

(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
2011 年 6 月 23 日(23.06.2011)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2011/074677 A1

- (51) 国際特許分類:
A01N 43/90 (2006.01) A01P 7/02 (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
A01N 47/40 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2010/072802
- (22) 国際出願日: 2010 年 12 月 17 日(17.12.2010)
- (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 2009-288224 2009 年 12 月 18 日(18.12.2009) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 石原産業株式会社 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目 3 番 1 5 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山元 一浩 (YAMAMOTO, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 植木 寿彦 (UEKI, Toshihiko) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社

中央研究所内 Shiga (JP). 岡本 智裕 (OKAMOTO, Tomohiro) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 渥美 省吾 (ATSUMI, Shogo) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 桐山 和久 (KIRIYAMA, Kazuhisa) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 吉田 幸太郎 (YOSHIDA, Kotaro) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 梅本 直 (UMEMOTO, Nao) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 小玉 哲也 (KODAMA, Tetsuya) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP).

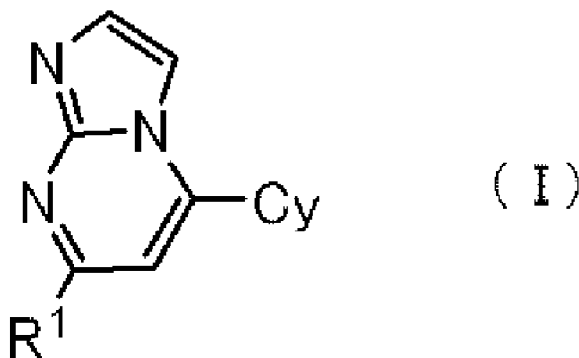
(74) 代理人: 泉名 謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒1010035 東京都千代田区神田紺屋町 1 7 番地 S I A 神田スクエア 4 階 Tokyo (JP).

(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, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO,

[続葉有]

(54) Title: IMIDAZOPYRIMIDINE DERIVATIVE OR SALT THEREOF, AND NOXIOUS ORGANISM CONTROL AGENT COMPRISING SAME

(54) 発明の名称: イミダゾピリミジン誘導体又はその塩、並びにそれらを含有する有害生物防除剤



(57) Abstract: Disclosed is a novel noxious organism control agent. Specifically disclosed is a noxious organism control agent comprising an imidazopyrimidine derivative represented by formula (I) [wherein Cy represents an aryl group substituted by X or a heteroaryl group substituted by X; and R¹ represents an unsubstituted alkyl group, an alkyl group substituted by A, an unsubstituted cycloalkyl group, a cycloalkyl group substituted by Q, an unsubstituted alkenyl group, an alkenyl group substituted by A, an unsubstituted alkynyl group, an alkynyl group substituted by A, a halogen atom, a cyano group, an aryl group, an unsubstituted heterocyclic group, a heterocyclic group substituted by an alkyl group, CH=NOR², CH=NNR⁴R⁵, COR², COOR², OR², S(O)ₙR³, NR⁴R⁵ or CONR⁴R⁵] or a salt thereof as an active ingredient.

(57) 要約: 新規な有害生物防除剤を提供する。式 (I): [式中、Cy は X で置換されたアリール又は X で置換されたヘテロアリールであり; R¹ は無置換若しくは A で置換されたアルキル、無置換若しくは Q で置換されたシクロアルキル、無置換若しくは A で置換されたアルケニル、無置換若しくは A で置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、CH=NOR²、CH=NNR⁴R⁵、COR²、COOR²、OR²、S(O)ₙR³、NR⁴R⁵又は CONR⁴R⁵である] で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤。

WO 2011/074677 A1



CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, 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, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- (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, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

明 細 書

発明の名称：

イミダゾピリミジン誘導体又はその塩、並びにそれらを含む有害生物防除剤

技術分野

[0001] 本発明は、イミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分として含む新規な有害生物防除剤に関する。

背景技術

[0002] 特許文献1には、有機電解発光素子として利用できるイミダゾピリミジン誘導体が記載されている。また、特許文献2には、イミダゾピリミジン誘導体が医薬として使用できることが記載されている。しかしながら、これらの文献には後記の一般式(1)で表されるイミダゾピリミジン誘導体の具体的な記載はなく、当該イミダゾピリミジン誘導体を有害生物防除剤として使用することについても記載はない。

先行技術文献

特許文献

[0003] 特許文献1：特許第4, 025, 468号明細書
特許文献2：米国特許第5, 037, 980号明細書

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分である、有害生物が抵抗性を獲得し、その使用が制限される等、種々の課題を有するものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤、例えば、農園芸分野で問題となる各種有害生物や、動物に寄生する有害生物を防除できる有害生物防除剤の開発が望まれている。

本発明の目的は、有害生物に対する高い防除効果を有し、哺乳動物等に対

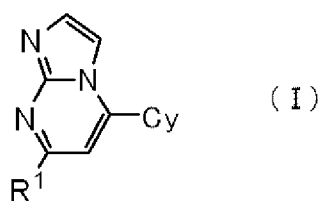
してはその使用に際し、高い安全性を有する有害生物防除剤を提供することである。

課題を解決するための手段

[0005] 本発明者らは、より優れた有害生物防除剤を見出すべく、イミダゾピリミジン誘導体について種々検討した。その結果、後記の式 (I) で表されるイミダゾピリミジン誘導体が、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有し、且つ、作物、有害生物の天敵或は哺乳動物に対する安全性を併せ持つことを見出し、本発明を完成した。

[0006] すなわち本発明は、式 (I) :

[0007] [化1]



〔式中、CyはXで置換されたアリール又はXで置換されたヘテロアリールであり；R¹は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、CH=NOR²、CH=NNR⁴R⁵、COR²、COOR²、OR²、S(O)_nR³、NR⁴R⁵又はCONR⁴R⁵であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、NR⁴R⁵、CONR⁴R⁵、S(O)_nR³、OR²、COR²、COOR²、アルコキシビニル、S(O)_m[N(CN)]R³又はC(R³)=NNG¹G²であり；Aはハロゲン原子、OR²、S(O)_nR³、OS(O)_nR³、NR⁴R⁵、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、SCH₂COOR²、NHNHNR⁴R⁵、COOR²、ニトロ又はCH(CN)₂であり；Qはハロゲン原子、OR²、S(O)_nR³、OS(O)_nR³、NR⁴R⁵、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、SCH₂COOR²、NHNHNR⁴R⁵

、 COOR^2 、ニトロ又は $\text{CH}(\text{CN})_2$ であり； R^2 は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^3 はアルキル、無置換若しくはハロゲン原子で置換されたアリール又はハロアルキルであり； R^4 は水素原子又はアルキルであり； R^5 は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 COOR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^2$ 又は CH_2CN であり； G^1 及び G^2 は各々独立に水素原子、アルキル又は COOR^3 であり、 G^1 及び G^2 は相互に結合して隣接する窒素原子と共に環を形成していてもよく； n は0～2の整数であり； m は0又は1の整数である。〕で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤、及びそれらを施用して有害生物を防除する方法に関する。

また、前記式（I）のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩に関する。

発明の効果

[0008] 式（I）のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤は、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有する。

発明を実施するための形態

[0009] 式（I）における C_y 及び R^1 中の置換基について、以下に詳述する。

X 、 A 及び Q の置換数は、各々1又は2以上であってよく、2以上の場合、同一でも相異なってもよい。また、 X 、 A 及び Q の置換位置は各々いずれの位置でもよい。

[0010] ハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲン原子の数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、各ハロゲン原子は同一でも相異なってもよい。また、ハロゲン原子の置換位置はいずれの位置でもよい。

アルキルとしては、直鎖状又は分枝状のいずれでもよく、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシルのような C_{1-6} のものなどが挙げられる。

シクロアルキルとしては、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロ

ペンチル、シクロヘキシルのような C_{3-6} のものなどが挙げられる。

- [0011] アルケニルとしては、直鎖状又は分枝状のいずれでもよく、例えばビニル、1-プロペニル、アリル、イソプロペニル、1-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ヘキセニルのような C_{2-6} のものなどが挙げられる。

アルキニルとしては、直鎖状又は分枝状のいずれでもよく、例えばエチニル、2-ブチニル、2-ペンチニル、3-メチル-1-ブチニル、2-ペンテン-4-イニル、3-ヘキシニルのような C_{2-6} のものなどが挙げられる。

アリールとしては、例えばフェニル、ナフチルのような C_{6-10} のものなどが挙げられる。

- [0012] ヘテロアリールとしては、単環ヘテロアリール又は縮合ヘテロアリールのいずれのものでもよく、O、S及びNからなる群より選ばれる少なくとも1種の原子を1~4含有していてよい。その具体例としては、フリル、チエニル、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリルのような5員ヘテロアリール；ピリジル、チアジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニルのような6員ヘテロアリール；ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、インドリル、イソインドリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、イミダゾピリジル、ナフチリジニル、プテリジニルのような8~10員縮合ヘテロアリールなどが挙げられる。

- [0013] 複素環基としては、単環式複素環基又は縮合複素環基のいずれのものでもよく、O、S及びNからなる群より選ばれる少なくとも1種の原子を1~4含有していてよい。その具体例としては、オキシラニルのような3員複素環基；フリル、テトラヒドロフリル、チエニル、ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、ジオキサラニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピラ

ゾリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリルなどの5員複素環基；ピラニル、ピリジル、ピペリジニル、ジオキサニル、オキサジニル、モルホリニル、チアジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピペラジニル、トリアジニルなどの6員複素環基；ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、ジヒドロイソベンゾチエニル、テトラヒドロベンゾチエニル、インドリル、イソインドリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾジオキサラニル、ベンゾジオキサニル、クロメニル、クロマニル、イソクロマニル、クロモニル、クロマノニル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、インドリジニル、キノリジニル、イミダゾピリジル、ナフチリジニル、プテリジニル、ジヒドロベンゾオキサジニル、ジヒドロベンゾオキサゾリノニル、ジヒドロベンゾオキサジノニル、ベンゾチオキサニルのような8～10員縮合複素環基などが挙げられる。

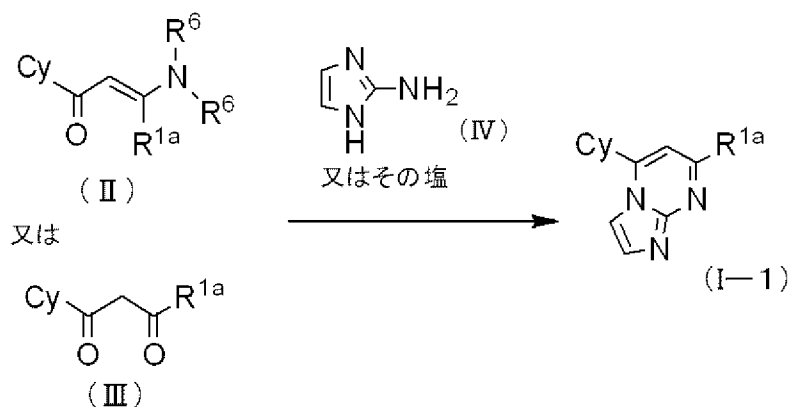
[0014] 式(I)のイミダゾピリミジン誘導体の塩としては、当該技術分野で許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば、ジメチルアンモニウム塩、トリエチルアンモニウム塩のようなアンモニウム塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

[0015] 式(I)のイミダゾピリミジン誘導体には、光学異性体、幾何異性体のような異性体が存在する場合があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。本発明においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、式(I)とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内であることは明らかである。

[0016] 式 (I) のイミダゾピリミジン誘導体又その塩 (以下、本発明化合物と略す) は、下記の製法 [1] ~ [12] 並びに通常 of 塩の製造方法に従って製造することができる。以下に各製法について、反応フローを示し詳述する。

製法 [1]

[0017] [化2]



[0018] 製法 [1] 中、 R^{1a} は無置換若しくは A^1 で置換されたアルキル、無置換若しくは Q^1 で置換されたシクロアルキル、無置換若しくは A^1 で置換されたアルケニル、無置換若しくは A^1 で置換されたアルキニル、アリール又は無置換若しくはアルキルで置換された複素環基であり； R^6 は各々独立にアルキルであり； A^1 はハロゲン原子、 OR^{2a} 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^{5a} 、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、 $\text{SCH}_2\text{COOR}^{2a}$ 、 $\text{NHN R}^4\text{R}^{5a}$ 又は $\text{CH}(\text{CN})_2$ であり； Q^1 はハロゲン原子、 OR^{2a} 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^{5a} 、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、 $\text{SCH}_2\text{COOR}^{2a}$ 、 $\text{NHN R}^4\text{R}^{5a}$ 又は $\text{CH}(\text{CN})_2$ であり； R^{2a} は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^{5a} は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、 COR^{2a} 、 COOR^{2a} 又は $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ であり； R^3 、 R^4 、 Cy 及び n は前述の通りである。式 (IV) の塩としては、当該技術分野で許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば塩酸塩、硫酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩；などが挙げられる。

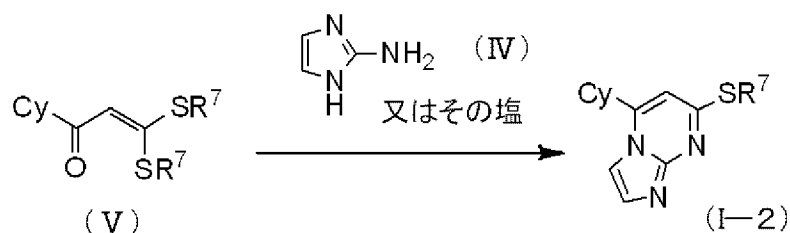
[0019] 本反応は、必要に応じ、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては

、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムのような酢酸塩；トリエチルアミン、ピリジンのような有機塩基；などから１種又は２種以上が適宜選択される。

[0020] 本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば酢酸、プロピオン酸のようなカルボン酸類；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンのような脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、１，２－ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；*N,N*－ジメチルホルムアミド、*N,N*－ジメチルアセトアミド、*N*－メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドのようなリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、１，２－ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられるが、中でもカルボン酸類が望ましい。反応温度は、通常５０～１５０℃、望ましくは８０～１２０℃である。反応時間は、通常０．５～１００時間である。

製法〔２〕

[0021] [化３]



