

(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
2018年7月5日(05.07.2018)



(10) 国際公開番号

WO 2018/124129 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 413/04 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
A01N 43/707 (2006.01) A61K 31/4439 (2006.01)
A01N 43/76 (2006.01) A61K 31/444 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01) A61P 33/14 (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01) C07D 471/04 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2017/046772

(22) 国際出願日: 2017年12月26日(26.12.2017)

(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 2016-253824 2016年12月27日(27.12.2016) JP

(71) 出願人: 日本農薬株式会社(NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1048386 東京都中央区京橋1丁目19番8号 Tokyo (JP).

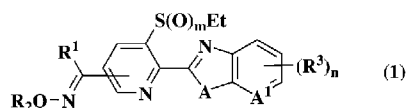
(72) 発明者: 米村 樹(YONEMURA, Ikki); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 佐野 勇介(SANO, Yusuke); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 諏訪 明之(SUWA, Akiyuki); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 藤江 隼平(FUJIE, Shunpei); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 田中 綾介(TANAKA, Ryosuke); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 岩谷 龍(IWATANI, Ryo); 〒5300003 大阪府大阪市北区堂島2丁目1番31号 京阪堂島ビル6階 Osaka (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,

(54) Title: FUSED HETEROCYCLIC COMPOUND HAVING OXIME GROUP OR SALTS THEREOF, AGRICULTURAL/HORTICULTURAL INSECTICIDE CONTAINING SAID COMPOUNDS, AND METHOD FOR USING SAID INSECTICIDE

(54) 発明の名称: オキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類、及びそれらの化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



(57) Abstract: The present invention addresses the problem of developing and providing a novel agricultural and horticultural insecticide due to factors such as the development of pests resistant to existing chemicals since damage by pests is still a major issue in crop production such as agriculture and horticulture. The present invention provides a fused heterocyclic compound having an oxime group represented by general formula (1) (in the formula, R¹ represents an alkoxy group, R² represents a haloalkyl group, R³ represents a haloalkylthio group, A represents an oxygen atom, A¹ represents a CH group, m is 2, and n is 1) or salts thereof, agricultural/horticultural insecticides having these as active ingredients, and a method for using the insecticides.

(57) 要約: 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害が今なお大きいことから、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤を開発し、提供することを課題とする。本発明は、一般式(1){式中、R¹はアルコキシ基を示し、R²はハロアルキル基を示し、R³はハロアルキルチオ基を示し、Aは酸素原子、A¹はCH基を示し、mは2、nは1を示す。}で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類、これを有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法を提供する。

BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

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

添付公開書類:

- 一 国際調査報告(条約第21条(3))

明 細 書

発明の名称：

オキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類、及びそれらの化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

技術分野

[0001] 本発明は、オキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類、及びそれらの化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関する。

背景技術

[0002] これまでに農園芸用殺虫剤として様々な化合物が検討されており、ある種の縮合複素環化合物が殺虫剤として有用であることが報告されている（例えば特許文献1～7参照）。かかる文献中には、オキシム基が縮合複素環と結合した化合物は具体的に開示されていない。

先行技術文献

特許文献

- [0003] 特許文献1：特開2009-280574号公報
特許文献2：特開2010-275301号公報
特許文献3：特開2011-79774号公報
特許文献4：特開2012-131780号公報
特許文献5：国際公開第2012/086848号パンフレット
特許文献6：国際公開第2014/142135号パンフレット
特許文献7：国際公開第2015/121136号パンフレット

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。

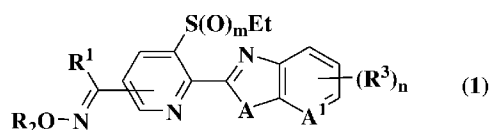
課題を解決するための手段

[0005] 本発明者は上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、一般式（１）で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類が農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有し、併せて環境中又は非防除対象生物で適度な分解性を見出し、本発明に至った。

即ち、本発明は、

[１] 一般式（１）

[化1]



{式中、R¹は、(a1) ハロゲン原子；(a2) (C₁-C₆) アルコキシ基；(a3) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；(a4) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；(a5) (C₁-C₆) アルキルチオ基；(a6) (C₂-C₆) アルケニルチオ基；(a7) (C₂-C₆) アルキニルチオ基；(a8) イミダゾール基；(a9) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1～3 の置換基を環上に有するイミダゾール基；(a10) トリアゾール基；(a11)

同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスル

フィニル基、(m)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(n) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基から選択される1～2の置換基を環上に有するトリアゾール基；(a12) (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基；(a13) (C_1-C_6) アルキルカルボニルアミノ基；(a14) (C_1-C_6) アルコキシカルボニルアミノ基；(a15) (C_1-C_6) アルキルカルボニル (C_1-C_6) アルキルアミノ基；又は(a16) (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルコキシ基を示す。 R^2 は、(b1) 水素原子；(b2) (C_1-C_6) アルキル基；(b3) (C_2-C_6) アルケニル基；(b4) (C_2-C_6) アルキニル基；(b5) (C_3-C_6) シクロアルキル基；(b6) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；(b7) (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基；(b8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(b9) ハロ (C_2-C_6) アルケニル基；(b10) ハロ (C_2-C_6) アルキニル基；又は(b11) (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基を示す。 R^3 は、(c1) ハロゲン原子；(c2) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(c3) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；(c4) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；(c5) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；又は(c6) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基；を示す。Aは酸素原子、又はN - R^4 を示す（ここで R^4 は、(e1) (C_1-C_6) アルキル基；(e2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；(e3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は(e4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す)。A¹はCH基、又は窒素原子を示し、mは0、1、又は2を示し、nは0、1、又は2を示す。} で示されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩、

[2] Aが酸素原子であり、A¹がCH基である[1]に記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩、

[3] Aが、N - R^4 である（ここで R^4 は、前記に同じ。）である請求項1に記載のオキシム化合物又はその塩、

[4] [1]～[3]のいずれかに記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤、

[5] [1] ~ [3] のいずれかに記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩の有効量で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用法、

[6] [1] ~ [3] のいずれかに記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする動物用外部寄生虫防除剤、
に関する。

発明の効果

[0006] 本発明のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類は農園芸用殺虫剤として優れた効果を有するだけでなく、犬や猫といった愛玩動物、又は牛や羊等の家畜に寄生する害虫、白蟻等のその他の有害害虫に対しても駆除効果を有する。

発明を実施するための形態

[0007] 本発明のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類の一般式（1）の定義において、「ハロ」とは「ハロゲン原子」を意味し、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はフッ素原子を示す。

[0008] 「(C₁ - C₆) アルキル基」は、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、イソペンチル基、ターシャリーペンチル基、ネオペンチル基、2, 3 - ジメチルプロピル基、1 - エチルプロピル基、1 - メチルブチル基、2 - メチルブチル基、ノルマルヘキシル基、イソヘキシル基、2 - ヘキシル基、3 - ヘキシル基、2 - メチルペンチル基、3 - メチルペンチル基、1, 1, 2 - トリメチルプロピル基、3, 3 - ジメチルブチル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキル基を示す。

「(C₂ - C₆) アルケニル基」は、例えばビニル基、アリル基、イソプロペニル基、1 - ブテニル基、2 - ブテニル基、2 - メチル - 2 - プロペニル基、1 - メチル - 2 - プロペニル基、2 - メチル - 1 - プロペニル基、ペン

テニル基、1 - ヘキセニル基、3, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数 2 ~ 6 個のアルケニル基を示す。

「(C₂ - C₆) アルキニル基」は、例えばエチニル基、1 - プロピニル基、2 - プロピニル基、1 - ブチニル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、3 - メチル - 1 - プロピニル基、2 - メチル - 3 - プロピニル基、ペンチニル基、1 - ヘキシニル基、3 - メチル - 1 - ブチニル基、3, 3 - ジメチル - 1 - ブチニル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数 2 ~ 6 個のアルキニル基を示す。

[0009] 「(C₃ - C₆) シクロアルキル基」は、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素原子数 3 ~ 6 個の環状のアルキル基を示し、「(C₁ - C₆) アルコキシ基」は、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ターシャリーペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、2, 3 - ジメチルプロピルオキシ基、1 - エチルプロピルオキシ基、1 - メチルブチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、1, 1, 2 - トリメチルプロピルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルコキシ基を示し、「(C₂ - C₆) アルケニルオキシ基」は、例えば、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基、ペンテニルオキシ基、ヘキセニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 2 ~ 6 個のアルケニルオキシ基を示し、「(C₂ - C₆) アルキニルオキシ基」は、例えば、プロピニルオキシ基、ブチニルオキシ基、ペンチニルオキシ基、ヘキシニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 2 ~ 6 個のアルキニルオキシ基を示す。

[0010] 「(C₁ - C₆) アルキルチオ基」は、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ターシャリーペンチルチオ基、ネオペンチ

ルチオ基、2, 3 - ジメチルプロピルチオ基、1 - エチルプロピルチオ基、1 - メチルブチルチオ基、ノルマルヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、1, 1, 2 - トリメチルプロピルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキルチオ基を示し、「(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基」は、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ノルマルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ターシャリーペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、2, 3 - ジメチルプロピルスルフィニル基、1 - エチルプロピルスルフィニル基、1 - メチルブチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基、1, 1, 2 - トリメチルプロピルスルフィニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキルスルフィニル基を示し、「(C₁ - C₆) アルキルスルホニル基」は、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリーブチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ターシャリーペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、2, 3 - ジメチルプロピルスルホニル基、1 - エチルプロピルスルホニル基、1 - メチルブチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基、1, 1, 2 - トリメチルプロピルスルホニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキルスルホニル基を示す。

[0011] 「(C₂ - C₆) アルケニルチオ基」は、例えば、プロペニルチオ基、ブテニルチオ基、ペンテニルチオ基、ヘキセニルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 2 ~ 6 個のアルケニルチオ基を示し、「(C₂ - C₆) アルキニルチオ基」は、例えば、プロピニルチオ基、ブチニルチオ基、ペンチニルチオ基、ヘキシニルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 2 ~ 6 個のアルキ

ニルチオ基を示す。

[0012] 「(C₁-C₆) アルキルカルボニルアミノ基」は、例えば、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、ノルマルプロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、ノルマルブチルカルボニルアミノ基、セカンダリーブチルカルボニルアミノ基、ターシャリーブチルカルボニルアミノ基、ノルマルペンチルカルボニルアミノ基、イソペンチルカルボニルアミノ基、ターシャリーペンチルカルボニルアミノ基、ネオペンチルカルボニルアミノ基、2, 3 - ジメチルプロピルカルボニルアミノ基、1 - エチルプロピルカルボニルアミノ基、1 - メチルブチルカルボニルアミノ基、ノルマルヘキシルカルボニルアミノ基、イソヘキシルカルボニルアミノ基、1, 1, 2 - トリメチルプロピルカルボニルアミノ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキルカルボニルアミノ基を示す。

「(C₁-C₆) アルコキシカルボニルアミノ基」は、例えば、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、ノルマルプロポキシカルボニルアミノ基、イソプロポキシカルボニルアミノ基、ノルマルブトキシカルボニルアミノ基、セカンダリーブトキシカルボニルアミノ基、ターシャリーブトキシカルボニルアミノ基、ノルマルペントキシカルボニルアミノ基、イソペンチルオキシカルボニルアミノ基、ターシャリーペンチルオキシカルボニルアミノ基、ネオペンチルオキシカルボニルアミノ基、2, 3 - ジメチルプロピルオキシカルボニルアミノ基、1 - エチルプロピルオキシカルボニルアミノ基、1 - メチルブチルオキシカルボニルアミノ基、ノルマルヘキシルオキシカルボニルアミノ基、イソヘキシルオキシカルボニルアミノ基、1, 1, 2 - トリメチルプロピルオキシカルボニルアミノ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルコキシカルボニルアミノ基を示す。

[0013] 上記「(C₁-C₆) アルキル基」、「(C₂-C₆) アルケニル基」、「(C₂-C₆) アルキニル基」、「(C₃-C₆) シクロアルキル基」、「(C₃-C₆) シクロアルキルオキシ基」、「(C₁-C₆) アルコキシ基」、「(C₂-C₆) アルケニルオキシ基」、「(C₂-C₆) アルキニルオキシ基」、「(

C₁－C₆) アルキルチオ基」、「(C₁－C₆) アルキルスルフィニル基」、「(C₁－C₆) アルキルスルホニル基」、「(C₂－C₆) アルケニルチオ基」、「(C₂－C₆) アルキニルチオ基」、「(C₁－C₆) アルキルカルボニルアミノ基」、「(C₁－C₆) アルコキシカルボニルアミノ基」、「(C₂－C₆) アルケニルスルフィニル基」、「(C₂－C₆) アルキニルスルフィニル基」、「(C₂－C₆) アルケニルスルホニル基」、「(C₂－C₆) アルキニルスルホニル基」、(C₃－C₆) シクロアルキルチオ基」、「(C₃－C₆) シクロアルキルスルフィニル基」又は「(C₃－C₆) シクロアルキルスルホニル基」の水素原子が置換され得る位置において1又は2以上のハロゲン原子によって置換されていても良く、置換するハロゲン原子が2以上の場合は、ハロゲン原子は同一又は異なっても良い。

[0014] 上記1又は2以上のハロゲン原子が置換された置換基は、それぞれ、「ハロ(C₁－C₆) アルキル基」、「ハロ(C₂－C₆) アルケニル基」、「ハロ(C₂－C₆) アルキニル基」、「ハロ(C₃－C₆) シクロアルキル基」、「ハロ(C₃－C₆) シクロアルキルオキシ基」、「ハロ(C₁－C₆) アルコキシ基」、「ハロ(C₂－C₆) アルケニルオキシ基」、「ハロ(C₂－C₆) アルキニルオキシ基」、「ハロ(C₁－C₆) アルキルチオ基」、「ハロ(C₁－C₆) アルキルスルフィニル基」、「ハロ(C₁－C₆) アルキルスルホニル基」、「ハロ(C₂－C₆) アルケニルチオ基」、「ハロ(C₂－C₆) アルキニルチオ基」、「ハロ(C₁－C₆) アルキルカルボニルアミノ基」、「ハロ(C₁－C₆) アルコキシカルボニルアミノ基」、「ハロ(C₂－C₆) アルケニルスルフィニル基」、「ハロ(C₂－C₆) アルキニルスルフィニル基」、「ハロ(C₂－C₆) アルケニルスルホニル基」、「ハロ(C₂－C₆) アルキニルスルホニル基」、「ハロ(C₃－C₆) シクロアルキルチオ基」、「ハロ(C₃－C₆) シクロアルキルスルフィニル基」又は「ハロ(C₃－C₆) シクロアルキルスルホニル基」を示す。本発明における置換基自体の意義及び例示はいずれも、当該技術分野において当業者にとって自明のものである。

[0015] 「(C₁－C₆)」、「(C₂－C₆)」、「(C₃－C₆)」等の表現は各種

置換基の炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「 (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基」の場合は直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1～6 個のアルコキシ基が直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1～6 個のアルキル基に結合していることを示す。

[0016] 本発明の一般式 (1) で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物の塩類としては、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、磷酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

[0017] 本発明の一般式 (1) で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物及びその塩類は、その構造式中に 1 つ又は複数個の不斉中心を有する場合があり、2 種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式 (1) で表される化合物及びその塩類は、その構造式中に炭素-炭素二重結合に由来する 2 種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。本発明の化合物はオキシム基によるシン異性体 (Z 異性体) とアンチ異性体 (E 異性体) があるが、本発明はいずれの異性体であってもよく、また、それらの任意の割合の異性体混合物であってもよい。

[0018] 本発明の一般式 (1) で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類において、一般式 (1) 中、 R^1 は、(a1) ハロゲン原子；(a2) (C_1-C_6) アルコキシ基；(a3) (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；(a4) (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；(a5) (C_1-C_6) アルキルチオ基；(a6) (C_2-C_6) アルケニルチオ基；(a7) (C_2-C_6) アルキニルチオ基；(a8) イミダゾール基；(a9) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シ

アノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C_1-C_6) アルキル基、(f)ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(g) (C_1-C_6) アルコキシ基、(h)ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(i) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルコキシ基、(j) (C_1-C_6) アルキルチオ基、(k)ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(l) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(n) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基から選択される 1～3 の置換基を環上に有するイミダゾール基；(a10) トリアゾール基；又は(a11) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C_1-C_6) アルキル基、(f)ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(g) (C_1-C_6) アルコキシ基、(h)ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(i) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルコキシ基、(j) (C_1-C_6) アルキルチオ基、(k)ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(l) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(n) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基から選択される 1～2 の置換基を環上に有するトリアゾール基；が好ましく。 R^2 は、(b1) 水素原子；(b2) (C_1-C_6) アルキル基；(b3) (C_2-C_6) アルケニル基；(b4) (C_2-C_6) アルキニル基；(b5) (C_3-C_6) シクロアルキル基；(b6) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；(b7) (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基；(b8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(b9) ハロ (C_2-C_6) アルケニル基；又は(b10) ハロ (C_2-C_6) アルキニル基；が好ましい。 R^3 は、(c1) ハロゲン原子；(c2) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(c3) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；(c4) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；(c5) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；又は(c6) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基；が好ましく。 A はO、又はN - R^4 (ここで R^4 は、(e1) (C_1-C_6) アルキル基；(e2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；(e3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は(e4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す)が好ましい。 A^1 はCH基、又は窒素原子が好ましく、 m は0、1、又は2が好ましく、

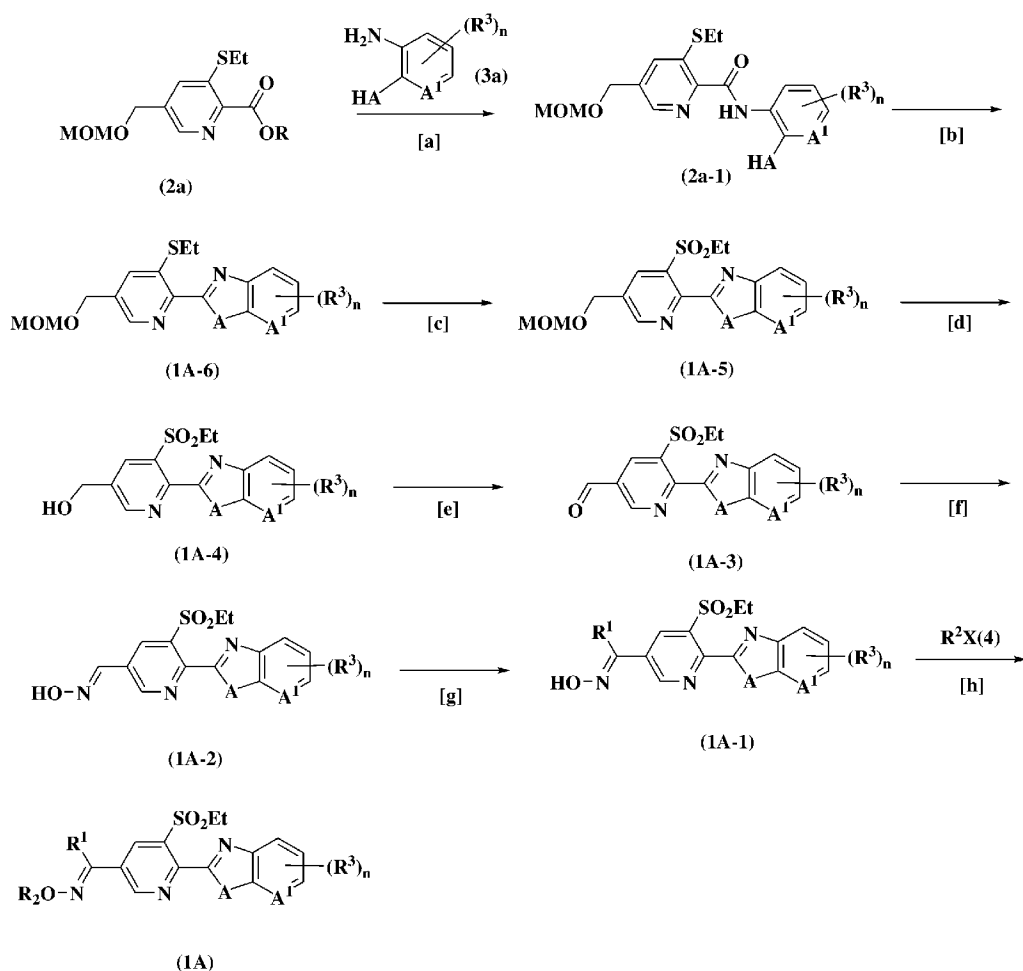
nは0、1、又は2が好ましい。

上記で定義される R^1 、 R^2 、 R^3 、A、 A^1 、m及びnの組み合わせが、式(1)の好ましい例である。

[0019] 本発明のオキシム基を有する複合複素環化合物又はその塩類は、例えば下記製造方法によって製造することができるが、本発明はこれらに限定されるものではない。本発明の製造方法で使用される中間化合物は公知方法又は自体公知の方法によって製造される。

[0020] 製造方法 1

[化2]



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、A、 A^1 及びnは前記と同じ。Xはハロゲン原子等の脱離基を示し、MOMはメトキシメチルを意味する。)

[0021] 工程 [a] の製造方法

一般式 (2 a - 1) で表される化合物は、一般式 (2 a) で表わされる化合物と一般式 (3 a) で表わされる化合物とを、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより製造することができる。

[0022] 本反応で使用するする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、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属ヒドリド類、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム *t*-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (3 a) で表される化合物に対して通常 1 倍モル～10 倍モルの範囲で使用される。

[0023] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化脂肪族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

[0024] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48 時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的

物を含む反応混合物から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0025] 工程 [b] の製造方法

一般式 (1 A - 6) で表される化合物は、一般式 (2 a - 1) で表される化合物を不活性溶媒の存在下、Synthesis 1, 1981 に記載された方法に従って（好ましくはアゾジカルボン酸ジエステル類、及びトリフェニルホスフィンの存在下で）製造することができる。

[0026] 工程 [c] の製造方法

一般式 (1 A - 5) で表される化合物は、一般式 (1 A - 6) で表される化合物を、不活性溶媒中、酸化剤と反応させることにより製造することができる。

[0027] 本反応で使用する酸化剤としては、過酸化水素水、過安息香酸、m - クロル過安息香酸などの過酸化物などが挙げられる。これら酸化剤は、一般式 (1 A - 6) で表される化合物類に対して 3 倍モル～5 倍モルの範囲で適宜選択することができる。

[0028] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、蟻酸、酢酸等の有機酸類、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン、水等の極性溶媒を例として挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

[0029] 本反応における反応温度は - 10℃ から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化

し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。反応終了後、目的物を含む反応混合物から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0030] 工程 [d] の製造方法

一般式 (1A-4) で表される化合物は、一般式 (1A-5) で表される化合物を、Greene's Protective GROUPS in Organic SYNTHESIS (4th Edition) に記載の方法により、脱保護することにより、製造することができる。

[0031] 工程 [e] の製造方法

一般式 (1A-3) で表される化合物は、一般式 (1A-4) で表される化合物を、Synthesis 1153, 1996に記載された方法により製造することができる。

[0032] 工程 [f] の製造方法

一般式 (1A-2) で表される化合物は、一般式 (1A-3) で表される化合物を、ORGANIC FUNCTIONAL GROUP PREPARATIONS III 2th edition (ACADEMIC PRESS, INC.) に記載された方法に従ってホルミル基をオキシム基に変換することにより製造することができる。

[0033] 工程 [g] の製造方法

一般式 (1A-1) で表される化合物は、Journal of Agricultural and Food Chemistry, 56 (15), 6562-6566, 2008に記載された方法、即ち、一般式 (1A-2) で表される化合物を、不活性溶媒中、tert-Butyl Hypochlorite、N-ブロモスクシンイミド (NBS)、又はN-クロロスクシンイミド (NCS) 等と反応させて、ハロイミデート化合物に誘導した後、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、1, 2, 4-トリアゾール等の求核試薬と反応させることにより製造することができる。又は、前

記反応により製造したハロイミデート化合物を、後述の工程〔j〕の製造方法に記載したクロスカップリング反応にて製造することもできる。

[0034] 工程〔h〕の製造方法

一般式（1 A）で表される化合物は、一般式（1 A - 1）で表される化合物と一般式（4）で表される化合物とを、塩基、及び不活性溶媒下、反応させることにより、製造することができる。

[0035] 本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム *t*-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式（1 A - 1）で表される化合物に対して通常1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。

