

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局

(43) 国際公開日  
2023年12月28日(28.12.2023)



(10) 国際公開番号

WO 2023/248871 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 413/14 (2006.01) A61K 31/506 (2006.01)  
A01N 43/653 (2006.01) A61K 31/5377 (2006.01)  
A01N 43/76 (2006.01) A61P 33/10 (2006.01)  
A01N 43/78 (2006.01) A61P 33/14 (2006.01)  
A01N 43/84 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01)  
A01P 7/02 (2006.01) C07D 403/14 (2006.01)  
A01P 7/04 (2006.01) C07D 417/14 (2006.01)  
A61K 31/4439 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2023/021894

(22) 国際出願日: 2023年6月13日(13.06.2023)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願 2022-099256 2022年6月20日(20.06.2022) JP

(71) 出願人: 日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1008165 東京都千代田区大手町二丁目2番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 矢田 理奈(YADA Rina); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 西尾 史也

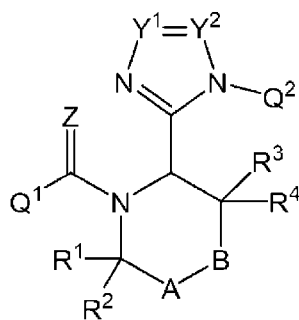
(NISHIO Fumiya); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 川口 昌宏(KAWAGUCHI Masahiro); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 古川 裕紀(FURUKAWA Hironori); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 伊藤 衆一(ITO Shuichi); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP). 牧野 聖(MAKINO Satoshi); 〒2500280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP).

(74) 代理人: 松沼 泰史, 外(MATSUNUMA Yasushi et al.); 〒1006620 東京都千代田区丸の内一丁目9番2号 Tokyo (JP).

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

(54) Title: HETEROARYL COMPOUND AND PEST CONTROL AGENT

(54) 発明の名称: ヘテロアリール化合物および有害生物防除剤



(I)

(57) Abstract: Provided are a compound represented by formula (I), etc. (wherein: Z represents an oxygen atom, etc.; R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> each independently represent a hydrogen atom or a substituted or unsubstituted C1-6 alkyl group; Y<sup>1</sup> and Y<sup>2</sup> each independently represent a nitrogen atom, etc.; Q<sup>1</sup> represents a substituted or unsubstituted 5-membered heteroaryl group, etc.; Q<sup>2</sup> represents a substituted or unsubstituted 6-membered heteroaryl group, etc.; A represents a single bond or a substituted or unsubstituted methylene group; and B represents an oxygen atom, a sulfur atom, a sulfinyl group, a sulfonyl group, etc.) or a salt thereof, and a pest control agent.

(57) 要約: 式(I)(式中、Zは、酸素原子などを示し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、または置換若しくは無置換のC1~6アルキル基を示し、Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、窒素原子などを示し、Q<sup>1</sup>は、置換若しくは無置換の5員ヘテロアリール基などを示し、Q<sup>2</sup>は、置換若しくは無置換の6員ヘテロアリール基などを示し、Aは、単結合、または置換もしくは無置換のメチレン基を示し、Bは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基などを示す)等で表される化合物またはその塩、および有害生物防除剤が提供される。



WO 2023/248871 A1

KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU,  
LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, MW, MX, MY,  
MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL,  
PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK,  
SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,  
UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保  
護が可能): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS,  
MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU,  
TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ,  
DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS,  
IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT,  
RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF,  
CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE,  
SN, TD, TG).

添付公開書類：

- 一 国際調査報告 (条約第21条(3))

## 明 細 書

発明の名称：ヘテロアリアル化合物および有害生物防除剤

### 技術分野

[0001] 本発明は、ヘテロアリアル化合物および有害生物防除剤に関する。

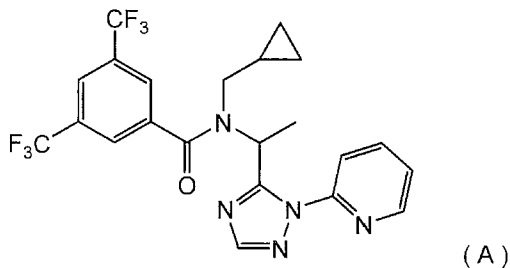
本願は、2022年6月20日に、日本に出願された特願2022-099256号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

### 背景技術

[0002] 殺虫・殺ダニ活性を有する化合物が種々提案されている。そのような化合物を農薬として実用するためには、効力が十分に高いだけでなく、薬剤抵抗性が生じ難いこと、植物に対する薬害や土壌汚染を生じさせないこと、家畜や魚類などに対する毒性が低いことなどが要求される。

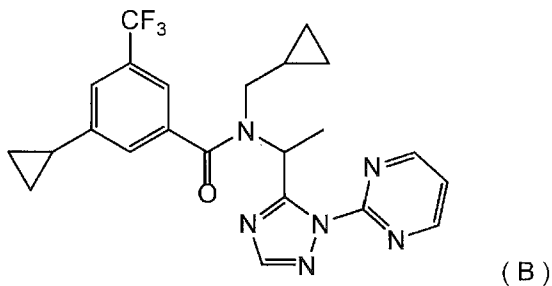
[0003] ところで、式(A)などで表される化合物が、動物の外部寄生虫の抑制に使用できると特許文献1は述べている。

[0004] [化1]



[0005] その他、式(B)などで表される化合物が、有害生物の防除に使用できると特許文献2は述べている。

[0006] [化2]



## 先行技術文献

### 特許文献

[0007] 特許文献1：WO 2017/192385 A1

特許文献2：WO 2019/197468 A1

### 発明の概要

#### 発明が解決しようとする課題

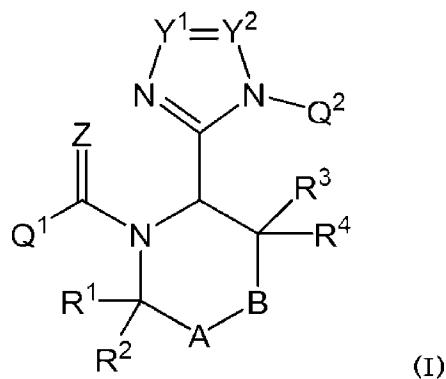
[0008] 本発明の課題は、有害生物防除活性、その中でも特に殺虫活性および／または殺ダニ活性に優れ、安全性に優れ、かつ工業的に有利に合成できるヘテロアリアル化合物を提供することである。本発明の別の課題は、上記ヘテロアリアル化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤、殺虫若しくは殺ダニ剤、外部寄生虫防除剤、または内部寄生虫防除若しくは駆除剤を提供することである。

#### 課題を解決するための手段

[0009] 上記課題を解決すべく鋭意検討した結果、以下の形態を包含する本発明を完成するに至った。

〔1〕 式(I)若しくは式(II)で表される化合物またはその塩。

[0010] [化3]



[0011] 〔式(I)中、

Zは、酸素原子、または硫黄原子を示し、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、または置換若しくは無置換のC<sub>1</sub>～6アルキル基を示し、

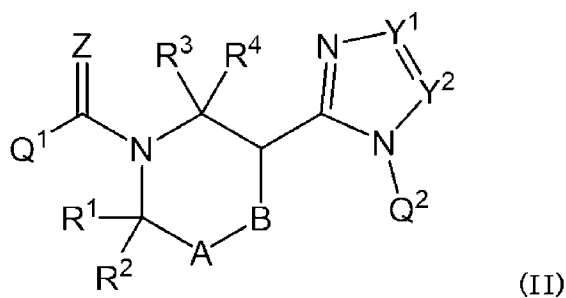
Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、窒素原子、またはC R<sup>a</sup>で表される基を示し、ここで、R<sup>a</sup>は、水素原子、ハロゲン基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基を示し、

Q<sup>1</sup>は、置換若しくは無置換の5員ヘテロアリール基、置換若しくは無置換の6員ヘテロアリール基、置換若しくは無置換のフェニル基、または置換若しくは無置換の縮合二環式9～10員ヘテロアリール基を示し、Q<sup>2</sup>は、置換若しくは無置換の5員ヘテロアリール基、または置換若しくは無置換の6員ヘテロアリール基を示し、

Aは、単結合、または置換もしくは無置換のメチレン基を示し、且つ

Bは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、S=N-R<sup>c</sup>で表される基、S(=O)=N-R<sup>c</sup>で表される基、NR<sup>b</sup>で表される基、または置換もしくは無置換のメチレン基を示し、ここで、R<sup>b</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルカルボニル基、または置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシカルボニル基を示し、R<sup>c</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、またはシアノ基を示す。]

[0012] [化4]



[0013] [式(II)中、Z、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、AおよびBは、式(I)中のそれらと同じものを示す。]

[0014] [2] [1]に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも

も1つを有効成分として含有する、有害生物防除剤。

[0015] [3] [1]に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する、殺虫若しくは殺ダニ剤。

[0016] [4] [1]に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する、外部寄生虫防除剤。

[0017] [5] [1]に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する、内部寄生虫防除若しくは駆除剤。

### 発明の効果

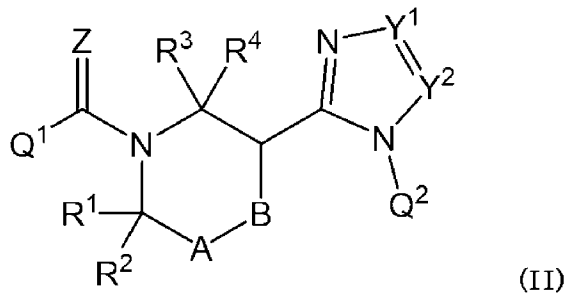
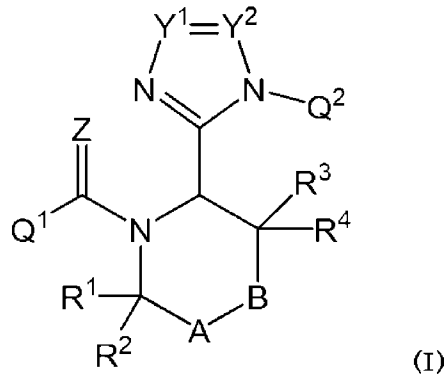
[0018] 本発明のヘテロアリアル化合物は、農作物や衛生面で問題となる有害生物を防除することができる。本発明のヘテロアリアル化合物は、特に農業害虫およびダニ類をより低濃度で効果的に防除することができる。本発明のヘテロアリアル化合物は、さらに、人畜を害する外部寄生虫および内部寄生虫を効果的に防除することができる。

### 発明を実施するための形態

[0019] 本発明のヘテロアリアル化合物は、式(I)で表される化合物（以下、化合物(I)と表記することがある。）若しくは化合物(I)の塩または式(II)で表される化合物（以下、化合物(II)と表記することがある。）若しくは化合物(II)の塩である。

[0020]

[化5]



[0021] 本発明において、「無置換 (unsubstituted)」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。「置換」との記載がなく母核となる基の名称のみで記載しているときは、別段の断りが無い限り「無置換」の意味である。

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

「C 1～6」などの用語は、母核となる基の炭素原子数が1～6個などであることを表している。この炭素原子数には、置換基の中に在る炭素原子の数を含まない。例えば、置換基としてエトキシ基を有するブチル基は、C 2 アルコキシ C 4 アルキル基に分類する。

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

[0022] 以下に「置換基」となり得る基を例示する。

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

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基（アリル基）、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基などのC 2～6アルケニル基；

エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基などのC 2～6アルキニル基；

[0023] シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3～6シクロアルキル基；

フェニル基、ナフチル基；

ベンジル基、フェネチル基などのフェニルC 1～6アルキル基；

3～6員ヘテロシクリル基；

3～6員ヘテロシクリルC 1～6アルキル基；

[0024] 水酸基；

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

ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのC 2～6アルケニルオキシ基；

エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのC 2～6アルキニルオキシ基；

フェノキシ基、ナフトキシ基；

ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのフェニルC 1～6アルコキシ基；

チアゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基などの5～6員ヘテロアリアルオキシ基；

チアゾリルメチルオキシ基、ピリジルメチルオキシ基などの5～6員ヘテロアリーールC 1～6アルキルオキシ基；

[0025] ホルミル基；

アセチル基、プロピオニル基などのC 1～6アルキルカルボニル基；

ホルミルオキシ基；

アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基などのC 1～6アルキルカルボニルオキシ基；

ベンゾイル基；

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

メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、n-プロポキシカルボニルオキシ基、i-プロポキシカルボニルオキシ基、n-ブトキシカルボニルオキシ基、t-ブトキシカルボニルオキシ基などのC 1～6アルコキシカルボニルオキシ基；

カルボキシル基；

[0026] フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などのハロゲノ基；

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

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

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

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

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

クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基などのC 1～6ハロアルキルカルボニル基；

[0027] アミノ基；

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

アニリノ基、ナフチルアミノ基；

ベンジルアミノ基、フェネチルアミノ基などのフェニルC 1～6アルキルアミノ基；

ホルミルアミノ基；

アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチリルアミノ基、i-プロピルカルボニルアミノ基などのC 1～6アルキルカルボニルアミノ基；

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

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

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

N-ヒドロキシイミノメチル基、(1-(N-ヒドロキシ)イミノ)エチル基、(1-(N-ヒドロキシ)イミノ)プロピル基、N-メトキシイミノメチル基、(1-(N-メトキシ)イミノ)エチル基などの置換若しくは無置換のN-ヒドロキシイミノC 1～6アルキル基；

アミノカルボニルオキシ基；

エチルアミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基などのC 1～6アルキル置換アミノカルボニルオキシ基；

[0028]メルカプト基；

メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、i-プロピルチオ基

、n-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、s-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基などのC1~6アルキルチオ基；

トリフルオロメチルチオ基、2,2,2-トリフルオロエチルチオ基などのC1~6ハロアルキルチオ基；

フェニルチオ基、ナフチルチオ基；

チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などの5~6員ヘテロアリールチオ基；

[0029] メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、t-ブチルスルフィニル基などのC1~6アルキルスルフィニル基；

トリフルオロメチルスルフィニル基、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル基などのC1~6ハロアルキルスルフィニル基；

フェニルスルフィニル基；

チアゾリルスルフィニル基、ピリジルスルフィニル基などの5~6員ヘテロアリールスルフィニル基；

[0030] メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基などのC1~6アルキルスルホニル基；

トリフルオロメチルスルホニル基、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル基などのC1~6ハロアルキルスルホニル基；

フェニルスルホニル基；

チアゾリルスルホニル基、ピリジルスルホニル基などの5~6員ヘテロアリールスルホニル基；

メチルスルホニルオキシ基、エチルスルホニルオキシ基、t-ブチルスルホニルオキシ基などのC1~6アルキルスルホニルオキシ基；

トリフルオロメチルスルホニルオキシ基、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニルオキシ基などのC1~6ハロアルキルスルホニルオキシ基；

[0031] トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、t-ブチルジメチルシリル基などのトリC1~6アルキル置換シリル基；

トリフェニルシリル基；

シアノ基；ニトロ基。

[0032] また、これらの「置換基」は、当該置換基中のいずれかの水素原子が、異なる構造の基で置換されていてもよい。その場合の「置換基」としては、C 1～6アルキル基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、ハロゲノ基、シアノ基、ニトロ基などを挙げることができる。

[0033] また、上記の「3～6員ヘテロシクリル基」とは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる1～4個のヘテロ原子を環の構成原子として含むものである。ヘテロシクリル基は、単環および多環のいずれであってもよい。多環ヘテロシクリル基は、少なくとも一つの環がヘテロ環であれば、残りの環が飽和脂環、不飽和脂環または芳香環のいずれであってもよい。「3～6員ヘテロシクリル基」としては、3～6員飽和ヘテロシクリル基、5～6員ヘテロアリール基、5～6員部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げることができる。

[0034] 「3～6員飽和ヘテロシクリル基」としては、アジリジニル基、エポキシ基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、チアゾリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げることができる。

[0035] 「5員ヘテロアリール基」としては、ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などを挙げることができる。

「6員ヘテロアリール基」としては、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などを挙げることができる。

「5～6員部分不飽和ヘテロシクリル基」としては、ピロリニル基、ジヒドロフラニル基、ジヒドロチオフェニル基、イミダゾリニル基、ピラゾリニル基、オキサゾリニル基、イソオキサゾリニル基、チアゾリニル基、イソチアゾリニル基などの5員部分不飽和ヘテロシクリル基；ジヒドロピラニル基

などの6員部分不飽和ヘテロシクリル基を挙げることができる。

[0036] [Z]

式(I)中のZは、酸素原子、または硫黄原子を示し、好ましくは酸素原子を示す。

[0037] [R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>]

式(I)中のR<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、または置換若しくは無置換のC1～6アルキル基を示す。

[0038] R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>における「C1～6アルキル基」は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>における「C1～6アルキル基」としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、i-プロピル基、i-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、i-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、i-ヘキシル基などを挙げることができる。

[0039] R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>における「C1～6アルキル基」上の置換基としては、ハロゲノ基、水酸基、C1～6アルコキシ基、C1～6ハロアルコキシ基、C3～6Rアルキル基、フェニル基、5員ヘテロアリール基、6員ヘテロアリール基、シアノ基； C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリール基；または C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリール基が好ましい。

[0040] これらの中でも、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、水素原子、または無置換のC1～6アルキルであることが好ましく、水素原子またはメチル基であることがより好ましい。

[0041] [Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>]

式(I)中のY<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、窒素原子、またはC R<sup>a</sup>で表される基を示す。ここで、R<sup>a</sup>は、水素原子、ハロゲノ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、または置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基を示す。

[0042] R<sup>a</sup>における「置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基」としては、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>におけるそれとして示したものと同一ものを挙げるができる。

[0043] R<sup>a</sup>における「ハロゲノ基」としては、フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基などを挙げるができる。

[0044] R<sup>a</sup>における「C 3～6シクロアルキル基」としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などを挙げるができる。

[0045] R<sup>a</sup>における「C 3～6シクロアルキル基」上の置換基としては、ハロゲノ基、C 1～6アルキル基、C 1～6ハロアルキル基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～6シクロアルキル基、フェニル基、5員ヘテロアリール基、6員ヘテロアリール基、シアノ基； C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリール基；または C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリール基が好ましい。

[0046] これらの中でも、式(I)中のY<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、窒素原子、またはC Hであることが好ましく、Y<sup>1</sup>がC Hであり、Y<sup>2</sup>が窒素原子であることがより好ましい。

[0047] [Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>]

式(I)中のQ<sup>1</sup>は、置換若しくは無置換の5員ヘテロアリアル基、置換若しくは無置換の6員ヘテロアリアル基、置換若しくは無置換のフェニル基、または置換若しくは無置換の縮合二環式9～10員ヘテロアリアル基を示す。

式(I)中のQ<sup>2</sup>は、置換若しくは無置換の5員ヘテロアリアル基、または置換若しくは無置換の6員ヘテロアリアル基を示す。

[0048] Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>における「5員ヘテロアリアル基」としては、ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などを挙げる事ができる。

Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>における「6員ヘテロアリアル基」としては、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などを挙げる事ができる。

[0049] Q<sup>1</sup>における「縮合二環式9員ヘテロアリアル基」としては、インドリル基、イソインドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、インダゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基などを挙げる事ができる。

Q<sup>1</sup>における「縮合二環式10員ヘテロアリアル基」としては、キノリニル基、イソキノリニル基、シンノリニル基、フタラジニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基などを挙げる事ができる。

[0050] Q<sup>1</sup>における「5員ヘテロアリアル基」、「6員ヘテロアリアル基」、「フェニル基」

または「縮合二環式9～10員ヘテロアリアル基」上の置換基、およびQ<sup>2</sup>における「5員ヘテロアリアル基」または「6員ヘテロアリアル基」上の置換基としては、ハロゲン基、C<sub>1</sub>～6アルキル基、C<sub>1</sub>～6ハロアルキル基、水酸基、C<sub>1</sub>～6アルコキシ基、C<sub>1</sub>～6ハロアルコキシ基、C<sub>3</sub>～6シ

クロアルキル基、C 1～6 ハロアルキルチオ基、C 1～6 ハロアルキルスルホニル基、フェニル基、5員ヘテロアリアル基、6員ヘテロアリアル基、シアノ基、アミノ基、アミノカルボニル基； C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリアル基；または C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリアル基が好ましい。

[0051] 前記置換基としての「C 1～6 ハロアルキルチオ基」としては、トリフルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基などが挙げられる。

[0052] 前記置換基としての「C 1～6 ハロアルキルスルホニル基」としては、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル基などが挙げられる。

[0053] これらの中でも、式(I)中のQ<sup>1</sup>は、置換若しくは無置換のフェニル基を示すことが好ましい。

前記Q<sup>1</sup>におけるフェニル基上の置換基は、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 1～6 ハロアルキルチオ基、C 1～6 ハロアルキルスルホニル基、および、アミノ基からなる群から選択される少なくとも一つであることが好ましい。

前記Q<sup>1</sup>におけるフェニル基上の置換基数は0～3であることが好ましく、2または3であることがより好ましく、2であることがより更に好ましい。

[0054] 式(I)中のQ<sup>2</sup>は、置換若しくは無置換の6員ヘテロアリアル基を示すことが好ましく、置換若しくは無置換のピリジル基または置換若しくは無置換のピリミジニル基を示すことがより好ましい。

前記Q<sup>2</sup>における6員ヘテロアリアル基上の置換基として、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルコキシ基、シアノ基、または、アミノカルボニル基が好ましく、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルコキシ基、またはシアノ基がより好ましい。

これらの中でも、前記Q<sup>2</sup>におけるピリジル基上の置換基として、ハロゲノ基、シアノ基、または、アミノカルボニル基が好ましく、ハロゲノ基またはシアノ基がより好ましい。

また、前記Q<sup>2</sup>におけるピリミジニル基上の置換基として、ハロゲノ基またはC 1～6ハロアルコキシ基が好ましい。

[0055] [A、B]

式(I)中のAは、単結合、または置換もしくは無置換のメチレン基を示す。

式(I)中のBは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、S = N - R<sup>o</sup>で表される基、S (=O) = N - R<sup>o</sup>で表される基、NR<sup>b</sup>で表される基、または置換もしくは無置換のメチレン基を示す。

R<sup>b</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルカルボニル基、または置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。

[0056] R<sup>b</sup>における「置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基」としては、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>におけるそれとして示したものと同一ものを挙げることができる。

[0057] R<sup>b</sup>における「置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基」としては、R<sup>a</sup>におけるそれとして示したものと同一ものを挙げるができる。

[0058] R<sup>b</sup>における「C 1～6アルコキシ基」としては、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*i*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基などを挙げるができる。

[0059] R<sup>b</sup>における「C 1～6アルキルカルボニル基」としては、アセチル基、プロピオニル、*n*-プロピルカルボニル基、*i*-プロピルカルボニル基、*n*-

ブチルカルボニル基、*t*-ブチルカルボニル基などを挙げることができる。

[0060] R<sup>b</sup>における「C 1～6 アルコキシカルボニル基」としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、*i*-プロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*t*-ブトキシカルボニル基などを挙げることができる。

[0061] R<sup>b</sup>における、「C 1～6 アルキル基」、「C 1～6 アルコキシ基」、「C 1～6 アルキルカルボニル基」、または「C 1～6 アルコキシカルボニル基」上の置換基としては、ハロゲノ基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 3～6 シクロアルキル基、フェニル基、5員ヘテロアリール基、6員ヘテロアリール基、シアノ基； C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリール基；または C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリール基が好ましい。

[0062] R<sup>b</sup>における、「C 3～6 シクロアルキル基」上の置換基としては、ハロゲノ基、C 1～6 アルキル基、C 1～6 ハロアルキル基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 3～6 シクロアルキル基、フェニル基、5員ヘテロアリール基、6員ヘテロアリール基、シアノ基； C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアルキル基、若しくはC 1～6 ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリール基；または C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 ハロアル

キル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリアル基が好ましい。

[0063] R<sup>o</sup>は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、またはシアノ基を示す。

[0064] R<sup>o</sup>における「置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基」としては、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>におけるそれとして示したものと同一ものを挙げる事ができる。

[0065] R<sup>o</sup>における「置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基」としては、R<sup>a</sup>におけるそれとして示したものと同一ものを挙げる事ができる。

[0066] R<sup>o</sup>における、「C 1～6アルキル基」上の置換基としては、ハロゲノ基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～6シクロアルキル基、フェニル基、5員ヘテロアリアル基、6員ヘテロアリアル基、シアノ基； C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリアル基；または C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリアル基が好ましい。

[0067] R<sup>o</sup>における、「C 3～6シクロアルキル基」または「フェニル基」上の置換基としては、ハロゲノ基、C 1～6アルキル基、C 1～6ハロアルキル基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～6シクロアルキル基、フェニル基、5員ヘテロアリアル基、6員ヘテロアリアル基、シアノ基； C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C 1～6ハロアルキル基、若しくはC 1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C 1～6アルキル基、C 1

～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリアル基；または C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリアル基が好ましい。

[0068] これらの中でも、R<sup>o</sup>としては、水素原子またはシアノ基であることが好ましく、水素原子であることがより好ましい。

[0069] AまたはBにおける「メチレン基」上の置換基としては、ハロゲノ基、水酸基、C1～6アルコキシ基、C1～6ハロアルコキシ基、C3～6シクロアルキル基、フェニル基、5員ヘテロアリアル基、6員ヘテロアリアル基、シアノ基； C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換されたフェニル基； C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された5員ヘテロアリアル基；または C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ハロゲノ基、C1～6ハロアルキル基、若しくはC1～6ハロアルコキシ基のいずれか1つ以上の置換基で置換された6員ヘテロアリアル基が好ましい。

[0070] これらの中でも、Aが酸素原子である時、Bは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、S=N-R<sup>o</sup>で表される基、S(=O)=N-R<sup>o</sup>で表される基、または無置換のメチレン基を示すことが好ましく、酸素原子または硫黄原子を示すことがより好ましい。

