

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6428773号
(P6428773)

(45) 発行日 平成30年11月28日(2018.11.28)

(24) 登録日 平成30年11月9日(2018.11.9)

(51) Int. Cl.		F I	
AO 1 N 43/90	(2006.01)	AO 1 N 43/90	1 0 4
AO 1 N 43/52	(2006.01)	AO 1 N 43/52	
AO 1 N 47/02	(2006.01)	AO 1 N 47/02	
AO 1 N 43/76	(2006.01)	AO 1 N 43/90	1 0 3
AO 1 P 7/04	(2006.01)	AO 1 N 43/76	1 0 1

請求項の数 9 (全 46 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2016-531293 (P2016-531293)	(73) 特許権者	000002093
(86) (22) 出願日	平成27年6月24日(2015.6.24)		住友化学株式会社
(86) 国際出願番号	PCT/JP2015/068168		東京都中央区新川二丁目27番1号
(87) 国際公開番号	W02016/002595	(74) 代理人	100113000
(87) 国際公開日	平成28年1月7日(2016.1.7)		弁理士 中山 亨
審査請求日	平成30年1月31日(2018.1.31)	(74) 代理人	100151909
(31) 優先権主張番号	特願2014-138434 (P2014-138434)		弁理士 坂元 徹
(32) 優先日	平成26年7月4日(2014.7.4)	(72) 発明者	西村 慎哉
(33) 優先権主張国	日本国(JP)		兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
(31) 優先権主張番号	特願2014-162206 (P2014-162206)	(72) 発明者	赤山 敦夫
(32) 優先日	平成26年8月8日(2014.8.8)		東京都中央区新川二丁目27番1号 住友化学株式会社内
(33) 優先権主張国	日本国(JP)		
(31) 優先権主張番号	特願2014-194870 (P2014-194870)		
(32) 優先日	平成26年9月25日(2014.9.25)		
(33) 優先権主張国	日本国(JP)		

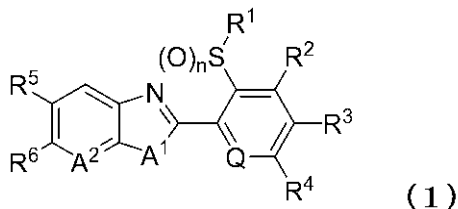
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 有害生物防除組成物およびその用途

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)：



【式中、

A¹ は -NR⁷ -、酸素原子又は硫黄原子を表し、A² は =N -、=N(O) - 又は =CR⁸ - を表し、

Q は =N - 又は =N(O) - を表し、

R¹ は群 X 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 アルキル基を表し、R²、R³ 及び R⁴ は同一又は相異なり、群 X 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 アルキル基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、-S(O)₂NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰CO₂R¹¹、-NR¹⁰C(O)R¹¹、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、-C(O)NR¹⁰R¹¹、-SF₅、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

10

20

R⁵ 及び R⁶ は同一又は相異なり、群 X 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 アルキル基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、-S(O)₂NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰CO₂R¹¹、-NR¹⁰C(O)R¹¹、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、-C(O)NR¹⁰R¹¹、-OC(O)R¹⁰、-SF₅、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し(但し、R⁵ 及び R⁶ が同時に水素原子を表すことはない)、

R⁷ は群 W 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 アルキル基、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、-CH₂CO₂R¹⁰、C₃ - C₆ シクロアルキル基又は水素原子を表し、

R⁸ は 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、-OR¹⁰、
-S(O)_mR¹⁰、-NR¹⁰R¹¹、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、シアノ基、
ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R¹⁰ 及び R¹¹ は同一又は相異なり、群 X 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 アルキル基又は水素原子を表し(但し、-S(O)_mR¹⁰ において、m が 1 又は 2 の場合には、R¹⁰ が水素原子を表すことはない)、
m はそれぞれ独立して、0、1 又は 2 を表し、n は 0、1 又は 2 を表す。

群 X: 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、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C₁ - C₃ アルキル基を有していてもよい C₃ - C₆ シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群 W: 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、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C₃ - C₆ シクロアルキル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子及びシアノ基からなる群。] で示される化合物と、2, 4 - ジオキソ - 1 - (5 - ピリミジニルメチル) - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジニウム分子内塩とを含有する有害生物防除組成物。

【請求項 2】

A¹ が -NMe-、酸素原子又は硫黄原子であり、

A² が =N-、=N(O)- 又は =CH- であり、

R¹ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C₁ - C₆ アルキル基であり、

R² 及び R⁴ が水素原子であり、

R³ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C₁ - C₃ アルキル基又は水素原子であり、

R⁵ が 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、-OR¹⁰、又は -S(O)_mR¹⁰ であり、

R⁶ が -NR¹⁰R¹¹ 又は水素原子であり、

R¹⁰ 及び R¹¹ が各々独立して 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C₁ - C₃ アルキル基である、

請求項 1 に記載の有害生物防除組成物。

【請求項 3】

A¹ が -NMe- である請求項 1 または請求項 2 に記載の有害生物防除組成物。

【請求項 4】

A¹ が酸素原子である請求項 1 または請求項 2 に記載の有害生物防除組成物。

【請求項 5】

式 (1) で示される化合物と、2, 4 - ジオキソ - 1 - (5 - ピリミジニルメチル) - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジニウム分子内塩との含有量の比が、重量比で 100 : 1 ~ 1 : 100 である請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の有害生物防除組成物。

【請求項 6】

式 (1) で示される化合物と、2, 4 - ジオキソ - 1 - (5 - ピリミジニルメチル) - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジニウム分子内塩との含有量の比が、重量比で 10 : 1 ~ 1 : 10 である請求項 1 ~ 4 のいずれ

10

20

30

40

50

かに記載の有害生物防除組成物。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の有害生物防除組成物の有効量を、有害生物又は有害生物の生息場所に施用する工程を有する有害生物の防除方法。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の有害生物防除組成物の有効量を、植物、植物種子、球根又は植物を栽培する土壤に施用する工程を有する有害生物の防除方法。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の有害生物防除組成物の有効量を付着させた植物種子または球根。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、有害生物防除組成物及び有害生物の防除方法に関する。

【背景技術】

【0002】

従来、有害生物防除組成物の有効成分として、多くの化合物が知られている（例えば、非特許文献 1 参照。）。

【先行技術文献】

【特許文献】

20

【0003】

【特許文献 1】国際公開第 2013/018928 号

【特許文献 2】国際公開第 2012/092115 号

【特許文献 3】国際公開第 2014/104407 号

【非特許文献】

【0004】

【非特許文献 1】The Pesticide Manual - 16th edition (BCPC 刊) ISBN ISBN 9781901396867

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

30

【0005】

本発明は、有害生物に対する優れた防除効力を有する有害生物防除組成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】

【0006】

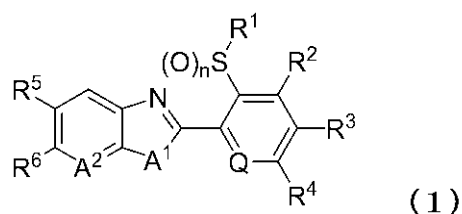
本発明者は、有害生物に対する優れた防除効力を有する有害生物防除組成物を見出すべく検討した結果、下記式 (1) で示される化合物と、2,4-ジオキソ-1-(5-ピリミジニルメチル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2H-ピリド[1,2-a]ピリミジニウム分子内塩（以下、トリフルメゾピリン (Triflumezopyrim) と記す）とを含有する組成物が、有害生物に対する優れた防除効力を有することを見出した。

40

【0007】

本発明は以下の通りである。

項 1. 式 (1) :



50

[式中、

A^1 は $-NR^7-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、 A^2 は $=N-$ 、 $=N(O)-$ 又は $=CR^8-$ を表し、 Q は $=N-$ 又は $=N(O)-$ を表し、 R^1 は群 X 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 アルキル基を表し、 R^2 、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、群 X 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 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}CO_2R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、 R^5 及び R^6 は同一又は相異なり、群 X 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 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}CO_2R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-OC(O)R^{10}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し (但し、 R^5 及び R^6 が同時に水素原子を表すことはない)、 R^7 は群 W 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 アルキル基、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-CH_2CO_2R^{10}$ 、C3 - C6 シクロアルキル基又は水素原子を表し、 R^8 は 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、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、 R^{10} 及び R^{11} は同一又は相異なり、群 X 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 アルキル基又は水素原子を表し (但し、 $-S(O)_mR^{10}$ において、 m が 1 又は 2 の場合には、 R^{10} が水素原子を表すことはない)、 m はそれぞれ独立して、0、1 又は 2 を表し、 n は 0、1 又は 2 を表す。群 X：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、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C1 - C3 アルキル基を有していてもよい C3 - C6 シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群 W：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、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C3 - C6 シクロアルキル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子及びシアノ基からなる群。] で示される化合物と、2, 4 - ジオキソ - 1 - (5 - ピリミジニルメチル) - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジニウム分子内塩 (トリフルメゾピリン) とを含有する有害生物防除組成物 (以下、本発明組成物と記す)。