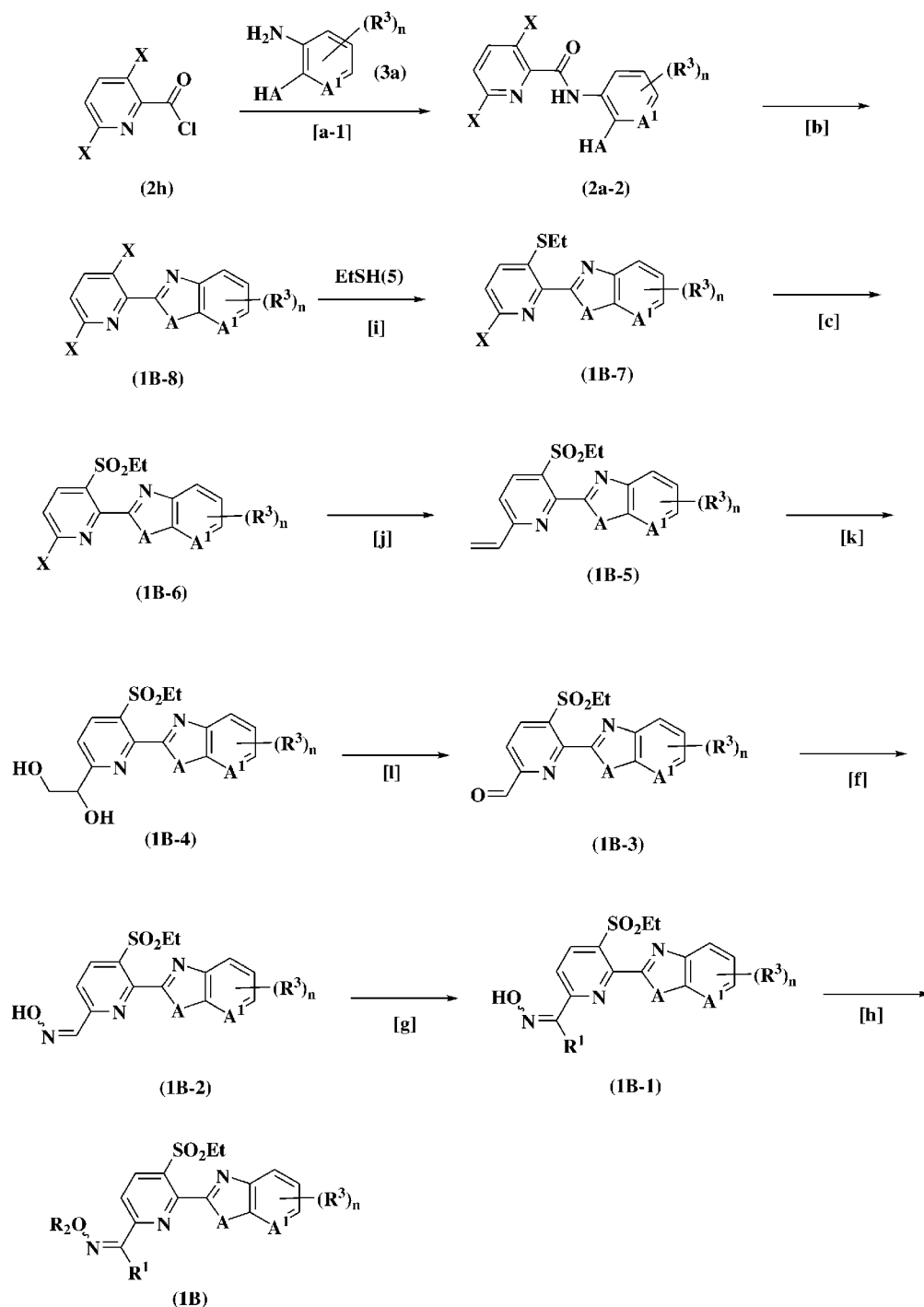
[0036] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0037] 本反応は等モル反応であるので、一般式（1 A - 1）で表わされる化合物と一般式（4）で表される化合物を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は-10℃から使用する不活

性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応混合物から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0038] 製造方法2

[化3]



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 A 、 A^1 、及び n は前記と同じであって、Etはエチル基を示し、Xはハロゲン原子を示す。)

[0039] 工程 [a - 1] の製造方法

一般式 (2 a - 2) で表されるアミド化合物は、3、6 - ジクロロピリジ

ン - 2 - カルボン酸から通常の方法により製造した一般式 (2 h) で表されるカルボン酸クロリドと一般式 (3 a) で表される化合物とを塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより製造することができる。

[0040] 本反応で 사용할 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、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属ヒドリド類、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム *t* - ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8 - ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック - 7 - エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (2 h) で表される化合物に対して通常 1 倍モル ~ 10 倍モルの範囲で使用される。

[0041] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

[0042] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分 ~ 48 時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応混合物から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて

再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0043] 工程 [b] の製造方法

一般式 (1 B - 8) で表される化合物は、一般式 (2 a - 2) で表されるアミド化合物を、製造方法 1 の工程 [b] に記載した方法に従って製造することができる。

[0044] 工程 [i] の製造方法

一般式 (1 B - 7) で表される化合物は、一般式 (1 B - 8) で表される化合物と、一般式 (5) で表される化合物とを塩基、及び不活性溶媒下、反応させることにより製造することができる。

[0045] 本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム *t*-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8 - ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック - 7 - エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (1 B - 8) で表される化合物に対して通常 1 倍モル ~ 10 倍モルの範囲で使用される。また一般式 (5) で表わされる化合物のアルカリ塩を使用する場合は、塩基を使用しなくてもよい。

[0046] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチ

ルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0047] 本反応は等モル反応であるので、一般式(1B-8)で表される化合物と一般式(5)で表わされる化合物を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は-10℃から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応混合物から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0048] 工程[c]の製造方法

一般式(1B-6)で表される化合物は、一般式(1B-7)で表される化合物を、製造方法1の工程[c]に記載した方法に従って製造することができる。

[0049] 工程[j]の製造方法

一般式(1B-5)で表される化合物は、一般式(1B-6)で表される化合物とビニルホウ酸化合物とを金属触媒並びに、塩基の存在下、不活性溶媒中にて、クロスカップリング反応を行い、製造することができる。

[0050] 本反応で 사용할 ことができる金属触媒としては、例えば、パラジウム触媒、ニッケル触媒、鉄触媒、ルテニウム触媒、白金触媒、ロジウム触媒、イリジウム触媒等を列挙することができる。これらの金属触媒は、「金属」、「担持金属」、「金属の塩化物、臭化物、ヨウ化物、硝酸塩、硫酸塩、炭酸塩、シュウ酸塩、酢酸塩または酸化物等の金属塩」、「オレフィン錯体、ホスフィン錯体、アミン錯体、アンミン錯体又はアセチルアセトナート錯体等の錯化合物」を用いることができる。好ましくはパラジウム触媒である。

[0051] パラジウム触媒としては、パラジウム黒、パラジウムスポンジ等のパラジウム金属が例示でき、また、パラジウム／アルミナ、パラジウム／炭素、パ

ラジウム／シリカ、パラジウム／Ｙ型ゼオライト等の担持パラジウム金属も例示できる。また、塩化パラジウム、臭化パラジウム、ヨウ化パラジウム、酢酸パラジウム等の金属塩を例示できる。さらに、 π -アリルパラジウムクロリドダイマー、パラジウムアセチルアセトナート、ジクロロビス（アセトニトリル）パラジウム、ジクロロビス（ベンゾニトリル）パラジウム、ビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウム、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（クロロホルム付加物）、ジクロロジアミンパラジウム、ジクロロビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、ジクロロビス（トリシクロヘキシルホスフィン）パラジウム、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、ジクロロ[1, 2-ビス（ジフェニルホスフィノ）エタン]パラジウム、ジクロロ[1, 3-ビス（ジフェニルホスフィノ）プロパン]パラジウム、ジクロロ[1, 4-ビス（ジフェニルホスフィノ）ブタン]パラジウム、ジクロロ[1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン]パラジウム、ジフェニルホスフィノフェロセンジクロロパラジウム・ジクロロメタン錯体等の錯化合物を例示できる。

- [0052] これらのパラジウム触媒は単独で使用しても良いが、さらに三級ホスフィンと組み合わせて使用しても良い。使用することのできる三級ホスフィンとしては、トリフェニルホスフィン、トリメチルホスフィン、トリエチルホスフィン、トリブチルホスフィン、トリ（*tert*-ブチル）ホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリーオトリルホスフィン、トリオクチルホスフィン、9, 9-ジメチル-4, 5-ビス（ジフェニルホスフィノ）キサンテン、2-（ジ-*tert*-ブチルホスフィノ）ビフェニル、2-（ジシクロヘキシルホスフィノ）ビフェニル、1, 2-ビス（ジフェニルホスフィノ）エタン、1, 3-ビス（ジフェニルホスフィノ）プロパン、1, 4-ビス（ジフェニルホスフィノ）ブタン、1, 1'-ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン、（*R*）-（+）-2, 2'-ビス（ジフェニルホスフィノ）-1, 1'-ビナフチル、（*S*）-（-）-2, 2'-ビス（ジフェニル

ホスフィノ) - 1, 1' - ビナフチル、(±) - 2, 2' - ビス (ジフェニルホスフィノ) - 1, 1' - ビナフチル等が例示できる。

[0053] 本反応で使用する事ができるビニルホウ酸化合物としては、臭化ビニルマグネシウム、塩化ビニルマグネシウム、塩化ビニル亜鉛、トリブチルビニルスズ、ビニルトリフルオロホウ酸カリウム、ビニルホウ酸、ビニルホウ酸無水物、ビニルホウ酸 2 - メチル - 2, 4 - ペンタンジオールエステル、ビニルホウ酸ピナコールエステル、トリエトキシビニルシラン等を例示することができる。

[0054] 本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化アルカリ金属、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルコキシド類が挙げられる。塩基の使用量は一般式 (1 B - 6) で表される化合物に対して通常約 1 倍モル～5 倍モルの範囲で使用する。

[0055] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2 - プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン (DME) 等の鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の極性溶媒及び水を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

[0056] 本反応における反応温度は通常約 0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～4

8時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応混合物から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0057] 工程 [k] の製造方法

一般式 (1 B - 4) で表されるジオール縮合複素環化合物は、一般式 (1 B - 5) で表されるビニル縮合複素環化合物を四酸化オスミウムと酸化剤の存在下、第4版実験化学講座23、有機化学V、-酸化反応- (丸善株式会社) に記載してある方法に従って製造することかできる。反応終了後、目的物を含む反応混合物から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0058] 工程 [l] の製造方法

一般式 (1 B - 3) で表される化合物は、一般式 (1 B - 4) で表されるジオール化合物と過ヨウ素酸化合物を、不活性溶媒の存在下、新実験化学講座15、酸化と還元1-1 (丸善株式会社) に記載してある方法に従って反応させ製造することかできる。反応終了後、目的物を含む反応混合物から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0059] 工程 [f] の製造方法

一般式 (1 B - 2) で表される化合物は、一般式 (1 B - 3) で表される化合物を、製造方法1の工程 [f] に記載された方法に従って製造することができる。

[0060] 工程 [g] の製造方法

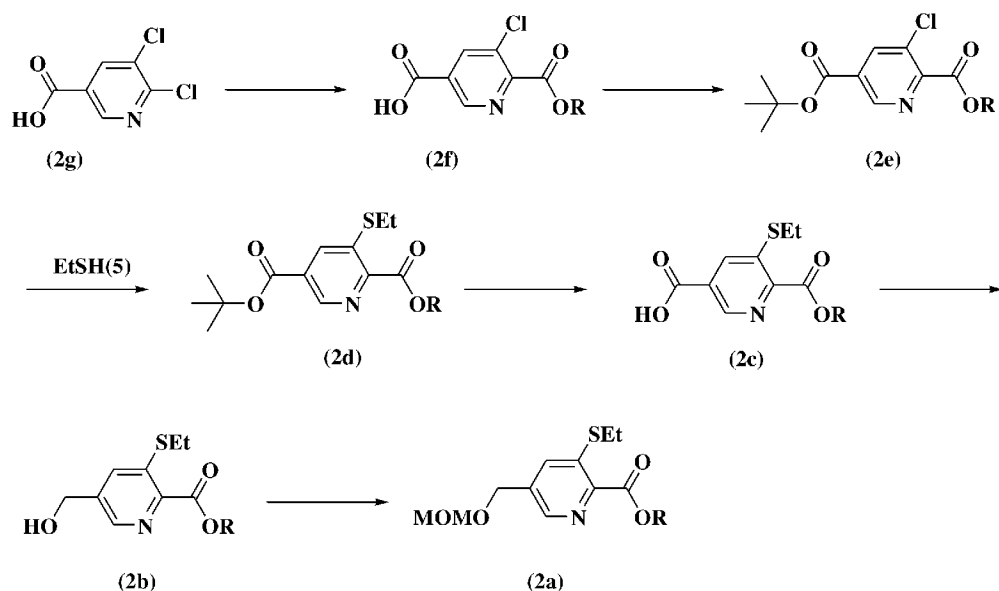
一般式 (1 B - 1) で表される化合物は、一般式 (1 B - 2) で表される化合物を、製造方法1の工程 [g] に記載された方法に従って製造することができる。

[0061] 工程 [h] の製造方法

一般式 (1 B) で表される化合物は、一般式 (1 B - 1) で表される化合物を、製造方法 1 の工程 [h] に記載された方法に従って製造することができる。

[0062] 中間体 (2 a) の製造方法

[化4]



(式中、RはC₁-C₄のアルキル基を示す。)

[0063] 一般式 (2 a) で表わされる本発明化合物の製造中間体は、以下の方法により製造することができる。

[0064] 入手可能な5、6-ジクロロピリジン-3-カルボン酸 (2 g) を特開 2005-272338号に記載された方法 (ヘック反応) に従って、6位にエステル基が導入されたピリジン-3-カルボン酸 (2 f) を合成することができる。反応終了後、目的物を含む反応混合物から常法により目的物を単離すれば良く、所望により再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0065] ピリジン-2, 6-ジカルボン酸エステル (2 e) は、通常の合成法に従って、先ずエステル基が導入されたピリジン-3-カルボン酸 (2 f) と塩素化剤とを不活性溶媒下、反応させることにより、ピリジンカルボン酸クロ

リド体に誘導し、その後ターシャリーブチルアルコールと反応させることにより製造することができる。

[0066] ピリジンジカルボン酸エステル (2 d) は、一般式 (2 e) で表されるピリジンのターシャリーブチルエステル化合物と一般式 (5) で表わされる化合物とを塩基、及び不活性溶媒下、反応させることにより、製造することができる。

[0067] 本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム *t*-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (2 e) で表されるターシャリーブチルエステル化合物に対して通常 1 倍モル～10 倍モルの範囲で使用される。また一般式 (5) で表わされる化合物のアルカリ塩を使用する場合は、塩基を使用しなくてもよい。

[0068] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0069] 本反応は等モル反応であるので、一般式 (5) で表わされる化合物と一般

式(2e)で表されるピリジンのターシャリーブチルエステル化合物を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は-10℃から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応混合物から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0070] ピリジンジカルボン酸(2c)は、一般式(2d)で表されるピリジンのターシャリーブチルエステル化合物を酸及び/又は不活性溶媒下、加水分解させることにより製造することができる。

[0071] 本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等のスルホン酸等を例示することができ、その使用量は一般式(2-d)で表されるターシャリーブチルエステル化合物に対して1倍モル～10倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。場合によっては、当該酸類を溶媒として使用することもできる。

[0072] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。また前記酸類を溶媒として使用する場合は溶媒を使用しなくてもよい。

[0073] 反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応

時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。

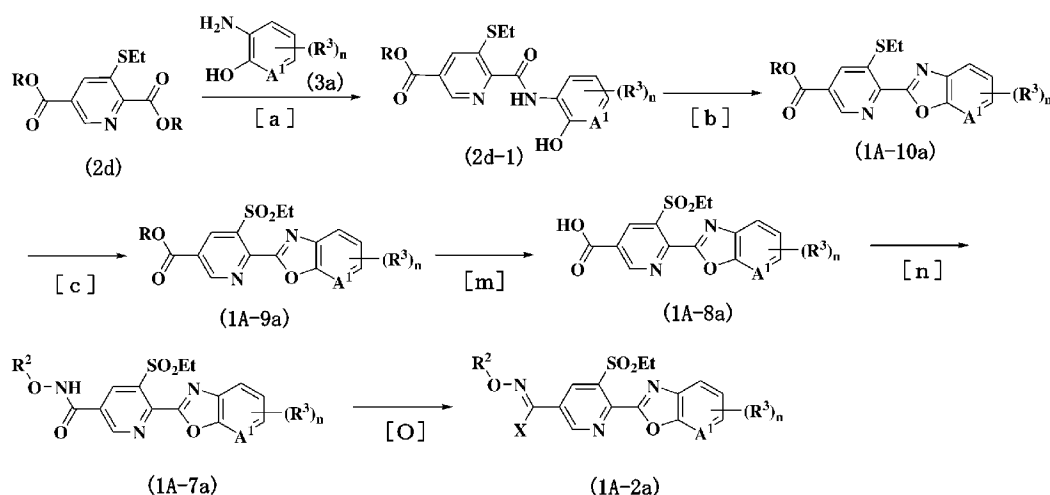
反応終了後、目的物を含む反応混合物から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0074] 一般式(2b)で表わされる化合物は、一般式(2c)で表わされる化合物を、通常方法によってカルボン酸からカルボン酸クロリドに誘導した後、当該カルボン酸クロリドを水素化ホウ素ナトリウム(NaBH_4)により還元することにより製造することができる。

[0075] 一般式(2a)で表わされる化合物は、当該化合物を、Greene's Protective Groups in Organic Synthesis (4th Edition) に記載の方法により製造することができる。

[0076] 中間体(1A-2a)の製造方法

[化5]



(式中、 R^2 、 R^3 、及び A^1 は前記と同じであって、 X はハロゲン原子、 R は $\text{C}_1\text{-C}_4$ のアルキル基を示す。)

[0077] 一般式(2d-1)で表わされる化合物は、上記中間体(2a)の製造方法にて製造することができる一般式(2d)で表わされる化合物を、上記製造方法1の工程[a]の製造方法と同様な方法にて製造することができる。

[0078] 一般式(1A-10a)で表わされる化合物は、一般式(2d-1)で表わ

される化合物を、上記製造方法 1 の工程 [b] の製造方法と同様な方法にて製造することができる。

[0079] 一般式 (1 A - 9 a) で表わされる化合物は、一般式 (1 A - 10 a) で表わされる化合物を、上記製造方法 1 の工程 [c] の製造方法と同様な方法にて製造することができる。

[0080] 工程 [m] の製造方法

一般式 (1 A - 8 a) で表わされる化合物は、一般式 (1 A - 9 a) で表わされる化合物を、酸及び/又は不活性溶媒下、加水分解させることにより製造することができる。

[0081] 本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等のスルホン酸等を例示することができ、その使用量は一般式 (1 A - 9 a) で表される化合物に対して 1 倍モル～10 倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。場合によっては、当該酸類を溶媒として使用することもできる。

[0082] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。また前記酸類を溶媒として使用する場合は他の溶媒を使用しなくてもよい。

[0083] 反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48 時間の範囲で行

えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応混合物から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0084] 工程 [n] の製造方法

一般式 (1 A - 7 a) で表わされる化合物は、一般式 (1 A - 8 a) で表わされる化合物と R^2O-NH_2 (R^2 は、前記と同じ。) で表わされる化合物とを、縮合剤、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより製造することができる。

[0085] 本反応で使用する縮合剤としては、例えば 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチル塩酸塩 (EDCI)、カルボジイミド塩酸塩シアノリン酸ジエチル (DEPC)、カルボニルジイミダゾール (CDI)、1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化 2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウム等を例示することができ、その使用量は一般式 (1 A - 8 a) で表される化合物に対して 1 倍モル ~ 1.5 倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

[0086] 塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類；カリウム t - ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8 - ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデック - 7 - エン等の第三級アミン類；ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は (1 A - 8 a) で表される化合物に対して通常 1 倍モル ~ 10 倍モルの範囲で使用される。

[0087] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類

；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類；酢酸エチル等のエステル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0088] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応混合物から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0089] 工程 [O] の製造方法

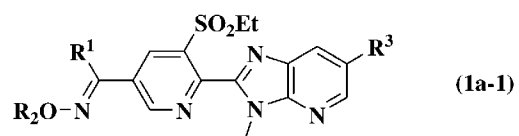
一般式 (1 A - 2 a) で表わされる化合物は、一般式 (1 A - 7 a) で表わされる化合物を、トリフェニルホスフィンと四塩化炭素又は四臭化炭素と反応させる、所謂アップル反応 (O r g . S y n t h . 54, 63 - 63) にて製造することができる。

[0090] 前製造方法にて製造した一般式 (1 A - 2 a) で表わされる化合物は、製造方法 1 に記載された工程 [g] に記載した製造方法により、一般式 (1 A) を製造することができる。

[0091] 次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。下記の表において、Me はメチル基を表し、Et はエチル基を示し、n - Pr はノルマルプロピル基、i - Pr はイソプロピル基、i - Bu はイソブチル基、t - Bu はターシャリーブチル基を示す。物性は融点又はNMRを示す。第32表にNMRデータを示す。

[0092]

[化6]



[0093] [表1]

第1表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
1-1	OMe	Me	CF ₃	
1-2	OMe	Et	CF ₃	
1-3	OMe	n-Pr	CF ₃	
1-4	OMe	i-Pr	CF ₃	
1-5	OMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-6	OMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	NMR
1-7	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-8	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
1-9	OMe	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
1-10	OMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	NMR
1-11	OEt	Me	CF ₃	
1-12	OEt	Et	CF ₃	
1-13	OEt	n-Pr	CF ₃	
1-14	OEt	i-Pr	CF ₃	
1-15	OEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-16	OEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
1-17	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-18	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
1-19	OEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
1-20	OEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
1-21	On-Pr	Me	CF ₃	
1-22	On-Pr	Et	CF ₃	
1-23	On-Pr	n-Pr	CF ₃	
1-24	On-Pr	i-Pr	CF ₃	
1-25	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	

[0094]

[表2]

第2表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
1-26	On-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
1-27	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-28	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
1-29	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
1-30	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
1-31	Oi-Pr	Me	CF ₃	
1-32	Oi-Pr	Et	CF ₃	
1-33	Oi-Pr	n-Pr	CF ₃	
1-34	Oi-Pr	i-Pr	CF ₃	
1-35	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-36	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
1-37	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-38	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
1-39	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
1-40	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
1-41	Ot-Bu	Me	CF ₃	
1-42	Ot-Bu	Et	CF ₃	
1-43	Ot-Bu	n-Pr	CF ₃	
1-44	Ot-Bu	i-Pr	CF ₃	
1-45	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-46	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
1-47	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-48	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
1-49	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
1-50	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	

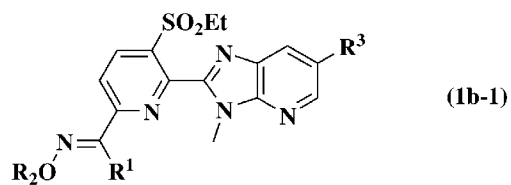
[0095]

[表3]

第3表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
1-51	SEt	Me	CF ₃	
1-52	SEt	Et	CF ₃	
1-53	SEt	n-Pr	CF ₃	
1-54	SEt	i-Pr	CF ₃	
1-55	SEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-56	SEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
1-57	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-58	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
1-59	SEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
1-60	SEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
1-61	1,2,4-Triazolyl	Me	CF ₃	
1-62	1,2,4-Triazolyl	Et	CF ₃	
1-63	1,2,4-Triazolyl	n-Pr	CF ₃	
1-64	1,2,4-Triazolyl	i-Pr	CF ₃	
1-65	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-66	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	198-199
1-67	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
1-68	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
1-69	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
1-70	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
1-71	NHAc	CH ₂ CF ₃	CF ₃	168-169

[0096] [化7]



[0097]

[表4]