Aがメチレン基である時、Bは酸素原子であることが好ましい。

[0071] 式(II)中、Z、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、AおよびBは、式(I)中のそれらと同じものを示す。

[0072] これらの中でも、防除効果、製造の難易度など総合的な評価を踏まえると、化合物(I)またその塩であることが好ましい。

[0073] 化合物(I)の塩および化合物(II)の塩は、農園芸学的に許容される塩であれ

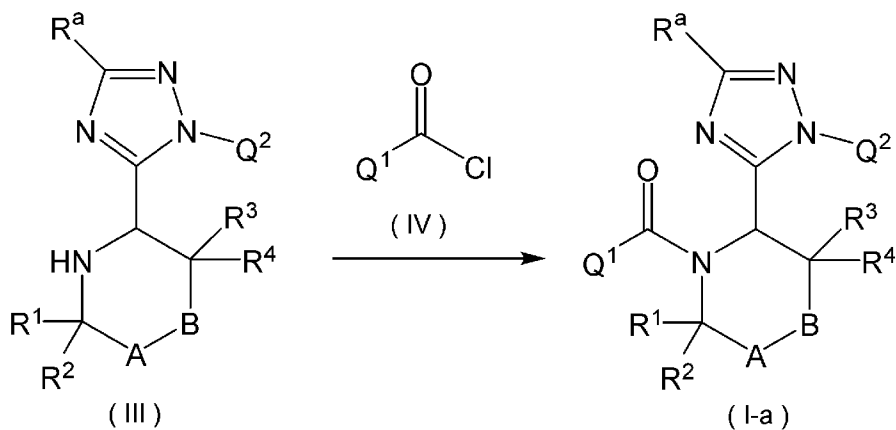
ば、特に制限されない。化合物(I)の塩および化合物(II)の塩としては、例えば、塩酸、硫酸などの無機酸の塩；酢酸、乳酸などの有機酸の塩；リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属の塩；カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属の塩；鉄、銅などの遷移金属の塩；アンモニア；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ヒドラジンなどの有機塩基の塩などを挙げることができる。

[0074] 化合物(I)、化合物(I)の塩、化合物(II)、および化合物(II)の塩の製造方法は特に限定されない。例えば、化合物(I)、化合物(I)の塩、化合物(II)、および化合物(II)の塩は、実施例等に記載した公知の製造方法によって得ることができる。また、化合物(I)の塩または化合物(II)の塩は、化合物(I)または化合物(II)から公知の手法によって得ることができる。

[0075] (反応スキーム1)

例えば、化合物(I)のうちで、式(I-a)で表される化合物（以下、式(I-a)の化合物と言うことがある。）の調製方法は、以下の反応スキーム1に示すことができる。

[0076] [化6]



[0077] 式(I-a)の化合物は、式(III)で表される化合物（以下、式(III)の化合物と言うことがある。）と式(IV)で表される化合物（以下、式(IV)の化合物と言うことがある。）を、有機塩基（例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンなど）の存在下混合し、0～100℃の範囲内の温度で反応させることで調製できる。

この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

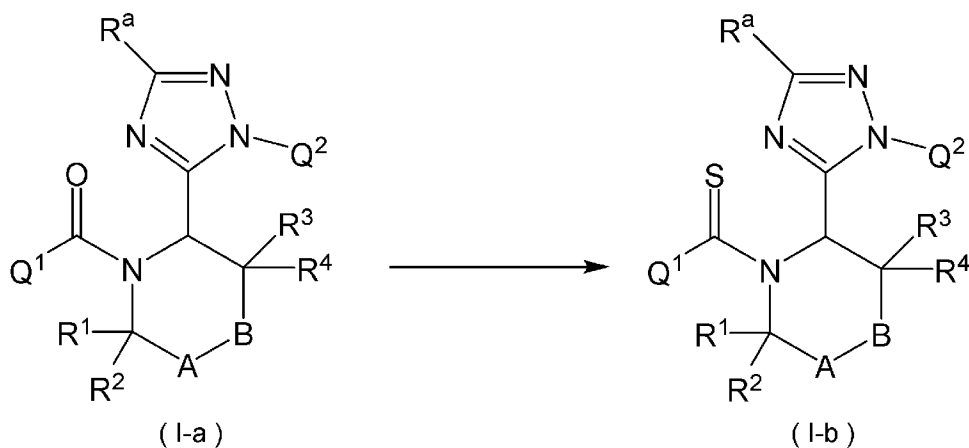
ここで、式(I-a)、式(III)、および式(IV)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

式(IV)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。例えば、引用文献1、または引用文献2に記載されている方法を用いて、調製することができる。

[0078] (反応スキーム2)

化合物(I)のうちで、式(I-b)で表される化合物(以下、式(I-b)の化合物とすることがある。)の調製方法は、以下の反応スキーム2に示すことができる。

[0079] [化7]



[0080] 式(I-b)の化合物は、式(I-a)の化合物を、ローソン試薬の存在下、0～100℃の範囲内の温度で反応させることで調製できる。

この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

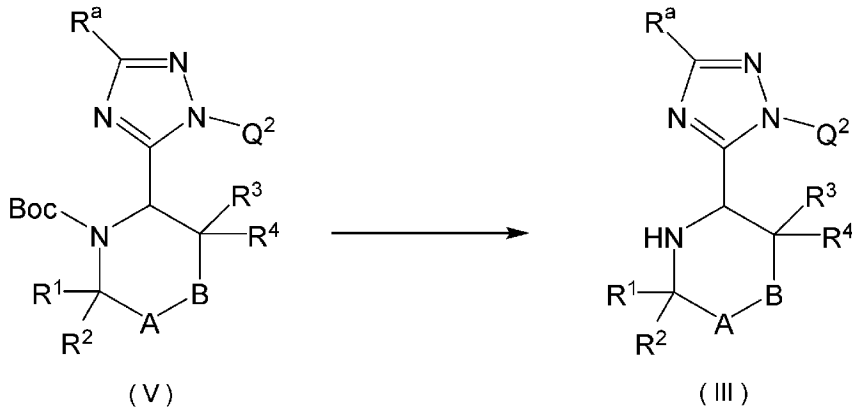
ここで、式(I-b)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

[0081] (反応スキーム3)

式(III)の化合物の調製方法は、以下の反応スキーム3に示すことができる。

。

[0082] [化8]



[0083] 式(III)の化合物は、式(V)で表される化合物（以下、式(V)の化合物と言うことがある。）を、酸（例えばトリフルオロ酢酸、塩酸など）の存在下、0～50℃の範囲内の温度で脱保護することで調製できる。この場合、得られる式(III)の化合物は、塩であってよい。

この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

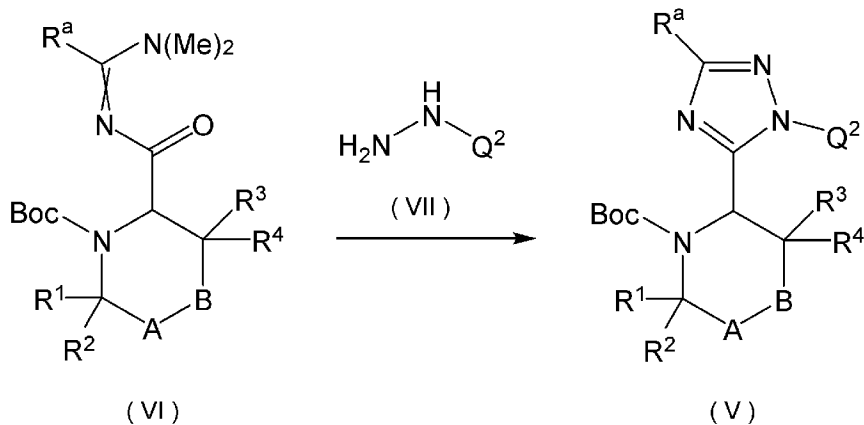
ここで、式(V)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。Bocは、tert-ブトキシカルボニル基を意味する。

[0084] (反応スキーム4)

式(V)の化合物の調製方法は、以下の反応スキーム4に示すことができる。

[0085]

[化9]



[0086] 式(V)の化合物は、式(VI)で表される化合物（以下、式(VI)の化合物とすることがある。）と式(VII)で表される化合物（以下、式(VII)の化合物とすることがある。）を、酸性条件下（例えば、酢酸と1,4-ジオキサンの混合溶媒）混合し、約20～100℃の範囲内の温度で反応させることで調製できる。

この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

ここで、式(VI)、および式(VII)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

式(VII)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。例えば、引用文献1、または引用文献2に記載されている方法を用いて、調製することができる。

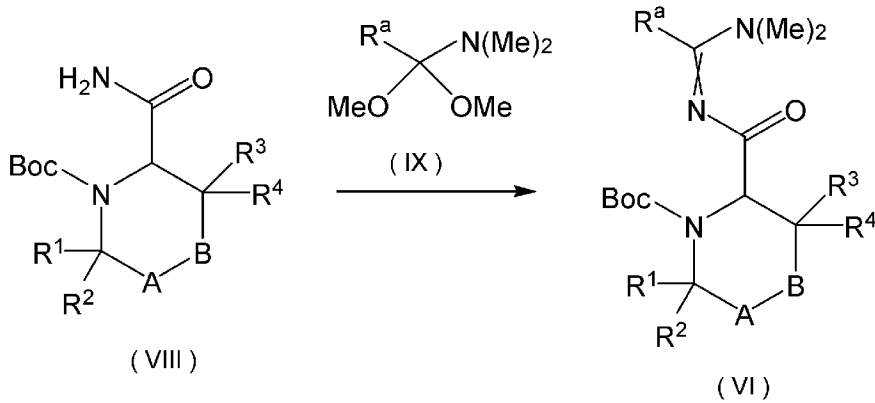
[0087] (反応スキーム5)

式(VI)の化合物の調製方法は、以下の反応スキーム5に示すことができる。

。

[0088]

[化10]



[0089] 式(VI)の化合物は、ジクロロメタンなどの好適な溶媒中、式(VIII)で表される化合物（以下、式(VIII)の化合物とすることがある。）と式(IX)で表される化合物（以下、式(IX)の化合物とすることがある。）を混合し、還流温度で反応させることで調製できる。

この化合物は、特に単離せず次の反応を行うことが好ましい。

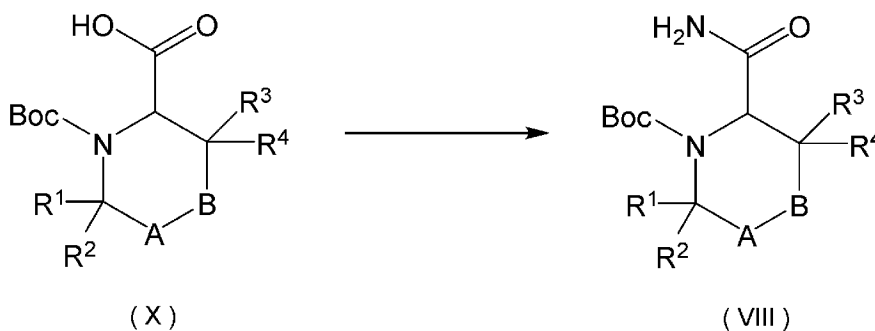
ここで、式(VIII)、および式(IX)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

式(IX)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。例えば、引用文献1、または引用文献2に記載されている方法を用いて、調製することができる。

[0090] (反応スキーム6)

式(VIII)の化合物の調製方法は、以下の反応スキーム6に示すことができる。

[0091] [化11]



[0092] 式(VIII)の化合物は、式(X)で表される化合物（以下、式(X)の化合物とすることがある。）に窒素源となる化合物を用いてアミド化することで、調製できる。例えば、式(X)の化合物を酸ハライドに誘導し、窒素源としてアンモニアを用いてアミド化する方法を挙げることができる。その他、式(X)の化合物をエステルに誘導し、窒素源としてアンモニアを用いてアミド化する方法を挙げることができる。その他、一般的なアミド結合の調製方法である、縮合剤を用いた脱水縮合反応も挙げることができる。

縮合剤としては、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩などを挙げることができる。

必要に応じて縮合補助剤も添加することができ、縮合補助剤としては、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール、1-ヒドロキシ-7-アザベンゾトリアゾールなどを挙げることができる。

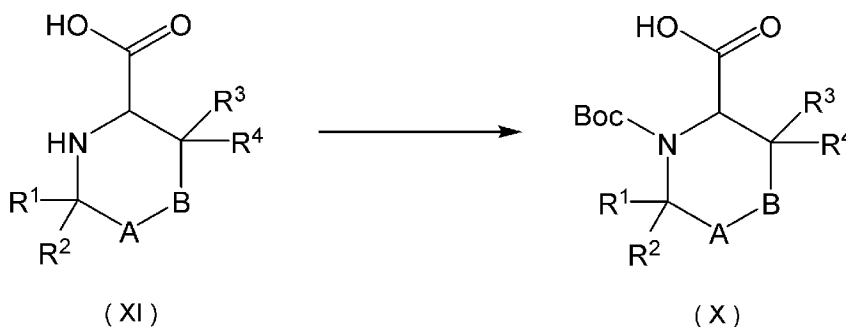
この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

ここで、式(X)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

[0093] (反応スキーム7)

式(X)の化合物の調製方法は、以下の反応スキーム7に示すことができる。

[0094] [化12]



[0095] 式(X)の化合物は、式(XI)で表される化合物（以下、式(XI)の化合物とすることがある。）を二炭酸ジ-*t*-ブチル（Boc<sub>2</sub>O）などを用いてBoc保

護することで、調製できる。

この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

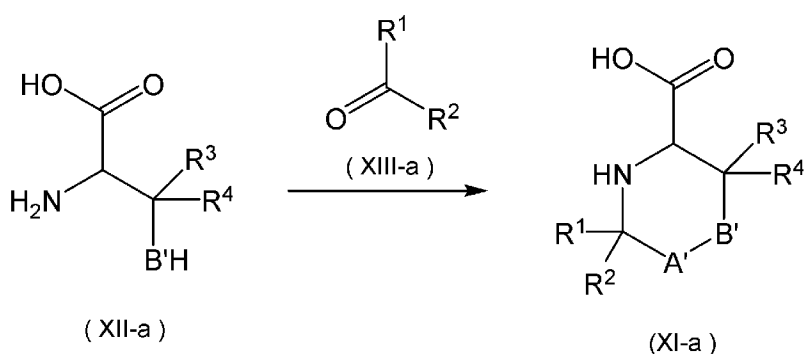
ここで、式(XI)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

式(XI)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。例えば、次に示す反応スキーム8または反応スキーム9を用いて、調製することができる。

[0096] (反応スキーム8)

化合物(XI)のうちで、式(XI-a)で表される化合物（以下、式(XI-a)の化合物と言うことがある。）の調製方法は、以下の反応スキーム8に示すことができる。

[0097] [化13]



[0098] 式(XI-a)の化合物は、エタノール、水、または含水エタノールなどの好適な溶媒中、式(XII-a)で表される化合物（以下、式(XII-a)の化合物と言うことがある。）と式(XIII-a)で表される化合物（以下、式(XIII-a)の化合物と言うことがある。）を、無機塩基（例えば、水酸化ナトリウム、酢酸ナトリウムなど）の存在下混合し、0℃～室温の範囲内の温度で反応させることで調製できる。

この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

ここで、式(XI-a)、および式(XII-a)中のA' は単結合を示し、B' は酸素原子、または硫黄原子を示し、その他の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。式(XIII-a)中の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

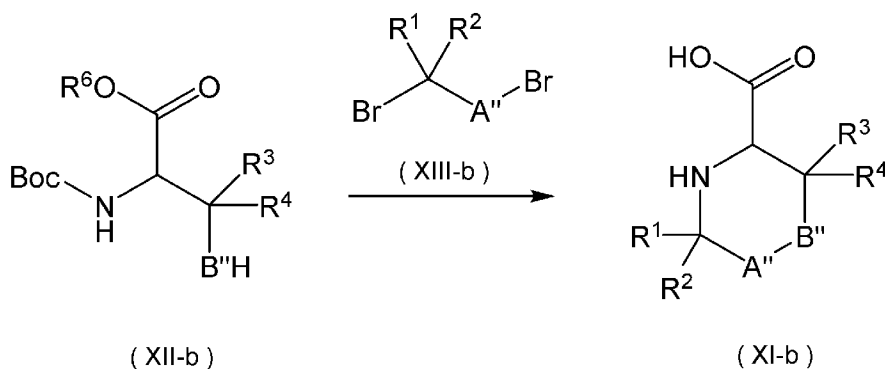
式(XII-a)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。

式(XIII-a)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。

[0099] (反応スキーム9)

化合物(XI)のうちで、式(XI-b)で表される化合物(以下、式(XI-b)の化合物と言うことがある。)の調製方法は、以下の反応スキーム9に示すことができる。

[0100] [化14]



[0101] 式(XI-b)の化合物は、アセトニトリルなどの好適な溶媒中、式(XII-b)で表される化合物(以下、式(XII-b)の化合物と言うことがある。)と式(XIII-b)で表される化合物(以下、式(XIII-b)の化合物と言うことがある。)を、無機塩基(例えば、カリウム tert-ブトキシドなど)の存在下混合し、還流温度で反応させることで調製できる。

次いで、酸(例えばトリフルオロ酢酸、塩酸など)の存在下、0~50℃の範囲内の温度で脱保護すること、および塩基(例えば、水酸化ナトリウムなど)の存在下、0~50℃の範囲内の温度でエステルの加水分解を行うことで、式(XI-b)の化合物を調製できる。

この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、ク

ロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

ここで、式(XI-b)および式(XIII-b)中のA”は置換もしくは無置換のメチレン基を示し、式(XI-b)、(XII-b)、および式(XIII-b)中のB”は酸素原子、または硫黄原子を示し、式(XII-b)中のR<sup>6</sup>はC<sub>1</sub>~6アルキル基を示し、その他の記号は式(I)中のそれらと同様の意味を示す。

式(XII-b)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。

式(XIII-b)の化合物は、市販されているか、または既知の方法で合成することができる。

[0102] 本発明のヘテロアリール化合物（以下、「本発明化合物」という。）は、植物の生育に影響する各種の農業害虫およびダニ類などの有害生物の防除効果に優れている。

また、本発明化合物は、農園芸作物に対する薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低いため、安全性の高い物質である。そのため、殺虫剤または殺ダニ剤の有効成分として有用である。

さらに、近年、コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシなど多くの害虫において各種既存薬剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫にも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は、感受性系統のみならず、各種抵抗性系統の害虫や、さらに殺ダニ剤抵抗性系統のダニ類にも優れた防除効果を示す。

[0103] 本発明化合物は、人獣に害を及ぼす外部寄生虫および内部寄生虫の防除効果に優れている。また、魚類や温血動物への毒性が低いため、安全性の高い物質である。そのため、外部寄生虫および内部寄生虫の防除剤の有効成分として有用である。

[0104] また、本発明化合物は、防除の対象となる生物のすべての发育ステージにおいて効力を示し、例えば、ダニ、昆虫などの卵、若虫、幼虫、蛹、成虫に対して優れた防除効果を示す。

## [0105] [有害生物防除剤]

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物およびその塩からなる群から選ばれる少なくともひとつを有効成分として含有する。本発明の有害生物防除剤に含まれる本発明化合物の量は有害生物の防除効果を示す限りにおいて特に制限されない。有害生物防除剤は、有害生物を防除する剤であり、殺虫若しくは殺ダニ剤、外部寄生虫防除剤、または内部寄生虫防除若しくは駆除剤などを包含するものである。

## [0106] [殺虫若しくは殺ダニ剤]

本発明の殺虫若しくは殺ダニ剤は、本発明化合物およびその塩からなる群から選ばれる少なくともひとつを有効成分として含有する。本発明の殺虫若しくは殺ダニ剤に含まれる本発明化合物の量は殺虫若しくは殺ダニ効果を示す限りにおいて特に制限されない。

[0107] 本発明の有害生物防除剤、または殺虫若しくは殺ダニ剤は、穀物類；野菜類；根菜類；イモ類；花卉類；果樹類；観葉植物、茶、コーヒー、カカオなどの樹木類；牧草類；芝類；ワタなどの植物に対して用いることが好ましい。

植物への施用において、本発明の有害生物防除剤、または殺虫若しくは殺ダニ剤は、葉、茎、柄、花、蕾、果実、種子、スプラウト、根、塊茎、塊根、苗条、挿し木などのいずれの部位に用いてもよい。

また、本発明の有害生物防除剤、または殺虫若しくは殺ダニ剤は、施用される植物の種によって特に制限されない。植物の種としては、例えば、原種、変種、改良品種、栽培品種、突然変異体、ハイブリッド体、遺伝子組み換え体（GMO）などを挙げることができる。

本発明の有害生物防除剤は、各種の農業害虫およびダニ類を防除するために、種子処理、茎葉散布、土壌施用、水面施用などに使用することができる。

[0108] 本発明の有害生物防除剤によって防除可能な各種の農業害虫およびダニ類の具体例を以下に示す。

[0109] (1) 鱗翅目 (Lepidoptera) のチョウまたは蛾

(a) ヒトリガ科 (Arctiidae) のガ、例えば、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、クワゴマダラヒトリ (*Lemyra imparilis*) ;

(b) チビガ科 (Bucculatricidae) のガ、例えば、ナシチビガ (*Bucculatrix pyrivorella*) ;

(c) シンクイガ科 (Carposinidae) のガ、例えば、モモシンクイガ (*Carposina sasakii*) ;

(d) ツトガ科 (Crambidae) のガ、例えば、ジアファニア属種 (*Diaphania* spp.) の、ワタヘリクロノメイガ (*Diaphania indica*)、アメリカウリノメイガ (*Diaphania nitidalis*) ; 例えば、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.) の、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ヨーロッパアンコンボラー (*Ostrinia nubilalis*)、アズキノメイガ (*Ostrinia scapulalis*) ; その他、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、モモノゴマダラノメイガ (*Conogethes punctiferalis*)、サウスウエスタンコンボラー (*Diatraea grandiosella*)、クワノメイガ (*Glyphodes pyloalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、シバツトガ (*Parapediasia teterrella*) ;

(e) キバガ科 (Gelechiidae) のガ、例えば、イモキバガ (*Helcystogramma triannulella*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、ジャガイモキバガ (*Phthorimaea operculella*)、バクガ (*Sitotroga cerealella*) ;

(f) シャクガ科 (Geometridae) のガ、例えば、ヨモギエダシャク (*Ascotis selenaria*) ;

(g) ホソガ科 (Gracillariidae) のガ、例えば、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*

)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*) ;

(h) セセリチョウ科 (Hesperiidae) のチョウ、例えば、イチモンジセセリ

(*Parnara guttata*) ;

(i) カレハガ科 (*Lasiocampidae*) のガ、例えば、オビカレハ (*Malacosoma neustria*) ;

(j) ドクガ科 (*Lymantriidae*) のガ、例えば、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.) の、マイマイガ (*Lymantria dispar*)、ノンネマイマイ (*Lymantria monacha*) ; その他の、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*)、ヒメシロモンドクガ (*Orgyia thyellina*) ;

[0110] (k) モグリガ科 (*Lyonetiidae*) のガ、例えば、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.) の、モモハモグリガ (*Lyonetia clerkella*)、ギンモンハモグリガ (*Lyonetia prunifoliellamalinella*) ;

(l) ヤガ科 (*Noctuidae*) のガ、例えば、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.) の、スジキリヨトウ (*Spodoptera depravata*)、サザンアーミーワーム (*Spodoptera eridania*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*)、アフリカヨトウ (*Spodoptera littoralis*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) ; 例えば、オートグラファ属種 (*Autographa* spp.) の、ガマキンウワバ (*Autographa gamma*)、タマナギンウワバ (*Autographa nigrisigna*) ; 例えば、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.) の、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、カブラヤガ (*Agrotis segetum*) ; 例えば、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.) の、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、タバコガ (*Helicoverpa assulta*)、コットンボールワーム (*Helicoverpa zea*) ; 例えば、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.) の、ワタキバガ (*Heliothis armigera*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) ; その他の、ナカジロシタバ (*Aedia leucomelas*)、ミツモンキンウワバ (*Ctenoplusia agnata*)、アケビコノハ (*Eudocima tyrannus*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、アワヨトウ (*Mythimna separata*)、フタオビコヤガ (*Naranga aenescens*)、マツキリガ (*Panolis japonica*)、ニセタマナヤガ (*Peridroma saucia*)、ソイビーンルーパー (*Pseudoplusia includens*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*) ;

(m) コブガ科 (Nolidae) のガ、例えば、ミスジアオリングア (*Earias insulana*) ;

(n) シロチョウ科 (Pieridae) のチョウ、例えば、モンシロチョウ属種 (*Pieris* spp.) のオオモンシロチョウ (*Pieris brassicae*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*) ;

(o) コナガ科 (Plutellidae) のガ、例えば、アクロレピオプシス属種 (*Acrolepiopsisspp.*) の、ネギコガ (*Acrolepiopsis sapporensis*)、ヤマノイモコガ (*Acrolepiopsis suzukiella*) ; その他、コナガ (*Plutella xylostella*) ;

(p) メイガ科 (Pyralidae) のガ、例えば、スジマダラメイガ (*Cadra cautella*)、モロコシマダラメイガ (*Elasmopalpus lignosellus*)、シロイチモジマダラメイガ (*Etiella zinckenella*)、ハチノスツヅリガ (*Galleria mellonella*) ;

(q) スズメガ科 (Sphingidae) のガ、例えば、マンジュカ属種 (*Manduca* spp.) の、トマトホーンワーム (*Manduca quinquemaculata*)、タバコホーンワーム (*Manduca sexta*) ;

[0111] (r) ニセマイコガ科 (Stathmopodidae) のガ、例えば、カキノヘタムシガ (*Stathmopoda masinissa*) ;

(s) ヒロズコガ科 (Tineidae) のガ、例えば、イガ (*Tinea translucens*) ;