[0022] 製法〔２〕中、 R^7 は各々独立にアルキルであり、 Cy は前述の通りである

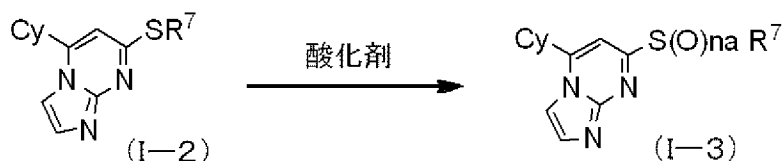
。

[0023] 本反応は、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；ナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムなどの酢酸塩；トリエチルアミン、ピリジンのような有機塩基；などから1種又は2種以上が適宜選択される。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば前記製法〔1〕と同様のものが挙げられる。反応温度は、通常60～200℃、望ましくは80～120℃である。反応時間は、通常0.1～10時間である。

。

[0024] 製法〔3〕

[0025] [化4]



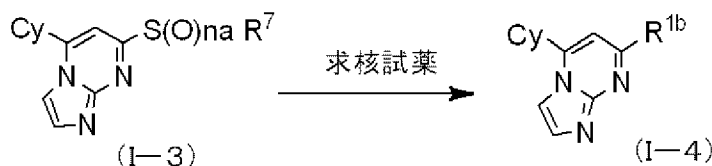
[0026] 製法〔3〕中、naは1又は2の整数であり、R⁷及びCyは前述の通りである。

[0027] 酸化剤としては、例えば過酸化水素、過酢酸、m-クロロ過安息香酸などが挙げられる。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば酢酸、プロピオン酸のようなカルボン酸類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。

。反応温度は、通常 -10°C ～反応混合物の還流温度、望ましくは $0\sim40^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、通常 $1\sim24$ 時間である。

製法〔4〕

[0028] [化5]



[0029] 製法〔4〕中、 R^{1b} は無置換若しくは A^1 で置換されたアルキル、無置換若しくは Q^1 で置換されたシクロアルキル、無置換若しくは A^1 で置換されたアルケニル、無置換若しくは A^1 で置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 SR^3 、 OR^{2a} 又は NR^4R^{5a} であり； R^{2a} 、 R^{5a} 、 R^3 、 R^4 、 R^7 、 A^1 、 Q^1 、 Cy 及び na は前述の通りである。

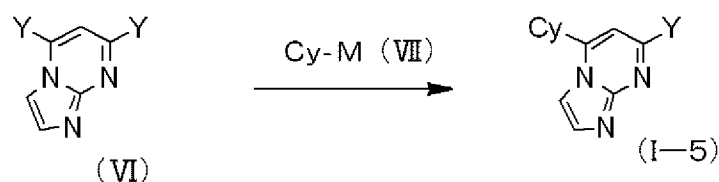
[0030] 求核試薬としては、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；ナトリウムチオメトキシドのようなアルカリ金属チオラート；メチルアミン、ジメチルアミン、ピペリジンのような一般式 $\text{HN R}^4\text{R}^{5a}$ 〔式中、 R^4 及び R^{5a} は前述の通りである〕で表されるアミン類；シアニ化ナトリウム、シアニ化カリウムのようなアルカリ金属シアニ化物；メチルマグネシウムブロミド、エチルマグネシウムブロミド、フェニルマグネシウムブロミドのような有機金属試薬；フッ化カリウム、フッ化セシウム、テトラブチルアンモニウムフルオリドのようなフッ素化剤；などが挙げられる。

[0031] 本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンのような脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4

ージオキサン、1, 2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は、通常 $-100 \sim 50^{\circ}\text{C}$ 、望ましくは $-70 \sim 30^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、通常1分～48時間である。

製法〔5〕

[0032] [化6]



[0033] 製法〔5〕中、Yはハロゲン原子であり；Mは $\text{B}(\text{OH})_2$ 、 $\text{B}(\text{OR}^8)_2$ 、 MgY^1 又は ZnY^1 であり； R^8 は各々独立にアルキルであり； Y^1 は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり；Cyは前述の通りである。Yのハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。 $\text{B}(\text{OR}^8)_2$ 中、 R^8 は相互に結合してホウ素原子を含む環を形成していてもよい。

[0034] 本反応は、必要に応じ、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウムのような金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸カルシウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；フッ化セシウム、フッ化カリウムのような金属フッ化物；トリエチルアミン、ピリジン、4-(N, N-ジメチルアミノ)ピリジンのような有機塩基；などから1種又は2種以上が適宜選択される。

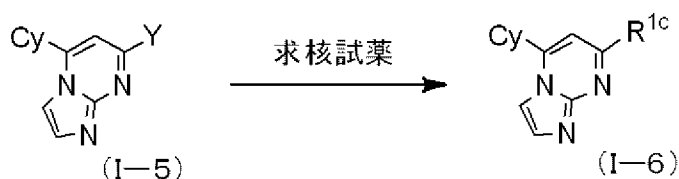
[0035] 本反応は、必要に応じ、金属触媒の存在下で行うことができる。金属触媒としては、例えば銅化合物、錫化合物、パラジウム化合物などが挙げられるが、中でもパラジウム化合物が望ましい。また、金属触媒を使用する場合、必要に応じ、助触媒が併用される。助触媒としては、例えば塩化リチウムの

ようなアルカリ金属ハロゲン化物などが挙げられる。金属触媒及び助触媒の組合せとしては、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムのようなパラジウム化合物及び塩化リチウムが挙げられる。

[0036] 本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば水；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンのような脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は、通常40℃～150℃、望ましくは60～120℃である。反応時間は、通常10～96時間である。式(VII)の化合物がホウ素化合物の場合は、市場で入手できるか、又は常法により合成することが可能である。例えば、Cy-B(OH)₂は、CyI、CyBr又はCyClのようなハロゲン化物とホウ酸トリメチルとをtert-ブチルリチウムのような塩基の存在下で反応させることにより合成できる。

製法〔6〕

[0037] [化7]



[0038] 製法〔6〕中、R¹ᶜは無置換若しくはA¹で置換されたアルキル、無置換若しくはQ¹で置換されたシクロアルキル、無置換若しくはA¹で置換されたアル

ケニル、無置換若しくはA¹で置換されたアルキニル、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、OR^{2a}、SR³又はNR⁴R^{5a}であり；R^{2a}、R³、R⁴、R^{5a}、A¹、Q¹、Y及びCyは前述の通りである。

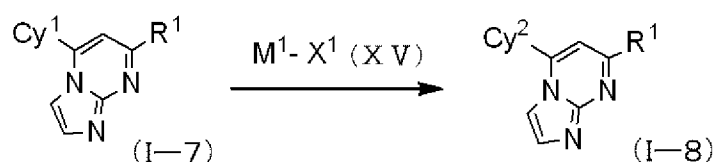
[0039] 求核試薬としては、例えば前記製法〔4〕で用いられる求核試薬中、フッ素化剤以外のものが挙げられる。

[0040] 本反応は、必要に応じ、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；トリエチルアミン、ピリジンのような有機塩基；などから1種又は2種以上が適宜選択される。

[0041] 本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば前記製法〔4〕と同様のものが挙げられる。反応温度は、通常−30℃～反応混合物の還流温度、望ましくは20～120℃である。反応時間は、通常10～96時間である。

製法〔7〕

[0042] [化8]



[0043] 製法〔7〕中、Cy¹はY¹で置換されたアリール又はY¹で置換されたヘテロアリールであり；Cy²はX¹で置換されたアリール又はX¹で置換されたヘテロアリールであり；X¹はアルコキシビニルであり；M¹はB(OH)₂、B(OR⁸)₂、SnR⁸₃、MgY¹、ZnY¹又はLiであり；R¹、R⁸及びY¹は前述の通りである。Cy¹及びCy²中のアリール又はヘテロアリールは、各々X^aで置換されていてもよい。X^aの置換数は各々1又は2以上であってよく、2以上の場合、同一でも相異なってもよい。またX^aの置換位置は各々い

ずれの位置でもよい。X^aはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、塩素、ハロアルキル、ニトロ、NR⁴R⁵、CONR⁴R⁵、S(O)_nR³、OR²又はCO₂R²である。

[0044] 本反応は、必要に応じ、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば前記製法〔5〕と同様のものが挙げられる。

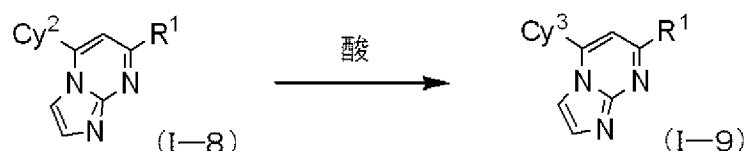
[0045] 本反応は、必要に応じ、金属触媒の存在下で行うことができる。金属触媒としては、例えば前記製法〔5〕と同様のものが挙げられるが、中でもパラジウム化合物が望ましい。

また、金属触媒を使用する場合、必要に応じ、助触媒が併用される。助触媒としては、例えば前記製法〔5〕と同様のものが挙げられる。金属触媒及び助触媒の組合せとしては、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムのようなパラジウム化合物及び塩化リチウムが挙げられる。

[0046] 本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば前記製法〔5〕と同様のものが挙げられる。反応温度は、通常50℃～反応混合物の還流温度、望ましくは80℃～反応混合物の還流温度である。反応時間は、通常1～96時間である。

製法〔8〕

[0047] [化9]



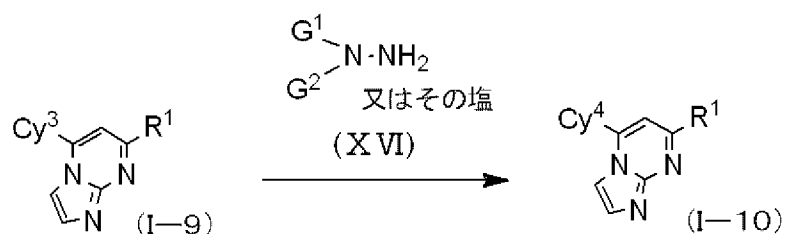
[0048] 製法〔8〕中、Cy³はアセチルで置換されたアリール又はアセチルで置換されたヘテロアリールであり；Cy²及びR¹は前述の通りである。Cy³中のアリール又はヘテロアリールは、X^aで置換されていてもよい。X^aの置換数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、同一でも相異なってもよい。またX^aの置換位置はいずれの位置でもよい。X^aは前述の通りである。

[0049] 酸としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸、リン酸、酢酸、p-トルエンスルホン酸などが挙げられる。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができ

る。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば水；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は、通常、室温～反応混合物の還流温度、望ましくは室温～70℃である反応時間は、通常1～24時間である。

製法〔9〕

[0050] [化10]



[0051] 製法〔9〕中、Cy⁴はC(CH₃)=NNG¹G²で置換されたアリール又はC(CH₃)=NNG¹G²で置換されたヘテロアリールであり；Cy³、R¹、G¹及びG²は前述の通りである。Cy⁴中のアリール又はヘテロアリールは、X^aで置換されていてもよい。X^aの置換数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、同一でも相異なってもよい。またX^aの置換位置はいずれの位置でもよい。X^aは前述の通りである。式(XVI)の塩としては、当該技術分野で許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば塩酸塩、硫酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩；などが挙げられる。

[0052] 本反応は、必要に応じ、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；ナトリウム、カリウム

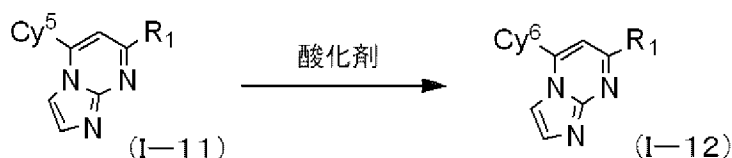
のようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類；ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのようなピリジン類；などから1種又は2種以上が適宜選択される。

[0053] 本反応は、必要に応じ、触媒量の酸の存在下で行うことができる。酸としては、例えば塩酸、硫酸、パラトルエンスルホン酸などが挙げられる。

[0054] 本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば、水；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドのようなリン酸アミド類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。また、これに加えて、本製法〔9〕で使用できる上記塩基の中で、アミン類又はピリジン類を溶媒として使用することもできる。反応温度は、通常、室温～反応混合物の還流温度、望ましくは50℃～反応混合物の還流温度である。反応時間は、通常1～24時間である。

製法〔10〕

[0055] [化11]

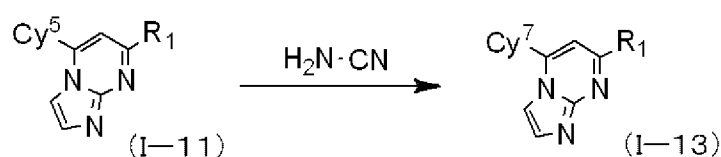


[0056] 製法〔10〕中、 Cy^5 は SR^3 で置換されたアリール又は SR^3 で置換されたヘテロアリールであり； Cy^6 は $S(O)_n a R^3$ で置換されたアリール又は $S(O)_n a R^3$ で置換されたヘテロアリールであり； R^1 、 R^3 及び $n a$ は前述の通りである。 Cy^5 及び Cy^6 中のアリール又はヘテロアリールは、各々 X^b で置換されていてもよい。 X^b の置換数は各々1又は2以上であってよく、2以上の場合、同一でも相異なってもよい。また X^b の置換位置は各々いずれの位置でもよい。 X^b はアルキル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 $NR^4 R^5$ 、 $CONR^4 R^5$ 、 $S(O)_2 R^3$ 、 OR^2 又は $CO_2 R^2$ である。

[0057] 酸化剤としては、例えば前記製法〔3〕と同様のものが挙げられる。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば前記製法〔3〕と同様のものが挙げられる。反応温度は、通常 $-10^{\circ}C$ ～反応混合物の還流温度、望ましくは $-10 \sim 50^{\circ}C$ である。反応時間は、通常1～24時間である。

製法〔11〕

[0058] [化12]



[0059] 製法〔11〕中、 Cy^7 は $S[N(CN)]R^3$ で置換されたアリール又は $S[N(CN)]R^3$ で置換されたヘテロアリールであり； Cy^5 、 R^1 及び R^3 は前述の通りである。 Cy^7 中のアリール又はヘテロアリールは、 X^b で置換されていてもよい。 X^b の置換数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、同一でも相異なってもよい。また X^b の置換位置はいずれの位置でもよい。 X^b は前述の通りである。

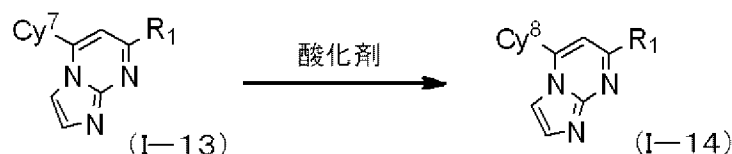
[0060] 本反応は、通常、酸化剤の存在下で行うことができる。酸化剤としては、例えばヨードベンゼンジアセタート、次亜塩素酸塩などが挙げられる。

