体、液体担体、ガス状担体等の不活性担体とを混合し、必要に応じて界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、乳剤、油剤、粉剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤、

10

20

30

40

50

樹脂製剤等に製剤化されている。

【0201】

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物を通常0.01～95重量%含有する。

【0202】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類（カオリンクレイ、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレイ、酸性白土等）、合成含水酸化珪素、タルク、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等）、化学肥料（硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等）等の微粉末及び粒状物等があげられる。

【0203】

液体担体としては、例えば水、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、フェノキシエタノール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、エチルベンゼン、ドデシルベンゼン、フェニルキシリルエタン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸エチル、アジピン酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソブチル、プロピレングリコールモノメチルエーテルアセテート等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、3-メトキシ-3-メチル-1-ブタノール等）、酸アミド類（N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等）、スルホキシド類（ジメチルスルホキシド等）、炭酸プロピレン及び植物油（大豆油、綿実油等）が挙げられる。

【0204】

ガス状担体としては、例えばフルオロカーボン、ブタンガス、LPG（液化石油ガス）、ジメチルエーテル及び炭酸ガスがあげられる。

【0205】

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル、等の非イオン界面活性剤、及びアルキルスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキル硫酸塩当の陰イオン界面活性剤が挙げられる。

【0206】

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤、着色剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼイン、ゼラチン、糖類（でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ベントナイト、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）、PAP（酸性りん酸イソプロピル）、BHT（2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）、BHA（2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物）が挙げられる。

【0207】

本発明の有害生物防除方法は、本発明化合物の有効量を有害生物に直接、及び／又は、有害生物の生息場所（植物体、土壌、家屋内、動物体等）に施用することにより行われる。本発明の有害生物防除方法には、本発明化合物が通常本発明の有害生物防除剤の形態で用いられる。

【0208】

本発明の有害生物防除剤を農業分野の有害生物防除に用いる場合、その施用量は10000m²あたりの本発明化合物量で1～10000gである。本発明の有害生物防除剤が

10

20

30

40

50

乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常、有効成分濃度が0.01～10000ppmとなるように水で希釈して施用し、粒剤、粉剤等は、通常、そのまま施用する。

【0209】

これらの製剤や製剤の水希釈液は、有害生物または有害生物から保護すべき作物等の植物に直接散布処理してもよく、また耕作地の土壤に生息する有害生物を防除するために、該土壤に処理してもよい。

【0210】

また、シート状やひも状に加工した樹脂製剤を作物に巻き付ける、作物近傍に張り渡す、株元土壤に敷く等の方法により処理することもできる。

10

【0211】

本発明の有害生物防除剤を家屋内に生息する有害生物の防除に用いる場合、その施用量は、面上に処理する場合は処理面積1m²あたりの本発明化合物量で、通常、0.01～1000mgであり、空間に処理する場合は処理空間1m³あたりの本発明化合物量で、通常、0.01～500mgである。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常有効成分濃度が0.1～1000ppmとなるように水で希釈して施用し、油剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤等はそのまま施用する。

【0212】

本発明の有害生物防除剤は、下記「作物」が栽培されている農地で使用することができる。

20

【0213】

農作物：トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等。

【0214】

野菜；ナス科野菜（ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス）、セリ科野菜（ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等）、アカザ科野菜（ハウレンソウ、フダンソウ等）、シソ科野菜（シソ、ミント、バジル等）、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等。

30

【0215】

果樹：仁果類（リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等）、液果類（ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等）、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ、アブラヤシ等。

【0216】

果樹以外の樹木：チャ、クワ、花木類（サツキ、ツバキ、アジサイ、サザンカ、シキミ、サクラ、ユリノキ、サルスベリ、キンモクセイ等）、街路樹（トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチョウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ、ニレ、トチノキ等）、サンゴジュ、イヌマキ、スギ、ヒノキ、クロトン、マサキ、カナメモチ、等。

40

【0217】

芝生：シバ類（ノシバ、コウライシバ等）、バミューダグラス類（ギョウギシバ等）、ベントグラス類（コヌカグサ、ハイコヌカグサ、イトコヌカグサ等）、ブルーグラス類（ナガハグサ、オオスズメノカタビラ等）、フェスク類（オニウシノケグサ、イトウシノケグサ、ハイウシノケグサ等）、ライグラス類（ネズミムギ、ホソムギ等）、カモガヤ、

50

オオアワガエリ等。

【0218】

その他：花卉類（バラ、カーネーション、キク、トルコギキョウ、カスミソウ、ガーベラ、マリーゴールド、サルビア、ペチュニア、バーベナ、チューリップ、アスター、リンドウ、ユリ、パンジー、シクラメン、ラン、スズラン、ラベンダー、ストック、ハボタン、プリムラ、ポインセチア、グラジオラス、カトレア、デージー、シンビジューム、ペゴニア等）、バイオ燃料植物（ヤトロファ、クルカス、ベニバナ、アマナズナ類、スイッチグラス、ミスカンサス、クサヨシ、ダンチク、ケナフ、キャッサバ、ヤナギ、藻類等）、観葉植物等。

【0219】

「作物」には、遺伝子組換え作物も含まれる。

【0220】

本発明の有害生物防除剤は、他の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物成長調節剤、除草剤及び共力剤と混用又は併用することができる。かかる殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物成長調節剤、除草剤及び共力剤の有効成分の例を以下に示す。

【0221】

殺虫剤の有効成分

(1) カーバメート系化合物

アラニカルブ (A l a n y c a r b)、アルジカルブ (A l d i c a r b)、ベンダイオカルブ (B e n d i o c a r b)、ベンフラカルブ (B e n f u r a c a r b)、ブトカルボキシム (B u t o c a r b o x i m)、ブトキシカルボキシム (B u t o x y c a r b o x i m)、カルバリル (C a r b a r y l = N A C)、カルボフラン (C a r b o f u r a n)、カルボスルファン (C a r b o s u l f a n)、クロエトカルブ (C l o e t h o c a r b)、エチオフエンカルブ (E t h i o f e n c a r b)、フェノブカルブ (F e n o b u c a r b = B P M C)、フェノチオカルブ (F e n o t h i o c a r b)、フォルメタネート (F o r m e t a n a t e)、フラチオカルブ (F u r a t h i o c a r b)、イソプロカルブ (I s o p r o c a r b = M I P C)、メチオカルブ (M e t h i o c a r b)、メソミル (M e t h o m y l)、メトルカルブ (M e t o l c a r b)、オキサミル (O x a m y l)、ピリミカーブ (P i r i m i c a r b)、プロポキスル (P r o p o x u r : P H C)、チオジカルブ (T h i o d i c a r b)、チオフアノクス (T h i o f a n o x)、トリアザメート (T r i a z a m a t e)、トリメサカルブ (T r i m e t h a c a r b)、XMC、及びキシリルカルブ (X y l y l c a r b)。

(2) 有機リン系化合物

アセフェート (A c e p h a t e)、アザメチホス (A z a m e t h i p h o s)、アジンホスエチル (A z i n p h o s - e t h y l)、アジンホスメチル (A z i n p h o s - m e t h y l)、カズサホス (C a d u s a f o s)、クロルエトキシホス (C h l o r e t h o x y f o s)、クロルフェンビンホス (C h l o r f e n v i n p h o s)、クロルメフォス (C h l o r m e p h o s)、クロルピリホス (C h l o r p y r i f o s)、クロルピリホスメチル (C h l o r p y r i f o s - m e t h y l)、クマフォス (C o u m a p h o s)、シアノホス (C y a n o p h o s = C Y A P)、デメトン-S-メチル (D e m e t o n - S - m e t h y l)、ダイアジノン (D i a z i n o n)、ジクロルボス (D i c h l o r v o s = D D V P)、ジクロトホス (D i c r o t o p h o s)、ジメトエート (D i m e t h o a t e)、ジメチルビンホス (D i m e t h y l v i n p h o s)、ジスルホトン (D i s u l f o t o n)、EPN、エチオン (E t h i o n)、エトプロホス (E t h o p r o p h o s)、エトリムホス (E t r i m f o s)、ファミファール (F a m p h u r)、フェナミホス (F e n a m i p h o s)、フェニトロチオン (F e n i t r o t h i o n = M E P)、フェンチオン (F e n t h i o n = M P P)、ホスチアゼート (F o s t h i a z a t e)、ヘプテノホス (H e p t e n o p h o s)、イミサイホス (I m i c y f o s)、イソフェンホス (I s o f e n p h o

10

20

30

40

50

s)、Isopropyl O-(methoxyaminothio-phosphoryl) salicylate、イソキサチオン (Isoxathion)、マラチオン (Malathion)、メカルバム (Mecarbam)、メスルフェンホス (Methidathion=DMTP)、メチダチオン (Mevinphos)、モノクロトホス (Monocrotophos)、ナレド (Naled:BRP)、オメトエート (Omethoate)、オキシデメトンメチル (Oxydemeton-methyl)、パラチオン (Parathion)、メチルパラチオン (Parathion-methyl)、フェントエート (Phenthoate=PAP)、フォレート (Phorate)、ホサロン (Phosalone)、ホスメット (Phosmet=PMP)、フォスファミドン (Phosphamidon)、ホキシム (Phoxim)、ピリミホスメチル (Pirimiphos-methyl)、プロフェノホス (Profenofos)、プロベタムホス (Propetamphos)、プロチオホス (Prothiofos)、ピラクロホス (Pyraclorfos)、ピリダフェンチオン (Pyridafenthion)、キナルホス (Quinalphos)、スルフォテップ (Sulfotep)、テブピリムホス (Tebupirimfos)、テムホス (Temephos)、テルブホス (Terbufos)、テトラクロルビンホス (Tetrachlorvinphos)、チオメトン (Thiometon)、トリアゾホス (Triazophos)、トリクロルホン (Trichlorophon=DEP)、バミドチオン (Vamidothion)、りん化アルミニウム (Aluminium phosphide)、ブタチオホス (Butathiofos)、DCIP (Dichlorodiiisopropyl ether)、ジクロフェンチオン (Dichlofenthion=ECF)、ホルモチオン (Formothion)、りん化水素 (Hydrogen phosphide)、オキシデプロホス (Oxydeprofos=ESP)、プロパホス (Propaphos)、サリチオン (Salithion)、及びスルプロホス (Sulprofos)。

(3) ピレスロイド化合物

アクリナトリン (Acrinathrin)、アレスリン (Allethrin)、ベンフルスリン (Benfluthrin)、ベーターシフルトリン (Beta-Cyfluthrin)、ビフェントリン (Bifenthrin)、シクロプロトリン (Cycloprothrin)、シフルトリン (Cyfluthrin)、シハロトリン (Cyhalothrin)、シペルメトリン (Cypermethrin)、デルタメトリン (Deltamethrin)、エスフェンバレレート (Esfenvalerate)、エトフェンプロックス (Ethofenprox)、フェンプロパトリン (Fenpropathrin)、フェンバレレート (Fenvalerate)、フルシトリネート (Flucythrinate)、フルフェンプロックス (Flufenoprox)、フルメスリン (Flumethrin)、フルバリネート (Fluvalinate)、ハルフェンプロックス (Halfenprox)、イミプロトリン (Imiprothrin)、ペルメトリン (Permethrin)、プラレトリン (Prallethrin)、ピレトリン (Pyrethrins)、レスメトリン (Resmethrin)、シグマサイパーメスリン (sigma-Cypermethrin)、シラフルオフエン (Silaflofen)、テフルトリン (Tefluthrin)、トラロメトリン (Tralomethrin)、トランスフルトリン (Transfluthrin)、テトラメトリン (Tetramethrin)、フェノトリン (Phenothrin)、シフェノトリン (Cyphenothrin)、アルファシペルメトリン (alpha-Cypermethrin)、ゼータシペルメトリン (zeta-Cypermethrin)、ラムダシハロトリン (lambda-Cyhalothrin)、ガンマシハロトリン (gamma-Cyhalothrin)、フラメトリン (Furamethrin)、タウフルバリネート (tau-Fluvalinate)、メトフルトリン (Metofluthrin)、プロフルトリン (Profluthrin)、ジメフルト

