

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年 4 月 29 日 (29.04.2004)

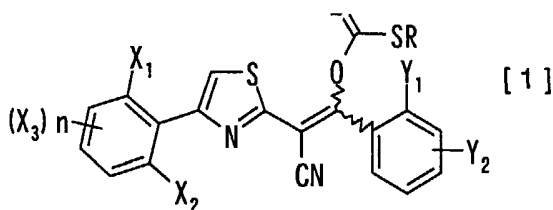
PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/035554 A1

- (51) 国際特許分類: **C07D 277/30**, A01N 43/78 250-0280 神奈川県 小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa (JP).
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2003/013112
- (22) 国際出願日: 2003 年 10 月 14 日 (14.10.2003)
- (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 2002-303013
2002 年 10 月 17 日 (17.10.2002) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本曹達株式会社 (NIPPON SODA CO.,LTD.) [JP/JP]; 〒100-8165 東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 柴田 泰史 (SHIBATA,Yasushi) [JP/JP]; 〒933-8507 富山県高岡市向野本町 3 0 0 日本曹達株式会社 高岡工場内 Toyama (JP). 波多野 連平 (HATANO,Renpei) [JP/JP]; 〒100-8165 東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号 日本曹達株式会社内 Tokyo (JP). 岩佐 孝男 (IWASA,Takao) [JP/JP]; 〒421-0412 静岡県榛原郡榛原町坂部 6 2-1 日本曹達株式会社小田原研究所内榛原農業研究部 Shizuoka (JP). 花井 大輔 (HANAI,Daisuke) [JP/JP]; 〒
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: THIAZOLYL CINNAMONITRILE COMPOUND AND PEST CONTROL AGENT

(54) 発明の名称: チアゾリルケイ皮酸ニトリル化合物及び有害生物防除剤



(57) Abstract: A novel compound capable of serving as a pest control agent. The compound is represented by the formula [1]: [1] wherein R represents optionally substituted C₁₋₆ alkyl, optionally substituted C₃₋₈ cycloalkyl, optionally substituted phenyl, etc.; X₁, X₂, and X₃ each independently represents halogeno, C₁₋₃ alkyl, or C₁₋₃ haloalkyl and n is an integer of 0 to 3, provided that when n is an integer of 2 or larger, then the X₃'s may be the same or different; Y₁ represents nitro, cyano, halogeno, C₁₋₃ alkyl, etc.; Y₂ represents hydrogen, halogeno, C₁₋₃ alkyl, etc.; and Z represents oxygen or

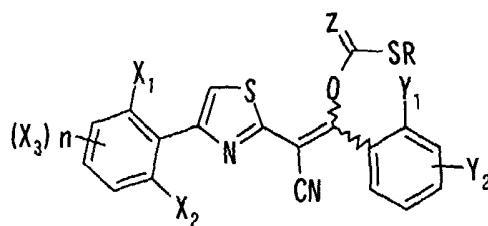
sulfur. Also provided is a pest control agent containing the compound as an active ingredient.

[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。
すなわち、式〔1〕



〔1〕

〔式中、Rは、置換されてもよいC₁₋₆アルキル基、置換されてもよいC₃₋₈シクロアルキル基、置換されてもよいフェニル基等を表し、

X₁、X₂およびX₃は、それぞれ独立してハロゲン原子、C₁₋₃アルキル基またはC₁₋₃ハロアルキル基を表し、nは0または1～3の整数を表し、nが2以上の整数であるとき、X₃は同一または相異なっているもよい。

Y₁は、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、C₁₋₃アルキル基等を表し、

Y₂は、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₃アルキル基等を表し、

Zは、酸素原子または硫黄原子を表す。〕で表される化合物、および該化合物を有効成分として含有してなる有害生物防除剤である。

明細書

チアゾリルケイ皮酸ニトリル化合物及び有害生物防除剤

技術分野：

本発明は、新規なチアゾリルケイ皮酸ニトリル化合物および有害生物防除剤に関する。

背景技術：

従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されているが、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じたり、あるいは人畜魚類などに対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

本発明化合物と類似したチアゾリルケイ皮酸ニトリル化合物としては、たとえば、特開昭53-92769号公報、特開昭55-154963号、欧州特許出願公開第189960号明細書、国際公開第95/29591号パンフレットおよび特開平10-158254号公報に記載の化合物が知られている。

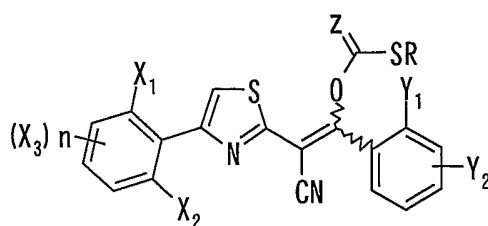
特開昭53-92769号公報、特開昭55-154963号、欧州特許出願公開第189960号明細書には、3-ヒドロキシ-2-(4-フェニル-2-チアゾリル)-ケイ皮酸ニトリル化合物が記載され、また、特開昭55-154963号にはそれらのアルカリ金属塩およびアンモニウム塩が記載されているが、効力不足等の問題から殺虫剤として実用化された化合物はまだない。