項 2. A^1 が $-NMe-$ 、酸素原子又は硫黄原子であり、 A^2 が $=N-$ 、 $=N(O)-$ 又は $=CH-$ であり、 R^1 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1 - C6 アルキル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1 - C3 アルキル基又は水素原子であり、 R^5 が 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、 $-OR^{10}$ 、又は $-S(O)_mR^{10}$ であり、 R^6 が $-NR^{10}R^{11}$ 又は水素原子であり、 R^{10} 及び R^{11} が各々独立して 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1 - C3 アルキル基である、項 1 に記載の有害生物防除組成物。

項 3. A^1 が $-NMe-$ である項 1 または項 2 に記載の有害生物防除組成物。

項 4. A^1 が酸素原子である項 1 または項 2 に記載の有害生物防除組成物。

項 5. 式 (1) で示される化合物と、2, 4 - ジオキソ - 1 - (5 - ピリミジニルメチル) - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジニウム分子内塩との含有量の比が、重量比で 100 : 1 ~ 1 : 100 である項 1 ~ 4 のいずれかに記載の有害生物防除組成物。

項 6. 式 (1) で示される化合物と、2, 4 - ジオキソ - 1 - (5 - ピリミジニルメチル) - 3 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2H - ピリド [1, 2 - a] ピリミジニウム分子内塩との含有量の比が、重量比で 10 : 1 ~ 1 : 10 である請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の有害生物防除組成物。

10

20

30

40

50

項 7 . 項 1 ~ 6 のいずれかに記載の有害生物防除組成物の有効量を、有害生物又は有害生物の生息場所に施用する工程を有する有害生物の防除方法。

項 8 . 項 1 ~ 6 のいずれかに記載の有害生物防除組成物の有効量を、植物、植物種子、球根又は植物を栽培する土壌に施用する工程を有する有害生物の防除方法。

項 9 . 項 1 ~ 6 のいずれかに記載の有害生物防除組成物の有効量を付着させた植物種子または球根。

【発明の効果】

【 0 0 0 8 】

本発明により、有害生物を防除することができる。

【発明を実施するための形態】

【 0 0 0 9 】

本発明の有害生物防除組成物は、前記式 (1) で示される化合物 (以下、本化合物と記す場合がある。) とトリフルメゾピリン (*T r i f l u m e z o p y r i m*) とを含有する。

【 0 0 1 0 】

本明細書の記載において用いられる基について、以下に説明する。

【 0 0 1 1 】

本明細書における $C a - C b$ アルキル基の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ である直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、

$C a - C b$ ハロアルキル基の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって 1 個以上置換された、炭素原子数が $a \sim b$ である直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2 個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよく、

$C a - C b$ アルコキシ基の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ である直鎖状又は分岐鎖状のアルキル - O - 基を表し、

$C a - C b$ シクロアルキル基の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ である環状の飽和炭化水素基を表す。

【 0 0 1 2 】

本明細書における「群 X 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」の表記は、群 X より選ばれる 2 個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群 X より選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

本明細書における「群 W 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」の表記は、群 W より選ばれる 2 個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群 W より選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

本明細書における「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい」の表記は、2 個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

【 0 0 1 3 】

本化合物において、「ハロゲン原子」とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を意味する。

【 0 0 1 4 】

本化合物において「群 X 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 $C 1 - C 6$ アルキル基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群 X より選ばれる原子もしくは基によって任意に置換された、炭素原子数が 1 ~ 6 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の飽和炭化水素基を表し、このとき、群 X より選ばれる 2 個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群 X より選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「群 X 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 $C 1 - C 6$ 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、ネオペンチル基、ヘキ

10

20

30

40

50

シル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロルオキシメチル基、ブチルオキシメチル基、*sec*-ブチルオキシメチル基、*tert*-ブチルオキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-プロピルオキシエチル基、2-イソプロピルオキシエチル基、2-ブチルオキシエチル基、2-*sec*-ブチルオキシエチル基、2-*tert*-ブチルオキシエチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、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及びペンタフルオロエチル基、2-ヒドロキシエチル基、シクロプロピルメチル基、1-メチルシクロプロピルメチル基、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル基、トリメトキシメチル基、トリエトキシメチル基等の群X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アルキル基が挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【0015】

本化合物において「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」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が1~6個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「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、ネオペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、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及びペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基等の1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基が挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

【0016】

本化合物において「群W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、ネオペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、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、ペンタフルオロエチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピルオキシメチル基、ブチルオキシメチル基、*sec*-ブチルオキシメチル基、イソブチルオキシメチル基、*tert*-ブチルオキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、プロピルオキシエチル基、イソプロピルオキシエチル基、ブチルオキシエチル基、*sec*-ブチルオキシエチル基、イソブチルオキシエチル基、*tert*-ブチルオキシエチル基等の群W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アルキル基が挙げられる。このとき、群Wより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Wより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

30

【0017】

本化合物において「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、トリフルオロメトキシ基、エトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、*sec*-ブチルオキシ基、*tert*-ブチルオキシ基、ペンチルオキシ基及びヘキシルオキシ基が挙げられる。

40

【0018】

本化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、2,2-ジフルオロシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジブromoシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

50

【 0 0 1 9 】

本化合物において「1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1 - C3アルキル基を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、1 - メチルシクロプロピル基、2 - メチルシクロプロピル基、1 - フルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジフルオロシクロプロピル基、2, 2 - ジクロロシクロプロピル基、2, 2 - ジブromoシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

【 0 0 2 0 】

本化合物において「C1 - C3ハロアルキル基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって1個以上置換された、炭素原子数が1 ~ 3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「C1 - C3ハロアルキル基」としては、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブromोजiフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2 - フルオロエチル基、2 - クロロエチル基、2 - ブromo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、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

【 0 0 2 1 】

本化合物において「C1 - C3アルキル基」としては、メチル基、エチル基、プロピル基及びイソプロピル基が挙げられる。

【 0 0 2 2 】

本化合物において「C1 - C3パーフルオロアルキル基」としては、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基が挙げられる。

【 0 0 2 3 】

本化合物の態様としては、例えば下記の[表1] ~ [表20]に示される式(1)で表される化合物が挙げられる。

【 0 0 2 4 】

10

20

【表 1】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
1	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
2	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
3	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
4	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
5	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
6	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
7	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
8	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
9	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	0	N
10	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	N	0	N
11	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	N	2	N
12	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	2	N
13	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
14	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
15	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
16	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
17	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
18	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
19	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
20	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	NMe	N	2	N
21	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	0	N
22*	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N(→O)	2	N
23	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	0	N
24	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	2	N
25	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

10

20

30

【 0 0 2 5 】

【表 2】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
26	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	0	N
27	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
28	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
29	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
30	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
31	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	1	N
32	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	2	N
33	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
34	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	1	N
35	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	2	N
36*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N(→O)
37*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N
38	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	0	N
39	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	1	N
40	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
41	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	0	N
42	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	N	0	N
43	Et	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	N	0	N
44	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
45	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	0	N
46	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	2	N
47*	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N(→O)
48*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N
49	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	0	N
50	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	2	N

10

20

30

40

【表 3】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
51*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N(→O)
52	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
53	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	2	N
54	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
55	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	2	N
56	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	CH	2	N
57	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
58	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
59	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N	0	N
60	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	NMe	N	2	N
61	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	0	N
62	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	1	N
63	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	2	N
64	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	NMe	CH	2	N
65	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	0	N
66	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	0	N
67	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	2	N
68	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	N	2	N
69	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N	2	N
70*	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	N(→O)	2	N
71	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
72	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
73	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
74	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
75	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	0	N

10

20

30

40

【表 4】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
76	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	0	N
77	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	2	N
78	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	N	0	N
79	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	N	2	N
80	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	0	N
81	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	2	N
82	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	N	0	N
83	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	N	2	N
84	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
85	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	2	N
86	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
87	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	2	N
88	Et	H	H	H	CF ₃	Cl	NMe	N	2	N
89	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	NMe	N	2	N
90	Et	H	H	H	CF ₃	OC(O)Me	NMe	N	2	N
91	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OC(O)Me	NMe	N	2	N
92	Et	H	H	H	CF ₃	OH	NMe	N	2	N
93	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OH	NMe	N	2	N
94	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	N	2	N
95	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OMe	NMe	N	2	N
96	Et	H	H	H	CF ₃	SMe	NMe	N	2	N
97	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	SMe	NMe	N	2	N
98	Et	H	H	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	N	2	N
99	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	N	2	N
100	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

10

20

30

40

【表 5】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
101	CH ₂ CycPr	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
102	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
103	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
104	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
105	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
106	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
107	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
108	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	2	N
109	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
110	Et	H	SCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
111	Et	H	S(O)CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
112	Et	H	S(O) ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
113	Et	H	CF(CF ₃) ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
114	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
115	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
116	Et	H	I	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
117	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
118	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
119	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
120	Et	H	CF ₃	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
121	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	N	2	N
122	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
123	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
124	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
125	Et	H	CF ₃	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