(t) ハマキガ科 (Tortricidae) のガ、例えば、アドキシソフィエス属種 (*Adoxophyes* spp.) の、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) ; 例えば、アルチプス属種 (*Archips* spp.) の、リンゴモンハマキ (*Archips breviplicanus*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*) ; その他の、トウヒノシントメハマキ (*Choristoneura fumiferana*)、コドリガ (*Cydia pomonella*)、ブドウホソハマキ (*Eupoecilia ambiguella*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholitha molesta*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、マメシンクイガ (*Leguminivora g*

lycinivorella)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*)、マメヒメサヤムシガ (*Matsumuraeses phaseoli*)、トビハマキ (*Pandemis heparana*)、テングハマキ (*Sparganothis pilleriana*) ;

(u) スガ科 (*Yponomeutidae*) のガ、例えば、リンゴヒメシンクイ (*Argyresthia conjugella*) 。

[0112] (2) アザミウマ目 (*Thysanoptera*) 害虫

(a) クダアザミウマ科 (*Phlaeothripidae*) の、例えば、カキクダアザミウマ (*Ponticulothrips diospyrosi*) ;

(b) アザミウマ科 (*Thripidae*) の、例えば、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella* spp.) の、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) ; 例えば、トリプス属種 (*Thrips* spp.) の、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*) ; その他の、クロトンアザミウマ (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*) 。

[0113] (3) カメムシ目 (*Hemiptera*) の害虫

(A) 頸吻亜目 (*Archaeorrhyncha*)

(a) ウンカ科 (*Delphacidae*) の、例えば、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)

、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) 。

[0114] (B) 頸吻亜目 (*Clypeorrhyncha*)

(a) ヨコバイ科 (*Cicadellidae*) の、例えば、エンポアスカ属種 (*Empoasca* spp.) の、ジャガイモヒメヨコバイ (*Empoasca fabae*)、カキノヒメヨコバイ (*Empoasca nipponica*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、マメノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca sakaii*)、; その他の、フタテンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、ミドリナガヨコバイ (*Balclutha saltuella*)、フタテンオオヨコバイ (*Epiacanthus stramineus*)、ヒメフタテンヨコバイ (*Macrosteles striifrons*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix c*

inctinceps)。

[0115] (C) カメムシ亜目 (Heteroptera)

(a) ホソヘリカメムシ科 (Alydidae) の、例えば、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*) ;

(b) ヘリカメムシ科 (Coreidae) の、例えば、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)

、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*) ;

(c) ナガカメムシ科 (Lygaeidae) の、例えば、アメリカコバネナガカメムシ (*Blissus leucopterus*)、カンシャコバネナガカメムシ (*Cavelerius saccharivorus*)、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*) ;

(d) カスミカメムシ科 (Miridae) の、例えば、クロトビカスミカメ (*Halticus insularis*)、サビイロカスミカメ (*Lygus lineolaris*)、コットンフリーホッパー (*Pseudatomoscelis seriatus*)、ナガムギカスミカメ (*Stenodema sibiricum*)、アカスジカスミカメ (*Stenotus rubrovittatus*)、イネホソミドリカスミカメ (*Trigonotylus caelestialium*) ;

[0116] (e) カメムシ科 (Pentatomidae) の、例えば、ネザラ属種 (*Nezara* spp.) の、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*) ; 例えば、シラホシカメムシ属種 (*Eysarcoris* spp.) の、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris aeneus*)、オオトゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris lewisi*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、その他の、ブチヒゲカメムシ (*Dolycoris baccarum*)、ナガメ (*Eurydema rugosum*)、ツヤアオカメムシ (*Glaucias subpunctatus*)、サギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、クイチモンジカメムシ (*Piezodorus hybneri*)、チャバネアオカメムシ (*Plautia crossota*)、イネクロカメムシ (*Scotinophora lurida*) ;

(f) ホシカメムシ科 (Pyrrhocoridae) の、例えば、アカホシカメムシ (*Dysdercus cingulatus*) ;

(g) ヒメヘリカメムシ科 (Rhopalidae) の、例えば、アカヒメヘリカメムシ (*Rhopalusmsculatus*) ;

(h) キンカメムシ科 (Scutelleridae) の、例えば、ムギチャイロカメムシ (*Eurygaster integriceps*) ;

(i) グンバイムシ科 (Tingidae) の、例えば、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*) 。

[0117] (D) 腹吻亜目 (Sternorrhyncha)

(a) カサアブラムシ科 (Adelgidae) の、例えば、カラマツカサアブラムシ (*Adelges laricis*) ;

(b) コナジラミ科 (Aleyrodidae) の、例えば、ベミシア属種 (*Bemisia* sp p.) の、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*) ; その他の、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*) ;

(c) アブラムシ科 (Aphididae) の、例えば、アフィス属種 (*Aphis* spp.) の、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、マメクロアブラムシ (*Aphis fabae*)、イチゴネアブラムシ (*Aphis forbesi*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、ヨーロッパリンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、ニワトコアブラムシ (*Aphis sambuci*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*) ; 例えば、ロパロシウム属種 (*Rhopalosiphum* spp.) の、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*) ; 例えば、ジサフィス属種 (*Dysaphis* spp.) の、オオバコアブラムシ (*Dysaphis plantaginea*)、ギシギシネアブラムシ (*Dysaphis radicola*) ; 例えば、マクロシウム属種 (*Macrosiphum* spp.) の、ムギヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum avenae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*) ; 例えば、ミズス属種 (*Myzus* spp.) の、ニワウメクロコブアブラムシ (*Myzus cerasi*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、カワリコブアブラムシ (*Myzus varians*) ; その他の、エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ムギワラギクオマルアブラムシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ダイコンアブラ

ムシ (*Brevicoryne brassicae*)、イチゴケナガアブラムシ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*)、チシャミドリアブラムシ (*Hyperomyzus lactucae*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ (*Megoura viciae*)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、レタスアブラムシ (*Nasonovia ribis-nigri*)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*)、ムギヒゲナガアブラムシ (*Sitobion avenae*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*) ;

[0118] (d) カタカイガラムシ科 (*Coccidae*) の、例えば、セロプラスター属種 (*Ceroplastesspp.*) の、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*) ;

(e) マルカイガラムシ科 (*Diaspididae*) の、シューダウラカスピス属種 (*Pseudaulacaspis spp.*) の、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、ウメシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis prunicola*) ; 例えば、ウナスピス属種 (*Unaspis spp.*) の、マサキナガカイガラムシ (*Unaspis euonymi*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*) ; その他の、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、ナシマルカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、チャコノハカイガラムシ (*Fiorinia theae*)、チャノマルカイガラムシ (*Pseudaonidia paeoniae*) ;

(f) ワタフキカイガラムシ科 (*Margarodidae*) の、例えば、オオワラジカイガラムシ (*Drosicha corpulenta*)、イセリアカイガラムシ (*Icerya purchasi*) ;

(g) ネアブラムシ科 (*Phylloxeridae*) の、例えば、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*) ;

(h) コナカイガラムシ科 (*Pseudococcidae*) の、例えば、プラノコッカス属種 (*Planococcus spp.*) の、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kuraunhiaei*) ; その他の、ナスコナカイガラムシ (*Phenacoccus solani*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococ*

cus comstocki) ;

(i) キジラミ科 (Psyllidae) の、例えば、プスルラ属種 (Psylla spp.) の、リンゴキジラミ (Psylla mali) 、ナシキジラミ (Psylla pyrisuga) ; その他の、ミカンキジラミ (Diaphorina citri) 。

[0119] (4) カブトムシ亜目 (Polyphaga) の害虫

(a) シバンムシ科 (Anobiidae) の、例えば、タバコシバンムシ (Lasioderma serricorne) ;

(b) オトシブミ科 (Attelabidae) の、例えば、ドロハマキチヨッキリ (Byctiscus betulae) 、モモチヨッキリゾウムシ (Rhynchites heros) ;

(c) ナガシクイムシ科 (Bostrichidae) の、例えば、ヒラタクイムシ (Lyctus brunneus) ;

(d) ミツギリゾウムシ科 (Brentidae) の、例えば、アリモドキゾウムシ (Cylas formicarius) ;

(e) タمامシ科 (Buprestidae) の、例えば、アカバナガタمامシ (Agrilus sinuatus) ;

(f) カミキリムシ科 (Cerambycidae) の、例えば、ゴマダラカミキリ (Anoplophora malasiaca) 、マツノマダラカミキリ (Monochamus alternatus) 、キボシカミキリ (Psacothea hilaris) 、ブドウトラカミキリ (Xylotrechus pyrrhoderus) ;

(g) ハムシ科 (Chrysomelidae) の、例えば、ブルクス属種 (Bruchus spp.) の、エンドウマメゾウムシ (Bruchus pisorum) 、ソラマメゾウムシ (Bruchus rufimanus) ; 例えば、ジアブロチカ属種 (Diabrotica spp.) の、ノーザンコーンルートワーム (Diabrotica barberi) 、サザンコーンルートワーム (Diabrotica undecimpunctata) 、ウエスタンコーンルートワーム (Diabrotica virgifera) ; 例えば、フィロトレタ属種 (Phyllotreta spp.) の、ノミトビヨロイムシ (Phyllotreta nemorum) 、キスジノミハムシ (Phyllotreta striolata) ; その他の、ウリハムシ (Aulacophora femoralis) 、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis) 、カメノコハムシ (Cassida nebulos

a) 、テンサイトビハムシ (*Chaetocnema concinna*) 、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) 、イネクビホソハムシ (*Oulema oryzae*) 、ナスナガスネトビハムシ (*Psylliodes angusticollis*) ;

[0120] (h) テントウムシ科 (Coccinellidae) の、例えば、エピラクナ属種 (*Epilachna* spp.) の、インゲンテントウ (*Epilachna varivestis*) 、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) ;

(i) ゾウムシ科 (Curculionidae) の、例えば、アントノムス属種 (*Anthonomus* spp.) の、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*) 、ナシハナゾウムシ (*Anthonomus pomorum*) ; 例えば、シトフィルスコクゾウムシ属種 (*Sitophilus* spp.) の、グラナリーウィービル (*Sitophilus granarius*) 、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*) ; その他の、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*) 、イモゾウムシ (*Euscepes postfasciatus*) 、マツアナアキゾウムシ (*Hylobius abietis*) 、アルファルフアタコゾウムシ (*Hypera postica*) 、イネミズゾウムシ (*Lissohoptrus oryzophilus*) 、キンケクチフトゾウムシ (*Otiorhynchus sulcatus*) 、アカアシチビコフキゾウムシ (*Sitona lineatus*) 、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus*) ;

(j) コメツキムシ科 (Elateridae) の、例えば、メラノツス属種 (*Melanotus* spp.) の、マルクビクシコメツキ (*Melanotus fortnumi*) 、カンシャクシコメツキ (*Melanotus tamsuyensis*) ;

(k) ケシキスイ科 (Nitidulidae) の、例えば、ヒメヒラタケシキスイ (*Epuraea domina*) ;

(l) コガネムシ科 (Scarabaeidae) の、例えば、アノマラ属種 (*Anomala* spp.) の、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*) 、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*) ; その他の、キンイロハナムグリ (*Cetonia aurata*) 、コアオハナムグリ (*Gametis jucunda*) 、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*) 、ヨーロッパコフキコガネ (*Melolontha melolontha*) 、マメコガネ (*Popillia japonica*) ;

(m) キクイムシ科 (Scolytidae) の、例えば、ヤツバクイ (*Ips typogr*

aphus) ;

(n) ハネカクシ科 (Staphylinidae) の、例えば、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) ;

(o) ゴミムシダマシ科 (Tenebrionidae) の、例えば、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*) ;

(p) コクヌスト科 (Trogossitidae) の、例えば、コクヌスト (*Tenebrioides mauritanicus*) 。

[0121] (5) ハエ目 (Diptera) の害虫

(A) ハエ亜目 (Brachycera)

(a) ハモグリバエ科 (Agromyzidae) の、例えば、リリオマイザ属種 (*Liriomyza* spp.) の、ナスハモグリバエ (*Liriomyza bryoniae*)、ネギハモグリバエ (*Liriomyza chinensis*)、トマトハモグリバエ (*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*) ; その他の、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*) ;

(b) ハナバエ科 (Anthomyiidae) の、例えば、デリア属種 (*Delia* spp.) の、タネバエ (*Delia platura*)、キャベツハナバエ (*Delia radicum*) ; その他の、テンサイモグリハナバエ (*Pegomya cunicularia*) ;

(c) ショウジョウバエ科 (Drosophilidae) の、例えば、ショウジョウバエ属種 (*Drosophila* spp.) の、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、オウトウショウジョウバエ (*Drosophila suzukii*) ;

(d) ミギワバエ科 (Ephydriidae) の、例えば、イネヒメハモグリバエ (*Hydrellia griseola*) ;

(e) ハネオレバエ科 (Psilidae) の、例えば、ニンジンサビバエ (*Psilarosae*) ;

(f) ミバエ科 (Tephritidae) の、例えば、バクトロセラ属種 (*Bactrocera* spp.) の、ウリミバエ (*Bactrocera cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Bactrocera dorsalis*) ; 例えば、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.) の、ヨーロ

ツパオウトウミバエ (*Rhagoletis cerasi*)、リンゴミバエ (*Rhagoletis pomonella*) ; その他の、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*)、オリーブミバエ (*Dacus oleae*)。

[0122] (B) カ垂目 (Nematocera)

(a) タマバエ科 (Cecidomyiidae) の、例えば、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia yushimai*)、ソルガムタマバエ (*Contarinia sorghicola*)、ヘシアンバエ (*Mayetiola destructor*)、ムギアカタマバエ (*Sitodiplosis mosellana*)。

[0123] (6) バッタ目 (Orthoptera) の害虫

(a) バッタ科 (Acrididae) の、例えば、スキストセルカ属種 (*Schistocerca* spp.) の、アメリカイナゴ (*Schistocerca americana*)、サバクトビバッタ (*Schistocerca gregaria*) ; その他の、オーストラリアトビバッタ (*Chortoicetes terminifera*)、モロッコイナゴ (*Doclostaurus maroccanus*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、ブラウンイナゴ (*Locustana pardalina*)、アカトビバッタ (*Nomadacris septemfasciata*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*) ;

(b) コオロギ科 (Gryllidae) の、例えば、ヨーロッパイエコオロギ (*Acheta domestica*)、エンマコオロギ (*Teleogryllus emma*) ;

(c) ケラ科 (Gryllotalpidae) の、例えば、ケラ (*Gryllotalpa orientalis*) ;

(d) キリギリス科 (Tettigoniidae) の、例えば、クラズミウマ (*Tachycines asynamorus*)。

[0124] (7) ダニ類 (Acari)

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

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

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

[0125] (B) 前気門目 (Prostigmata) のケダニ類 (Actinedida)

(a) ハダニ科 (Tetranychidae) のダニ、例えば、ブリオビア属種 (*Bryobia*  
*spp.*) の、クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*)、ニセクローバーハダ  
ニ (*Bryobia rubrioculus*) ; 例えば、エオテトラニクス属種 (*Eotetranychu*  
*s spp.*) の、コウノシロハダニ (*Eotetranychus asiaticus*)、アンズハダニ  
(*Eotetranychus boreus*)、エノキハダニ (*Eotetranychus celtis*)、ミチ  
ノクハダニ (*Eotetranychus geniculatus*)、ミヤケハダニ (*Eotetranychus*  
*kankitus*)、クリハダニ (*Eotetranychus pruni*)、シイノキハダニ (*Eotetr*  
*anychus shii*)、スミスハダニ (*Eotetranychus smithi*)、スギナミハダニ  
(*Eotetranychus suginamensis*)、クルミハダニ (*Eotetranychus uncatus*)  
; 例えば、オリゴニクス属種 (*Oligonychus spp.*) の、スギノハダニ (*Oligo*  
*nychus hondoensis*)、チビコブハダニ (*Oligonychus ilicis*)、カラマツハ  
ダニ (*Oligonychus karamatus*)、マンゴーハダニ (*Oligonychus mangiferus*  
)、サトウキビハダニ (*Oligonychus orthius*)、アボガドハダニ (*Oligonyc*  
*hus perseae*)、エゾスギハダニ (*Oligonychus pustulosus*)、イネハダニ (*O*  
*ligonychus shinkajii*)、トドマツハダニ (*Oligonychus ununguis*) ; 例え  
ば、パノニクス属種 (*Panonychus spp.*) の、ミカンハダニ (*Panonychus cit*  
*ri*)、クワオオハダニ (*Panonychus mori*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulm*  
*i*) ; 例えば、テトラニクス属種 (*Tetranychus spp.*) の、ニセナミハダニ (*T*  
*etranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、  
アシノウハダニ (*Tetranychus ludeni*)、ミズナラハダニ (*Tetranychus que*  
*rcivorus*)、サガミハダニ (*Tetranychus phaselus*)、ナミハダニ (*Tetrany*  
*chus urticae*)、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*) ミツユビナミ  
ハダニ (*Tetranychus evansi*) ; 例えば、アポニクス属 (*Aponychus spp.*)

の、イトマキハダニ (*Aponychus corpuzae*)、タイリクハダニ (*Aponychus firmiana*) ; 例えば、ミドリハダニ属 (*Sasanychus* spp.) の、ミドリハダニ (*Sasanychus akitanus*)、ヒメミドリハダニ (*Sasanychus pusillus*) ; 例えば、シゾテトラニクス属 (*Shizotetranychus* spp.) の、タケスゴモリハダニ (*Shizotetranychus celarius*)、ケナガスゴモリハダニ (*Shizotetranychus longus*)、ススキスゴモリハダニ (*Shizotetranychus miscanthi*)、ヒメササハダニ (*Shizotetranychus recki*)、ヤナギハダニ (*Shizotetranychus schizopus*) ; その他、カタバミハダニ (*Tetranychina harti*)、ナミケナガハダニ (*Tuckerella pavoniformis*)、ケウスハダニ (*Yezonychus sapporensis*) ;

[0126] (b) ヒメハダニ科 (*Tenuipalpidae*) のダニ、例えば、ブレビパルプス属種 (*Brevipalpus* spp.) の、ブドウヒメハダニ (*Brevipalpus lewisi*)、チャノヒメハダニ (*Brevipalpus obovatus*)、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*)、サボテンヒメハダニ (*Brevipalpus russulus*)、オンシツヒメハダニ (*brevipalpus californicus*) ; 例えば、テニパルプス属種 (*Tenuipalpus* spp.) の、ランヒメハダニ (*Tenuipalpus pacificus*)、カキヒメハダニ (*Tenuipalpus zhizhilashviliae*) ; その他、パイナップルヒメハダニ (*Dolichotetranychus floridanus*) ;

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

リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*) ; その他、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ブドウハモグリダニ (*Colomerus vitis*)、ブドウサビダニ (*Calepitrimerus vitis*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)、キンモクサビダニ (*Paraphytoptus kikus*)、マキサビダニ (*Paracalacarus podocarpi*)、リュウキュウミカンサビダニ (*Phyllocotruta citri*) ;

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

(e) ハシリダニ科 (*Penthaleidae*) のダニ、例えば、ペントレウス属種 (*Penthaleus* spp.) の、ハクサイダニ (*Penthaleus erythrocephalus*)、ムギダニ (*Penthaleus major*) 。

[0127] 本発明の有害生物防除剤は、殺菌剤、殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤などの他の有効成分； 植物調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料などと混用または併用してもよい。

本発明化合物と他の有効成分との組合せは、殺虫・殺ダニ・殺線虫活性に関して相乗効果が期待できる。相乗効果は、定法に従ってコルビーの式 (Colby, S.R. ; Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations ; Weeds 15, 20-22頁, 1967) により確認することができる。

[0128] 本発明の有害生物防除剤と混用または併用することができる、殺虫・殺ダニ剤の具体例を以下に示す。

(1 B) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤 (有機リン系)

アセフェート (Acephate)、アザメチホス (Azamethiphos)、アジンホスエチル (Azinphos-ethyl)、アジンホスメチル (Azinphosmethyl)、カズサホス (Cadusafos)、クロレトキシホス (Chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス (Chlorfenvinphos)、クロルメホス (Chlormephos)、クロルピリホ

ス (Chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (Chlorpyrifos-methyl)、クマホス (Coumaphos)、シアノホス (Cyanophos)、ジメトン-S-メチル (Demeton-S-methyl)、ダイアジノン (Diazinon)、ジクロルボス (Dichlorvos/ DDV P)、ジクロトホス (Dicrotophos)、ジメトエート (Dimethoate)、ジメチルビンホス (Dimethylvinphos)、ジスルホトン (Disulfoton)、E P N、エチオン (Ethion)、エトプロホス (Ethoprophos)、ファンフル (Famphur)、フェナミホス (Fenamiphos)、フェニトロチオン (Fenitrothion)、フェンチオン (Fenthion)、ホスチアゼート (Fosthiazate)、ヘプテノホス (Heptenophos)、イミシアホス (Imicyafos)、イソフェンホス (Isofenphos)、イソプロピル=O-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチラート (Isopropyl O-(methoxyaminothio-phosphoryl) salicylate)、イソキサチオン (Isoxathion)、馬拉チオン (Malathion)、メカルバム (Mecarbam)、メタミドホス (Methamidophos)、メチダチオン (Methidathion)、メビンホス (Mevinphos)、モノクロトホス (Monocrotophos)、ナレド (Naled)、オメトエート (Omethoate)、オキシジメトンメチル (Oxydemeton-methyl)、パラチオン (Parathion)、パラチオンメチル (Parathion-methyl)、フェントエート (Phenthoate)、ホレート (Phorate)、ホサロン (Phosalone)、ホスメット (Phosmet)、ホスファミドン (Phosphamidon)、ホキシム (Phoxim)、ピリミホスメチル (Pirimiphos-methyl)、プロフェノホス (Profenofos)、プロペタムホス (Propetamphos)、プロチオホス (Prothiofos)、ピラクロホス (Pyraclofos)、ピリダフェンチオン (Pyridaphenthion)、キナルホス (Quinalphos)、スルホテップ (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 (Trichlorfon)、バミドチオン (Vamidothion)。

ブロモホス-エチル (Bromophos-e)、シアノフェンホス (Cyanofenphos)、デメトン-S-メチルスルホン (Demeton-S-methylsulfone)、ジアリホス (Dialifos)、ジクロフェンチオン (Dichlofenthion)、ジオキサベンゾ

ホス (Dioxabenzofos)、エトリムホス (Etrimfos)、フェンスルホチオン (Fensulfothion)、ホノホス (Fonofos)、ホルモチオン (Formothion)、ヨードフェンホス (iodofenphos)、イサゾホス (Isazofos)、イソカルボホス (Isocarbofos)、メタクリホス (Methacrifos)、ホスホカルブ (Phosphocarb)、ピリミホス-エチル (Pirimiphos-e)、プロパホス (Propaphos)、プロトエート (Prothoate)、スルプロホス (Sulprofos)。

[0129] (2) GABA作動性塩化物イオン(塩素イオン)チャンネルブロッカー

クロルデン (Chlordane)、エンドスルファン (Endosulfan) ; エチプロール (Ethiprole)、フィプロニル (Fipronil)。

アセトプロール (Acetoprole)、カンフェクロル (Camphechlor)、ジエノクロル (Dienochlor)、ヘプタクロル (Heptachlor)、ピラフルプロール (Pyrfluprole)、ピリプロール (Pyriprole) ; フルフィプロール (Flufiprole)。

(3A) ナトリウムチャンネルモジュレーター (ピレスロイド系)

アクリナトリン (Acrinathrin)、アレスリン (Allethrin)、d-シス-トランス-アレスリン (d-cis-trans Allethrin)、d-トランス-アレスリン (d-trans Allethrin)、ビフェントリン (Bifenthrin)、バイオアレスリン (Bioallethrin)、バイオアレスリン-S-シクロペンテニル-異性体 (Bioallethrin S-cyclopentenyl-isomer)、ビオレスメトリン (Bioresmethrin)、シクロプロトリン (Cycloprothrin)、シフルトリン (Cyfluthrin)、 $\beta$ -シフルトリン (beta-Cyfluthrin)、シハロトリン (Cyhalothrin)、 $\lambda$ -シハロトリン (lambda-Cyhalothrin)、 $\gamma$ -シハロトリン (gamma-Cyhalothrin)、シペルメトリン (Cypermethrin)、 $\alpha$ -シペルメトリン (alpha-Cypermethrin)、 $\beta$ -シペルメトリン (beta-Cypermethrin)、 $\theta$ -シペルメトリン (theta-Cypermethrin)、 $\zeta$ -シペルメトリン (zeta-Cypermethrin)、シフェノトリン[(1R)-トランス異性体] (Cyphenothrin [(1R)-trans-isomers])、デルタメトリン (Deltamethrin)、エンペントリン[(EZ)-(1R)-異性体] (Empenthrin [(EZ)-(1R)-isomers])、エスフェンバレレート (Esfenvalerate)、エトフェンプロック

ス (Etofenprox)、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)、フルメトリン (Flumethrin)、 $\tau$ -フルバリネート ( $\tau$ -Fluvalinate)、ハルフェンプロックス (Halfenprox)、イミプロトリン (Imiprothrin)、カデスリン (Kadethrin)、ペルメトリン (Permethrin)、フェノトリン[(1R)-トランス異性体] (Phenothrin [(1R)-trans-isomer])、プラレトリン (Prallethrin)、ピレトリン (Pyrethrins)、レスメトリン (Resmethrin)、シラフルオフエン (Silafluofen)、テフルトリン (Tefluthrin)、テトラメスリン (Tetramethrin)、テトラメスリン[(1R)-異性体] (Tetramethrin[(1R)-isomers])、トラロメトリン (Tralomethrin)、トランスフルトリン (Transfluthrin)。