10

20

30

40

50

リン (Dimefluthrin)、プロトリフェンビュート (Prot trifenbut e)、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル (EZ)- (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル (EZ)- (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、及び2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)ベンジル (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-(2-メチル-1-プロペニル)シクロプロパンカルボキシレート等。

(4) ネライストキシン化合物

カルタップ (Cartap)、ベンスルタップ (Bensultap)、チオシクラム (Thiocyclam)、チオスルタップ (Thisultap)、モノスルタップ (Monosultap)、及びビスルタップ (Bisultap)。

10

(5) ネオニコチノイド化合物

イミダクロプリド (Imidacloprid)、ニテンピラム (Nitenpyram)、アセタミプリド (Acetamiprid)、チアメトキサム (Thiamethoxam)、チアクロプリド (Thiacloprid)、ジノテフラン (Dinotefuran)、及びクロチアニジン (Clothianidin)。

(6) ベンゾイル尿素化合物

ビストリフルロン (Bistrifluron)、クロルフルアズロン (Chlorfluaazuron)、ジフルベンズロン (Diflubenzuron)、フルシクロクスロン (Flucycloxaduron)、フルフェノクスロン (Flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (Hexaflumuron)、ルフエヌロン (Lufenuron)、ノバルロン (Novaluron)、ノビフルムロン (Noviflumuron)、テフルベンズロン (Teflubenzuron)、トリフルムロン (Triflumuron)、及びフルアズロン (fluaazuron)。

20

(7) フェニルピラゾール化合物

アセトプロール (Acetoprole)、エチプロール (Ethiprole)、フィプロニル (Fipronil)、バニリプロール (Vaniliprole)、ピリプロール (Pyriprole)、及びピラフルプロール (Pyrafluprole)。

(8) Btトキシン殺虫剤

バチルス・チューリングエンシス菌由来の生芽胞および産生結晶毒素、並びにそれらの混合物。

30

(9) ヒドラジン化合物

クロマフェノジド (Chromafenozide)、ハロフェノジド (Halofenozide)、メトキシフェノジド (Methoxyfenozide)、及びテブフェノジド (Tebufenozide)。

(10) 有機塩素化合物

アルドリン (Aldrin)、ディルドリン (Dieldrin)、ジエノクロル (Dienochlor)、エンドスルファン (Endosulfan)、メトキシクロル (Methoxychlor)、クロルデン (Chlordane)、及びDDT。

40

(11) その他の殺虫剤有効成分

マシン油 (Machine oil)、硫酸ニコチン (Nicotine-sulfate)、ニコチン (Nicotine)、アバメクチン (Abamectin)、エマメクチン安息香酸塩 (Emamectin-benzoate)、ミルベメクチン (Milbemectin)、レピメクチン (Lepimectin)、スピノサッド (Spinosad)、スピネトラム (Spinetoram)、インドキサカルブ (Indoxacarb)、メタフルミゾン (Metaflumizone)、ブプロフェジン (Buprofezin)、シロマジン (Cyromazine)、ハイドロブレン (Hydroprene)、メトブレン (Methoprene)、キノブレン (Kinoprene)、ピリプロキシフェン (Pyriproxifen)、フェノキシカルブ (Fenox

50

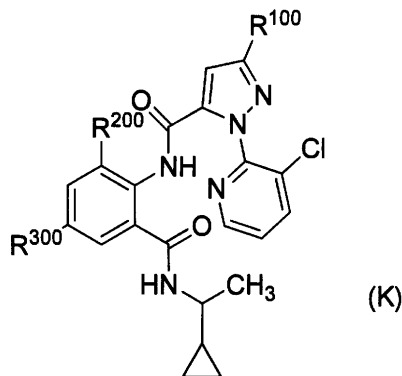
y carb)、クロルフェナピル (Chlorphenapyr)、DNOC、ジアフェンチウロン (Difenthiuron)、ピメトロジン (Pymetrozine)、フロニカミド (Flonicamid)、ピリフルキナゾン (Pyrifluquinazone)、ピリダリル (Pyridalyl)、トルフェンピラド (Tolfenpyrad)、フルリムフェン (Flurimfen)、フルフェネリム (Flufenefenrim)、スピロテトラマト (Spirotetramat)、スピロメシフェン (Spiromesifen)、スルフォキサフロール (sulfoxafloor)、クロラントラニリプロール (Chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール (Cyantraniliprole)、フルベンジアミド (Flubendiamide)、

10

下記式 (K) :

【0222】

【化26】



20

【0223】

〔式中、

R^{100} は塩素原子、臭素原子またはトリフルオロメチル基を表し、

R^{200} は塩素原子、臭素原子またはメチル基を表し、

R^{300} は塩素原子、臭素原子またはシアノ基を表す。〕

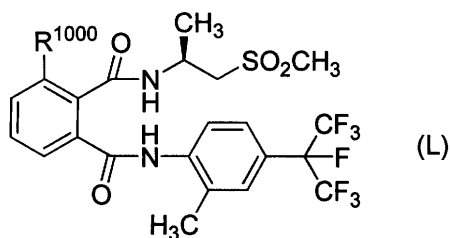
で示される化合物、

下記式 (L) :

30

【0224】

【化27】



【0225】

40

〔式中、

R^{1000} は塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子を表す。〕

で示される化合物、メトキサジアゾン (Metoxadiazon)、スルフラミド (Sulfluramid)、亜ヒ酸 (Arsenic acid)、ベンクロチアズ (Benclothiaz)、石灰窒素 (Calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤 (Calcium polysulfide)、メタム・アンモニウム (Metam-ammonium)、メタム・ナトリウム (Metam-sodium)、オレイン酸カリウム (Potassium oleate)、硫黄 (Sulfur)、及びトラロピリル (Tralopyril)。

【0226】

50

殺ダニ剤の有効成分

アセキノシル (Acequinocyl)、アミトラズ (Amitraz)、ベンゾキシメート (Benzoximate)、ビフェナゼート (Bifenaate)、ブロモプロピレート (Bromopropylate)、キノメチオネート (Chinomethionat)、クロルベンジレート (Chlorobenzilate)、CPCBS (Chlorfenson)、クロフェンテジン (Clofentezine)、シフルメトフェン (Cyflumetofen)、ジコホル (Dicofol)、エトキサゾール (Etoxazole)、フェナザキン (Fenazaquin)、酸化フェンブタスズ (Fenbutatin oxide)、フェノチオカルブ (Fenothiocarb)、フェンピロキシメート (Fenpyroximate)、フルアクリピリム (Fluacrypyrim)、ヘキシチアゾクス (Hexythiazox)、プロパルギット (Propargite=BPPS)、ポリナクチン複合体 (Polynactins)、ピリダベン (Pyridaben)、ピリミジフェン (Pyrimidifen)、テブフェンピラド (Tebufenpyrad)、テトラジホン (Tetradifon)、スピロジクロフェン (Spirodiclofen)、アミドフルメット (Amidoflumet)、及びシエノピラフェン (cyenopyrafen)。

【0227】

殺線虫剤の有効成分

臭化メチル (Methyl bromide)、D-D (1, 3-Dichloropropene)、DCIP、フォスチアゼート (Fosthiazate)、塩酸レバミゾール (Levamisol)、メチルイソチオシアネート (Methyisothiocyanate)、酒石酸モランテル (Morantel tartarate)、及びイミシアホス (Imicyafos)。

【0228】

殺菌剤の有効成分

アザコナゾール (Azaconazole)、ビテルタノール (Biterتانول)、ブロムコナゾール (Bromuconazole)、シプロコナゾール (Cyproconazole)、ジフェノコナゾール (Difenoconazole)、ジニコナゾールM (Diniconazole-M)、エポキシコナゾール (Epoxiconazole)、フェナリモル (Fenarimol)、フェンブコナゾール (Fenbuconazole)、フルシラゾール (Flusilazole)、フルキンコナゾール (Fluquinconazole)、フルトリアホル (Flutriafol)、ヘキサコナゾール (Hexaconazole)、イマザリル (Imazalil)、イミベンコナゾール (Imibenconazole)、イブコナゾール (Ibconazole)、メトコナゾール (Metconazole)、ミクロブタニル (Myclobutanil)、ヌアリモル (Nuarimol)、オキシポコナゾール (Oxpoconazole)、ペフラゾエート (Pefurazoate)、ペンコナゾール (Penconazole)、プロクロラズ (Prochloraz)、プロピコナゾール (Propiconazole)、プロチオコナゾール (Prothioconazole)、ピリフェノクス (Pyriphenox)、シメコナゾール (Simeconazole)、テブコナゾール (Tebuconazole)、テトラコナゾール (Tetraconazole)、トリアジメホン (Triadimefon)、トリアジメノール (Triadimenol)、トリフルミゾール (Triflumizole)、トリホリン (Trifolin)、トリティコナゾール (Triticonazole)、アルジモルフ (Aldimorph)、ドデモルフ (Dodemorph)、フェンプロピモルフ (Fenpropimorph)、トリデモルフ (Tridemorph)、フェンプロピジン (Fenpropidin)、ピペラリン (Piperalin)、スピロキサミン (Spiroxamine)、フェンヘキサミド (Fenhexamide)、ピリブチカルブ (Pyrabuticarb)、ナフチフィン (Naphthifine)、テルビナフィン (Terbinafine) 等のステロール生合成阻害化合物；

ベノミル (Benomyl)、カルベンダジム (Carbendazim)、フベリダゾール (Fuberidazole)、チアベンダゾール (Thiabendazole)、チオファネート (Thiophanate)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、ジエトフェンカルブ (Diethofencarb)、ゾキサミド (Zoxamide) ペンシクロン (Pencycuron)、フルオピコリド (Fluopicolide) 等の細胞分裂阻害殺菌化合物；

クロゾリネート (Chlozolinate)、イプロジオン (Iprodione)、プロシミドン (Procymidone)、ビンクロゾリン (Vinclozolin)、キノキシフェン (Quinoxifen)、プロキナジド (Proquinazid)、フェンピクロニル (Fenpiclonil)、フルジオキシソニル (Fludioxonil) 等のシグナル伝達系阻害殺菌化合物；

シプロジニル (cyprodinil)、ピリメタニル (pyrimethanil)、メパニピリム (Mepanipyrim) 等のアミノ酸生合成阻害殺菌化合物；
メタラキシル (Metalaxyl)、ベナラキシル (Benalaxyl)、オキシロニック酸 (Oxolinic acid) 等の核酸生合成阻害殺菌化合物；

イソプロチオラン (Isoprothiolane)、イプロベンホス (Iprobenfos)、トルクロホスメチル (Tolclofos-methyl)、プロチオカルブ (Prothiocarb)、ジメトモルフ (Dimethomorph)、ベンチアバリカルブイソプロピル (Benthiavalicarb-isopropyl)、イプロバリカルブ (Iprovalicarb)、マンジプロパミド (Mandipropamid) 等の脂質・膜合成阻害殺菌化合物；

ジクロシメット (Diclocymet)、カルプロパミド (Carpropamid)、フェノキサニル (Fenoxanil)、フサライド (Fthalide)、トリシクラゾール (Tricyclazole)、ピロキロン (Pyroquilon) 等のメラニン生合成阻害殺菌化合物；