10

20

30

40

【表 6】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
126	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
127	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
128	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	2	N
129	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	2	N
130	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	2	N
131	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CCN	2	N
132	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CF	2	N
133	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	2	N
134	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CMe	2	N
135	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	2	N
136	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	COMe	2	N
137	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	COMe	2	N
138	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	2	N
139	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	2	N
140	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2	N
141	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₂ CH ₃	2	N
142	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
143	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
144	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
145	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
146	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
147	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
148	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
149	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
150	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

10

20

30

40

【表 7】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
151	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
152	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
153	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
154	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
155	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
156	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	0	N
157	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	1	N
158	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	N	2	N
159	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	0	N
160	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	1	N
161	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	N	2	N
162	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	0	N
163	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	1	N
164	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	N	2	N
165	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	0	N
166	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	1	N
167	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	N	2	N
168	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	0	N
169	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	1	N
170	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	2	N
171	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	N	0	N
172	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	0	N
173	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	1	N
174	Et	H	H	H	Me	H	NMe	N	2	N
175	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N

10

20

30

40

【表 8】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
176	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	1	N
177	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	2	N
178	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	1	N
179	Et	H	H	H	I	H	NMe	N	2	N
180	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	0	N
181	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	1	N
182	Et	H	H	H	CN	H	NMe	N	2	N
183	Et	H	H	H	CHO	H	NMe	N	0	N
184	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	0	N
185	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	1	N
186	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	N	2	N
187	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	0	N
188	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	0	N
189	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	1	N
190	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCl	2	N
191	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CBr	1	N
192	Me	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	0	N
193	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	1	N
194	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	N	1	N
195	Me	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	0	N
196	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	1	N
197	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
198	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
199	Et	H	H	H	COCF ₃	H	NMe	N	0	N
200	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	0	N

10

20

30

40

【表 9】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
201	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	1	N
202	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	N	2	N
203	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
204	Et	H	H	SEt	CF ₃	H	NMe	N	0	N
205	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	0	N
206	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	N	0	N
207	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Et	N	0	N
208	Et	H	H	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₂ OMe	N	0	N
209	Et	H	H	H	CF ₃	H	NBu	N	0	N
210	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	N	0	N
211	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	N	0	N
212	Et	H	H	H	CHF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
213	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
214	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
215	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
216	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
217	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
218	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
219	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
220	Et	H	OH	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
221	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	N	0	N
222	Et	H	H	H	CHF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
223	Et	H	H	H	CHF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
224	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
225	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N

10

20

30

40

【表 10】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
226	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
227	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
228	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
229	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
230	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
231	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	0	N
232	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	N	1	N
233	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	0	N
234	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	1	N
235	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	N	2	N
236	Et	H	H	H	SH	H	NMe	N	0	N
237	Et	H	H	H	Et	H	NMe	N	0	N
238	Et	H	H	H	iPr	H	NMe	N	0	N
239	Et	H	H	H	NHEt	H	NMe	N	0	N
240	Et	H	H	H	NEt ₂	H	NMe	N	0	N
241	Et	H	H	H	tBu	H	NMe	N	0	N
242	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	0	N
243	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
244	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
245	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
246	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	1	N
247	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	2	N
248	Et	H	H	H	NMe ₂	H	NMe	N	0	N
249	Et	H	H	H	NHCOMe	H	NMe	N	0	N
250	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N

10

20

30

40

【表 1 1】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
251	Et	H	H	H	NMeCOMe	H	NMe	N	0	N
252	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	N	1	N
253	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
254	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	0	N
255	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	1	N
256	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	N	2	N
257	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	N	1	N
258	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
259	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
260	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
261	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
262	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
263	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
264	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
265	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	0	N
266	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	1	N
267	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	N	2	N
268	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
269	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
270	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
271	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
272	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
273	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
274	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
275	Et	H	H	H	SMe	H	NMe	N	0	N

10

20

30

40

【表 1 2】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
276	Et	H	H	H	S(O) ₂ Me	H	NMe	N	2	N
277	Et	H	H	H	SEt	H	NMe	N	0	N
278	Et	H	H	H	S(O) ₂ Et	H	NMe	N	2	N
279	Et	H	H	H	S(O) ₂ iPr	H	NMe	N	2	N
280	Et	H	H	H	SCH ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
281	Et	H	H	H	S(O) ₂ CH ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
282	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
283	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
284	Et	H	H	H	SCF(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
285	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	N	0	N
286	Et	H	H	H	CH(Cl)CF ₃	H	NMe	N	0	N
287	Et	H	H	H	OH	H	NMe	N	0	N
288	Et	H	H	H	OH	H	NMe	N	2	N
289	Et	H	H	H	OCF ₂ Br	H	NMe	N	2	N
290	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	N	2	N
291	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
292	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
293	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
294	Et	H	H	H	tBu	H	NMe	N	0	N
295	Et	H	H	H	S(O) ₂ tBu	H	NMe	N	2	N
296	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	0	N
297	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	1	N
298	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	N	2	N
299	Et	H	I	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
300	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N

10

20

30

40

【表 1 3】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
301	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
302	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
303	Et	H	I	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
304	Et	H	I	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
305	Et	H	Br	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
306	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	N	0	N
307	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	N	2	N
308	Et	H	H	H	C(OH)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
309	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	0	N
310	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	1	N
311	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	N	2	N
312	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
313	Et	H	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	NMe	CH	0	N
314	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	0	N
315	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	N	2	N
316	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	1	N
317	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	1	N
318	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	0	N
319	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	1	N
320	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
321	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
322	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
323	Et	H	H	H	I	H	S	N	0	N
324	Et	H	CF ₃	H	I	H	S	N	0	N
325	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	0	N

10

20

30

40

【表 1 4】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
326	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	0	N
327	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	2	N
328	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	N	2	N
329	Et	H	Et	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
330	Et	H	H	H	S(O) ₂ NMe ₂	H	NMe	N	1	N
331	Et	H	H	H	S(O) ₂ NMe ₂	H	NMe	N	2	N
332	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CNH ₂	0	N
333	Et	H	Br	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
334	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CNMe ₂	0	N
335	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CNH ₂	0	N
336	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CNMe ₂	0	N
337	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
338	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
339	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
340	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NH	CH	0	N
341	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
342	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	1	N
343	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	2	N
344	Et	H	H	H	Br	H	NMe	N	0	N
345	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	N	1	N
346	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	0	N
347	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NEt	N	2	N
348	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CN	N	2	N
349	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	N	2	N
350	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NPr	N	2	N

10

20

30

40

【表 15】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
351	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₃ CH ₃	N	2	N
352	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	N	2	N
353	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	N	2	N
354	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ Me	N	2	N
355	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCOMe	N	2	N
356	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
357	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
358	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
359	Et	H	NH ₂	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
360	Et	H	NHCOCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
361	Et	H	iPr	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
362	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
363	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
364	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
365	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
366	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
367	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
368	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
369	Et	H	CF ₂ H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
370	Et	H	CH ₂ OH	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
371	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
372	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
373	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
374	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
375	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N

10

20

30

40

【表 16】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
376	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
377	Et	H	CH ₂ F	H	CF ₃	H	NMe	N	2	N
378	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	0	N
379	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	2	N
380	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
381	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	1	N
382	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
383	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	0	N
384	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CMe	1	N
385	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	0	N
386	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CF	1	N
387	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	0	N
388	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	1	N
389	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	0	N
390	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₂ CH ₃	0	N
391	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	0	N
392	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	1	N
393	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	N	2	N
394	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	1	N
395	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CBr	2	N
396	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	N	0	N
397	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	N	2	N
398	Et	H	H	H	CF ₃	CN	NMe	N	2	N
399	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CN	NMe	N	2	N
400*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)

10

20

30

40

【表 17】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
401*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)
402	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	COMe	0	N
403	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CSCH ₃	0	N
404	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₃	2	N
405	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CS(O) ₂ CH ₂ CF ₃	2	N
406	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	0	N
407	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	COOH	NMe	N	2	N
408	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CONH ₂	NMe	N	2	N
409*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N
410*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N(→O)	2	N(→O)
411	Et	H	CF ₃	H	COOH	H	NMe	N	0	N
412	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCN	1	N
413	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CCF ₃	0	N
414	Et	H	C(OCH ₃) ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
415	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	0	N
416	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	2	N
417	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCF ₃	2	N
418	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
419	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
420	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
421	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
422	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
423	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
424	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
425	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N

10

20

30

40

【表 18】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
426	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
427	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
428	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
429	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
430	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
431	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
432	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	0	N
433	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	N	2	N
434	Et	H	CF ₃	H	CN	H	NMe	N	0	N
435	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CCF ₃	0	N
436	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	0	N
437	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	1	N
438	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	N	2	N
439	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	N	2	N
440	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N
441	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	0	N
442	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	1	N
443	Et	H	H	H	SCF ₃	H	O	CH	2	N
444	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	2	N
445	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
446	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	0	N
447	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	1	N
448	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	N	2	N
449	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	N	2	N
450	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N