第4表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
2-1	OMe	Me	CF ₃	
2-2	OMe	Et	CF ₃	
2-3	OMe	n-Pr	CF ₃	
2-4	OMe	i-Pr	CF ₃	
2-5	OMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-6	OMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	112-113
2-7	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-8	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
2-9	OMe	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
2-10	OMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
2-11	OEt	Me	CF ₃	
2-12	OEt	Et	CF ₃	
2-13	OEt	n-Pr	CF ₃	
2-14	OEt	i-Pr	CF ₃	
2-15	OEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-16	OEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
2-17	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-18	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
2-19	OEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
2-20	OEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
2-21	On-Pr	Me	CF ₃	
2-22	On-Pr	Et	CF ₃	
2-23	On-Pr	n-Pr	CF ₃	
2-24	On-Pr	i-Pr	CF ₃	
2-25	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	

[0098]

[表5]

第5表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
2-26	On-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
2-27	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-28	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
2-29	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
2-30	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
2-31	Oi-Pr	Me	CF ₃	
2-32	Oi-Pr	Et	CF ₃	
2-33	Oi-Pr	n-Pr	CF ₃	
2-34	Oi-Pr	i-Pr	CF ₃	
2-35	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-36	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
2-37	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-38	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
2-39	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
2-40	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
2-41	Ot-Bu	Me	CF ₃	
2-42	Ot-Bu	Et	CF ₃	
2-43	Ot-Bu	n-Pr	CF ₃	
2-44	Ot-Bu	i-Pr	CF ₃	
2-45	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-46	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
2-47	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-48	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
2-49	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
2-50	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	

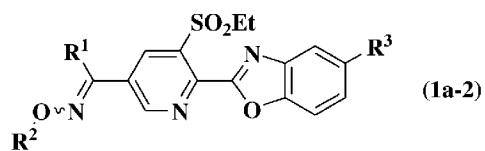
[0099]

[表6]

第6表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
2-51	SEt	Me	CF ₃	
2-52	SEt	Et	CF ₃	
2-53	SEt	n-Pr	CF ₃	
2-54	SEt	i-Pr	CF ₃	
2-55	SEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-56	SEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
2-57	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-58	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
2-59	SEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
2-60	SEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
2-61	1,2,4-Triazole	Me	CF ₃	
2-62	1,2,4-Triazole	Et	CF ₃	
2-63	1,2,4-Triazole	n-Pr	CF ₃	
2-64	1,2,4-Triazole	i-Pr	CF ₃	
2-65	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-66	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
2-67	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
2-68	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
2-69	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
2-70	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	

[0100] [化8]



[0101]

[表7]

第7表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-1	OMe	Me	CF ₃	
3-2	OMe	Et	CF ₃	
3-3	OMe	n-Pr	CF ₃	
3-4	OMe	i-Pr	CF ₃	
3-5	OMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-6	OMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	167-168
3-7	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-8	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-9	OMe	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
3-10	OMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
3-11	OEt	Me	CF ₃	
3-12	OEt	Et	CF ₃	
3-13	OEt	n-Pr	CF ₃	
3-14	OEt	i-Pr	CF ₃	
3-15	OEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-16	OEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
3-17	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-18	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-19	OEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
3-20	OEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
3-21	On-Pr	Me	CF ₃	
3-22	On-Pr	Et	CF ₃	
3-23	On-Pr	n-Pr	CF ₃	
3-24	On-Pr	i-Pr	CF ₃	
3-25	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	

[0102]

[表8]

第8表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-26	On-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
3-27	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-28	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-29	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
3-30	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
3-31	Oi-Pr	Me	CF ₃	
3-32	Oi-Pr	Et	CF ₃	
3-33	Oi-Pr	n-Pr	CF ₃	
3-34	Oi-Pr	i-Pr	CF ₃	
3-35	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-36	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
3-37	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-38	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-39	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
3-40	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
3-41	Ot-Bu	Me	CF ₃	
3-42	Ot-Bu	Et	CF ₃	
3-43	Ot-Bu	n-Pr	CF ₃	
3-44	Ot-Bu	i-Pr	CF ₃	
3-45	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-46	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
3-47	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-48	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-49	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
3-50	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	

[0103]

[表9]

第9表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-51	SEt	Me	CF ₃	
3-52	SEt	Et	CF ₃	
3-53	SEt	n-Pr	CF ₃	
3-54	SEt	i-Pr	CF ₃	
3-55	SEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-56	SEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
3-57	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-58	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-59	SEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
3-60	SEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
3-61	1,2,4-Triazole	Me	CF ₃	
3-62	1,2,4-Triazole	Et	CF ₃	
3-63	1,2,4-Triazole	n-Pr	CF ₃	
3-64	1,2,4-Triazole	i-Pr	CF ₃	
3-65	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-66	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
3-67	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
3-68	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-69	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
3-70	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	

[0104]

[表10]

第10表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-71	OMe	Me	SCF ₃	
3-72	OMe	Et	SCF ₃	
3-73	OMe	n-Pr	SCF ₃	
3-74	OMe	i-Pr	SCF ₃	
3-75	OMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-76	OMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	135-136
3-77	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-78	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-79	OMe	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
3-80	OMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
3-81	OEt	Me	SCF ₃	
3-82	OEt	Et	SCF ₃	
3-83	OEt	n-Pr	SCF ₃	
3-84	OEt	i-Pr	SCF ₃	
3-85	OEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-86	OEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	118-119
3-87	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-88	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-89	OEt	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
3-90	OEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
3-91	On-Pr	Me	SCF ₃	
3-92	On-Pr	Et	SCF ₃	
3-93	On-Pr	n-Pr	SCF ₃	
3-94	On-Pr	i-Pr	SCF ₃	
3-95	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	

[0105]

[表11]

第11表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-96	On-Pr	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-97	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-98	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-99	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
3-100	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
3-101	Oi-Pr	Me	SCF ₃	
3-102	Oi-Pr	Et	SCF ₃	
3-103	Oi-Pr	n-Pr	SCF ₃	
3-104	Oi-Pr	i-Pr	SCF ₃	
3-105	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-106	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-107	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-108	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-109	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
3-110	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
3-111	Ot-Bu	Me	SCF ₃	
3-112	Ot-Bu	Et	SCF ₃	
3-113	Ot-Bu	n-Pr	SCF ₃	
3-114	Ot-Bu	i-Pr	SCF ₃	
3-115	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-116	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-117	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-118	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-119	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
3-120	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	

[0106]

[表12]

第12表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-121	SEt	Me	SCF ₃	
3-122	SEt	Et	SCF ₃	
3-123	SEt	n-Pr	SCF ₃	
3-124	SEt	i-Pr	SCF ₃	
3-125	SEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-126	SEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	98-99
3-127	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-128	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-129	SEt	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
3-130	SEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
3-131	1,2,4-Triazole	Me	SCF ₃	
3-132	1,2,4-Triazole	Et	SCF ₃	
3-133	1,2,4-Triazole	n-Pr	SCF ₃	88-89
3-134	1,2,4-Triazole	i-Pr	SCF ₃	
3-135	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-136	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-137	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
3-138	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
3-139	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
3-140	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	

[0107]

[表13]

第13表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-141	OMe	Me	OCF ₃	
3-142	OMe	Et	OCF ₃	
3-143	OMe	n-Pr	OCF ₃	
3-144	OMe	i-Pr	OCF ₃	
3-145	OMe	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-146	OMe	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	129-130
3-147	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-148	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-149	OMe	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
3-150	OMe	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
3-151	OEt	Me	OCF ₃	
3-152	OEt	Et	OCF ₃	
3-153	OEt	Pr	OCF ₃	
3-154	OEt	i-Pr	OCF ₃	
3-155	OEt	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-156	OEt	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-157	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-158	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-159	OEt	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
3-160	OEt	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
3-161	OPr	Me	OCF ₃	
3-162	OPr	Et	OCF ₃	
3-163	OPr	n-Pr	OCF ₃	
3-164	OPr	i-Pr	OCF ₃	
3-165	OPr	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	

[0108]

[表14]

第14表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-166	OPr	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-167	OPr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-168	OPr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-169	OPr	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
3-170	OPr	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
3-171	Oi-Pr	Me	OCF ₃	
3-172	Oi-Pr	Et	OCF ₃	
3-173	Oi-Pr	n-Pr	OCF ₃	
3-174	Oi-Pr	i-Pr	OCF ₃	
3-175	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-176	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-177	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-178	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-179	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
3-180	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
3-181	Ot-Bu	Me	OCF ₃	
3-182	Ot-Bu	Et	OCF ₃	
3-183	Ot-Bu	n-Pr	OCF ₃	
3-184	Ot-Bu	i-Pr	OCF ₃	
3-185	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-186	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-187	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-188	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-189	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
3-190	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	

[0109]

[表15]

第15表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-191	SEt	Me	OCF ₃	
3-192	SEt	Et	OCF ₃	
3-193	SEt	n-Pr	OCF ₃	
3-194	SEt	i-Pr	OCF ₃	
3-195	SEt	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-196	SEt	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-197	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-198	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-199	SEt	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
3-200	SEt	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
3-201	1,2,4-Triazole	Me	OCF ₃	
3-202	1,2,4-Triazole	Et	OCF ₃	
3-203	1,2,4-Triazole	n-Pr	OCF ₃	
3-204	1,2,4-Triazole	i-Pr	OCF ₃	
3-205	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-206	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-207	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
3-208	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
3-209	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
3-210	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	

[0110]

[表16]

第16表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-211	OMe	Me	SO ₂ CF ₃	
3-212	OMe	Et	SO ₂ CF ₃	
3-213	OMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-214	OMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-215	OMe	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-216	OMe	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	114-115
3-217	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-218	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-219	OMe	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-220	OMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-221	OEt	Me	SO ₂ CF ₃	
3-222	OEt	Et	SO ₂ CF ₃	
3-223	OEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-224	OEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-225	OEt	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-226	OEt	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-227	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-228	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-229	OEt	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-230	OEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-231	On-Pr	Me	SO ₂ CF ₃	
3-232	On-Pr	Et	SO ₂ CF ₃	
3-233	On-Pr	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-234	On-Pr	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-235	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	

[0111]

[表17]

第17表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-236	On-Pr	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-237	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-238	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-239	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-240	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-241	Oi-Pr	Me	SO ₂ CF ₃	
3-242	Oi-Pr	Et	SO ₂ CF ₃	
3-243	Oi-Pr	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-244	Oi-Pr	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-245	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-246	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-247	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-248	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-249	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-250	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-251	Ot-Bu	Me	SO ₂ CF ₃	
3-252	Ot-Bu	Et	SO ₂ CF ₃	
3-253	Ot-Bu	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-254	Ot-Bu	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-255	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-256	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-257	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-258	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-259	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-260	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	

[0112]

[表18]

第18表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-261	SEt	Me	SO ₂ CF ₃	
3-262	SEt	Et	SO ₂ CF ₃	
3-263	SEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-264	SEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-265	SEt	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-266	SEt	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-267	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-268	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-269	SEt	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-270	SEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-271	1,2,4-Triazolyl	Me	SO ₂ CF ₃	
3-272	1,2,4-Triazolyl	Et	SO ₂ CF ₃	
3-273	1,2,4-Triazolyl	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-274	1,2,4-Triazolyl	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
3-275	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	NMR
3-276	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	166-167
3-277	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
3-278	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
3-279	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-280	1,2,4-Triazolyl	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
3-281	OMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	91-93
3-282	On-Pr	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	60-61
3-283	On-Bu	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	50-51
3-284	Oi-Bu	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	44-45
3-285	OCH ₂ C≡CH	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	53-54

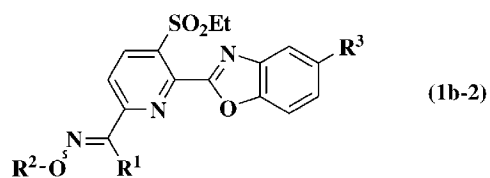
[0113]

[表19]

第19表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
3-286	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	136-137
3-287	OCH ₂ C≡CH	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	122-123
3-288	SMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	NMR
3-289	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	51-52
3-290	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	77-78
3-291	NHAc	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	89-90
3-292	NHCOOMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	167-168
3-293	NHAc	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	131-132
3-294	NMeAc	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	102-103

[0114] [化9]



[0115]

[表20]

第20表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-1	OMe	Me	CF ₃	
4-2	OMe	Et	CF ₃	
4-3	OMe	Pr	CF ₃	
4-4	OMe	i-Pr	CF ₃	
4-5	OMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-6	OMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
4-7	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-8	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-9	OMe	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
4-10	OMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
4-11	OEt	Me	CF ₃	
4-12	OEt	Et	CF ₃	
4-13	OEt	n-Pr	CF ₃	
4-14	OEt	i-Pr	CF ₃	
4-15	OEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-16	OEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
4-17	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-18	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-19	OEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
4-20	OEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
4-21	On-Pr	Me	CF ₃	
4-22	On-Pr	Et	CF ₃	
4-23	On-Pr	n-Pr	CF ₃	
4-24	On-Pr	i-Pr	CF ₃	
4-25	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	

[0116]

[表21]

第21表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-26	On-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
4-27	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-28	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-29	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
4-30	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
4-31	Oi-Pr	Me	CF ₃	
4-32	Oi-Pr	Et	CF ₃	
4-33	Oi-Pr	n-Pr	CF ₃	
4-34	Oi-Pr	i-Pr	CF ₃	
4-35	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-36	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
4-37	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-38	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-39	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
4-40	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
4-41	Ot-Bu	Me	CF ₃	
4-42	Ot-Bu	Et	CF ₃	
4-43	Ot-Bu	n-Pr	CF ₃	
4-44	Ot-Bu	i-Pr	CF ₃	
4-45	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-46	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
4-47	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-48	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-49	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
4-50	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	

[0117]

[表22]

第22表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-51	SEt	Me	CF ₃	
4-52	SEt	Et	CF ₃	
4-53	SEt	n-Pr	CF ₃	
4-54	SEt	i-Pr	CF ₃	
4-55	SEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-56	SEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
4-57	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-58	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-59	SEt	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
4-60	SEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	
4-61	1,2,4-Triazole	Me	CF ₃	
4-62	1,2,4-Triazole	Et	CF ₃	
4-63	1,2,4-Triazole	n-Pr	CF ₃	
4-64	1,2,4-Triazole	i-Pr	CF ₃	
4-65	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-66	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	CF ₃	
4-67	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	
4-68	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-69	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	
4-70	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	

[0118]

[表23]

第23表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-71	OMe	Me	SCF ₃	
4-72	OMe	Et	SCF ₃	
4-73	OMe	n-Pr	SCF ₃	
4-74	OMe	i-Pr	SCF ₃	
4-75	OMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-76	OMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-77	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-78	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-79	OMe	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
4-80	OMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
4-81	OEt	Me	SCF ₃	
4-82	OEt	Et	SCF ₃	
4-83	OEt	n-Pr	SCF ₃	
4-84	OEt	i-Pr	SCF ₃	
4-85	OEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-86	OEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-87	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-88	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-89	OEt	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
4-90	OEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
4-91	On-Pr	Me	SCF ₃	
4-92	On-Pr	Et	SCF ₃	
4-93	On-Pr	n-Pr	SCF ₃	
4-94	On-Pr	i-Pr	SCF ₃	
4-95	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	

[0119]

[表24]

第24表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-96	On-Pr	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-97	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-98	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-99	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
4-100	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
4-101	Oi-Pr	Me	SCF ₃	
4-102	Oi-Pr	Et	SCF ₃	
4-103	Oi-Pr	n-Pr	SCF ₃	
4-104	Oi-Pr	i-Pr	SCF ₃	
4-105	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-106	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-107	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-108	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-109	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
4-110	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
4-111	Ot-Bu	Me	SCF ₃	
4-112	Ot-Bu	Et	SCF ₃	
4-113	Ot-Bu	n-Pr	SCF ₃	
4-114	Ot-Bu	i-Pr	SCF ₃	
4-115	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-116	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-117	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-118	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-119	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
4-120	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	

[0120]

[表25]

第25表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-121	SEt	Me	SCF ₃	
4-122	SEt	Et	SCF ₃	
4-123	SEt	n-Pr	SCF ₃	
4-124	SEt	i-Pr	SCF ₃	
4-125	SEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-126	SEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-127	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-128	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-129	SEt	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
4-130	SEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	
4-131	1,2,4-Triazole	Me	SCF ₃	
4-132	1,2,4-Triazole	Et	SCF ₃	
4-133	1,2,4-Triazole	n-Pr	SCF ₃	
4-134	1,2,4-Triazole	i-Pr	SCF ₃	
4-135	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-136	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-137	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	
4-138	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SCF ₃	
4-139	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	SCF ₃	
4-140	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	

[0121]

[表26]

第26表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-141	OMe	Me	SO ₂ CF ₃	
4-142	OMe	Et	SO ₂ CF ₃	
4-143	OMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-144	OMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-145	OMe	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-146	OMe	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-147	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-148	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-149	OMe	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-150	OMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-151	OEt	Me	SO ₂ CF ₃	
4-152	OEt	Et	SO ₂ CF ₃	
4-153	OEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-154	OEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-155	OEt	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-156	OEt	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-157	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-158	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-159	OEt	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-160	OEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-161	On-Pr	Me	SO ₂ CF ₃	
4-162	On-Pr	Et	SO ₂ CF ₃	
4-163	On-Pr	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-164	On-Pr	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-165	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	

[0122]

[表27]

第27表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-166	On-Pr	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-167	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-168	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-169	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-170	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-171	Oi-Pr	Me	SO ₂ CF ₃	
4-172	Oi-Pr	Et	SO ₂ CF ₃	
4-173	Oi-Pr	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-174	Oi-Pr	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-175	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-176	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-177	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-178	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-179	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-180	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-181	Ot-Bu	Me	SO ₂ CF ₃	
4-182	Ot-Bu	Et	SO ₂ CF ₃	
4-183	Ot-Bu	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-184	Ot-Bu	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-185	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-186	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-187	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-188	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-189	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-190	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	

[0123]

[表28]

第28表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-191	SEt	Me	SO ₂ CF ₃	
4-192	SEt	Et	SO ₂ CF ₃	
4-193	SEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-194	SEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-195	SEt	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-196	SEt	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-197	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-198	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-199	SEt	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-200	SEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-201	1,2,4-Triazole	Me	SO ₂ CF ₃	
4-202	1,2,4-Triazole	Et	SO ₂ CF ₃	
4-203	1,2,4-Triazole	n-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-204	1,2,4-Triazole	i-Pr	SO ₂ CF ₃	
4-205	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-206	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-207	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	
4-208	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	
4-209	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-210	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	
4-211	OMe	Me	OCF ₃	
4-212	OMe	Et	OCF ₃	
4-213	OMe	n-Pr	OCF ₃	
4-214	OMe	i-Pr	OCF ₃	
4-215	OMe	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	

[0124]

[表29]

第29表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-216	OMe	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-217	OMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-218	OMe	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-219	OMe	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
4-220	OMe	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
4-221	OEt	Me	OCF ₃	
4-222	OEt	Et	OCF ₃	
4-223	OEt	n-Pr	OCF ₃	
4-224	OEt	i-Pr	OCF ₃	
4-225	OEt	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-226	OEt	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-227	OEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-228	OEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-229	OEt	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
4-230	OEt	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
4-231	On-Pr	Me	OCF ₃	
4-232	On-Pr	Et	OCF ₃	
4-233	On-Pr	n-Pr	OCF ₃	
4-234	On-Pr	i-Pr	OCF ₃	
4-235	On-Pr	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-236	On-Pr	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-237	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-238	On-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-239	On-Pr	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
4-240	On-Pr	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	

[0125]

[表30]

第30表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-241	Oi-Pr	Me	OCF ₃	
4-242	Oi-Pr	Et	OCF ₃	
4-243	Oi-Pr	n-Pr	OCF ₃	
4-244	Oi-Pr	i-Pr	OCF ₃	
4-245	Oi-Pr	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-246	Oi-Pr	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-247	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-248	Oi-Pr	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-249	Oi-Pr	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
4-250	Oi-Pr	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
4-251	Ot-Bu	Me	OCF ₃	
4-252	Ot-Bu	Et	OCF ₃	
4-253	Ot-Bu	n-Pr	OCF ₃	
4-254	Ot-Bu	i-Pr	OCF ₃	
4-255	Ot-Bu	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-256	Ot-Bu	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-257	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-258	Ot-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-259	Ot-Bu	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
4-260	Ot-Bu	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
4-261	SEt	Me	OCF ₃	
4-262	SEt	Et	OCF ₃	
4-263	SEt	n-Pr	OCF ₃	
4-264	SEt	i-Pr	OCF ₃	
4-265	SEt	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	

[0126]

[表31]

第31表

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	物性値
4-266	SEt	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-267	SEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-268	SEt	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-269	SEt	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
4-270	SEt	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	
4-271	1,2,4-Triazole	Me	OCF ₃	
4-272	1,2,4-Triazole	Et	OCF ₃	
4-273	1,2,4-Triazole	n-Pr	OCF ₃	
4-274	1,2,4-Triazole	i-Pr	OCF ₃	
4-275	1,2,4-Triazole	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-276	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-277	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	
4-278	1,2,4-Triazole	CH ₂ CF ₂ CF ₃	OCF ₃	
4-279	1,2,4-Triazole	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	
4-280	1,2,4-Triazole	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	

[0127] [表32]

第32表 NMR データ

化合物番号	¹ H-NMR データ(CDCl ₃)
1-6	9.31(d, 1H)、8.80(d, 1H)、8.77(d, 1H)、8.31(d, 1H)、4.53(q, 2H)、4.34(s, 3H)、3.89(s, 3H)、3.88 (t, 3H) 1.39(t, 3H)
1-10	9.33(d, 1H)、8.80(d, 1H)、8.76(d, 1H)、8.31(d, 1H)、5.25(s, 2H)、4.31(s,3H)、3.89(s,3H)、3.87(q,2H)、2.34(s, 3H)、1.39(t, 3H)
3-275	9.19(d, 1H)、9.15(s, 1H)、8.77(d, 1H)、8.61(d, 1H)、8.19(dd, 1H)、8.13(s, 1H)、7.98(d, 1H)、6.14(tt,1H)、4.62(td,2H)、4.03(q,2H)、1.48(t, 3H)
3-288	9.14(d, 1H)、8.73(d, 1H)、8.20(d, 1H)、7.79(d, 1H)、7.76(dd, 1H)、4.66(q,2H)、4.10(q,2H)、2.37(s,3H)、1.46(t, 3H)

[0128] 本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉類を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫、白蟻類等の害虫防除に適している。

[0129] 上記害虫又は線虫類等として以下のものが例示される。

鱗翅目(チョウ目) 害虫として例えば、アオイラガ(*Parasa consocia*)、アカキリバ(*Anomis mesogona*)、アゲハ(*Papilio xuthus*)、アズキサヤムシガ(*Matsumuraeses azukivora*)、アズキノメイガ(*Ostrinia scapulalis*)、アフリカヨトウ(*Spodoptera exempta*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イガ(*Tinea translucens*)、イグサシンムシガ(*Bactra furfurana*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、イネタテハマキ(*Marasmia exigua*)、イネツトムシ(*Parnara guttata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、イモキバガ(*Brachmia triannulella*)、イラガ(*Monema flavescens*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、ウコンノメイガ(*Pleuroptya ruralis*)、ウメエダシャク(*Cystidia couaggaria*)、ウラナミシジミ(*Lampides boeticus*)、オオスカシバ(*Cephonodes hylas*)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)、オオトビモンシャチホコ(*Phalerodonta manleyi*)、オオミノガ(*Eumeta japonica*)、オオモンシロチョウ(*Pieris brassicae*)、オビカレハ(*Malacosoma neustria testacea*)、カキノヘタムシガ(*Stathmopoda masinissa*)、カキホソガ(*Cuphodes diospyrosella*)、カクモンハマキ(*Archips xylosteanus*)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、カンショシンクイハマキ(*Tetramoera schistaceana*)、キアゲハ(*Papilio machaon hippocrates*)、キマダラコウモリ(*Endoclyta sinensis*)、ギンモンハモグリガ(*Lyonetia prunifoliella*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoneella*)、クリミガ(*Cydia kurokoi*)、クリミドリシンクイガ(*Eucoenogenes aestuosa*)、グレープベリーモス(*Lobesia botrana*)、クロシタアオイラガ(*Latoia sinica*)、クロフタモンマダラメイガ(*Euzophera batangensis*)、クワイホソハマキ(*Phalonidia mesotypa*)、クワゴマダラヒトリ(*Spilosoma imparilis*)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、クワヒメハマキ(*Olethreutes mori*)、コイガ(*Tineola bisselliella*)、コウモリガ(*Endoclyta excrescens*)、コクガ(*Nemapogon granellus*)、コスカシバ(*Synanthedon hector*)、コドリリング(*Cydia pomonella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、コブノメ

イガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、サザンピンクボーラー(*Sesamia calamistis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、シャチホコガ(*Stauropus fagi persimilis*)、シロイチモジマダラメイガ(*Etiella zinckenella*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、シロテンコウモリ(*Palpifer sexnotata*)、シロナヨトウ(*Spodoptera mauritia*)、イネシロオオメイガ(*Scirpophaga innotata*)、シロモンヤガ(*Xestia c-nigrum*)、スジキリヨトウ(*Spodoptera depravata*)、スジコナマダラメイガ(*Ephestia kuehniella*)、スモモエダシャク(*Angerona prunaria*)、セグロシャチホコ (*Clostera anastomosis*)、ソイビーンルーパー(*Pseudoplusia includens*)、ダイズサヤムシガ(*Matsumuraeses falcana*)、タバコガ(*Helicoverpa assulta*)、タマナギンウワバ(*Autographa nigrisigna*)、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon*)、チャドクガ(*Euproctis pseudoconspersa*)、チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)、チャノホソガ(*Caloptilia theivora*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、チャミノガ(*Eumeta minuscula*)、ツマアカシヤチホコ(*Clostera anachoreta*)、ツメクサガ(*Heliothis maritima*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、トウモロコシメイガ(*Busseola fusca*)、ドクガ(*Euproctis subflava*)、トビモンオオエダシャク (*Biston robustum*)、トマトフルーツワーム(*Heliothis zea*)、ナカジロシタバ(*Aedia leucomelas*)、ナシイラガ(*Narosoideus flavidorsalis*)、ナシケンモン (*Viminia ruminis*)、ナシチビガ(*Bucculatrix pyrivorella*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、ナシホソガ(*Spulerina astaurola*)、ナシマダラメイガ(*Ectomyelois pyrivorella*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、ネギコガ(*Acrolepiopsis sapporensis*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、バクガ(*Sitotroga cerealella*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、ハマキガの一種(*Eucosma aporema*)、バラハマキ(*Acleris comariana*)、ヒメクロイラガ(*Scopelodes contractus*)、ヒメシロモンドクガ (*Orgyia thyellina*)、フォールアーミーワーム(*Spodop*

tera frugiperda)、フキノメイガ(*Ostrinia zaguliaevi*)、フタオビコヤガ(*Naranga aenescens*)、フタテンカギバモドキ(*Andraca bipunctata*)、ブドウスカシバ(*Paranthrene regalis*)、ブドウスズメ(*Acosmeryx castanea*)、ブドウハモグリガ(*Phyllocnistis toparcha*)、ブドウヒメハマキ(*Endopiza viteana*)、ブドウホソハマキ(*Eupoecillia ambiguella*)、ベルベットビーンキャタピラー(*Anticarsia gemmatalis*)、ホソバハイイロハマキ(*Cnephasia cinereipalpata*)、マイマイガ(*Lymantria dispar*)、マツカレハ(*Dendrolimus spectabilis*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinivorella*)、マメノメイガ(*Maruca testulalis*)、マメヒメサヤムシガ(*Matsumuraeses phaseoli*)、マメホソガ(*Caloptilia soyella*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、マエウスキノメイガ(*Omiodes indicata*)、ミダレカクモンハマキ(*Archips fuscocupreanus*)、ミツモンキンウワバ(*Acanthopplusia agnata*)、ミノガ(*Bambalina* sp.)、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)、モモノゴマダラノメイガ(*Conogethes punctiferalis*)、モモスカシバ類 (*Synanthedon* sp.)、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)、モンキアゲハ(*Papilio helenus*)、モンキチョウ(*Colias erate poliographus*)、モンクロシャチホコ(*Phalera flavescens*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、モンシロドクガ(*Euproctis similis*)、ヤマノイモコガ(*Acrolepiopsis suzukiella*)、ヨーロピアンコーンボーラー(*Ostrinia nubilalis*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、ヨモギエダシャク(*Ascotis selenaria*)、ヨモギオオホソハマキ(*Phtheochroides clandestina*)、リンゴオオハマキ(*Hoshinoa adumbratana*)、リンゴカレハ(*Odonestis pruni japonensis*)、リンゴケンモン(*Triaena intermedia*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、リンゴコシンクイ(*Grapholita inopinata*)、リンゴシロヒメハマキ(*Spilonota ocellana*)、リンゴハイイロハマキ(*Spilonota lechriaspis*)、リンゴハマキクロバ(*Illiberis pruni*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、リンゴホソガ(*Caloptilia zachrysa*)、リンゴモンハマキ(*Archips breviplicanus*)、ワタアカキリバ(*Anomis flava*)、ワタアカ

ミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、ワタノメイガ(*Notarcha derogata*)、ワタヘリクロノメイガ(*Diaphania indica*)、ニセアメリカタバコガ(*Heliothis virescens*)、及びワタリングア(*Earias cupreoviridis*)等が挙げられる。

- [0130] 半翅目(カメムシ目)害虫として例えば、アオクサカメムシ(*Nezara antennata*)、アカスジカスミカメ(*Stenotus rubrovittatus*)、アカスジカメムシ(*Graphosoma rubrolineatum*)、アカヒゲホソミドリカスミカメ(*Trigonotylus coelestialium*)等、アカヒメヘリカメムシ(*Aeschynoteles maculatus*)、アカホシカスミカメ(*Creontiades pallidifer*)、アカホシカメムシ(*Dysdercus cingulatus*)、アカホシマルカイアガラムシ(*Chrysomphalus ficus*)、アカマルカイガラムシ(*Aonidiella aurantii*)、アブラゼミ(*Graptopsaltria nigrofuscata*)、アメリカコバネナガカメムシ(*Blissus leucopterus*)、イセリヤカイガラムシ(*Icerya purchasi*)、イチモンジカメムシ(*Piezodorus hybneri*)、イネカメムシ(*Lagynotomus elongatus*)、イネキイロヒメヨコバイ(*Thaia subrufa*)、イネクロカメムシ(*Scotinophara lurida*)、イバラヒゲナガアブラムシ(*Sitobion ibarae*)、イワサキカメムシ(*Stariodes iwasakii*)、ウスイロマルカイガラムシ(*Aspidiotus destructor*)、ウスモンミドリカスミカメ(*Taylorilygus pallidulus*)、ウメコブアブラムシ(*Myzus umecola*)、ウメシロカイガラムシ(*Pseudaulacaspis prunicola*)、エンドウヒゲナガアブラムシ(*Acyrtosiphon pisum*)、オオクモヘリカメムシ(*Anacanthocoris stricornis*)、オオクロトビカスミカメ(*Ectometopterus micantulus*)、オオトゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris lewisi*)、オオヘリカメムシ(*Molipteryx fuliginosa*)、オオヨコバイ(*Cicadella viridis*)、オカボノアカアブラムシ(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、オリーブカタカイガラムシ(*Saissetia oleae*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、カシヒメヨコバイ(*Aguriahana quercus*)、カスミカメムシ類(*Lygus* spp.)、カバワタフキマダラアブラムシ(*Euceraphis punctipennis*)、カンキツカイガラムシ(*Andaspis kashicola*)、カンキツカタカイガラムシ(*Coccus pseudomagnoliarum*)、カンシャコバネナガカメムシ(*Cavalerius saccharivorus*)、キクグン

バイ (*Galeatus spinifrons*)、キクヒメヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphonia sanborni*)、キマルカイガラムシ (*Aonidiella citrina*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*)、クスグンバイ (*Stephanitis fasciicarina*)、クストガリキジラミ (*Trioza camphorae*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、クリトガリキジラミ (*Trioza quercicola*)、クルミグンバイ (*Uhlertites latius*)、グレープリーフホッパー (*Erythroneura comes*)、クロアシホソナガカメムシ (*Paromius exiguus*)、クロカタマルカイガラムシ (*Duplaspidiotus claviger*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、クロトビカスミカメ (*Halticicellus insularis*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、クロリンゴキジラミ (*Psylla malivorella*)、クワキジラミ (*Anomomeura mori*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinis*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、クワワタカイガラムシ (*Pulvinaria kuwacola*)、コアオカスミカメ (*Apolygus lucorum*)、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*)、サトウキビコナカイガラムシ (*Saccharicoccus sacchari*)、サトウキビネワタムシ (*Geioica lucifuga*)、サトウノウスイロウンカ (*Numata muiri*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、シトラススノースケール (*Unaspis citri*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、シロオオヨコバイ (*Cicadella spectra*)、シロマルカイガラムシ (*Aspidiotus hederae*)、スカシヒメヘリカメムシ (*Liorhyssus hyalinus*)、セグロヒメキジラミ (*Calophya nigridorsalis*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ (*Megoura crassicauda*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ダイズアブラムシ (*Aphis glycines*)、タイワンクモヘリカメムシ (*Leptocorisa oratorius*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、タイワンヒゲナガアブラムシ (*Uroeucon formosanus*)、タバコカスミカメ (*Cyrtopeltis tenuis*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、チャノカタカイ

ガラムシ (*Lecanium persicae*)、チャノクロホシカイガラムシ (*Parlatoria theae*)、チャノマルカイガラムシ (*Pseudaonidia paeoniae*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、チャバネアオカメムシ (*Plautia stali*)、チューリップネアブラムシ (*Dysaphis tulipae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ツバキクロホシカイガラムシ (*Parlatoria camelliae*)、ツマグロアオカスミカメ (*Apolygus spinolai*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、ツヤアオカメムシ (*Glaucias subpunctatus*)、テンサイカスミカメ (*Orthotylus flavosparsus*)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、トコジラミ (*Cimex lectularius*)、トドキシラミ (*Psylla abietis*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、トベラキシラミ (*Psylla tobirae*)、ナガメ (*Eurydema rugosum*)、ナシアブラムシ (*Schizaphis piricola*)、ナシキシラミ (*Psylla pyricola*)、ナシクロホシカイガラムシ (*Parlatoreopsis pyri*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ナシコナカイガラムシ (*Dysmicoccus wistariae*)、ナシシロナガカイガラムシ (*Lepholeucaspis japonica*)、ナシマルアブラムシ (*Sappaphis piri*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ネギアブラムシ (*Neotoxoptera formosana*)、ハスクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum nymphaeae*)、バラヒメヨコバイ (*Edwardsianarosae*)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspis aspidistrae*)、ハンノキシラミ (*Psylla alni*)、ハンノナガヨコバイ (*Speusotettix subfuscus*)、ハンノヒメヨコバイ (*Alnetoidia alneti*)、ヒエウンカ (*Sogatella panicicola*)、ヒゲナガカスミカメ (*Adelphocoris lineolatus*)、ヒメアカホシカメムシ (*Dysdercus poecilus*)、ヒメクロカイガラムシ (*Parlatoria ziziphi*)、ヒメグンバイ (*Uhlerites debile*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、ヒメハリカメムシ (*Cletus trigonus*)、ヒメフタテンナガアワフキ (*Clovium punctata*)、ヒメヨコバイ類 (*Empoasca* sp.)、

ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ヒラタヒョウタンナガカメムシ (*Pachybrachius luridus*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhi* ae)、フタスジカスミカメ (*Stenotus binotatus*)、フタテンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、フタテンヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ブチヒゲカメムシ (*Dolycoris baccarum*)、ブチヒゲクロカスミカメ (*Adelphocoris triannulatus*)、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*)、ホオズキカメムシ (*Acanthocoris sordidus*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisa acuta*)、ホソコバネナガカメムシ (*Macropes obnubilus*)、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ポテトピシリド (*Paratrioza cockerelli*)、マエキアワフキ (*Aphrophora costalis*)、マキバカスミカメ (*Lygus disponi*)、マダラカスミカメ (*Lygus saundersi*)、マツコナカイガラムシ (*Crisicoccus pini*)、マツヒメヨコバイ (*Empoasca abietis*)、マツモトコナカイガラムシ (*Crisicoccus matsumotoi*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、マルカメムシ (*Megacopta punctatissimum*)、マルシラホシカメムシ (*Eysarcoris guttiger*)、ミカンカキカイガラムシ (*Lepidosaphes beckii*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、ミカンヒメコナカイガラムシ (*Pseudococcus citriculus*)、ミカンヒメヨコバイ (*Zyginella citri*)、ミカンヒメワタカイガラムシ (*Pulvinaria citricola*)、ミカンヒラタカイガラムシ (*Coccus discrepans*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、ムギカスミカメ (*Stenodema calcaratum*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ムギヒゲナガアブラムシ (*Sitobion akebiae*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*)、ムギヨコバイ (*Sorhoanus tritici*)、ムギワラギクオマルアブラムシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ムラサキカメムシ (*Carpocoris pur*

pureipennis)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus pruni*)、ヤナギアブラムシ (*Aphis farinose yanagicola*)、ヤナギグンバイ (*Metasalis populi*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yan onensis*)、ヤマアサキジラミ (*Mesohomotoma camphorae*)、ユキヤナギアブラムシ(*Aphis spiraeicola*)、リンゴアブラムシ(*Aphis pomi*)、リンゴカキカイガラムシ (*Lepidosaphes ulmi*)、リンゴキジラミ (*Psylla mali*)、リンゴクロカスミカメ (*Heterocordylus flavipes*)、リンゴコブアブラムシ (*Myzus malisuctus*)、リンゴネアブラムシ (*Aphidonuguis mali*)、リンゴマダラヨコバイ (*Orientus ishidai*)、リンゴミドリアブラムシ (*Ovatus malicollens*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、ルビーロウムシ(*Ceroplastes rubens*)、及びワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)等が挙げられる。

- [0131] 鞘翅目(コウチュウ目)害虫として例えば、アオスジカミキリ(*Xystrocera globosa*)、アオバアリガタハネカクシ(*Paederus fuscipes*)、アオハナムグリ (*Eucetonia roelofsi*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、アリモドキゾウムシ(*Cylas formicarius*)、アルファルファタコゾウムシ(*Hypera postica*)、イネゾウムシ(*Echinocnemus squameus*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、イネネクイハムシ(*Donacia provosti*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、イモサルハムシ(*Colasposoma dauricum*)、イモゾウムシ(*Euscepes postfasciatus*)、インゲンテントウ(*Epilachna varivestis*)、インゲンマメゾウムシ (*Acanthoscelides obtectus*)、ウエスタンコーンルートワーム(*Diabrotica virgifera virgifera*)、ウメチョッキリゾウムシ (*Involvulus cupreus*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、エンドウゾウムシ(*Bruchus pisorum*)、オオニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctomaculata*)、ガイマイデオキスイ(*Carpophilus dimidiatus*)、カメノコハムシ(*Cassida nebulosa*)、キアシノミハムシ(*Luperomorpha tenebrosa*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、キボシカミキリ(*Psacotheta hilaris*)、キマダラカミキリ(*Aeolesthes chrysothrix*)、クリシギゾウムシ(*Curculio sikkimensis*)、クリヤケシキスイ (*Carpophilus hemipterus*)、コ

アオハナムグリ (*Oxycetonia jucunda*)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica* spp.)、コガネムシ (*Mimela splendens*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、ココクゾウムシ (*Sitophilus oryzae*)、コヒメコクヌストモドキ (*Palorus subdepressus*)、コフキコガネ (*Melolontha japonica*)、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、ゴミムシダマシ (*Neatus picipes*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus*)、ジュウシホシクビナガハムシ (*Crioceris quatuordecimpunctata*)、スモモゾウムシ (*Conotrachelus nenuphar*)、ダイコンサルゾウムシ (*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*)、ダイコンハムシ (*Phaedon brassicae*)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、チビコフキゾウムシ (*Sitona japonicus*)、チャイロコガネ (*Adoretus tenuimaculatus*)、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、チャイロサルハムシ (*Basilepta balyi*)、ツメクサタコゾウムシ (*Hypera nigrirostris*)、テンサイトビハムシ (*Chaetocnema concinna*)、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)、ノーザンコーンルートワーム (*Diabrotica longicornis*)、ハナムグリ (*Eucetonia pilifera*)、ハリガネムシ類 (*Agriotes* spp.)、ヒメカツオブシムシ (*Attagenus unicolor japonicus*)、ヒメキバネサルハムシ (*Pagria signata*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、ヒメコクヌストモドキ (*Palorus ratzeburgii*)、ヒメゴミムシダマシ (*Alphitobius laevigatus*)、ヒメマルカツオブシムシ (*Anthrenus verbasci*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、ヒラタコクヌストモドキ (*Tribolium confusum*)、フタスジヒメハムシ (*Medythia nigrobilineata*)、ブドウトラカミキリ (*Xylotrechus pyrrhoderus*)、ポテトフリービートル (*Epitrix cucumeris*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、マツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、マメハンミョウ (*Epicauta gorhami*)、メイズウィービル (*Sitophilus zeamais*)、モモチョッキリゾウムシ (*R*

hynchites heros)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、ヨツモンマメゾウムシ (*Callosobruchus maculatus*)、リンゴコフキゾウムシ(*Phyllobius armatus*)、リンゴハナゾウムシ(*Anthonomus pomorum*)、ルリハムシ(*Linnaea aenea*)、及びワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)等が挙げられる。

[0132] 双翅目(ハエ目)害虫として例えば、アカイエカ(*Culex pipiens pallens*)、アカザモグリハナバエ(*Pegomya hyoscyami*)、アシグロハモグリバエ (*Liriomyza huidobrensis*)、イエバエ(*Musca domestica*)、イネキモグリバエ(*Chlorops oryzae*)、イネクキミギワバエ (*Hydrellia sasakii*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、イネヒメハモグリバエ(*Hydrellia griseola*)、イネミギワバエ (*Hydrellia griseola*)、インゲンモグリバエ(*Ophiomyia phaseoli*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オウトウショウジョウバエ (*Drosophila suzukii*)、オウトウハマダラミバエ (*Rhacochlaena japonica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、オオキモンノミバエ(*Megaselia spiracularis*)等のノミバエ類、オオチョウバエ(*Clogmia albipunctata*)、キリウジガガンボ (*Tipula aino*)、クロキンバエ (*Phormia regina*)、コガタアカイエカ(*Culex tritaeniorhynchus*)、シナハマダラカ(*Anopheles sinensis*)、ダイコンバエ(*Hylemya brassicae*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia* sp.)、タネバエ(*Delia platura*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、ヨーロッパオウトウミバエ(*Rhagoletis cerasi*)、チカイエカ (*Culex pipiens molestus* Forskal)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、チビクロバネキノコバエ (*Bradysia agrestis*)、テンサイモグリハナバエ (*Pegomya cunicularia*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ナスハモグリバエ (*Liriomyza bryoniae*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*)、ネギハモグリバエ (*Liriomyza chinensis*)、ネッタイイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ミカンコミバエ (*Dacus dorsalis*)、ミカンバエ (*Dacus tsuneonis*)、ムギアカタマバエ(*Sitodiplosis mosellana*)、ムギキモグリバエ (*Meromyza nigri*

tris)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、及びリンゴミバエ(*Rhagoletis pomonella*)等が挙げられる。

[0133] 膜翅目(ハチ目)害虫として例えば、アミメアリ(*Pristomyrmex pungens*)、アリガタバチ類、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、オオズアリ(*Pheidole noda*)、カブラハバチ(*Athalia rosae*)、クリタマバチ(*Dryocosmus kuriphilus*)、クロヤマアリ(*Formica fusca japonica*)、スズメバチ類、セグロカブラハバチ(*Athalia infumata infumata*)、チュウレンジハバチ(*Arge pagana*)、ニホンカブラハバチ(*Athalia japonica*)、ハキリアリ(*Acromyrmex* spp.)、ファイヤーアント(*Solenopsis* spp.)、リンゴハバチ(*Arge mali*)、及びルリアリ(*Ochetellus glaber*)等が挙げられる。

[0134] 直翅目(バッタ目)害虫として例えば、クサキリ(*Homorocoryphus lineosus*)、ケラ(*Gryllotalpa* sp.)、コイナゴ(*Oxya hyla intricata*)、コバネイナゴ(*Oxya yezoensis*)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、ハネナガイナゴ(*Oxya japonica*)、ヒメクサキリ(*Homorocoryphus jezoensis*)、及びエンマコオロギ(*Teleogryllus emma*)等が挙げられる。

[0135] アザミウマ目害虫として例えば、アカオビアザミウマ(*Selenothrips rubrocinctus*)、イネアザミウマ(*Stenchaetothrips biformis*)、イネクダアザミウマ(*Haplothrips aculeatus*)、カキクダアザミウマ(*Ponticulothrips diospyrosi*)、キイロハナアザミウマ(*Thrips flavus*)、クサキイロアザミウマ(*Anaphothrips obscurus*)、クスクダアザミウマ(*Liothrips floridensis*)、グラジオラスアザミウマ(*Thrips simplex*)、クロゲハナアザミウマ(*Thrips nigropilosus*)、クロトンアザミウマ(*Heliothrips haemorrhoidalis*)、クワアザミウマ(*Pseudodendrothrips mori*)、コスモスアザミウマ(*Microcephalothrips abdominalis*)、シイオナガクダアザミウマ(*Leeuwenia pasanii*)、シイマルクダアザミウマ(*Litotetothrips pasaniae*)、シトラススリップス(*Scirtothrips citri*)、シナクダアザミウマ(*Haplothrips chinensis*)、ダイズアザミウマ(*Mycterothrips glycines*)、ダイズウスイロアザミウマ(*Thrips setosus*)、チャノキイロアザミウマ(*Scirtothrips dorsalis*)、チャノクロアザミウマ(*D*

endrothrips minowai)、ツメクサクダアザミウマ(*Haplothrips niger*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ネギクロアザミウマ(*Thrips alliorum*)、ハナアザミウマ(*Thrips hawaiiensis*)、ハナクダアザミウマ(*Haplothrips kurdjumovi*)、ヒゲブトアザミウマ(*Chirothrips manicatus*)、ヒラズハナアザミウマ(*Frankliniella intonsa*)、ビワハナアザミウマ(*Thrips coloratus*)、ミカンキイロアザミウマ(*Franklinella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)、ユリキイロアザミウマ(*Frankliniella lilivora*)、及びユリノクダアザミウマ(*Liothrips vaneeckei*)等が挙げられる。

- [0136] ダニ目害虫として例えば、アオツツガムシ(*Leptotrombidium akamushi*)、アシノワハダニ(*Tetranychus ludeni*)、アメリカンドックチック (*Dermacentor variabilis*)、イシイナミハダニ(*Tetranychus truncatus*)、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、オウトウハダニ(*Tetranychus viennensis*)、カンザワハダニ(*Tetranychus kanzawai*)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)等のマダニ類、クワガタツメダニ(*Cheyletus malaccensis*)、ケナガコナダニ(*Tyrophagus putrescentiae*)、コナヒョウヒダニ(*Dermatophagoides farinae*)、セアカゴケグモ(*Latrodectus hasseltii*)、タイワンカクマダニ(*Dermacentor taiwanicus*)、チャノナガサビダニ(*Acaphylla theavagrans*)、チャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*)、トマトサビダニ(*Aculops lycopersici*)、トリサシダニ(*Ornithonyssus sylvarum*)、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)、ニセナシサビダニ(*Eriophyes chibaensis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、フタトゲチマダニ(*Haemaphysalis longicornis*)、ブラックレグドチック(*Ixodes scapularis*)、ホウレンソウケナガコナダニ(*Tyrophagus similis*)、ホソツメダニ(*Cheyletus eruditus*)、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、ミナミツメダニ(*Cheyletus moorei*)、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*)、ミミヒゼンダニ (*Octodectes cynotis*)、ヤケヒョウヒダニ(*Dermatophagoides pteromyssus*)、ヤマトチマダニ(*Haemaphysalis flava*)、ヤマトマダニ(*Ixodes ovatus*)、リュウキュウミカンサビダニ(*Phyllocoptruta citri*)、リンゴサビダニ(*Ac*

ulus schlechtendali)、リンゴハダニ(Panonychus ulmi)、ローンスターチック (Amblyomma americanum)、及びワクモ(Dermanyssus gallinae)、ロビンネダニ (Rhyzoglyphus robini)、ネダニモドキの一種 (Sancassania sp.) 等が挙げられる。