$\kappa$ -ビフェントリン (kappa-Bifenthrin)、ビオペルメトリン (Biopermethrin)、クロロプラレスリン (Chloroprallethrin)、ジメフルトリン (Dimethylfluthrin)、フェンフルトリン (Fenfluthrin)、フェンピリトリン (Fenpirithrin)、フルフェンプロックス (Flufenprox)、ヘプタフルスリン (Heptafuthrin)、メペルフルスリン (Meperfluthrin)、 $\epsilon$ -メトフルトリン (epsilon-Metofluthrin)、モンフルオロトリン (Momfluorothrin)、 $\epsilon$ -モンフルオロトリン (epsilon-Momfluorothrin)、トランス-ペルメトリン (trans-Permethrin)、プロフルトリン (Profluthrin)、プロトリフェンブト (Protrifenbute)、 $\kappa$ -テフルトリン (kappa-Tefluthrin)、テラレトリン (Terallethrin)、テトラメチルフルスリン (Tetramethylfluthrin) ; ビオエタノメトリン (Bioethanomethrin)。

(3B) ナトリウムチャンネルモジュレーター (DDT類)

DDT、メトキシクロル (Methoxychlor)。

[0130] (4) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)競合的モジュレーター

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

スルホキサフロル (Sulfoxaflo) ; フルピラジフロン (Flupyradifurone) ; トリフルメゾピリム (Triflumezopyrim) 。

ニチアジン (Nithiazine) ; ジクロロメゾチアズ (Dicloromezotiaz) 、フルピリミン (Flupyrimin) 。

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)アロステリックモジュレーター

スピネトラム (Spinetoram) 、スピノサド (Spinosad) 。

(6) グルタミン酸作動性塩化物イオン(塩素イオン)チャンネル(GluCl) アロステリックモジュレーター

アバメクチン (Abamectin) 、エマメクチン (Emamectin) 、エマメクチン安息香酸塩 (Emamectin-benzoate) 、レピメクチン (Lepimectin) 、ミルベメクチン (Milbemectin) 。

ドラメクチン (Doramectin) 、エプリノメクチン (Eprinomectin) 、イベルメクチン (Ivermectin) 、モキシデクチン (Moxidectin) 、セラメクチン (Selamectin) 。

[0131] (7) 幼若ホルモン類似剤

ヒドロプレン (Hydroprene) 、キノプレン (Kinoprene) 、メトプレン (Methoprene) ; フェノキシカルブ (Fenoxycarb) ; ピリプロキシフェン (Pyriproxiifen) 。

ジオフェノラン (Diofenolan) 、エポフェノナン (Epofenonane) 、トリプレン (Triprene) 。

(8) その他の非特異的(マルチサイト)阻害剤

臭化メチル (Methyl bromide) 、ハロゲン化アルキル類 (alkyl halides) ; クロルピクリン (Chloropicrin) ; 弗化アルミニウムナトリウム (Sodium aluminum fluoride) 、フッ化スルフリル (Sulfuryl fluoride) ; ホウ砂 (Borax) 、ホウ酸 (Boric acid) 、オクタホウ酸二ナトリウム塩 (Disodium octaborate) 、ホウ酸ナトリウム塩 (Sodium borate) 、メタホウ酸ナトリウム塩 (Sodium metaborate) ; 吐酒石 (Tartar emetic) ; ダゾメット (Dazomet)

)、メタム (Metam)、メタムカリウム塩 (Metam Sodium)、メタムナトリウム塩 (Metam Potassium)。

(9) 弦音器官TRPVチャネルモジュレーター

ピメトロジン (Pymetrozine)、ピリフルキナゾン (Pyriproxyfen) ;  
アフィドピロペン (Afidopyropen)。

(10) ダニ類成長阻害剤

クロフェンテジン (Clofentezine)、ジフロビダジン (Diflovidazin)、  
ヘキシチアゾクス (Hexythiazox) ; エトキサゾール (Etoxazole)。

[0132] (11) 微生物由来昆虫中腸内膜破壊剤

*B. t. subsp. israelensis*, *B. t. subsp. aizawai*, *B. t. subsp. kurstaki*  
、*B. t. subsp. tenebrionis* ; *B. t.* 作物に含まれるタンパク質 (*B. t. crop proteins*) : Cry1  
Ab、Cry1Ac  
、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1  
/Cry35Ab1 ; *Bacillus sphaericus*。

(12) ミトコンドリアATP合成酵素阻害剤

ジアフェンチウロン (Diafenthiuron) ; アゾシクロチン (Azocyclotin)  
、シヘキサチン (Cyhexatin)、酸化フェンブタスズ (Fenbutatin-oxide) ;  
プロパルギット (Propargite) ; テトラジホン (Tetradifon)。

(13) プロトン勾配を攪乱する酸化的リン酸化脱共役剤

クロルフェナピル (Chlorfenapyr)、DNOC (4,6-dinitro-*o*-cresol)  
、スルフルラミド (Sulfluramid)。

ビナパクリル (Binapacryl)、ジノブトン (Dinobuton)、ジノカップ (Dinocap)。

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)チャネルブロッカー

ベンスルタップ (Bensultap)、カルタップ塩酸塩 (Cartap hydrochloride)  
)、チオシクラム (Thiocyclam)、チオスルタップ-ナトリウム塩 (Thiosultap-sodium)。

## [0133] (15) キチン生合成阻害剤、タイプ0

ビストリフルロン (Bistrifluron)、クロルフルアズロン (Chlorfluazuron)、ジフルベンズロン (Diflubenzuron)、フルシクロクスロン (Flucycloxiuron)、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)。

フルアズロン (Fluazuron)。

## (16) キチン生合成阻害剤、タイプ1

ブプロフェジン (Buprofezin)。

## (17) 脱皮阻害剤

シロマジン (Cyromazine)。

## (18) 脱皮ホルモン(エクダイソン)受容体アゴニスト

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

## [0134] (19) オクトパミン受容体アゴニスト

アミトラズ (Amitraz)。

クロルジメホルム (Chlordimeform)。

## (20) ミトコンドリア電子伝達系複合体III阻害剤

ヒドラメチルノン (Hydramethylnon) ; アセキノシル (Acequinocyl) ; フルアクリピリム (Fluacrypyrim) ; ビフェナゼート (Bifenazate)。

## (21) ミトコンドリア電子伝達系複合体I阻害剤(METI)

フェナザキン (Fenazaquin)、フェンピロキシメート (Fenpyroximate)、ピリダベン (Pyridaben)、ピリミジフェン (Pyrimidifen)、テブフェンピラド (Tebufenpyrad)、トルフェンピラド (Tolfenpyrad) ; ロテノン (Rotenone)。

## (22) 電位依存性ナトリウムチャネルブロッカー

インドキサカルブ (Indoxacarb) ; メタフルミゾン (Metaflumizone) 。

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤

スピロジクロフェン (Spirodiclofen) 、スピロメシフェン (Spiromesifen) 、スピロテトラマト (Spirotetramat) 。

スピロピジオン (Spiropidion) 。

(24) ミトコンドリア電子伝達系複合体IV阻害剤

リン化アルミニウム (Al-phosphide) 、リン化カルシウム (Ca-phosphide) 、リン化亜鉛 (Zn-phosphide) 、ホスフィン (Phosphine) ; シアン化カルシウム (Ca-cyanide) シアン化ナトリウム (Na-cyanide) 、シアン化カリウム (K-cyanide) 。

(25) ミトコンドリア電子伝達系複合体II阻害剤

シエノピラフェン (Cyenopyrafen) 、シフルメトフェン (Cyflumetofen) ; ピフルブミド (Pyflubumide) 。

[0135] (28) リアノジン受容体モジュレーター

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) 、シクラニリプロール (Cyclaniliprole) 、フルベンジアミド (Flubendiamide) 。

シハロジアミド (Cyhalodiamide) 、テトラクロラントラニリプロール (Tetrachlorantraniliprole) 、テトラニリプロール (Tetraniliprole) 。

(29) 弦音器官モジュレーター 標的部位未特定

フロニカミド (Flonicamid) 。

(30) GABA作動性塩化物イオン(塩素イオン)チャンネルアロステリックモジュレーター

ブロフラニリド (Broflanilide) 、フルキサメタミド (Fluxametamide) 。

イソシクロセラム (Isocycloseram) ; アフォキシラネル (Afoxolaner) 、フルララネル (Fluralaner) 、ロチラネル (Lotilaner) 、サロラネル (Sarolaner) 。

[0136] (31) その他の殺虫剤、殺ダニ剤

アザジラクチン (Azadirachtin)、ベンゾキシメート (Benzoximate)、ブ  
ロモプロピレート (Bromopropylate)、キノメチオナート (Chinomethionat  
)、ジコホル (Dicofol)、石灰硫黄合剤 (Lime sulfur)、マンコゼブ (Man  
cozeb)、ピリダリル (Pyridalyl)、硫黄 (Sulfur)。

アシノナピル (Acynonapyr)、アミドフルメット (Amidoflumet)、ベンゾ  
メート (Benzomate)、ベンズピリモキサノ (Benzpyrimoxan)、クロルベン  
ジレート (Chlorobenzilate)、ジシクラニル (Dicyclanil)、フェノキサク  
リム (Fenoxacrim)、フェントリファニル (Fentrifanil)、フロメトキン (F  
lometoquin)、フルベンジミン (Flubenzimine)、フルフェンジン (Flufen  
zine)、フルヘキサホン (Fluhexafon)、フルオピラム (Fluopyram)、メタ  
フルミゾン (Metaflumizone)、メトキサジアゾン (Metoxadiazone)、オキ  
サゾスルフィル (Oxazosulfyl)、テトラスル (Tetrasul)、トリアラセン (T  
riarathene)、チクロピラゾフロル (Tyclopyrazoflor)。

[0137] 本発明の有害生物防除剤と混用または併用することができる、駆虫剤の具  
体例を以下に示す。

(a) ベンズイミダゾール系： フェンベンダゾール、アルベンダゾール、  
トリクラベンダゾール、オキシベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェ  
ンダゾール、パーベンダゾール、フルベンダゾール；フェバンテル、ネトビ  
ミン、チオファネート；チアベンダゾール、カンベンダゾール；

(b) サリチルアニリド系： クロサンテル、オキシクロザニド、ラフォキ  
サニド、ニコロサミド；

(c) 置換フェノール系： ニトロキシニル、ニトロスカネイト；

(d) ピリミジン系： ピランテル、モランテル；

(e) イミダゾチアゾール系： レバミソール、テトラミソール；

(f) テトラヒドロピリミジン系： プラジカンテル、エプシプランテル；

(g) その他の駆虫薬： シクロジエン、リアニア、クロルスロン、メトロ  
ニダゾール、デミジトラズ；ピペラジン、ジエチルカルバマジン、ジクロロ  
フェン、モネパンテル、トリベンジミジン、アミダンテル；チアセタルサミ

ド、メラルサミン、アルセナマイド。

[0138] 本発明の有害生物防除剤と混用または併用することができる、殺菌剤の具体例を以下に示す。

(A) 核酸合成代謝の阻害剤

A 1) RNAポリメラーゼI阻害剤

ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルM (benalaxyl-M)、フララキシル (furalaxyl)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルM (metalaxyl-M) ; オキサジキシル (oxadixyl) ; オフラセ (ofurace) 。

A 2) アデノシンデアミナーゼ阻害剤

ブピリメート (bupirimate)、ジメチリモール (dimethirimol)、エチリモール (ethirimol) 。

A 3) DNA/RNA生合成阻害剤

ヒメキサゾール (hymexazole)、オクチリノン (octhilinone) 。

A 4) DNAトポイソメラーゼタイプII阻害剤

オキシリニック酸 (oxolinic acid) 。

[0139] (B) 細胞骨格とモーター蛋白質に作用する剤

B 1) ~ B 3)  $\beta$ -チューブリン重合阻害

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)、エタボキサム (ethaboxam) 。

クロルフェナゾール (chlorfenazole)、デバカルブ (debacarb)、トリクラミド (trichlamide)、ザリラミド (zarilamid) 。

B 4) 細胞分裂 (作用点不明)

ペンシクロン (pencycuron) 。

B 5) スペクトリン様蛋白質の非局在化

フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピモミド (fluopimomide) 。

## B 6) アクチン／ミオシン／フィブリン機能

フェナマクリル (phenamacril)、メトラフェノン (metrafenone)、ピリオフェノン (pyriofenone)。

## [0140] (C) 呼吸阻害剤

## C 1) 複合体I：NADH酸化還元酵素

ジフルメトリム (diflumetorim)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、フェナザキン (fenazaquin)。

## C 2) 複合体II：コハク酸脱水素酵素

ベノダニル (benodanil)、フルトラニル (flutolanil)、メプロニル (meppronil)；イソフェタミド (isofetamid)；フルオピラム (fluopyram)；シクロブトリフルラム (cyclobutrifluram)；フェンフラム (fenfuram)；カルボキシシン (carboxin)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)；チフルザミド (thifluzamide)；ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr)、ビキサフェン (bixafen)、フルインダピル (fluindapyr)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フラメトピル (furametpyr)、インピルフルキサム (inpyrfluxam)、イソピラザム (isopyrazam)、ペンフルフェン (penflufen)、ペンチオピラド (penthiopyrad)、セダキサン (sedaxane)；イソフルシプラム (isoflucypram)；ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)；ボスカリド (boscalid)；ピラジフルミド (pyraziflumid)。

フルメシクロックス (furmecyclox)。

## C 3) 複合体III：チトクローム bc1 (ユビキノール酸化酵素) Qo部位 (cyt b遺伝子)

アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クモキシストロビン (coumoxystrobin)、エノキサストロビン (enoxastrobin)、フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)；マンDESTロビン (mandestrobin)；ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、トリクロピリカルブ (tricyclopyricarb)；クレソキシムメチル (kresoxim-

methyl)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin) ; ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、フェナミンストロビン (fenaminstrobin)、メトミノストロビン (metominostrobin)、オリサストロビン (orysastrobin) ; ファモキサドン (famoxadone) ; フルオキサストロビン (fluoxastrobin) ; フェンアミドン (fenamidone) ; ピリベンカルブ (pyribencarb) ; メチルテトラプロール (metyltetraprole) 。

C 4) 複合体III : ユビキノン還元酵素 Qi部位

シアゾファミド (cyazofamid) ; アミスルブロム (amisulbrom) ; フェンピコキサミド (fenicoxamid)、フロリルピコキサミド (florylpicoxamid)

。

C 5) 酸化リン酸化の脱共役

ビナパクリル (binapacryl)、ジノカップ (dinocap)、メプチルジノカップ (meptyldinocap) ; フルアジナム (fluazinam) 。

C 6) 酸化リン酸化、ATP合成酵素の阻害

酢酸トリフェニルスズ (fentin acetate)、塩化トリフェニルスズ (fentin chloride)

、水酸化トリフェニルスズ (fentin hydroxide) 。

C 7) ATP輸送

シルチオフアム (silthiofam) 。

C 8) 複合体III : ユビキノン還元酵素 (Qo部位、スチグマテリン結合サブサイト)

アメトクトラジン (ametoctradin) 。

[0141] (D) アミノ酸および蛋白質合成の阻害剤

D 1) メチオニン生合成(cgs遺伝子)

シプロジニル (cyprodinil)、メパニピリム (mepanipyrim)、ピリメタニル (pyrimethanil) 。

D 2) 蛋白質合成 (リボソーム 翻訳終了段階)

ブラストサイジンS (blasticidin-S)

D 3)、D 4) 蛋白質合成 (リボソーム 翻訳開始段階)

カスガマイシン (kasugamycin)、カスガマイシン塩酸塩 (kasugamycin hydrochloride)、ストレプトマイシン (streptomycin)。

D 5) 蛋白質合成 (リボソーム ポリペプチド伸長段階)

オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)。

[0142] (E) シグナル伝達阻害剤

E 1) シグナル伝達 (作用機構不明)

キノキシフェン (quinoxifen)、プロキナジド (proquinazid)。

E 2) 浸透圧シグナル伝達におけるMAP/ヒスチジンキナーゼ (os-2、HOG1)

フェンピクロニル (fenpiclonil)、フルジオキシソニル (fludioxonil)。

E 3) 浸透圧シグナル伝達におけるMAP/ヒスチジンキナーゼ (os-1、Daf1)

クロゾリネート (chlozolate)、ジメタクロン (dimethachlone)、イプロジオン (iprodione)、プロシミドン (procymidone)、ビクロゾリン (vinclozolin)。

[0143] (F) 脂質生合成または輸送/細胞膜の構造または機能を阻害する剤

F 2) リン脂質生合成、メチルトランスフェラーゼ

エジフェンホス (edifenphos)、イプロベンホス (iprobenfos)、ピラゾホス (pyrazophos); イソプロチオラン (isoprothiolane)。

F 3) 細胞の過酸化

ビフェニル (biphenyl)、クロロネブ (chloroneb)、ジクロラン (dicloran)、キントゼン (quintozene)、テクナゼン (tecnazene)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl); エトリジアゾール (etridiazole)。

F 4) 細胞膜透過性、脂肪酸

ヨードカルブ (iodocarb)、プロパモカルブ (propamocarb)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、プロチオカルブ (prothiocarb)。

F 8) エルゴステロール結合

ナタマイシン (natamycin)。

## F 9) 脂質恒常性および輸送／貯蔵

オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin)、フルオキサピプロリン (fluo xapiprolin)。

## [0144] (G) 細胞膜のステロール生合成の阻害剤

## G 1) ステロール生合成のC14位のデメチラーゼ (erg11/cyp51)

トリホリン (triforine) ; ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリソキサゾール (pyrisoxazole) ; フェナリモル (fenarimol)、ヌアリモール (nuar imol) ; イマザリル (imazalil)、オキスポコナゾール (oxpoconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、プロクロラズ (prochloraz)、トリフルミゾール (triflumizole) ; アザコナゾール (azaconazole)、ビテルタノール (bitertanol)、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 (diniconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルトリアホール (flutriafol)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イプコナゾール (ipconazole)、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole)、メトコナゾール (metconazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ペンコナゾール (penconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、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)、トリチコナゾール (triticonazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)。

フルコナゾール (furconazole)、フルコナゾールーシス (furconazole-cis)、ジニコナゾールM (diniconazole-M)。

G 2) ステロール生合成における $\Delta 14$ 還元酵素および $\Delta 8 \rightarrow \Delta 7$ -イソメラーゼ (erg24、erg2)

アルジモルフ (aldimorph)、ドデモルフ (dodemorph)、ドデモルフ酢酸

塩 (dodemorphacetate)、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) 。

ブチオベート (buthiobate) 。

G 3) ステロール生合成系のC4位脱メチル化における3-ケト還元酵素 (erg27)

フェンヘキサミド (fenhexamid) ; フェンピラザミン (fenpyrazamine) 。

G 4) ステロール生合成系のスクワレンエポキシダーゼ (erg1)

ピリブチカルブ (pyributicarb) ; ナフチフィン (naftifine)、テルビナフィン (terbinafine) 。

[0145] (H) 細胞壁生合成の阻害剤

H 4) キチン合成酵素

ポリオキシシン (polyoxin) 。

ポリオクソリム (polyoxorim) 。

H 5) セルロース合成酵素

ジメトモルフ (dimethomorph)、フルモルフ (flumorph)、ピリモルフ (pyrimorph) ; ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、バリフェナレート (valifenalate) ; マンジプロパミド (mandipropamid) 。

[0146] (I) 細胞壁のメラニン合成の阻害剤

I 1) メラニン生合成の還元酵素

フサライド (fthalide) ; ピロキロン (pyroquilon) ; トリシクラゾール (tricyclazole) 。

I 2) メラニン生合成の脱水酵素

カルプロパミド (carpropamid) ; ジクロシメット (diclocymet) ; フェノキサニル (fenoxanil) 。

I 3) メラニン生合成のポリケタイド合成酵素

トルプロカルブ (tolprocarb)。

[0147] (P) 宿主植物の抵抗性を誘導する剤

P 1 ~ P 3) サリチル酸シグナル伝達

アシベンゾラルSメチル (acibenzolar-S-methyl) ; プロベナゾール (prob enazole) ; チアジニル (tiadinil) 、 イソチアニル (isotianil) 。

P 4) 多糖類エリシターラミナリン (laminarin) 。

P 5) アントラキノンエリシター

オオイタドリ抽出液 (extract from *Reynoutria sachalinensis*) 。

P 6) 微生物エリシター

バチルス・マイコイデス分離株J (*Bacillus mycoides* isolate J) ; サツカロミセス・セレピシア LAS117 株の細胞壁 (cell walls of *Saccharomyces cerevisiae* strain LAS117) 。

P 7) ホスホナート

ホセチル (fosetyl-Al) ; 亜リン酸および塩 (phosphorous acid and salt s) ; ホセチルカルシウム (fosetyl-K) 、 ホセチルナトリウム (fosetyl-N a) 。

P 8) サリチル酸関連

ジクロベンチアゾクス (dichlobentiazox)

[0148] (U) 作用機構不明の剤

シモキサニル (cymoxanil) ; テクロフタラム (tecloftalam) ; トリアゾキシド (triazoxide) ; フルスルファミド (flusulfamide) ; ジクロメジン (diclomezine) ; シフルフェナミド (cyflufenamid) ; ドジン (dodine) 、 ドジン遊離塩基 (dodine free base) ; フルチアニル (flutianil) ; フェリムゾン (ferimzone) ; テブフロキン (tebufloquin) ; ピカルブトラゾクス (picarbutrazox) ; バリダマイシン (validamycin) 。

ベトキサジン (bethoxazin) 、 シプロフラム (cyprofuram) 、 フルメトベル (flumetover) 、 ニトロタルイソプロピル (nitrothal-isopropyl) 、 プロパミジン (propamidine) 。

イプフルフェノキン (ipflufenquin)、ピリダクロメチル (pyridachlome  
tyl)、ピラプロポイン (pyrapropoyne)、アミノピリフェン (aminopyrifen  
)、イプフェントリフルコナゾール (ipfentrifluconazole)、キノフメリ  
ン (quinofumelin)、ジピメチトロン (dipymetitrone)。

[0149] (M) 多作用点接触活性を示す剤

銅 (種々の塩) (copper(different salts))、塩基性硫酸銅 (basic copp  
er sulfat)、ボルドー液 (Bordeaux mixture)、水酸化銅 (copper hydrox  
ide)、銅ナフタレート (copper naphthenate)、オキシ塩化銅 (copper oxy  
chloride)、硫酸銅 (copper sulfat)、酸化銅 (cuprous oxide)、オキシ  
ン銅 (oxine-copper) ; 硫黄 (sulphur)、石灰硫黄合剤 (Lime sulfur) ;  
アンバム (amobam)、ファーバム (ferbam)、マンゼブ (mancozeb)、マン  
ネブ (maneb)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チウラム  
(thiram)、チアゾール亜鉛 (zinc thiazole)、ジネブ (zineb)、ジラム  
(ziram) ; キャプタン (captan)、カプタホル (captafol)、ホルペット  
(folpet) ; クロロタロニル (chlorothalonil) ; ジクロフルアニド (dichl  
ofluanid)、トリルフルアニド (tolylfluanid) ; グアザチン (guazatine)  
、グアザチン酢酸塩 (guazatine acetates)、イミノクタジン (iminoc  
tadine)、イミノクタジン酢酸塩 (iminoc  
tadine triacetate)、イミノクタジン  
アルベシル酸塩 (iminoc  
tadine trialbesilate) ; アニラジン (anilazine) ;  
ジチアノン (dithianon) ; キノメチオナート (chinomethionat) ; フルオル  
イミド (fluoroimide) ; メタスルホカルブ (methasulfocarb) 。

ダゾメット (dazomet)、クフラネブ (cufraneb)、マンカッパー (mancop  
per)、ポリカーバメート (polycarbamate) 。

[0150] (BMO1) 複数の作用機構を有する生物農薬/生物由来の農薬

ハウチワマメ苗木の子葉からの抽出物 (extract from the cotyledons of  
lupine plantlets) ; Swinglea glutinosa からの抽出物 (extract from Swi  
nglea glutinosa) ; ゴセイカユプテ (ティーツリー) の抽出物 (extract from  
Melaleuca alternifolia (tea treeoil)) ; 植物油類 (混合物) (plant oi

ls (mixtures)) :オイゲノール (eugenol) 、ゲラニオール (geraniol) 、チモール (thymol) 。

[0151] (BMO2) 複数の作用機構を有する生物農薬／生物由来の農薬

トリコデルマ・アトロビリデ I-1237株 (Trichoderma atroviride strain I-1237) 、トリコデルマ・アトロビリデ LU132株 (Trichoderma atroviride strain LU132) 、トリコデルマ・アトロビリデ SC1株 (Trichoderma atroviride strain SC1) 、トリコデルマ・アトロビリデ SKT-1株 (Trichoderma atroviride strain SKT-1) 、トリコデルマ・アトロビリデ 77B株 (Trichoderma atroviride strain 77B) ;

トリコデルマ・アスペレルム T34 株 (Trichoderma asperellum strain T34) 、トリコデルマ・アスペレルムkd株 (Trichoderma asperellum strain kd) ;

トリコデルマ・ハルチアナム T-22 株 (Trichoderma harzianum strain T-22) ;

トリコデルマ・ビレンスG-41株 (Trichoderma virens strain G-41) ;  
グリオクラディウム・カテナラタム J1446 株 (Gliocladium catenulatum strain J1446) ;

クロノスタキス・ロゼアCR-7株 (Clonostachys rosea strain CR-7) ;

コニオチリウム・ミニタンスCON/M/91-08株 (Coniothyrium minitans strain CON/M/91-08) ;

タラロマイセス・フラバス SAY-Y-94-01 株 (Talaromyces flavus strain SAY-Y-94-01) ;

サッカロマイセス・セレビスエLAS02株 (Saccharomyces cerevisiae strain LAS02) ;

バチルス・アミロリクエファシエンズQST713 株 (Bacillus amyloliquefaciens strain QST713) 、バチルス・アミロリクエファシエンズFZB24 株 (Bacillus amyloliquefaciens strain FZB24) 、バチルス・アミロリクエファシエンズMBI600 株 (Bacillus amyloliquefaciens strain MBI600) 、バチルス・