10

20

30

40

【表 19】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
451	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	CH	0	N
452	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	CH	1	N
453	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	O	CH	2	N
454	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	2	N
455	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
456*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N(→O)	2	N
457*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N(→O)	2	N
458*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N(→O)
459*	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N(→O)
460*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	2	N(→O)
461*	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N(→O)
462	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	0	N
463	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	1	N
464	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	2	N
465	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N
466	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	1	N
467	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
468	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	0	N
469	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	1	N
470	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	N	2	N
471	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N
472	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	1	N
473	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	O	CH	2	N
474	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	N	0	N
475	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	0	N

10

20

30

40

【表 20】

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	n	Q
476	Et	H	H	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	0	N
477	Et	H	H	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N
478	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	N	0	N
479	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	N	0	N
480	Et	H	CF ₃	H	S(O)CF ₃	H	O	CH	0	N
481	Et	H	CF ₃	H	S(O) ₂ CF ₃	H	O	CH	0	N

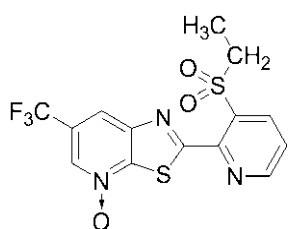
10

【0044】

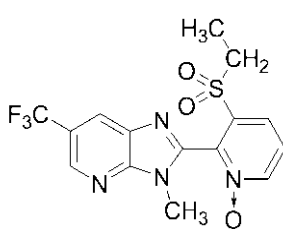
ここで上記の表〔表1〕～〔表20〕の本化合物における「*」の記載は、N-オキシドであることを意味する。具体的には下記の化合物である。

【0045】

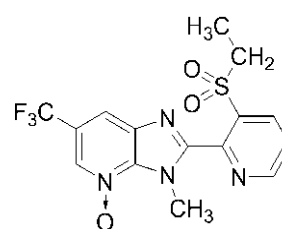
本化合物 2 2



本化合物 3 6



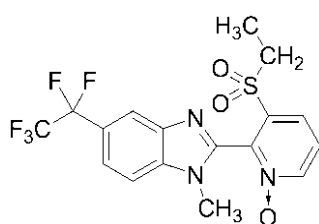
本化合物 3 7



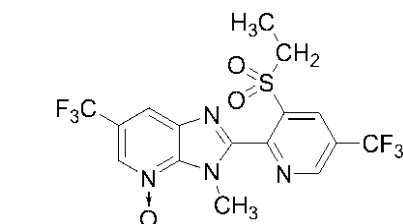
20

【0046】

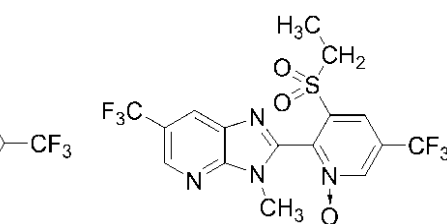
本化合物 4 7



本化合物 4 8



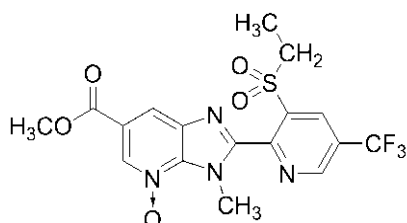
本化合物 5 1



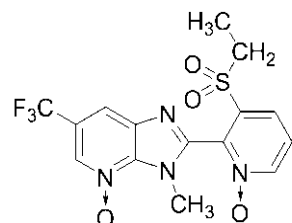
30

【0047】

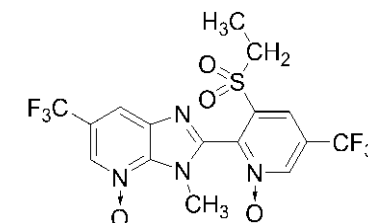
本化合物 7 0



本化合物 4 0 0



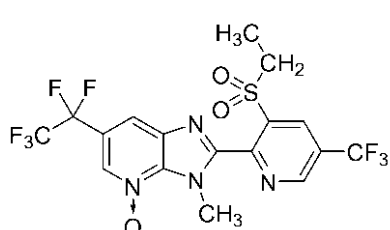
本化合物 4 0 1



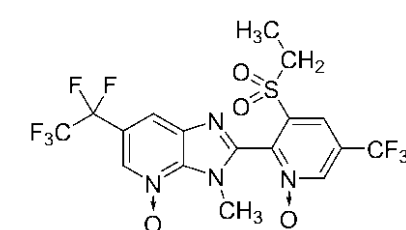
40

【0048】

本化合物 4 0 9



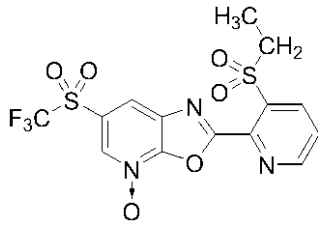
本化合物 4 1 0



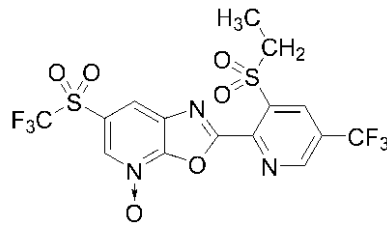
50

【 0 0 4 9 】

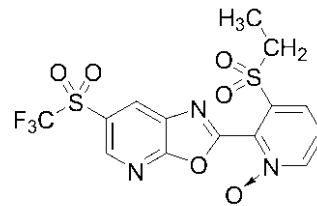
本化合物 4 5 6



本化合物 4 5 7



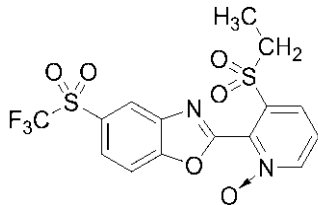
本化合物 4 5 8



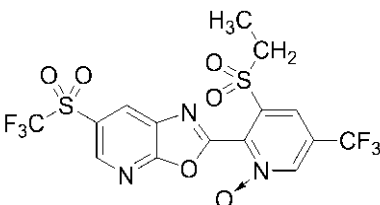
10

【 0 0 5 0 】

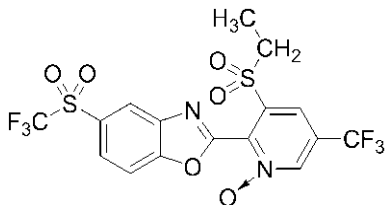
本化合物 4 5 9



本化合物 4 6 0



本化合物 4 6 1



【 0 0 5 1 】

上記の〔表 1〕～〔表 2 0〕において、Me はメチル基を表し、Et はエチル基を表し、Pr はプロピル基を表し、Bu はブチル基を表し、t Bu はターシャリーブチル基を表し、i Pr はイソプロピル基を表し、Cyc Pr はシクロプロピル基を表し、Cyc Bu はシクロブチル基を表す。

20

【 0 0 5 2 】

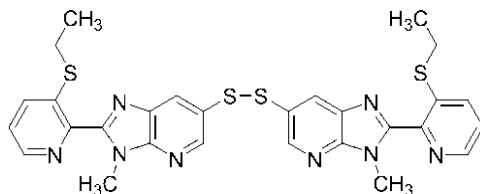
これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 3 / 0 1 8 9 2 8 号、又は国際公開第 2 0 1 4 / 1 0 4 4 0 7 号に記載される方法により製造することができる。一部の化合物について、製造法を以下に記載する。

【 0 0 5 3 】

製造例 1 (1)

2 - (3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - イル) - 6 - ヨード - 3 - メチル - 3 H イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 1 . 1 g、ヨウ化銅 1 6 0 m g、硫化ナトリウム 9 水和物 2 . 7 g、及び N , N - ジメチルホルムアミド (以下、DMF と記す) 1 0 m L の混合物を、1 1 0 ℃ で 5 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、下式

30



40

で示される化合物 (以下、化合物 (1 - 1) と記す。) 7 1 0 m g を得た。

¹ H - NMR (DMSO - D₆) : 8 . 5 6 - 8 . 5 5 (2 H , m) , 8 . 5 3 - 8 . 5 0 (2 H , m) , 8 . 3 8 - 8 . 3 6 (2 H , m) , 8 . 0 4 (2 H , d) , 7 . 6 1 - 7 . 5 6 (2 H , m) , 3 . 8 7 (6 H , b r s) , 3 . 0 0 (4 H , q) , 1 . 2 3 - 1 . 1 6 (6 H , m) .

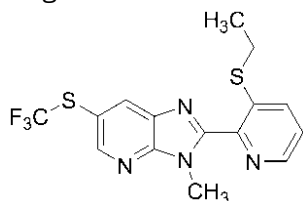
【 0 0 5 4 】

製造例 1 (2)

化合物 (1 - 1) 7 1 0 m g 及び DMF 1 2 m L の混合物を、- 6 0 ℃ に冷却し、トリフルオロヨードメタン 1 0 g を加えた。この混合物に、- 4 0 ℃ でテトラキス (ジメチルア

50

ミノ) エチレン 1.2 mL を滴下した。-10℃まで昇温し、-10℃で5時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本化合物13と記す。)530 mgを得た。



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.67 (1H, d), 8.52 (1H, dd), 8.46 (1H, d), 7.79 (1H, dd), 7.39 (1H, dd), 4.03 (3H, s), 2.97 (2H, q), 1.36 (3H, t).