アゾキシストロビン (Azoxystrobin)、ジモキシストロビン (Dimoxystrobin)、エネストロビン (Enestrobin)、フルオキサストロビン (Fluoxastrobin)、クレソキシムメチル (Kresoxim-methyl)、メトミノストロビン (Metominostrobin)、オリサストロビン (Orysastrobin)、ピコキシストロビン (Picoxystrobin)、ピラクロストロビン (Pyraclostrobin)、ピリベンカルブ (Pyribencarb) トリフロキシストロビン (Trifloxystrobin) 等のストロビルリン殺菌化合物；

カルボキシシン (Carboxin)、オキシカルボキシシン (Oxycarboxin)、メプロニル (Mepronil)、フルトラニル (Flutoranil)、フラメトピル (Furametopyr)、チフルザミド (Thi fluzamide)、ボスカリド (Boscalid)、ペンチオピラド (Penthiopyrad)、フルオピラム (Fluopyram)、ビキサフェン (Bixafen)、イソピラザム (Isopyrazam)、ペンフルフェン (Penflufen)、セダキサン (Sedaxan)、フルキサピロキサド (Fluxapyroxad) 等のアニリド系殺菌化合物；

アシベンゾラル S メチル (Acibenzolar-S-methyl)、プロベナゾール (Probenazole)、チアジニル (Tiadinil)、イソチアニル (Isotianil) 等の抵抗性誘導化合物；

バリダマイシン A (Validamycin A)、ポリオキシシン B (Polyoxin B) 等のグルカン合成阻害殺菌化合物；

ブラストサイジン S (Blastcidin-S)、カスガマイシン (Kasugamycin)、ストレプトマイシン (Streptomycin) 等のタンパク質生合成阻害殺菌化合物；

チウラム (Thiuram)、マンコゼブ (Mancozeb)、クロロタロニル (Chlorothalonil)、キャプタン (Captan)、ジクロフルアニド (Di

10

20

30

40

50

chllofluaniid)、フォルペット (Folpet)、イミノクタジン (Imin octadine)、ジラム (Ziram) 等のマルチサイト接触活性の殺菌化合物；アミスルブロム (Amisulbrom)；シアゾファミド (Cyazofamid)；フェリムゾン (Ferimzone)；フルアジナム (Fluazinam)；ビナパクリル (Binapacryl)；ジノカップ (Dinocap)；ファモキサドン (Famoxadone)；フェナミドン (Fenamidon)；エタボキサム (Ethaboxam)；メトラフェノン (Metrafenone)；シフルフェナミド (Cyflufenamid) 等。

【0229】

除草剤の有効成分

10

(1) フェノキシ脂肪酸除草性化合物

2, 4-PA、MCP、MCPB、フェノチオール (Phenothiol)、メコプロップ (Mecoprop)、フルロキシピル (Fluroxypyr)、トリクロピル (Triclopyr)、クロメプロップ (Clomeprop)、及びナプロアニリド (Naproanilide)。

(2) 安息香酸除草性化合物

2, 3, 6-TBA、ジカンバ (Dicamba)、クロピラリド (Clopyralid)、ピクロラム (Picloram)、アミノピラリド (Aminopyralid)、キンクロラック (Quinclorac)、及びキンメラック (Quinmerac)。

20

(3) 尿素除草性化合物

ジウロン (Diuron)、リニュロン (Linuron)、クロルトロン (Chlortoluron)、イソプロツロン (Isoproturon)、フルオメツロン (Fluometuron)、イソウロン (Isouron)、テブチウロン (Tebuthiuron)、メタベンズチアズロン (Methabenzthiazuron)、クミルロン (Cumyluron)、ダイムロン (Daimuron)、及びメチルダイムロン (Methyl-daimuron)。

(4) トリアジン除草性化合物

アトラジン (Atrazine)、アメトリン (Ametoryn)、シアナジン (Cyanazine)、シマジン (Simazine)、プロパジン (Propazine)、シメトリン (Simetryn)、ジメタメトリン (Dimethametryn)、プロメトリン (Prometryn)、メトリブジン (Metribuzin)、トリアジフラム (Triaziflam)、及びインダジフラム (Indaziflam)。

30

(5) ビピリジニウム除草性化合物

パラコート (Paraquat)、及びジクワット (Diquat)。

(6) ヒドロキシベンゾニトリル除草性化合物

ブロモキシニル (Bromoxynil)、及びアイオキシニル (Ioxynil)。

(7) ジニトロアニリン除草性化合物

ペンディメタリン (Pendimethalin)、プロジアミン (Prodiamine)、及びトリフルラリン (Trifluralin)。

40

(8) 有機リン除草性化合物

アミプロホスメチル (Amiprofos-methyl)、ブタミホス (Butamifos)、ベンスリド (Bensulide)、ピペロホス (Piperophos)、アニロホス (Anilofos)、グリホサート (Glyphosate)、グルホシネート (Glufosinate)、グルホシネート-P (Glufosinate-P)、及びビアラホス (Bialaphos)。

(9) カーバメート除草性化合物

ジアレート (Di-allate)、トリアレート (Tri-allate)、EPTC、ブチレート (Butylate)、ベンチオカーブ (Benthocarb)、エスプロカルブ (Esprocarb)、モリネート (Molinate)、ジメピペレー

50

ト (Dimepiperate)、スエップ (Swep)、クロルプロファム (Chlorpropham)、フェンメディファム (Phenmedipham)、フェニソファム (Phenisopham)、ピリブチカルブ (Pyributicarb)、及びアシュラム (Asulam)。

(10) 酸アミド除草性化合物

プロパニル (Propanil)、プロピザミド (Propyzamide)、ブロモブチド (Bromobutide)、及びエトベンザニド (Etobenzanid)。

(11) クロロアセトアニリド除草性化合物

アセトクロール (Acetochlor)、アラクロール (Alachlor)、ブタクロール (Butachlor)、ジメテナミド (Dimethenamid)、プロパクロール (Propachlor)、メタザクロール (Metazachlor)、メトラクロール (Metolachlor)、プレチラクロール (Pretilachlor)、テニルクロール (Thenylchlor)、及びペトキサミド (Pethoxamid)。

(12) ジフェニルエーテル除草性化合物

アシフルオルフェン (Acifluorfen-sodium)、ビフェノックス (Bifenox)、オキシフルオルフェン (Oxyfluorfen)、ラクトフェン (Lactofen)、フォメサフェン (Fomesafen)、クロメトキシニル (Chlometoxynil)、及びアクロニフェン (Aclonifen)。

(13) 環状イミド除草性化合物

オキサジアゾン (Oxadiazon)、シニドンエチル (Cinidon-ethyl)、カルフェントラゾンエチル (Carfentrazone-ethyl)、スルフェントラゾン (Surfentrazone)、フルミクロラックペンチル (Flumiclorac-pentyl)、フルミオキサジン (Flumioxazin)、ピラフルフェンエチル (Pyraflufen-ethyl)、オキサジアルギル (Oxadialargyl)、ペントキサゾン (Pentoxazone)、フルチアセットメチル (Fluthiacet-methyl)、ブタフェナシル (Butafenacil)、ベンズフェンジゾン (Benzfendizone)、ベンカルバゾン (Bencarbazone)、及びサフルフェナシル (Saflufenacil)。

(14) ピラゾール除草性化合物

ベンゾフェナップ (Benzofenap)、ピラゾレート (Pyrazolate)、ピラゾキシフェン (Pyrazoxyfen)、トプラメゾン (Topramezone)、及びピラスルホトール (Pyrasulfotole)。

(15) トリケトン除草性化合物

イソキサフルトール (Isoxaflutole)、ベンゾビシクロン (Benzobicyclon)、スルコトリオン (Sulcotrione)、メソトリオン (Mesotrione)、テンボトリオン (Tembotrione)、及びテフルリトリオン (Tefuryltrione)。

(16) アリールオキシフェノキシプロピオン酸除草性化合物

クロジナホッププロパルギル (Clodinafop-propargyl)、シハロホップブチル (Cyhalofop-butyl)、ジクロホップメチル (Diclofop-methyl)、フェノキサプロップエチル (Fenoxaprop-ethyl)、フルアジホップブチル (Fluazifop-butyl)、ハロキシホップメチル (Haloxypop-methyl)、キザロホップエチル (Quizalofop-ethyl)、及びメタミホップ (Metamifop) 及び。

(17) トリオンオキシム除草性化合物

アロキシジム (Alloxydim-sodium)、セトキシジム (Sethoxydim)、ブトロキシジム (Butroxydim)、クレソジム (Clethodim)、クロプロキシジム (Cloproxydim)、シクロキシジム (Cycloxydim)、テプラロキシジム (Tepraloxym)、トラルコキシジム (Tral

10

20

30

40

50

k oxydim)、及びプロフォキシジム (Profoxydim)。

(18) スルホニル尿素除草性化合物

クロルスルフロン (Chlorsulfuron)、スルホメツロンメチル (Sulfometuron-methyl)、メトスルフロンメチル (Metsulfuron-methyl)、クロリムロンエチル (Chlorimuron-ethyl)、トリベニューロンメチル (Tribenuron-methyl)、トリアスルフロン (Triasulfuron)、ベンスルフロンメチル (Bensulfuron-methyl)、チフェンスルフロンメチル (Thifensulfuron-methyl)、ピラズスルフロンエチル (Pyrazosulfuron-ethyl)、プリミスルフロンメチル (Primisulfuron-methyl)、ニコスルフロン (Nicosulfuron)、アミドスルフロン (Amidosulfuron)、シノスルフロン (Cinosulfuron)、イマゾスルフロン (Imazosulfuron)、リムスルフロン (Rimsulfuron)、ハロスルフロンメチル (Halosulfuron-methyl)、プロスルフロン (Prosulfuron)、エタメトスルフロンメチル (Ethametsulfuron-methyl)、トリフルスルフロンメチル (Triflusaluron-methyl)、フラザスルフロン (Flazasulfuron)、シクロスルファミロン (Cyclosulfamuron)、フルピルスルフロン (Flupyralsulfuron)、スルホスルフロン (Sulfosulfuron)、アジムスルフロン (Azimsulfuron)、エトキシスルフロン (Ethoxysulfuron)、オキサスルフロン (Oxasulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (Iodosulfuron-methyl-sodium)、フォラムスルフロン (Foramsulfuron)、メソスルフロンメチル (Mesosulfuron-methyl)、トリフロキシスルフロン (Trifloxysulfuron)、トリトスルフロン (Tritosulfuron)、オルソスルファミロン (Orthosulfamuron)、フルセトスルフロン (Flucetosulfuron)、及びプロピリスルフロン (Propyrisulfuron)。

10

20

(19) イミダゾリノン除草性化合物

イマザメタバズメチル (Imazamethabenz-methyl)、イマザメタピル (Imazamethapyr)、イマザモックス (Imazamox)、イマザピル (Imazapyr)、イマザキン (Imazaquin)、イマゼタピル (Imazethapyr) 等。

30

(20) スルホンアミド除草性化合物

フルメトスラム (Flumetsulam)、メトスラム (Metosulam)、ジクロスラム (Diclosulam)、フロラスラム (Florasulam)、クロランスラムメチル (Cloransulam-methyl)、ペノキススラム (Penoxsulam)、及びピロキススラム (Pyroxsulam)。

(21) ピリミジニルオキシ安息香酸除草性化合物

ピリチオバックナトリウム (Pyriithiobac-sodium)、ビスピリバックナトリウム (Bispyribac-sodium)、ピリミノバックメチル (Pyriminobac-methyl)、ピリベンゾキシム (Pyribenzoxim)、ピリフタリド (Pyriftalid)、及びピリミスルファン (Pyrimisulfan)。

