

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2017-222576

(P2017-222576A)

(43) 公開日 平成29年12月21日(2017.12.21)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>C07D 213/26 (2006.01)</b>	C07D 213/26 CSP	4C055
<b>A01N 43/40 (2006.01)</b>	A01N 43/40 I01A	4H011
<b>A01P 5/00 (2006.01)</b>	A01P 5/00	
<b>A01P 7/02 (2006.01)</b>	A01P 7/02	
<b>A01P 7/04 (2006.01)</b>	A01P 7/04	

審査請求 未請求 請求項の数 10 O L (全 36 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2014-222136 (P2014-222136)  
 (22) 出願日 平成26年10月31日 (2014.10.31)

(71) 出願人 000000354  
 石原産業株式会社  
 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号  
 (72) 発明者 吉田 幸太郎  
 滋賀県草津市西洪川二丁目3番1号 石原  
 産業株式会社 中央研究所内

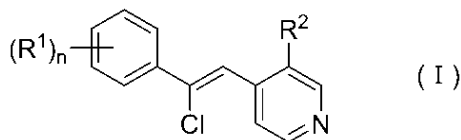
Fターム(参考) 4C055 AA01 BA01 CA02 CA05 CA06  
 CA39 CA42 CA47 CB01 CB02  
 CB15 DA06 DA13 DA16 DA18  
 DB01 DB02 DB04 DB07 FA08  
 4H011 AC01 AC04 BA01 BB09 BC01  
 BC03 BC06 BC07 BC18 BC19  
 BC20 DA02 DA15 DA16 DC05  
 DD03 DH02

(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 有害生物に対して高活性な化合物の提供。

【解決手段】 式(I)で表される4-(フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩。該化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。



〔R<sup>1</sup>はハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基等；R<sup>2</sup>はハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基等；nは1～4の整数；nが2以上のとき、複数のR<sup>1</sup>は各々独立に〕

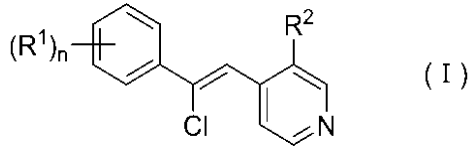
【選択図】 なし

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 (I) :

## 【化 1】



〔式中、R<sup>1</sup> は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニル基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルオキシ基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルチオ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルチオ基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルアミノ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルアミノ基、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノ基、ジ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルアミノ基、ジ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルアミノ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルスルフィニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルスルフィニル基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキルスルフィニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキルスルフィニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルスルホニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルスルホニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルオキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノ基であり；

R<sup>2</sup> はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルオキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルチオ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルアミノ基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルアミノ基、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノ基、ジ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルアミノ基、ジ(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルアミノ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルスルフィニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルスルフィニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルスルホニル基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニルスルホニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルオキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、ホルミル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルオキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ基又はジ(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ基であり；n は 1 ~ 4 の整数であり；n が 2 以上のとき、複数の R<sup>1</sup> は同一又は異なっているもよい〕で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩。

## 【請求項 2】

R<sup>1</sup> がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基であり、R<sup>2</sup> がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基である請求項 1 に記載の 4 - (フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩。

## 【請求項 3】

R<sup>1</sup> がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基である請求項 2 に記載の 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩。

## 【請求項 4】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。

## 【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤。

## 【請求項 6】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤。

## 【請求項 7】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤又は殺ダニ剤。

## 【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺動物寄生生物剤。

10

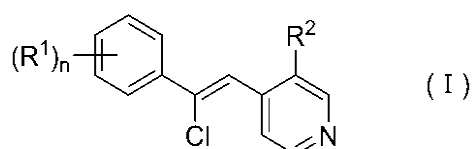
## 【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

## 【請求項 10】

式 (I) :

## 【化 2】



〔式中、 $R^1$  は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニル基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキル基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルオキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルオキシ基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルチオ基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルフィニル基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルホニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルオキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルアミノ基又は $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニル $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基であり；