[0137] シロアリ目害虫として例えば、アマミシロアリ(Reticulitermes miyatakei)、アメリカカンザイシロアリ(Incisitermes minor)、イエシロアリ(Coptotermes formosanus)、オオシロアリ(Hodotermopsis japonica)、カンモンシロアリ(Reticulitermes sp.)、キアシシロアリ(Reticulitermes flaviceps amamianus)、クシモトシロアリ(Glyptotermes kushimensis)、コウシュウイエシロアリ(Coptotermes guangzhoensis)、コウシュンシロアリ(Neotermes koshunensis)、コダマシロアリ(Glyptotermes kodamai)、サツマシロアリ(Glyptotermes satsumensis)、ダイコクシロアリ (Cryptotermes domesticus)、タイワンシロアリ (Odontotermes formosanus)、ナカジマシロアリ(Glyptotermes nakajimai)、ニトベシロアリ(Pericapritermes nitobei)、及びヤマトシロアリ(Reticulitermes speratus)等が挙げられる。

[0138] ゴキブリ目害虫として例えば、クロゴキブリ(Periplaneta fuliginosa)、チャバネゴキブリ(Blattella germanica)、トウヨウゴキブリ(Blattea orientalis)、トビイロゴキブリ(Periplaneta brunnea)、ヒメチャバネゴキブリ(Blattella lituricollis)、ヤマトゴキブリ(Periplaneta japonica)、及びワモンゴキブリ(Periplaneta americana)等が挙げられる。

[0139] ノミ目として例えば、ヒトノミ(Pulex irritans)、ネコノミ(Ctenocephalides felis)、及びニワトリノミ(Ceratophyllus gallinae)等が挙げられる。

[0140] 線虫類として例えば、イチゴメセンチュウ (Nothotylenchus acris)、イネシンガレセンチュウ (Aphelenchoides besseyi)、キタネグサレセンチュウ(Pratylenchus penetrans)、キタネコブセンチュウ (Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita)、ジャガイモシストセンチュウ (Globodera rostochiensis)、ジャワネコブセンチュウ (Meloidogyne javanica)、ダイズシストセンチュウ (Heterodera glycines)、ミナ

ミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、及びミカンネセンチュウ (*Tylenchus semipene trans*)等が挙げられる。

[0141] 軟体動物類として例えば、スクミリンゴガイ (*Pomacea canaliculata*)、アフリカマイマイ (*Achatina fulica*)、ナメクジ (*Meghimatium bilineatum*)、チャコウラナメクジ (*Lehmannina valentiana*)、コウラナメクジ (*Limax flavus*)、及びウスカワマイマイ (*Acusta despecta sieboldiana*)等が挙げられる。

[0142] また、本発明の農園芸用殺虫剤は、その他の害虫としてトマトキバガ (*Tuta absoluta*) に対しても強い殺虫効果を有するものである。

[0143] また防除対象の一つである動物寄生性のダニとして例えば、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*)、シュルツエマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、及びタイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanesis*) のようなマダニ類、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、及び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 wichmanni*)、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*)、及び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 (*Cheyletiell*

a yasguri)、ウサギツメダニ (*Cheyletiella parasitivorax*)、及びネコツメダニ (*Cheyletiella blakei*) のようなツメダニ類、ウサギキュウセンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウシショクヒダニ (*Chorioptes bovis*)、イヌミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、及びネコショウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) のようなヒゼンダニ類、並びにイヌニキビダニ (*Demodex canis*) のようなニキビダニ類等が挙げられる。

[0144] 他の防除対象であるノミとして例えば、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*)、及びナガノミ科 (*Ceratephyllus*) 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*)、及びヤマトネズミノミ (*Monopsyllus anisus*) 等が挙げられる。

[0145] さらに他の防除対象である外部寄生生物としては例えば、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ウマジラミ (*Haematopinus asini*)、ヒツジジラミ (*Dalmanella ovis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ケジラミ (*Phthirus pubis*)、及びアタマジラミ (*Pediculus capitis*) のようなシラミ類、並びにイヌハジラミ (*Trichodectes canis*) のようなハジラミ類、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、ウアイヌカカ (*Culicoides schultzei*)、及びツメトゲブユ (*Simulium ornatum*) 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、及び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、及び多包条虫のような条虫類、日本住血吸虫、及び肝蛭のような吸虫類、並びにコクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、及びクリプトスポリ

ジウムのような原生動物等が挙げられる。

[0146] 本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で育苗施設、水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌等の栽培担体等を本発明の農園芸用殺虫剤で処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。中でも、作物、花卉等の育苗土壌、移植時の植え穴土壌、株元、灌漑水、水耕栽培における栽培水等に処理を施して、土壌を介し又は介さずして根から本発明化合物を吸収させることによるいわゆる浸透移行性を利用した施用が本発明の農園芸用殺虫剤の好ましい使用形態である。

[0147] 本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる有用植物は特に限定されるものではないが、例えば穀類（例えば、稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦、とうもろこし等）、豆類（大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、いんげん豆、落花生等）、果樹・果実類（林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、桜桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ等）、葉・果菜類（キャベツ、トマト、ほうれんそう、ブロッコリー、レタス、たまねぎ、ねぎ（あさつき、わけぎ）、ピーマン、なす、いちご、ペッパー、おくら、にら等）、根菜類（にんじん、馬鈴薯、さつまいも、さといも、だいこん、かぶ、れんこん、ごぼう、にんにく、らっきょう等）、加工用作物（棉、麻、ビート、ホップ、さとうきび、てんさい、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等）、ウリ類（かぼちゃ、きゅうり、すいか、まくわうり、メロン等）、牧草類（オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等）、芝類（高麗芝、ベントグラス等）、香料等鑑賞用作物（ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、生姜等）、花卉類（きく、ばら、カーネーション、蘭、チューリップ、ゆり等）、庭木（いちょう、さくら類、あおき等）、林木（トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧、ユウカリ等）等の植物

を挙げることができる。

[0148] 上記「植物」には、イソキサフルトール等のH P P D阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のA L S阻害剤、グリホサート等のE P S P合成酵素阻害剤、グルホシネート等のグルタミン合成酵素阻害剤、セトキシジム等のアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤、ブロモキシニル、ジカンバ、2, 4-D等の除草剤に対する耐性を古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により耐性を付与された植物も含まれる。

[0149] 古典的な育種法により耐性を付与された「植物」の例としては、イマゼタピル等のイミダゾリノン系A L S阻害型除草剤に耐性のナタネ、コムギ、ヒマワリ、イネがありC l e a r f i e l d（登録商標）の商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によるチフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系A L S阻害型除草剤に耐性のダイズがあり、S T Sダイズの商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によりトリオンオキシム系、アリールオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤などのアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物の例としてS Rコーン等がある。

またアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物はP r o c. N a t l. A c a d. S c i. U S A 87巻、7175～7179頁（1990年）等に記載されている。またアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルC o Aカルボキシラーゼがウィード・サイエンス（W e e d S c i e n c e）53巻、728～746頁（2005年）等に報告されており、こうした変異アセチルC o Aカルボキシラーゼ遺伝子を遺伝子組換え技術により植物に導入するもしくは抵抗性付与に関わる変異を植物アセチルC o Aカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の植物を作出することができ、さらに、キメラプラスティ技術（G u r a T. 1999. R e p a i r i n g t h e G e

nome's Spelling Mistakes. Science 285 : 316-318.) に代表される塩基置換変異導入核酸を植物細胞内に導入して植物のアセチルCoAカルボキシラーゼ遺伝子やALS遺伝子等に部位特異的アミノ酸置換変異を導入することにより、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤やALS阻害剤等に耐性の植物を作出することができ、これらの植物に対しても本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる。

[0150] 更に遺伝子組換え植物で発現される毒素として、バチルス・セレウスやバチルス・ポピリエ由来の殺虫性タンパク、バチルス・チューリングエンシス由来のCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の δ -エンドトキシン、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパク、線虫由来の殺虫タンパク、さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素、糸状菌類毒素、植物レクチン、アグルチニン、トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤、リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリン、ブリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク(RIP)、3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素、エクダイソン阻害剤、HMG-CoAリダクターゼ、ナトリウムチャネル、カルシウムチャネル阻害剤等のイオンチャネル阻害剤、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ、グルカナナーゼ等が挙げられる。

[0151] またこの様な遺伝子組換え植物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C、Cry34AbまたはCry35Ab等の δ -エンドトキシンタンパク、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパクのハイブリッド毒素、一部を欠損した毒素、修飾された

毒素も含まれる。ハイブリッド毒素は組換え技術を用いて、これらタンパクの異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出される。一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したCry1Abが知られている。修飾された毒素としては、天然型の毒素のアミノ酸の1つまたは複数が置換されている。

これら毒素の例及びこれら毒素を合成することができる組換え植物は、EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878、WO 03/052073等に記載されている。

[0152] これらの組換え植物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、半翅目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫、線虫類への耐性を植物に付与する。本発明の農園芸用殺虫剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることもできる。

[0153] 本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫あるいは線虫防除に有効な量を当該害虫および線虫の発生が予測される植物に使用すればよく、例えば果樹、穀類、野菜等において発生する害虫および線虫に対しては茎葉部に散布する他に、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。加えて、養液（水耕）栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。

更に、本発明の農園芸用殺虫剤は、そのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される場所に使用すればよく、例えば貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫、森林害虫等に散布する他に、家屋建材への塗布、くん煙、ベイト等として使用することもできる。

[0154] 種子処理の方法としては、例えば、液状又は固体状の製剤を希釈又は希釈

せずして液体状態にて種子を浸漬して種子に薬剤を浸透させる方法、固形製剤又は液状製剤を種子と混和、粉衣処理して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の担体と混和して種子に薬剤をコーティングする方法、植え付けと同時に製剤を種子付近に散布する方法等が挙げられる。

当該種子処理を行う「種子」とは、植物の繁殖に用いられる栽培初期の植物体を意味し、例えば、種子の他、球根、塊茎、種芋、株芽、むかご、鱗茎、あるいは挿し木栽培用の栄養繁殖用の植物体を挙げることができる。

本発明の使用方法を実施する場合の植物の「土壌」又は「栽培担体」とは、作物を栽培するための支持体、特に根を生えさせる支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、いわゆる土壌、育苗マット、水等であっても良く、具体的な素材としては例えば、砂、軽石、バーミキュライト、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、バーク等であっても良い。

[0155] 作物茎葉部又は貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫若しくは森林害虫等への散布方法としては、乳剤、フロアブル剤等の液体製剤又は水和剤もしくは顆粒水和剤等の固形製剤を水で適宜希釈し、散布する方法、粉剤を散布する方法、又はくん煙等が挙げられる。

土壌への施用方法としては、例えば、液体製剤を水に希釈又は希釈せずして植物体の株元または育苗用苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の株元又は育苗のための苗床等に散布する方法、播種前または移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壌全体と混和する方法、播種前または植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布する方法等が挙げられる。

[0156] 水稻の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤型で施用すればよい。培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。単に、培土と各種製剤

を交互に層状にして施用してもよい。

水田への施用方法としては、ジャンボ剤、パック剤、粒剤、顆粒水和剤等の固形製剤、フロアブル、乳剤等の液体状製剤を、通常は、湛水状態の水田に散布する。その他、田植え時には、適当な製剤をそのまま、あるいは、肥料に混和して土壌に散布、注入することもできる。また、水口や灌漑装置等の水田への水の流入元に乳剤、フロアブル等の薬液を利用することにより、水の供給に伴い省力的に施用することもできる。

[0157] 畑作物においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等へ処理ができる。畑に直接播種する植物においては、種子への直接処理の他、栽培中の植物の株元への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釈あるいは希釈しない薬剤を液状にて灌注処理を行うこと等ができる。粒剤を播種前の栽培担体と混和させた後、播種するのも好ましい処理である。

移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接処理の他、育苗用苗床への、液状とした薬剤の灌注処理又は粒剤の散布処理が好ましい。また、定植時に粒剤を植え穴に処理をしたり、移植場所近辺の栽培担体に混和することも好ましい処理である。

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、本発明の一般式（１）で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

[0158] 本発明の組成物（農園芸用殺虫剤又は動物寄生生物防除剤）は、有効成分の他に必要に応じて農薬製剤又は動物寄生生物防除剤に通常用いられる添加成分を含有することができる。この添加成分としては、固体担体、液体担体等の担体、界面活性剤、分散剤、湿潤剤、結合剤、粘着付与剤、増粘剤、着

色剤、拡張剤、展着剤、凍結防止剤、固結防止剤、崩壊剤、分解防止剤等が挙げられる。その他必要に応じ、防腐剤、植物片等を添加成分に用いてもよい。これらの添加成分は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0159] 固体担体としては、例えば石英、クレー、カオリナイト、ピロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類、合成ケイ酸、合成ケイ酸塩、デンプン、セルロース、植物粉末（例えばおがくず、ヤシガラ、トウモロコシ穂軸、タバコ茎等）等の有機固体担体、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、尿素、無機中空体、プラスチック中空体、フュームド シリカ（fumed silica, ホワイトカーボン）等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0160] 液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール等の一価アルコール類や、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類のようなアルコール類、プロピレングリコールエーテル等の多価アルコール化合物類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、エチルエーテル、ジオキサン、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ノルマルパラフィン、ナフテン、イソパラフィン、ケロシン、鉱油等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート、アジピン酸ジメチル等のエステル類、 γ -ブチロラクトン

等のラクトン類、ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-アルキルピロリジノン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類、大豆油、ナタネ油、綿実油、ヒマシ油等の植物油、水等を挙げることができる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0161] 分散剤や湿展剤として用いる界面活性剤としては、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、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樹脂酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸ジエステル、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アルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンジアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルホルマリン縮合物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリスチレンポリオキシエチレンブロックポリマー、アルキルポリオキシエチレンポリプロピレンブロックコポリマーエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアミン、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脂肪酸ビスフェニルエーテル、ポリアルキレンベンジルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンスチリルフェニルエーテル、アセチレンジオール、ポリオキシアルキレン付加アセチレンジオール、ポリオキシエチレンエーテル型シリコーン、エステル型シリコーン、フッ素系界面活性剤、ポリオキシエチレンひまし油、ポリオキシエチレン硬化ひまし油等の非イオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、ポリアクリル酸塩、N-メチル-脂肪酸サ

ルコシネート、樹脂酸塩、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フェニルエーテルリン酸塩等のアニオン性界面活性剤、ラウリルアミン塩酸塩、ステアリルアミン塩酸塩、オレイルアミン塩酸塩、ステアリルアミン酢酸塩、ステアリルアミノプロピルアミン酢酸塩、アルキルトリメチルアンモニウムクロライド、アルキルジメチルベンザルコニウムクロライド等のアルキルアミン塩等のカチオン界面活性剤、アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤等が挙げられる。これらの界面活性剤は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0162] 結合剤や粘着付与剤としては、例えばカルボキシメチルセルロースやその塩、デキストリン、水溶性デンプン、キサンタンガム、グアーガム、蔗糖、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテート、ポリアクリル酸ナトリウム、平均分子量6000～20000のポリエチレングリコール、平均分子量10万～500万のポリエチレンオキサイド、燐脂質（例えばセファリン、レシチン等）セルロース粉末、デキストリン、加工デンプン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、架橋ポリビニルピロリドン、マレイン酸とスチレン類の共重合体、（メタ）アクリル酸系共重合体、多価アルコールからなるポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリスチレンスルホン酸の水溶性塩、パラフィン、テルペン、ポリアミド樹脂、ポリアクリル酸塩、ポリオキシエチレン、ワックス、ポリビニルアルキルエーテル、アルキルフェノールホルマリン縮合物、合成樹脂エマルジョン等が挙げられる。

[0163] 増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グアーガム、ダイユウタンガム、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、アクリル系ポリマー、デンプン化合物、多糖類のような水溶性高分子、高純度ベントナイト、フュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)のような無機微粉等が挙げられる。

[0164] 着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーのような無機顔料、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料のような有

機染料等が挙げられる。

[0165] 凍結防止剤としては、例えば、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類等が挙げられる。

[0166] 固結防止や崩壊促進のための補助剤としては、例えばデンプン、アルギン酸、マンノース、ガラクトース等の多糖類、ポリビニルピロリドン、フュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)、エステルガム、石油樹脂、トリポリリン酸ナトリウム、ヘキサメタリン酸ナトリウム、ステアリン酸金属塩、セルロース粉末、デキストリン、メタクリル酸エステルの共重合体、ポリビニルピロリドン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、スルホン化スチレン・イソブチレン・無水マレイン酸共重合体、デンプン・ポリアクリロニトリルグラフト共重合体等が挙げられる。

[0167] 分解防止剤としては、例えばゼオライト、生石灰、酸化マグネシウムのような乾燥剤、フェノール化合物、アミン化合物、硫黄化合物、リン酸化合物等の酸化防止剤、サリチル酸化合物、ベンゾフェノン化合物等の紫外線吸収剤等が挙げられる。

[0168] 防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、1, 2-ベンゾチアゾリン-3-オン等が挙げられる。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の補助剤も使用することができる。

[0169] 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、本発明の農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、粉剤、粒剤、乳剤又は水和剤とする場合は0.01～50重量部（農園芸用殺虫剤全体の重量に対して0.01～50重量%）が適当である。

[0170] 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用

場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g～10kg、好ましくは0.01g～1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、また、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

[0171] かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤として、3,5-xylyl methylcarbamate(XMC)、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*、*Bacillus thuringiensis*が生成する結晶タンパク毒素、BPMC、Btトキシン系殺虫性化合物、CPCBS(chlorfenson)、DCIP(dichlorodiisopropyl ether)、D-D(1,3-Dichloropropene)、DDT、NAC、0-4-dimethylsulfamoylphenyl 0, 0-diethyl phosphorothioate(DSP)、0-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate(EPN)、tripropylisocyanurate (TPIC)、アクリナトリン(acrinathrin)、アザディラクチン(azadirachtin)、アジンホス・メチル(azinphos-methyl)、アセキノシル(acequinocyl)、アセタミプリド(acetamiprid)、アセトプロール(acetoprole)、アセフェート(acephate)、アバメクチン(abamectin)、アベルメクチン(ivermectin-B)、アミドフルメット(amidoflumet)、アミトラズ(amtiraz)、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、アルドリリン(aldrin)、アルファーエンドスルファン (alpha-endosulfan)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、アルベンダゾール(albendazole)、アレスリン(allethrin)、イサゾホス(isazofos)、イサミドホス(isamidofos)、イソアミドホス(isoamidofos)、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロカルブ(isoprocab : MIPC)、イベルメクチン (ivermectin)、イミシアホス(imicyafos)、イミ

ダクロプリド(imidacloprid)、イミプロトリン(imiprothrin)、インドキサカルブ(indoxacarb)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、エチオン(ethion)、エチプロール(ethiprole)、エトキサゾール(etoxazole)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrimfos)、エマメクチン(emamectin)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、エンドスルファン(endosulfan)、エンペントリン(empenthrin)、オキサミル(oxamyl)、オキシジメトン・メチル(oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス(oxydeprofos: ESP)、オキシベンダゾール(oxibendazole)、オクスフェンダゾール(oxfendazole)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、オレイン酸ナトリウム(sodium oleate)、カズサホス(cadusafos)、カルタップ(cartap)、カルバリル(carbaryl)、カルボスルファン(carbosulfan)、カルボフラン(carbofuran)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、キシリルカルブ(xylylcarb)、キナルホス(quinalphos)、キノプレン(kinoprene)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロエトカルブ(cloethocarb)、クロチアニジン(clothianidin)、クロフェンテジン(clofentazine)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルジメホルム(chlordimeform)、クロルデン(chlordane)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロルフェナピル(chlorphenapyr)、クロルフェンソン(chlorfenson)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロルベンジレート(chlorobenzilate)、クロロベンゾエート(chlorobenzoate)、ケルセン(ジコホル: dicofol)、サリチオン(salithion)、シアノホス(cyanophos: CYAP)、ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、ジアミダホス(diamidafos)、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)、シーターシペルメトリン(theta-cypermethrin)、ジエノクロル(dienochlor)、シエノピラフェン(cyenoxyrafen)、ジオキサベンゾホス(dioxabenzofos)、ジオフェノラン(diofenolan)、シグマ-サイパーメトリン(sigma-cypermethrin)、ジクロフェンチオン(di

chlofenthion: ECP)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、ジクロルボス(dichlorvos: DDVP)、ジスルホトン(disulfoton)、ジノテフラン(dinotefuran)、シハロトリン(cyhalothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、ジフロビダジン(diflovidazin)、シヘキサチン(cyhexatin)、シペルメトリン(cypermethrin)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメフルスリン(dimefluthrin)、シラフルオフエン(silafluofen)、シロマジン(cyromazine)、スピネトラム(spinetoram)、スピノサッド(spinosad)、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetramat)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スルフラミド(sulfluramid)、スルプロホス(sulprofos)、スルホキサフロール(sulfoxaflor)、ゼータ-シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ダイアジノン(diazinon)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、ダゾメット(dazomet)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオシクラム(thiocyclam)、チオスルタップ(thiosultap)、チオスルタップナトリウム(thiosultap-sodium)、チオナジン(thionazin)、チオメトン(thiometon)、ディート(deet)、ディルドリン(dieldrin)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テトラジホン(tetradifon)、テトラメチルフルトリン(tetramethylfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テブフェノジド(tebufenozide)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、テフルトリン(tefluthrin)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、テムホス(temephos)、デルタメトリン(deltamethrin)、テルブホス(terbufos)、トラロピリル(tralopyril)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、トリアザメート(triazamate)、トリアズロン(triazuron)、トリクラミド(trichlamide)、トリクロルホン(trichlorphon: DEP)、トリフルムロン(triflumuron)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、ナレッド(naled: BRP)、ニチアジン(nithiazine)、ニテンピラム(nitenpyram)、ノバルロン(novaluro

n)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ハイドロプレン(hydroprene)、バニリプロール(vaniliprole)、バミドチオン(vamidothion)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、ハルフェンプロックス(halfe nprox)、ハロフェノジド(halofenozide)、ビストリフルロン(bistrifluron)、ビスルタップ(bisultap)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、ヒドロキシプロピルデンプン(hydroxy propyl starch)、ビナパクリル(binapacryl)、ビフェナゼート(bifenazate)、ビフェントリン(bifenthrin)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclorfos)、ピラフルプロール(pyraflupro le)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、ピリダベン(pyridaben)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、ピリプロール(py riprole)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ピリミカーブ(pirimicarb)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピレトリン(pyrethrins)、フィプロニル(fipronil)、フェナザキン(fenazaqu in)、フェナミフォス(fenamiphos)、フェニソブロモレート(bromopropylate)、フェニトロチオン(fenitrothion: MEP)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノトリン(phenothrin)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェンスルフォチオン(fensulfothion)、フェンチオン(f enthion: MPP)、フェントエート(phenthoate: PAP)、フェンバレレート(fenv alerate)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フェンプロパトリン(fen propathrin)、フェンベンダゾール(fenbendazole)、フォスチアゼート(fosth iazate)、フォルメタネート(formetanate)、ブタチオホス(butathiofos)、ブプロフェジン(buprofezin)、フラチオカルブ(furathiocarb)、プラレトリン(prallethrin)、フルアクリピリム(flucacrypyrim)、フルアジナム(fluzin am)、フルアズロン(fluzuron)、フルエンスルホン(fluensulfone)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(flualinate)、フルピラゾホス(flupyrzofos)、フルフェネリム(flufenerim)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、フルフェンジン(flufen zine)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルプロキシフェン(fluproxy

fen)、フルブロシスリネート(flubrocylthrin)、フルベンジアミド(flubendiamide)、フルメトリン(flumethrin)、フルリムフェン(flurimfen)、プロチオホス(prothiofos)、プロトリフェンブト(protrifenbute)、フロニカミド(flonicamid)、プロパホス(propaphos)、プロパルギット(propargite: BPPS)、プロフェノホス(profenofos)、プロフルスリン(profluthrin)、プロポキスル(propoxur: PHC)、ブromoプロピレート(bromopropylate)、ベータシフルトリン(beta-cyfluthrin)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、ヘプテノホス(heptenophos)、ペルメトリン(permethrin)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ベンフラカルブ(benfluracarb)、ホキシム(phoxim)、ホサロン(phosalone)、ホスチアゼート(fosythiazate)、ホスチエタン(fosythietan)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホスホカルブ(phosphocarb)、ホスメット(phosmet: PMP)、ポリナクチン複合体(polynactins)、ホルメタネート(formetanate)、ホルモチオン(formothion)、ホレート(phorate)、マシン油(machine oil)、マラチオン(malathion)、ミルベマイシン(milbemycin)、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ミルベメクチン(milbemectin)、メカルバム(mecarbam)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メソミル(methomyl)、メタアルデヒド(metaldehyde)、メタフルミゾン(metaflumizone)、メタミドホス(methamidophos)、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、メチオカルブ(methiocarb)、メチダチオン(methidathion: DMTP)、メチルイソチオシアネート(methylisothiocyanate)、メチルネオデカナミド(methylneodecanamide)、メチルパラチオン(methylparathion)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、メトキシクロル(methoxychlor)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、メトフルトリン(metofluthrin)、メトプレン(methoprene)、メトルカルブ(metolcarb)、メルフルスリン(meperfluthrin)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、モノスルタップ(monosultap)、ラムダーシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、リアノジン(ryanodine)、ルフェヌロン(lufenuron)、