40

(22) その他の除草性化合物

ベンタゾン (Bentazon)、ブロマシル (Bromacil)、ターバシル (Terbacil)、クロルチアミド (Chlorthiamid)、イソキサベン (Is oxaben)、ジノセブ (Dinoseb)、アミトロール (Amitrole)、シンメチリン (Cinmethylin)、トリジファン (Tridiphane)、ダラポン (Dalapon)、ジフルフェンゾピルナトリウム (Diflufenzopyr-sodium)、ジチオピル (Dithiopyr)、チアゾピル (Thiazopyr)、フルカルバゾンナトリウム (Flucarbazone-sodium)、プロポ

50

キシカルバゾンナトリウム (Propoxycarbazone-sodium)、メフェナセツ (Mefenacet)、フルフェナセツ (Flufenacet)、フェントラザミド (Fentr azamide)、カフェンストロール (Cafenstro le)、インダノファン (Indanofan)、オキサジクロメホン (Oxazic lomefone)、ベンフレセート (Benfuresate)、ACN、ピリデート (Pyridate)、クロリダゾン (Chloridazon)、ノルフルラゾン (Nor flurazon)、フルルタモン (Flurtamone)、ジフルフェニカン (D iflufenican)、ピコリナフェン (Picolinafen)、ベフルブタミド (Beflubutamid)、クロマゾン (Clomazone)、アミカルバゾン (Amicarbazone)、ピノキサデン (Pinoxaden)、ピラクロニル (Pyraclonil)、ピロキサスルホン (Pyroxasulfone)、チエンカルバゾンメチル (Thiencarbazone-methyl)、アミノシクロピラクロール (Aminocyclopyrachlor)、イプフェンカルバゾン (Ipfe ncarbazone)、及びメチオゾリン (Methiozolin)。

共力剤の有効成分

ピペロニル ブトキサイド (Piperonyl butoxide)、セサメックス (Sesame x)、スルホキシド (Sulfoxide)、N-(2-エチルヘキシル)-8, 9, 10-トリノルボルン-5-エン-2, 3-ジカルボキシイミド (MGK 264)、N-デクリイミダゾール (N-Declyimidazole)、WARF-アンチレジスタント (WARF-antiresistant)、TBPT、TPP、IBP、PSCP、ヨウ化メチル (CH₃I)、t-フェニルブテノン (t-Phenylbutenone)、ジエチルマレエート (Diethylmaleate)、DMC、FDMC、ETP、及びETN。

【実施例】

【0230】

以下、製造例、製剤例、試験例等により本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。

【0231】

まず、本発明化合物の製造例を以下に示す。

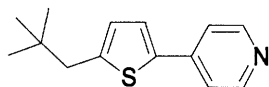
【0232】

製造例 1

4-(5-ネオペンチルチオフェン-2-イル)-ピリジン (化合物 1-18) の製造

【0233】

【化 28】



【0234】

(1) 1-(5-ブロモチオフェン-2-イル)-2, 2-ジメチルプロパン-1-オール 2.08 g、4-ピリジンボロン酸 1.13 g、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム塩化メチレン錯体 0.34 g、りん酸三カリウム n水和物 8.85 g および 1, 4-ジオキサン 16 mL の混合物を 3 時間還流した。放冷した反応混合物に酢酸エチルと水を注加した後、セライト濾過した。水層を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に濃縮後、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、2, 2-ジメチル-1-(5-ピリジン-4-イル-チオフェン-2-イル)-プロパン-1-オール 0.61 g を得た。

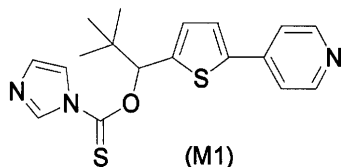
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 1.02 (9H, s), 2.29 (1H, br s), 4.66 (1H, d), 6.95 (1H, d), 7.38 (1H, d), 7.45 (2H, dd), 8.56 (2H, dd).

(2) 2, 2-ジメチル-1-(5-ピリジン-4-イル-チオフェン-2-イル)-ブ

ロパンー１－オール 0.61 g、1, 1'－チオカルボニルジイミダゾール 0.87 g、4－ジメチルアミノピリジン 30 mg およびトルエン 18 ml の混合物を 8 時間還流した。放冷した反応混合物に酢酸エチルとメタノールを加え、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に濃縮後、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式

【0235】

【化29】



10

【0236】

で示される化合物 (M1) 0.55 g を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 1.19 (9H, s), 4.97 (1H, s), 7.07-7.09 (2H, m), 7.34 (1H, d), 7.42-7.46 (3H, m), 8.18 (1H, s), 8.58 (2H, dd).

(3) 化合物 (M1) 0.55 g、水素化トリブチルスズ 0.62 ml、2, 2'－アゾビス(2－メチルプロピオニトリル) 38 mg およびトルエン 30 ml の混合物を 2 時間還流した。放冷した反応混合物に 1 規定塩酸を加え分液した。水層をトルエンで洗浄した後、水酸化ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチルで抽出した有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4－(5－ネオペンチルチオフェン－2－イル)－ピリジン 0.21 g を得た。

20

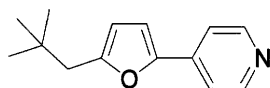
【0237】

製造例 2

4－(5－ネオペンチルフラン－2－イル)－ピリジン (化合物 2－18) の製造

【0238】

【化30】



30

【0239】

(1) 2, 5－ジブロモフラン 2.50 g とテトラヒドロフラン 100 ml との混合物に、－78℃で、n－ブチルリチウム (1.6 M のヘキサン溶液) 7.8 ml を滴下後、－78℃で 1 時間攪拌した。次に、－70℃で、トリメチルアセトアルデヒド 1.80 ml を滴下した。－10℃まで昇温し、飽和塩化アンモニウム水溶液を反応液に注加した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、1－(5－ブロモフラン－2－イル)－2, 2－ジメチルプロパン－1－オール 1.83 g を得た。

40

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 0.97 (9H, s), 4.32 (1H, d), 6.21 (1H, d), 6.25 (1H, d).

(2) 1－(5－ブロモフラン－2－イル)－2, 2－ジメチルプロパン－1－オール 1.83 g、4－ピリジンボロン酸 1.06 g、[1, 1'－ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム塩化メチレン錯体 0.32 g、りん酸三カリウム n 水和物 8.33 g および 1, 4－ジオキサン 13 mL の混合物を 4 時間還流した。放冷した反応混合物に酢酸エチルと水を注加した後、セライト濾過した。水層を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に濃縮後、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、2, 2－ジメチル－1－(5－ピリジン－4－イル－フラン－2－イル)－プロパン－1－オール 0.98 g を得た。

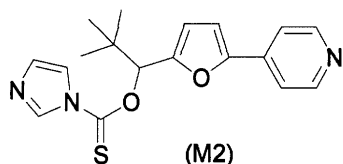
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 1.02 (9H, s), 2.08 (1H, br s), 4.45 (1H, d), 6.38 (1H, d), 6.84 (1H, d), 7.47 (2H, dd), 8.58 (2H, dd).

50

(3) 2, 2-ジメチル-1-(5-ピリジン-4-イル-フラン-2-イル)-プロパン-1-オール 0.98 g、1, 1'-チオカルボニルジイミダゾール 0.58 g、4-ジメチルアミノピリジン 26 mg およびトルエン 20 ml の混合物を2時間還流した。放冷した反応混合物に酢酸エチルとメタノールを加え、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に濃縮後、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式

【0240】

【化31】



10

【0241】

で示される化合物 (M2) 0.71 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.09 (9H, s), 6.15 (1H, d), 6.29 (1H, d), 6.78-6.81 (2H, m), 7.18 (1H, d), 7.46-7.49 (3H, m), 8.58 (2H, dd).

(4) 化合物 (M2) 0.71 g、水素化トリブチルスズ 0.83 ml、2, 2'-アゾビス(2-メチルプロピオニトリル) 51 mg およびトルエン 20 ml の混合物を4時間還流した。放冷した反応混合物に1規定塩酸を加え分液した。水層をトルエンで洗浄した後、水酸化ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチルで抽出した有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(5-ネオペンチルフラン-2-イル)-ピリジン 0.12 g を得た。

20

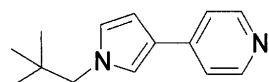
【0242】

製造例 3

4-(1-ネオペンチルピロール-3-イル)-ピリジン (化合物 3-18) の製造

【0243】

【化32】



30

【0244】

4-(ピロール-3-イル)-ピリジン 0.15 g、ネオペンチルヨード 0.31 g、水素化ナトリウム (60%の鉱油混合物) 50 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml の混合物を 90 °C で 2 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(1-ネオペンチルピロール-3-イル)-ピリジン 0.18 g を得た。

【0245】

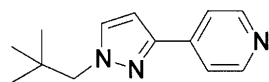
40

製造例 4

4-(1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-ピリジン (化合物 4-18) の製造

【0246】

【化33】



【0247】

4-(ピラゾール-3-イル)-ピリジン 0.20 g、ネオペンチルヨード 0.33 g、水素化ナトリウム (60%の鉱油混合物) 66 mg および N, N-ジメチルホル

50

ムアミド 3 m l の混合物を 1 0 0 °C で 2 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4 - (1 - ネオペンチルピラゾール - 3 - イル) - ピリジン 0 . 2 6 g を得た。

【 0 2 4 8 】

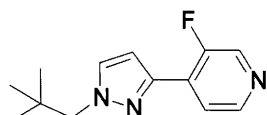
製造例 5

4 - (1 - ネオペンチルピラゾール - 3 - イル) - 3 - フルオロピリジン (化合物 4 - 1 9) の製造

【 0 2 4 9 】

10

【化 3 4】



【 0 2 5 0 】

(1) 4 - アセチル - 3 - フルオロピリジン 0 . 4 4 g と N , N - ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 5 m l の混合物を 2 時間還流した。溶媒を減圧下に濃縮し、3 - ジメチルアミノ - 1 - (3 - フルオロピリジン - 4 - イル) - 2 - プロペン - 1 - オン 0 . 6 1 g を得た。

20

¹H-NMR (CDCl₃) δ : 2.94 (3H, s), 3.19 (3H, s), 5.59 (1H, d), 7.64 (1H, br s), 7.89 (1H, br s), 8.47 (1H, dd), 8.51 (1H, d).

(2) 3 - ジメチルアミノ - 1 - (3 - フルオロピリジン - 4 - イル) - 2 - プロペン - 1 - オン 0 . 6 1 g 、ヒドラジン (抱水) 0 . 1 5 m l およびエタノール 1 9 m l の混合物を 8 0 °C で 2 時間攪拌した。溶媒を減圧下に濃縮後、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3 - フルオロ - 4 - (ピラゾール - 3 - イル) - ピリジン 0 . 4 5 g を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ : 6.90 (1H, t), 7.71 (1H, d), 7.88 (1H, t), 8.46 (1H, dd), 8.56 (1H, d).