20

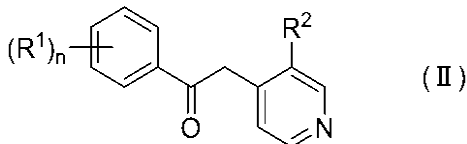
30

$R^2$  はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニル基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルコキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルオキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルオキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルホニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルオキシ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ $(C_1-C_6)$ アルキル基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ $(C_1-C_6)$ アルキル基、ホルミル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルオキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルアミノ基又はジ $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルアミノ基であり； $n$  は 1 ~ 4 の整数であり； $n$  が 2 以上のとき、複数の  $R^1$  は同一又は異なってもよい〕で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩の製造方法であって、式 (II) :

40

50

## 【化3】



〔式中、 $R^1$  及び  $R^2$  は前述の定義通りである〕で表される化合物を塩基の存在下で、塩素化剤と反応させることを特徴とする前記 4 - (フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩の製造方法。

## 【発明の詳細な説明】

## 【技術分野】

10

## 【0001】

本発明は、新規な 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

## 【背景技術】

## 【0002】

特許文献 1 には、3,5-ジクロロ-4-[(1E)-2-[4-(1,1-ジメチルエチニル)フェニル]-1,2-ジフルオロエテニル]ピリジン、3,5-ジクロロ-4-[(1E)-2-[4-(1,1-ジメチルエチニル)フェニル]-2-フルオロエテニル]ピリジン等の化合物が、農園芸用殺虫剤として有用であることが記載されているが、クロロエテニル部分を有する化合物は記載されていない。特許文献 2 には、殺虫、殺ダニ作用を有するフェニルエテニルピリジン誘導体及びその塩が記載されているが、本発明化合物は記載されていない。非特許文献 1 には、(Z)-4-(2-クロロ-2-フェニルエテニル)ピリジンが記載されているが、このものは農薬用途の化合物ではない。

20

## 【先行技術文献】

## 【特許文献】

## 【0003】

【特許文献 1】国際公開第 2013/158422 号

【特許文献 2】特開平 1 - 316359 号

【非特許文献 1】J. Agri. Food Chem. 1996, 44, 1337-1342

## 【発明の概要】

30

## 【発明が解決しようとする課題】

## 【0004】

長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分である、害虫等が抵抗性を獲得しその使用が制限されるなど、種々の課題を有するものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤の開発が望まれている。本発明の目的は、有害生物に対して高活性な化合物を提供すること、該化合物を用いた有害生物防除剤を提供すること、該化合物を施用して有害生物を防除する方法を提供することである。

## 【課題を解決するための手段】

## 【0005】

本発明者らは、より優れた有害生物防除剤を見出すべく、ピリジン誘導体につき種々検討した。その結果、新規な 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物が、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有することを見出し、本発明を完成した。

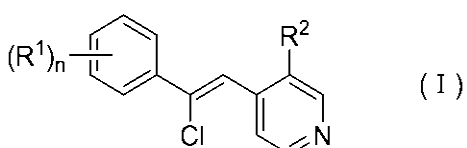
40

## 【0006】

即ち本発明は、式 (I) :

## 【0007】

## 【化1】



50

## 【 0 0 0 8 】

〔式中、 $R^1$  は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニル基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキル基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルオキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルオキシ基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルチオ基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルフィニル基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルホニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルオキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルアミノ基又は $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニル $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基であり；

10

$R^2$  はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニル基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ ハロアルコキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルオキシ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルオキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルチオ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルケニルアミノ基、ジ $(C_2-C_6)$ アルキニルアミノ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルフィニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニルスルホニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニルスルホニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルオキシ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ $(C_1-C_6)$ アルキル基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノ $(C_1-C_6)$ アルキル基、ホルミル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、ジ $(C_1-C_6)$ アルキルアミノカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルオキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルアミノ基又はジ $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルアミノ基であり； $n$  は 1 ~ 4 の整数であり； $n$  が 2 以上のとき、複数の  $R^1$  は同一又は異なってもよい〕で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩、該化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤、該化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法、並びに、該化合物又はその塩の製造方法に関する。