国際公開第95/29591号パンフレットおよび特開平10-158254号公報には、本発明類似のケイ皮酸ニトリル誘導体が水中付着生物防汚剤として有用である旨が記載されているが、それらの殺虫活性については何ら記載されていない。

発明の開示：

本発明は、工業的に有利に合成でき効果が確実安全に使用できる有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

本発明は、第1に、式[1]



[1]

(式中、Rは、G₁で置換されてもよいC₁₋₆アルキル基、G₁で置換されてもよいC₃₋₈シクロアルキル基、G₂で置換されてもよいフェニル基、G₂で置換されてもよいフェノキシ基またはG₂で置換されてもよいフェニルチオ基を表し、

ここで、G₁はハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、置換基を有してもよいフェニル基、置換基を有してもよいフェノキシ基、置換基を有してもよいフェニルチオ基を表し、

G₂は、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、ジC₁₋₆アルキルアミノ基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、置換基を有してもよいフェニル基および置換基を有してもよいフェノキシ基を表す。G₁およびG₂は同一または相異なって複数置換していてもよい。

X_1 、 X_2 および X_3 は、それぞれ独立してハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル基または C_{1-3} ハロアルキル基を表し、 n は0または1～3の整数を表し、 n が2以上の整数であるとき、 X_3 は同一または相異なっているもよい。

Y₁は、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、C₁₋₃アルキル基、C₁₋₃ハロアルキル基またはC₁₋₄アルコキシ基を表し、

Y₂は、水素原子、ハロゲン原子、C₁₋₃アルキル基、C₁₋₃ハロアルキル基またはC₁₋₄アルコキシ基を表し、

Zは、酸素原子または硫黄原子を表す。) で表される化合物であり、

第2に前記式〔1〕で表される化合物を有効成分として含有してなる有害生物防除剤である。

前記式〔1〕において、(式中、Rは、 G_1 で置換されてもよいメチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、sec-ブチル、イソブチル、 t -ブチル等の C_{1-6} アルキル基； G_1 で置換されてもよいシクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル

等の C_{3-8} シクロアルキル基； G_2 で置換されてもよいフェニル基； G_2 で置換されてもよいフェノキシ基または G_2 で置換されてもよいフェニルチオ基を表し、

ここで、 G_1 はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、イソプロポキシ、 n -ブトキシ、*sec*-ブトキシ、イソブトキシ、 t -ブトキシ等の C_{1-6} アルコキシ基；メチルチオ、エチルチオエチル、 n -プロピルチオ、イソプロピルチオ、 n -ブチルチオ、イソブチルチオ、*sec*-ブチルチオ、 t -ブチルチオ等の C_{1-6} アルキルチオ基；置換基を有してもよいフェニル基；置換基を有してもよいフェノキシ基；置換基を有してもよいフェニルチオ基を表し、

G_2 は、ニトロ基；シアノ基；フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、 t -ブチル等の C_{1-6} アルキル基；シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の C_{3-8} シクロアルキル基；クロロメチル、フルオロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリブロモメチル、トリクロロエチル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル等の C_{1-6} ハロアルキル基；メトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、イソプロポキシ、 n -ブトキシ、*sec*-ブトキシ、イソブトキシ、 t -ブトキシ等の C_{1-6} アルコキシ基；クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、1, 1-ジフルオロエトキシ等の C_{1-6} ハロアルコキシ基；メチルチオ、エチルチオエチル、 n -プロピルチオ、イソプロピルチオ、 n -ブチルチオ、イソブチルチオ、*sec*-ブチルチオ、 t -ブチルチオ等の C_{1-6} アルキルチオ基；メチルアミノ、エチルアミノ、 n -プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、 n -ブチルアミノ、イソブチルアミノ、*sec*-ブチルアミノ、 t -ブチルアミノ、1-メチルブチルアミノ、 n -ペンチルアミノ等の C_{1-6} アルキルアミノ基；ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、エチルイソプロピルアミノ、メチルプロピルアミノ、メチルブチルアミノ等の C_{1-6} アルキルアミノ基；メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル、ブチルカルボニル等の C_{1-6} アルキルカルボニル基；または、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、 n -ブトキシカルボニル、 t -ブトキシカルボニル等の C_{1-6} アルコキシカルボニル基；置換基を有してもよいフェニル基および置換基を有してもよいフェノキシ基を表す。 G_1 および G_2 は同一または相異なって複数置換していてもよい。

X_1 、 X_2 および X_3 は、それぞれ独立してフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル等の C_{1-3} アルキル基またはクロロメチル、フルオロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリブロモメチル、トリクロロエチル、

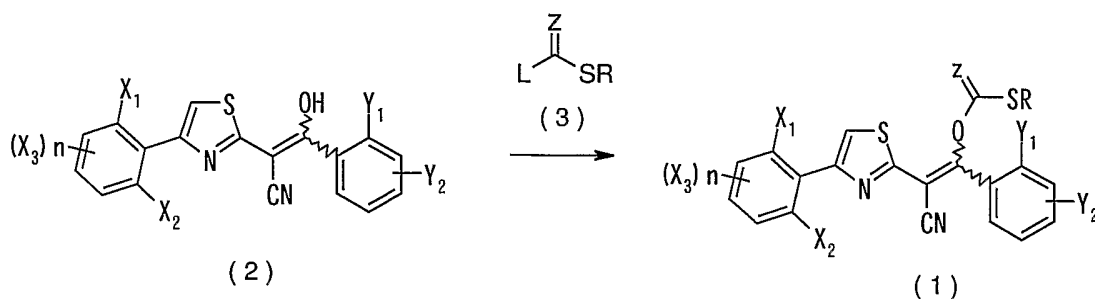
トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル等の C_{1-3} ハロアルキル基を表し、 n は0または1～3の整数を表し、 n が2以上の整数であるとき、 X_3 は同一または相異なっているてもよい。