アミロリクエファシエンズD747 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain D747)、バチルス・アミロリクエファシエンズF727 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain F727)、バチルス・アミロリクエファシエンズAT-332 株 (*Bacillus amyloliquefaciens* strain AT-332) ;

バチルス・ズブチリスAFS032321 株 (*Bacillus subtilis* strain AFS032321)、バチルス・ズブチリスY1336 株 (*Bacillus subtilis* strain Y1336)、バチルス・ズブチリスHAI-0404 株 (*Bacillus subtilis* strain HAI-0404) ;

シュードモナス・クロロファフィス A F S 009 株 (*Pseudomonas chlororaphis* strain AFS009) ;

ストレプトミセス・グリセオビリデス K61 株 (*Streptomyces griseoviridis* strain K61) ;

ストレプトミセス・リディクス W Y E C 108株 (*Streptomyces lydicus* strain WYEC108) 。

(N C) 未分類の成分

鉱物油 (mineral oils)、有機油 (organic oils)、無機塩類 (inorganic salts)、天然物起源 (material of biological origin) 。

[0152] 本発明の有害生物防除剤と混用または併用することができる、植物調節剤の具体例を以下に示す。

アブシジン酸、カイネチン、ベンジルアミノプリン、1, 3-ジフェニルウレア、ホルクロルフェヌロン、チジアズロン、クロルフェヌロン、ジヒドロゼアチン、ジベレリンA、ジベレリンA4、ジベレリンA7、ジベレリンA3、1-メチルシクロプロパン、N-アセチルアミノエトキシビニルグリシン (別名: アビグリシン)、アミノオキシ酢酸、硝酸銀、塩化コバルト、IAA、4-CPA、クロプロップ、2, 4-D、MCPB、インドール-3-酪酸、ジクロルプロップ、フェノチオール、1-ナフチルアセトアミド、エチクロゼート、クロキシホナック、マレイン酸ヒドラジド、2, 3, 5-トリヨード安息香酸、サリチル酸、サリチル酸メチル、(-)-ジャスモン酸、ジャスモン酸メチル、(+)-ストリゴール、(+)-デオキシストリゴ

ール、 (+) -オロバンコール、 (+) -ソルゴラクトン、 4-オキソ-4-(2-フェニルエチル) アミノ酪酸；エテホン、 クロルメコート、 メピコートクロリド、 ベンジルアデニン、 5-アミノレブリン酸。

[0153] 〔外部寄生虫防除剤〕

本発明の外部寄生虫防除剤は、本発明化合物およびその塩からなる群から選ばれる少なくともひとつを有効成分として含有するものである。本発明の外部寄生虫防除剤に含まれる本発明化合物の量は外部寄生虫の防除効果を示す限りにおいて特に制限されない。

[0154] 本発明の外部寄生虫防除剤の処理の対象となる宿主動物としては、ヒト、家畜哺乳動物（例えば、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギなど）、実験動物（例えば、マウス、ラット、スナネズミなど）、愛玩動物（例えば、ハムスター、モルモット、イヌ、ネコ、ウマ、リス、ウサギ、フェレットなど）、野生および動物園の哺乳動物（サル、キツネ、シカ、バッファローなど）、家禽（シチメンチョウ、アヒル、ニワトリ、ウズラ、ガチョウなど）、愛玩鳥（ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリアなど）などの温血動物； または、サケ、マス、ニシキゴイなどの魚類を挙げることができる。その他にも、ミツバチ、クワガタムシ、カブトムシを挙げることができる。

[0155] 本発明の外部寄生虫防除剤は、公知の獣医学的手法（局所、経口、非経口または皮下投与）で施用することができる。その方法として、錠剤、カプセル、飼料混入などにより動物に経口的に投与する方法； 浸漬液、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など）などにより動物に投与する方法； 油性または水性液剤を噴霧、ポアオン、スポットオンなどにより局所的に投与する方法； 樹脂に外部寄生虫防除剤を練り込み、前記混練物を首輪、耳札などの適当な形状に成形し、それを動物に装着し局所的に投与する方法； などを挙げることができる。

[0156] 外部寄生虫は、宿主動物、特に温血動物の中および上に寄生する。詳しくは、宿主動物の背、脇下、下腹部、内股部などに寄生して動物から血液や

フケなどの栄養源を得て生息する。外部寄生虫としては、ダニ類、シラミ類、ノミ類、カ、サシバエ、ニクバエなどを挙げることができる。本発明の外部寄生虫防除剤によって防除可能な外部寄生虫の具体例を以下に示す。

[0157] (1) ダニ類 (Acarı)

ワクモ科 (Dermanyssidae) のダニ、オオサシダニ科 (Macronyssidae) のダニ、トゲダニ科 (Laelapidae) のダニ、ヘギダニ科 (Varroidae) のダニ、ヒメダニ科 (Argasidae) のダニ、マダニ科 (Ixodidae) のダニ、キュウセンヒゼンダニ科 (Psoroptidae) のダニ、ヒゼンダニ科 (Sarcoptidae) のダニ、トリヒゼンダニ科 (Knemidokoptidae) のダニ、ニキビダニ科 (Demodixidae) のダニ、ツツガムシ科 (Trombiculidae) のダニ、クワガタナカセ類等の昆虫寄生性のダニ。

(2) シラミ目 (Phthiraptera)

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

(3) ノミ目 (Siphonaptera)

ヒトノミ科 (Pulicidae) のノミ、例えば、イヌノミ属種 (Ctenocephalides spp.) の、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis) ; スナノミ科 (Tungidae) のノミ、ナガノミ科 (Ceratophyllidae) のノミ、ホソノミ科 (Leptopsyllidae) のノミ。

(4) カメムシ目 (Hemiptera)。

(5) ハエ目 (Diptera) の害虫カ科 (Culicidae) のカ、ブユ科 (Simuliidae) のブユ、

ヌカカ科 (Ceratopogonidae) のヌカカ、アブ科 (Tabanidae) のアブ、イエバエ科 (Muscidae) のハエ、ツエツエバエ科 (Glossinidae) のシェシェバエ、ニクバエ科のニクバエ、シラミバエ科 (Hippoboscidae) のハエ、クロバエ科 (Calliphoridae) のハエ、ヒツジバエ科 (Oestridae) のハエ。

## [0158] [内部寄生虫防除若しくは駆除剤]

本発明の内部寄生虫防除若しくは駆除剤は、本発明化合物およびその塩からなる群から選ばれる少なくともひとつを有効成分として含有するものである。本発明の内部寄生虫防除若しくは駆除剤に含まれる本発明化合物の量は内部寄生虫の防除効果を示す限りにおいて特に制限されない。

[0159] 本発明の内部寄生虫防除若しくは駆除剤の対象となる寄生虫は、宿主動物、特に温血動物や魚類の中に寄生する（内部寄生虫）。本発明の内部寄生虫防除若しくは駆除剤が有効な宿主動物としては、ヒト、家畜哺乳動物（例えば、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギなど）、実験動物（例えば、マウス、ラット、スナネズミなど）、愛玩動物（例えば、ハムスター、モルモット、イヌ、ネコ、ウマ、リス、ウサギ、フェレットなど）、野生および動物園の哺乳動物（サル、キツネ、シカ、バッファローなど）、家禽（シチメンチョウ、アヒル、ニワトリ、ウズラ、ガチョウなど）、愛玩鳥（ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリアなど）などの温血動物；または、サケ、マス、ニシキゴイなどの魚類を挙げることができる。寄生虫を防除および駆除することで、寄生虫が媒介する寄生虫疾患を予防または治療することができる。

[0160] 防除または駆除対象の寄生虫としては、以下のものを挙げることができる。

(1) 腎虫目 (Dioctophymatida) の線虫類

(a) 腎虫科 (Dioctophymatidae) の腎虫、例えば、ディオクトフィーマ属種 (Dioctophyma spp.) の、腎虫 (Dioctophyma renale) ；

(b) ソブリフィメ科 (Soboliphymatidae) の腎虫、例えば、ソブリフィメ属種 (Soboliphyme spp.) の、ソブリフィメ・アベイ (Soboliphyme abei)、ソブリフィメ・ブツリニ (Soboliphyme baturini) 。

[0161] (2) 毛頭虫目 (Trichocephalida) の線虫類

(a) 旋毛虫科 (Trichinellidae) の旋毛虫、例えば、旋毛虫属種 (Trichinella spp.) の、旋毛虫 (Trichinella spiralis) ；

(b) 鞭虫科 (Trichuridae) の鞭虫、例えば、キャピラリア属種 (Capillaria spp.) の、有環毛細線虫 (Capillaria annulata)、捻転毛細線虫 (Capillaria contorta)、肝毛細線虫 (Capillaria hepatica)、穿通毛細線虫 (Capillaria perforans)、キャピラリア・プリカ (Capillaria plica)、豚毛細線虫 (Capillaria suis) ; トリキュリス属種 (Trichuris spp.) の、犬鞭虫 (Trichuris vulpis)、牛鞭虫 (Trichuris discolor)、羊鞭虫 (Trichuris ovis)、トリキュリス・スクリジャビニー (Trichuris skrjabini)、豚鞭虫 (Trichuris suis) 。

[0162] (3) 桿線虫目 (Rhabditida) の線虫類

糞線虫科 (Strongyloididae) の糞線虫、例えば、糞線虫属種 (Strongyloides spp.) の、乳頭糞線虫 (Strongyloides papillosus)、猫糞線虫 (Strongyloides planiceps)、豚糞線虫 (Strongyloides ransomi)、豚糞線虫 (Strongyloides suis)、糞線虫 (Strongyloides stercoralis)、アメリカ猫糞線虫 (Strongyloides tumefaciens)、ネズミ糞線虫 (Strongyloides ratti) 。

[0163] (4) 円虫目 (Strongylida) の線虫類

鉤虫科 (Ancylostomatidae) の鉤虫、例えば、鉤虫属種 (Ancylostoma spp.) の、ブラジル鉤虫 (Ancylostoma braziliense)、犬鉤虫 (Ancylostoma caninum)、ズビニ鉤虫 (Ancylostoma duodenale)、ネコ鉤虫 (Ancylostoma tubaeforme) ; ウンシナリア属種 (Uncinaria stenocephala) の、狭頭鉤虫 (Uncinaria stenocephala) ; ブノストマム属種 (Bunostomum spp.) の、牛鉤虫 (Bunostomum phlebotomum)、羊鉤虫 (Bunostomum trigonocephalum) 。

[0164] (5) 円虫目 (Strongylida) の線虫類

(a) 住血線虫科 (Angiostrongylidae) の線虫、例えば、ネコ肺虫属種 (Aelurostrongylus spp.) の、猫肺虫 (Aelurostrongylus abstrusus) ; 住血線虫属種 (Angiostrongylus spp.) の、住血線虫 (Angiostrongylus vasorum)、広東住血線虫 (Angiostrongylus cantonesis) ;

(b) クレノゾーマ科 (Crenosomatidae) の線虫、例えば、クレノゾーマ属種 (Crenosoma spp.) の、肺毛細線虫 (Crenosoma aerophila)、キツネ肺虫 (Crenosoma vulpis) ;

(c) フィラロイデス科 (Filaroididae) の線虫、例えば、フィラロイデス属種 (Filaroides spp.) の、犬肺虫 (Filaroides hirthi)、フィラロイデス・オスレリ (Filaroides osleri) ;

(d) 肺虫科 (Metastrongylidae) の肺虫、例えば、豚肺虫属種 (Metastrongylus spp.) の、豚肺虫 (Metastrongylus apri)、メタストロンギルス・アシムメトリクス (Metastrongylus asymmetricus)、メタストロンギルス・プデントテクタス (Metastrongylus pudendotectus)、メタストロンギルス・サルミィ (Metastrongylus salmi) ;

(e) 開嘴虫科 (Syngamidae) の開嘴虫、例えば、シアトストーマ属種 (Cyathostoma spp.) の、水鳥肺虫 (Cyathostoma bronchialis) ; シンガムス属種 (Syngamus spp.) の、スクリジャビン開嘴虫 (Syngamus skrjabinomorpha)、鶏開嘴虫 (Syngamus trachea) 。

[0165] (6) 円虫目 (Strongylida) の線虫類

(a) モリネウス科 (Molineidae) の線虫、例えば、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.) の、細頸毛円虫 (Nematodirus filicollis)、ネマトジルス・スパティガー (Nematodirus spathiger) ;

(b) ディクチオカウルス科 (Dictyocaulidae) の線虫、例えば、ディクチオカウルス属種 (Dictyocaulus spp.) の、糸状肺虫 (Dictyocaulus filaria)、牛肺虫 (Dictyocaulus viviparus) ;

(c) 捻転胃虫科 (Haemonchidae) の線虫、例えば、ヘモンクス属種 (Haemonchus spp.) の、捻転胃虫 (Haemonchus contortus) ; メキストシリウス属種 (Mecistocirrus spp.) の、牛捻転胃虫 (Mecistocirrus digitatus) ;

(d) 捻転胃虫科 (Haemonchidae) の線虫、例えば、胃虫属種 (Ostertagia spp.) の、オステルターグ胃虫 (Ostertagia ostertagi) ;

(e) ヘリグモネラ科 (Heligmonellidae) の線虫、例えば、ニッポストロ

ンジルス属種 (*Nippostrongylus* spp.) の、ネズミ円虫 (*Nippostrongylus braziliensis*) ;

(f) 毛様線虫科 (*Trichostrongylidae*) の線虫、例えば、毛様線虫属種 (*Trichostrongylus* spp.) の、皺胃毛様線虫 (*Trichostrongylus axei*)、蛇状毛様線虫 (*Trichostrongylus colubriformis*)、毛様線虫科 (*Trichostrongylus tenuis*) ; ヒオストロンギルス属種 (*Hyostromylus* spp.) の、紅色毛様線虫 (*Hyostromylus rubidus*) ; オベリスコイデス属種 (*Obeliscoides* spp.) の、オベリスコイデス・クニクリ (*Obeliscoides cuniculi*) 。

[0166] (7) 円虫目 (*Strongylida*) の線虫類

(a) シャベルティア科 (*Chabertiidae*) の線虫、例えば、シャベルティア属種 (*Chabertia* spp.) の、羊縮小線虫 (*Chabertia ovina*) ; 腸結節虫属種 (*Oesophagostomum* spp.) の、腸結節虫 (豚) (*Oesophagostomum brevicaudatum*)、コロンビア腸結節虫 (*Oesophagostomum columbianum*)、豚腸結節虫 (*Oesophagostomum dentatum*)、腸結節虫 (豚) (*Oesophagostomum georgianum*)、腸結節虫 (*Oesophagostomum maplestonei*)、腸結節虫 (豚) (*Oesophagostomum quadrispinulatum*)、牛腸結節虫 (*Oesophagostomum radiatum*)、山羊腸結節虫 (*Oesophagostomum venulosum*)、腸結節虫 (イノシシ) (*Oesophagostomum watanabei*) ;

(b) 豚腎虫科 (*Stephanuridae*) の線虫、例えば、ステファヌラス属種 (*Stephanurus* spp.) の、豚腎虫 (*Stephanurus dentatus*) ;

(c) 円虫科 (*Strongylidae*) の線虫、例えば、円虫属種 (*Strongylus* spp.) の、ロバ円虫 (*Strongylus asini*)、無歯円虫 (*Strongylus edentatus*)、馬円虫 (*Strongylus equinus*)、普通円虫 (*Strongylus vulgaris*) 。

[0167] (8) 蟯虫目 (*Oxyurida*) の線虫類

蟯虫科 (*Oxyuridae*) の線虫、例えば、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.) の、チンパンジー蟯虫 (*Enterobius anthropopithecii*)、蟯虫 (*Enterobius vermicularis*) ; オキシルス属 (*Oxyuris* spp.) の、馬蟯虫 (*Oxyuris equi*) ; パサルルス属種 (*Passalurus* spp.) の、ウサギ蟯虫 (*Passalurus a*

mbiguus)。

[0168] (9) 回虫目 (Ascaridida) の線虫類

(a) ニワトリ回虫科 (Ascaridiidae) の線虫、例えば、ニワトリ回虫属種 (Ascaridia

spp.) の、ニワトリ回虫 (*Ascaridia galli*) ;

(b) 盲腸虫科 (Heterakidae) の線虫、例えば、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.) の、ヘテラキス・ベラムポリア (*Heterakis beramporia*)、ヘテラキス・ブレビスピクルム (*Heterakis brevispiculum*)、鶏盲腸虫 (*Heterakis gallinarum*)、ヘテラキス・プシーラ (*Heterakis pusilla*)、ヘテラキス・プトオーストラリス (*Heterakis putaustralis*) ;

(c) アニサキス科 (Anisakidae) の線虫、例えば、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.) の、アニサキス線虫 (*Anisakis simplex*) ;

(d) 回虫科 (Ascarididae) の線虫、例えば、回虫属種 (*Ascaris* spp.) の、ヒト回虫 (*Ascaris lumbricoides*)、豚回虫 (*Ascaris suum*) ; パラスカリア属種 (*Parascaris* spp.) の、馬回虫 (*Parascaris equorum*) ;

(e) トキソカーラ科 (Toxocaridae) の線虫、例えば、トキソカーラ属種 (*Toxocara* spp.) の、犬回虫 (*Toxocara canis*)、犬小回虫 (*Toxocara leonina*)、豚回虫 (*Toxocarasuum*)、牛回虫 (*Toxocara vitulorum*)、猫回虫 (*Toxocara cati*)。

[0169] (10) 旋尾線虫目 (Spirurida) の線虫類

(a) オンコセルカ科 (Onchocercidae) の線虫、例えば、ブルギア属種 (*Brugia* spp.) の、マレー糸状虫 (*Brugia malayi*)、ブルギア・パハンギ (*Brugia pahangi*)、ブルギア・パティ (*Brugia patei*) ; ディペタロネーマ属種 (*Dipetalonema* spp.) の、ディペタロネーマ・リコンディトゥム (*Dipetalonema reconditum*) ; イヌ糸状虫属種 (*Dirofilaria* spp.) の、イヌ糸状虫 (*Dirofilaria immitis*) ; フィラリア属種 (*Filaria* spp.) の、フィラリア・オクリ (*Filaria oculi*) ; オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.) の、頸部糸状虫 (*Onchocerca cervicalis*)、ギブソン糸状虫 (*Onchocerca gibso*

ni)、咽頭糸状虫 (*Onchocerca gutturosa*) ;

(b) セタリア科 (*Setariidae*) の線虫、例えば、セタリア属種 (*Setaria* spp.) の、指状糸状虫 (*Setaria digitata*)、馬糸条虫 (*Setaria equina*)、唇乳頭糸状虫 (*Setarialabiatopapillosa*)、マーシャル糸状虫 (*Setaria marshalli*) ; ブケレリア属種 (*Wuchereria* spp.) の、バンクcroft糸状虫 (*Wuchereria bancrofti*) ;

(c) 糸状虫科 (*Filariidae*) の線虫、例えば、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.) の、多乳頭糸状虫 (*Parafilaria multipapillosa*) ; ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.) の、ステファノフィラリア・アッサムエンシス (*Stephanofilaria assamensis*)、ステファノフィラリア・デドエシー (*Stephanofilaria dedoesi*)、ステファノフィラリア・カエリー (*Stephanofilaria kaeli*)、沖縄糸状虫 (*Stephanofilaria okinawaensis*)、ステファノフィラリア・スティレシー (*Stephanofilaria stilesi*)。

[0170] (11) 旋尾線虫目 (*Spirurida*) の線虫類

(a) 顎口虫科 (*Gnathostomatidae*) の線虫、例えば、顎口虫属種 (*Gnathostoma* spp.) の、顎口虫 (*Gnathostoma doloresi*)、有棘顎口虫 (*Gnathostoma spinigerum*) ;

(b) ハブロンーマ科 (*Habronematidae*) の線虫、例えば、ハブロンーマ属種 (*Habronema* spp.) の、小口胃虫 (*Habronema majus*)、小口胃虫 (*Habronema microstoma*)、蠅馬胃虫 (*Habronema muscae*) ; ドラスキア属種 (*Draschia* spp.) の、大口馬胃虫 (*Draschia megastoma*) ;

(c) フィザロプテラ科 (*Physalopteridae*) の線虫、例えば、フィザロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.) の、犬胃虫 (*Physaloptera canis*)、キツネ胃虫 (*Physaloptera cestacillata*)、フィザロプテラ・エルドシオーナ (*Physaloptera erdocyona*)、フィザロプテラ・フェリディス (*Physaloptera felidis*)、エジプト猫胃虫 (*Physaloptera gemina*)、フィザロプテラ・パピロラディラータ (*Physaloptera papilloradiata*)、猫胃虫 (*Physaloptera praeputialis*)、フィザロプテラ・シュードプラエルティアリス (*Physaloptera*

pseudopraerutialis)、ラーラ胃虫 (Physaloptera rara)、フィサロプテラ・シビリカ (Physaloptera sibirica)、フィサロプテラ・ブルピニウス (Physaloptera vulpineus) ;

(d) ゴンギロネマ科 (Gongylonematidae) の線虫、例えば、ゴンギロネマ属種 (Gongylonema spp.) の、美麗食道虫 (Gongylonema pulchrum) ;

(e) スピロセルカ科 (Spirocercidae) の線虫、例えば、アスカロプス属種 (Ascaropsspp.) の、類円豚胃虫 (Ascarops strongylina) ;

(f) テラジア科 (Thelaziidae) の線虫、例えば、テラジア属種 (Thelazia spp.) の、東洋眼虫 (Thelazia callipaeda)、テラジア・グローサ (Thelazia gulosa)、涙眼虫 (Thelazia lacrymalis)、ロデシア眼虫 (Thelazia rhodesi)、スクリヤービン眼虫 (Thelazia skrjabini) 。

[0171] [その他の有害生物についての防除剤]

本発明化合物は、その他にも、毒針や毒液を持ち、人獣に被害を加える害虫、各種の病原体・病原菌を媒介する害虫、人に不快感を与える害虫 (有毒害虫・衛生害虫・不快害虫など) の防除効果に優れている。

[0172] 以下に、その具体例を示す。

(1) ハチ目 (Hymenoptera) の害虫

ミフシババチ科 (Argidae) のハチ、タマバチ科 (Cynipidae) のハチ、マツハバチ科 (Diprionidae) のハチ、アリ科 (Formicidae) のアリ、アリバチ科 (Mutillidae) のハチ、スズメバチ科 (Vespidae) のハチ。

[0173] (2) その他の害虫

ゴキブリ類 (Blattodea)、シロアリ類 (termite)、クモ類 (Araneae)、ムカデ類 (centipede)、ヤスデ類 (millipede)、甲殻類 (crustacea)、南京虫 (Cimex lectularius) 。

[0174] [製剤処方]

本発明の有害生物防除剤、殺虫若しくは殺ダニ剤、外部寄生虫防除剤、または内部寄生虫防除若しくは駆除剤の製剤処方を若干示すが、添加物および添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化さ

せることが可能である。製剤処方中の「部」は「重量部」を示し、「%」は「重量%」を示す。

以下に農園芸用および水稻用の製剤処方を示す。

[0175] (製剤1：水和剤)

本発明化合物40部、珪藻土53部、高級アルコール硫酸エステル4部、およびアルキルナフタレンスルホン酸塩3部を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分40%の水和剤を得る。

[0176] (製剤2：乳剤)

本発明化合物30部、キシレン33部、ジメチルホルムアミド30部、およびポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル7部を混合溶解して、有効成分30%の乳剤を得る。

[0177] (製剤3：粒剤)

本発明化合物5部、タルク40部、クレー38部、ベントナイト10部、およびアルキル硫酸ソーダ7部を均一に混合して微細に粉碎後、直径0.5～1.0mmの粒状に造粒して有効成分5%の粒剤を得る。

[0178] (製剤4：粒剤)

本発明化合物5部、クレー73部、ベントナイト20部、ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩1部、およびリン酸カリウム1部をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分5%の粒剤を得る。

[0179] (製剤5：懸濁剤)

本発明化合物10部、ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル4部、ポリカルボン酸ナトリウム塩2部、グリセリン10部、キサントガム0.2部、および水73.8部を混合し、粒度が3ミクロン以下になるまで湿式粉碎し、有効成分10%の懸濁剤を得る。

[0180] 以下に外部寄生虫防除剤、または内部寄生虫防除もしくは駆除剤の製剤処方を示す。

[0181] (製剤6：顆粒剤)

本発明化合物5部を有機溶媒中で溶解させて溶液を得、該溶液をカオリン94部およびホワイトカーボン1部の上に噴霧し、次いで溶媒を減圧下で蒸発させる。この種の顆粒は動物の餌と混合できる。

[0182] (製剤7：注入剤)

本発明化合物0.1～1部とラッカセイ油99～99.9部を均一に混合し、次いで滅菌フィルターによりろ過滅菌する。

[0183] (製剤8：ポアオン剤)

本発明化合物5部、ミリスチン酸エステル10部、およびイソプロパノール85部を均一に混合してポアオン剤を得る。

[0184] (製剤9：スポットオン剤)

本発明化合物10～15部、パルミチン酸エステル10部、およびイソプロパノール75～80部を均一に混合してスポットオン剤を得る。

[0185] (製剤10：スプレー剤)

本発明化合物1部、プロピレングリコール10部、およびイソプロパノール89部を均一に混合してスプレー剤を得る。

[0186] 次に、実施例を示し、本発明をより具体的に説明する。ただし、本発明は以下の実施例によって何ら制限されるものではない。

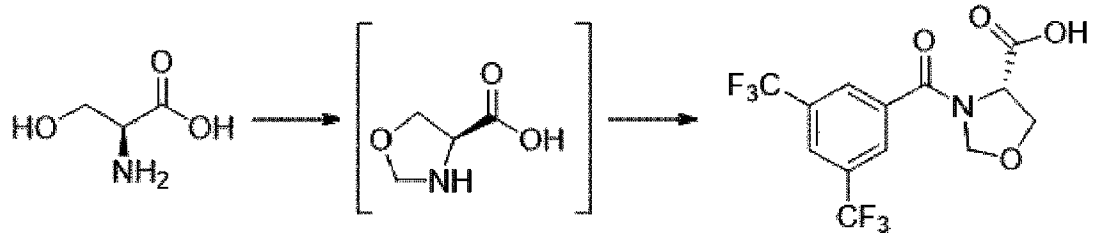
[0187] (実施例1)