レスメトリン(resmethrin)、レピメクチン(lepimectin)、ロテノン(rotenone)、塩酸レバミゾール(levamisol hydrochloride)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、臭化メチル(methyl bromide)、水酸化トリシクロヘキシルスズ(cyhexatin)、石灰窒素(calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(calcium polysulfide)、硫黄(sulfur)、及び硫酸ニコチン(nicotine-sulfate)等を例示することができる。

[0172] 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤として、アウレオフンギン(aureofungin)、アザコナゾール(azaconazole)、アジチラム(azithiram)、アシペタックス(acypetacs)、アシベンゾラル(acibenzolar)、アシベンゾラルSメチル(acibenzolar-S-methyl)、アゾキシストロビン(azoxystrobin)、アニラジン(anilazine)、アミスルブロム(amisulbrom)、アムプロピルホス(ampropylfos)、アメトクトラジン(ametoctradin)、アリルアルコール(allyl alcohol)、アルジモルフ(aldimorph)、アンバム(amobam)、イソチアニル(isotianil)、イソバレジオン(isovalledione)、イソピラザム(isopyrazam)、イソプロチオラン(isoprothiolane)、イプコナゾール(ipconazole)、イプロジオン(iprodione)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、イプロベンホス(iprobenfos)、イマザリル(imazalil)、イミノクタジン(iminoctadine)、イミノクタジンアルベシル酸塩(iminoctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩(iminoctadine-triacetate)、イミベンコナゾール(imibenconazole)、ウニコナゾール(uniconazole)、ウニコナゾールP(uniconazole-P)、エクロメゾール(echlomezole)、エジフェンホス(edifenphos)、エタコナゾール(etaconazole)、エタボキサム(ethaboxam)、エチリモール(ethirimol)、エテム(etem)、エトキシキン(ethoxyquin)、エトリジアゾール(etridiazole)、エネストロブリン(enestroburin)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、オキサジキシル(oxadixyl)、オキシカルボキシシン(oxycarboxin)、オキシキノリン銅(copper-8-quinolinate)、オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)、オキシシン銅(copper-oxinate)、オキスポコナゾール(oxpoconazole)、オキスポコナゾールフマ

ル酸塩(oxpoconazole-fumarate)、オキシリニック酸(oxolinic acid)、オクチリノン(octhilinone)、オフラセ(ofurace)、オリサストロビン(orysastrobin)、カーバム(metam-sodium)、カスガマイシン(kasugamycin)、カルバモルフ(carbamorph)、カルプロパミド(carpropamid)、カルベンダジム(carbendazim)、カルボキシシン(carboxin)、カルボン(carvone)、キナザミド(quinazamid)、キナセトール(quinacetol)、キノキシフェン(quinoxifen)、キノメチオネート(quinomethionate)、キャプタホール(captafol)、キャプタン(captan)、キララキシル(kiralaxyl)、キンコナゾール(quinconazole)、キントゼン(quintozene)、グアザチン(guazatine)、クフラネブ(cufraneb)、クプロバム(cuprobam)、グリオジン(glyodin)、グリセオフルビン(griseofulvin)、クリムバゾール(climbazole)、クレゾール(cresol)、クレソキシムメチル(kresoxim-methyl)、クロゾリネート(chlozolate)、クロトリマゾール(clotrimazole)、クロベンチアゾン(chlobenthiazole)、クロラニホルメタン(chloraniformethan)、クロラニル(chloranil)、クロルキノックス(chlorquinox)、クロルピクリン(chloropicrin)、クロルフェナゾール(chlorfenazole)、クロロジニトロナフタレン(chlorodinitronaphthalene)、クロロタロニル(chlorothalonil)、クロロネブ(chloroneb)、ザリラミド(zarilamid)、サリチルアニリド(salicylanilide)、シアゾファミド(cyazofamid)、ジエチルピロパカーボナート(diethyl pyrocarbonate)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、シクラフラミド(cyclafuramid)、シクロシメット(diclocymet)、ジクロゾリン(dichlozoline)、ジクロブトラゾール(diclobutrazol)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、シクロヘキシミド(cycloheximide)、ジクロメジン(diclomezine)、ジクロラン(dicloran)、ジクロロフェン(dichlorophen)、ジクロン(dichlone)、ジスルフィラム(disulfiram)、ジタリムフォス(ditalimfos)、ジチアノン(dithianon)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾールM(diniconazole-M)、ジネブ(zineb)、ジノカップ(dinocap)、ジノクトン(dinocton)、ジノスルホン(di

nosulfon)、ジノテルボン (dinoterbon)、ジノブトン (dinobuton)、ジノ
ペントン (dinopenton)、ジピリチオン (dipyrithione)、ジフェニルアミ
ン (diphenylamine)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、シフルフェ
ナミド (cyflufenamid)、ジフルメトリム (diflumetorim)、シプロコナゾー
ル (cyproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprof
uram)、シペンダゾール (cypendazole)、シメコナゾール (simeconazole)
、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、シモ
キサニル (cymoxanil)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、臭化メチ
ル (methyl bromide)、ジラム (ziram)、シルチオフアム (silthiofam)、
ストレプトマイシン (streptomycin)、スピロキサミン (spiroxamine)、ス
ルトロペン (sultropen)、セダキサン (sedaxane)、ゾキサミド (zoxamide
)、ダゾメット (dazomet)、チアジアジン (thiadiazin)、チアジニル (tia
dinil)、チアジフルオル (thiadifluor)、チアベンダゾール (thiabendazo
le)、チオキシミド (tioxyimid)、チオクロルフェンフィム (thiochlorfep
him)、チオフアネート (thiophanate)、チオフアネートメチル (thiophana
te-methyl)、チシオフエン (thicyofen)、チノキノックス (thioquinox)
、キノメチオネート (chinomethionat)、チオフルザミド (thifluzamide)、
チラム (thiram)、デカフェンチン (decafentin)、テクナゼン (tecnazene
)、テクロフタラム (tecloftalam)、テコラム (tecoram)、テトラコナゾ
ール (tetraconazole)、デバカルブ (debacarb)、デヒドロ酢酸 (dehydroa
cetic acid)、テブコナゾール (tebuconazole)、テブフロキン (tebufloqu
in)、ドジシン (dodycin)、ドジン (dodine)、ドデシルベンゼンスルホン
酸ビスエチレンジアミン銅錯塩 (II) (DBEDC)、ドデモルフ (dodemorph)、
ドラゾキソロン (drazoxolon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリア
ジメホン (triadimefon)、トリアズブチル (triazbutil)、トリアゾキシド
(triazoxide)、トリアミホス (triamiphos)、トリアリモール (triarimol
)、トリクラミド (trichlamide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、ト
リチコナゾール (triticonazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリブチ

ルチンオキシド (tributyltin oxide)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリホリン (triforine)、トリルフルアラニド (tolylfluanid)、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、ナタマイシン (natamycin)、ナバム (nabam)、ニトロタサルイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ニトロスチレン (nitrostyrene)、ヌアリモール (nuarimol)、ノニルフェノールスルホン酸銅 (copper nonylphenol sulfonate)、ハラクリネート (halacrinat)、バリダマイシン (validamycin)、バリフェナラート (valifenalate)、ハルピンタンパク (harpin protein)、ビキサフェン (bixafen)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピコベンザミド (picobenzamide)、ビチオノール (bithionol)、ビテルタノール (bitertanol)、ヒドロキシイソキサゾール (hydroxyisoxazole)、ヒドロキシイソキサゾールカリウム (hydroisoxazole-potassium)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ピペラリン (piperalin)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、ピリオフェノン (pyriofenone)、ピリジニトリル (pyridinitril)、ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキシクロル (pyroxychlor)、ピロキシフル (pyroxyfur)、ピロキロン (pyroquilon)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ファミキサドン (famoxadone)、フェナパニル (fenapanil)、フェナミドン (fenamidone)、フェナミノスルフ (fenaminosulf)、フェナリモール (fenarimol)、フェニトロパン (fenitropan)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェリムゾン (ferimzone)、フェルバム (ferbam)、フェンチン (fentin)、フェンピクロニル (fempiclonil)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラム (fenfuram)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フタリド (phthalide)、ブチオベート (buthiobate)

、ブチルアミン (butylamine)、ブピリメート (bupirimate)、フベリダゾール (fuberidazole)、ブラストサイジンS (blasticidin-S)、フラメトピル (furametpyr)、フララキシル (furalaxyl)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルアジナム (fluazinam)、フルオキサストロビン (fluoxastrobina)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピラム (fluopyram)、フルオロイミド (fluoroimide)、フルカルバニル (furcarbanil)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルコナゾール (furconazole)、フルコナゾール-シス (furconazole-cis)、フルジオキシニル (fludioxonil)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルチアニル (flutianil)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアホル (flutriafol)、フルフラール (furfural)、フルメシクロックス (furmecycloxy)、フルメットベル (flumetover)、フルモルフ (flumorph)、プロキナジド (proquinazid)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロチオカルブ (prothiocarb)、プロチオコナゾール (prothiiconazole)、プロパモカルブ (propamocarb)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、フロファネート (furophanate)、プロベナゾール (probenazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ヘキサクロブタジエン (hexachlorobutadiene)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヘキシルチオホス (hexylthiofos)、ベトキサジン (bethoxazin)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルM (benalaxyl-M)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ベンキノックス (benquinox)、ペンコナゾール (penconazole)、ベンザモルフ (benzamorf)、ペンシクロン (pencycuron)、ベンゾヒドロキサム酸 (benzohydroxamic acid)、ベントルロン (bentaluron)、ベンチアゾール (benthiazole)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、ベンチオピラド (penthiopyrad)、ペンフルフェン (penflufen)、ボスカリド (boscalid)、ホスジフェン (phosdiphen)、ホセチル (fosetyl)、ホ

セチルアルミニウム (fosetyl - Al)、ポリオキシシン (polyoxins)、ポリオキソリン (polyoxorim)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ホルペット (folpet)、ホルムアルデヒド (formaldehyde)、マシン油 (machine oil)、マネブ (maneb)、マンコゼブ (mancozeb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、ミクロゾリン (myclozolin)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ミルディオマイシン (mildiomycin)、ミルネブ (milneb)、メカルビンジド (mecarbinzid)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メタゾキシロン (metazoxolon)、メタム (metam)、メタムナトリウム塩 (metam - sodium)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルM (metalaxyl-M)、メチラム (metiram)、メチルイソチオシアナート (methyl isothiocyanate)、メチルジノカップ (mepthyldinocap)、メトコナゾール (metconazole)、メトスルホバックス (metsulfovax)、メトフロキサム (methfuroxam)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、メパニピリム (mepanipirim)、メフェノキサム (mefenoxam)、メプチルジノカップ (mepthyldinocap)、メプロニル (mepronil)、メベニル (mebenil)、ヨウ化メチ

ル (iodomethane)、ラベンザゾール (rabenzazole)、塩化ベンザルコニウム (benzalkonium chloride)、塩基性塩化銅 (basic copper chloride)、塩基性硫酸銅 (basic copper sulfate)、金属銀 (silver) 等の無機殺菌剤、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、水酸化第二銅 (cupric hydroxide)、水和硫黄剤 (wetttable sulfur)、石灰硫黄合剤 (calcium polysulfide)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、無機硫黄 (sulfur)、無水硫酸銅 (copper sulfate anhydride)、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル (nickel dimethyldithiocarbamate)、8-ヒドロキシキノリン銅 (oxine copper) のような銅系化合物、硫酸亜鉛 (zinc sulfate)、硫酸銅五水塩 (copper sulfate pentahydrate) 等を例示することができる。

[0173] 同様に除草剤として、1-ナフチルアセトアミド、2, 4-PA、2, 3, 6-TBA、2, 4

, 5-T、2, 4, 5-TB、2, 4-D、2, 4-DB、2, 4-DEB、2, 4-DEP、3, 4-DA、3, 4-DB、3, 4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、MCPAチオエチル、MCPB、アイオキシニル (ioxynil)、アクロニフェン (aclonifen)、アザフェニジン (azafenidin)、アシフルオルフェン (acifluorfen)、アジプロトリン (aziprotryne)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、アシュラム (asulam)、アセトクロール (acetochlor)、アトラジン (atrazine)、アトラトン (atraton)、アニスロン (anisuron)、アニロホス (anilofos)、アビグリシン (aviglycine)、アブシジン酸 (abscisic acid)、アミカルバゾン (amicarbazone)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アミトロール (amitrole)、アミノシクロピラクロール (aminocyclopyrachlor)、アミノピラリド (aminopyralid)、アミブジン (amibuzin)、アミプロホスメチル (amiprophos-methyl)、アメトリジオン (ametridione)、アメトリン (ametryn)、アラクロール (alachlor)、アリドクロール (allidochlor)、アロキシジム (alloxydim)、アロラック (alorac)、イソウロン (isouron)、イソカルバミド (isocarbamid)、イソキサクロルトール (isoxachlortole)、イソキサピリホップ (isoxapyrifop)、イソキサフルトール (isoxaflutole)、イソキサベン (isoxaben)、イソシル (isocil)、イソノルロン (isonoruron)、イソプロツロン (isoproturon)、イソプロパリン (isopropalin)、イソポリナート (isopolinate)、イソメチオジン (isomethiozin)、イナベンフィド (inabenfide)、イパジン (ipazine)、イプフェンカルバゾン (ipfencarbazone)、イプリミダム (iprymidam)、イマザキン (imazaquin)、イマザピック (imazapic)、イマザピル (imazapyr)、イマザメタピル (imazamethapyr)、イマザメタベンズ (imazamethabenz)、イマザメタベンズメチル (imazamethabenz-methyl)、イマザモックス (imazamox)、イマゼタピル (imazethapyr)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、インダジフラム (indaziflam)、インダノファン (indanofan)、インドール酪酸 (indolebutyric acid)、ウニコナゾール-P (uniconazole-P)、エグリナジン (eglinazine)、エスプロカルブ (esprocarb)、エタメスルフロン (ethametsulfuron)、エタメトスルフロンメチル (eth

ametsulfuron-methyl)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、エチオレート (ethiolate)、エチクロゼート-エチル(ethychlozate ethyl)、エチジムロン (ethidimuron)、エチノフェン (etinofen)、エテホン(ethephon)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エトキシフェン (ethoxyfen)、エトニプロミド (etnipromid)、エトフメセート (ethofumesate)、エトベンザニド (etobenzanid)、エプロナズ (epronaz)、エルボン (erbon)、エンドタール (endothal)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、オキサピラゾン (oxapyrazon)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、オリザリン (oryzalin)、オルソスルフアムロン (orthosulfamuron)、オルベンカルブ (orbencarb)、カフェンストロール (cafenstrole)、カムベンジクロール (cambendichlor)、カルバスラム (carbasulam)、カルフェントラゾン (carfentrazone)、カルフェントラゾン-エチル(carfentrazone-ethyl)、カルブチレート (karbutilate)、カルベタミド (carbetamide)、カルボキサゾール (carboxazole)、キザロホップ (quizalofop)、キザロホップ-P (quizalofop-P)、キザロホップ-エチル(quizalofop-ethyl)、キシラクロール (xylachlor)、キノクラミン (quinoclamine)、キノナミド (quinonamid)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、クミルロン (cumyluron)、クリオジネート (cliodinate)、グリホサート(glyphosate)、グルホシネート (glufosinate)、グルホシネート-P (glufosinate-P)、クレダジン (credazine)、クレトジム (clethodim)、クロキシホナック(cloxyfonac)、クロジナホップ (clodinafop)、クロジナホップ-プロパルギル(clodinafop-propargyl)、クロトルロン (chlorotoluron)、クロピラリド (clopyralid)、クロプロキシジム (cloproxydim)、クロプロップ (cloprop)、クロブロムロン (chlorbromuron)、クロホップ (clofop)、クロマゾン (clomazone)、クロメトキシニル(chlomethoxynil)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロメプロップ (clomeprop)、クロラジホップ (chlorazifop)、クロラジン (chlorazine)、クロラスラム (clor

ansulam)、クロラノクリル (chloranocryl)、クロラムベン (chloramben)、クロランスラム-メチル (cloransulam-methyl)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン (chlorimuron)、クロリムロン-エチル (chlorimuron-ethyl)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルタール (chlorthal)、クロルチアミド (chlorthiamid)、クロルトルロン (chlortoluron)、クロルニトロフェン (chlornitrofen)、クロルフェナック (chlorfenac)、クロルフェンプロップ (chlorfenprop)、クロルブファム (chlorbufam)、クロルフルラゾール (chlorflurazole)、クロルフルレノール (chlorflurenol)、クロルプロカルブ (chlorprocarb)、クロルプロファム (chlorpropham)、クロルメコート (chlormequat)、クロレツロン (chloreturon)、クロロキシニル (chloroxynil)、クロロクスロン (chloroxuron)、クロロポン (chloropon)、サフルフェナシル (saflufenacil)、シアナジン (cyanazine)、シアナトリン (cyanatryn)、ジアレート (di-allate)、ジウロン (diuron)、ジエタムコート (diethamquat)、ジカンバ (dicamba)、シクルロン (cycluron)、シクロエート (cycloate)、シクロキシジム (cycloxydim)、ジクロスラム (diclosulam)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamuron)、ジクロプロップ (dichlorprop)、ジクロプロップ-P (dichlorprop-P)、ジクロベニル (dichlobenil)、ジクロホップ (diclofop)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、ジクロメート (dichlormate)、ジクロラルウレア (dichloral urea)、ジクワット (diquat)、シサニリド (cisanilide)、ジスル (disul)、シズロン (siduron)、ジチオピル (dithiopyr)、ジニトラミン (dinitramine)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、ジノサム (dinosam)、シノスルフロン (cinosulfuron)、ジノセブ (dinoseb)、ジノテルブ (dinoterb)、ジノフェナート (dinofenate)、ジノプロップ (dinoprop)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ジフェナミド (diphenamid)、ジフェノクスロン (difenoxuron)、ジフェノペンテン (difenopenten)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、シブトリン (cybutryne)、シプラジン (cyprazine)、シプラゾール (cyprazole)、ジフルフェニカン (diflufenican)、ジフル

フェンゾピル (diflufenzopyr)、ジプロペトリン (dipropetryn)、シプロミド (cypromid)、シペルコート (cyperquat)、ジベレリン (gibberellin)、シマジン (simazine)、ジメキサノ (dimexano)、ジメタクロール (dimetachlor)、ジメダゾン (dimidazon)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、シメトリン (simetryn)、シメトン (simeton)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメフロノ (dimefuron)、シンメチリン (cinmethylin)、スエップ (swep)、スルグリカピン (sulglycapin)、スルコトリオン (sulcotrione)、スルファレート (sulfallate)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、スルホスルフロノ (sulfosulfuron)、スルホメツロン (sulfometuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、セクブメトン (sebumeton)、セトキシジム (sethoxydim)、セブチラジン (sebuthylazine)、ターバシル (terbacil)、ダイムロン (daimuron)、ダゾメット (dazomet)、ダラポン (dalapon)、チアザフルロン (thiazafururon)、チアゾピル (thiazopyr)、チエンカルバゾン (thiencarbazone)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazone-methyl)、チオカルバジル (tiocarbaryl)、チオクロリム (tioclorim)、チオベンカルブ (thiobencarb)、チジアジミン (thidiazimin)、チジアズロン (thidiazuron)、チフェンスルフロノ (thifensulfuron)、チフェンスルフロノメチル (thifensulfuron-methyl)、デスメディファム (desmedipham)、デスメトリン (desmetryn)、テトラフルロン (tetrafluron)、テニルクロール (thenylchlor)、テブタム (tebutam)、テブチウロン (tebuthiuron)、テルブメトン (terbumeton)、テプラロキシジム (tepraloxymid)、テフリールトリオン (tefuryltrione)、テムボトリオン (tembotrione)、デラクロール (delachlor)、テルバシル (terbacil)、テルブカルブ (terbucarb)、テルブクロール (terbucchlor)、テルブチラジン (terbuthylazine)、テルブトリン (terbutryn)、トプラメゾン (topramezone)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、トリアジフラム (triaziflam)、トリアスルフロノ (triasulfuron)、トリアレート (tri-allate)、トリエタジン (trietazine)、トリカンバ (tricamba)、

トリクロピル (triclopyr)、トリジファン (tridiphane)、トリタック (tritac)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、トリフルスルフロン (triflurosulfuron)、トリフルスルフロンメチル(triflurosulfuron-methyl)、トリフルラリン (trifluralin)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリプロピンダン (tripropindan)、トリベニューロンメチル(tribenuron-methyl)、トリベヌロン (tribenuron)、トリホップ (trifop)、トリホプシメ (trifopsime)、トリメツロン (trimeturon)、ナプタラム (naptalam)、ナプロアニリド (naproanilide)、ナプロパミド (napropamide)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、ニトラリン (nitralin)、ニトロフェン (nitrofen)、ニトロフルオルフェン (nitrofluorfen)、ニピラクロフェン (nipyraclufen)、ネブロン (neburon)、ノルフルラゾン (norflurazon)、ノルロン (noruron)、バーバン (barban)、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、パラコート (paraquat)、パラフルロン (parafluron)、ハロキシジン (haloxydine)、ハロキシホップ (haloxyfop)、ハロキシホップ-P (haloxyfop-P)、ハロキシホップメチル(haloxyfop-methyl)、ハロサフェン (halosafen)、ハロスルフロン (halosulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ビスクロピロン (bicyclopyrone)、ビスピリバック (bispribac)、ビスピリバックナトリウム(bispribac-sodium)、ピダノン (pydanon)、ピノキサデン (pinoxaden)、ビフェノックス (bifenox)、ピペロホス (piperophos)、ヒメキサゾール(hymexazol)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラスルホトール (pyrasulfotole)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピラゾスルフロン (pyrazosulfuron)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラナホス (bilanafos)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、ピリクロール (pyriclor)、ピリダホール (pyridafol)、ピリチオバック (pyrithiobac)、ピリチオバックナトリウム(pyrithiobac-sodium)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリ

ミスルファン (pyrimisulfan)、ピリミスルフロン (primisulfuron)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl)、ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、ピロクスラム (pyroxsulam)、フェナスラム (fenasulam)、フェニソファム (phenisopham)、フェヌロン (fenuron)、フェノキサスルホン (fenoxasulfone)、フェノキサプロップ (fenoxaprop)、フェノキサプロップ-P (fenoxaprop-P)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フェノチオール (phenothiol)、フェノプロップ (fenoprop)、フェノベンズロン (phenobenzuron)、フェンチアプロップ (fenthiaaprop)、フェンテラコール (fenteracol)、フェントラザミド (fentrazamide)、フェンメディファム (phenmedipham)、フェンメディファムエチル (phenmedipham-ethyl)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホス (butamifos)、ブチウロン (buthiuron)、ブチダゾール (buthidazole)、ブチレート (butylate)、ブツロン (buturon)、ブテナクロール (butenachlor)、ブトキシジム (butoxydim)、ブトラリン (butralin)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、フラムプロップ (flamprop)、フリロオキシフェン (furyloxyfen)、プリナクロール (prynachlor)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、フルアジホップ (fluazifop)、フルアジホップ-P (fluazifop-P)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、フルアゾレート (fluazolate)、フルロキシピル (fluroxypyr)、フルオチウロン (fluothiuron)、フルオメツロン (fluometuron)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen)、フルロクロリドン (flurochloridone)、フルオロジフェン (fluorodifen)、フルオロニトロフェン (fluoronitrofen)、フルオロミジン (fluoromidine)、フルカルバゾン (flucarbazon)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazon-sodium)、フルクロラリン (fluchloralin)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、フルチアセット (fluthiacet)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、フルピルスルフロン (flupyr-sulfuron)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェニカン (flufenican)、フルフェンピル (flufenpyr)、フルプロパシル (flupropacil)、フルプロパナート