Y_1 は、ニトロ基；シアノ基；フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル等の C_{1-3} アルキル基；クロロメチル、フルオロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリブロモメチル、トリクロロエチル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル等の C_{1-3} ハロアルキル基またはメトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、イソプロポキシ、 n -ブトキシ、*sec*-ブトキシ、イソブトキシ、 t -ブトキシ等の C_{1-4} アルコキシ基を表し、

Y_2 は、水素原子；フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル等の C_{1-3} アルキル基； C_{1-3} ハロアルキル基またはメトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、イソプロポキシ、 n -ブトキシ、*sec*-ブトキシ、イソブトキシ、 t -ブトキシ等の C_{1-4} アルコキシ基を表し、

Z は、酸素原子または硫黄原子を表す。) で表される化合物。

本発明化合物は、例えば、以下の方法により製造することができる。



(式中、 R 、 X_1 、 X_2 、 X_3 、 Y_1 、 Y_2 、 Z および n は前記と同じ意味を表し、 L_2 はハロゲン原子等の脱離基を表す。)

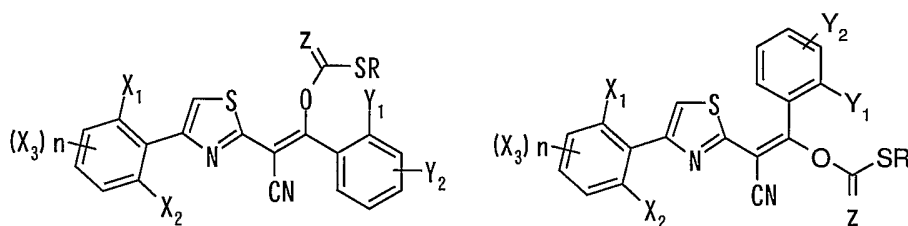
式(2)で表される化合物と式(3)で表される化合物とを塩基存在下に反応させることによって、式(1)で表される化合物を得ることができる。

この反応で用いられる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩、ナトリウムメトキシド、カリウム t -ブトキシド、マグネシウムエトキシド等の金属アルコキシド、 n -ブチルリチウム、LDA等の有機金属、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、トリエチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基等が挙げられる。また、用い

ることのできる溶媒としては、N，N-ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）、テトラヒドロフラン（THF）、アセトニトリル、ヘキサメチルリン酸トリアミド（HMPA）、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等を用いることができる。反応温度は -78°C から用いる溶媒の沸点までの温度範囲が好ましい。

その他、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等と水の二相系溶媒中で、4級アミン塩等の相関移動触媒と水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の塩基を用い、 -78°C から用いる溶媒の沸点までの温度範囲で反応を行い、式（1）で示される化合物を得ることもできる。

なお、本発明の化合物である一般式〔1〕で示される化合物には、以下に示すように、立体異性体が存在し、反応条件および精製方法によって、2種のうちのいずれか1種の異性体のみが得られる場合、あるいは2種の異性体混合物として得られる場合がある。これらの異性体は全て本発明の範囲に含まれる。

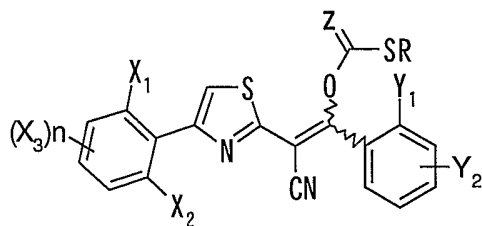


反応終了後は、通常の後処理を行なうことにより目的物を得ることができる。本発明化合物の構造は、IR，NMRおよびMS等から決定した。

以上のようにして製造することのできる本発明化合物の代表例を、第1表から第3表に示す。なお、表中の略記号は以下の意味を示す。

Me：メチル、Et：エチル、Pr：プロピル、Bu：ブチル、Pen：ペンチル、Hex：ヘキシル、Ph：フェニル、n：ノルマル、i：イソ、t：ターシャリー、c：シクロ

第1表の1 (R=Me ; Z=O)



X ₁	X ₂	(X ₃) _n	Y ₁	Y ₂
F	F	—	NO ₂	—
F	F	—	CN	—
F	F	—	F	—
F	F	—	Cl	—
F	F	—	Br	—
F	F	—	I	—
F	F	—	Me	—
F	F	—	Et	—
F	F	—	nPr	—
F	F	—	iPr	—
F	F	—	CF ₃	—
F	F	—	CH ₂ CF ₃	—
F	F	—	CF(CF ₃) ₂	—
F	F	—	OMe	—
F	F	—	OEt	—
F	F	—	O-nBu	—
F	F	—	F	3-F
F	F	—	F	4-F
F	F	—	F	5-F
F	F	—	F	6-F
F	F	—	F	6-Cl