(3) 3 - フルオロ - 4 - (ピラゾール - 3 - イル) - ピリジン 0 . 4 5 g 、ネオペンチルヨード 0 . 6 6 g 、水素化ナトリウム (6 0 % の鉱油混合物) 0 . 1 7 g および N , N - ジメチルホルムアミド 3 m l の混合物を 1 0 0 °C で 8 時間攪拌した。放冷した反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4 - (1 - ネオペンチルピラゾール - 3 - イル) - 3 - フルオロピリジン 0 . 4 2 g を得た。

30

【 0 2 5 1 】

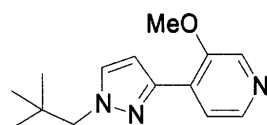
製造例 6

4 - (1 - ネオペンチルピラゾール - 3 - イル) - 3 - メトキシピリジン (化合物 4 - 2 4) の製造

40

【 0 2 5 2 】

【化 3 5】



【 0 2 5 3 】

4 - (1 - ネオペンチルピラゾール - 3 - イル) - 3 - フルオロピリジン 0 . 2 1 g 、ナトリウムメトキシド (2 8 % のメタノール溶液) 1 . 7 0 g および N , N - ジメチルホルムアミド 2 . 5 m l の混合物を 1 0 0 °C で 1 時間攪拌した。放冷した反応混合物

50

に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-3-メトキシピリジン 0.19 g を得た。

【0254】

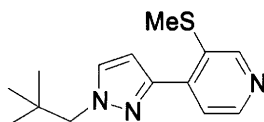
製造例 7

4-(1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-3-(メチルチオ)ピリジン (化合物 4-27) の製造

【0255】

【化36】

10



【0256】

4-(1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-3-フルオロピリジン 0.21 g、ナトリウムチオメトキシド 0.13 g および N,N-ジメチルホルムアミド 2.0 ml の混合物を室温で 5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-3-(メチルチオ)ピリジン 0.23 g を得た。

20

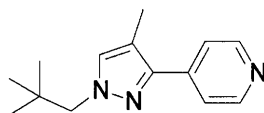
【0257】

製造例 8

4-(4-メチル-1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-ピリジン (化合物 4-40) の製造

【0258】

【化37】



30

【0259】

4-(4-メチルピラゾール-3-イル)-ピリジン 0.20 g、ネオペンチルヨージド 0.37 g、水素化ナトリウム (60% の鉱油混合物) 60 mg および N,N-ジメチルホルムアミド 2 ml の混合物を 110 °C で 4 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(4-メチル-1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-ピリジン 0.26 g を得た。

40

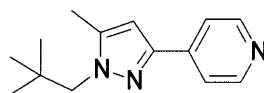
【0260】

製造例 9

4-(5-メチル-1-ネオペンチルピラゾール-3-イル)-ピリジン (化合物 4-46) の製造

【0261】

【化38】



【0262】

4-(5-メチルピラゾール-3-イル)-ピリジン 0.20 g、ネオペンチルヨージド

50

ジド 0.37 g、水素化ナトリウム（60%の鉱油混合物）60 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml の混合物を 100 °C で 4 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-（5-メチル-1-ネオペンチルピラゾール-3-イル）-ピリジン 0.26 g を得た。

【0263】

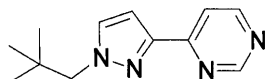
製造例 10

4-（1-ネオペンチルピラゾール-3-イル）-ピリミジン（化合物 4-51）の製造

10

【0264】

【化39】



【0265】

4-（ピラゾール-3-イル）-ピリミジン 0.17 g、ネオペンチルヨージド 0.45 g、水素化ナトリウム（60%の鉱油混合物）68 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 3 ml の混合物を 100 °C で 8 時間攪拌した。放冷した反応混合物に水を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-（1-ネオペンチルピラゾール-3-イル）-ピリミジン 0.14 g を得た。

20

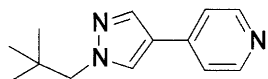
【0266】

製造例 11

4-（1-ネオペンチルピラゾール-4-イル）-ピリジン（化合物 4-84）の製造

【0267】

【化40】



30

【0268】

4-（ピラゾール-4-イル）-ピリジン 0.18 g、ネオペンチルヨージド 0.37 g、水素化ナトリウム（60%の鉱油混合物）59 mg および N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml の混合物を 100 °C で 4 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-（1-ネオペンチルピラゾール-4-イル）-ピリジン 0.26 g を得た。

【0269】

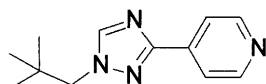
製造例 12

4-（1-ネオペンチル-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イル）-ピリジン（化合物 5-18）の製造

40

【0270】

【化41】



【0271】

4-（[1, 2, 4]トリアゾール-3-イル）-ピリジン 0.25 g、ネオペンチルヨージド 0.51 g、水素化ナトリウム（60%の鉱油混合物）82 mg および N, N

50

ージメチルホルムアミド 2.5 ml の混合物を 100℃で 2 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(1-ネオペンチル-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イル)-ピリジン 0.15 g を得た。

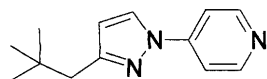
【0272】

製造例 13

4-(3-ネオペンチルピラゾール-1-イル)-ピリジン (化合物 6-18) の製造

【0273】

【化 42】



【0274】

3-ネオペンチルピラゾール 0.30 g、4-クロロピリジン塩酸塩 1.64 g、炭酸カリウム 1.51 g および N-メチルピロリジノン 6 ml の混合物を 100℃で 4 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(3-ネオペンチルピラゾール-1-イル)-ピリジン 0.23 g を得た。

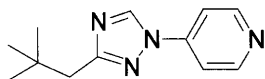
【0275】

製造例 14

4-(3-ネオペンチル-[1, 2, 4]トリアゾール-1-イル)-ピリジン (化合物 7-18) の製造

【0276】

【化 43】



【0277】

3-ネオペンチル-[1, 2, 4]トリアゾール 0.35 g、4-クロロピリジン塩酸塩 1.62 g、炭酸カリウム 1.50 g および N-メチルピロリジノン 6 ml の混合物を 110℃で 4 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム溶液を注加した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、4-(3-ネオペンチル-[1, 2, 4]トリアゾール-1-イル)-ピリジン 0.33 g を得た。

【0278】

以下、前述の実施製造例に記載の方法に準じた製造方法により製造される化合物を例示する。

【0279】

表中、Me はメチル基 (CH_3 -)、Et はエチル基 (CH_3CH_2 -)、Pr はプロピル基 ($\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$ -)、i-Pr はイソプロピル基 ($(\text{CH}_3)_2\text{CH}$ -)、t-Bu は tert-ブチル基 ($(\text{CH}_3)_3\text{C}$ -) を表し、sec-Bu は sec-ブチル基 ($\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ -) を表す。

【0280】

表中、「 $(\text{E}^1)_n$ 」の列において、n が 1 である場合は、例えば「3-Me」のように示し、これは、 E^1 が H et で表されるヘテロ芳香環の 3 位に置換したメチル基であることを意味し、n が 0 である場合は、「-」のように示し、無置換であることを意味する。

【0281】

10

20

30

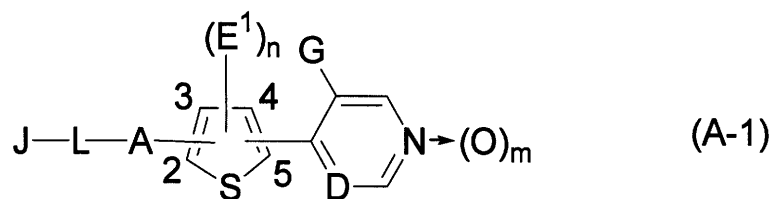
40

50

式 (A-1) で表される化合物。

【0282】

【化44】



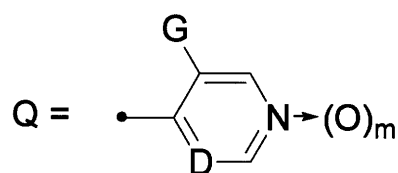
【0283】

10

式中の J-L-A 基、 $(E^1)_n$ 、D、G 及び m は、下記の〔表2〕～〔表3〕に記載の組み合わせを表す。以下、Q は下式を表す。

【0284】

【化45】



【0285】

20

【表 2】

(表中、Aの置換位置は2位、Qの置換位置は5位である。)

化合物	J-L-A-	(E') _n	D	G	m
1-1	t-Bu	-	CH	H	0
1-2	t-Bu	-	CH	F	0
1-3	t-Bu	-	CH	Cl	0
1-4	t-Bu	-	CH	Br	0
1-5	t-Bu	-	CH	Me	0
1-6	t-Bu	-	CH	Et	0
1-7	t-Bu	-	CH	MeO	0
1-8	t-Bu	-	CH	EtO	0
1-9	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
1-10	t-Bu	-	CH	MeS	0
1-11	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
1-12	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
1-13	t-Bu	-	CH	EtS	0
1-14	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
1-15	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
1-16	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
1-17	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
1-18	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
1-19	t-BuCH ₂	-	CH	F	0
1-20	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
1-21	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
1-22	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
1-23	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
1-24	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0

10

20

30

40

【表 3】

(表中、Aの置換位置は2位、Qの置換位置は5位である。)

化合物	J-L-A-	(E ¹) _n	D	G	m
1-25	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0
1-26	t-BuCH ₂	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
1-27	t-BuCH ₂	-	CH	MeS	0
1-28	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O)	0
1-29	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O) ₂	0
1-30	t-BuCH ₂	-	CH	EtS	0
1-31	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O)	0
1-32	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O) ₂	0
1-33	t-BuCH ₂	-	CH	Me ₂ N	0
1-34	t-BuCH ₂	-	CH	Et ₂ N	0
1-35	トリメチルシリル	-	CH	H	0
1-36	トリメチルシリル	-	CH	F	0
1-37	トリメチルシリル	-	CH	Cl	0
1-38	トリメチルシリル	-	CH	Br	0
1-39	トリメチルシリル	-	CH	Me	0
1-40	トリメチルシリル	-	CH	Et	0
1-41	トリメチルシリル	-	CH	MeO	0
1-42	トリメチルシリル	-	CH	EtO	0
1-43	トリメチルシリル	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
1-44	トリメチルシリル	-	CH	MeS	0
1-45	トリメチルシリル	-	CH	MeS(O)	0
1-46	トリメチルシリル	-	CH	MeS(O) ₂	0
1-47	トリメチルシリル	-	CH	EtS	0
1-48	トリメチルシリル	-	CH	EtS(O)	0
1-49	トリメチルシリル	-	CH	EtS(O) ₂	0
1-50	トリメチルシリル	-	CH	Me ₂ N	0
1-51	トリメチルシリル	-	CH	Et ₂ N	0

10

20

30

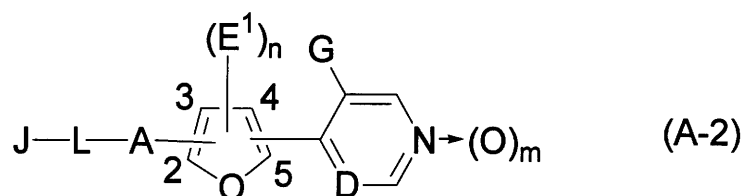
40

【0287】

式(A-2)で表される化合物。

【0288】

【化 4 6】



【 0 2 8 9 】

式中の J-L-A 基、 $(E^1)_n$ 、D、G 及び m は、下記の〔表 4〕～〔表 5〕に記載の組み合わせを表す。

10

【 0 2 9 0 】

【表 4】

(表中、A の置換位置は 2 位、Q の置換位置は 5 位である。)

化合物	J-L-A-	$(E^1)_n$	D	G	m
2-1	t-Bu	-	CH	H	0
2-2	t-Bu	-	CH	F	0
2-3	t-Bu	-	CH	Cl	0
2-4	t-Bu	-	CH	Br	0
2-5	t-Bu	-	CH	Me	0
2-6	t-Bu	-	CH	Et	0
2-7	t-Bu	-	CH	MeO	0
2-8	t-Bu	-	CH	EtO	0
2-9	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
2-10	t-Bu	-	CH	MeS	0
2-11	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
2-12	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
2-13	t-Bu	-	CH	EtS	0
2-14	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
2-15	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
2-16	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
2-17	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
2-18	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
2-19	t-BuCH ₂	-	CH	F	0