以下に示す工程によって、(R)-6-(5-[3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-イル]-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ニコチノニトリル(英名：(R)-6-(5-[3-{3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl}oxazolidin-4-yl]-1H-1,2,4-triazol-1-yl)nicotinonitrile)を製造した。

[0188] (工程1：L-セリンから(S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボン酸(英名：(S)-3-{3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl}oxazolidine-4-carboxylic acid)への転化)

[0189]

[化15]

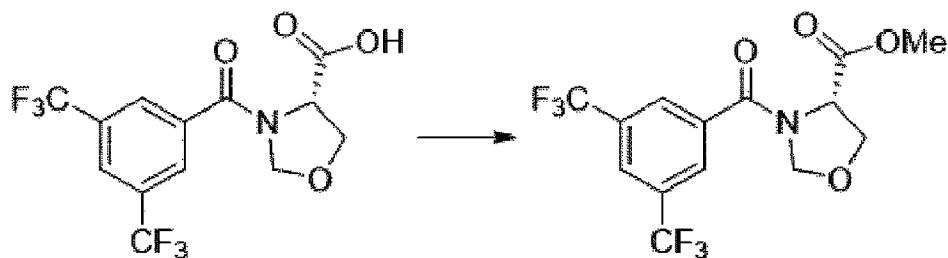


[0190] L-セリン 3.0 g (28.5 mmol) を 2 M 水酸化ナトリウム水溶液 14 ml に溶解させ、これに氷冷下で 37% ホルマリン溶液 4.2 ml を加え、7 時間攪拌した。その後、1 M 塩酸 7.2 ml を加え、(S)-オキサゾリジン-4-カルボン酸 (英名: (S)-oxazolidine-4-carboxylic acid) を含む水溶液を得た。

3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド 2.76 g をテトラヒドロフラン 10 ml に加えて溶液を得、これを氷冷した (S)-オキサゾリジン-4-カルボン酸を含む水溶液に攪拌しながら滴下した。得られた液に飽和炭酸ナトリウム水溶液を加えて pH 8 に調整し、室温で一晩攪拌した。その後、それに 1 M 塩酸を加えて pH 4 に調整した。それに酢酸エチルを加えて抽出処理を施した。得られた有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、次いで溶媒を減圧下で留去して、(S)-3-{{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボン酸の粗生成物 2.98 g を得た。

[0191] (工程 2 : メチル (S)-3-{{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボキシレート (英名: methyl (S)-3-{{3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl}oxazolidine-4-carboxylate) への転化)

[0192] [化16]

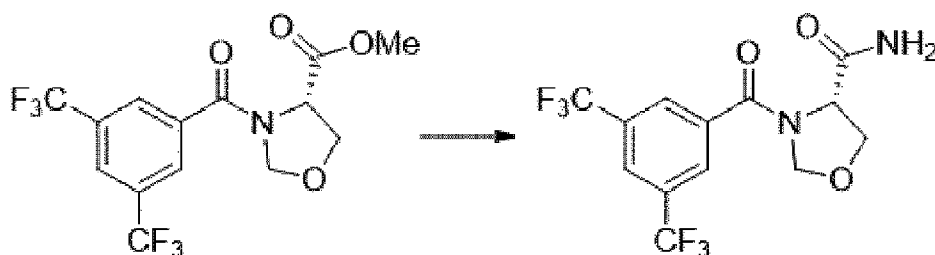


[0193] (S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボン酸の粗生成物 2.98 g (8.36 mmol) をジクロロメタン 84 ml に溶解させた。これに氷冷下で塩化オキサリル 0.86 ml を加え、2 時間攪拌した。これから溶媒を減圧下で留去した。次いで残渣にメタノール 40 ml とトリエチルアミン 1.16 ml を加えて室温で一晩攪拌した。これから溶媒を減圧下で留去し、残渣に水および酢酸エチルを用いて抽出処理を施した。得られた有機層を硫酸マグネシウムで脱水した。その後、有機層を減圧下で濃縮し、得られた濃縮物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することでメチル (S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボキシレート 0.98 g を得た。2 工程収率 31 %。工程 2 の生成物の NMR スペクトルは以下のとおりであった。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $\delta$  ppm) 7.74(2H, brs), 7.70(1H, s), 5.07(1H, brs), 4.94(2H, brs), 4.38(1H, brs), 4.15-4.10(1H, m), 3.81(3H, s)

[0194] (工程 3 : (S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボキサミド (英名 : (S)-3-(3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl)oxazolidine-4-carboxamide) への転化)

[0195] [化17]



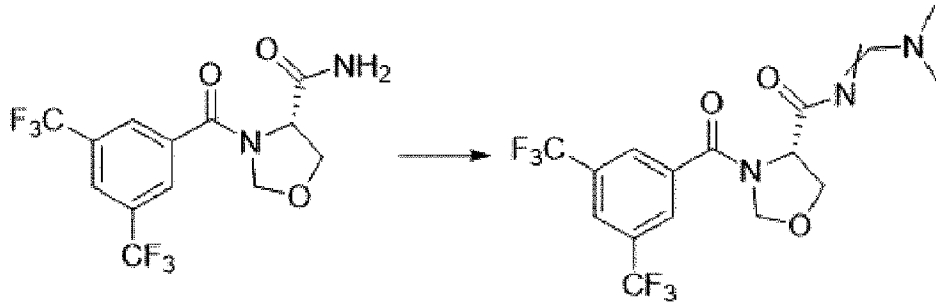
[0196] メチル (S)-3-(3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル)オキサゾリジン-4-カルボキシレート 0.98 g (2.64 mmol) をメタノール 15.3 ml に溶解させた。これに、25%アンモニア水 16.5 ml を加えて室温で 4.5 時間攪拌した。それから溶媒を減圧下で留去した。残渣に水および酢酸エチルを用いて抽出処理を施した。得られた有機層を硫酸マグネシウムで脱水した。その後、有機層を減圧下で濃縮し、得られた濃縮物をシリ

カゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで(S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボキサミド 0.62 gを得た。収率66%。工程3の生成物のNMRスペクトルは以下のとおりであった。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm) 8.03(1H, brs), 8.02(2H, s), 6.85(1H, brs), 6.07(1H, brs), 5.04(1H, brs), 4.92(1H, brs), 4.86(1H, brs), 4.42-4.34(2H, m)

[0197] (工程4 : (S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}-N-{(ジメチルアミノ)メチレン}オキサゾリジン-4-カルボキサミド (英名:(S)-3-{3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl}-N-{(dimethylamino)methylene}oxazolidine-4-carboxamide) への転化)

[0198] [化18]

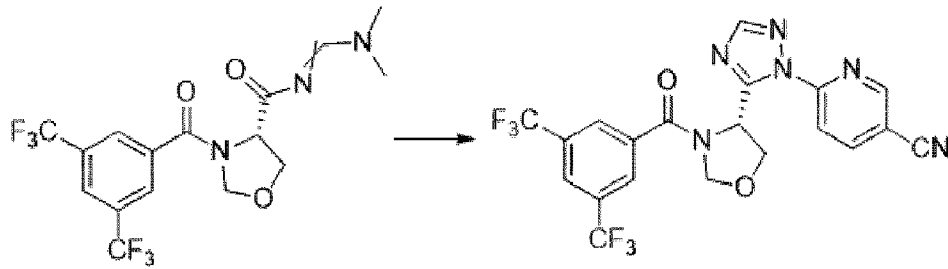


[0199] (S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-カルボキサミド 0.62 g (1.73 mmol) をジクロロメタン 17.3 ml に溶解させた。これに、N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 0.30 ml を加えて加熱し1時間還流させた。その後、これから溶媒を減圧下で留去し、(S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}-N-{(ジメチルアミノ)メチレン}オキサゾリジン-4-カルボキサミドの粗生成物 0.70 g を得た。

[0200] (工程5 : (R)-6-(5-[3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-イル]-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ニコチノニトリルへの転化)

[0201]

[化19]



[0202] (S)-3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}-N-{(ジメチルアミノ)メチレン}オキサゾリジン-4-カルボキサミドの粗生成物0.35gを1,4-ジオキサン0.6mlと酢酸3.0mlとの混合溶媒に溶解させ、これに2-ヒドラジノ-5-シアノピリジン0.23gを加えて60℃で一晩攪拌した。これから溶媒を減圧下で留去し、次いで残渣に酢酸エチルと炭酸水素ナトリウム水溶液とを用いて抽出処理を施した。得られた有機層をブラインで洗浄した。その後、有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去することで粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで(R)-6-(5-[3-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}オキサゾリジン-4-イル]-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ニコチノニトリル0.18gを得た。2工程収率44%。液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間は1.53分であった。

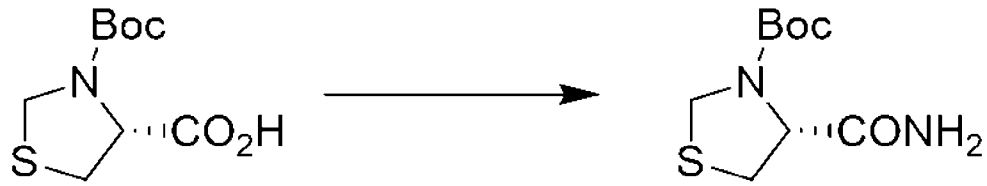
[0203] (実施例2)

以下の工程にて(R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタンオン(英名:(R)-{3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl}[4-{1-(pyrimidin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}thiazolidin-3-yl]methanone)を製造した。

[0204] (工程1 : (R)-3-(t-ブトキシカルボニル)チアゾリジン-4-カルボン酸(英名:(R)-3-(tert-butoxycarbonyl)thiazolidine-4-carboxylic acid)からt-ブチル(R)-4-カルバモイルチアゾリジン-3-カルボキシレート(英名:tert-butyl(R)-4-carbamoylthiazolidine-3-carboxylate)への転化

[0205]

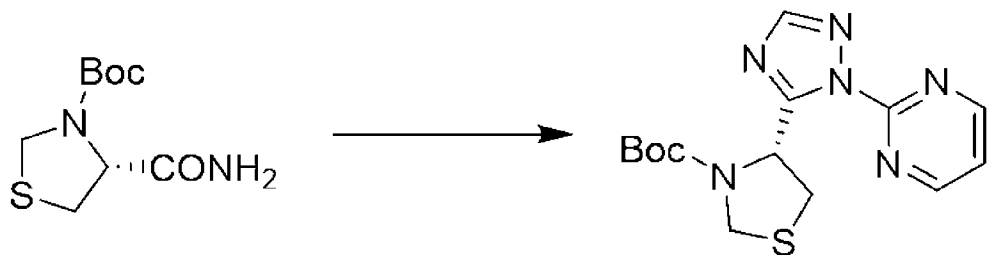
[化20]



[0206] (R)-3-(*t*-ブトキシカルボニル)チアゾリジン-4-カルボン酸 12.5 g (54.1 mmol) をジクロロメタン 135 ml と *N,N*-ジメチルホルムアミド 15 ml との混合溶媒に溶解させ、これに氷冷下で 1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 12.4 g および 1-ヒドロキシベンゾトリアゾール 16.6 g を加えて 30 分間攪拌した。これに 25% アンモニア水 65 ml を加え、室温で一晩攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去した。その後、これに酢酸エチルと硫酸水素カリウム水溶液とを加え、セライト（登録商標）濾過した。ろ液を分液して、有機層を飽和重曹水およびブラインで洗浄し、次いで硫酸マグネシウムで乾燥させた。これを濾過し、得られた液を濃縮することによって、*t*-ブチル (R)-4-カルバモイルチアゾリジン-3-カルボキシレートの粗生成物 11.0 g を得た。

[0207] (工程 2 : *t*-ブチル (R)-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1*H*-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-カルボキシレート (英名 : *tert*-butyl (R)-4-{1-(pyrimidin-2-yl)-1*H*-1,2,4-triazol-5-yl}thiazolidine-3-carboxylate) への転化)

[0208] [化21]

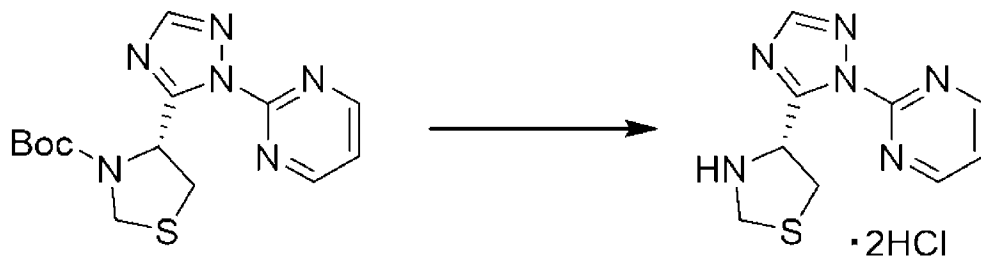


[0209] *t*-ブチル (R)-4-カルバモイルチアゾリジン-3-カルボキシレートの粗生成物 2.18 g を塩化メチレン 15 ml に溶解させ、これに *N,N*-ジメチル

ホルムアミドジメチルアセタール 1.7 g を加えて加熱し 3 時間還流した。得られた液を減圧下で濃縮した。これに 2-ヒドラジノピリミジン 1.14 g を加え、これを 1,4-ジオキサン 15 ml と酢酸 15 ml に溶解させ、50℃で 90 分間攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去した。得られた物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで *t*-ブチル (R)-4-(1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル)チアゾリジン-3-カルボキシレート 1.75 g を得た。液体クロマトグラフィー質量分析法 (LCMS) における保持時間は 0.69 分であった。

[0210] (工程 3 : (R)-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジンジヒドロクロライド (英名 : (R)-4-{1-(pyrimidin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}thiazolidine dihydrochloride) への転化)

[0211] [化22]

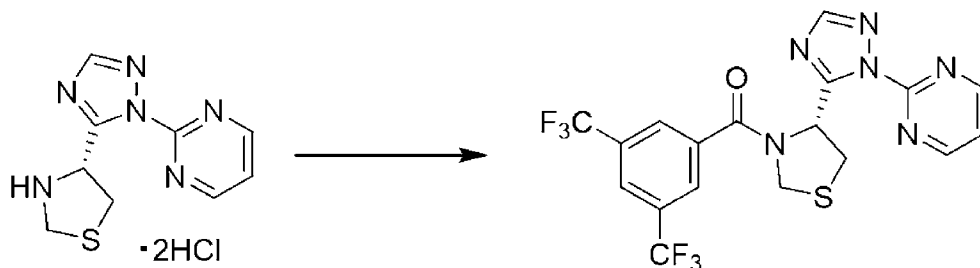


[0212] *t*-ブチル (R)-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-カルボキシレート 1.75 g (5.23 mmol) を、1,4-ジオキサン 15 ml に溶解させ、これに 4 M 塩酸 1,4-ジオキサン溶液 15 ml およびメタノール 10 ml を加え、50℃で一時間攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去して (R)-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジンジヒドロクロライドの粗生成物 1.9 g を得た。

[0213] (工程 4 : (R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタノンへの転化)

[0214]

[化23]



[0215] (R)-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジンジヒドロクロライドの粗生成物0.4 gをクロロホルム10 mlに溶解させ、これに氷冷下でトリエチルアミン1.0 gおよび3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド0.41 gを加えて室温にて1時間攪拌した。得られた液を水およびブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過した。ろ液を減圧下で濃縮した。得られた物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで(R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタノン0.18 gを得た(収率26%)。

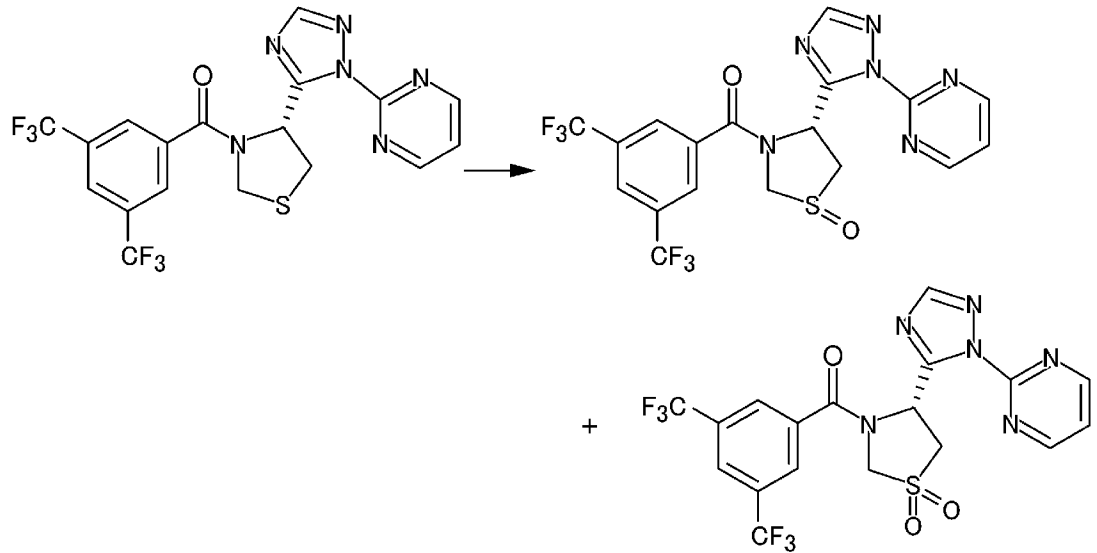
液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間は1.41分であった。

[0216] (実施例3)

以下の工程にて、{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[(4R)-1-オキシド-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタノン(英名:{3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl}[(4R)-1-oxido-4-{1-(pyrimidin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}thiazolidin-3-yl]methanone)および(R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[1,1-ジオキシド-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタノン(英名:(R)-{3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl}[1,1-dioxido-4-{1-(pyrimidin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}thiazolidin-3-yl]methanone)を製造した。

[0217]

[化24]



[0218] (R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタノン 0.34 g (0.71 mmol) をクロロホルム 6 ml に溶解させ、これに 70% メタクロロ過安息香酸 0.21 g を加えて室温にて 90 分間攪拌した。得られた液をチオ硫酸ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液、およびブラインで洗浄し、その後、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過した。ろ液を減圧下で濃縮した。得られた物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで {3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[(4R)-1-オキシド-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタノン 0.2 g (収率 64%、液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間: 1.02 分)、(R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[1,1-ジオキシド-4-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}チアゾリジン-3-イル]メタノン 0.05 g (収率 14%、液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間: 1.36 分) をそれぞれ得た。

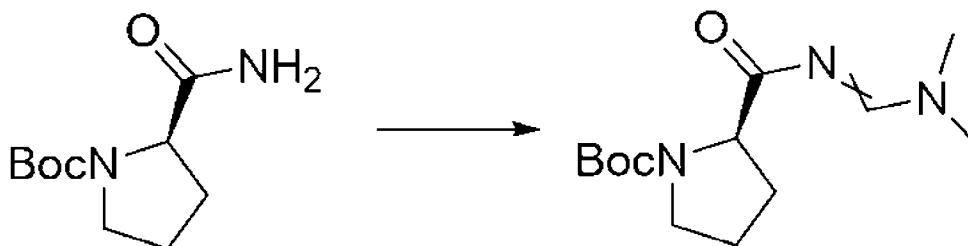
[0219] (実施例 4)

以下の工程にて、(R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[2-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}ピロリジン-1-イル]メタノン (英名: (R)-{3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl}[2-{1-(pyrimidin-2-yl

)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}pyrrolidin-1-yl]methanone) を製造した。

[0220] (工程1 : t-ブチル (R)-2-カルバモイルピロリジン-1-カルボキシレート (英名 : tert-butyl (R)-2-carbamoylpyrrolidine-1-carboxylate) からt-ブチル (R)-2-[(ジメチルアミノ)メチレン]カルバモイルピロリジン-1-カルボキシレート (英名 : tert-butyl(R)-2-[(dimethylamino)methylene]carbamoylpyrrolidine-1-carboxylate) への転化

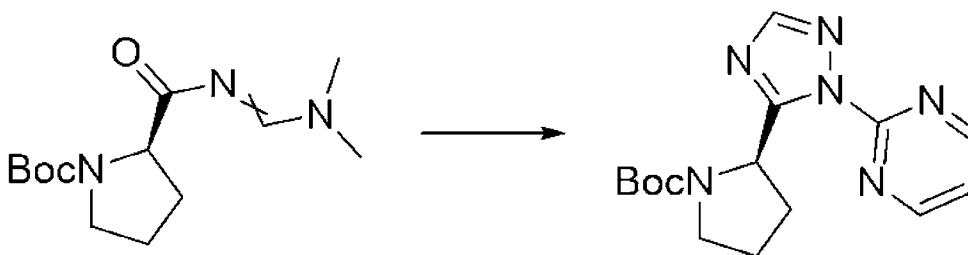
[0221] [化25]



[0222] t-ブチル (R)-2-カルバモイルピロリジン-1-カルボキシレート 2.0 g (9.3 mmol) をジクロロメタン 31 ml に溶解させ、これに N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 1.6 ml を加え加熱して 4 時間還流した。得られた液から溶媒を減圧下で留去して t-ブチル (R)-2-[(ジメチルアミノ)メチレン]カルバモイルピロリジン-1-カルボキシレートを得た。

[0223] (工程2 : t-ブチル (R)-2-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}ピロリジン-1-カルボキシレート (英名 : tert-butyl (R)-2-{1-(pyrimidin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}pyrrolidine-1-carboxylate) への転化

[0224] [化26]



[0225] t-ブチル (R)-2-[(ジメチルアミノ)メチレン]カルバモイルピロリジン-1-カルボキシレート 1.25 g を 1,4-ジオキササン 15 ml と酢酸 8 ml

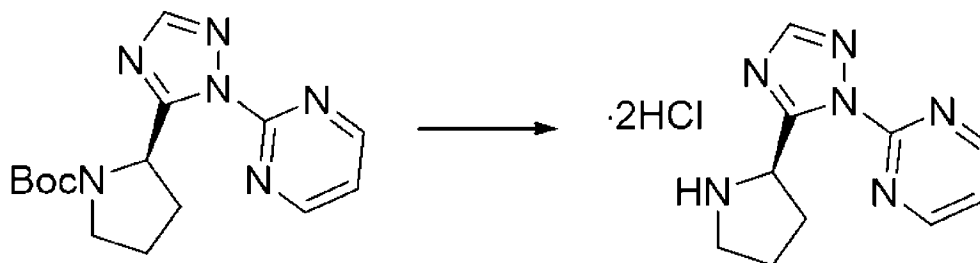
に溶解させ、60℃で6時間攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することでt-ブチル (R)-2-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}ピロリジン-1-カルボキシレート0.76gを得た。2工程収率52%。

工程2の生成物のNMRスペクトルは以下のとおりであった。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) 8.87(1H, d), 8.83(1H, d), 8.02(0.5H, s), 7.98(0.5H, s), 7.36(0.5H, t), 7.31(0.5H, t), 6.02(0.5H, dd), 5.85(0.5H, dd), 3.82-3.30(3H, m), 2.55-1.90(3H, m), 1.50-1.44(9H, m)

[0226] (工程3 : (R)-2-{5-(ピロリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル}ピリミジンジヒドロクロライド (英名 : (R)-2-{5-(pyrrolidin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-1-yl}pyrimidine dihydrochloride) への転化

[0227] [化27]

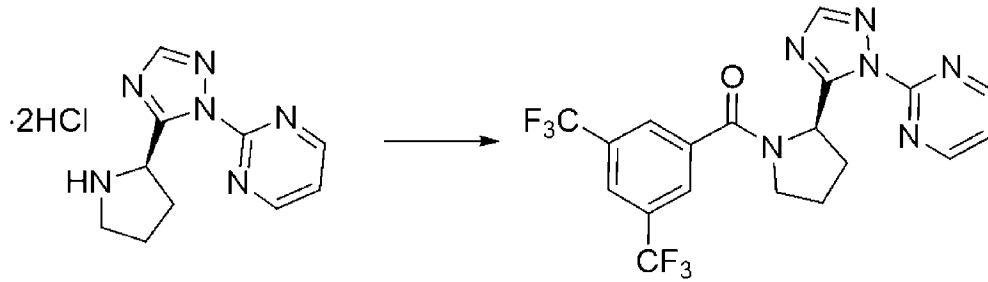


[0228] t-ブチル (R)-2-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}ピロリジン-1-カルボキシレート0.76g (2.4mmol) をジクロロメタン16mlに溶解させ、これに4M塩酸1,4-ジオキサン溶液3mlを加え、室温で一晩攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去して(R)-2-{5-(ピロリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル}ピリミジンジヒドロクロライドを得た。

[0229] (工程4 : (R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[2-{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}ピロリジン-1-イル]メタノン (英名 : (R)-{3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl}[2-{1-(pyrimidin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}pyrrolidin-1-yl]methanone) への転化

[0230]

[化28]



[0231] (R)-2-{{5-(ピロリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル}ピリミジンジヒドロクロライド} 0.13 g をジクロロメタン 2.3 ml に懸濁させ、これに3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロライド 0.16 g 及びトリエチルアミン 0.25 ml を加えて室温にて一晩攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去し、得られた物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで(R)-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル}[2-{{1-(ピリミジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}ピロリジン-1-イル}]メタノン 85 mg を得た。2工程収率は32%であった。