第1表の1 (つづき)

X ₁	X ₂	(X ₃) _n	Y ₁	Y ₂
F	F	—	F	6-Me
F	F	—	F	6-CF ₃
F	F	—	F	6-OMe
F	F	—	Cl	6-Cl
F	F	—	Me	3-F
F	F	—	Me	4-F
F	F	—	Me	5-F
F	F	—	Me	6-Me
F	F	3-F	Me	—
F	F	3-F	CF ₃	—
F	F	2,3,6-F ₃	Me	—
F	F	2,3,6-F ₃	CF ₃	—
F	Cl	—	NO ₂	—
F	Cl	—	CN	—
F	Cl	—	F	—
F	Cl	—	Cl	—
F	Cl	—	Br	—
F	Cl	—	Me	—
F	Cl	—	CF ₃	—
F	Me	—	NO ₂	—
F	Me	—	CN	—
F	Me	—	F	—
F	Me	—	Cl	—
F	Me	—	Br	—
F	Me	—	Me	—
F	Me	—	CF ₃	—
Cl	Me	—	NO ₂	—
Cl	Me	—	CN	—
Cl	Me	—	F	—
Cl	Me	—	Cl	—
Cl	Me	—	Br	—
Cl	Me	—	Me	—
Cl	Me	—	CF ₃	—

第1表の1 (つづき)

X_1	X_2	$(X_3)_n$	Y_1	Y_2
F	CF_3	—	NO_2	—
F	CF_3	—	CN	—
F	CF_3	—	F	—
F	CF_3	—	Cl	—
F	CF_3	—	Br	—
F	CF_3	—	Me	—
F	CF_3	—	CF_3	—
Cl	Cl	—	NO_2	—
Cl	Cl	—	CN	—
Cl	Cl	—	F	—
Cl	Cl	—	Cl	—
Cl	Cl	—	Br	—
Cl	Cl	—	Me	—
Cl	Cl	—	CF_3	—
Me	Me	—	NO_2	—
Me	Me	—	CN	—
Me	Me	—	F	—
Me	Me	—	Cl	—
Me	Me	—	Br	—
Me	Me	—	Me	—
Me	Me	—	CF_3	—
Et	F	—	NO_2	—
Et	F	—	CN	—
Et	F	—	F	—
Et	F	—	Cl	—
Et	F	—	Br	—

第1表の1 (つづき)

X ₁	X ₂	(X ₃) _n	Y ₁	Y ₂
Et	F	—	Me	—
Et	F	—	CF ₃	—
iPr	F	—	NO ₂	—
iPr	F	—	CN	—
iPr	F	—	F	—
iPr	F	—	Cl	—
iPr	F	—	Br	—
iPr	F	—	Me	—
iPr	F	—	CF ₃	—
CF(CF ₃) ₂	F	—	NO ₂	—
CF(CF ₃) ₂	F	—	CN	—
CF(CF ₃) ₂	F	—	F	—
CF(CF ₃) ₂	F	—	Cl	—
CF(CF ₃) ₂	F	—	Br	—
CF(CF ₃) ₂	F	—	Me	—
CF(CF ₃) ₂	F	—	CF ₃	—
F	Cl	—	F	F
F	Me	—	F	F
F	CF ₃	—	F	F
Cl	Cl	—	F	F
Me	Me	—	F	F
Et	F	—	F	F
iPr	F	—	F	F
CF(CF ₃) ₂	F	—	F	F

R=Me ; Z=O以外である化合物を第1表の2に例示する。

第1表の2

R	Z	$X_1 X_2 (X_3)_n Y_1 Y_2$	R	Z	$X_1 X_2 (X_3)_n Y_1 Y_2$
Et	O	第1表の1の組み合わせ	cPr	O	第1表の1の組み合わせ
nPr	O	第1表の1の組み合わせ	cBu	O	第1表の1の組み合わせ
iPr	O	第1表の1の組み合わせ	cPen	O	第1表の1の組み合わせ
nBu	O	第1表の1の組み合わせ	cHex	O	第1表の1の組み合わせ
iBu	O	第1表の1の組み合わせ	cOct	O	第1表の1の組み合わせ
tBu	O	第1表の1の組み合わせ	1-Me-cPr	O	第1表の1の組み合わせ
nPen	O	第1表の1の組み合わせ	2-Me-cPr	O	第1表の1の組み合わせ
nHex	O	第1表の1の組み合わせ	2,3-Me ₂ -cPr	O	第1表の1の組み合わせ
CF ₃	O	第1表の1の組み合わせ	2,2-Me ₂ -cPr	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ CF ₃	O	第1表の1の組み合わせ	2,2-Cl ₂ -cPr	O	第1表の1の組み合わせ
CF(CF ₃) ₂	O	第1表の1の組み合わせ	1-Me-cPen	O	第1表の1の組み合わせ
nC ₆ F ₁₃	O	第1表の1の組み合わせ	1-Me-cHex	O	第1表の1の組み合わせ
CCl ₃	O	第1表の1の組み合わせ	Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ OMe	O	第1表の1の組み合わせ	4-NO ₂ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ Oet	O	第1表の1の組み合わせ	4-CN-Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ (O-iPr)	O	第1表の1の組み合わせ	2-F-Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ SMe	O	第1表の1の組み合わせ	3-F-Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ SEt	O	第1表の1の組み合わせ	4-F-Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ (S-iPr)	O	第1表の1の組み合わせ	2,6-F ₂ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ Ph	O	第1表の1の組み合わせ	3,5-F ₂ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ -(4-Cl)-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	2-Cl-Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ CH ₂ Ph	O	第1表の1の組み合わせ	3-Cl-Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ OPh	O	第1表の1の組み合わせ	4-Cl-Ph	O	第1表の1の組み合わせ
CH ₂ SPh	O	第1表の1の組み合わせ	2,4-Cl ₂ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ

第1表の2 (つづき)

R	Z	X ₁ X ₂ (X ₃) _n Y ₁ Y ₂	R	Z	X ₁ X ₂ (X ₃) _n Y ₁ Y ₂
4-Br-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	Et	S	第1表の1の組み合わせ
4-I-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	nPr	S	第1表の1の組み合わせ
4-Me-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	iPr	S	第1表の1の組み合わせ
2,4-Me ₂ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ	nBu	S	第1表の1の組み合わせ
4-tBu-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	iBu	S	第1表の1の組み合わせ
4-nHex-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	tBu	S	第1表の1の組み合わせ
4-cHex-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	nPen	S	第1表の1の組み合わせ
4-CF ₃ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ	nHex	S	第1表の1の組み合わせ
4-OMe-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CF ₃	S	第1表の1の組み合わせ
4-OMe-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ CF ₃	S	第1表の1の組み合わせ
4-(O-iPr)-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CF(CF ₃) ₂	S	第1表の1の組み合わせ
4-(O-tBu)-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	nC ₆ F ₁₃	S	第1表の1の組み合わせ
4-(O-nHex)-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CCl ₃	S	第1表の1の組み合わせ
4-OCF ₃ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ OMe	S	第1表の1の組み合わせ
4-SMe-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ OEt	S	第1表の1の組み合わせ
4-NHMe-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ (O-iPr)	S	第1表の1の組み合わせ
4-NMe ₂ -Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ SMe	S	第1表の1の組み合わせ
4-COMe-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ SEt	S	第1表の1の組み合わせ
4-CO ₂ Me-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ (S-iPr)	S	第1表の1の組み合わせ
4-CO ₂ Et-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ Ph	S	第1表の1の組み合わせ
4-Ph-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ -(4-Cl)-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
3-OPh-Ph	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ CH ₂ Ph	S	第1表の1の組み合わせ
OPh	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ OPh	S	第1表の1の組み合わせ
O-(4-Cl-Ph)	O	第1表の1の組み合わせ	CH ₂ SPh	S	第1表の1の組み合わせ
SPh	O	第1表の1の組み合わせ	cPr	S	第1表の1の組み合わせ

第1表の2 (つづき)

R	Z	$X_1 X_2 (X_3)_n Y_1 Y_2$	R	Z	$X_1 X_2 (X_3)_n Y_1 Y_2$
S-(4-Cl-Ph)	O	第1表の1の組み合わせ	4-Me-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
cPen	S	第1表の1の組み合わせ	2,4-Me ₂ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ
cHex	S	第1表の1の組み合わせ	cBu	S	第1表の1の組み合わせ
cOct	S	第1表の1の組み合わせ	4-tBu-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
1-Me-cPr	S	第1表の1の組み合わせ	4-nHex-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
2-Me-cPr	S	第1表の1の組み合わせ	4-cHex-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
2,3-Me ₂ -cPr	S	第1表の1の組み合わせ	4-CF ₃ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ
2,2-Me ₂ -cPr	S	第1表の1の組み合わせ	4-OMe-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
2,2-Cl ₂ -cPr	S	第1表の1の組み合わせ	4-OMe-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
1-Me-cPen	S	第1表の1の組み合わせ	4-(O-iPr)-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
1-Me-cHex	S	第1表の1の組み合わせ	4-(O-tBu)-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-(O-nHex)-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
4-NO ₂ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-OCF ₃ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ
4-CN-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-SMe-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
2-F-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-NHMe-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
3-F-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-NMe ₂ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ
4-F-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-COMe-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
2,6-F ₂ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-CO ₂ Me-	S	第1表の1の組み合わせ
3,5-F ₂ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-CO ₂ Et-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
2-Cl-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	4-Ph-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
3-Cl-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	3-OPh-Ph	S	第1表の1の組み合わせ
4-Cl-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	OPh	S	第1表の1の組み合わせ
2,4-Cl ₂ -Ph	S	第1表の1の組み合わせ	O-(4-Cl-Ph)	S	第1表の1の組み合わせ
4-Br-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	SPh	S	第1表の1の組み合わせ
4-I-Ph	S	第1表の1の組み合わせ	S-(4-Cl-Ph)	S	第1表の1の組み合わせ

〔有害生物防除剤〕

本発明化合物は、有害生物防除剤の有効成分として有用であり、特に、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、衛生害虫防除剤や水中付着生物防汚剤として有用である。

本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えることなく純粋な形で使用できるし、また農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、例えば、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤等の形態で使用することもできる。

添加剤及び担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ペントナイト、パイロフィライト、クレー等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよび石油系の芳香族炭化水素、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用することができる。