[0061] 本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応

が進行する限り特に限定はなく、例えば、水；tert-ブチルアルコールのような第3級アルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は、通常-40～80℃、望ましくは-10～50℃である。反応時間は、通常0.5～25時間である。

製法〔12〕

[0062] [化13]



[0063] 製法〔12〕中、Cy⁸はS(O)[N(CN)]R³で置換されたアリール又はS(O)[N(CN)]R³で置換されたヘテロアリールであり；Cy⁷、R¹及びR³は前述の通りである。Cy⁸中のアリール又はヘテロアリールは、X^bで置換されていてもよい。X^bの置換数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、同一でも相異なってもよい。またX^bの置換位置は各々いずれの位置でもよい。X^bは前述の通りである。

[0064] 本反応は、通常、塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのような炭酸塩；重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウムのような重炭酸塩；などから1種又は2種以上が適宜選択される。

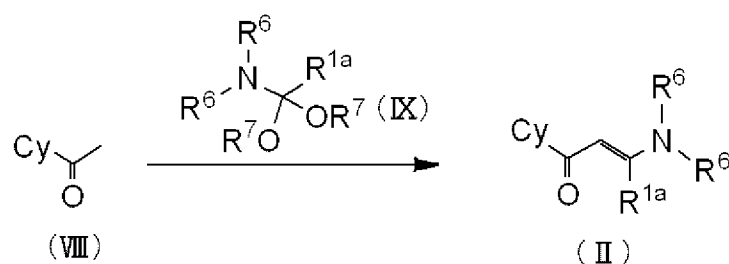
[0065] 酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸、四酸化ルテニウム、過マンガン酸塩などが挙げられる。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、例えば、水；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのようなアルコール類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；及びこ

これらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は、通常 $-10\sim 50^{\circ}\text{C}$ 、望ましくは $-10\sim 30^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、通常 $0.5\sim 24$ 時間である。

[0066] 製法〔1〕で使用される式(II)の化合物は、以下の製法〔A〕に従って製造できる。

製法〔A〕

[0067] [化14]



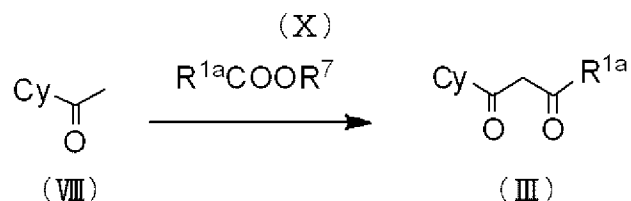
[0068] 製法〔A〕中、 R^{1a} 、 R^6 、 R^7 及びCyは前述の通りである。

[0069] 本反応は、必要に応じ、溶媒の存在下で行なうことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば前記製法〔2〕と同様のものが挙げられる。反応温度は、通常 $80\sim 200^{\circ}\text{C}$ 、望ましくは $100\sim 150^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、通常 $6\sim 48$ 時間である。製法〔A〕の反応終了後、式(II)の化合物を単離することなく、引き続き製法〔1〕の反応を行うことができる。

[0070] 製法〔1〕で使用される式(III)の化合物は、以下の製法〔B〕又は製法〔C〕に従って製造できる。

製法〔B〕

[0071] [化15]



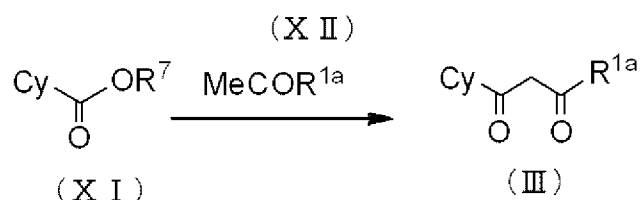
[0072] 製法〔B〕中、 R^{1a} 、 R^7 及びCyは前述の通りである。

[0073] 本反応は、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのような金属水素化物；水酸

化ナトリウム、水酸化カリウムのような金属水酸化物；ナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；などから1種又は2種以上が適宜選択される。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンのような脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、1, 2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのような酸アミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホランのようなスルホン類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられるが、中でもエーテル類が望ましい。反応温度は、通常0～70℃、望ましくは0～50℃である。反応時間は、通常5分～24時間である。製法〔B〕の終了後、式(III)の化合物を単離することなく、引き続き、製法〔1〕の反応を行うことができる。

製法〔C〕

[0074] [化16]



[0075] 製法〔C〕中、R^{1a}、R⁷及びCyは前述の通りである。

[0076] 本反応は、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば前記製法〔B〕と同様のものなどが挙げられる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば前記製法〔B〕と同様のものが挙げられるが、中でもエーテル類が望ましい。反応温度は、通常0～70℃

、望ましくは $0 \sim 50^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、通常5分～80時間である。

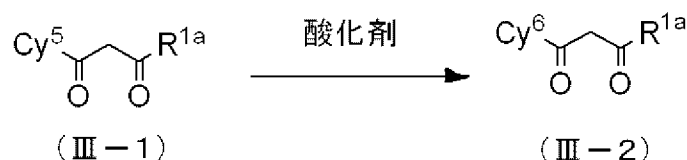
製法〔C〕の終了後、式(III)の化合物を単離することなく、引き続き、製法〔1〕の反応を行うことができる。

[0077] 式(XI)の化合物は、市場で入手できるか、又は常法により製造することが可能である。例えば、後記の合成例5(1)に示すように、カルボン酸誘導体を出発物とするエステル化反応によって製造することができる。

[0078] 上記の製法〔B〕又は製法〔C〕に従って製造される式(III)の化合物は、さらにCy中の置換基変換反応を行った後、製法〔1〕の反応に使用することもできる。例えば、スルホキシ誘導体又はスルホン誘導体である式(III-2)の化合物は、以下に示す製法〔C-1〕に従って、式(III-1)の化合物から製造することができ、製法〔1〕の反応の原料として使用することができる。

製法〔C-1〕

[0079] [化17]



[0080] 製法〔C-1〕中、 R^{1a} 、 Cy^5 及び Cy^6 は前述の通りである。

[0081] 酸化剤としては、例えば前記の製法〔3〕と同様のものが挙げられる。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えば前記の製法〔3〕と同様のものが挙げられる。反応温度は、通常 $-10^{\circ}\text{C} \sim$ 反応混合物の還流温度、望ましくは $-10 \sim 50^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、通常1～24時間である。製法〔C-1〕の終了後、式(III-2)の化合物を単離することなく、引き続き、製法〔1〕の反応を行うことができる。

[0082] 製法〔2〕で使用される式(V)の化合物は、以下の製法〔D〕に従って製造できる。

製法〔D〕

化リンなどが挙げられる。臭素化剤としては、例えばオキシ臭化リン、三臭化リンおよび五臭化リンなどが挙げられる。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えばトルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；スルホランのようなスルホン類；ジクロロメタンのようなハロゲン化炭化水素；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。また、過剰量の塩素化剤又は臭素化剤を溶媒として利用してもよい。反応温度は、通常 0°C ～反応混合物の還流温度、望ましくは $20\sim 100^{\circ}\text{C}$ である。反応時間は、通常 $1\sim 24$ 時間である。

[0091] (b) フッ素化剤としては、フッ化カリウムのようなアルカリ金属フッ化物；五フッ化アンチモン；三フッ化ジエチルアミノ硫黄；などが挙げられる。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；クラウンエーテルのようなエーテル類；N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミドのような酸アミド類；スルホランのようなスルホン類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。スルホラン又はN，N-ジメチルホルムアミドを溶媒として用いる場合には、フッ素化剤の脱水を助けるためにトルエンを共溶媒として用いるのが有利である。反応温度は、通常約 15°C ～反応混合物の還流温度、望ましくは 40°C ～反応混合物の還流温度である。反応時間は $1\sim 24$ 時間である。

[0092] (c) NH_3 との反応は、通常、塩基の存在下で行うことができるが、中でも過剰量の NH_3 を塩基として使用することが望ましい。本反応は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応が進行する限り特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、1，4-ジオキサン、1，2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1，2-ジクロロ

エタンのようなハロゲン化炭化水素類；及びこれらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は、通常20℃～反応混合物の還流温度であり、望ましくは40℃～反応混合物の還流温度である。反応時間は通常1～24時間である。

[0093] ジアゾ化剤としては、例えば亜硝酸のアルキルエステルなどが挙げられるが、中でも亜硝酸イソペンチルが望ましい。ジヨードメタンとの反応は、通常、溶媒の存在下で行なうことができる。溶媒としては反応が進行する限り特に限定はなく、例えば、ジアゾ化剤として亜硝酸のアルキルエステルを用いる場合、これをジヨードメタンとの共溶媒として使用することができる。反応温度は、通常-30℃～100℃、望ましくは-10～80℃であり、反応時間は、通常1～48時間である。（c）の各反応は、中間生成物の単離精製を行わずに連続して1つの容器で実施することができる。

[0094] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば農園芸分野で問題となる各種有害生物の防除剤、即ち農園芸用有害生物防除剤や、動物に寄生する有害生物の防除剤、即ち動物寄生生物防除剤として特に有用である。

[0095] 農園芸用有害生物防除剤としては、例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤として有用であるが、具体的には、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダニなどのような植物寄生性ダニ類；モモアカアブラムシ、ワタアブラムシなどのようなアブラムシ類；コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリリング、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、チャノコカクモンハマキ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、ウンカ類、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、タマナヤガ、カブラヤガ、アリ類などのような農業害虫類；ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシंगाレセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウなどのような植物寄生性線虫

類；ナメクジ、マイマイなどのような腹足類；ダンゴムシ、ワラジムシのような等脚類などのような土壌害虫類；イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカなどのような衛生害虫類；バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類などのような貯穀害虫類；イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類などのような衣類、家屋害虫類；ケナガコナダニ、コナヒョウダニ、ミナミツメダニなどのような屋内塵性ダニ類；などの防除に有効である。本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類などの防除に特に有効である。その中でも、植物寄生性ダニ類、農業害虫類の防除にさらに優れた効果を示すため、殺虫剤又は殺ダニ剤として有用である。また、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤、ネオニコチノイド剤などの薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有効である。さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤を土壌に処理することによって土壌有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に茎葉部の害虫類をも防除することができる。

[0096] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様としては、前記した植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類、腹足類、土壌害虫類などを総合的に防除する農園芸用有害生物防除剤が挙げられる。

[0097] 本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、通常、該化合物と各種農業上の補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、顆粒水溶剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤などの種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト、セリサイト、クレイ、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉などの固形担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサ

ン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコールなどの溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸塩ホルムアルデヒド縮合物のような陰イオン系の界面活性剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤；オリーブ油、カポック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油；などが挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用す

ることができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤、など通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は0.001 : 99.999～95 : 5、望ましくは0.005 : 99.995～90 : 10である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油など）を添加して使用することができる。

[0098] 本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤の施用は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に0.05～800,000ppm、望ましくは0.5～500,000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1ヘクタール当り本発明化合物が0.05～50,000g、望ましくは1～30,000gである。本発明には、このような施用方法による有害生物の防除方法、特に植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類の防除方法も含まれる。

[0099] 本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤の種々の製剤、又はその希釈物の施用は、通常、一般に行なわれている施用方法すなわち、散布（例えば、噴霧、ミスティング、アトマイジング（Atomizing）、散粒、水面施用等）、土壌施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）、浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫の発生及び生育を阻害することも可能である。また、いわゆる超高濃度少量散布法（ultra low volume application method）により施用することもできる。この方法においては、活性成分を100%含有することが可能である。

[0100] また、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤などと混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、抗生物質

、植物ホルモン、植物成長調整剤、などが挙げられる。特に、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用或は併用した混合有害生物防除用組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような混合有害生物防除用組成物も含まれる。

[0101] 本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物との混合比（重量比）は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に1：300～300：1、望ましくは1：100～100：1である。また、施用適量は1ヘクタール当りの総有効成分化合物量として0.1～50,000g、望ましくは1～30,000gである。本発明には、このような混合有害生物防除用組成物の施用方法による有害生物の防除方法も含まれる。

[0102] 上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤の有効成分化合物（一般名；一部申請中を含む、又は試験コード）としては、例えばプロフェノホス（profenofos）、ジクロロボス（dichlorvos）、フェナミホス（fenamiphos）、フェニトロチオン（fenitrothion）、EPN、ダイアジノン（diazinon）、クロルピリホス（chlorpyrifos）、クロルピリホスメチル（chlorpyrifos-methyl）、アセフェート（acephate）、プロチオホス（prothiofos）、ホスチアゼート（fosthiazate）、カズサホス（cadusafos）、ジスルホトン（disulfoton）、イソキサチオン（isoxathion）、イソフェンホス（isofenphos）、エチオン（ethion）、エトリムホス（etrimfos）、キナルホス（quinalphos）、ジメチルビンホス（dimethylvinphos）、ジメトエート（dimethoate）、スルプロホス（sulprofos）、チオメトン（thiometon）、バミドチオン（vamidothion）、ピラクロホス（pyraclofos）、ピリダフェンチオン（pyridaphenthion）、ピリミホスメチル（pirimiphos-methyl）、プロパホス（propaphos）、ホサロン（phosalone）、ホルモチオン（formothion）、マラチオン（malathion）、テトラクロルビンホス（tetrachlorvinphos）、クロルフェンビンホス（chlorfenvinphos）

)、シアノホス(cyanophos)、トリクロロホン(trichlorfon)、メチダチオン(methidathion)、フェントエート(phenthoate)、ESP、アジンホスメチル(azinphos-methyl)、フェンチオン(fenthion)、ヘプテノホス(heptenophos)、メトキシクロル(methoxychlor)、パラチオン(parathion)、ホスホカルブ(phosphocarb)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、モノクロトホス(monocrotophos)、メタミドホス(methamidophos)、イミシアホス(imicyafos)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、テルブホス(terbufos)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホスメット(phosmet)、ホレート(phorate)のような有機リン酸エステル系化合物；

カルバリル(carbaryl)、プロポキスル(propoxur)、アルジカルブ(aldicarb)、カルボフラン(carbofuran)、チオジカルブ(thiodicarb)、メソミル(methomyl)、オキサミル(oxamyl)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、ピリミカルブ(pirimicarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、カルボスルファン(carbosulfan)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoproc carb)、メトルカルブ(metolcarb)、キシリルカルブ(xylylcarb)、XMC、フェノチオカルブ(fenothiocarb)のようなカーバメート系化合物；

カルタップ(cartap)、チオシクラム(thiocyclam)、ベンスルタップ(bensultap)、チオスルタップナトリウム(thiosultap-sodium)のようなネライストキシン誘導体；