20

30

## 【 発明の効果 】

## 【 0 0 0 9 】

前記式 ( I ) の化合物又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤は、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有する。

## 【 発明を実施するための形態 】

## 【 0 0 1 0 】

前記式 ( I ) 中のハロゲン原子又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲン原子の数は 1 又は 2 以上であってよく、2 以上の場合、各ハロゲン原子は同一でも相異なってもよい。また、ハロゲン原子の置換位置は何れの位置でもよい。

40

## 【 0 0 1 1 】

前記式 ( I ) 中のアルキル又はアルキル部分としては、例えば、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ノルマルブチル、イソブチル、セカンダリーブチル、ターシャリーブチル、ノルマルペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ノルマルヘキシル、ネオヘキシルのような直鎖又は分岐鎖状の  $C_1 - C_6$  の基が挙げられる。

本明細書中、「ターシャリー」を「tert-」と表記する場合がある。

50

## 【 0 0 1 2 】

前記式 ( I ) 中のアルケニル又はアルケニル部分としては、例えば、ビニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、イソプロピニル、2 - メチル - 1 - プロピニル、1 - メチル - 1 - プロピニル、2 - メチル - 2 - プロピニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、1 - ブテニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1 - ペンテニル、2 - ペンテニル、2 - メチル - 2 - ブテニル、1 - ヘキセニル、2, 3 - ジメチル - 2 - ブテニルのような直鎖又は分岐鎖状の  $C_2 - C_6$  の基が挙げられる。

## 【 0 0 1 3 】

前記式 ( I ) 中のアルキニル又はアルキニル部分としては、例えば、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、1 - ブチニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、2 - メチル - 3 - ブチニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブチニル、1 - ヘキシニル、2 - ヘキシニル、3 - ヘキシニル、4 - ヘキシニル、5 - ヘキシニルのような直鎖又は分岐鎖状の  $C_2 - C_6$  の基が挙げられる。

10

## 【 0 0 1 4 】

前記式 ( I ) 中のシクロアルキル又はシクロアルキル部分としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルのような  $C_3 - C_6$  の基が挙げられる。

## 【 0 0 1 5 】

前記式 ( I ) の化合物の塩としては、当該技術分野で許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば、ジメチルアンモニウム塩、トリエチルアンモニウム塩のようなアンモニウム塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、シュウ酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

20

## 【 0 0 1 6 】

前記式 ( I ) の化合物又はその塩には、光学異性体のような異性体が存在する可能性があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。本願明細書においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、前記一般式 ( I ) とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内であることは明らかである。

30

## 【 0 0 1 7 】

前記式 ( I ) の化合物又はその塩 ( 以下、本発明化合物と略す ) は、以下の製造方法、並びに通常の方法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

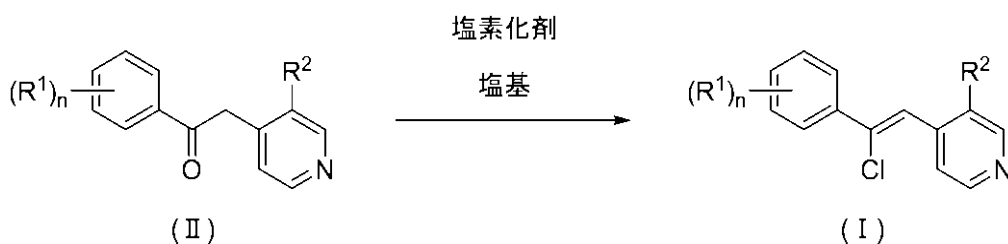
## 【 0 0 1 8 】

## 製法 [ 1 ]

本発明化合物は、式 ( I I ) の化合物と塩素化剤を、塩基の存在下で、反応させることにより製造できる。

## 【 0 0 1 9 】

## 【 化 2 】



40

## 【 0 0 2 0 】

[ 式中、n、R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は前述の定義通りである ]