また、これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合体等が挙げられる。

製剤中の有効成分量は好ましくは0.01～90重量%であり、特に好ましくは0.05～85重量%である。このようにして得られた水和剤、乳剤、懸濁剤、水溶剤、顆粒水和剤等は水で所定の濃度に希釈して溶液、懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤・粒剤はそのまま植物あるいは土壤に適用される。

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることは言うまでもないが、各種の殺菌剤や有害生物防除剤または共力剤の1種又は2種以上と混合して使用することもできる。

本発明化合物と混合して使用することのできる殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤の代表例を以下に示す。

殺菌剤：

キャプタン、フォルペット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロピネブ、ポリカーバメート、クロロタロニン、キントーゼン、キャプタホル、イプロジオン、プロサイミドン、ピンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、オキシカルボキシシン、ホセチルアルミニウム、プロパモカ

ープ、トリアジメホン、トリアジメノール、プロピコナゾール、ジクロブトラゾール、ピテルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルシラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ペンコナゾール、ジニコナゾール、サイプロコナゾール、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ペフラゾエート、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、トリホリン、ブチオベート、ピリフェノックス、アニラジン、ポリオキシシ、メタラキシル、オキサジキシル、フララキシル、イソプロチオラン、プロベナゾール、ピロールニトリン、プラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン、ベノミル、カルベンダジム、チオファネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオナート、ビナパクリル、レシチン、重曹、ジチアノン、ジノカップ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メパニピリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアジナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ピロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、トリシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロパモカルブ塩酸塩、オキシソリニック酸。

有害生物防除剤：

有機燐及びカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェントロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルボス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロポキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ等。

ピレスロイド系殺虫剤：

ペルメトリン、シベルメトリン、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロバスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロクス、シクロプロトリン、トラロメトリン、シラフルオフェン、アクリナトリン等。

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトプレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、ニテンピラム、アセタミプリド、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ、クロルフェナピル、エマメクチンベンゾエート、テブフェノジド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、B Tや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、B P P S、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、C P C B S、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル、エトキサゾール、ハルフェンブロックス、アセキノシル、ビフェナゼート等。

植物生長調節剤：

ジベレリン類（例えばジベレリンA3、ジベレリンA4、ジベレリンA7）、IAA、NAA等。

本発明化合物は、農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のもものが挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウババ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロピアンコーンボラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタアカミムシ等、

半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、

鞘翅目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タ

バコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、

双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチニクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等、

総翅目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、

膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、

直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ等

等翅目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、

隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、

ダニ類、例えば、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、リングハダニ、ミカンサビダニ、リングサビダニ、チャノホコリダニ、プレビバルパス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等、

植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシンガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

適用が好ましい有害生物としては、鱗翅目害虫、半翅目害虫、鞘翅目害虫、総翅目害虫、ハダニ類であり、特に好ましくは鱗翅目害虫、半翅目害虫、ハダニ類である。

また、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ、ハダニ等多くの害虫およびダニ類において有機リン剤、カーバメート剤や殺ダニ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、抵抗性系統の害虫やダニ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、有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤抵抗性系統の害虫や、殺ダニ剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。

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

また本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することもできる。

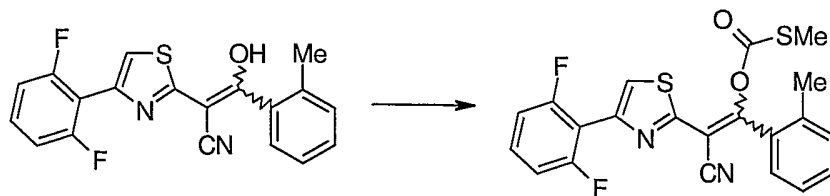
発明を実施するための最良の形態：

次に、実施例を挙げて、本発明をさらに詳細に説明する。

実施例 1

2-[4-(2,6-ジフルオロフェニル)チアゾール-2-イル]-3-(S-メチルカ

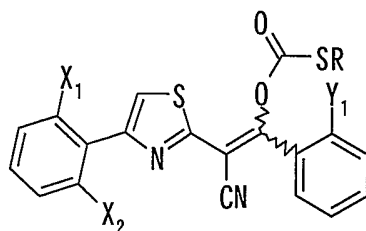
ルボニルオキシ) - 3 - (2 - メチルフェニル) アクリロニトリル (化合物番号 2 - 1) の製造



2 - [4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) チアゾール - 2 - イル] - 3 - ヒドロキシ - 3 - (2 - メチルフェニル) アクリロニトリル 0.5 g をアセトニトリル 5 ml に溶解し、氷冷下、トリエチルアミン 0.17 g およびクロロチオギ酸 S - メチル 0.19 g を順次加えた後、室温にゆっくり戻した。析出した塩を濾過、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒; 1 : 4 酢酸エチル / n ヘキサン) で精製した。ここで得られた粗結晶を n ヘキサンで洗浄して目的化合物 0.39 g を得た。収率 65% : 融点 161 - 162℃