(flupropanate)、フルボキサム (flupoxam)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルミクロラック (flumiclorac)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl)、フルミプロピン (flumipropyn)、フルメジン (flumezin)、フルオメツロン (fluometuron)、フルメトスラム (flumetsulam)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、フルロキシピル (fluroxypyr)、プレチラクロール (pretilachlor)、プロキサン (proxaan)、プログリナジン (proglinazine)、プロシアジン (procyazine)、プロジアミン (prodiamine)、プロスルファリン (prosulfalin)、プロスルフロン (prosulfuron)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、プロパキザホップ (propaquizafop)、プロパクロール (propachlor)、プロパジン (propazine)、プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、プロピソクロール (propisochlor)、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron)、プロファム (propham)、プロフルアゾール (profluazol)、プロフルラリン (profluralin)、プロヘキサジオンカルシウム (prohexadione-calcium)、プロボキシカルバゾン (propoxycarbazone)、プロボキシカルバゾンナトリウム (propoxycarbazone-sodium)、プロホキシジム (profoxydim)、ブロマシル (bromacil)、ブロムピラゾン (brompyrazon)、プロメトリン (prometryn)、プロメトン (prometon)、ブロモキシニル (bromoxynil)、ブロモフェノキシム (bromofenoxim)、ブロモブチド (bromobutide)、ブロモボニル (bromobonil)、フロラスラム (florasulam)、ヘキサクロロアセトン (hexachloroacetone)、ヘキサジノン (hexazinone)、ペトキサミド (pethoxamid)、ベナゾリン (benazolin)、ペノクスラム (penoxsulam)、ペブレート (pebulate)、ベフルブタミド (beflubutamid)、ベルノレート (vernolate)、ペルフルイドン (perfluidone)、ベンカルバゾン (bencarbazone)、ベンザドックス (benzadox)、ベンジプラム (benzipram)、ベンジルアミノプリン (benzylaminopurine)、ベンズチアズロン (benzthiazuron)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ベンスリド (bensulide)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、ベンゾイルプロ

ップ (benzoylprop)、ベンゾビスクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナ
ップ (benzofenap)、ベンゾフルオール (benzofluor)、ベントゾン (benta
zone)、ペンタノクロール (pentanochlor)、ベンチオカーブ (benthiocarb)
、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペントキサゾン (pentoxazone)、
ベンフラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ホサミン
(fosamine)、ホメサフェン (fomesafen)、ホラムスルフロン (foramsulfu
ron)、ホルクロルフエニユロン (forchlorfenuron)、マレイン酸ヒドラジド (maleic hydrazide)、メコプロップ (mecoprop)、メコプロップ-P (mecopro
p-P)、メジノテルブ (medinoterb)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メ
ソスルフロンメチル (mesosulfuron-methyl)、メソトリオン (mesotrione)、
メソプラジン (mesoprazine)、メソプロトリン (methoprotryne)、メタザ
クロール (metazachlor)、メタゾール (methazole)、メタゾスルフロン (m
etazosulfuron)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、メタミト
ロン (metamitron)、メタミホップ (metamifop)、メタム (metam)、メタ
ルプロパリン (methalpropalin)、メチウロン (methiuron)、メチオゾリン
(methiozolin)、メチオベンカルブ (methiobencarb)、メチルダイムロン (m
ethyl dymron)、メトクスロン (metoxuron)、メトスラム (metosulam)、メ
トスルフロン (metsulfuron)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)
、メトフラゾン (metflurazon)、メトブロムロン (metobromuron)、メトベ
ンズロン (metobenzuron)、メトメトン (methometon)、メトラクロール (m
etolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メピコートクロリド (mepiquat
-chloride)、メフェナセツト (mefenacet)、メフルイジド (mefluidide)、
モナリド (monalide)、モニソウロン (monisouron)、モニュヌロン (monur
on)、モノクロル酢酸 (monochloroacetic acid)、モノリニユヌロン (mono
linuron)、モリネート (molinate)、モルフアムコート (morfamquat)、ヨ
ードスルフロン (iodosulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (iodo
sulfuron-methyl-sodium)、ヨードボニル (iodobonil)、ヨードメタン (iod
omethane)、ラクトフェン (lactofen)、リヌロン (linuron)、リムスルフ

ロン (rimsulfuron)、レナシル (lenacil)、ローデタニル (rhodethanil)、過酸化カルシウム (calcium peroxide)、臭化メチル (methyl bromide) 等を例示することができる。

[0174] また、生物農薬として例えば、核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ボックスウイルス (Entomopoxi virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ (Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema kushidai)、パスツーリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobactor)、非病原性エルビニア・カロトボーラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

[0175] 更に、生物農薬として例えば、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレマンアブラバチ (Aphidius colemani)、ショクガタマバエ (Aphidolestes aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメリスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ (Orius sauteri) 等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (Beauveria brongniartii) 等の微生物農薬、(Z) - 10 - テトラデセニル = アセタート、(E, Z) - 4, 10 - テトラデカジニエル = アセタート、(Z) - 8 - ドデセニル = アセタート、(Z) - 11 - テトラデセニル = アセタート、(Z) - 13 - イコセン - 10 - オン、14 - メチル - 1 - オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

[0176] さらに、ヒト、家畜、ペット等の動物の体内又は体外に寄生する寄生虫の駆除にも適している。

本発明に係るインドリン化合物又はその塩を有効成分として含有することと特徴とする動物用の外部寄生虫防除剤、並びに、当該外部寄生虫防除剤を動物の外部寄生虫に処理することを特徴とする動物用外部寄生虫の防除方法も本発明の範疇である。本発明に係る化合物は、猫又は犬等の動物の皮膚に、通常、1箇所又は2箇所、点状塗布又は流し込み塗布して使用することも可能である。塗布面積は、通常5～10cm²である。本発明における化合物は、好ましくは、一度塗布すると動物の体全体に広がり、結晶化したり、外観又は手触りを変えたりすることなく、乾燥し得る。使用量は動物の重量に応じて0.1～10ml、特に猫については約0.5～1ml、犬については約0.3～3mlが好ましい。

[0177] 本発明の外部寄生虫防除剤が効力を示す動物外部寄生虫は、ノミ目害虫としては、ヒトノミ (*Pulex irritans*) 等のPulex類、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*) 等のCtenocephalides類、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) 等のXenopsylla類、スナノミ (*Tunga penetrans*) 等のTunga類、ニワトリノミ (*Echidnophaga gallinacea*) 等のEchidnophaga類、ヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*) 等のNosopsyllus類等が挙げられる。

[0178] シラミ目害虫としては、アタマジラミ (*Pediculus humanus capitis*) 等のPediculus類、ケジラミ (*Phthirus pubis*) 等のPhthirus類、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*) 等のHaematopinus類、ヒツジジラミ (*Damalinia ovis*)、ダマリニア・ボビス (*Damalinia bovis*) 等のDamalinia類、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、ヒツジ体幹寄生ホソジラミ (*Linognathus ovillus*) 等のLinognathus類、ケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) 等のSolenopotes類等が挙げられる。

[0179] ハジラミ目害虫としては、ニワトリハジラミ (*Menopon gallinae*) 等のMenopon類、トリメノポン類 (*Trimenopon* spp.)、トリノトン類 (*Trinoton* spp.)

.)、イヌハジラミ (*Trichodectes canis*) 等の *Trichodectes* 類、ネコハジラミ (*Felicola subrostratus*) 等の *Felicola* 類、ウシハジラミ (*Bovicola bovis*) 等の *Bovicola* 類、ニワトリオオハジラミ (*Menacanthus stramineus*) 等の *Menacanthus* 類、ウェルネッキエラ類 (*Werneckiella* spp.)、レピケントロン類 (*Lepikentron* spp.) 等が挙げられる。

[0180] カメムシ目害虫としては、トコジラミ (*Cimex lectularius*)、ネツタイトコジラミ (*Cimex hemipterus*) 等の *Cimex* 類、レジュヴァイアス・セニリス (*Reduvius senilis*) 等の *Reduvius* 類、アリラス・クリタツス (*Arilus critatus*) 等の *Arilus* 類、ロドニウス・プロリクス (*Rhodnius prolixus*) 等の *Rhodnius* 類、オオサシガメ (*Triatoma rubrofasciata*) 等の *Triatoma* 類、パンストロンギルス類 (*Panstrongylus* spp.) 等が挙げられる。

[0181] ダニ目害虫としては、ローンスターチック (*Amblyomma americanum*)、アンブリオンマ・マクラタム (*Amblyomma maculatum*) 等の *Amblyomma* 類、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、ブーフィラス・アンヌラタス (*Boophilus annulatus*) 等の *Boophilus* 類、アメリカンドックチック (*Dermacentor variabilis*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanicus*)、デルマセントル・アンデルソニ (*Dermacentor andersoni*) 等の *Dermacentor* 類、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*) 等の *Haemaphysalis* 類、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、ブラックレグドチック (*Ixodes scapularis*)、西部クロアシマダニ (*Ixodes pacificus*)、イキシデス・ホロシクラス (*Ixodes holocyclus*) 等の *Ixodes* 類、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファラス・アペンディキュレイタス (*Rhipicephalus appendiculatus*) 等の *Rhipicephalus* 類、ナガヒメダニ (*Argas persicus*) 等の *Argas* 類、オルニトドルス・ヘルムシ (*Ornithodoros hermsi*)、オルニトドルス・ツリカタ (*Ornithodoros turicata*) 等の *Ornithodoros* 類、ヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*)、ウマキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes equi*) 等のキュ

ウセンヒゼンダニ類、クネミドコプテス・ミュタンス (*Knemidocoptes mutans*) 等の*Knemidocoptes*類、ネコショウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*)、ネズミショウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres muris*) 等の*Notoedres*類、センコウヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*) 等の*Sarcoptes*類、ミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*) 等の*Otodectes*類、ウサギズツキダニ (*Listrophorus gibbus*) 等の*Listrophorus*類、ショクヒヒゼンダニ類 (*Chorioptes* spp.)、ヒカダニ類 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス類 (*Pterolichus* spp.)、サイトジテス類 (*Cytodites* spp.)、ラミノシオプテス類 (*Laminosioptes* spp.)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等の*Dermanyssus*類、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*) 等の*Ornithonyssus*類、ミツバチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*) 等の*Varroa*類、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*)、ネコツメダニ (*Cheyletiella blaklei*) 等の*Cheyletiella*類、オルニソケイレチア類 (*Ornithocheyletia* spp.)、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、ネコニキビダニ (*Demodex cati*) 等の*Demodex*類、ミオビア類 (*Myobia* spp.)、プソレルガテス類 (*Psorergates* spp.)、アカツツガムシ (*Trombicula akamushi*)、フトゲツツガムシ (*Trombicula pallida*)、タテツツガムシ (*Trombicula scutellaris*) 等の*Trombicula*類が挙げられ、好ましくはノミ目害虫、シラミ目害虫、又はダニ目害虫である。

[0182] 本発明の外部寄生虫防除剤の投与対象となる動物としては、前記動物外部寄生虫の宿主となり得る動物が挙げられ、通常、家畜やペットとして飼養されている恒温動物および変温動物が挙げられる。恒温動物としては、例えば、哺乳動物としてウシ、スイギュウ、ヒツジ、ヤギ、ブタ、ラクダ、シカ、ファロージカ、トナカイ、ウマ、ロバ、イヌ、ネコ、ウサギ、フェレット、マウス、ラット、ハムスター、リス、サル等が挙げられ、さらには毛皮動物としてミンク、チンチラ、アライグマ等が挙げられ、鳥類としてはニワトリ、ガチョウ、シチメンチョウ、アヒル、ハト、オウム、ウズラ等が挙げられる。変温動物としては、例えば、爬虫類としてはリクガメ、ウミガメ、ミド

リガメ、ゼニガメ、トカゲ、イグアナ、カメレオン、ヤモリ、ニシキヘビ、ナミヘビ、コブラ等が挙げられ、好ましくは恒温動物であり、より好ましくはイヌ、ネコ、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ等の哺乳動物が挙げられる。

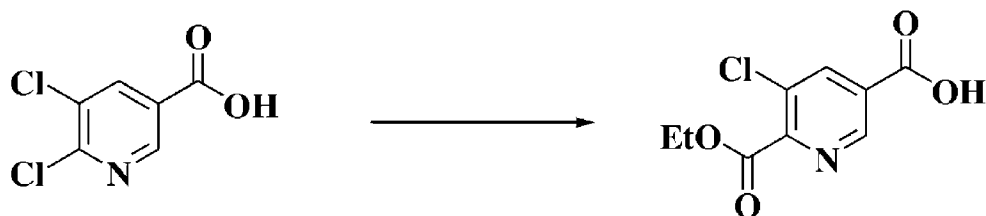
[0183] 以下に本発明の代表的な化合物、及び製造中間体の製造例によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

実施例

[0184] 中間体（2 a）の製造例 1.

5 - クロロ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸の製造方法

[化10]



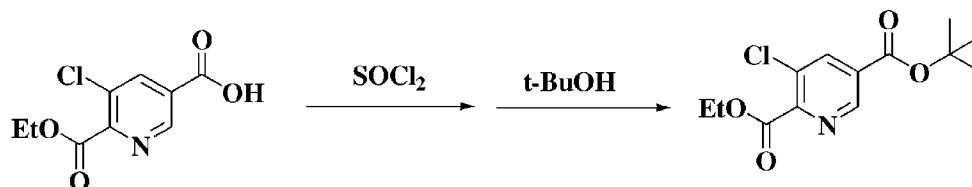
オートクレーブ中、5, 6 - ジクロロピリジン - 3 - カルボン酸（10 g, 52 mmol）のエタノール（60 mL）溶液にDPPB（1,4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン）（2.2 g, 10 mol%）、トリエチルアミン（14 g, 2.5当量）、PdCl₂(PPh₃)₂（911 mg, 2.5 mol%）を加え、反応混合物を一酸化炭素置換し（CO圧、4.0 MPa）、135℃で4時間撹拌した。反応混合物に水、3 N塩酸を加えて水層を酸性にした後に、酢酸エチルで数回抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後に濃縮し、得られた固体をヘキサン - 酢酸エチル = 2 : 1（v/v）の溶液で洗い、目的の5 - クロロ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸10.9 g, 76%）を得た。

物性：¹H-NMR(CDCl₃): 9.02 (d, 1H)、8.44 (d, 1H)、4.42 (dd, 2H)、1.33 (t, 3H)

[0185] 中間体（2 a）の製造例 2.

5 - クロロ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸 t - ブチルエステルの製造方法

[化11]



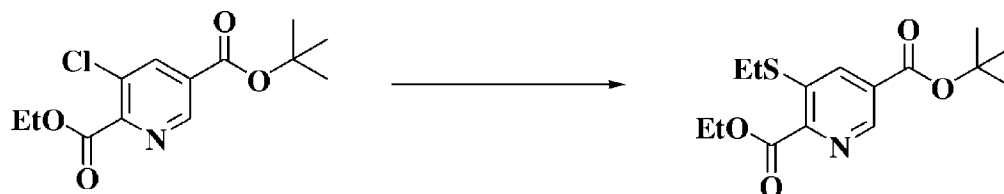
前工程で得られた5 - クロロ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸 (10.9 g, 47.6 mmol) をトルエン (30 mL) に溶解し、DMF (ジメチルホルムアミド) (4 mL) を加えた。続いて、塩化チオニル (11 g, 2 当量) を加え、90℃で3時間加熱撹拌した。反応溶液を室温に戻し、濃縮し、濃縮残渣を得た。別の容器に t - ブタノール (35 mL, 10 当量)、THF (テトラヒドロフラン) (100 mL)、ジイソプロピルエチルアミン (50 mL, 7 当量)、DMA P (N,N-ジメチル-4-アミノピリジン) (6 g, 1 当量) の混合溶液に氷冷下、上述した濃縮残渣をゆっくりと加えた。反応混合物を3時間加熱還流し、室温まで冷却後、水、酢酸エチルを加えて数回抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー (ヘキサン - AcOEt (酢酸エチルエステル) = 5 : 1 (v/v)) に付し、目的の5 - クロロ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸 t - ブチルエステル (8.43 g, 62%) を得た。

物性：¹H - NMR (CDCl₃) : 9.05 (d, 1H)、8.30 (d, 1H)、4.50 (dd, 2H)、1.61 (s, 9H)、1.44 (t, 3H)

[0186] 中間体 (2 a) の製造例 3.

5 - エチルチオ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸 t - ブチルエステルの製造方法

[化12]



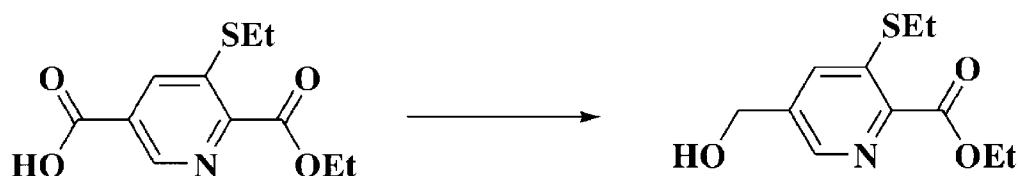
5 - クロロ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸 t-ブチルエステル (8.43 g, 21.65 mmol) を DMF (100 mL) に溶解した。氷冷下、ナトリウムエタンチオレート (2.27 g, 1 当量) をゆっくりと加え、5 分攪拌した後、水を加え、続けて 0.5 N 塩酸を加えた。酢酸エチルで数回抽出した後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー (ヘキサン - AcOEt = 5 : 1 (v/v)) に付し、目的の 5 - エチルチオ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸 t-ブチルエステル (6.17 g, 92%) を得た。

物性：¹H-NMR (CDCl₃) : 8.91 (d, 1H)、8.22 (d, 1H)、4.49 (dd, 2H)、2.99 (dd, 2H)、1.61 (s, 9H)、1.45 (t, 3H)、1.40 (t, 3H)

[0187] 中間体 (2a) の製造例 4.

3 - エチルチオ - 5 - ヒドロキシメチルピリジン - 2 - カルボン酸 エチルエステルの製造方法

[化13]



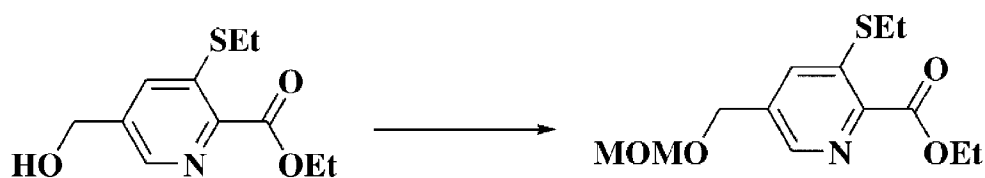
上記製造例 3 に記載の製造方法に従って製造した 10 g の 5 - エチルチオ - 6 - エトキシカルボニルピリジン - 3 - カルボン酸の THF 溶液 (100 mL) に CDI (カルボニルジイミダゾール) (10 g) を加え、室温で 2 時間攪拌した。NaBH₄ (5.5 g) 100 mL 水溶液に上記の THF 溶

液を0℃でゆっくり加えた後、室温で1時間撹拌した。反応終了後、4 M 塩酸溶液を加え、pH 2にした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-エチルチオ-5-ヒドロキシメチルピリジン-2-カルボン酸 エチルエステル (6.4 g, 62%) を得た。

物性：¹H-NMR (CDCl₃) : 8.39 (d, 1H)、7.73 (d, 1H)、4.81 (d, 2H)、4.49 (q, 2H)、2.96 (q, 2H)、1.92 (t, 1H)、1.45 (t, 3H)、1.40 (t, 3H)

[0188] 中間体 (2a) の製造例5. 3-エチルチオ-5-メトキシメトキシピリジン-2-カルボン酸 エチルエステルの製造方法

[化14]



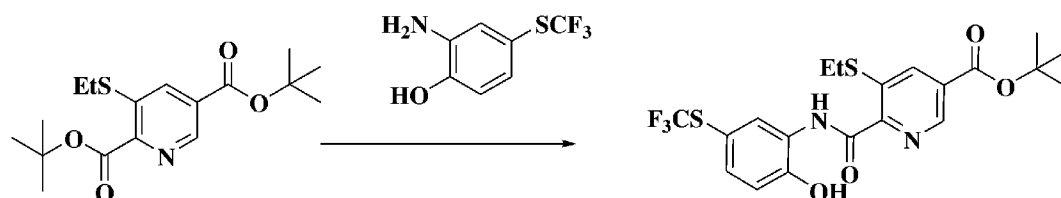
6.4 g の 3-エチルチオ-5-ヒドロキシメチルピリジン-2-カルボン酸 エチルエステルの CHCl₃ 溶液 (50 mL) に DIPEA (N,N-ジイソプロピルエチルアミン) (13.6 mL) とメトキシメチルクロライド (MOMCl) (6.0 mL) を加え、室温で1時間撹拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮して 3-エチルチオ-5-メトキシメトキシピリジン-2-カルボン酸 エチルエステル (7.1 g, 94%) を得た。

物性：¹H-NMR (CDCl₃) : 8.40 (d, 1H)、7.68 (d, 1H)、4.73 (s, 2H)、4.67 (s, 2H)、4.49 (q, 2H)、3.41 (s, 3H)、2.96 (q, 2H)、1.45 (t, 3H)

）、1.40（t、3H）

[0189] 中間体の製造例6．*t*-ブチル 5-エチルチオ-6-（（2-ヒドロキシ-5-（トリフルオロメチルチオ）フェニル）カルバモイル）ニコチネートの製造方法

[化15]



3-（エチルチオ）ピリジン-2，5-ジカルボン酸 ジ*t*-ブチルエステル（6.5 g，19.1 mmol）のTHF溶液（100 mL）に室温でカリウム*t*-ブトキシド（5.4 g，47.8 mmol）と2-アミノ-4-（トリフルオロメチルチオ）フェノール（4.0 g，19.1 mmol）を順次ゆっくり加えた後、1時間撹拌した。反応混合物を飽和塩化アンモニウム溶液に対し、ゆっくりと加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮しシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た。

[0190] 中間体の製造例7．*t*-ブチル 5-エチルチオ-6-（5-（トリフルオロメチルチオ）ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル）ニコチネートの製造方法

[化16]



t-ブチル 5-エチルチオ-6-（（2-ヒドロキシ-5-（トリフルオロメチルチオ）フェニル）カルバモイル）ニコチネートのTHF溶液（100 mL）に室温でPPh₃（7.52 g，28.7 mmol）とDEAD

(アゾジカルボン酸ジエチル) (14.3 mL, 28.7 mmol, 2.2 m) を順次加え、60 °Cまで昇温し、2時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た。

[0191] 中間体の製造例 8. t - ブチル 5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチネートの製造方法

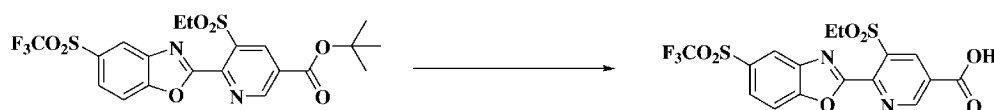
[化17]



t - ブチル 5 - エチルチオ - 6 - (5 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾオキサゾール - 2 - イル) ニコチネートの CHCl_3 溶液 (100 mL) に氷冷下、m - CPBA (メタクロロ過安息香酸) (25.3 g, 95.6 mmol) を加え、室温で終夜攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、 CHCl_3 で抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た (4.99 g, 9.59 mmol, 50%)。

[0192] 中間体の製造例 9. 5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチン酸の製造方法

[化18]



t - ブチル 5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチネート (4.99 g

, 9.59 mmol) に室温でトリフルオロ酢酸 (50 mL) を加え、室温で終夜撹拌した。反応終了後、減圧濃縮した。得られた残渣にヘキサンを加え、生じた固体を濾過して集め、目的物を得た (3.53 g, 7.61 mmol, 79%)。

[0193] 中間体の製造例 10. 5 - エチルスルホニル - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンアミドの製造方法

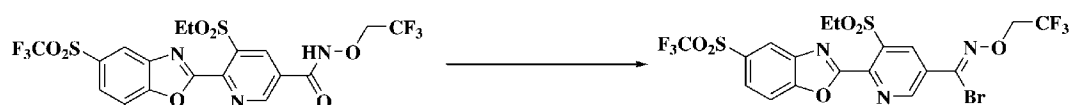
[化19]



5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチン酸 (4.34 g, 9.35 mmol) の溶液に室温で 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシアミン塩酸塩 (1.83 g, 12.2 mmol) とジメチルアミノピリジン (3.4 g, 28.0 mmol) と EDCI · HCl (2.33 g, 12.2 mmol) を順次加え、室温で終夜撹拌した。反応終了後、1 M HCl 水溶液を加え、CHCl₃ で抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た (4.96 g, 8.84 mmol, 95%)。