液体クロマトグラフィー質量分析法(LCMS)における保持時間は1.32分であった。

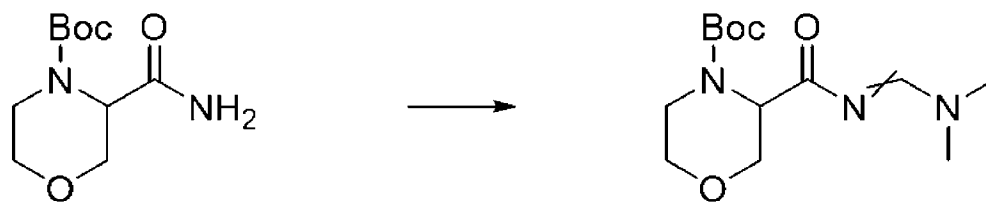
[0232] (実施例5)

以下の工程にて、6-(5-[4-{{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}モルホリン-3-イル}][1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ニコチノニトリル (英名: 6-(5-[4-{{3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl}morpholin-3-yl}][1H-1,2,4-triazol-1-yl)nicotinonitrile) を製造した。

[0233] (工程1 : t-ブチル 3-カルバモイルモルホリン-4-カルボキシレート (英名: tert-butyl 3-carbamoylmorpholine-4-carboxylate) からt-ブチル 3-[[{(ジメチルアミノ)メチレン}カルバモイル]モルホリン-4-カルボキシレート (英名: tert-butyl 3-[[{(dimethylamino)methylene}carbamoyl]morpholine-4-carboxylate) への転化

[0234]

[化29]

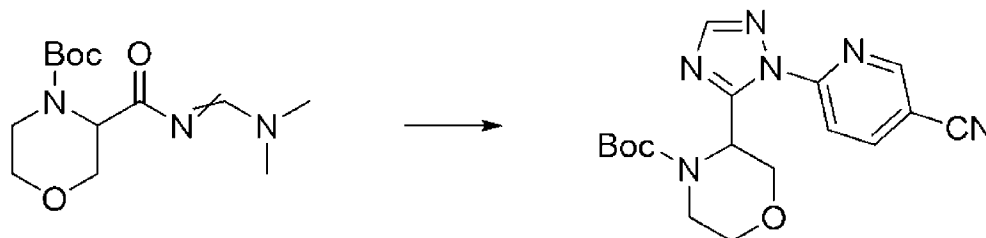


[0235] t-ブチル 3-カルバモイルモルホリン-4-カルボキシレート 1.2 g (5.2 mmol) をジクロロメタン 52 ml に溶解させ、これに N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 0.82 ml を加えて加熱し 1.5 時間還流した。得られた液から溶媒を減圧下で留去し、t-ブチル 3-[(ジメチルアミノ)メチレン]カルバモイル]モルホリン-4-カルボキシレート 1.25 g を得た。収率 84%。工程 1 の生成物の NMR スペクトルは以下のとおりであった。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm) 8.48(1H, s), 4.61(1H, dd), 4.46(1H, dd), 3.83(1H, d), 3.72-3.62(2H, m), 3.52-3.22(2H, m), 3.12(3H, dd), 3.07(3H, s), 1.46(9H, d)

[0236] (工程 2 : t-ブチル 3-{1-(5-シアノピリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}モルホリン-4-カルボキシレート (英名 : tert-butyl 3-{1-(5-cyanopyridin-2-yl)-1H-1,2,4-triazol-5-yl}morpholine-4-carboxylate) への転化

[0237] [化30]



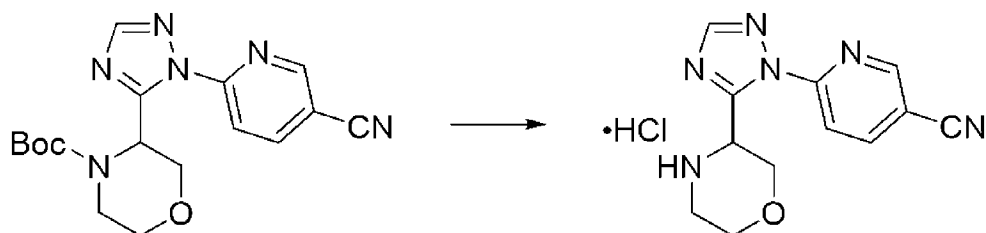
[0238] t-ブチル 3-[(ジメチルアミノ)メチレン]カルバモイル]モルホリン-4-カルボキシレート 0.63 g (2.19 mmol) を 1,4-ジオキサン 1.6 ml と酢酸 7.8 ml との混合溶媒に溶解させ、これに 2-ヒドラジノ-5-シアノピリジン 0.35 g を加えて 60°C で 2 時間攪拌した。得られた

液を室温に戻し、その後、溶媒を減圧下で留去し、残渣に酢酸エチルと炭酸水素ナトリウム水溶液とを用いて抽出処理を施した。有機層をブラインで洗浄し、次いで硫酸マグネシウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することでt-ブチル 3-{1-(5-シアノピリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}モルホリン-4-カルボキシレート0.58gを得た。収率75%。

液体クロマトグラフィー質量分析法 (LCMS) における保持時間は1.32分であった。

[0239] (工程3 : 6-{5-(モルホリン-3-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル}ニコチノニトリル ヒドロクロライド (英名 : 6-{5-(morpholin-3-yl)-1H-1,2,4-triazol-1-yl}nicotinonitrile hydrogen chloride) への転化

[0240] [化31]



[0241] t-ブチル 3-{1-(5-シアノピリジン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}モルホリン-4-カルボキシレート0.16g (1.3mmol) をジクロロメタン2.8mlに溶解させ、これに4M塩酸1,4-ジオキサン溶液0.6mlを加え、室温で一晩攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去し、6-{5-(モルホリン-3-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル}ニコチノニトリル ヒドロクロライド0.13gを得た。収率100%。

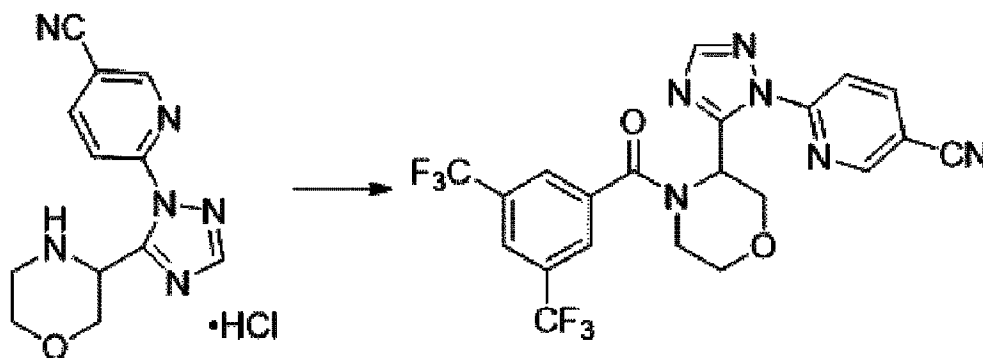
工程3の生成物のNMRスペクトルは以下のとおりであった。

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-d<sub>6</sub>, δ ppm) 9.90(1H, d), 9.12(1H, dd), 8.63(1H, dd), 8.54(1H, s), 8.15(1H, dd), 5.50(1H, dd), 4.39(1H, dd), 4.03(1H, d), 3.87(1H, dt), 3.76(1H, dd), 3.57(1H, s), 3.41(1H, d)

[0242] (工程4 : 6-(5-[4-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}モルホリン-3-イル])1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ニコチノニトリル (英名 : 6-(

5-[4-{3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl}morpholin-3-yl][1H-1,2,4-triazol-1-yl]nicotinonitrile) への転化

[0243] [化32]



[0244] 6-{5-(モルホリン-3-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル}ニコチノニトリル ヒドロクロライド 0.13 g (1.3 mmol) をテトラヒドロフラン 3.8 ml に溶解させ、これに氷冷下で3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロライド (英名: 3,5-bis(trifluoromethyl)benzoyl chloride) 0.1051 g およびジイソプロピルエチルアミン 0.23 ml を加えて室温で一晩攪拌した。得られた液から溶媒を減圧下で留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで 6-(5-[4-{3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゾイル}モルホリン-3-イル])[1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ニコチノニトリル 0.14 g を得た。収率 72%。

液体クロマトグラフィー質量分析法 (LCMS) における保持時間は 1.59 分であった。

[0245] 上記の実施例と同様の工程を経て以下の表 1~4 に示す化合物を製造した。物性欄に融点を記した。物性が AMORPHOUS または VISCOUS OIL であるもの一部には LCMS 保持時間を記した。

[0246] LCMS 保持時間は、以下の方法で決定した。

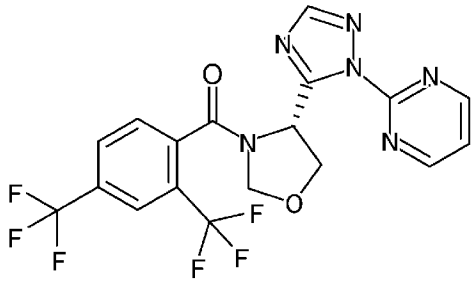
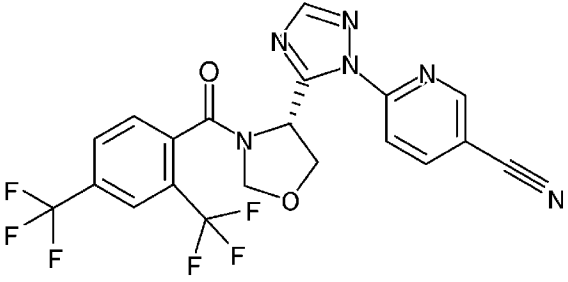
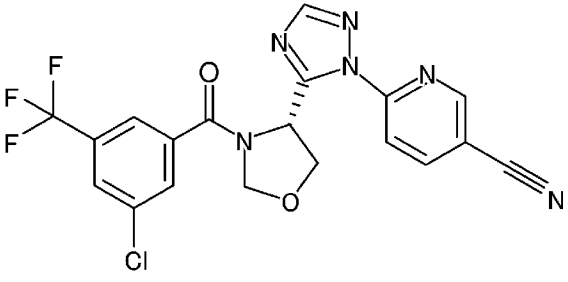
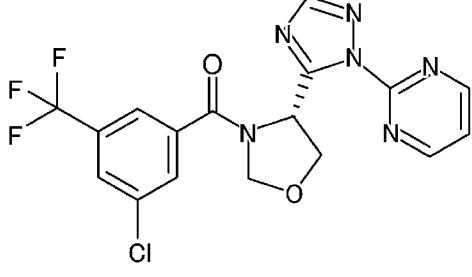
超高速高分離液体クロマトグラフ (ACQUITY UPLC H-Class: ウォーターズ社製)、ACQUITY UPLC フォトダイオードアレイ (PDA) eλ 検出器 (ウォーターズ社製) 及び ACQUITY QDa 検出器 (正及び負イオンエレクトロスプレーモードで、UV PDA 検出、ウォーターズ社製) を用いてなるシステムに、Wat

ers CORTECS UPLC C18カラム（ウォーターズ社製、2.1×50mm、1.6 μm）を取り付け、温度40℃、流量0.6mL/分、2 μL注入で測定した。移動相(A)に0.1%ギ酸を含む水を使用し、移動相(B)にアセトニトリルを使用した。移動相(B)の濃度を30質量%で0.15分間維持し、その後1.35分間を掛けて移動相(B)の濃度を30質量%から95質量%に等速で上げ、0.5分間95質量%で維持し、次いで移動相(B)の濃度を30質量%にすぐ下げ、最後に移動相(B)の濃度を30質量%で0.50分間維持した。

[0247]

[表1]

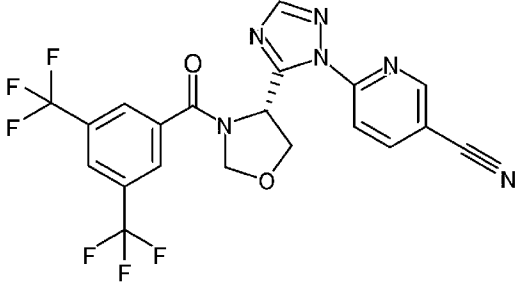
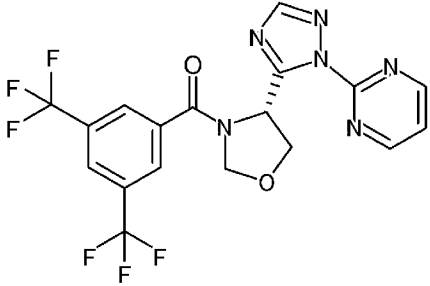
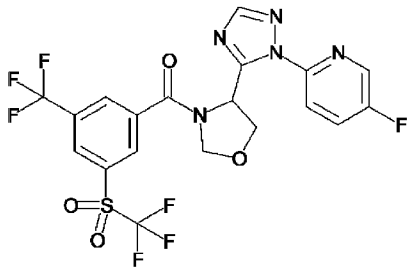
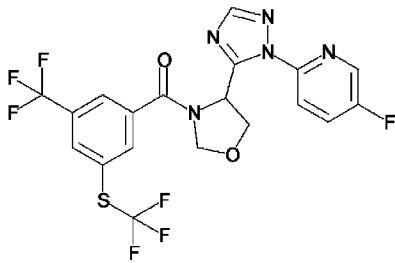
表 1

化合物番号	構造式	物性
A-1		Mp: 141-142°C
A-2		AMORPHOUS 1.47 min
A-3		Mp: 206-208°C
A-4		AMORPHOUS 1.11 min

[0248]

[表2]

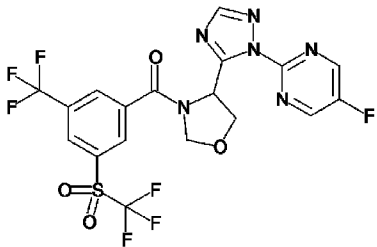
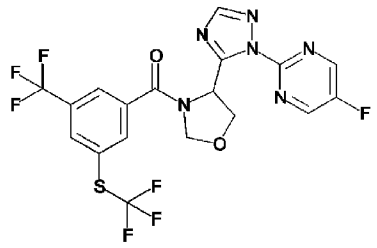
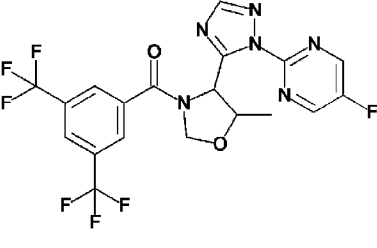
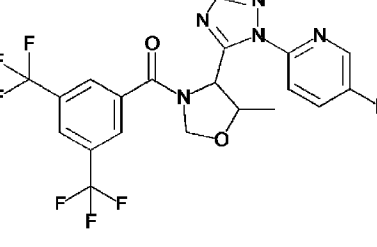
表 1 (続き)

化合物番号	構造式	物性
A-5		Mp: 93-95°C
A-6		AMORPHOUS 1.57 min
A-7		AMORPHOUS 1.59 min
A-8		Mp: 127-128°C

[0249]

[表3]

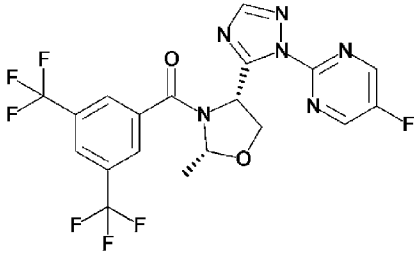
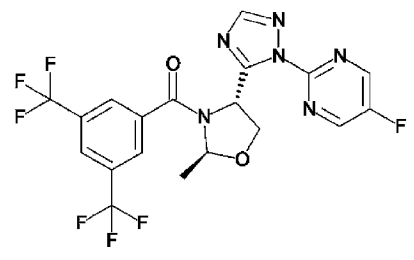
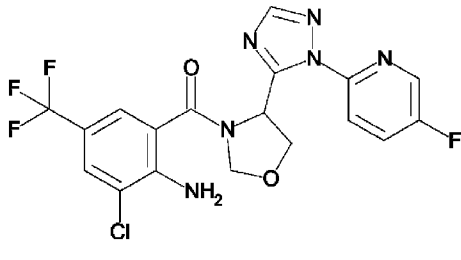
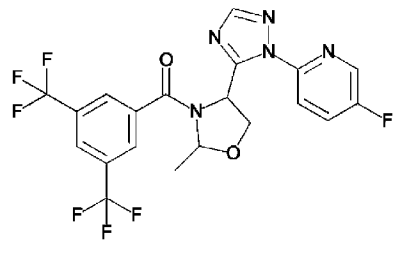
表 1 (続き)

化合物番号	構造式	物性
A-9		Mp: 101-102°C
A-10		Mp: 126-127°C
A-11		Mp: 176-178°C
A-12		Mp: 125-127°C

[0250]

[表4]

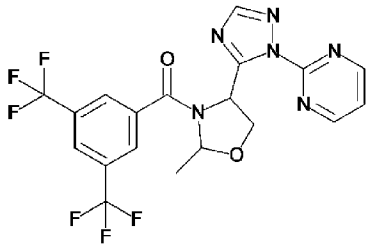
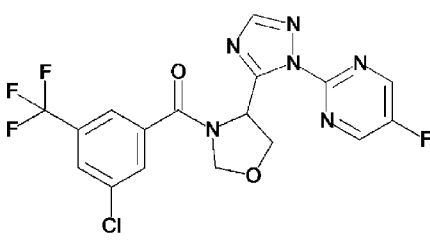
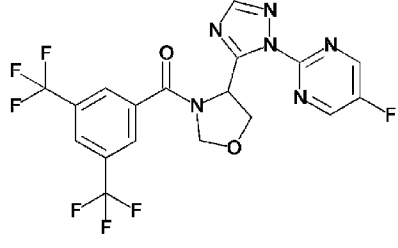
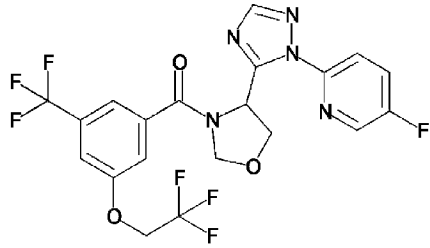
表 1 (続き)

化合物番号	構造式	物性
A-13		Mp: 132-133°C
A-14		AMORPHOUS 1.37 min
A-15		Mp: 177-178°C
A-16		Mp: 121-122°C

[0251]

[表5]

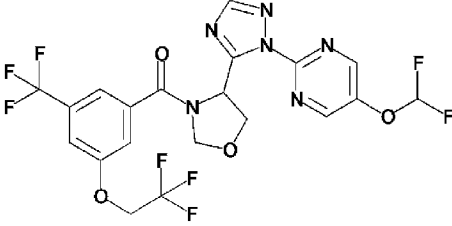
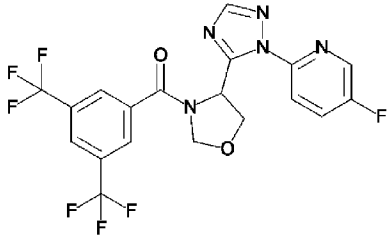
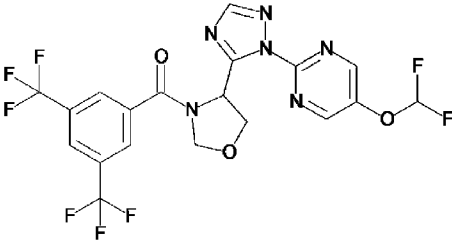
表 1 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
A-17		Mp: 127-129°C
A-18		AMORPHOUS 1.27 min
A-19		Mp: 97-99°C
A-20		AMORPHOUS 1.58 min

[0252]

[表6]

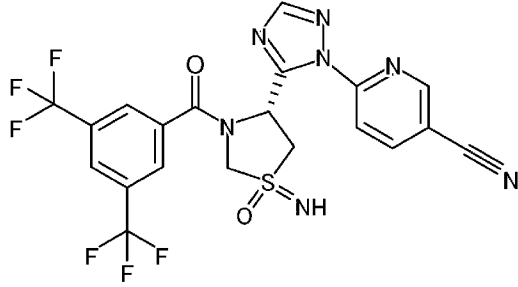
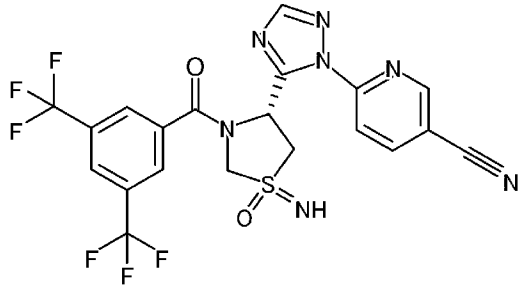
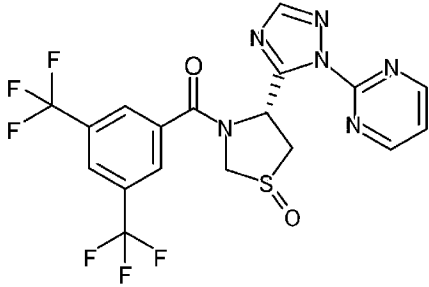
表 1 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
A-21		AMORPHOUS 1.47 min
A-22		Mp:116-117°C
A-23		Mp: 124-125°C

[0253]

[表7]

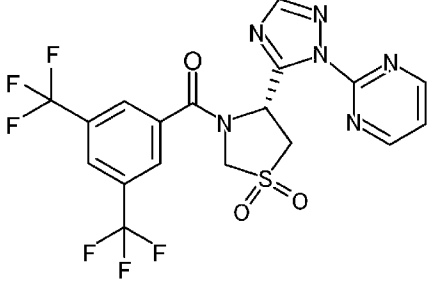
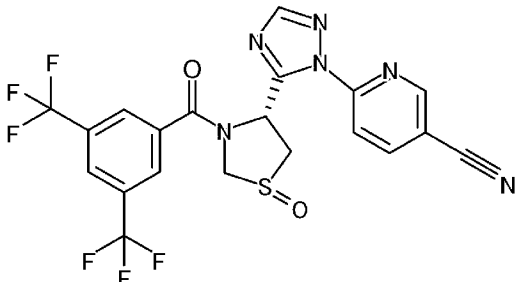
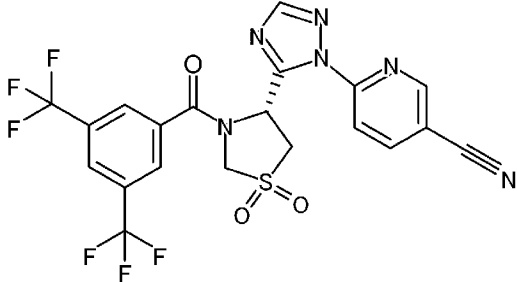
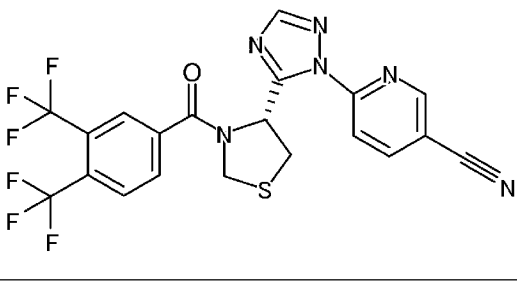
表 2

化合物 番号	構造式	物性
B-1		Mp: 106-108°C
B-2		Mp: 158-160°C
B-3		VISCOUS OIL 1.02 min

[0254]

[表8]

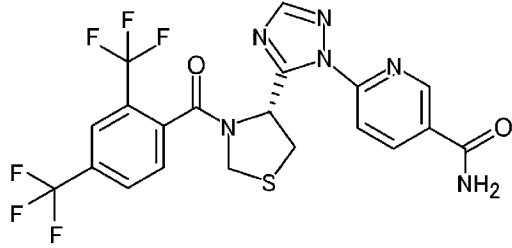
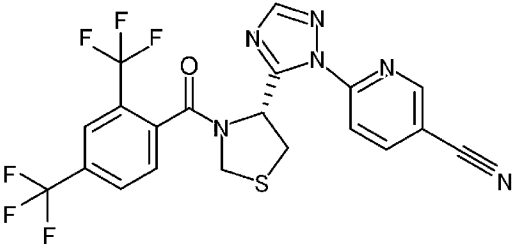
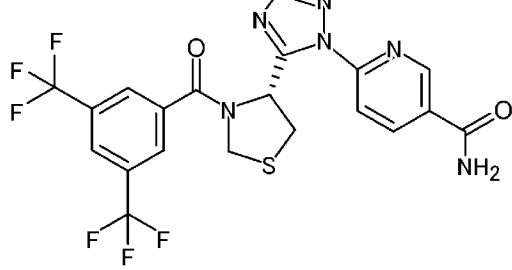
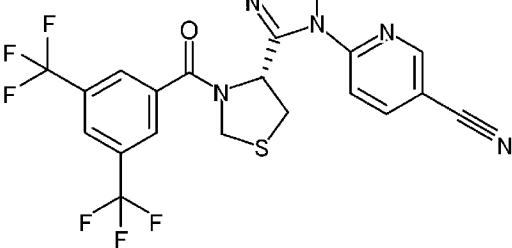
表 2 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
B-4		VISCOUS OIL 1.36 min
B-5		VISCOUS OIL 1.34 min
B-6		Mp: 89-93°C
B-7		AMORPHOUS 1.31 min

[0255]

[表9]

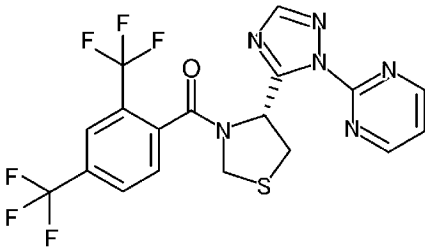
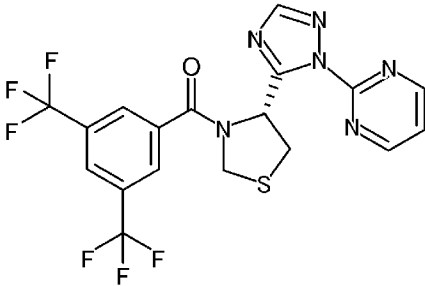
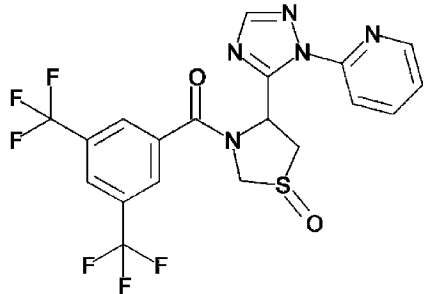
表2 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
B-8		AMORPHOUS 1.31 min
B-9		VISCOUS OIL 1.65 min
B-10		AMORPHOUS 1.34 min
B-11		AMORPHOUS 1.66 min