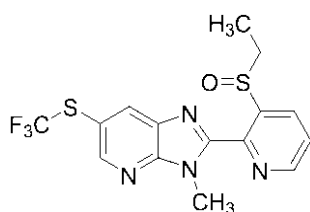
【0055】

製造例 2

本化合物13を200 mg、*m*-クロロ過安息香酸(純度65%以上)230 mg、及びクロロホルム10 mLの混合物を、氷冷下5時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルフィニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本化合物14と記す。)89 mg及び2-(3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本化合物15と記す。)130 mgを得た。

20

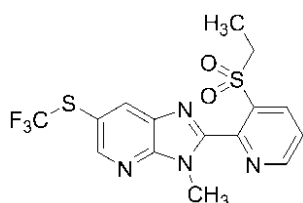
本化合物 14



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.87 - 8.83 (1H, m), 8.73 - 8.64 (2H, m), 8.41 (1H, d), 7.72 - 7.66 (1H, m), 4.34 (3H, s), 3.72 - 3.62 (1H, m), 3.17 - 3.05 (1H, m), 1.47 (3H, t).

本化合物 15



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.01 - 8.98 (1H, m), 8.71 (1H, d), 8.55 - 8.52 (1H, m), 8.39 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 3.90 - 3.81 (5H, m), 1.36 (3H, t).

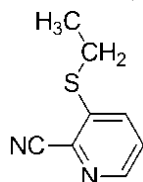
【0056】

製造例 3 (1)

3-クロロ-2-シアノピリジン1.39 g、エチルメルカプタン0.9 mL及びDM

50

F 1 0 m l の混合物に、氷冷下、水素化ナトリウム（60%、油状）0.52 g を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-シアノ-3-エチルスルファニルピリジン1.52 g を得た。

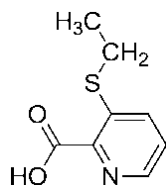


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.49 (1H, dd), 7.75 (1H, dd), 7.43 (1H, dd), 3.06 (2H, q), 1.38 (3H, t).

【0057】

製造例3(2)

濃硫酸15ml及び水5mlの混合物に、2-シアノ-3-エチルスルファニルピリジン1.4gを加え、130で2時間攪拌した。室温に放冷した反応混合物に水酸化カリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた水層に濃塩酸を加え、クロロホルムで抽出した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、3-エチルスルファニルピコリン酸1.15gを得た。



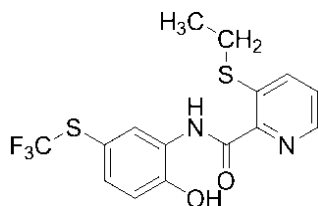
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.31 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.49 (1H, dd), 2.97 (2H, q), 1.44 (3H, t).

【0058】

製造例3(3)

2-アミノ-4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェノール(国際公開第2009/131237号に記載の方法で合成)1.0g、3-エチルスルファニルピコリン酸0.87g、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩1.10g及びクロロホルム10mlの混合物を、室温で30分間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-エチルスルファニル-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]ピコリンアミド(以下、化合物3-3と記す)1.32gを得た。

化合物3-3



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 10.40 (1H, brs), 9.63 (1H, s), 8.36 (1H, dd), 7.75 (1H, dd), 7.53 (1H, d), 7.45 (1H, dd), 7.41 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 2.97 (2H, q), 1.44 (3H, t).

【0059】

製造例3(4)

10

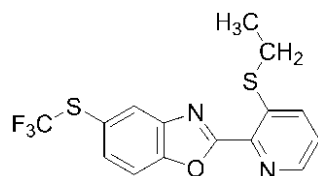
20

30

40

50

化合物 3 - 3 を 1 . 2 3 g、ジ - 2 - メトキシエチルアゾジカルボキシレート 1 . 2 8 g、トリフェニルホスフィン 1 . 3 9 g 及びテトラヒドロフラン 3 0 m l の混合物を、室温で 1 時間及び 5 0 で 1 時間攪拌した。室温に放冷した反応混合物を減圧下濃縮した後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 - (3 - エチルスルファニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール (以下、本化合物 4 4 1 と記す) 1 . 2 1 g を得た。



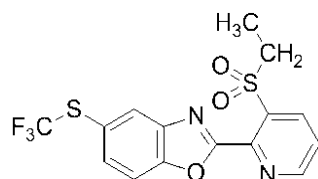
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8 . 5 9 (1 H , d d) , 8 . 2 7 (1 H , s) , 7 . 7 8 (1 H , d d) , 7 . 7 5 - 7 . 6 9 (2 H , m) , 7 . 4 2 (1 H , d d) , 3 . 0 7 (2 H , q) , 1 . 4 7 (3 H , t) .

【 0 0 6 0 】

製造例 4

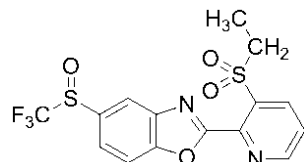
本化合物 4 4 1 (1 . 0 6 g) 及びクロロホルム 3 0 m l の混合物に、氷冷下、*m*-クロロ過安息香酸 (純度 6 5 % 以上) 1 . 4 7 g を添加した後、室温で 6 時間攪拌した。反応混合物に 1 0 % 亜硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 - (3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズオキサゾール (以下、本化合物 4 4 3 と記す) 0 . 8 7 g 及び 2 - (3 - エチルスルホニルピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルスルフィニル) ベンズオキサゾール (以下、本化合物 4 4 4 と記す) 0 . 1 7 g を得た。

本化合物 4 4 3



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9 . 0 3 (1 H , d d) , 8 . 6 0 (1 H , d d) , 8 . 1 9 (1 H , d) , 7 . 8 0 - 7 . 7 1 (3 H , m) , 4 . 0 2 (2 H , q) , 1 . 4 3 (3 H , t) .

本化合物 4 4 4



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9 . 0 4 (1 H , d d) , 8 . 6 1 (1 H , d d) , 8 . 3 5 (1 H , d) , 7 . 9 6 - 7 . 8 6 (2 H , m) , 7 . 7 7 (1 H , d d) , 4 . 0 1 (2 H , q) , 1 . 4 4 (3 H , t) .

【 0 0 6 1 】

製造例 5

本化合物 4 4 3 を 0 . 3 5 g 及びクロロホルム 8 m l の混合物に、氷冷下、*m*-クロロ過安息香酸 (純度 6 5 % 以上) 0 . 4 3 g を添加した後、4 0 で 6 時間攪拌した。室温に放冷した反応混合物に 1 0 % 亜硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した

10

20

30

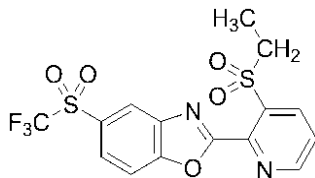
40

50

。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣にアセトニトリル 4 ml、タンゲステン酸ナトリウム 2 水和物 30 mg 及び過酸化水素水 (30%) 4 ml を加え、80℃ で 6 時間攪拌した。室温に放冷した反応混合物に水を加え、析出した固体をろ取り、ろ液に 10% 亜硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズオキサゾール(以下、本化合物 445) 0.35 g を得た。

本化合物 445

10

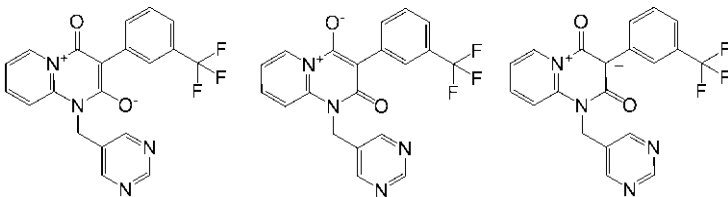
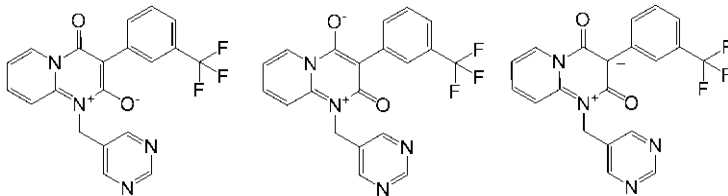


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 9.05 (1H, dd), 8.61 (1H, dd), 8.59 (1H, d), 8.17 (1H, dd), 7.96 (1H, d), 7.80 (1H, dd), 3.98 (2H, q), 1.45 (3H, t).