20

30

40

【 0 2 9 1 】

【表 5】

(表中、A の置換位置は 2 位、Q の置換位置は 5 位である。)

化合物	J-L-A-	(E ¹) _n	D	G	m
2-20	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
2-21	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
2-22	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
2-23	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
2-24	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0
2-25	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0
2-26	t-BuCH ₂	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
2-27	t-BuCH ₂	-	CH	MeS	0
2-28	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O)	0
2-29	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O) ₂	0
2-30	t-BuCH ₂	-	CH	EtS	0
2-31	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O)	0
2-32	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O) ₂	0
2-33	t-BuCH ₂	-	CH	Me ₂ N	0
2-34	t-BuCH ₂	-	CH	Et ₂ N	0

10

20

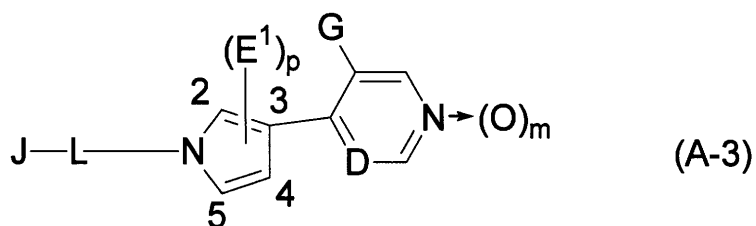
【0 2 9 2】

式 (A-3) で表される化合物。

【0 2 9 3】

【化 4 7】

30



【0 2 9 4】

式中の J-L 基、(E¹)_p、D、G 及び m は、下記の〔表 6〕～〔表 7〕に記載の組み合わせを表す。

【0 2 9 5】

40

【表 6】

化合物	J-L-A-	(E ¹) _p	D	G	m
3-1	t-Bu	-	CH	H	0
3-2	t-Bu	-	CH	F	0
3-3	t-Bu	-	CH	Cl	0
3-4	t-Bu	-	CH	Br	0
3-5	t-Bu	-	CH	Me	0
3-6	t-Bu	-	CH	Et	0
3-7	t-Bu	-	CH	MeO	0
3-8	t-Bu	-	CH	EtO	0
3-9	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
3-10	t-Bu	-	CH	MeS	0
3-11	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
3-12	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
3-13	t-Bu	-	CH	EtS	0
3-14	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
3-15	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
3-16	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
3-17	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
3-18	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
3-19	t-BuCH ₂	-	CH	F	0
3-20	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
3-21	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
3-22	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
3-23	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
3-24	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0
3-25	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0

10

20

30

40

【表 7】

化合物	J-L-A-	(E ¹) _p	D	G	m
3-26	t-BuCH ₂	—	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
3-27	t-BuCH ₂	—	CH	MeS	0
3-28	t-BuCH ₂	—	CH	MeS(O)	0
3-29	t-BuCH ₂	—	CH	MeS(O) ₂	0
3-30	t-BuCH ₂	—	CH	EtS	0
3-31	t-BuCH ₂	—	CH	EtS(O)	0
3-32	t-BuCH ₂	—	CH	EtS(O) ₂	0
3-33	t-BuCH ₂	—	CH	Me ₂ N	0
3-34	t-BuCH ₂	—	CH	Et ₂ N	0
3-35	i-Bu	—	CH	H	0
3-36	t-BuCH ₂ CH ₂	—	CH	H	0
3-37	CF ₃ (Me)CH	—	CH	H	0
3-38	Me(CF ₃) ₂ CCH ₂	—	CH	H	0

10

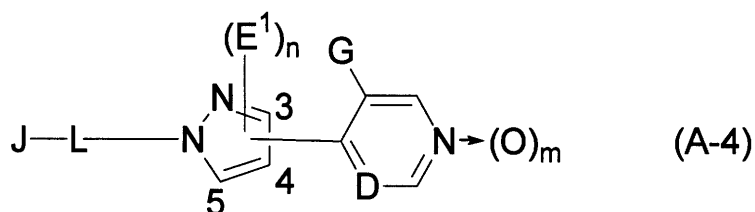
20

【0297】

式(A-4)で表される化合物。

【0298】

【化48】



30

【0299】

式中のJ-L基、(E¹)_n、D、G及びmは、下記の「表8」～「表12」に記載の組み合わせを表す。

【0300】

【表 8】

(表中、Qの置換位置は3位である。)

化合物	J-L-	(E') _n	D	G	m
4-1	t-Bu	-	CH	H	0
4-2	t-Bu	-	CH	F	0
4-3	t-Bu	-	CH	Cl	0
4-4	t-Bu	-	CH	Br	0
4-5	t-Bu	-	CH	Me	0
4-6	t-Bu	-	CH	Et	0
4-7	t-Bu	-	CH	MeO	0
4-8	t-Bu	-	CH	EtO	0
4-9	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
4-10	t-Bu	-	CH	MeS	0
4-11	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
4-12	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
4-13	t-Bu	-	CH	EtS	0
4-14	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
4-15	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
4-16	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
4-17	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
4-18	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
4-19	t-BuCH ₂	-	CH	F	0
4-20	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
4-21	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
4-22	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
4-23	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
4-24	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0
4-25	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0

【 0 3 0 1 】

【表 9】

(表中、Q の置換位置は 3 位である。)

化合物	J-L-	(E') _n	D	G	m
4-26	t-BuCH ₂	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
4-27	t-BuCH ₂	-	CH	MeS	0
4-28	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O)	0
4-29	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O) ₂	0
4-30	t-BuCH ₂	-	CH	EtS	0
4-31	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O)	0
4-32	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O) ₂	0
4-33	t-BuCH ₂	-	CH	Me ₂ N	0
4-34	t-BuCH ₂	-	CH	Et ₂ N	0
4-35	i-Bu	-	CH	H	0
4-36	t-BuCH ₂ CH ₂	-	CH	H	0
4-37	CF ₃ (Me)CH	-	CH	H	0
4-38	Me(CF ₃) ₂ CCH ₂	-	CH	H	0
4-39	t-Bu	4-Me	CH	H	0
4-40	t-BuCH ₂	4-Me	CH	H	0
4-41	i-Bu	4-Me	CH	H	0
4-42	t-BuCH ₂ CH ₂	4-Me	CH	H	0
4-43	CF ₃ (Me)CH	4-Me	CH	H	0
4-44	Me(CF ₃) ₂ CCH ₂	4-Me	CH	H	0

10

20

30

【 0 3 0 2 】

【表 10】

(表中、Qの置換位置は3位である。)

化合物	J-L-	(E') _n	D	G	m
4-45	t-Bu	5-Me	CH	H	0
4-46	t-BuCH ₂	5-Me	CH	H	0
4-47	i-Bu	5-Me	CH	H	0
4-48	t-BuCH ₂ CH ₂	5-Me	CH	H	0
4-49	CF ₃ (Me)CH	5-Me	CH	H	0
4-50	Me(CF ₃) ₂ CCH ₂	5-Me	CH	H	0
4-51	t-BuCH ₂	-	N	H	0
4-52	t-BuCH ₂	-	N	F	0
4-53	t-BuCH ₂	-	N	Cl	0
4-54	t-BuCH ₂	-	N	Br	0
4-55	t-BuCH ₂	-	N	Me	0
4-56	t-BuCH ₂	-	N	Et	0
4-57	t-BuCH ₂	-	N	MeO	0
4-58	t-BuCH ₂	-	N	EtO	0
4-59	t-BuCH ₂	-	N	CF ₃ CH ₂ O	0
4-60	t-BuCH ₂	-	N	MeS	0
4-61	t-BuCH ₂	-	N	MeS(O)	0
4-62	t-BuCH ₂	-	N	MeS(O) ₂	0
4-63	t-BuCH ₂	-	N	EtS	0
4-64	t-BuCH ₂	-	N	EtS(O)	0
4-65	t-BuCH ₂	-	N	EtS(O) ₂	0
4-66	t-BuCH ₂	-	N	Me ₂ N	0
4-67	t-BuCH ₂	-	N	Et ₂ N	0

【0303】

【表 1 1】

(表中、Qの置換位置は4位である。)

化合物	J-L-	(E') _n	D	G	m
4-68	t-Bu	-	CH	F	0
4-69	t-Bu	-	CH	Cl	0
4-70	t-Bu	-	CH	Br	0
4-71	t-Bu	-	CH	Me	0
4-72	t-Bu	-	CH	Et	0
4-73	t-Bu	-	CH	MeO	0
4-74	t-Bu	-	CH	EtO	0
4-75	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
4-76	t-Bu	-	CH	MeS	0
4-77	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
4-78	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
4-79	t-Bu	-	CH	EtS	0
4-80	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
4-81	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
4-82	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
4-83	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
4-84	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
4-85	t-BuCH ₂	-	CH	F	0
4-86	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
4-87	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
4-88	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
4-89	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
4-90	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0
4-91	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0

【 0 3 0 4 】

【表 1 2】

(表中、Q の置換位置は 4 位である。)

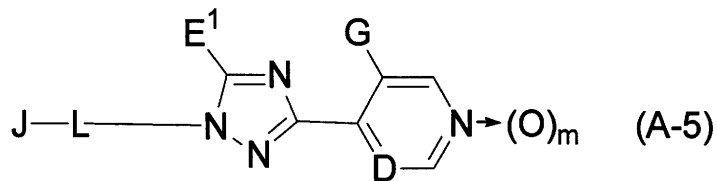
化合物	J-L-	(E ¹) _n	D	G	m
4-92	t-BuCH ₂	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
4-93	t-BuCH ₂	-	CH	MeS	0
4-94	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O)	0
4-95	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O) ₂	0
4-96	t-BuCH ₂	-	CH	EtS	0
4-97	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O)	0
4-98	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O) ₂	0
4-99	t-BuCH ₂	-	CH	Me ₂ N	0
4-100	t-BuCH ₂	-	CH	Et ₂ N	0
4-101	i-Bu	-	CH	H	0
4-102	t-BuCH ₂ CH ₂	-	CH	H	0
4-103	CF ₃ (Me)CH	-	CH	H	0
4-104	Me(CF ₃) ₂ CCH ₂	-	CH	H	0

【0305】

式 (A-4) で表される化合物。

【0306】

【化 4 9】



【0307】

式中の J-L 基、E¹、D、G 及び m は、下記の「表 1 3」～「表 1 4」に記載の組み合わせを表す。

【0308】

10

20

30

【表 1 3】

化合物	J-L-	E ¹	D	G	m
5-1	t-Bu	-	CH	H	0
5-2	t-Bu	-	CH	F	0
5-3	t-Bu	-	CH	Cl	0
5-4	t-Bu	-	CH	Br	0
5-5	t-Bu	-	CH	Me	0
5-6	t-Bu	-	CH	Et	0
5-7	t-Bu	-	CH	MeO	0
5-8	t-Bu	-	CH	EtO	0
5-9	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
5-10	t-Bu	-	CH	MeS	0
5-11	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
5-12	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
5-13	t-Bu	-	CH	EtS	0
5-14	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
5-15	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
5-16	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
5-17	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
5-18	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
5-19	t-BuCH ₂	-	CH	F	0
5-20	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
5-21	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
5-22	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
5-23	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
5-24	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0
5-25	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0