上記のようにして製造された本発明化合物の構造式と物理恒数を第 2 表に示す。なお略号、記号は前記と同じ意味を表す。

第2表



化合物 番号	X ₁	X ₂	Y ₁	R	物理恒数*
2-1	F	F	Me	Me	[161-162]
2-2	F	F	CF ₃	Me	[169-172]
2-3	F	F	CF ₃	Et	Viscous oil
2-4	F	F	CF ₃	nPr	Viscous oil
2-5	F	F	CF ₃	iPr	[93-95]
2-6	F	F	CF ₃	tBu	[54-56]
2-7	F	Cl	Me	Me	[159-160]
2-8	Me	Me	Me	Me	[146-148]
2-9	Me	Me	CF ₃	Me	[133-135]
2-10	Me	Me	CF ₃	Et	[185-190]
2-11	Me	Me	CF ₃	nPr	[143-146]
2-12	Me	Me	CF ₃	tBu	[112-120]
2-13	F	Me	CF ₃	Me	[143-145]
2-14	Cl	Me	CF ₃	Me	[176-179]

次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、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。また、製剤実施例中の部は重量部を示す。

製剤実施例 1 水和剤

本発明化合物	40部
クレー	48部
ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩	4部
リグニンスルホン酸ナトリウム塩	8部

以上を均一に混合して微細に粉碎すれば、有効成分40%の水和剤を得る。

製剤実施例 2 乳剤

本発明化合物	10部
ソルベッソ 200	53部
シクロヘキサノン	26部
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム塩	1部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	10部

以上を混合溶解すれば、有効成分 10 % の乳剤を得る。

製剤実施例 3 粉剤

本発明化合物	10部
クレー	90部

以上を均一に混合して微細に粉碎すれば、有効成分 10 % の粉剤を得る

製剤実施例 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キシネートナトリウム塩	1部
リン酸カリウム	1部

以上をよく粉碎混合し、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。

製剤実施例 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
水	73.8部

以上を混合し、粒度が 3 ミクロン以下になるまで湿式粉碎すれば、有効成分 10 % の懸濁剤を得る。

製剤実施例 6 顆粒水和剤

本発明化合物	40部
クレー	36部
塩化カリウム	10部
アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩	1部
リグニンスルホン酸ナトリウム塩	8部
アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩の ホルムアルデヒド縮合物	5部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、適量の水を加えてから練り込んで粘土状にする。粘土状物を造粒した後乾燥すれば、有効成分40%の顆粒水和剤を得る。

産業上の利用可能性：

以上のようにして得られた本発明の組成物を有害生物防除剤として適用した例を以下に示す。

試験例1 ワタアブラムシに対する効力

3寸鉢に播種した発芽10日が経過したキュウリにワタアブラムシ成虫を接種した。1日後に成虫を除去し、産下された若虫が寄生するキュウリに、前記製剤実施例2に示された乳剤の処方に従い、化合物濃度が125ppmになるように水で希釈した薬液を散布した。温度25℃、湿度65%の恒温室内に置き、5日後に生死を調べ、殺虫率を求めた。試験は2反復である。その結果、以下の化合物が100%の殺虫率を示した。なお、化合物番号は第2表に対応する。

2-1、2-2、2-3、2-4、2-5、2-6、2-7、2-8、2-9、2-10、2-11、2-12、2-13、2-14

対照に用いたピリミカーブの殺虫率は9%であった。

試験例2 アワヨトウに対する効力

前記製剤実施例1に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が125ppmになるように水で希釈した。その薬液中にトウモロコシ葉を30秒間浸漬し風乾後、ろ紙を敷いたシャーレに入れ、アワヨトウ2齢幼虫5頭を接種した。ガラス蓋をして、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置き、5日後に生死を調べ、殺虫率を求めた。試験は2反復である。その結果、以下の化合物が100%の殺虫率を示した。

2-1、2-2、2-3、2-4、2-5、2-6、2-7、2-8、2-9、2-10、2-11、2-12

対照に用いたクロルジメフォルムの殺虫率は40%であった。

試験例 3 ミカンハダニに対する効力

シャーレ内に置いたミカン葉に薬剤感受性ミカンハダニ雌成虫を 8 頭接種した。前記製剤実施例 2 に示された乳剤の処方に従い、化合物濃度が 1 2 5 ppm になるように希釈した薬液を、回転散布塔により一定量散布した。温度 2 5℃、湿度 6 5 % の高温室に保持し、散布 3 日後に殺成虫率を調査した。その結果、以下の化合物が 1 0 0 % の殺虫率を示した。

2-3、2-4

対照に用いたクロルジメホルムの殺虫率は 1 3 % であった。

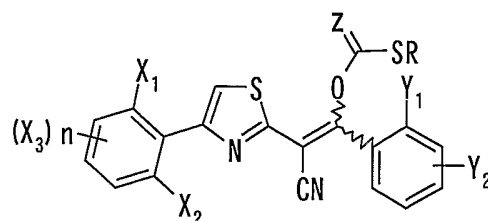
試験例 4 ナミハダニに対する効力

3 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ~ 1 0 日を経過した第 1 本葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を 1 7 頭接種したのち、前記薬剤の実施例 1 に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が 1 2 5 p p m になるように水で希釈した薬液を散布した。温度 2 5℃、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、3 日後に殺成虫率を調査した。試験は 2 反復である。その結果、以下の化合物が 1 0 0 % の殺虫率を示した。

2-13

請 求 の 範 囲

1. 式[1]



[1]