【0062】

本発明に用いられるトリフルメゾピリンはメソイオン性分子内塩であり、下記式(2A)のように、6つの構造式で表現される。

20



(2A)

30

なお、トリフルメゾピリンは、国際公開第 2012/092115 号に記載された方法で製造することができ、該文献では、2-ヒドロキシ-4-オキソ-1-(5-ピリジニルメチル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-4H-ピリド[1,2-a]ピリミジニウム分子内塩と記載されている。

【0063】

本発明組成物の態様として、以下が挙げられる。

【0064】

40

式(1)において、 A^1 が -NMe-、酸素原子又は硫黄原子であり、 A^2 が =N-、=N(O)- 又は =CH- であり、 R^1 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基又は水素原子であり、 R^5 が 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、-OR¹⁰、又は -S(O)_mR¹⁰ であり、 R^6 が -NR¹⁰R¹¹ 又は水素原子であり、 R^10 及び R^11 が各々独立して 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0065】

式(1)において、 A^1 が -NMe-、又は酸素原子であり、 A^2 が =N-、=N(O)

50

) - 又は = CH - であり、R¹ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基であり、R² 及び R⁴ が水素原子であり、R³ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基又は水素原子であり、R⁵ が 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、- OR^{1 0}、又は - S(O)_mR^{1 0} であり、R⁶ が - NR^{1 0}R^{1 1} 又は水素原子であり、R^{1 0} 及び R^{1 1} が各々独立して 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0066】

式(1)において、A¹ が - NMe -、又は酸素原子であり、A² が = N -、= N(O) - 又は = CH - であり、R¹ が C 1 - C 6 アルキル基であり、R²、R⁴ 及び R⁶ が水素原子であり、R³ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基又は水素原子であり、R⁵ が 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、- OR^{1 0}、又は - S(O)_mR^{1 0} であり、R^{1 0} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

10

【0067】

式(1)において、A¹ が - NMe - であり、A² が = N -、又は = N(O) - であり、R¹ が C 1 - C 6 アルキル基であり、R²、R⁴ 及び R⁶ が水素原子であり、R³ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基又は水素原子であり、R⁵ が 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、又は - S(O)_mR^{1 0} であり、R^{1 0} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

20

【0068】

式(1)において、A¹ が酸素原子であり、A² が = N -、= N(O) - 又は = CH - であり、R¹ が C 1 - C 6 アルキル基であり、R²、R⁴ 及び R⁶ が水素原子であり、R³ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基又は水素原子であり、R⁵ が 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、- OR^{1 0}、又は - S(O)_mR^{1 0} であり、R^{1 0} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

30

【0069】

式(1)において、A¹ が酸素原子であり、A² が = N -、又は = N(O) - であり、R¹ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基であり、R²、R³、R⁴ 及び R⁶ が水素原子であり、R⁵ が 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、又は - S(O)_mR^{1 0} であり、R^{1 0} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0070】

式(1)において、A¹ が酸素原子であり、A² が = N - であり、R¹ が C 1 - C 6 アルキル基であり、R²、R³、R⁴ 及び R⁶ が水素原子であり、R⁵ が 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、又は - S(O)_mR^{1 0} であり、R^{1 0} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

40

【0071】

式(1)において、A¹ が酸素原子であり、A² が = CH - であり、R¹ が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基であり、R²、R³、R⁴ 及び R⁶ が水素原子であり、R⁵ が 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、又は - S(O)_mR^{1 0} であり、R^{1 0} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

50

【0072】

式(1)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CH-$ であり、 R^1 がC1-C6アルキル基であり、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^6 が水素原子であり、 R^5 が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、又は $-S(O)_mR^{10}$ であり、 R^{10} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0073】

式(1)において、 R^1 が群Yより選ばれる1個以上の原子又は基を有していてもよいC1-C6アルキル基(群Y:1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基及びハロゲン原子からなる群。)であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 が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、 $-C(OR^{10})_3$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^5 が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、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子であり、 R^6 が $-OR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-OC(O)R^{10}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^7 が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、 $-CH_2CO_2R^{10}$ 、C3-C6シクロアルキル基又は水素原子であり、 R^8 が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、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{10} 及び R^{11} が独立して1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基又は水素原子(但し、 $-S(O)_mR^{10}$ において、 m が1又は2の場合には、 R^{10} が水素原子を表すことはない。)である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0074】

式(1)において、 R^1 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 が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、 $-C(OR^{10})_3$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^5 が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、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 又はハロゲン原子であり、 R^6 がシアノ基、 $-NR^{10}R^{11}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^7 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^8 が $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{10} 及び R^{11} が独立して1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0075】

式(1)において、 R^1 がエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 が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、 $-C(OR^{10})_3$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^5 がC1-C3ハロアルキル基、 $-OR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 又はハロゲン原子(R^{20} はC1-C3ハロアルキル基を表す)であり、 R^6 がシアノ基、 $-NR^{10}R^{11}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^7 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^8 が $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{10} 及び R^{11} が独立して1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0076】

式(1)において、 A^1 が $-NR^7-$ である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0077】

式(1)において、 A^1 が酸素原子である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

10

20

30

40

50

【0078】

式(1)において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 R^1 がC1-C3アルキル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^3 が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、 $-C(OR^{10})_3$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^5 がC1-C3ハロアルキル基、 $-OR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 又はハロゲン原子であり、 R^6 がシアノ基、 $-NR^{10}R^{11}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^7 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 R^8 が $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{10} 及び R^{11} が独立して1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^{20} がC1-C3ハロアルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

10

【0079】

式(1)において、 A^1 が酸素原子であり、 R^1 がエチル基であり、 R^2 、 R^4 及び R^6 が水素原子であり、 R^3 が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、 $-C(OR^{10})_3$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^5 がC1-C3ハロアルキル基、 $-OR^{20}$ 、 $-S(O)_mR^{20}$ 又はハロゲン原子であり、 R^8 が $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{10} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^{20} がC1-C3ハロアルキル基である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

【0080】

式(1)において、 A^1 が酸素原子であり、 R^1 がエチル基であり、 R^2 、 R^4 及び R^6 が水素原子であり、 R^3 がハロゲン原子又は水素原子であり、 R^5 がC1-C3パーフルオロアルキル基、 $-OR^{30}$ 又は $-S(O)_mR^{30}$ であり、 R^{30} がC1-C3パーフルオロアルキル基であり、 R^8 がハロゲン原子又は水素原子である化合物と、トリフルメゾピリンとを含有する有害生物防除組成物。

20

【0081】

本発明組成物は、本化合物とトリフルメゾピリンとを単に混合したものでもよいが、通常は、本化合物とトリフルメゾピリンと不活性担体とを混合し、必要に応じて界面活性剤やその他の製剤用補助剤を添加して、油剤、乳剤、フロアブル剤、水和剤、顆粒水和剤、粉剤、粒剤等に製剤化されたものが用いられる。

また、前記の製剤化された有害生物防除組成物は、そのまま又はその他の不活性成分を添加して使用することができる。

30

本発明組成物における、本化合物とトリフルメゾピリンの合計量は、通常0.1%~100重量%、好ましくは0.2~90重量%、より好ましくは1~80重量%の範囲である。

【0082】

製剤化の際に用いられる不活性担体としては、固体担体、液体担体が挙げられる。かかる固体担体としては、例えば粘土類(カオリンクレー、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、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(硫酸、燐安、硝安、尿素、塩安等)等の微粉末及び粒状物等、並びに合成樹脂(ポリプロピレン、ポリアクリロニトリル、ポリメタクリル酸メチル、ポリエチレンテレフタレート等のポリエステル樹脂、ナイロン-6、ナイロン-11、ナイロン-66等のナイロン樹脂、ポリアミド樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、塩化ビニル-プロピレン共重合体等)があげられる。

40

【0083】

かかる液体担体としては、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

50

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。

10

【0084】

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。

【0085】

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）、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。

20

【0086】

本発明の有害生物防除方法は、本発明組成物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所（植物、土壌等）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、通常、本発明組成物が製剤化された有害生物防除剤の形態で用いられる。

【0087】

本発明組成物の施用方法としては、具体的には、例えば、植物の茎葉、花器、苗又は穂（植物）への施用、植物を植えつける前又は植えつけた後の土壌（植物を栽培する土壌）への施用、種子消毒や種子浸漬、種子コート等の植物種子又は種芋等の球根への施用等が挙げられる。また、本化合物及びトリフルメゾピリンは別々に施用してもよく、本化合物及びトリフルメゾピリンのどちらか一方を付着させた種子又は球根を、植物、植物種子、球根又は植物を栽培する土壌に施用する前後に、残る一方を施用してもよい。

30

【0088】

植物の茎葉、花器、苗又は穂（植物）への施用としては、具体的には、茎葉散布、樹幹散布等の植物の表面に施用する施用方法が挙げられ、また、開花前、開花中、開花後を含む開花時期における花器あるいは植物全体に散布する方法が挙げられ、また、穀物等においては出穂時期の穂あるいは植物全体に散布する方法が挙げられる。

40

【0089】

また、植物を植えつける前又は植えつけた後の土壌（植物を栽培する土壌）への施用方法は、例えば、有害生物による摂食等の被害から保護しようとする作物の根圏に本発明組成物を施用して有害生物を直接防除する方法、または根部等から植物体内部に本発明組成物を浸透移行させて、植物を摂食等する有害生物を防除する方法である。

具体的には、例えば、植穴処理（植穴散布、植穴処理土壌混和）、株元処理（株元散布、株元土壌混和、株元灌注、育苗期後半株元処理）、植溝処理（植溝散布、植溝土壌混和）、作条処理（作条散布、作条土壌混和、生育期作条散布）、播種時作条処理（播種時作条散布、播種時作条土壌混和）、全面処理（全面土壌散布、全面土壌混和）、側条処理、水面処理（水面施用、湛水後水面施用）、その他土壌散布処理（生育期粒剤葉面散布、樹