ジコホル(dicofol)、テトラジホン(tetradifon)、エンドスルファン(endosulfan)、ジエノクロル(dienochlor)、ディルドリン(dieldrin)のような有機塩素系化合物；

[0103] 酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、シヘキサチン(cyhexatin)のような有機金属系化合物；

フェンバレレート(fenvalerate)、ペルメトリン(permethrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、テフルトリン(tefluthrin)、エトフェンプロックス(et

hofenprox)、フルフェンプロックス (flufenprox)、シフルトリン (cyfluthrin)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルバリネート (fluvalinate)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、ラムダ-シハロトリン (lambda-cyhalothrin)、ピレトリン (pyrethrins)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、テトラメトリン (tetramethrin)、レスメトリン (resmethrin)、プロトリフェンブト (protrifenbute)、ビフェントリン (bifenthrin)、ゼータ-シペルメトリン (zeta-cypermethrin)、アクリナトリン (acrinathrin)、アルファ-シペルメトリン (alpha-cypermethrin)、アレスリン (allethrin)、ガンマ-シハロトリン (gamma-cyhalothrin)、シータ-シペルメトリン (theta-cypermethrin)、タウ-フルバリネート (tau-fluvalinate)、トラロメトリン (tralomethrin)、プロフルトリン (profluthrin)、ベータ-シペルメトリン (beta-cypermethrin)、ベータ-シフルトリン (beta-cyfluthrin)、メトフルトリン (metofluthrin)、フェノトリン (phenothrin)、フルメトリン (flumethrin) のようなピレスロイド系化合物；

ジフルベンズロン (diflubenzuron)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、トリフルムロン (triflumuron)、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)、ビストリフルロン (bistrifluron)、フルアズロン (fluazuron) のようなベンゾイルウレア系化合物；

メトプレン (methoprene)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、ジオフェノラン (diofenolan) のような幼若ホルモン様化合物；

フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フィプロニル (fipronil)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、エチプロール (ethiprole)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、アセトプロール (acetoprole)、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピリプロール (pyriprole) のようなピラゾール系化合物；

イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、アセタミプリド (acetamiprid)、チアクロプリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、クロチアニジン (clothianidin)、ジノテフラン (dinotefuran)、ニチアジン (nithiazine) のようなネオニコチノイド；

テブフェノジド (tebufenozide)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、クロマフェノジド (chromafenozide)、ハロフェノジド (halofenozide) のようなヒドラジン系化合物；

[0104] ピリダリル (pyridalyl)、フロニカミド (flonicamid) のようなピリジン系化合物；

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) のような環状ケトエノール系化合物；

フルアクリピリム (fluacrypyrim) のようなストロビルリン系化合物；

フルフェネリム (flufenerim) のようなピリミジナミン系化合物；

ジニトロ系化合物；有機硫黄化合物；尿素系化合物；トリアジン系化合物；ヒドラゾン系化合物；また、その他の化合物として、ブプロフェジン (buprofezin)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、アミトラズ (amitraz)、クロルジメホルム (chlordimeform)、シラフルオフエン (silaflofen)、トリアザメート (triazamate)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、インドキサカルブ (indoxacarb)、アセキノシル (acequinocyl)、エトキサゾール (etoxazole)、シロマジン (cyromazine)、1,3-ジクロロプロペン (1,3-dichloropropene)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、ビフェナゼート (bifenazate)、プロパルギット (propargite)、クロフェンテジン (clofentezine)、メタフルミゾン (metaflumizone)、フルベンジアミド (flubendiamide)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、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)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、ピリフルキナゾ

ン(pyrifluquinazon)、フェナザキン(fenazaquin)、ピリダベン (pyridaben)、アミドフルメト (amidoflumet)、スルフルラミド (sulfluramid)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、メタルデヒド (metaldehyde)、HGW 86、リアノジン (ryanodine)、ベルブチン (verbutin)、シプロペン (cyproprone) のような化合物；などが挙げられる。更に、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis* 又は

*Bacillus thuringiensis*が生成する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤などのような微生物農薬；アベルメクチン (avermectin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、ミルベメクチン (milbemectin)、ミルベマイシン (milbemycin)、スピノサド (spinosad)、イベルメクチン (ivermectin)、レピメクチン (lepipmectin)、DE-175、アバメクチン (abamectin)、エマメクチン (emamectin)、スピネトラム (spinetoram) のような抗生物質及び半合成抗生物質；アザディラクチン (azadirachtin)、ロテノン (rotenone) のような天然物；ディート (deet) のような忌避剤；などが挙げられる。

[0105] 上記他の農薬中の、殺菌剤の有効成分化合物（一般名；一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会供試試験コード）としては、例えば、メパニピリム (mepanipirim)、ピリメサニル (pyrimethanil)、シプロジニル (cyprodinil) のようなアニリノピリミジン系化合物；

5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジンのようなトリアゾロピリミジン系化合物；

フルアジナム (fluazinam) のようなピリジナミン系化合物；

トリアジメホン (triadimefon)、ビテルタノール (bitertanol)、トリフルミゾール (triflumizole)、エタコナゾール (etaconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、ペンコナゾール (penconazole)、フルシラゾー

ル (flusilazole)、マイクロブタニル (myclobutanil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ファーコナゾールシス (furconazole - cis)、プロクロラズ (prochloraz)、メトコナゾール (metconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、オキシポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、シプロコナゾール (sipconazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、フルトリアホル (flutriafol)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、トリシクラゾール (tricyclazole)、プロベナゾール (probenazole)、シメコナゾール (simeconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、イプコナゾール (ipconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole) のようなアゾール系化合物；

[0106] キノメチオネート (quinomethionate) のようなキノキサリン系化合物；

マンネブ (maneb)、ジネブ (zineb)、マンゼブ (mancozeb)、ポリカーバメート (polycarbamate)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チラム (thiram) のようなジチオカーバメート系化合物；

フサライド (fthalide)、クロロタロニル (chlorothalonil)、キントゼン (quintozene) のような有機塩素系化合物；

ベノミル (benomyl)、チオファネートメチル (thiophanate - methyl)、カーベンダジム (carbendazim)、チアベンダゾール (thiabendazole)、フベリアゾール (fuberiazole)、シアゾファミド (cyazofamid) のようなイミダゾール系化合物；

シモキサニル (cymoxanil) のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルーM (metalaxyl-M)、メフェノキサム (mefenoxam)、オキサジキシル (oxadixyl)、オフレース (ofurace)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルーM (benalaxyl-M、別名キラ

ラキシル(kiralaxyl、chiralaxyl))、フララキシル(furalaxyl)、シプロフラム(cyprofuram)、カルボキシン(carboxin)、オキシカルボキシン(oxyarboxin)、チフルザミド(thifluzamide)、ボスカリド(boscalid)、イソチアニル(isothianil)、ビキサフェン(bixafen)、チアジニル(tiadinil)、セダキサン(sedaxane)のようなアニリド系化合物；

[0107] ジクロフルアニド(dichlofluanid)のようなスルファミド系化合物；

水酸化第二銅(cupric hydroxide)、有機銅(oxine copper)のような銅系化合物；

ヒメキサゾール(hymexazol)のようなイソキサゾール系化合物；

ホセチルアルミニウム(fosetyl - Al)、トルクロホスメチル(tolclofos - methyl)、エジフェンホス(edifenphos)、イプロベンホス(iprobenfos)、S-ベンジル O, O-ジイソプロピルホスホロチオエート、O-エチル S, S-ジフェニルホスホロジチオエート、アルミニウムエチルハイドロゲンホスホネートのような有機リン系化合物；

キャプタン(captan)、キャプタホル(captafol)、フォルペット(folpet)のようなフタルイミド系化合物；

プロシミドン(procymidone)、イプロジオン(iprodione)、ビンクロゾリン(vinclozolin)のようなジカルボキシイミド系化合物；

[0108] フルトラニル(flutolanil)、メプロニル(mepronil)のようなベンズアニリド系化合物；

ペンチオピラド(penthiopyrad)、3-(ジフロロメチル)-1-メチル-N-[(1RS, 4SR, 9RS)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-イソプロピル-1, 4-メタノナフタレン-5-イル]ピラゾール-4-カルボキサミドの2種のシン異性体と3-(ジフロロメチル)-1-メチル-N-[(1RS, 4SR, 9SR)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-9-イソプロピル-1, 4-メタノナフタレン-5-イル]ピラゾール-4-カルボキサミドの2種のアンチ異性体の混合物(イソピラザム(isopyrazam))、シルチオファム(silthiopham)、フェノキサニル(fenoxanil)のようなアミド系化合物；

フルオピラム(fluopyram)、ゾキサミド(zoxamid)のようなベンズアミド

系化合物；

トリホリン (triforine) のようなピペラジン系化合物；

ピリフェノックス (pyrifenoX) のようなピリジン系化合物；

フェナリモル (fenarimol) のようなカルビノール系化合物；

フェンプロピディン (fenpropidine) のようなピペリジン系化合物；

フェンプロピモルフ (fenpropimorph) 、トリデモルフ (tridemorph) のようなモルフォリン系化合物；

[0109] フェンチンヒドロキシド (fentin hydroxide) 、フェンチンアセテート (fentin acetate) のような有機スズ系化合物；

ペンシキュロン (pencycuron) のような尿素系化合物；

ジメトモルフ (dimethomorph) 、フルモルフ (flumorph) のようなシンナミック酸系化合物；

ジエトフェンカルブ (diethofencarb) のようなフェニルカーバメート系化合物；

フルジオキサニル (fludioxonil) 、フェンピクロニル (fenpiclonil) のようなシアノピロール系化合物；

アゾキシストロビン (azoxystrobin) 、クレソキシムメチル (kresoxim - methyl) 、メトミノフェン (metominofen) 、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin) 、ピコキシストロビン (picoxystrobin) 、オリザストロビン (oryzastrobin) 、ジモキシストロビン (dimoxystrobin) 、ピラクロストロビン (pyraclostrobin) 、フルオキサストロビン (fluoxastrobin) のようなストロビルリン系化合物；

[0110] ファモキサドン (famoxadone) のようなオキサゾリジノン系化合物；

エタボキサム (ethaboxam) のようなチアゾールカルボキサミド系化合物；

イプロバリカルブ (iprovalicarb) 、ベンチアバリカルブーイソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl) のようなバリンアミド系化合物；

メチル N-(イソプロポキシカルボニル)-L-バリル-(3RS)-3-(4-クロロフェニル)- β -アラニナート (valiphenalate) のようなアシルアミノアシッド系

化合物；

フェナミドン (fenamidone) のようなイミダゾリノン系化合物；

フェンヘキサミド (fenhexamid) のようなヒドロキシアニリド系化合物

；

フルスルファミド (flusulfamide) のようなベンゼンスルホンアミド系化合物；

シフルフェナミド (cyflufenamid) のようなオキシムエーテル系化合物；

アントラキノン系化合物；

クロトン酸系化合物；

バリダマイシン (validamycin) 、カスガマイシン (kasugamycin) 、ポリオキシン (polyoxins) のような抗生物質；

イミノクタジン (iminooctadine) 、ドディン (dodine) のようなグアニジン系化合物；

6-ターシャリーブチル-8-フルオロ-2, 3-ジメチルキノリン-4-イル アセテート (tebufloquin) のようなキノリン系化合物；

(Z)-2-(2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) フェニルチオ)-2-(3-(2-メトキシフェニル) チアゾリジン-2-イルイデン) アセトニトリル (フルチアニル (flutianil)) のようなチアゾリジン系化合物；

[0111] また、その他の化合物として、イソプロチオラン (isoprothiolane) 、ピロキロン (pyroquilon) 、ジクロメジン (diclomezine) 、キノキシフェン (quinoxifen) 、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) 、クロルピクリン (chloropicrin) 、ダゾメット (dazomet) 、メタムナトリウム塩 (metam - sodium) 、ニコビフェン (nicobifen) 、メトラフェノン (metrafenone) 、UBF-307、ジクロシメット (diclocymet) 、プロキンアジド (proquinazid) 、アミスルブロム (amisulbrom) 、ピリオフェノン (pyriofenone) 、ピリベンカルブ (pyribencarb) 、マンジプロパミド (mandipropamid) 、フルオピコリド (fluopicolide) 、カルプロパミド (carpropamid) 、メプチルジノカップ (meptyldinocap) 、フェリムゾン (ferimzone) 、スピロキ

サミン (spiroxamine)、S-2188 (fenpyrazamine)、S-2200、ZF-9646、BCF-051、BCM-061、BCM-062；などが挙げられる。

[0112] その他、本発明化合物と混用或いは併用することが可能な農薬としては、例えば、The Pesticide Manual (第15版)に記載されているような除草剤の有効成分化合物、特に土壌処理型のものなどがある。

[0113] 動物寄生生物防除剤としては、例えば、宿主動物の体表(背、腋下、下腹部、内股部など)に寄生する外部寄生生物や、宿主動物の体内(胃、腸管、肺、心臓、肝臓、血管、皮下、リンパ組織など)に寄生する内部寄生生物の防除に有効であるが、中でも、外部寄生生物の防除に有効である。

[0114] 外部寄生生物としては、例えば、動物寄生性のダニやノミなどが挙げられる。これらの種類は非常に多く、全てを列記することが困難であるので、その一例を挙げる。

[0115] 動物寄生性のダニとしては、例えばオウシマダニ (Boophilus microplus)、クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus)、フタトゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis)、キチマダニ (Haemaphysalis flava)、ツリガネチマダニ (Haemaphysalis campanulata)、イスカチマダニ (Haemaphysalis concinna)、ヤマトチマダニ (Haemaphysalis japonica)、ヒゲナガチマダニ (Haemaphysalis kitaokai)、イヤスチマダニ (Haemaphysalis ias)、ヤマトマダニ (Ixodes ovatus)、タネガタマダニ (Ixodes nipponensis)、シュルツェマダニ (Ixodes persulcatus)、タカサゴキラマダニ (Amblyomma testudinarium)、オオトゲチマダニ (Haemaphysalis megaspinosa)、アミノカクマダニ (Dermacentor reticulatus)、タイワンカクマダニ (Dermacentor taiwanensis) のようなマダニ類；ワクモ (Dermanyssus gallinae)；トリサシダニ (Ornithonyssus sylviarum)、ミナミトリサシダニ (Ornithonyssus bursa) のようなトリサシダニ類；ナンヨウツツガムシ (Eutrombicula wichianni)、アカツツガムシ (Leptotrombidium akamushi)、フトゲツツガムシ (Leptotrombidium pallidum)、フジツツガムシ (Leptotrombidium fuji)、トサツツガムシ (Leptotrombidium tosa)、ヨーロッパアキダニ