[0256]

[表10]

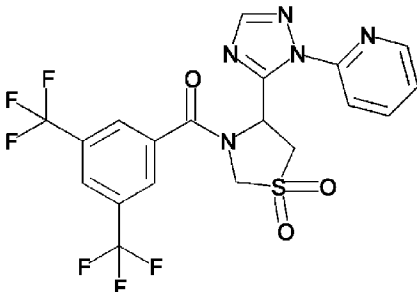
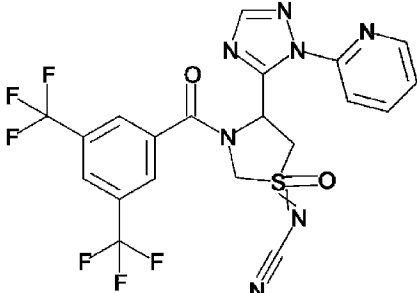
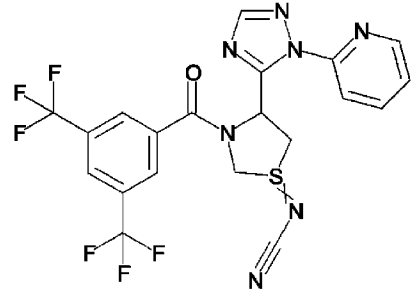
表 2 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
B-12		VISCOUS OIL 1.99 min
B-13		AMORPHOUS 1.41 min
B-14		Mp: 134-137°C

[0257]

[表11]

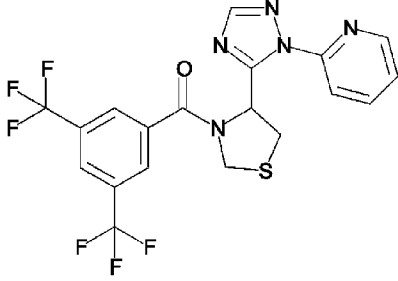
表 2 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
B-15		Mp: 174-177°C
B-16		VISCOUS OIL 測定中に分解
B-17		VISCOUS OIL 1.39 min

[0258]

[表12]

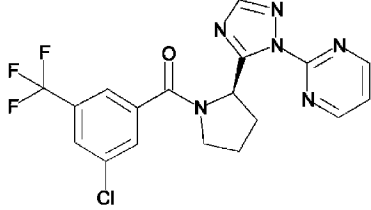
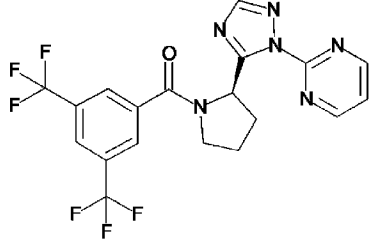
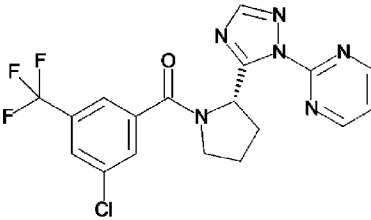
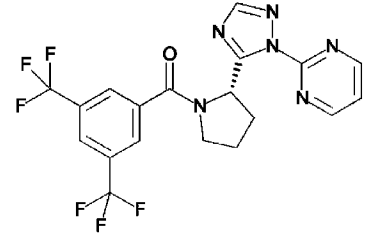
表 2 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
B-18		Mp: 94-97°C

[0259]

[表13]

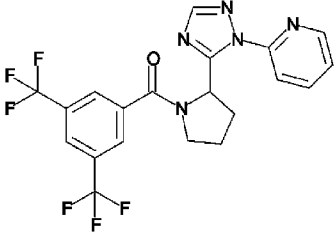
表 3

化合物 番号	構造式	物性
C-1		AMORPHOUS 1.22 min
C-2		AMORPHOUS 1.32 min
C-3		Mp: 120-123°C
C-4		Mp: 85-88°C

[0260]

[表14]

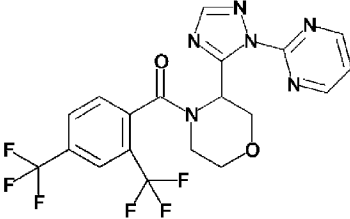
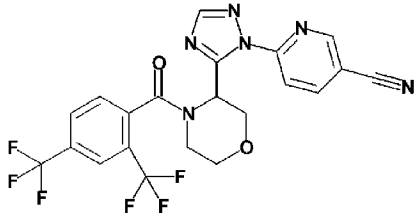
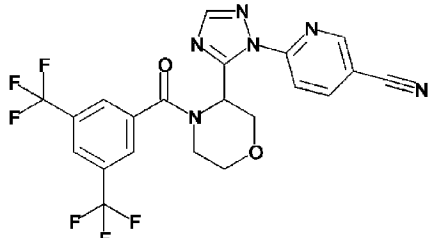
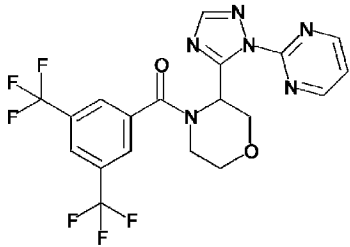
表 3 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
C-5		VISCIOUS OIL 1.59 min

[0261]

[表15]

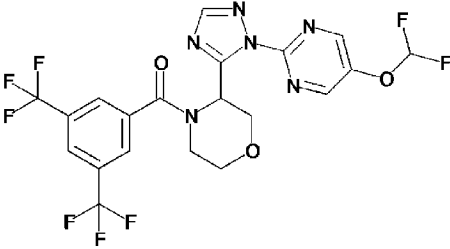
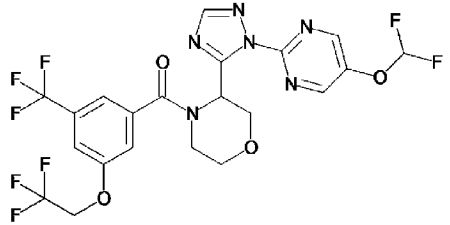
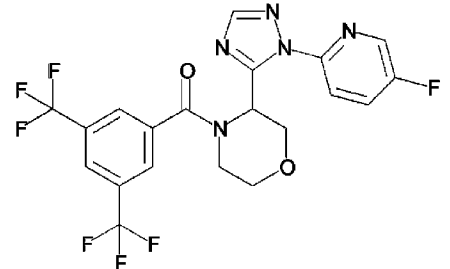
表 4

化合物 番号	構造式	物性
D-1		Mp: 117-119°C
D-2		Mp: 109-110°C
D-3		Mp: 167-168°C
D-4		Mp: 179-180°C

[0262]

[表16]

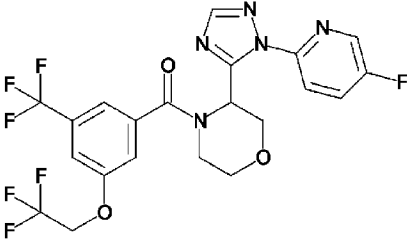
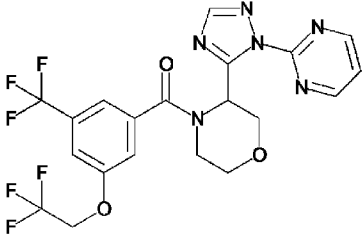
表4 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
D-5		Mp: 195-196°C
D-6		AMORPHOUS 1.51 min
D-7		Mp: 159-160°C

[0263]

[表17]

表 4 (続き)

化合物 番号	構造式	物性
D-8		Mp: 139-141°C
D-9		AMORPHOUS 1.35 min

## [0264] [生物試験]

本発明化合物が、有害生物防除剤および外部寄生虫防除剤の有効成分として有用であることを以下の試験例で示す。なお「部」は重量基準である。

## [0265] (試験用乳剤の調製)

本発明化合物 5 部、ジメチルホルムアミド 9 3. 6 部、およびポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル 1. 4 部を混合し溶解させて、有効成分 5 質量%の乳剤(I)を得た。

ジメチルホルムアミド 9 3. 6 部、およびポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル 1. 4 部を混合し溶解させて、乳剤(II)を得た。

## [0266] (試験例 1) アワヨトウに対する効力試験(1)

市販の人工飼料(インセクタ L F S、日本農産工業社製) 0. 8 g と乳剤(I) 1 μ l をよく混和し、プラスチック製試験容器(1. 4 m l 容)に各処理区当り 0. 2 g を詰めて試験用飼料とした。

市販の人工飼料(インセクタ L F S、日本農産工業社製) 0. 8 g と乳剤

(II) 1  $\mu$  l をよく混和し、プラスチック製試験容器 (1.4 ml 容) に各処理区当り 0.2 g を詰めて対照用飼料とした。

アワヨトウ 2 齢幼虫を各処理区当り 2 頭接種し、プラスチック製の蓋で密閉した。それを 25  $^{\circ}$ C の恒温室内に置き、5 日目に殺虫率と摂食量を調べた。試験は 2 反復で行った。

$$\text{殺虫率 (\%)} = (\text{死亡虫数} / \text{供試虫数}) \times 100$$

[0267] 化合物番号 A-3、A-4、A-5、A-6、A-13、A-14、A-15、A-16、A-17、A-18、A-19、A-20、A-21、A-22、A-23、D-3、D-7 および D-8 の化合物について、アワヨトウに対する効力試験(1)を行った。いずれの化合物も、殺虫率が 100% であり、有効であった。対照用飼料では、殺虫率が 0% であった。

[0268] (試験例 2) アワヨトウに対する効力試験(2)

乳剤(I)を、本発明化合物の濃度が 125 質量 ppm になるように水で希釈し、希釈液(I)を得た。乳剤(II)を、希釈液(I)と同じ希釈倍率になる量の水で希釈し、希釈液(II)を得た。希釈液(I)および希釈液(II)のそれぞれにトウモロコシ葉片を 30 秒間浸漬した。浸漬処理後のトウモロコシ葉片を、シャーレに入れ、アワヨトウ 2 齢幼虫 5 頭を放った。前記シャーレを、温度 25  $^{\circ}$ C、湿度 60% の恒温室内に放置した。放虫から 6 日間経過したときに生死判定を行い、殺虫率を算出した。試験は 2 反復で行った。

[0269] 化合物番号 A-3、A-5、A-6、A-7、A-8、A-9、A-10、A-15、A-20、A-21、A-22、B-2、B-11、D-1、D-3、D-7 および D-8 の化合物について、アワヨトウに対する効力試験(2)を行った。いずれの化合物も 80% 以上の殺虫率を示した。希釈液(II)では殺虫率が 0% であった。

[0270] (試験例 3) ハスモンヨトウに対する効力試験

乳剤(I)を、本発明化合物の濃度が 125 質量 ppm になるように水で希釈し、希釈液(I)を得た。乳剤(II)を、希釈液(I)と同じ希釈倍率になる量の水で希釈し、希釈液(II)を得た。希釈液(I)および希釈液(II)のそれぞれにキャベツ葉を 30 秒間浸漬した。浸漬処理後のキャベツ葉を風乾してシャーレに入れ、ハスモンヨトウ 2 齢幼虫 5 頭を放した。シャーレを温度 25  $^{\circ}$ C、湿度

60%の恒温室内に放置した。放虫から6日間経過したときに生死判定を行い、殺虫率を算出した。試験は2反復で行った。

[0271] 化合物番号A-5およびD-3の化合物について、ハスモンヨトウに対する効力試験を行った。いずれの化合物も80%以上の殺虫率を示した。希釈液(II)では殺虫率が0%であった。

[0272] (試験例4) コナガに対する効力試験

乳剤(I)を、本発明化合物の濃度が125質量ppmになるように水で希釈し、希釈液(I)を得た。乳剤(II)を、希釈液(I)と同じ希釈倍率になる量の水で希釈し、希釈液(II)を得た。希釈液(I)および希釈液(II)のそれぞれにキャベツ葉を30秒間浸漬した。浸漬処理後のキャベツ葉を風乾して、シャーレに入れ、コナガ2齢幼虫5頭を放した。前記のシャーレを、温度25℃、湿度60%の恒温室内に放置した。放虫から3日間経過したときに生死判定を行い、殺虫率を算出した。試験は2反復で行った。

[0273] 化合物番号A-3、A-5、A-6、A-20、D-3、D-7およびD-8の化合物について、コナガに対する効力試験を行った。いずれの化合物も80%以上の殺虫率を示した。希釈液(II)では殺虫率が0%であった。

[0274] (試験例5) ワタアブラムシに対する効力試験

3寸鉢にキュウリを播種した。発芽から10日間経過したキュウリに、ワタアブラムシ雌成虫を放した。放虫の翌日に、産下された1齢幼虫を残し、雌成虫を取り除いた。乳剤(I)を、本発明化合物濃度が125質量ppmになるように水で希釈し、希釈液(I)を得た。乳剤(II)を、希釈液(I)と同じ希釈倍率になる量の水で希釈し、希釈液(II)を得た。希釈液(I)および希釈液(II)のそれぞれを前記のキュウリに散布した。キュウリを温度25℃・湿度60%の恒温室内に放置し、5日間経過したときにワタアブラムシの生死を調べ、殺虫率を求めた。

[0275] 化合物番号A-5、A-6、A-8、A-10、A-13、A-14、A-16、A-17、A-19、A-20、A-21、A-22、A-23、D-3、D-4、D-5およびD-7の化合物について、ワタアブラムシに対する効力試験を行った。いずれの化合物も下記式で定義される防除

率が100%であった。

$$\text{防除率} = \{1 - (N_t)/(N_c)\} \times 100$$

$N_t$  : 希釈液(I)処理区の寄生虫数

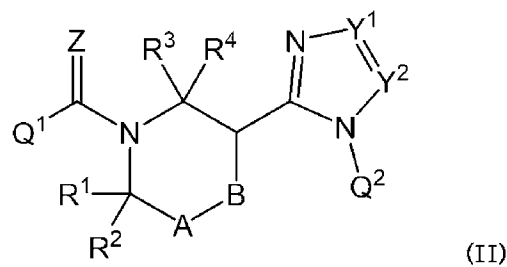
$N_c$  : 希釈液(II)処理区の寄生虫数

[0276] 本発明のヘテロアリール化合物の中から無作為に選択したものが、いずれも上記のような効果を奏することから、本発明のヘテロアリール化合物は、例示しきれなかった化合物を含め、有害生物防除、特に殺ダニ、殺虫などの効果を有する化合物であることが理解できる。また、外部寄生虫、内部寄生虫などの人畜に害のある寄生虫にも効果を有する化合物であることが理解できる。



、 $R^b$ は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシ基、置換若しくは無置換のC 1～6アルキルカルボニル基、または置換若しくは無置換のC 1～6アルコキシカルボニル基を示し、 $R^c$ は、水素原子、置換若しくは無置換のC 1～6アルキル基、置換若しくは無置換のC 3～6シクロアルキル基、置換若しくは無置換のフェニル基、またはシアノ基を示す。]

[化2]



〔式(II)中、Z、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、AおよびBは、式(I)中のそれらと同じものを示す。〕

[請求項2] 請求項1に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する、有害生物防除剤。

[請求項3] 請求項1に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する、殺虫若しくは殺ダニ剤。

[請求項4] 請求項1に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する、外部寄生虫防除剤。

[請求項5] 請求項1に記載の化合物及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する、内部寄生虫防除若しくは駆除剤

。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2023/021894

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
<p><i>C07D 413/14</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/653</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/76</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/78</i>(2006.01)i; <i>A01N 43/84</i>(2006.01)i; <i>A01P 7/02</i>(2006.01)i; <i>A01P 7/04</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/4439</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/506</i>(2006.01)i; <i>A61K 31/5377</i>(2006.01)i; <i>A61P 33/10</i>(2006.01)i; <i>A61P 33/14</i>(2006.01)i; <i>C07D 401/14</i>(2006.01)i; <i>C07D 403/14</i>(2006.01)i; <i>C07D 417/14</i>(2006.01)i            FI: C07D413/14 CSP; A01N43/653 K; A01N43/76; A01N43/78 E; A01N43/84 101; A01P7/02; A01P7/04; A61K31/4439; A61K31/506; A61K31/5377; A61P33/10; A61P33/14; C07D401/14; C07D403/14; C07D417/14</p> <p>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC</p>		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
C07D413/14; A01N43/653; A01N43/76; A01N43/78; A01N43/84; A01P7/02; A01P7/04; A61K31/4439; A61K31/506; A61K31/5377; A61P33/10; A61P33/14; C07D401/14; C07D403/14; C07D417/14		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Published examined utility model applications of Japan 1922-1996 Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2023 Registered utility model specifications of Japan 1996-2023 Published registered utility model applications of Japan 1994-2023		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)		
CAplus/REGISTRY (STN)		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2021-528473 A (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 21 October 2021 (2021-10-21) in particular, claims, examples	1-5
A	JP 2021-521133 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 26 August 2021 (2021-08-26) in particular, claims, examples	1-5
A	CN 108864075 A (NANKAI UNIVERSITY) 23 November 2018 (2018-11-23) in particular, claims, examples	1-5
A	JP 2013-532719 A (ZOETIS LLC) 19 August 2013 (2013-08-19) in particular, claims, examples	1-5
A	JP 2015-532650 A (BAYER CROPSCIENCE AG) 12 November 2015 (2015-11-12) in particular, claims, examples	1-5
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
<p>* Special categories of cited documents:</p> <p>“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date</p> <p>“L” document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> <p>“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art</p> <p>“&amp;” document member of the same patent family</p>		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
14 July 2023		22 August 2023
Name and mailing address of the ISA/JP		Authorized officer
Japan Patent Office (ISA/JP) 3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915 Japan		Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

**PCT/JP2023/021894**

<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2004-510765 A (NEUROGEN CORPORATION) 08 April 2004 (2004-04-08) in particular, claims, examples	1-5
A	ACS Medicinal Chemistry Letters. 2021, 12(12), 1962-1967, DOI: 10.1021/ acsmedchemlett.1c00540 in particular, claims, examples	1-5

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

International application No.

**PCT/JP2023/021894**

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
JP	2021-528473	A	21 October 2021	US 2021/0267203 A1 in particular, claims, examples WO 2020/002563 A1 EP 3814332 A1 CN 112351978 A KR 10-2021-0028201 A	
JP	2021-521133	A	26 August 2021	US 2021/0147387 A1 in particular, claims, examples WO 2019/197468 A1 EP 3774778 A1 EP 3904350 A1 EP 3904349 A1 CN 111989323 A KR 10-2020-0143367 A	
CN	108864075	A	23 November 2018	(Family: none)	
JP	2013-532719	A	19 August 2013	US 2012/0035122 A1 in particular, claims, examples WO 2012/017359 A1 EP 2601190 A1 KR 10-2013-0062333 A CN 103270036 A	
JP	2015-532650	A	12 November 2015	US 2015/0216168 A1 in particular, claims, examples WO 2014/037340 A1 EP 2892345 A1 CN 104780764 A	
JP	2004-510765	A	08 April 2004	US 2003/0055037 A1 in particular, claims, examples WO 2002/028839 A1 EP 1322620 A1 KR 10-2003-0060904 A	

<p>A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））</p> <p>C07D 413/14(2006.01)i; A01N 43/653(2006.01)i; A01N 43/76(2006.01)i; A01N 43/78(2006.01)i; A01N 43/84(2006.01)i; A01P 7/02(2006.01)i; A01P 7/04(2006.01)i; A61K 31/4439(2006.01)i; A61K 31/506(2006.01)i; A61K 31/5377(2006.01)i; A61P 33/10(2006.01)i; A61P 33/14(2006.01)i; C07D 401/14(2006.01)i; C07D 403/14(2006.01)i; C07D 417/14(2006.01)i</p> <p>FI: C07D413/14 CSP; A01N43/653 K; A01N43/76; A01N43/78 E; A01N43/84 I01; A01P7/02; A01P7/04; A61K31/4439; A61K31/506; A61K31/5377; A61P33/10; A61P33/14; C07D401/14; C07D403/14; C07D417/14</p>																	
<p>B. 調査を行った分野</p> <p>調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））</p> <p>C07D413/14; A01N43/653; A01N43/76; A01N43/78; A01N43/84; A01P7/02; A01P7/04; A61K31/4439; A61K31/506; A61K31/5377; A61P33/10; A61P33/14; C07D401/14; C07D403/14; C07D417/14</p> <p>最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの</p> <table border="0"> <tr> <td>日本国実用新案公報</td> <td>1922 - 1996年</td> </tr> <tr> <td>日本国公開実用新案公報</td> <td>1971 - 2023年</td> </tr> <tr> <td>日本国実用新案登録公報</td> <td>1996 - 2023年</td> </tr> <tr> <td>日本国登録実用新案公報</td> <td>1994 - 2023年</td> </tr> </table> <p>国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）</p> <p>CAplus/REGISTRY (STN)</p>			日本国実用新案公報	1922 - 1996年	日本国公開実用新案公報	1971 - 2023年	日本国実用新案登録公報	1996 - 2023年	日本国登録実用新案公報	1994 - 2023年							
日本国実用新案公報	1922 - 1996年																
日本国公開実用新案公報	1971 - 2023年																
日本国実用新案登録公報	1996 - 2023年																
日本国登録実用新案公報	1994 - 2023年																
<p>C. 関連すると認められる文献</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>引用文献の カテゴリー*</th> <th>引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示</th> <th>関連する 請求項の番号</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>A</td> <td>JP 2021-528473 A (シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー) 21.10.2021 (2021 - 10 - 21) 特に、特許請求の範囲、実施例</td> <td>1-5</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>JP 2021-521133 A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト) 26.08.2021 (2021 - 08 - 26) 特に、特許請求の範囲、実施例</td> <td>1-5</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>CN 108864075 A (NANKAI UNIVERSITY) 23.11.2018 (2018 - 11 - 23) 特に、特許請求の範囲、実施例</td> <td>1-5</td> </tr> <tr> <td>A</td> <td>JP 2013-532719 A (ゾエティス・エルエルシー) 19.08.2013 (2013 - 08 - 19) 特に、特許請求の範囲、実施例</td> <td>1-5</td> </tr> </tbody> </table> <p><input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input checked="" type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。</p> <p>* 引用文献のカテゴリー</p> <p>“A” 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの</p> <p>“E” 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの</p> <p>“L” 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）</p> <p>“O” 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献</p> <p>“P” 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献</p> <p>“T” 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と抵触するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの</p> <p>“X” 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの</p> <p>“Y” 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの</p> <p>“&amp;” 同一パテントファミリー文献</p>			引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号	A	JP 2021-528473 A (シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー) 21.10.2021 (2021 - 10 - 21) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5	A	JP 2021-521133 A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト) 26.08.2021 (2021 - 08 - 26) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5	A	CN 108864075 A (NANKAI UNIVERSITY) 23.11.2018 (2018 - 11 - 23) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5	A	JP 2013-532719 A (ゾエティス・エルエルシー) 19.08.2013 (2013 - 08 - 19) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号															
A	JP 2021-528473 A (シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー) 21.10.2021 (2021 - 10 - 21) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5															
A	JP 2021-521133 A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト) 26.08.2021 (2021 - 08 - 26) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5															
A	CN 108864075 A (NANKAI UNIVERSITY) 23.11.2018 (2018 - 11 - 23) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5															
A	JP 2013-532719 A (ゾエティス・エルエルシー) 19.08.2013 (2013 - 08 - 19) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5															
<p>国際調査を完了した日</p> <p>14.07.2023</p>	<p>国際調査報告の発送日</p> <p>22.08.2023</p>																
<p>名称及びあて先</p> <p>日本国特許庁(ISA/JP) 〒100-8915 日本国 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号</p>	<p>権限のある職員（特許庁審査官）</p> <p>安藤 倫世 4P 9837</p> <p>電話番号 03-3581-1101 内線 3492</p>																

C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリ*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 2015-532650 A (パイエル・クroppサイエンス・アクチエンゲゼルシャフト) 12.11.2015 (2015 - 11 - 12) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5
A	JP 2004-510765 A (ニューロジェン・コーポレーション) 08.04.2004 (2004 - 04 - 08) 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5
A	ACS Medicinal Chemistry Letters, 2021, 12(12), 1962-1967, DOI: 10.1021/ acsmedchemlett.1c00540 特に、特許請求の範囲、実施例	1-5

国際調査報告  
 パテントファミリーに関する情報

国際出願番号

PCT/JP2023/021894

引用文献	公表日	パテントファミリー文献	公表日
JP 2021-528473 A	21.10.2021	US 2021/0267203 A1 特に、特許請求の範囲、実施例 WO 2020/002563 A1 EP 3814332 A1 CN 112351978 A KR 10-2021-0028201 A	
JP 2021-521133 A	26.08.2021	US 2021/0147387 A1 特に、特許請求の範囲、実施例 WO 2019/197468 A1 EP 3774778 A1 EP 3904350 A1 EP 3904349 A1 CN 111989323 A KR 10-2020-0143367 A	
CN 108864075 A	23.11.2018	(ファミリーなし)	
JP 2013-532719 A	19.08.2013	US 2012/0035122 A1 特に、特許請求の範囲、実施例 WO 2012/017359 A1 EP 2601190 A1 KR 10-2013-0062333 A CN 103270036 A	
JP 2015-532650 A	12.11.2015	US 2015/0216168 A1 特に、特許請求の範囲、実施例 WO 2014/037340 A1 EP 2892345 A1 CN 104780764 A	
JP 2004-510765 A	08.04.2004	US 2003/0055037 A1 特に、特許請求の範囲、実施例 WO 2002/028839 A1 EP 1322620 A1 KR 10-2003-0060904 A	