50

冠下または主幹周辺散布、土壌表面散布、土壌表面混和、播穴散布、畦部地表面散布、株間散布)、その他灌注処理(土壌灌注、育苗期灌注、薬液注入処理、地際部灌注、薬液ドリップイリゲーション、ケミゲーション)、育苗箱処理(育苗箱散布、育苗箱灌注、育苗箱薬液湛水)、育苗トレイ処理(育苗トレイ散布、育苗トレイ灌注、育苗トレイ薬液湛水)、苗床処理(苗床散布、苗床灌注、水苗代苗床散布、苗浸漬)、床土混和处理(床土混和、播種前床土混和、播種時覆土前散布、播種時覆土後散布、覆土混和)、その他処理(培土混和、鋤き込み、表土混和、雨落ち部土壌混和、植位置処理、粒剤花房散布、ペースト肥料混和)が挙げられる。

【0090】

植物種子又は球根への施用としては、本発明組成物を、植物種子または球根に施用することにより行うこともできる。本発明において、植物種子とは、土壌または栽培する培地に播種する前の状態の植物の種子を意味し、球根とは、土壌あるいは栽培する培地に植付ける前の状態の植物の鱗茎、球茎、塊茎、根茎、茎断片、種芋及び塊根を意味する。本発明組成物を植物種子または球根に施用する方法は、例えば、有害生物による摂食等の被害から保護しようとする作物の植物種子もしくは球根等に直接施用して有害生物を防除する方法；植物種子もしくは球根等の近傍に本発明組成物を施用して、種子等を摂食等する有害生物を防除する方法；または植物種子もしくは球根等から植物体内部に本発明組成物を浸透移行させて、植物を摂食等する有害生物を防除する方法であり、具体的には、例えば、吹きつけ処理、塗沫処理、浸漬処理、含浸処理、塗布処理、フィルムコート処理、ペレットコート処理が挙げられる。

【0091】

本発明組成物を有害生物防除に用いる場合、その施用量は、施用時期、施用場所、施用方法等に応じて、広範囲に変えることができるが、一般的には、本化合物とトリフルメゾピリンとの合計量は、10,000 m²あたり通常1~10,000 gである。本発明組成物が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化される場合は、通常、本化合物とトリフルメゾピリンとは、それらの合計の濃度が0.01~10,000 ppmとなるように水で希釈して施用され、粒剤、粉剤等は、通常、そのまま施用される。

【0092】

また、本発明組成物をイネに施用する場合は、育苗箱処理で使用してもよい。本発明組成物を育苗箱処理する時期は、イネの播種時から移植時までであってもよい。また、本発明組成物は、イネの直播栽培又は移植栽培で使用してもよい。本発明組成物を直播栽培のイネに使用する際は、湛水直播前、湛水直播後、乾田直播前又は乾田直播後に施用してもよく、播種前から播種21日後までの時期であってもよい。本発明組成物を移植栽培のイネに使用する際は、移植後のイネであってもよく、施用する時期は、移植前から移植21日後までの時期であってもよい。

【0093】

本発明組成物が効力を有する有害生物としては、有害昆虫類や有害ダニ類等の有害節足動物が挙げられ、かかる有害生物としては、具体的には例えば、以下が挙げられる。

【0094】

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*)、チュ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(*Toxop*

tera citricidus)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus 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。

【0095】

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、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、リオネティア属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユープ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、およびイガ (*Tinea translucens*)。

【0096】

アザミウマ目害虫：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、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*) 等のアザミウマ類。

【0097】

双翅目害虫：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 (*10*

Ceratitidis capitata)等のミバエ類、ショウジョウバエ類。

【0098】

鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera a 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、メイズウィービル (*Sitophilus zeamais*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhopterus oryzophilus*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus 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*)、クスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)等のハムシ類、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 (*Lycetus brunneus*)、マツノクイムシ (*Tomicus piniperda*)等のクイムシ類、ナガシクイムシ類、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 (*Agriotes spp.*、*Limonius spp.*)、およびアオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*)。

10

20

【0099】

上記の有害生物には、既存剤に対して抵抗性を獲得した個体群も含み、本発明組成物はかかる抵抗性個体群に対しても有効である。

【0100】

本発明組成物を使用できる植物としては、例えば次のものが挙げられる。

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、セイヨウアブラナ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等、 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、スカッシュ等)、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 (ホウレンソウ、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

花卉、

観葉植物、

シバ、

40

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、ブルーベリー等)、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、オリブ、ピワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ等、

果樹以外の樹；チャ、クワ、花木、街路樹 (トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチヨウ、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)等。

50

【0101】

前記した植物とは、ハイブリッド技術により育種された植物であってもよい。

【0102】

すなわち、ハイブリッド技術により育種された植物とは、雑種強勢（一般に、収量ポテンシャルの増加、生物的及び非生物的ストレス因子に対する抵抗性の向上等をもたらす）の特性を有す植物である。

【0103】

前記した植物とは、遺伝子組換え技術により耐性を付与された植物であってもよい。

【0104】

例えば、上記植物には、イソキサフルトール等のHPPD阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のALS阻害剤、EPS合成酵素阻害剤、グルタミン合成酵素阻害剤、プロモキシニル、ジカンバ等の除草剤に対する耐性が、古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により付与された植物も含まれる。

10

【0105】

上記植物には、遺伝子組換え技術を用いて、例えば、バチルス属で知られている選択的毒素等を合成する事が可能となった植物も含まれる。

【0106】

また、上記植物には、古典的育種技術または遺伝子組換え技術を用い、先に述べたような除草剤耐性、害虫抵抗性、病害耐性等に関わる形質を2種以上付与された系統、および同類または異なる性質を有する遺伝子組換え植物同士を掛け合わせるにより親系統が有する2種以上の性質が付与された系統も含まれる。このような植物の例として、Smartstax（登録商標）等が挙げられる。

20

【0107】

本発明組成物における、本化合物とトリフルメゾピリンとの含有割合は、通常、重量比で100:1~1:100であり、好ましくは10:1~1:10である。

【0108】

本発明組成物は、下記群（A）より選ばれる1種以上の化合物をさらに含有してもよい。

群（A）：

クロチアニジン（clothianidin）、ジノテフラン（dinotefuran）、チアメトキサム（thiamethoxam）、イミダクロプリド（imidacloprid）、ニテンピラム（nitenpyram）、チアクロプリド（thiacloprid）、フィプロニル（fipronil）、エチプロール（ethiprole）、エトフェンプロックス（etofenprox）、シラフルオフエン（silaflofen）、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）、カルタップ（cartap）、フルピラジフロン（flupyradifurone）、ピメトロジン（pymetrozine）、イソチアニル（isotianil）、アゾキシストロビン（azoxystrobin）、オリサストロビン（orysastrobin）、プロベナゾール（probenazole）、チアジニル（tiadinil）、トリシクラゾール（tricyclazole）、ピロキロン（pyroquilon）、ジクロシメット（diclocymet）、フェリムゾン（ferimzone）、フサライド（phthalide）、カスガマイシン塩酸塩（kasugamycin hydrochloride hydrate）、テブフロキン（tebufloquin）、ペンシクロン（pencycuron）、バリダマイシン（validamycin）、ヘキサコナゾール（hexaconazole）、フルトラニル（flutolanil）、カルプロパミド（carpropamid）、フラメトピル（furametpyr）、ペンフルフェン（penflufen）、およびトルプロカルブ（tolprocarb）で示される化合物からなる群。

30

40

【0109】

50

かかる混合の組み合わせとして、例えば以下のものが挙げられる。

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとイソチアニルとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとオリサストロピンの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとプロベナゾールとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとトリシクラゾールとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとジクロシメットとの組み合わせ；

10

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとカルプロパミドとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとチアジニルとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとピロキロンとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとトルプロカルブとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとフラメトピルとの組み合わせ；

20

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとペンフルフェンとの組み合わせ；

【 0 1 1 0 】

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとイソチアニルとフラメトピルとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとイソチアニルとペンフルフェンとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとプロベナゾールとフラメトピルとの組み合わせ；

30

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとプロベナゾールとペンフルフェンとの組み合わせ；

【 0 1 1 1 】

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとトリシクラゾールとフラメトピルとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとトリシクラゾールとペンフルフェンとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとチアジニルとフラメトピルとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとチアジニルとペンフルフェンとの組み合わせ；

40

【 0 1 1 2 】

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとピロキロンとフラメトピルとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとピロキロンとペンフルフェンとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとトルプロカルブとフラメトピルとの組み合わせ；

「本化合物 1 から 4 8 1 のいずれかひとつ」とトリフルメゾピリンとトルプロカルブとペンフルフェンとの組み合わせ；

50

【実施例】

【0113】

以下、本発明を製剤例及び試験例にてさらに詳しく説明するが、本発明は以下の例のみに限定されるものではない。なお、以下の例において、部は特にことわりの無い限り重量部を表す。