10

20

30

40

【 0 3 0 9 】

【表 1 4】

化合物	J-L-	E ¹	D	G	m
5-26	t-BuCH ₂	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
5-27	t-BuCH ₂	-	CH	MeS	0
5-28	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O)	0
5-29	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O) ₂	0
5-30	t-BuCH ₂	-	CH	EtS	0
5-31	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O)	0
5-32	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O) ₂	0
5-33	t-BuCH ₂	-	CH	Me ₂ N	0
5-34	t-BuCH ₂	-	CH	Et ₂ N	0
5-35	i-Bu	-	CH	H	0
5-36	t-BuCH ₂ CH ₂	-	CH	H	0
5-37	CF ₃ (Me)CH	-	CH	H	0
5-38	Me(CF ₃) ₂ CCH ₂	-	CH	H	0

10

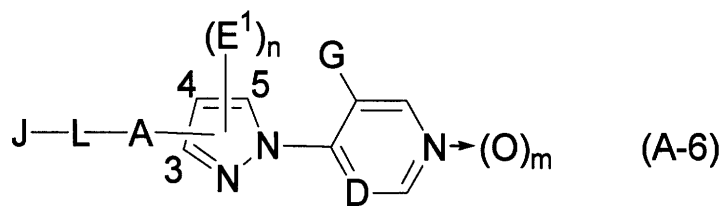
20

【0 3 1 0】

式 (A-5) で表される化合物。

【0 3 1 1】

【化 5 0】



30

【0 3 1 2】

式中の J-L-A 基、(E¹)_n、D、G 及び m は、下記の〔表 1 5〕～〔表 1 8〕に記載の組み合わせを表す。

【0 3 1 3】

【表 1 5】

(表中、Aの置換位置は3位である。)

化合物	J-L-A-	(E ¹) _n	D	G	m
6-1	t-Bu	-	CH	H	0
6-2	t-Bu	-	CH	F	0
6-3	t-Bu	-	CH	Cl	0
6-4	t-Bu	-	CH	Br	0
6-5	t-Bu	-	CH	Me	0
6-6	t-Bu	-	CH	Et	0
6-7	t-Bu	-	CH	MeO	0
6-8	t-Bu	-	CH	EtO	0
6-9	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
6-10	t-Bu	-	CH	MeS	0
6-11	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
6-12	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
6-13	t-Bu	-	CH	EtS	0
6-14	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
6-15	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
6-16	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
6-17	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
6-18	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
6-19	t-BuCH ₂	-	CH	F	0
6-20	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
6-21	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
6-22	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
6-23	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
6-24	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0
6-25	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0

【 0 3 1 4 】

【表 16】

(表中、Aの置換位置は3位である。)

化合物	J-L-A-	(E') _n	D	G	m
6-26	t-BuCH ₂	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
6-27	t-BuCH ₂	-	CH	MeS	0
6-28	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O)	0
6-29	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O) ₂	0
6-30	t-BuCH ₂	-	CH	EtS	0
6-31	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O)	0
6-32	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O) ₂	0
6-33	t-BuCH ₂	-	CH	Me ₂ N	0
6-34	t-BuCH ₂	-	CH	Et ₂ N	0
6-35	トリメチルシリル	-	CH	H	0
6-36	トリメチルシリル	-	CH	F	0
6-37	トリメチルシリル	-	CH	Cl	0
6-38	トリメチルシリル	-	CH	Br	0
6-39	トリメチルシリル	-	CH	Me	0
6-40	トリメチルシリル	-	CH	Et	0
6-41	トリメチルシリル	-	CH	MeO	0
6-42	トリメチルシリル	-	CH	EtO	0
6-43	トリメチルシリル	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
6-44	トリメチルシリル	-	CH	MeS	0
6-45	トリメチルシリル	-	CH	MeS(O)	0
6-46	トリメチルシリル	-	CH	MeS(O) ₂	0
6-47	トリメチルシリル	-	CH	EtS	0
6-48	トリメチルシリル	-	CH	EtS(O)	0
6-49	トリメチルシリル	-	CH	EtS(O) ₂	0
6-50	トリメチルシリル	-	CH	Me ₂ N	0
6-51	トリメチルシリル	-	CH	Et ₂ N	0

10

20

30

40

【0315】

【表 17】

(表中、Aの置換位置は4位である。)

化合物	J-L-A-	(E') _n	D	G	m
6-52	t-Bu	-	CH	H	0
6-53	t-Bu	-	CH	F	0
6-54	t-Bu	-	CH	Cl	0
6-55	t-Bu	-	CH	Br	0
6-56	t-Bu	-	CH	Me	0
6-57	t-Bu	-	CH	Et	0
6-58	t-Bu	-	CH	MeO	0
6-59	t-Bu	-	CH	EtO	0
6-60	t-Bu	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
6-61	t-Bu	-	CH	MeS	0
6-62	t-Bu	-	CH	MeS(O)	0
6-63	t-Bu	-	CH	MeS(O) ₂	0
6-64	t-Bu	-	CH	EtS	0
6-65	t-Bu	-	CH	EtS(O)	0
6-66	t-Bu	-	CH	EtS(O) ₂	0
6-67	t-Bu	-	CH	Me ₂ N	0
6-68	t-Bu	-	CH	Et ₂ N	0
6-69	t-BuCH ₂	-	CH	H	0
6-70	t-BuCH ₂	-	CH	F	0
6-71	t-BuCH ₂	-	CH	Cl	0
6-72	t-BuCH ₂	-	CH	Br	0
6-73	t-BuCH ₂	-	CH	Me	0
6-74	t-BuCH ₂	-	CH	Et	0
6-75	t-BuCH ₂	-	CH	MeO	0
6-76	t-BuCH ₂	-	CH	EtO	0

10

20

30

40

【0316】

【表 18】

(表中、Aの置換位置は4位である。)

化合物	J-L-A-	(E') _n	D	G	m
6-77	t-BuCH ₂	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
6-78	t-BuCH ₂	-	CH	MeS	0
6-79	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O)	0
6-80	t-BuCH ₂	-	CH	MeS(O) ₂	0
6-81	t-BuCH ₂	-	CH	EtS	0
6-82	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O)	0
6-83	t-BuCH ₂	-	CH	EtS(O) ₂	0
6-84	t-BuCH ₂	-	CH	Me ₂ N	0
6-85	t-BuCH ₂	-	CH	Et ₂ N	0
6-86	トリメチルシリル	-	CH	H	0
6-87	トリメチルシリル	-	CH	F	0
6-88	トリメチルシリル	-	CH	Cl	0
6-89	トリメチルシリル	-	CH	Br	0
6-90	トリメチルシリル	-	CH	Me	0
6-91	トリメチルシリル	-	CH	Et	0
6-92	トリメチルシリル	-	CH	MeO	0
6-93	トリメチルシリル	-	CH	EtO	0
6-94	トリメチルシリル	-	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
6-95	トリメチルシリル	-	CH	MeS	0
6-96	トリメチルシリル	-	CH	MeS(O)	0
6-97	トリメチルシリル	-	CH	MeS(O) ₂	0
6-98	トリメチルシリル	-	CH	EtS	0
6-99	トリメチルシリル	-	CH	EtS(O)	0
6-100	トリメチルシリル	-	CH	EtS(O) ₂	0
6-101	トリメチルシリル	-	CH	Me ₂ N	0
6-102	トリメチルシリル	-	CH	Et ₂ N	0

10

20

30

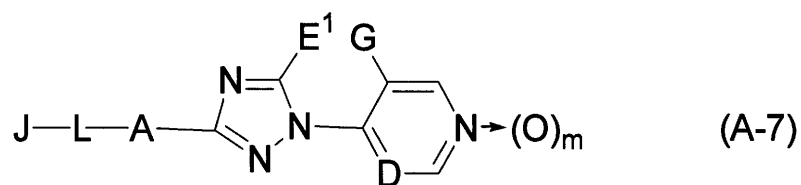
40

【0317】

式(A-7)で表される化合物。

【0318】

【化 5 1】



【 0 3 1 9 】

式中の J-L-A 基、E¹、D、G 及び m は、下記の〔表 1 9〕～〔表 2 0〕に記載の組み合わせを表す。

【 0 3 2 0 】

【表 19】

化合物	J-L-A-	E ¹	D	G	m
7-1	t-Bu	H	CH	H	0
7-2	t-Bu	H	CH	F	0
7-3	t-Bu	H	CH	Cl	0
7-4	t-Bu	H	CH	Br	0
7-5	t-Bu	H	CH	Me	0
7-6	t-Bu	H	CH	Et	0
7-7	t-Bu	H	CH	MeO	0
7-8	t-Bu	H	CH	EtO	0
7-9	t-Bu	H	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
7-10	t-Bu	H	CH	MeS	0
7-11	t-Bu	H	CH	MeS(O)	0
7-12	t-Bu	H	CH	MeS(O) ₂	0
7-13	t-Bu	H	CH	EtS	0
7-14	t-Bu	H	CH	EtS(O)	0
7-15	t-Bu	H	CH	EtS(O) ₂	0
7-16	t-Bu	H	CH	Me ₂ N	0
7-17	t-Bu	H	CH	Et ₂ N	0
7-18	t-BuCH ₂	H	CH	H	0
7-19	t-BuCH ₂	H	CH	F	0
7-20	t-BuCH ₂	H	CH	Cl	0
7-21	t-BuCH ₂	H	CH	Br	0
7-22	t-BuCH ₂	H	CH	Me	0
7-23	t-BuCH ₂	H	CH	Et	0
7-24	t-BuCH ₂	H	CH	MeO	0
7-25	t-BuCH ₂	H	CH	EtO	0

10

20

30

40

【0321】

【表 2 0】

化合物	J-L-A-	(E ¹) _n	D	G	m
7-26	t-BuCH ₂	—	CH	CF ₃ CH ₂ O	0
7-27	t-BuCH ₂	—	CH	MeS	0
7-28	t-BuCH ₂	—	CH	MeS(O)	0
7-29	t-BuCH ₂	—	CH	MeS(O) ₂	0
7-30	t-BuCH ₂	—	CH	EtS	0
7-31	t-BuCH ₂	—	CH	EtS(O)	0
7-32	t-BuCH ₂	—	CH	EtS(O) ₂	0
7-33	t-BuCH ₂	—	CH	Me ₂ N	0
7-34	t-BuCH ₂	—	CH	Et ₂ N	0

10

【 0 3 2 2 】

〔表 2〕～〔表 2 0〕に記載した本発明化合物の物性値を下記の〔表 2 1〕～〔表 2 2〕に示す。

20

【 0 3 2 3 】

【表 2 1】

化合物	物性値
1-18	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.99 (9H, s), 2.72 (2H, s), 6.78 (1H, d), 7.36 (1H, d), 7.43 (2H, dd), 8.55 (2H, dd).
2-18	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.99 (9H, s), 2.57 (2H, s), 6.15 (1H, d), 6.80 (1H, d), 7.46 (2H, dd), 8.56 (2H, dd).
3-18	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.98 (9H, s), 3.66 (2H, s), 6.49 (1H, d), 6.64 (1H, t), 7.04 (1H, t), 7.36 (2H, dd), 8.47 (2H, dd).
3-35	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.92 (3H, s), 0.94 (3H, s), 2.00-2.12 (1H, m), 3.69 (2H, d), 6.50 (1H, dd), 6.67 (1H, t), 7.07 (1H, t), 7.35 (2H, dd), 8.47 (2H, dd).
4-18	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.00 (9H, s), 3.96 (2H, s), 6.63 (1H, d), 7.40 (1H, d), 7.69 (2H, dd), 8.60 (2H, dd).
4-19	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.00 (9H, s), 3.98 (2H, s), 6.80 (1H, dd), 7.43 (1H, d), 7.96 (1H, dd), 8.40 (1H, dd), 8.49 (1H, d).
4-24	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.00 (9H, s), 3.97 (2H, s), 4.02 (3H, s), 6.88 (1H, d), 7.40 (1H, d), 7.91 (1H, d), 8.27 (1H, d), 8.35 (1H, s).
4-25	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.00 (9H, s), 1.53 (3H, t), 3.97 (2H, s), 4.24 (2H, q), 6.94 (1H, d), 7.39 (1H, d), 7.93 (1H, d), 8.24 (1H, d), 8.33 (1H, s).
4-27	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.02 (9H, s), 2.51 (3H, s), 3.98 (2H, s), 6.78 (1H, d), 7.42 (1H, d), 7.55 (1H, d), 8.40 (1H, d), 8.51 (1H, s).
4-30	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.02 (9H, s), 1.29 (3H, t), 2.94 (2H, q), 3.98 (2H, s), 6.86 (1H, d), 7.42 (1H, d), 7.60 (1H, d), 8.41 (1H, d), 8.59 (1H, s).
4-36	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.00 (9H, s), 1.82-1.90 (2H, m), 4.16-4.23 (2H, m), 6.63 (1H, d), 7.45 (1H, d), 7.68 (2H, dd), 8.60 (2H, dd).
4-38	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.52 (3H, s), 4.62 (2H, s), 6.69 (1H, d), 7.49 (1H, d), 7.68 (2H, dd), 8.64 (2H, dd).
4-40	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.99 (9H, s), 2.28 (3H, d), 3.89 (2H, s), 7.21 (1H, d), 7.63 (2H, dd), 8.61 (2H, dd).