[0194] 中間体の製造例 11. 5 - エチルスルホニル - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンイミドイルブロミドの製造方法

[化20]

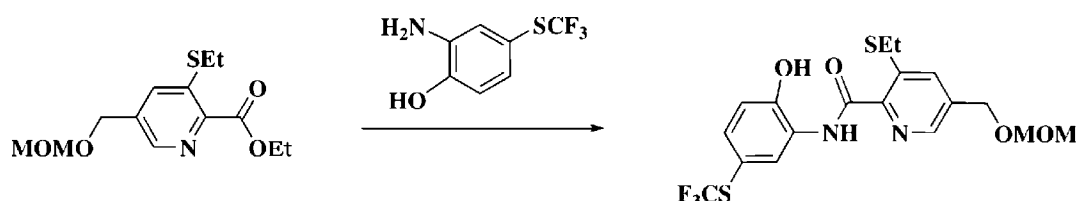


5 - エチルスルホニル - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2

-イル)ニコチンアミド (3.64 g, 6.48 mmol) のTHF溶液 (65 mL) に室温で PPh_3 (3.40 g, 13.0 mmol) と CBr_4 (4.30 g, 13.0 mmol) とを順次加え、室温で終夜撹拌した。反応終了後、セライト濾過し、酢酸エチルで濾過物を洗浄した。濾液を減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た (3.77 g, 6.04 mmol, 93%)。

[0195] 参考例 1. 3-エチルチオ-5-(メトキシメトキシ)-N-(2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルチオ)フェニル)-2-ピリジンカルボン酸アミドの製造方法

[化21]



前記中間体 (2a) の製造方法で製造した 0.64 g の 3-エチルチオ-5-メトキシメチル-2-ピリジンカルボン酸エチルエステルのTHF溶液 (10 mL) に 0℃で NaH (0.36 g) と 0.4 g の 2-アミノ-4-(トリフルオロメチルチオ)フェノールのTHF溶液 (2 mL) を加えた後、50℃で2時間撹拌した。反応終了後、飽和 NH_4Cl 水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-エチルチオ-5-(メトキシメトキシ)-N-(2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルチオ)フェニル)-2-ピリジンカルボン酸アミド (0.73 g, 60%) を得た。

物性: m. p. 135 - 136℃

[0196] 参考例 2. 2-(3-エチルチオ-5-(メトキシメトキシ)ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールの製造方法

[化22]



0.73 g の 3 - エチルチオ - 5 - (メトキシメトキシ) - N - (2 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル) - 2 - ピリジンカルボン酸アミドの THF 溶液 (5 mL) に PPh_3 (1.04 g) とアゾジカルボン酸ビス (2 - メトキシエチル) (0.93 g) を加えた後、60 °C で 1 時間攪拌した。反応終了後、 H_2O を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2 - (3 - エチルチオ - 5 - (メトキシメトキシ)ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ)ベンゾ [d] オキサゾール (0.70 g、定量的) を得た。

物性 : m. p. 145 - 146 °C

[0197] 参考例 3. 2 - (5 - メトキシメトキシ - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ)ベンゾ [d] オキサゾールの製造方法

[化23]



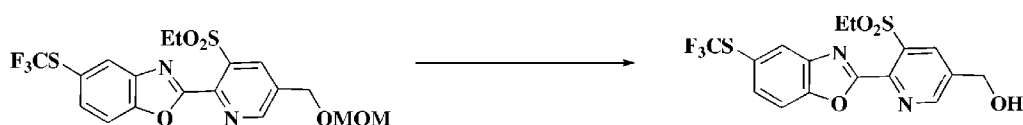
0.68 g の 2 - (3 - エチルチオ - 5 - (メトキシメトキシメチル)ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ)ベンゾ [d] オキサゾールの酢酸エチル溶液 (15 mL) に室温で m - クロロ過安息香酸 (0.74 g) を加え、2 時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減

圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2 - (5 - メトキシメトキシ - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール (0.40 g、60%) を得た。

物性：m. p. 127 - 128℃

[0198] 参考例 4. 2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - (ヒドロキシメチル) ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾールの製造方法

[化24]



0.55 g の 2 - (5 - メトキシメトキシ - 3 - エチルスルホニル - ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾールのメタノール溶液 (7 mL) に濃塩酸 (2 mL) を加え、室温で終夜撹拌した。反応終了後、減圧乾燥し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - (ヒドロキシメチル) ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール (0.34 g、70%) を得た。

物性：m. p. 156 - 157℃

[0199] 参考例 5. (5 - エチルスルホニル) - 6 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンアルデヒドの製造方法

[化25]



0.34 g の 2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - (ヒドロキシメチル) ピリジン - 2 - イル) - 5 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾールの CHCl_3 溶液 (7 mL) に B A I B ([ビス(アセトキシ)-イオド]ベンゼン) (0.32 g) と TEMPO (2, 2, 6, 6 - テトラメチルピペリジン 1-オキシル フリーラジカル) (0.028 g) を加え、室温で終夜撹拌した。反応終了後、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、5 - エチルスルホニル - 6 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンアルデヒド (0.26 g、75%) を得た。

物性：m. p. 150 - 151 °C

[0200] 参考例 6. 5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンアルデヒド オキシムの製造方法

[化26]



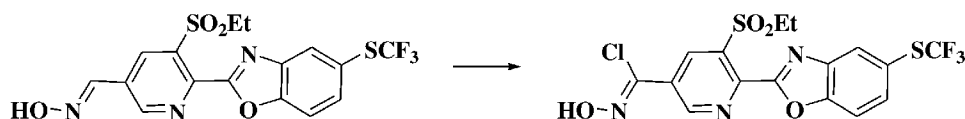
0.51 g の 5 - エチルスルホニル - 6 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンアルデヒドの EtOH 溶液 (12 mL) に 0.13 g のヒドロキシルアミン塩酸塩と 0.15 g の AcONa を加え、2 時間で加熱還流した。反応終了後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、0.47 g (87%) の 5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンアルデヒド オキシムを得た。

物性：m. p. 213 - 214 °C

[0201] 製造実施例 1. クロロ 5 - エチルスルホニル - N - ヒドロキシ - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチ

ンイミデートの製造方法

[化27]

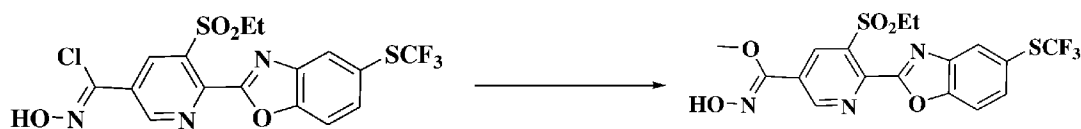


0.05 g の 5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンアルデヒド オキシムの MeOH 溶液 (4 mL) に 0.015 mL の t - BuOCl を 0℃ で加え、1 時間攪拌した。反応終了後減圧濃縮し、クロロ 5 - エチルスルホニル - N - ヒドロキシ - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンイミデートを定量的に得た。

物性：¹H - NMR (CDCl₃) : 9.45 (d、1H)、8.98 (d、1H)、8.21 (d、1H)、7.78 (d、1H)、7.77 (d、1H)、3.51 (q、2H)、1.47 (t、3H)

[0202] 製造実施例 2. メチル 5 - エチルスルホニル - N - ヒドロキシ - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンイミデートの製造方法

[化28]



前実施例 1 で得られたクロロ 5 - エチルスルホニル - N - ヒドロキシ - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンイミデートに MeOH (2 mL) と NaOMe (28% MeOH 溶液) を 0℃ で加え、1 時間攪拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、メチル 5 - エチルスルホニル - N - ヒドロキシ - 6 - (5 - トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンイミデート (0.029 g,

54%)を得た。

物性： ^1H -NMR (CDCl_3) : 9.34 (d、1H)、8.85 (d、1H)、8.19 (d、1H)、7.83 (s、1H)、7.78 (dd、1H)、7.74 (dd、1H)、4.29 (s、3H)、4.06 (q、2H)、1.45 (t、3H)

[0203] 製造実施例3. メチル 5-エチルスルホニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ-6-(5-トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンイミデート (化合物番号3-76) の製造方法 [化29]



0.029 g のメチル 5-エチルスルホニル-N-ヒドロキシ-6-(5-トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンイミデートのDMF溶液(1 mL)に0.04 gの Cs_2CO_3 と0.02 mgのトリフルオロメタンスルホン酸2, 2, 2-トリフルオロエチルを加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製してメチル 5-エチルスルホニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ-6-(5-トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンイミデート(0.022 g、65%)を得た。

物性：m. p. 135 - 136°C

[0204] 製造実施例4. プロピル 5-エチルスルホニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-6-(5-(トリフルオロメチルスルフィニル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンイミデート (化合物番号3-282) の製造方法

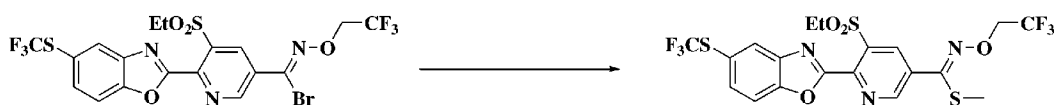
[化30]



5 - エチルスルホニル - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンイミドイルブロミド (0. 050 g, 0. 082 mmol) のトルエン溶液 (1 mL) に室温で n - プロパノール (1 mL) と Rock Phos Pd G3 (0. 005 g) を順次加え、50 °C で 10 分撹拌した。反応終了後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た (0. 007 g, 0. 012 mmol, 14%)。

[0205] 製造実施例 5. メチル 5 - エチルスルホニル - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 6 - (5 - (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ピリジン - 3 - カルボイミドチオエート (化合物番号 3 - 288) の製造方法

[化31]



5 - エチルスルホニル - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルホニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ニコチンイミドイルブロミド (0. 050 g, 0. 084 mmol) の MeOH 溶液 (1 mL) に室温で NaSMe (0. 08 g, 0. 13 mmol) を加え、1 時間撹拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物 (0. 018 g, 0. 032 mmol, 38%) を得た。

[0206] 製造実施例 6. N - (5 - エチルスルホニル - 6 - (5 - (トリフルオロメチルスルフィニル) ベンゾ [d] オキサゾール - 2 - イル) ピリジン - 3 -

イル) ((2, 2, 2-トリフルオロエトキシイミノ)メチルアセタミド (化合物番号3-291)の製造方法

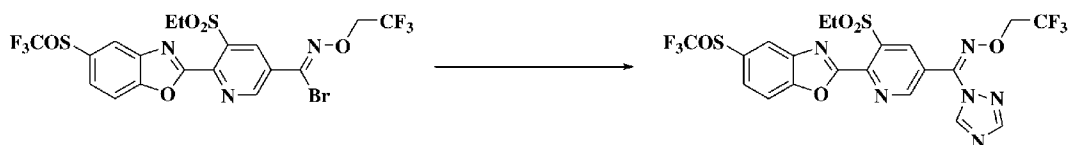
[化32]



5-エチルスルホニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-6-(5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンイミドイルブロミド (0.050 g, 0.082 mmol) のトルエン溶液 (1 mL) に室温でアセトアミド (0.08 g, 0.12 mmol) と Xantphos (0.011 g, 0.020 mmol) と Cs_2CO_3 (0.080 g, 0.25 mmol)、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ (0.008 g, 0.008 mmol) を加え、2時間加熱還流した。反応終了後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た (0.024 g, 0.041 mmol, 50%)。

[0207] 製造実施例7. 5-エチルスルホニル-6-(5-(トリフルオロメチルスルフィニル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-イル) (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)メタノン O-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)オキシム (化合物番号3-289)の製造方法

[化33]



5-エチルスルホニル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-6-(5-(トリフルオロメチルスルフィニル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンイミドイルブロミド (0.050 g, 0.082 mmol) のDMF溶液 (1 mL) に氷冷下、1, 2, 4-トリアゾール (0.028 g, 0.40 mmol) とNaH (0.016 g, 0.040 mmol)

l) を順次加え、室温で 1 時間撹加した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して目的物を得た (0.036 g, 0.061 mmol, 74%)。

[0208] 以下に、製剤の実施例を示すが、これらに限定されるものではない。製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

[0209] 製剤例 1.

本発明化合物	10 部
キシレン	70 部
N-メチルピロリドン	10 部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合 (重量比 1 : 1)	10 部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

[0210] 製剤例 2.

本発明化合物	3 部
クレー粉末	82 部
珪藻土粉末	15 部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。	

[0211] 製剤例 3.

本発明化合物	5 部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90 部
リグニンスルホン酸カルシウム	5 部
以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。	

[0212] 製剤例 4.

本発明化合物	20 部
カオリンと合成高分散珪酸	75 部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合（重量比 1 : 1） 5 部
以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

[0213] 次に本発明の試験例を示すが、これらに限定されるものではない。

[0214] 試験例 1 .

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) に対する防除価試験

直径 8 c m、高さ 8 c m のプラスチックポットにハクサイを植えてモモアカアブラムシを繁殖させ、それぞれのポットの寄生虫数を調査した。本発明の一般式 (1) で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて 5 0 0 p p m の薬液に希釈し、該薬液をポット植えハクサイの茎葉に散布して風乾後、ポットを温室に保管し、薬剤散布後 6 日目にそれぞれのハクサイに寄生しているモモアカアブラムシの寄生虫数を調査し、下記の式より防除価を算出し、下記判定基準に従って判定した。

[0215] [数1]

$$\text{防除価} = 100 - \{ (T \times C_a) / (T_a \times C) \} \times 100$$

[0216] T a : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C a : 無処理区の散布前寄生虫数

C : 無処理区の散布後寄生虫数

[0217] 判定基準

A . . . 防除価 1 0 0 %

B . . . 防除価 9 9 % ~ 9 0 %

C . . . 防除価 8 9 % ~ 8 0 %

D . . . 防除価 7 9 % ~ 5 0 %

[0218] その結果、本発明化合物の 1-6、1-10、1-66、1-71、2-6、3-6、3-76、3-86、3-126、3-133、3-146、3-216、3-275、3-276、3-281、3-282、3-283、3-284、3-285、3-286、3-287、3-288、3-

289, 3-290, 3-291, 3-292, 3-293、又は3-294は、Aの活性を示した。

[0219] 試験例2. ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*) に対する殺虫試験

本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて500ppmの薬液に希釈し、該薬液にイネ実生(品種:日本晴)を30秒間浸漬し、風乾した後にガラス試験管に入れ、ヒメトビウンカ3令を各10頭ずつ接種した後に綿栓をし、接種8日後に生死虫数を調査し、補正死虫率を下記の式より算出し、下記の判定基準に従って判定を行った。

[0220] [数2]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{(\text{無処理区生存率} - \text{処理区生存率})}{(\text{無処理区生存率})} \times 100$$

[0221] 補正死虫率

- A . . . 補正死虫率100%
- B . . . 補正死虫率99%~90%
- C . . . 補正死虫率89%~80%
- D . . . 補正死虫率79%~50%

[0222] その結果、本発明化合物の1-6、1-10、1-66、1-71、2-6、3-6、3-76、3-86、3-126、3-133、3-146、3-216、3-275、3-276、3-281、3-282、3-283、3-284、3-285、3-286、3-287、3-288、3-289、3-290、3-291、3-292、3-293、又は3-294は、Aの活性を示した。

[0223] 試験例3. コナガ(*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液に約

30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、試験例2の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制。

[0224] [数3]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

[0225] その結果、本発明化合物の1-6、1-10、1-66、1-71、2-6、3-6、3-76、3-86、3-126、3-133、3-146、3-216、3-275、3-276、3-281、3-282、3-283、3-284、3-285、3-286、3-287、3-288、3-289、3-290、3-291、3-292、3-293、又は3-294は、Aの活性を示した。

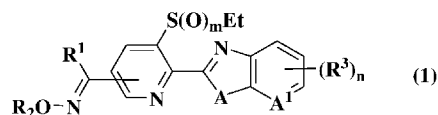
産業上の利用可能性

[0226] 本発明に係る化合物は、幅広い農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有しており、有用である。

請求の範囲

[請求項1] 一般式 (1)

[化1]



{式中、 R^1 は、(a1) ハロゲン原子；(a2) (C_1-C_6) アルコキシ基；(a3) (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；(a4) (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；(a5) (C_1-C_6) アルキルチオ基；(a6) (C_2-C_6) アルケニルチオ基；(a7) (C_2-C_6) アルキニルチオ基；(a8) イミダゾール基；(a9) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C_1-C_6) アルキル基、(f)ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(g) (C_1-C_6) アルコキシ基、(h)ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(i) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルコキシ基、(j) (C_1-C_6) アルキルチオ基、(k)ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(l) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(n) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基から選択される1～3の置換基を環上に有するイミダゾール基；(a10) トリアゾール基；(a11) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C_1-C_6) アルキル基、(f)ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(g) (C_1-C_6) アルコキシ基、(h)ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(i) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルコキシ基、(j) (C_1-C_6) アルキルチオ基、(k)ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(l) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(n) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基から選択される1～2の置換基を環上に

有するトリアゾール基；

(a12) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基；

(a13) (C₁-C₆) アルキルカルボニルアミノ基；

(a14) (C₁-C₆) アルコキシカルボニルアミノ基；

(a15) (C₁-C₆) アルキルカルボニル ((C₁-C₆) アルキル) アミノ基；又は

(a16) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルコキシ基を示す。

R²は、(b1) 水素原子；(b2) (C₁-C₆) アルキル基；(b3) (C₂-C₆) アルケニル基；(b4) (C₂-C₆) アルキニル基；(b5) (C₃-C₆) シクロアルキル基；(b6) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルキル基；(b7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基；(b8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；(b9) ハロ (C₂-C₆) アルケニル基；(b10) ハロ (C₂-C₆) アルキニル基；又は(b11) (C₁-C₆) アルキルチオ (C₁-C₆) アルキル基を示す。

R³は、(c1) ハロゲン原子；(c2) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；(c3) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基；(c4) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；(c5) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；又は(c6) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；を示す。

Aは酸素原子、又はN - R⁴を示す（ここでR⁴は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基；(e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基；(e3) (C₂-C₆) アルケニル基；又は(e4) (C₂-C₆) アルキニル基；を示す）。

A¹はCH基、又は窒素原子を示し、mは0、1、又は2を示し、nは0、1、又は2を示す。} で示されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩。

[請求項2] Aが酸素原子であり、A¹がCH基である請求項1に記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩。

[請求項3] Aが、N - R⁴である（ここでR⁴は、前記に同じ。）である請求

項 1 に記載のオキシム化合物又はその塩。

- [請求項4] 請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。
- [請求項5] 請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩の有効量で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。
- [請求項6] 請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする動物用外部寄生虫防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/046772

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl. C07D413/04 (2006.01) i, A01N43/707 (2006.01) i, A01N43/76 (2006.01) i, A01N43/90 (2006.01) i, A01N47/02 (2006.01) i, A01P7/04 (2006.01) i, A61K31/4439 (2006.01) i, A61K31/444 (2006.01) i, A61P33/14 (2006.01) i, C07D471/04 (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)

Int.Cl. C07D413/04, A01N43/707, A01N43/76, A01N43/90, A01N47/02, A01P7/04, A61K31/4439, A61K31/444, A61P33/14, C07D471/04

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

Published examined utility model applications of Japan	1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan	1971-2018
Registered utility model specifications of Japan	1996-2018
Published registered utility model applications of Japan	1994-2018

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

CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2016/121997 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 04 August 2016 & US 2018/0002347 A1 & AU 2016213001 A & KR 10-2017-0095909 A & CN 107207460 A & TW 201632505 A & AR 103547 A	1-6
A	WO 2015/071180 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 21 May 2015 & JP 2017-502927 A & US 2016/0272638 A1 & EP 2873668 A1 & EP 3068780 A1 & CN 105722839 A & ES 2638504 T	1-6



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

19 March 2018 (19.03.2018)

Date of mailing of the international search report

03 April 2018 (03.04.2018)

Name and mailing address of the ISA/

Japan Patent Office
3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/046772

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 2016/116338 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 28 July 2016 & EP 3247712 A1 & CN 107207501 A	1-6
A	WO 2016/104746 A1 (NIHON NOYAKU CO., LTD.) 30 June 2016 (Family: none)	1-6
A	WO 2016/144351 A1 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 15 September 2016 (Family: none)	1-6
P, X	WO 2017/065183 A1 (NIHON NOYAKU CO., LTD.) 20 April 2017, claims, table 2 (compounds 2-13 to 24, 37 to 42, 49 to 54, 61 to 66, 79 to 90, 103 to 108, 115 to 120, 127 to 132, 145 to 156, 169 to 174, 181 to 186, 194 to 198, 205 to 210, 217 to 222, 229 to 234, 239 to 240, 243, 245, 247, 253, 259, 265, 279, 281, 283, 285, 287), table 4 (compounds 4-6 to 10, 16 to 20, 23 to 24, 27 to 28, 37 to 43, 45, 47, 49, 55, 61, 67, 81, 83, 85, 87, 89, 95 to 99, 106 to 110, 118 to 120, 122, 124, 126, 132, 138, 144, 158, 160, 162, 164, 166, 168, 170, 172, 178, 184, 190, 204, 206, 208, 210, 212, 214, 216, 218, 220), table 5 (compounds 5-8 to 14, 22 to 28, 37 to 43, 45, 47, 49, 55, 61, 67, 81, 83, 85, 87, 89, 95 to 99, 105 to 109, 111, 113, 115, 121, 127, 133, 147, 149, 151, 153, 155, 157, 159, 161, 167, 173, 179, 193, 195, 201, 203, 205, 207, 209), table 6 (compounds 6-6 to 10, 14 to 16, 18, 20, 22, 28, 34, 40, 54, 56, 58, 60, 62), experimental examples (Family: none)	1-6

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D413/04(2006.01)i, A01N43/707(2006.01)i, A01N43/76(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, A61K31/4439(2006.01)i, A61K31/444(2006.01)i, A61P33/14(2006.01)i, C07D471/04(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 (IPC))

Int.Cl. C07D413/04, A01N43/707, A01N43/76, A01N43/90, A01N47/02, A01P7/04, A61K31/4439, A61K31/444, A61P33/14, C07D471/04

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	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2018年
日本国実用新案登録公報	1996-2018年
日本国登録実用新案公報	1994-2018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)

CAplus/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
A	WO 2016/121997 A1 (日本農薬株式会社) 2016.08.04, & US 2018/0002347 A1 & AU 2016213001 A & KR 10-2017-0095909 A & CN 107207460 A & TW 201632505 A & AR 103547 A	1-6
A	WO 2015/071180 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2015.05.21, & JP 2017-502927 A & US 2016/0272638 A1 & EP 2873668 A1 & EP 3068780 A1 & CN 105722839 A & ES 2638504 T	1-6

☑ 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

19.03.2018

国際調査報告の発送日

03.04.2018

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)
郵便番号 100-8915
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)

伊佐地 公美

4 P

5809

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

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
A	WO 2016/116338 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2016. 07. 28, & EP 3247712 A1 & CN 107207501 A	1-6
A	WO 2016/104746 A1 (日本農薬株式会社) 2016. 06. 30, (ファミリーなし)	1-6
A	WO 2016/144351 A1 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2016. 09. 15, (ファミリーなし)	1-6
P, X	WO 2017/065183 A1 (日本農薬株式会社) 2017. 04. 20, 特許請求の範囲、第2表の化合物 2-13~24、37~42、49~54、61~66、79~90、103~108、115~120、127~132、145~156、169~174、181~186、194~198、205~210、217~222、229~234、239~240、243、245、247、253、259、265、279、281、283、285、287、第4表の化合物 4-6~10、16~20、23~24、27~28、37~43、45、47、49、55、61、67、81、83、85、87、89、95~99、106~110、118~120、122、124、126、132、138、144、158、160、162、164、166、168、170、172、178、184、190、204、206、208、210、212、214、216、218、220、第5表の化合物 5-8~14、22~28、37~43、45、47、49、55、61、67、81、83、85、87、89、95~99、105~109、111、113、115、121、127、133、147、149、151、153、155、157、159、161、167、173、179、193、195、201、203、205、207、209、第6表の化合物 6-6~10、14~16、18、20、22、28、34、40、54、56、58、60、62、試験例 (ファミリーなし)	1-6