(Neotrombicula autumnalis)、アメリカツツガムシ (Eutrombicula alfreddugesi)、ミヤガワタマツツガムシ (Helenicula miyagawai) のようなツツガムシ類；イヌツメダニ (Cheyletiella yasguri)、ウサギツメダニ (Cheyletiella parasitivorax)、ネコツメダニ (Cheyletiella blakei) のようなツメダニ類；ウサギキュウセンダニ (Psoroptes cuniculi)、ウシシヨクヒダニ (Chorioptes bovis)、イヌミミヒゼンダニ (Otodectes cynotis)、ヒゼンダニ (Sarcoptes scabiei)、ネコシヨウセンコウヒゼンダニ (Notoedres cati) のようなヒゼンダニ類；イヌニキビダニ (Demodex canis) のようなニキビダニ類などが挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、マダニ類などの防除に特に有効である。

[0116] 動物寄生性のノミとしては、例えば、ノミ目 (Siphonaptera) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (Pulicidae)、ナガノミ科 (Ceratophyllus) などに属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、ヒトノミ (Pulex irritans)、ニワトリフトノミ (Echidnophaga gallinacea)、ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis)、メクラネズミノミ (Leptopsylla segnis)、ヨーロッパネズミノミ (Nosopsyllus fasciatus)、ヤマトネズミノミ (Monopsyllus anisus)；などが挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、ヒトノミ科に属するノミ類、特にイヌノミ、ネコノミなどの防除に有効である。

[0117] その他の外部寄生生物としては、例えば、ウシジラミ、ウマジラミ、ヒツジジラミ、ウシホソジラミ、アタマジラミのようなシラミ類；イヌハジラミのようなハジラミ類；ウシアブ、ウアイヌカカ、ツメトゲブユのような吸血性双翅目害虫などが挙げられる。また、内部寄生生物としては、例えば、肺虫、ベンチュウ、結節状ウオーム、胃内寄生虫、回虫、糸状虫類のような線虫類；マンソン裂頭条虫、広節裂頭条虫、瓜実条虫、多頭条虫、単包条虫、多包条虫のような条虫類；日本住血吸虫、肝蛭のような吸虫類；コクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、クリプトスポリジウム

のような原生動物など；が挙げられる。

[0118] 宿主動物としては、種々の愛玩動物、家畜、家禽などが挙げられ、より具体的には、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ハムスター、モルモット、リス、ウサギ、フェレット、鳥（例えば、ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリアなど）、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、アヒル、ニワトリ、などが挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、愛玩動物又は家畜に寄生する有害生物、特に外部寄生生物の防除に有効である。愛玩動物又は家畜の中ではイヌ、ネコ、ウシ又はウマに特に有効である。

[0119] 本発明化合物を動物寄生生物防除剤として使用する際、そのまま使用してもよく、また、適当な補助剤と共に粉剤、粒剤、錠剤、散剤、カプセル剤、液状剤、乳剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤などの種々の形態に製剤して使用することもできる。尚、前記製剤形態以外にも、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、前記した農園芸用有害生物防除剤の製剤用補助剤として例示した陰イオン系の界面活性剤や非イオン系の界面活性剤；セチルトリメチルアンモニウムブロミドのような陽イオン系の界面活性剤；水、アセトン、アセトニトリル、N-メチルアセトアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、2-ピロリドン、N-メチル-2-ピロリドン、ケロシン、トリアセチン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、液体ポリオキシエチレングリコール、ブチルジグリコール、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールノルマルブチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールノルマルブチルエーテルのような溶剤；ブチルヒドロキシアニソール、ブチルヒドロキシトルエン、アスコルビン酸、メタ亜硫酸水素ナトリウム、プロピル没食子酸塩、チオ硫酸ナトリ

ウムのような酸化防止剤；ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、酢酸ビニルとビニルピロリドンのコポリマーのような被膜形成剤；前記した農園芸用有害生物防除剤の製剤用補助剤として例示した植物油や鉱物油；乳糖、蔗糖、ブドウ糖、澱粉、麦粉、コーン粉、大豆油粕、脱脂米糠、炭酸カルシウム、その他市販の飼料原料のような担体；などが挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、１種又は２種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選択して使用することもでき、更には、前記した農園芸分野で使用される各種補助剤などから適宜選択して使用することもできる。

[0120] 本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は、通常、0.1：99.9～90：10程度である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油など）を添加して使用することができる。

[0121] 宿主動物への本発明化合物の投与は、経口又は非経口によって行われる。経口投与方法としては、例えば本発明化合物を含有する錠剤、液状剤、カプセル剤、ウエハース、ビスケット、ミンチ肉、その他の飼料等を投与する方法などが挙げられる。非経口投与方法としては、例えば本発明化合物を適当な製剤に調製した上で、静注投与、筋肉内投与、皮内投与、皮下投与等により体内に取り込ませる方法；スポットオン（spot-on）処理、ポワオン（pour-on）処理、スプレー処理等により体表面に投与する方法；宿主動物の皮下に本発明化合物を含有する樹脂片等を埋め込む方法などが挙げられる。

[0122] 宿主動物への本発明化合物の投与量は、投与方法、投与目的、疾病症状等によって異なるが、通常、宿主動物の体重 1 Kg に対して 0.01 mg～100 g、望ましくは 0.1 mg～10 g の割合で投与するのが適当である。

[0123] 本発明には、前記したような投与方法又は投与量による有害生物の防除方法、特に外部寄生生物又は内部寄生生物の防除方法も含まれる。

[0124] また、本発明においては、前述のようにして動物寄生性の有害生物を防除

することにより、それらに起因する宿主動物の各種疾患を予防又は治療できる場合がある。このように、本発明には、本発明化合物を有効成分として含有する寄生生物起因動物疾患の予防又は治療剤並びに、寄生生物起因動物疾患を予防又は治療する方法も含まれる。

[0125] 本発明化合物を動物寄生生物防除剤として使用する際、補助剤と共に各種ビタミン類、ミネラル類、アミノ酸類、栄養剤、酵素製剤、解熱剤、鎮静剤、消炎剤、殺菌剤、着色剤、芳香剤、保存剤等と混用又は併用することができる。また、必要に応じて他の各種動物薬や農薬、例えば駆虫剤、抗コクシジウム剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺ノミ剤、殺線虫剤、殺菌剤、抗菌剤などと混用又は併用することができ、この場合に一層優れた効果を示すこともある。本発明には、前記したような各種成分を混用又は併用した混合有害生物防除用組成物が含まれ、また、それを使用した有害生物の防除方法、特に外部寄生生物又は内部寄生生物の防除方法も含まれる。

[0126] 次に本発明の望ましい態様の一例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

(1) 式(I)中、 C_y はXで置換されたアリール又はXで置換されたヘテロアリールであり； R^1 は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NO R^2$ 、 $CH=NNR^4R^5$ 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 又は $CONR^4R^5$ であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 $CONR^4R^5$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 OR^2 、 COR^2 又は $COOR^2$ であり；Aはハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 $OS(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHNR^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又は $CH(CN)_2$ であり；Qはハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 $OS(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、 SCH_2CO

OR^2 、 $NHNR^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又は $CH(CN)_2$ であり； R^2 は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^3 はアルキルであり； R^4 は水素原子又はアルキルであり； R^5 は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 $CH_2CH_2OR^2$ 又は CH_2CN であり； n は0～2の整数である、イミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。

[0127] (2) 式 (I) 中、 Cy は X で置換されたアリール又は X で置換されたヘテロアリールであり； R^1 は無置換若しくは A で置換されたアルキル、無置換若しくは Q で置換されたシクロアルキル、無置換若しくは A で置換されたアルケニル、無置換若しくは A で置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NOR^2$ 、 $CH=NNR^4R^5$ 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 又は $CONR^4R^5$ であり； X はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 $CONR^4R^5$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 OR^2 、 COR^2 又は $COOR^2$ であり； A はハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 $OS(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHNR^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又は $CH(CN)_2$ であり； Q はハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 $OS(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHNR^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又は $CH(CN)_2$ であり； R^2 は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^3 はアルキルであり； R^4 は水素原子又はアルキルであり； R^5 は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 $CH_2CH_2OR^2$ 又は CH_2CN であり； n は0～2の整数である、イミダゾピリミジン誘導体又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

[0128] (3) 式 (I) 中、 Cy は X で置換されたアリール又は X で置換されたヘテ

ロアリールであり； R^1 は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NO R^2$ 、 $CH=NNR^4R^5$ 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 又は $CONR^4R^5$ であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 $CONR^4R^5$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 OR^2 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、アルコキシビニル、 $S(O)_m[N(CN)]R^3$ 又は $C(R^3)=NNG^1G^2$ であり；Aはハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 $OS(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHNR^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又は $CH(CN)_2$ であり；Qはハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 $OS(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHNR^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又は $CH(CN)_2$ であり； R^2 は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^3 はアルキル、無置換若しくはハロゲン原子で置換されたアリール又はハロアルキルであり； R^4 は水素原子又はアルキルであり； R^5 は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 $CH_2CH_2OR^2$ 又は CH_2CN であり； G^1 及び G^2 は各々独立に水素原子、アルキル又は $COOR^3$ であり、 G^1 及び G^2 は相互に結合して隣接する窒素原子と共に環を形成していてもよく；nは0～2の整数であり；mは0又は1の整数である、イミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0129] (4) 式(I)中、CyはXで置換されたアリール又はXで置換されたヘテロアリールであり； R^1 は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NO R^2$

、 $\text{CH}=\text{NNR}^4\text{R}^5$ 、 COR^2 、 COOR^2 、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 又は CONR^4R^5 であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 CONR^4R^5 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 OR^2 、 COR^2 又は COOR^2 であり；Aはハロゲン原子、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 $\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、 $\text{SCH}_2\text{COOR}^2$ 、 NHN^4R^5 、 COOR^2 、ニトロ又は $\text{CH}(\text{CN})_2$ であり；Qはハロゲン原子、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 $\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、 $\text{SCH}_2\text{COOR}^2$ 、 NHN^4R^5 、 COOR^2 、ニトロ又は $\text{CH}(\text{CN})_2$ であり； R^2 は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^3 はアルキルであり； R^4 は水素原子又はアルキルであり； R^5 は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 COOR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^2$ 又は CH_2CN であり；nは0～2の整数である、前記（1）に記載されたイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0130] （5）式（I）中、 C_y はXで置換されたアリール又はXで置換されたヘテロアリールであり； R^1 は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $\text{CH}=\text{NOR}^2$ 、 $\text{CH}=\text{NNR}^4\text{R}^5$ 、 COR^2 、 COOR^2 、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 又は CONR^4R^5 であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 CONR^4R^5 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 OR^2 、 COR^2 、 COOR^2 、アルコキシビニル、 $\text{S}(\text{O})_m[\text{N}(\text{CN})]\text{R}^3$ 又は $\text{C}(\text{R}^3)=\text{NNG}^1\text{G}^2$ であり；但し C_y がXで置換されたアリールであるとき、 R^1 は無置換のアルキルではない、前記（3）に記載されたイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0131] （6）式（I）中、 C_y はXで置換されたアリール又はXで置換されたヘテ

ロアリールであり； R^1 は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NOR^2$ 、 $CH=NNR^4R^5$ 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 又は $CONR^4R^5$ であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 $CONR^4R^5$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 OR^2 、 COR^2 又は $COOR^2$ であり；但し C_y がXで置換されたアリールであるとき、 R^1 は無置換のアルキルではない、前記（４）に記載されたイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0132] （７）式（I）中、 C_y がXで置換されたヘテロアリールである、前記（５）に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0133] （８）式（I）中、 C_y がXで置換されたヘテロアリールである、前記（６）に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0134] （９）式（I）中、 C_y がXで置換されたアリールであり、 R^1 がAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NOR^2$ 、 $CH=NNR^4R^5$ 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 又は $CONR^4R^5$ である、前記（５）に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0135] （１０）式（I）中、 C_y がXで置換されたアリールであり、 R^1 がAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NOR^2$ 、 $CH=NNR^4R^5$ 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 又は $CONR^4R^5$ である、前記（６）に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[0136] (11) 前記式 (I) で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤。

(12) 前記式 (I) で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤。

(13) 前記式 (I) で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤又は殺ダニ剤。

(14) 前記式 (I) で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

実施例

[0137] 次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず、本発明化合物の合成例を記載する。

なお、合成例中のシリカゲルカラムクロマトグラフィーで用いた溶離液の比 (／) は、体積比である。

[0138] 合成例 1

5-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン (化合物No. 1) の合成

(1) 3-クロロ-2-エトキシカルボニル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン 4.0 g、アセトン 1.01 g 及びテトラヒドロフラン 20 mL の混合溶液を氷冷し、ナトリウムエトキシド 1.29 g を少しずつ加えた。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、7 時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に 1 mol/L 塩酸を加えて酸性とした後、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮して、粗製の 1-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]ブタン-1,3-ジオンを得た。

(2) (1) で得られた粗製の 1-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ブタン-1,3-ジオン全量と酢酸 30 mL の混合溶液に、2-アミノイミダゾール硫酸塩 2.29 g 及び酢酸ナトリウム 1.56 g を加え、80 °C で 2 日間加熱した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、水 50 mL を加え、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムを用いて乾

燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル/ヘキサン=7/3）で精製して、目的物2.51 gを得た。

[0139] 合成例 2

5-(5-ブromo-2-クロロフェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン（化合物No. 96）の合成

(1) 5-ブromo-2-クロロ安息香酸メチル14.4 g、シクロプロピルメチルケトン5.9 g及びテトラヒドロフラン120 mLの混合溶液を氷冷し、ナトリウムメトキシド 4.8 gを少しずつ加えた。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、5時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に1 mol/L塩酸を加えて酸性とした後、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮して、粗製の1-(5-ブromo-2-クロロフェニル)-3-シクロプロピルプロパン-1,3-ジオン 15.7gを得た。

(2) (1)で得られた粗製の1-(5-ブromo-2-クロロフェニル)-3-シクロプロピルプロパン-1,3-ジオン5.3 gと酢酸100 mLの混合溶液に、2-アミノイミダゾール硫酸塩4.9 g及び酢酸ナトリウム3.1 gを加え、100 °Cで4日間加熱した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液を加えて中和し、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル/ヘプタン=1/1）で精製して、目的物 0.8 gを得た。

[0140] 合成例 3

5-(2-クロロ-5-(1-エトキシビニル)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン（化合物No. 170）及び 1-(4-クロロ-3-(7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-5-イル)フェニル)エタノン（化合物No. 97）の合成