(式中、Rは、 G_1 で置換されてもよい C_{1-6} アルキル基、 G_1 で置換されてもよい C_{3-8} シクロアルキル基、 G_2 で置換されてもよいフェニル基、 G_2 で置換されてもよいフェノキシ基または G_2 で置換されてもよいフェニルチオ基を表し、

ここで、 G_1 はハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、置換基を有してもよいフェニル基、置換基を有してもよいフェノキシ基、置換基を有してもよいフェニルチオ基を表し、

G_2 は、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{3-8} シクロアルキル基、 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、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、ジ C_{1-6} アルキルアミノ基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、置換基を有してもよいフェニル基および置換基を有してもよいフェノキシ基を表す。 G_1 および G_2 は同一または相異なって複数置換していてもよい。

X_1 、 X_2 および X_3 は、それぞれ独立してハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル基または C_{1-3} ハロアルキル基を表し、 n は0または1～3の整数を表し、 n が2以上の整数であるとき、 X_3 は同一または相異なっているいてもよい。

Y_1 は、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル基、 C_{1-3} ハロアルキル基または C_{1-4} アルコキシ基を表し、

Y_2 は、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-3} アルキル基、 C_{1-3} ハロアルキル基または C_{1-4} アルコキシ基を表し、

Zは、酸素原子または硫黄原子を表す。) で表される化合物。

2. 前記式[1]で表される化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/13112

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D277/30, A01N43/78

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)

Int.Cl⁷ C07D277/30, A01N43/78

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

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

STN/CAS

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 97/40009 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 30 October, 1997 (30.10.97), Claims & EP 913392 A & US 6063734 A	1-2

☒ 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 document 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
17 December, 2003 (17.12.03)

Date of mailing of the international search report
20 January, 2004 (20.01.04)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/13112

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	DE 2920182 A (Schering AG.), 09 April, 1981 (09.04.81), Claim 21 & NL 8002109 A & SU 906375 A & FI 8001380 A & AU 8058159 A & ES 491253 A & CA 1135264 A & CH 644854 A & US 4320125 A & SE 8003613 A & DK 8002114 A & FR 2456736 A & IN 155588 A & BE 883349 A & JP 55-154962 A & BR 8003060 A & ZA 8002922 A & AT 8002635 A & GB 2051060 A	1 2
X	WO 00/017174 A1 (Nippon Soda Co., Ltd.), 30 March, 2000 (30.03.00), Claims; compounds No. 5-27, 5-28 & CA 2341722 A & AU 9956515 A & EP 1114820 A & BR 9913757 A & ZA 2001001399 A & US 6492404 B1	1-2
A	WO 01/21618 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 29 March, 2001 (29.03.01), Claims & JP 2001-89473 A & AU 7314400 A	1-2
A	EP 189960 A2 (SHELL INTERNATIONALE RESEARCH MAATSCHAPPIJ B.V.), 06 August, 1986 (06.08.86), & AU 5247986 A & JP 61-180778 A & ZA 8600464 A & BR 8600329 A & US 4626543 A	1-2
P,A	WO 02/088099 A1 (Nippon Soda Co., Ltd.), 07 November, 2002 (07.11.02), Claims (Family: none)	1-2

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))		
Int. Cl ⁷ C07D277/30, A01N43/78		
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 (IPC))		
Int. Cl ⁷ C07D277/30, A01N43/78		
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		
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)		
STN/CAS		
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 請求の範囲の番号
X	WO 97/40009 A1 (日産化学工業株式会社) 1997. 10. 30 請求の範囲 & EP 913392 A & US 6063734 A	1-2
X A	DE 2920182 A (Schering AG) 1981. 04. 09 特許請求の範囲第21項 & NL 8002109 A & SU 906375 A & FI 8001380 A & AU 8058159 A & ES 491253 A & CA 1135264 A & CH 644854 A & US 4320125 A & SE 8003613 A & DK 8002114 A & FR 2456736 A & IN 155588 A & BE 883349 A & JP 55-154962 A & BR 8003060 A & ZA 8002922 A & AT 8002635 A & GB 2051060 A	1 2
☒ C欄の続きにも文献が列举されている。 ☐ 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	17. 12. 03	国際調査報告の発送日
		20. 1. 2004
国際調査機関の名称及びあて先	特許庁審査官 (権限のある職員)	4 C 8 5 1 9
日本国特許庁 (ISA/J P)	守安 智	
郵便番号 100-8915		
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	電話番号 03-3581-1101	内線 3452

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 請求の範囲の番号
X	WO 00/017174 A1 (日本曹達株式会社) 2000. 03. 30 請求の範囲、化合物番号 5-27、5-28 & CA 2341722 A & AU 9956515 A & EP 1114820 A & BR 9913757 A & ZA 2001001399 A & US 6492404 B1	1-2
A	WO 01/21618 A1 (日産化学工業株式会社) 2001. 03. 29 請求の範囲 & JP 2001-89473 A & AU 7314400 A	1-2
A	EP 189960 A2 (SHELL INTERNATIONALE RESEARCH MAATSCHAPPIJ B.V.) 1986. 08. 06 & AU 5247986 A & JP 61-180778 A & ZA 8600464 A & BR 8600329 A & US 4626543 A	1-2
PA	WO 02/088099 A1 (日本曹達株式会社) 2002. 11. 07 請求の範囲 (ファミリーなし)	1-2