【 0 3 2 4 】

10

20

30

40

【表 2 2】

化合物	物性値
4-42	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 0.99 (9H, s), 1.79-1.86 (2H, m), 2.27 (3H, s), 4.09-4.16 (2H, m), 7.26 (1H, s), 7.62 (2H, dd), 8.61 (2H, dd).
4-46	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.03 (9H, s), 2.33 (3H, d), 3.86 (2H, s), 6.41 (1H, d), 7.65 (2H, dd), 8.58 (2H, dd).
4-48	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.01 (9H, s), 1.72-1.79 (2H, m), 2.33 (3H, d), 4.07-4.13 (2H, m), 6.40 (1H, d), 7.63 (2H, dd), 8.58 (2H, dd).
4-51	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.00 (9H, s), 3.99 (2H, s), 6.98 (1H, d), 7.43 (1H, d), 7.92 (1H, dd), 8.70 (1H, d), 9.19 (1H, d).
4-84	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.01 (9H, s), 3.96 (2H, s), 7.37 (2H, dd), 7.71 (1H, d), 7.86 (1H, d), 8.55 (2H, dd).
4-101	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 0.94 (3H, s), 0.96 (3H, s), 2.20-2.31 (1H, m), 3.96 (2H, d), 7.36 (2H, dd), 7.73 (1H, d), 7.87 (1H, d), 8.55 (2H, dd).
4-102	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.00 (9H, s), 1.82-1.88 (2H, m), 4.16-4.21 (2H, m), 7.35 (2H, dd), 7.77 (1H, d), 7.85 (1H, d), 8.54 (2H, dd).
4-103	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.82 (3H, d), 4.90-4.99 (1H, m), 7.38 (2H, dd), 7.89 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.58 (2H, dd).
5-18	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.03 (9H, s), 4.01 (2H, s), 7.97 (2H, dd), 8.08 (1H, s), 8.69 (2H, dd).
5-36	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.02 (9H, s), 1.85-1.91 (2H, m), 4.21-4.26 (2H, m), 7.96 (2H, dd), 8.13 (1H, s), 8.69 (2H, dd).
6-18	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 0.99 (9H, s), 2.60 (2H, s), 6.31 (1H, d), 7.61 (2H, dd), 7.92 (1H, d), 8.62 (2H, dd).
7-18	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.04 (9H, s), 2.73 (2H, s), 7.64 (2H, dd), 8.60 (1H, s), 8.73 (2H, dd).

【0325】

次に本発明化合物の製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

【0326】

製剤例 1

上述の化合物 1-1 から 1-51、化合物 2-1 から 2-34、化合物 3-1 から 3-38、化合物 4-1 から 4-104、化合物 5-1 から 5-38、化合物 6-1 から 6-102 および化合物 7-1 から 7-34 のいずれか 1 種 10 部を、キシレン 35 部と N-ジメチルホルムアミド 35 部との混合物に溶解し、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、混合して各々の乳剤を得る。

【0327】

製剤例 2

ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪藻土 54 部を混合し、更に上述の化合物 1-1 から 1-51、化合

10

20

30

40

50

物 2-1 から 2-3 4、化合物 3-1 から 3-3 8、化合物 4-1 から 4-1 0 4、化合物 5-1 から 5-3 8、化合物 6-1 から 6-1 0 2 および化合物 7-1 から 7-3 4 のいずれか 1 種 2 0 部を加え、混合して各々の水和剤を得る。

【0328】

製剤例 3

上述の化合物 1-1 から 1-5 1、化合物 2-1 から 2-3 4、化合物 3-1 から 3-3 8、化合物 4-1 から 4-1 0 4、化合物 5-1 から 5-3 8、化合物 6-1 から 6-1 0 2 および化合物 7-1 から 7-3 4 のいずれか 1 種 2 部に、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 3 0 部およびカオリンクレー 6 5 部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

10

【0329】

製剤例 4

上述の化合物 1-1 から 1-5 1、化合物 2-1 から 2-3 4、化合物 3-1 から 3-3 8、化合物 4-1 から 4-1 0 4、化合物 5-1 から 5-3 8、化合物 6-1 から 6-1 0 2 および化合物 7-1 から 7-3 4 のいずれか 1 種 1 部を適当量のアセトンに溶解し、これに合成含水酸化珪素微粉末 5 部、P A P O . 3 部およびフバサミクレー 9 3 . 7 部を加え、充分攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の粉剤を得る。

【0330】

製剤例 5

ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩およびホワイトカーボンの混合物（重量比 1 : 1）3 5 部と、上述の化合物 1-1 から 1-5 1、化合物 2-1 から 2-3 4、化合物 3-1 から 3-3 8、化合物 4-1 から 4-1 0 4、化合物 5-1 から 5-3 8、化合物 6-1 から 6-1 0 2 および化合物 7-1 から 7-3 4 のいずれか 1 種 1 0 部と、水 5 5 部とを混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

20

【0331】

製剤例 6

上述の化合物 1-1 から 1-5 1、化合物 2-1 から 2-3 4、化合物 3-1 から 3-3 8、化合物 4-1 から 4-1 0 4、化合物 5-1 から 5-3 8、化合物 6-1 から 6-1 0 2 および化合物 7-1 から 7-3 4 のいずれか 1 種 0 . 1 部をキシレン 5 部およびトリクロロエタン 5 部に溶解し、これを脱臭灯油 8 9 . 9 部に混合して各々の油剤を得る。

30

【0332】

製剤例 7

上述の化合物 1-1 から 1-5 1、化合物 2-1 から 2-3 4、化合物 3-1 から 3-3 8、化合物 4-1 から 4-1 0 4、化合物 5-1 から 5-3 8、化合物 6-1 から 6-1 0 2 および化合物 7-1 から 7-3 4 のいずれか 1 種 1 0 m g をアセトン 0 . 5 m l に溶解し、この溶液を、動物用固形飼料粉末（飼育繁殖用固形飼料粉末 C E - 2、日本クレア株式会社商品）5 g に処理し、均一に混合する。ついでアセトンを蒸発乾燥させて各々の毒餌を得る。

40

【0333】

製剤例 8

上述の化合物 1-1 から 1-5 1、化合物 2-1 から 2-3 4、化合物 3-1 から 3-3 8、化合物 4-1 から 4-1 0 4、化合物 5-1 から 5-3 8、化合物 6-1 から 6-1 0 2 および化合物 7-1 から 7-3 4 のいずれか 1 種 0 . 1 部、ネオチオゾール（中央化成株式会社）4 9 . 9 部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、ジメチルエーテル 2 5 部、L P G 2 5 部を充填し振とうを加え、アクチュエータを装着することで油剤エアゾールを得る。

【0334】

50

製剤例 9

上述の化合物 1-1 から 1-51、化合物 2-1 から 2-34、化合物 3-1 から 3-38、化合物 4-1 から 4-104、化合物 5-1 から 5-38、化合物 6-1 から 6-102 および化合物 7-1 から 7-34 のいずれか 1 種 0.6 部、BHT (2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール) 0.01 部、キシレン 5 部、脱臭灯油 3.39 部および乳化剤 {アトモス 300 (アトモスケミカル社登録商標名)} 1 部を混合溶解したものと、蒸留水 50 部とをエアゾール容器に充填し、バルブを装着した後、該バルブを通じて噴射剤 (LPG) 40 部を加圧充填して水性エアゾールを得る。

【0335】

次に、本発明化合物の有害生物防除効力を試験例により示す。

10

【0336】

試験例 1

製剤例 5 により得られた本発明化合物の製剤を有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

【0337】

ポリエチレンカップに植えた第 2 葉展開期のイネ幼苗に、上記試験用薬液 10 ml を散布した。風乾後、トビイロウンカの 3~4 齢幼虫を 20 頭放して、25℃の温室内に保管した。6 日後イネに寄生したトビイロウンカの数进行调查し、下式により防除価を求めた。

【0338】

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

20

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

【0339】

C_b : 無処理区の処理前の虫数

C_{ai} : 無処理区の観察時の虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

T_{ai} : 処理区の観察時の虫数

その結果、下記の本発明化合物の試験用散布液の処理区が、防除価 90% 以上を示した。

化合物 1-18、2-18、3-18、3-35、4-18、4-24、4-25、4-36、4-38、4-40、4-42、4-46、4-48、4-51、4-84、4-101、4-102、4-103、5-18、5-36、6-18、7-18。

30

【0340】

試験例 2

製剤例 5 により得られた本発明化合物の製剤を有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

【0341】

一方、プラスチックカップに植えたキュウリ幼苗 (第 1 本葉展開期) にワタアブラムシ約 30 頭を接種し、1 日間放置した。この幼苗に、前記希釈液 20 ml を各々散布した。

【0342】

散布 6 日後に該キュウリの葉上に寄生したワタアブラムシ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

40

【0343】

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

【0344】

C_b : 無処理区の処理前の虫数

C_{ai} : 無処理区の観察時の虫数

T_b : 処理区の処理前の虫数

T_{ai} : 処理区の観察時の虫数

その結果、下記の本発明化合物の試験用散布液の処理区が、防除価 90% 以上を示した

50

。

化合物 1-18、2-18、3-18、4-18、4-24、4-25、4-36、4-40、4-46、4-48、4-51、4-84、4-101、4-102、5-18、5-36、6-18、7-18。

【産業上の利用可能性】

【0345】

本発明化合物は、有害生物の防除に有用である。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 0 1 N 43/653	G
C 0 7 D 409/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 6 1 K 31/4436 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
C 0 7 D 405/04 (2006.01)	C 0 7 D 409/04	
A 6 1 K 31/443 (2006.01)	A 6 1 K 31/4436	
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	C 0 7 D 405/04	
	A 6 1 K 31/443	
	A 6 1 K 31/4439	

F ターム (参考) 4C086 AA01 AA02 AA03 BC17 BC36 BC60 GA02 GA04 GA07 GA08
 MA01 MA04 MA63 NA14 ZB37
 4H011 AC01 BA01 BB09 DA01 DA02 DA15 DA16 DA21 DC04 DC05
 DC06 DC08