(1) 5-(5-ブromo-2-クロロフェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン（化合物No. 96）720 mg及びトルエン40 mLの混合溶液に、テトラキ

ス(トリフェニルホスフィン)パラジウム230 mg及びトリブチル(1-エトキシビニル)スズ845 mgを加え、窒素雰囲気下、9時間加熱還流した。反応終了後、反応混合物を減圧ろ過し、ろ液を減圧濃縮して、粗製の5-(2-クロロ-5-(1-エトキシビニル)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン(化合物No. 170)を得た。

(2) (1)で得られた粗製の5-(2-クロロ-5-(1-エトキシビニル)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン(化合物No. 170)全量とテトラヒドロフラン50 mLの混合溶液に、12 mol/L塩酸1 mL及び水5 mLを加え、40°Cで14時間加熱した。反応終了後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで3回洗浄した。水層を減圧濃縮し、析出した結晶を減圧ろ過し、ヘプタンで洗浄して、目的物279 mgを得た。

[0141] 合成例 4

N-(1-(4-クロロ-3-(7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-5-イル)フェニル)エチリデン)ピロリジン-1-アミン(化合物No. 101)の合成

1-(4-クロロ-3-(7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-5-イル)フェニル)エタノン(化合物No. 97) 93 mg及びメタノール30 mLの混合溶液に、N-アミノピロリジン塩酸塩48 mg及びピリジン38 mgを加え、6時間加熱還流した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン=1/2)で精製して、目的物24 mgを得た。

[0142] 合成例 5

5-(2-クロロ-5-(メチルチオ)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン(化合物No. 127)の合成

(1) 2-クロロ-5-(メチルチオ)安息香酸10.0 g、18 mol/L硫酸3.0 mL及びメタノール100 mLの混合溶液を6時間加熱還流した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮して、粗製の2-クロロ-5-(メチルチオ)安息香酸メチル10.3 gを得た。このものの¹H-NMRデータ〔

^1H -核磁気共鳴分光法 (Nuclear Magnetic Resonance Spectroscopy) にて測定した。 δ は化学シフト値 (Chemical shift) である。] は以下の通りである。

^1H -NMR (溶媒 : CDCl_3 /500MHz) δ (ppm) : 2.49 (3H, s), 3.95 (3H, s), 7.27 (1H, d), 7.35 (1H, d), 7.65 (1H, s)。

(2) (1)で得られた粗製の2-クロロ-5-(メチルチオ)安息香酸メチル5.0 g、シクロプロピルメチルケトン2.2 g及びテトラヒドロフラン 80 mLの混合溶液を氷冷し、ナトリウムメトキシド1.5 gを少しずつ加えた。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、3日間攪拌した。反応終了後、反応混合物に1 mol/L塩酸を加えて酸性とした後、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮して、粗製の1-(2-クロロ-5-(メチルチオ)フェニル)-3-シクロプロピルプロパン-1,3-ジオン3.8 gを得た。

(3) (2)で得られた粗製の1-(2-クロロ-5-(メチルチオ)フェニル)-3-シクロプロピルプロパン-1,3-ジオン1.9 gと酢酸50 mLの混合溶液に、2-アミノイミダゾール硫酸塩 3.8 g及び酢酸ナトリウム2.3 gを加え、100 °Cで3日間加熱した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル)で精製して、目的物 0.5 gを得た。

[0143] 合成例 6

5-(2-クロロ-5-(メチルスルフィニル)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン (化合物No. 139) の合成

(1) 1-(2-クロロ-5-(メチルチオ)フェニル)-3-シクロプロピルプロパン-1,3-ジオン1.9 g及びクロロホルム50 mLの混合溶液を氷冷し、3-クロロ過安息香酸 1.5 gを少しずつ加えた。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、20時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に飽和重炭酸ナトリウム水溶液を加えた後、クロロホルムで1回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナ

トリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル）で精製して、1-(2-クロロ-5-(メチルスルフィニル)フェニル)-3-シクロプロピルプロパン-1,3-ジオン 1.7 gを得た。

(2) (1)で得られた1-(2-クロロ-5-(メチルスルフィニル)フェニル)-3-シクロプロピルプロパン-1,3-ジオン 1.7 gと酢酸50 mLの混合溶液に、2-アミノイミダゾール硫酸塩3.2 g及び酢酸ナトリウム2.0 gを加え、100 °Cで3日間加熱した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液を加えて中和し、酢酸エチルで4回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：メタノール/酢酸エチル=1/10）で精製して、目的物 0.3 gを得た。

[0144] 合成例 7

5-(2-クロロ-5-(メチルスルホニル)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン（化合物No. 147）の合成

5-(2-クロロ-5-(メチルチオ)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン（化合物No. 127）150mg及びクロロホルム25 mLの混合溶液を氷冷し、3-クロロ過安息香酸171 mgを少しずつ加えた。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、19時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に飽和重炭酸ナトリウム水溶液を加えた。分液後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル）で精製して、目的物40 mgを得た。

[0145] 合成例 8

1-(4-クロロ-3-(7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-5-イル)フェニル)(メチル)- λ^4 -スルファニリデンシアナミド（化合物No. 155）の合成

5-(2-クロロ-5-(メチルチオ)フェニル)-7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン（化合物No. 127） 61 mg、シアナミド18 mg及びアセトニトリル 2

0 mlの混合溶液を氷冷し、ヨードベンゼンジアセタート135 mgを少しずつ加えた。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、24時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：メタノール/酢酸エチル=1/10）で精製して、目的物35 mgを得た。

[0146] 合成例 9

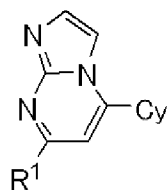
1-(4-クロロ-3-(7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-5-イル)フェニル)(メチル)-オキシド- λ^4 -スルファニリデンシアナミド（化合物No. 163）の合成

1-(4-クロロ-3-(7-シクロプロピルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-5-イル)フェニル)(メチル)- λ^4 -スルファニリデンシアナミド（化合物No. 155）255 mg、3-クロロ過安息香酸148 mg及びエタノール50 mLの混合溶液を氷冷し、炭酸カリウム299 mgを水10 mlに溶かし、少しずつ加えた。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、40分間攪拌した。反応終了後、反応混合物に飽和重炭酸ナトリウム水溶液を加えた後、酢酸エチルで1回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを用いて乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：メタノール/酢酸エチル=1/10）で精製して、目的物141mgを得た。

[0147] 前記式 (I) の化合物の代表例を第1表（表1～表6）に挙げる。これらの化合物は、前記合成例1 或は前記した種々の製造方法に基づいて製造することができる。第1表～第5表中、No. は化合物No. を示し、Meはメチル、c-Prはシクロプロピルを、i-Prはイソプロピルを、Acはアセチルを、Phはフェニルを各々示し、物性として示した温度は融点である。また、第1表の物性欄が油状又は無定形となっている化合物につき、 $^1\text{H-NMR}$ データ [^1H -核磁気共鳴分光法にて測定した。 δ は化学シフト値である] を第2表～第5表に示す。

[0148]

[表1]



第1表

No.	R ¹	Cy	物性
1	Me	3-C1-5-CF ₃ -2-ピリジル	油状
2	Me	3-Br-5-CF ₃ -2-ピリジル	
3	Me	3-I-5-CF ₃ -2-ピリジル	189-193°C
4	Me	3-F-5-CF ₃ -2-ピリジル	
5	Me	3-Me-5-CF ₃ -2-ピリジル	
6	Me	3-NH ₂ -5-CF ₃ -2-ピリジル	
7	Me	3-NHCOMe-5-CF ₃ -2-ピリジル	
8	Me	3-NHCOCF ₃ -5-CF ₃ -2-ピリジル	
9	Me	3-OMe-5-CF ₃ -2-ピリジル	
10	Me	3-SMe-5-CF ₃ -2-ピリジル	
11	c-Pr	3-C1-5-CF ₃ -2-ピリジル	油状
12	c-Pr	3-Br-5-CF ₃ -2-ピリジル	油状
13	c-Pr	3-I-5-CF ₃ -2-ピリジル	
14	c-Pr	3-F-5-CF ₃ -2-ピリジル	
15	c-Pr	3-Me-5-CF ₃ -2-ピリジル	油状
16	c-Pr	3-NH ₂ -5-CF ₃ -2-ピリジル	
17	c-Pr	3-NHCOMe-5-CF ₃ -2-ピリジル	
18	c-Pr	3-NHCOCF ₃ -5-CF ₃ -2-ピリジル	
19	c-Pr	3-OMe-5-CF ₃ -2-ピリジル	
20	c-Pr	3-SMe-5-CF ₃ -2-ピリジル	
21	C1	3-C1-5-CF ₃ -2-ピリジル	
22	C1	3-Br-5-CF ₃ -2-ピリジル	
23	C1	3-I-5-CF ₃ -2-ピリジル	
24	C1	3-F-5-CF ₃ -2-ピリジル	
25	C1	3-Me-5-CF ₃ -2-ピリジル	
26	Br	3-C1-5-CF ₃ -2-ピリジル	
27	Br	3-Br-5-CF ₃ -2-ピリジル	
28	Br	3-I-5-CF ₃ -2-ピリジル	
29	Br	3-F-5-CF ₃ -2-ピリジル	
30	Br	3-Me-5-CF ₃ -2-ピリジル	

[0149]

[表2]

第1表 (続き)

No.	R 1	Cy	物性
31	CF ₃	3-C1-5-CF ₃ -2-ピリジル	
32	CF ₃	3-Br-5-CF ₃ -2-ピリジル	
33	CF ₃	3-I-5-CF ₃ -2-ピリジル	
34	CF ₃	3-F-5-CF ₃ -2-ピリジル	
35	CF ₃	3-Me-5-CF ₃ -2-ピリジル	
36	c-Pr	2-C1-4-CF ₃ -Ph	
37	c-Pr	2-Br-4-CF ₃ -Ph	
38	c-Pr	2-I-4-CF ₃ -Ph	
39	c-Pr	2-F-4-CF ₃ -Ph	
40	c-Pr	2-Me-4-CF ₃ -Ph	
41	c-Pr	2-NH ₂ -4-CF ₃ -Ph	
42	c-Pr	2-NHCOMe-4-CF ₃ -Ph	
43	c-Pr	2-NHCOCF ₃ -4-CF ₃ -Ph	
44	c-Pr	2-C1-4-OCF ₃ -Ph	
45	c-Pr	2-C1-4-CF(CF ₃) ₂ -Ph	
46	c-Pr	2-C1-5-CF ₃ -Ph	185-188°C
47	c-Pr	2-Br-5-CF ₃ -Ph	
48	c-Pr	2-I-5-CF ₃ -Ph	
49	c-Pr	2-F-5-CF ₃ -Ph	
50	c-Pr	2-Me-5-CF ₃ -Ph	
51	c-Pr	2-C1-5-OCF ₃ -Ph	140-142°C
52	c-Pr	2-C1-5-CF(CF ₃) ₂ -Ph	
53	C1	2-C1-4-CF ₃ -Ph	
54	C1	2-Br-4-CF ₃ -Ph	
55	C1	2-I-4-CF ₃ -Ph	
56	C1	2-F-4-CF ₃ -Ph	
57	C1	2-Me-4-CF ₃ -Ph	
58	C1	2-C1-4-OCF ₃ -Ph	
59	C1	2-C1-5-CF ₃ -Ph	
60	C1	2-C1-5-OCF ₃ -Ph	
61	CF ₃	2-C1-4-CF ₃ -Ph	
62	CF ₃	2-Br-4-CF ₃ -Ph	
63	CF ₃	2-I-4-CF ₃ -Ph	
64	CF ₃	2-F-4-CF ₃ -Ph	
65	CF ₃	2-Me-4-CF ₃ -Ph	

[0150]

[表3]

第1表 (続き)

No.	R ¹	Cy	物性
66	CF ₃	2-C1-4-OCF ₃ -Ph	
67	CF ₃	2-C1-5-CF ₃ -Ph	
68	CF ₃	2-C1-5-OCF ₃ -Ph	
69	CF ₃	2-C1-4-CF ₃ -Ph	
70	Me	1-Me-3-CF ₃ -5-ピラゾリル	
71	Me	1-Me-3-CF ₃ -4-C1-5-ピラゾリル	
72	Me	5-CF ₃ -3-イソキサゾリル	
73	Me	2-CF ₃ -5-チエニル	
74	c-Pr	1-Me-3-CF ₃ -5-ピラゾリル	
75	c-Pr	1-Me-3-CF ₃ -4-C1-5-ピラゾリル	
76	c-Pr	5-CF ₃ -3-イソキサゾリル	
77	c-Pr	5-CF ₃ -2-チエニル	
78	Me	2-C1-4-CF ₃ -Ph	
79	Me	2-Br-4-CF ₃ -Ph	
80	Me	2-I-4-CF ₃ -Ph	
81	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	
82	Me	2-Me-4-CF ₃ -Ph	
83	Me	2-NH ₂ -4-CF ₃ -Ph	
84	Me	2-NHCOMe-4-CF ₃ -Ph	
85	Me	2-NHCOCF ₃ -4-CF ₃ -Ph	
86	Me	2-C1-4-OCF ₃ -Ph	
87	Me	2-C1-4-CF(CF ₃) ₂ -Ph	
88	Me	2-C1-5-CF ₃ -Ph	
89	Me	2-Br-5-CF ₃ -Ph	
90	Me	2-I-5-CF ₃ -Ph	
91	Me	2-F-5-CF ₃ -Ph	
92	Me	2-Me-5-CF ₃ -Ph	
93	Me	2-C1-5-OCF ₃ -Ph	
94	Me	2-C1-5-CF(CF ₃) ₂ -Ph	
95	c-Pr	3-C1-6-C1-2-ピリジリル	92-95°C
96	c-Pr	2-C1-5-Br-Ph	215-216°C
97	c-Pr	2-C1-5-Ac-Ph	134-136°C
98	c-Pr	2-C1-4-C(Me)=NNMe ₂ -Ph	
99	c-Pr	2-C1-5-C(Me)=NNMe ₂ -Ph	
100	c-Pr	2-C1-4-C(Me)=NN(CH ₂) ₄ -Ph	

[0151]

[表4]

第1表 (続き)