【0114】

まず、製剤例を示す。

【0115】

製剤例 1

本化合物 1 ~ 481 のうちいずれか 1 種を 5 部、トリフルメゾピリン 10 部、ホワイトカーボンと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との混合物（重量割合 1 : 1）35 部及び水を混合し全量を 100 部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

10

【0116】

製剤例 2

本化合物 1 ~ 481 のうちいずれか 1 種を 10 部、トリフルメゾピリン 2 部、ソルビタントリオレート 1.5 部、及びポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサンタンガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液を加え全量を 90 部とし、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

20

【0117】

製剤例 3

本化合物 1 ~ 481 のうちいずれか 1 種を 10 部、トリフルメゾピリン 10 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部、及び合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤 100 部を得る。

【0118】

製剤例 4

本化合物 1 ~ 481 のうちいずれか 1 種を 1 部、トリフルメゾピリン 0.5 部、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 30 部及びカオリンクレー残部を加え混合する。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 100 部を得る。

30

【0119】

製剤例 5

本化合物 1 ~ 481 のうちいずれか 1 種を 2 部、トリフルメゾピリン 0.75 部、イソチアニル 2 部、合成含水酸化珪素 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイトを 30 部及びカオリンクレー残部の混合物 100 部をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合わせた後、造粒乾燥することにより粒剤 100 部を得る。

【0120】

製剤例 6 ~ 15

製剤例 5 において、イソチアニル 2 部に代えて、[表 A] 記載のそれぞれの化合物及び使用量を用いた以外は製剤例 5 と同様の操作を行い、それぞれの粒剤を得る。

40

【0121】

[表 A]

製剤例	化合物	使用量 [部]
6	イソチアニル	2
	フラメトピル	4
7	イソチアニル	2
	ペンフルフェン	2
8	プロベナゾール	10
9	プロベナゾール	24
10	チアジニル	12
11	トリシクラゾール	4
12	オリサストロビン	7
13	ピロキロン	12
14	トルプロカルブ	4
15	トルプロカルブ	9

10

【0122】

次に本発明組成物の植物種子への適用例を示す。

適用例 1

ソルガム乾燥種子 100 kg に、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH 製）を用いて、製剤例 1 または 2 に準じて作製した各製剤 200 ml を塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

20

また、各製剤 200 ml に、オキサベトリニルを 180 グラム、またはフルキソフェニム 40 グラムを、それぞれ添加して塗沫処理することにより各処理種子を得ることもできる。

【0123】

適用例 2

トウモロコシ乾燥種子 10 kg に、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH 製）を用いて、製剤例 1 または 2 に準じて作製した各製剤 40 ml を塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

【0124】

適用例 3

トウモロコシ乾燥種子 10 kg に、製剤例 3 に準じて作製した各水和剤を 50 g 粉衣処理することにより、処理種子を得る。

30

【0125】

適用例 4

ダイズ乾燥種子 10 kg に、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH 製）を用いて、製剤例 1 または 2 に準じて作製した各製剤 20 ml を塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

【0126】

適用例 5

ダイズ乾燥種子 10 kg に、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH 製）を用いて、製剤例 3 に準じて作製した各水和剤を 30 g 粉衣処理することにより、各処理種子を得る。

40

【0127】

適用例 6

ワタ乾燥種子 10 kg に、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH 製）を用いて、製剤例 1 または 2 に準じて作製した各製剤 50 ml を塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

【0128】

適用例 7

50

セイヨウアブラナ乾燥種子10kgに、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH製）を用いて、製剤例1または2に準じて作製した各製剤150mlを塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

【0129】

適用例8

イネ乾燥種子10kgに対し、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH製）を用いて、製剤例1または2に準じて作製した各製剤20mlを塗沫処理することにより、各処理種子を得る。

【0130】

適用例9

イネ乾燥種子10kgに対し、回転式種子処理機（シードドレッサー、Hans-Ulrich Hege GmbH製）を用いて、製剤例3に準じて作製した各水和剤を60g粉衣処理することにより、各処理種子を得る。

【0131】

次に、本発明の効果を試験例にて示す。

【0132】

試験例1

本化合物3、15、19、20、48、50、72、81、85、99、130、421、444、445、464、467、およびトリフルメゾピリンをそれぞれ1mgあたり、キシレン：ジメチルホルムアミド：界面活性剤（商品名：ソルポール（登録商標）3005X、東邦化学工業製）=4：4：1（容量比）の混合溶媒10μLを用いて溶解した後、〔表21〕～〔表22〕記載の濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン（登録商標）、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈し、各試験用薬液を調整した。

キュウリ（*Cucumis sativus*）子葉の葉片（長さ1.5cm）を24穴マイクロプレート（Becton Dickinson製）の各ウェルに収容し、1ウェルあたりワタアブラムシ（*Aphis gossypii*）無翅成虫2匹および幼虫8匹を放飼し、1ウェルあたり該試験用薬液20μLを散布処理した。これを処理区とした。

なお、試験用薬液の代わりに展着剤（商品名：シンダイン（登録商標）、住友化学製）0.02容量%を含有する水を20μL散布したウェルを無処理区とした。

風乾後、マイクロプレート上部をガス透過性フィルムシート（商品名：Aera Seal, Excel Scientific Inc.製）で覆い、放飼5日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の防除価を下記式（1）より算出した。

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

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_{ai} ：無処理区の観察時の生存虫数

T_{ai} ：処理区の観察時の生存虫数

その結果、〔表21〕～〔表22〕に示すように、本化合物3、15、19、20、48、50、72、81、85、99、130、421、444、445、464、または467とトリフルメゾピリンとを含有する本発明組成物は、いずれも優れた防除効力を示した。

なお、上述の試験に準じて行った試験で観察されたトリフルメゾピリン及び本化合物の単独での防除価は、トリフルメゾピリンが4（濃度0.1ppm）、30（濃度1ppm）、本化合物15が28（濃度1ppm）、本化合物20が12（濃度0.01ppm）、本化合物72が32（濃度10ppm）、本化合物444が32（濃度1ppm）、本化合物445が30（濃度0.1ppm）、本化合物445が37（濃度1ppm）であった。

【0133】

10

20

30

40

【表 2 1】

供試化合物	濃度 (p p m)	観察された防除価
本化合物 3 + トリフルメゾピリン	1 + 1	8 4
本化合物 1 5 + トリフルメゾピリン	1 + 1	1 0 0
本化合物 1 5 + トリフルメゾピリン	1 + 0. 1	1 0 0
本化合物 1 9 + トリフルメゾピリン	0. 0 1 + 1	9 2
本化合物 2 0 + トリフルメゾピリン	0. 0 1 + 1	8 4
本化合物 4 8 + トリフルメゾピリン	0. 1 + 1	8 0
本化合物 5 0 + トリフルメゾピリン	1 0 + 1	8 0
本化合物 5 0 + トリフルメゾピリン	1 + 1	7 6
本化合物 7 2 + トリフルメゾピリン	1 0 + 1	1 0 0
本化合物 7 2 + トリフルメゾピリン	1 0 + 0. 1	1 0 0

10

【 0 1 3 4】

【表 2 2】

供試化合物	濃度 (p p m)	観察された防除価
本化合物 8 1 + トリフルメゾピリン	1 0 + 1	1 0 0
本化合物 8 1 + トリフルメゾピリン	1 + 1	9 2
本化合物 8 1 + トリフルメゾピリン	0. 1 + 1	6 4
本化合物 8 5 + トリフルメゾピリン	1 0 + 1	1 0 0
本化合物 8 5 + トリフルメゾピリン	1 + 1	6 8
本化合物 9 9 + トリフルメゾピリン	1 0 + 0. 1	9 2
本化合物 9 9 + トリフルメゾピリン	1 + 1	1 0 0
本化合物 1 3 0 + トリフルメゾピリン	1 0 + 0. 1	5 2
本化合物 4 2 1 + トリフルメゾピリン	0. 1 + 1	9 2
本化合物 4 4 4 + トリフルメゾピリン	1 + 1	8 8
本化合物 4 4 4 + トリフルメゾピリン	1 + 0. 1	6 0
本化合物 4 4 5 + トリフルメゾピリン	1 + 0. 1	7 3
本化合物 4 4 5 + トリフルメゾピリン	0. 1 + 1	8 0
本化合物 4 4 5 + トリフルメゾピリン	1 + 1	1 0 0
本化合物 4 6 4 + トリフルメゾピリン	0. 0 1 + 1	6 4
本化合物 4 6 7 + トリフルメゾピリン	0. 1 + 1	8 4
本化合物 4 6 7 + トリフルメゾピリン	0. 0 1 + 1	7 2

20

30

【産業上の利用可能性】

40

【 0 1 3 5】

本発明により、有害生物を防除することができる。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
A 0 1 P 7/04

(72)発明者 亀崎 将司
兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内

審査官 伊藤 幸司

(56)参考文献 特開2014-208695(JP,A)
特開2014-5263(JP,A)
特表2013-501065(JP,A)
国際公開第2015/133603(WO,A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
A 0 1 N A 0 1 P
CAplus/REGISTRY(STN)