No.	R ¹	Cy	物性
101	c-Pr	2-C1-5-C(Me)=NN(CH ₂) ₄ -Ph	無定形
102	c-Pr	2-C1-4-C(Me)=NN(CH ₂) ₅ -Ph	
103	c-Pr	2-C1-5-C(Me)=NN(CH ₂) ₅ -Ph	
104	c-Pr	2-C1-4-C(Me)=NNH(CO ₂ Me)-Ph	
105	c-Pr	2-C1-5-C(Me)=NNH(CO ₂ Me)-Ph	
106	c-Pr	2-C1-4-C(Me)=NNH(CO ₂ Et)-Ph	
107	c-Pr	2-C1-5-C(Me)=NNH(CO ₂ Et)-Ph	
108	c-Pr	2-C1-4-C(Me)=NN(CO ₂ CH ₂ CH ₂)-Ph	
109	c-Pr	2-C1-5-C(Me)=NN(CO ₂ CH ₂ CH ₂)-Ph	
110	Me	2-C1-5-SMe-Ph	162°C
111	Me	2-C1-5-SCF ₃ -Ph	
112	Me	2-C1-5-SCH ₂ CF ₃ -Ph	
113	Me	2-C1-5-S(O)Me-Ph	177°C
114	Me	2-C1-5-S[N(CN)]Me-Ph	無定形
115	Me	2-C1-5-S(O)[N(CN)]Me-Ph	
116	i-Pr	2-C1-5-SMe-Ph	
117	i-Pr	2-C1-5-SCF ₃ -Ph	
118	i-Pr	2-C1-5-SCH ₂ CF ₃ -Ph	
119	i-Pr	2-C1-5-S(O)Me-Ph	
120	i-Pr	2-C1-5-S[N(CN)]Me-Ph	
121	i-Pr	2-C1-5-S(O)[N(CN)]Me-Ph	
122	c-Pr	2-C1-4-SMe-Ph	無定形
123	c-Pr	2-Br-4-SMe-Ph	
124	c-Pr	2-I-4-SMe-Ph	
125	c-Pr	2-F-4-SMe-Ph	
126	c-Pr	2-Me-4-SMe-Ph	
127	c-Pr	2-C1-5-SMe-Ph	175°C
128	c-Pr	2-Br-5-SMe-Ph	
129	c-Pr	2-I-5-SMe-Ph	
130	c-Pr	2-F-5-SMe-Ph	
131	c-Pr	2-Me-5-SMe-Ph	
132	c-Pr	2-C1-5-SEt-Ph	
133	c-Pr	2-C1-5-S(i-Pr)-Ph	
134	c-Pr	2-C1-5-SCF ₃ -Ph	
135	c-Pr	2-C1-5-SCH ₂ CF ₃ -Ph	

[0152]

[表5]

第1表 (続き)

No.	R ¹	Cy	物性
136	c-Pr	2-C1-5-SPh-Ph	
137	c-Pr	2-C1-5-S(3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
138	c-Pr	2-C1-4-S(0)Me-Ph	無定形
139	c-Pr	2-C1-5-S(0)Me-Ph	177°C
140	c-Pr	2-C1-5-S(0)Et-Ph	
141	c-Pr	2-C1-5-S(0)(i-Pr)-Ph	
142	c-Pr	2-C1-5-S(0)CF ₃ -Ph	
143	c-Pr	2-C1-5-S(0)CH ₂ CF ₃ -Ph	
144	c-Pr	2-C1-5-S(0)Ph-Ph	
145	c-Pr	2-C1-5-S(0)(3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
146	c-Pr	2-C1-4-SO ₂ Me-Ph	112°C
147	c-Pr	2-C1-5-SO ₂ Me-Ph	無定形
148	c-Pr	2-C1-5-SO ₂ Et-Ph	
149	c-Pr	2-C1-5-SO ₂ (i-Pr)-Ph	
150	c-Pr	2-C1-5-SO ₂ CF ₃ -Ph	
151	c-Pr	2-C1-5-SO ₂ CH ₂ CF ₃ -Ph	
152	c-Pr	2-C1-5-SO ₂ Ph-Ph	
153	c-Pr	2-C1-5-SO ₂ (3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
154	c-Pr	2-C1-4-S[N(CN)]Me-Ph	
155	c-Pr	2-C1-5-S[N(CN)]Me-Ph	無定形
156	c-Pr	2-C1-5-S[N(CN)]Et-Ph	
157	c-Pr	2-C1-5-S[N(CN)](i-Pr)-Ph	
158	c-Pr	2-C1-5-S[N(CN)]CF ₃ -Ph	
159	c-Pr	2-C1-5-S[N(CN)]CH ₂ CF ₃ -Ph	
160	c-Pr	2-C1-5-S[N(CN)]Ph-Ph	
161	c-Pr	2-C1-5-S[N(CN)](3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
162	c-Pr	2-C1-4-S(0)[N(CN)]Me-Ph	
163	c-Pr	2-C1-5-S(0)[N(CN)]Me-Ph	油状
164	c-Pr	2-C1-5-S(0)[N(CN)]Et-Ph	
165	c-Pr	2-C1-5-S(0)[N(CN)](i-Pr)-Ph	
166	c-Pr	2-C1-5-S(0)[N(CN)]CF ₃ -Ph	
167	c-Pr	2-C1-5-S(0)[N(CN)]CH ₂ CF ₃ -Ph	
168	c-Pr	2-C1-5-S(0)[N(CN)]Ph-Ph	
169	c-Pr	2-C1-5-S(0)[N(CN)](3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
170	c-Pr	2-C1-5-(1-エトキシビニル)-Ph	129°C

[0153]

[表6]

第1表 (続き)

No.	R ¹	Cy	物性
171	CF ₃	2-C1-4-SMe-Ph	
172	CF ₃	2-Br-4-SMe-Ph	
173	CF ₃	2-I-4-SMe-Ph	
174	CF ₃	2-F-4-SMe-Ph	
175	CF ₃	2-Me-4-SMe-Ph	
176	CF ₃	2-C1-5-SMe-Ph	
177	CF ₃	2-Br-5-SMe-Ph	
178	CF ₃	2-I-5-SMe-Ph	
179	CF ₃	2-F-5-SMe-Ph	
180	CF ₃	2-Me-5-SMe-Ph	
181	CF ₃	2-C1-5-SCF ₃ -Ph	
182	CF ₃	2-C1-5-SCH ₂ CF ₃ -Ph	
183	CF ₃	2-C1-5-S(3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
184	CF ₃	2-C1-4-S(O)Me-Ph	
185	CF ₃	2-C1-5-S(O)Me-Ph	
186	CF ₃	2-C1-5-S(O)CF ₃ -Ph	
187	CF ₃	2-C1-5-S(O)CH ₂ CF ₃ -Ph	
188	CF ₃	2-C1-5-S(O)(3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
189	CF ₃	2-C1-4-SO ₂ Me-Ph	
190	CF ₃	2-C1-5-SO ₂ Me-Ph	
191	CF ₃	2-C1-5-SO ₂ CF ₃ -Ph	
192	CF ₃	2-C1-5-SO ₂ CH ₂ CF ₃ -Ph	
193	CF ₃	2-C1-5-SO ₂ (3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
194	CF ₃	2-C1-4-S[N(CN)]Me-Ph	
195	CF ₃	2-C1-5-S[N(CN)]Me-Ph	
196	CF ₃	2-C1-5-S[N(CN)]CF ₃ -Ph	
197	CF ₃	2-C1-5-S[N(CN)]CH ₂ CF ₃ -Ph	
198	CF ₃	2-C1-5-S[N(CN)](3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	
199	CF ₃	2-C1-4-S(O)[N(CN)]Me-Ph	
200	CF ₃	2-C1-5-S(O)[N(CN)]Me-Ph	
201	CF ₃	2-C1-5-S(O)[N(CN)]CF ₃ -Ph	
202	CF ₃	2-C1-5-S(O)[N(CN)]CH ₂ CF ₃ -Ph	
203	CF ₃	2-C1-5-S(O)[N(CN)](3, 5-F ₂ -Ph)-Ph	

[0154] [表7]

第2表

No.	¹ H-NMR δ ppm (溶媒 : CDCl ₃ / 300MHz)
1	2.75 (3H, s), 7.06 (1H, s), 7.36 (1H, d), 7.81 (1H, d), 8.24 (1H, d), 8.99 (1H, d)
11	1.10 (2H, m), 1.21 (2H, m), 2.06 (1H, m), 7.01 (1H, s), 7.26 (1H, d), 7.68 (1H, s), 8.19 (1H, d), 8.94 (1H, s)

[0155] [表8]

第3表

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (溶媒 : CDCl_3 / 400MHz)
12	1.13 (4H, m), 2.14 (1H, m), 6.98 (1H, d), 7.23 (1H, d), 7.12 (1H, s), 8.93 (1H, s), 9.01 (1H, s)
15	1.22 (4H, m), 2.13 (1H, m), 2.34 (3H, s), 6.82 (1H, s), 7.13 (1H, t), 7.69 (1H, d), 8.02 (1H, d), 8.91 (1H, s)

[0156] [表9]

第4表

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (溶媒 : CD_3OD / 500MHz)
101	1.28 (4H, m), 1.86 (4H, m), 2.26 (1H, m), 2.30 (3H, s), 3.13 (4H, m), 7.04 (1H, s), 7.19 (1H, d), 7.55 (1H, d), 7.92 (1H, s), 7.98 (1H, d), 8.20 (1H, d)
114	2.68 (3H, s), 3.18 (3H, s), 7.12 (1H, d), 7.33 (1H, s), 7.65 (1H, d), 8.00 (1H, d), 8.16 (2H, m)
122	1.18 (4H, m), 2.21 (1H, m), 2.57 (3H, s), 7.00 (1H, s), 7.21 (1H, d), 7.39 (1H, d), 7.52 (2H, m), 7.56 (1H, d)
138	1.21 (4H, m), 2.24 (1H, m), 2.91 (3H, s), 7.07 (1H, s), 7.24 (1H, s), 7.58 (1H, d), 7.8 (2H, m), 8.02 (1H, s)
155	1.21 (4H, m), 2.23 (1H, m), 3.18 (3H, s), 7.12 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.58 (1H, d), 8.00 (1H, d), 8.16 (2H, m)
163	1.21 (4H, m), 2.25 (1H, m), 3.65 (3H, s), 7.15 (1H, d), 7.29 (1H, d), 7.60 (1H, s), 8.08 (1H, d), 8.31 (1H, d), 8.36 (1H, s)

[0157] [表10]

第5表

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (溶媒 : CDCl_3 / 500MHz)
147	1.43 (4H, m), 2.11 (1H, m), 3.15 (3H, s), 6.87 (1H, s), 7.19 (1H, s), 7.68 (1H, s), 7.83 (1H, d), 8.11 (2H, m)

[0158] 次に試験例を記載する。

試験例1 モモアカアブラムシに対する効果試験

ダイコン葉を水の入った試験管に挿し、その葉上にモモアカアブラムシ1齢幼虫を約20頭放飼した。翌日、ダイコン葉上に寄生している幼虫数を数えた後、寄生したダイコン葉を本発明化合物の濃度が200ppmとなるように調整した薬液に約10秒間浸漬処理した。薬液が風乾した後に、25℃の照明付恒温室内に放置した。処理5日後にモモアカアブラムシの生死を判定し、下記の計算式により死虫率を求めた。尚、離脱虫及び異常虫は死亡虫

とみなした。前記化合物No. 1、11及び139を供試したところ、全ての化合物が80%以上の死虫率を示した。

$$\text{死虫率(\%)} = (1 - (\text{生存虫数} / \text{処理虫数})) \times 100$$

[0159] 試験例2 トビイロウンカに対する効果試験

本発明化合物の濃度が200 ppmとなるよう調整した薬液に、イネ幼苗を約10秒間浸漬処理した。薬液が風乾した後に、湿った脱脂綿で根部を包んで試験管に入れた。この中へトビイロウンカ2～3齢幼虫を10頭放ち、管口をガーゼでふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。放虫5日後にトビイロウンカの生死を判定し、下記の計算式により死虫率を求めた。前記化合物No. 1、3、11、12、15、46、51、95、110、113、122、127、138、139、146、147、155及び163を供試したところ、全ての化合物が80%以上の死虫率を示した。

$$\text{死虫率(\%)} = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

[0160] 試験例3 シルバーリーフコナジラミに対する効果試験

シルバーリーフコナジラミ1～2齢幼虫が寄生したポット植えのキュウリ苗に、本発明化合物の濃度が200 ppmとなるよう調整した薬液を、ハンドスプレーを用い散布処理した。薬液が風乾した後に、25℃の照明付恒温室内に放置した。処理7日後に老齢幼虫数を調査し、下記計算式により防除価(%)を求めた。前記化合物No. 3、12及び46を供試したところ、全ての化合物が80%以上の防除価を示した。

$$[0161] \text{防除価(\%)} = (1 - (Ta \times Cb) / (Tb \times Ca)) \times 100$$

Ta: 処理キュウリ苗における処理後の老齢幼虫

Tb: 処理キュウリ苗における処理前の1～2齢幼虫数

Ca: 無処理キュウリ苗における処理後の老齢幼虫数

Cb: 無処理キュウリ苗における処理前の1～2齢幼虫数

[0162] 試験例4 フタトゲチマダニに対するイヌを用いた薬効試験

イヌ(ビーグル、8ヶ月齢)に10 mg/kg体重の本発明化合物を含むゼラチンカプセルを投与し、その直後にフタトゲチマダニの若ダニ約50頭

をイヌの耳介に放ち、人工寄生させる。処理後、寄生数、落下数及び落下したフタトゲチマダニの生死を観察する。その結果、本発明化合物は、寄生させたフタトゲチマダニを落下又は致死させる。

[0163] 試験例 5 ネコノミに対するイヌを用いた薬効試験

イヌ（ビーグル、8ヶ月齢）に10mg/kg体重の本発明化合物を含むゼラチンカプセルを投与し、その直後にネコノミ未吸血成虫約100頭を背部被毛上に放ち人工寄生させる。処理後、ノミ取り櫛を用いてネコノミを回収し、その定着数を数える。その結果、本発明化合物は、ネコノミの寄生を抑制する。

[0164] 次に製剤例を記載する。

製剤例 1

- (1) 本発明化合物 20重量部
- (2) クレー 70重量部
- (3) ホワイトカーボン 5重量部
- (4) ポリカルボン酸ナトリウム 3重量部
- (5) アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム 2重量部

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

[0165] 製剤例 2

- (1) 本発明化合物 5重量部
- (2) タルク 60重量部
- (3) 炭酸カルシウム 34.5重量部
- (4) 流動パラフィン 0.5重量部

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

[0166] 製剤例 3

- (1) 本発明化合物 20重量部
- (2) N,N-ジメチルアセトアミド 20重量部
- (3) ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル 10重量部
- (4) ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 2重量部

(5) キシレン 48 重量部

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

[0167] 製剤例 4

(1) クレー 68 重量部

(2) リグニンスルホン酸ナトリウム 2 重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルアリアルサルフェート 5 重量部

(4) ホワイトカーボン 25 重量部

以上の各成分の混合物と、本発明化合物とを 4 : 1 の重量割合で混合し、水和剤とする。

[0168] 製剤例 5

(1) 本発明化合物 50 重量部

(2) アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物
2 重量部

(3) シリコンオイル 0.2 重量部

(4) 水 47.8 重量部

以上のものを均一に混合、粉碎した原液に更に

(5) ポリカルボン酸ナトリウム 5 重量部

(6) 無水硫酸ナトリウム 42.8 重量部

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

[0169] 製剤例 6

(1) 本発明化合物 5 重量部

(2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル 1 重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル 0.1 重量部

(4) 粒状炭酸カルシウム 93.9 重量部

(1) ~ (3) を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4) に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

[0170] 製剤例 7

(1) 本発明化合物 2.5 重量部

(2) N, N-ジメチルアセトアミド 2.5重量部

(3) 大豆油 95.0重量部

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤(ultra low volume formulation)とする。

[0171] 製剤例 8

(1) 本発明化合物 40重量部

(2) ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテルリン酸カリウム
4重量部

(3) シリコンオイル 0.2重量部

(4) キサンタンガム 0.1重量部

(5) エチレングリコール 5重量部

(6) 水 50.7重量部

以上のものを均一に混合、粉砕して水性懸濁剤とする。

[0172] 製剤例 9

(1) 本発明化合物 10重量部

(2) ジエチレングリコールモノエチルエーテル 80重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルエーテル 10重量部

以上の成分を均一に混合し、液剤とする。

産業上の利用可能性

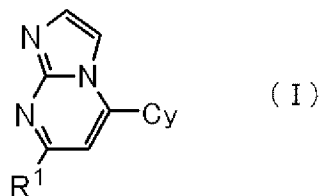
[0173] 本発明のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤は、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有し、農園芸分野で問題となる各種有害生物や、動物に寄生する有害生物を防除することが可能であり、且つ、作物、有害生物の天敵或は哺乳動物に対する安全性を併せ持つ等、極めて有用である。

なお、2009年12月18日に出願された日本特許出願2009-288224号の明細書、特許請求の範囲、及び要約書の全内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

請求の範囲

[請求項1] 式 (I) :

[化1]



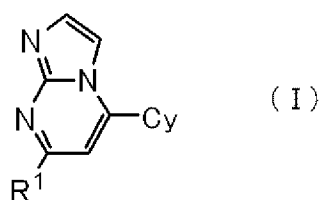
〔式中、CyはXで置換されたアリール又はXで置換されたヘテロアリールであり；R¹は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、CH=NOR²、CH=NNR⁴R⁵、COR²、COOR²、OR²、S(O)_nR³、NR⁴R⁵又はCONR⁴R⁵であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、NR⁴R⁵、CONR⁴R⁵、S(O)_nR³、OR²、COR²、COOR²、アルコキシビニル、S(O)_m[N(CN)]R³又はC(R³)=NNG¹G²であり；Aはハロゲン原子、OR²、S(O)_nR³、OS(O)_nR³、NR⁴R⁵、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、SCH₂COOR²、NHNHNR⁴R⁵、COOR²、ニトロ又はCH(CN)₂であり；Qはハロゲン原子、OR²、S(O)_nR³、OS(O)_nR³、NR⁴R⁵、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、SCH₂COOR²、NHNHNR⁴R⁵、COOR²、ニトロ又はCH(CN)₂であり；R²は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり；R³はアルキル、無置換若しくはハロゲン原子で置換されたアリール又はハロアルキルであり；R⁴は水素原子又はアルキルであり；R⁵は水素原子、アルキル、シク

ロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 COOR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^2$ 又は CH_2CN であり； G^1 及び G^2 は各々独立に水素原子、アルキル又は COOR^3 であり、 G^1 及び G^2 は相互に結合して隣接する窒素原子と共に環を形成していてもよく； n は0～2の整数であり； m は0又は1の整数である。〕で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。

[請求項2] 請求項1に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤。

[請求項3] 式 (I) :

[化2]



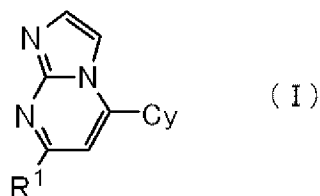
〔式中、 Cy は X で置換されたアリール又は X で置換されたヘテロアリールであり； R^1 は無置換若しくは A で置換されたアルキル、無置換若しくは Q で置換されたシクロアルキル、無置換若しくは A で置換されたアルケニル、無置換若しくは A で置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $\text{CH}=\text{NOR}^2$ 、 $\text{CH}=\text{NNR}^4\text{R}^5$ 、 COR^2 、 COOR^2 、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 又は CONR^4R^5 であり； X はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 CONR^4R^5 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 OR^2 、 COR^2 、 COOR^2 、アルコキシビニル、 $\text{S}(\text{O})_m[\text{N}(\text{CN})]\text{R}^3$ 又は $\text{C}(\text{R}^3)=\text{NNG}^1\text{G}^2$ であり； A はハロゲン原子、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 $\text{OS}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、シクロアルキル、アリール、複素環基、 $\text{SCH}_2\text{COOR}^2$ 、 NHN^4R^5 、 COOR^2 、ニトロ又は $\text{CH}(\text{CN})_2$ であり； Q はハロゲン原子、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 O

$S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHN R^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又は $CH(CN)_2$ であり； R^2 は水素原子、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^3 はアルキル、無置換若しくはハロゲン原子で置換されたアリール又はハロアルキルであり； R^4 は水素原子又はアルキルであり； R^5 は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 $CH_2CH_2OR^2$ 又は CH_2CN であり； G^1 及び G^2 は各々独立に水素原子、アルキル又は $COOR^3$ であり、 G^1 及び G^2 は相互に結合して隣接する窒素原子と共に環を形成していてもよく； n は0～2の整数であり； m は0又は1の整数である。〕で表されるイミダゾピリミジン誘導体又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

[請求項4]

式 (I) :

[化3]



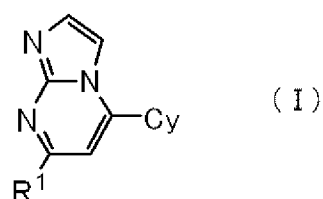
〔式中、 Cy は X で置換されたアリール又は X で置換されたヘテロアリールであり； R^1 は無置換若しくは A で置換されたアルキル、無置換若しくは Q で置換されたシクロアルキル、無置換若しくは A で置換されたアルケニル、無置換若しくは A で置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $CH=NOR^2$ 、 $CH=NNR^4R^5$ 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 又は $CONR^4R^5$ であり； X はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 $CONR^4R^5$ 、 $S(O)_nR^3$ 、

OR^2 、 COR^2 、 $COOR^2$ 、アルコキシビニル、 $S(O)_m[N(CN)]$
 R^3 又は $C(R^3)=NNG^1G^2$ であり；Aはハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)$
 $)_nR^3$ 、 $OS(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、シクロアルキル、アリール
 、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHN R^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ又
 は $CH(CN)_2$ であり；Qはハロゲン原子、 OR^2 、 $S(O)_nR^3$ 、 O
 $S(O)_nR^3$ 、 NR^4R^5 、シアノ、アルキル、シクロアルキル、アリール
 、複素環基、 SCH_2COOR^2 、 $NHN R^4R^5$ 、 $COOR^2$ 、ニトロ
 又は $CH(CN)_2$ であり； R^2 は水素原子、アルキル、アルケニル、
 アルキニル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシアルキル、
 アセチル、ベンジル又はアリールであり； R^3 はアルキル、無置換若
 しくはハロゲン原子で置換されたアリール又はハロアルキルであり；
 R^4 は水素原子又はアルキルであり； R^5 は水素原子、アルキル、シク
 ロアルキル、ハロアルキル、 COR^2 、 $COOR^2$ 、 $S(O)_nR^3$ 、 CH_2
 CH_2OR^2 又は CH_2CN であり； G^1 及び G^2 は各々独立に水素原子、
 アルキル又は $COOR^3$ であり、 G^1 及び G^2 は相互に結合して隣接する
 窒素原子と共に環を形成していてもよく；nは0～2の整数であり；
 mは0又は1の整数である。〕で表されるイミダゾピリミジン誘導体
 又はその塩。

[請求項5]

式 (I) :

[化4]



[式中、CyはXで置換されたアリール又はXで置換されたヘテロア
 リールであり； R^1 は無置換若しくはAで置換されたアルキル、無置
 換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換
 されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロ

ゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $\text{CH}=\text{NOR}^2$ 、 $\text{CH}=\text{NNR}^4\text{R}^5$ 、 COR^2 、 COOR^2 、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 又は CONR^4R^5 であり；Xはアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、ハロゲン原子、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^4R^5 、 CONR^4R^5 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 OR^2 、 COR^2 、 COOR^2 、アルコキシビニル、 $\text{S}(\text{O})_m[\text{N}(\text{CN})]\text{R}^3$ 又は $\text{C}(\text{R}^3)=\text{NNG}^1\text{G}^2$ であり；但し C_y がXで置換されたアリールであるとき、 R^1 は無置換のアルキルではない。]で表される、請求項4に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[請求項6] 式(I)中、 C_y がXで置換されたヘテロアリールである、請求項5に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

[請求項7] 式(I)中、 C_y がXで置換されたアリールであり、 R^1 がAで置換されたアルキル、無置換若しくはQで置換されたシクロアルキル、無置換若しくはAで置換されたアルケニル、無置換若しくはAで置換されたアルキニル、ハロゲン原子、シアノ、アリール、無置換若しくはアルキルで置換された複素環基、 $\text{CH}=\text{NOR}^2$ 、 $\text{CH}=\text{NNR}^4\text{R}^5$ 、 COR^2 、 COOR^2 、 OR^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^3$ 、 NR^4R^5 又は CONR^4R^5 である、請求項5に記載のイミダゾピリミジン誘導体又はその塩。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2010/072802

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01N47/40(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, C07D487/04(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A01N43/90, A01N47/02, A01N47/40, A01P7/02, A01P7/04, C07D487/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2011
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2011	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2011

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CA/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	Alexander S. KISELYOV and Leon SMITH, II, Novel one pot synthesis of polysubstituted pyrazolo [1,5-a]- and imidazo[1,2-a]pyrimidines, Tetrahedron Letters, 2006, Vol.47, p.2611-2614	4-7 1-3
X A	JP 2001-43978 A (Mitsui Chemicals, Inc.), 16 February 2001 (16.02.2001), claim 7 (Family: none)	4, 5, 7 1-3, 6
X A	US 5037980 A (American Cyanamid Co.), 06 August 1991 (06.08.1991), claim 1 (Family: none)	4, 5, 7 1-3, 6

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
14 January, 2011 (14.01.11)

Date of mailing of the international search report
25 January, 2011 (25.01.11)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2010/072802

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 03/089433 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 30 October 2003 (30.10.2003), claims 1 to 13 & JP 2004-2315 A	1-7
A	WO 03/022850 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 20 March 2003 (20.03.2003), claims 1 to 26 & US 2004/0235865 A1 & EP 1431299 A1	1-7
A	JP 62-281864 A (Pfizer Inc.), 07 December 1987 (07.12.1987), claims 1 to 4 & EP 247725 A2 & WO 1987/006576 A1	1-7
A	US 4551530 A (American Cyanamid Co.), 05 November 1985 (05.11.1985), abstract (Family: none)	1-7
A	US 5459145 A (Pfizer Inc.), 17 October 1995 (17.10.1995), column 2, line 45 to column 5 (Family: none)	1-7
A	Scott A. PETRICH et al., The application of unsymmetrical vinylogous iminium salts and related synthons to the preparation of monosubstituted triazolo[1,5-a]pyrimidines, Tetrahedron, 1994, Vol.50, No.42, p.12113-12124	1-7
A	MAGGIALI, C.A. et al., Biological properties of imidazopyrimidines, CHEMICAL ABSTRACTS, 1983, Vol.99, No.1, item no.99:1754e	1-7
A	WO 2007/101871 A1 (BASF AG.), 13 September 2007 (13.09.2007), Patentanspruche 1 (Family: none)	1-7

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01N47/40(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i,
A01P7/04(2006.01)i, C07D487/04(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. A01N43/90, A01N47/02, A01N47/40, A01P7/02, A01P7/04, C07D487/04

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

日本国実用新案公報	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 1 1 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 1 1 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 1 1 年

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)

CA/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	Alexander S. KISELYOV and Leon SMITH, II, Novel one pot synthesis of polysubstituted pyrazolo[1,5-a]- and	4-7
A	imidazo[1,2-a]pyrimidines, Tetrahedron Letters, 2006, Vol.47, p.2611-2614	1-3
X	JP 2001-43978 A (三井化学株式会社) 2001.02.16, 請求項 7 (ファミリーなし)	4, 5, 7
A		1-3, 6

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」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
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

1 4 . 0 1 . 2 0 1 1

国際調査報告の発送日

2 5 . 0 1 . 2 0 1 1

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (I S A / J P)

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号

特許庁審査官 (権限のある職員)

今井 周一郎

4 H

4 1 5 9

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 4 3

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X	US 5037980 A (American Cyanamid Company) 1991.08.06, Claim 1 (ファミリーなし)	4, 5, 7
A		1-3, 6
A	WO 03/089433 A1 (住友化学工業株式会社) 2003.10.30, 請求項 1 - 1 3 & JP 2004-2315 A	1-7
A	WO 03/022850 A1 (住友化学工業株式会社) 2003.03.20, 請求項 1 - 2 6 & US 2004/0235865 A1 & EP 1431299 A1	1-7
A	JP 62-281864 A (ファイザー・インコーポレイテッド) 1987.12.07, 請求項 1 - 4 & EP 247725 A2 & WO 1987/006576 A1	1-7
A	US 4551530 A (American Cyanamid Company) 1985.11.05, ABSTRACT (ファミリーなし)	1-7
A	US 5459145 A (Pfizer Inc.) 1995.10.17, 第 2 欄第 4 5 行 - 第 5 欄 (ファミリーなし)	1-7
A	Scott A. PETRICH et al., The application of unsymmetrical vinylogous iminium salts and related synthons to the preparation of monosubstituted triazolo[1,5-a]pyrimidines, Tetrahedron, 1994, Vol.50, No.42, p.12113-12124	1-7
A	MAGGIALI, C.A. et al., Biological properties of imidazopyrimidines, CHEMICAL ABSTRACTS, 1983, Vol.99, No.1, 記事番号 9 9 : 1 7 5 4 e	1-7
A	WO 2007/101871 A1 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2007.09.13, Patentanspruche 1 (ファミリーなし)	1-7