50

## 【0021】

本反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジメチルアニリン、ジエチルアニリンのようなN,N-ジ置換アニリン；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は通常0 ~ 180、望ましくは20 ~ 120 の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 24時間で行うことができる。

## 【0022】

塩素化剤としては、塩化チオニル、5塩化リン、オキシ塩化リン、3塩化リン等が挙げられる。塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのようなアルカリ金属の水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのようなアルカリ金属の炭酸塩；水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化リチウムなどのようなアルカリ金属の水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドなどのようなアルコキシド類；トリエチルアミン、ピリジン、ジイソプロピルエチルアミンなどのような第3級アミン類などが挙げられるが、第3級アミン類を使用するのが望ましい。

## 【0023】

製法〔2〕

前記一般式(I)中、 $R^2$ が $S(O)_m R^3$ である式(I-b)の化合物は、式(I-a)の化合物と酸化剤とを反応させることにより製造することができる。

## 【0024】

【化3】



## 【0025】

〔式中、 $m$ は1又は2であり、 $R^3$ は $(C_1-C_6)$ アルキル基を示す。 $n$ 、 $R^1$ は前述の定義通りである〕

酸化剤としては、例えば3-クロロ過安息香酸のようなカルボン酸の過酸化物；過酸化水素水；などが挙げられる。

溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルムのような脂肪族ハロゲン化炭化水素などが挙げられる。

反応温度は、通常約-20 から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 24時間で行うことができる。

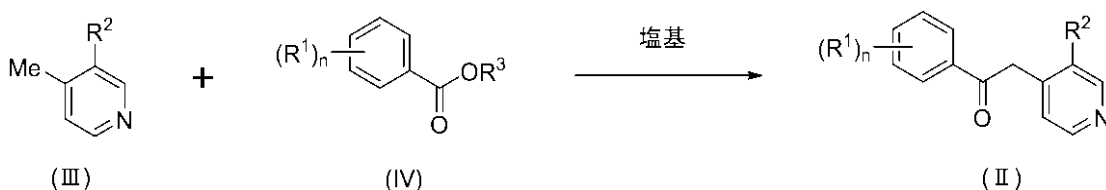
## 【0026】

中間体製法〔1〕

前記した式(II)の化合物は、塩基の存在下、式(III)の化合物と、式(IV)の化合物を反応させることにより製造できる。

## 【0027】

【化4】



## 【0028】

〔式中、Meはメチルであり、

$n$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は前述の定義通り

である〕

10

20

30

40

50

## 【0029】

本反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサンのようなエーテル類などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は、通常約 - 20 から使用する溶媒の沸点の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

## 【0030】

塩基としては、例えばリチウムビス(トリメチルシリル)アミド、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、リチウムジ(イソプロピル)アミドのようなアルカリ金属アミド；などが挙げられる。

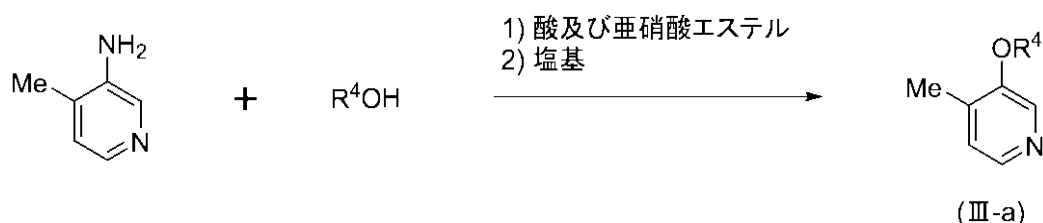
## 【0031】

中間体製法〔2〕

前記一般式(III)中、 $R^2$ が $OR^4$ である式(III-a)の化合物は、3-アミノ-4-メチルピリジンを、 $R^4OH$ 中、酸の存在下で、亜硝酸エステルと反応させた後、塩基を加えることにより製造できる。

## 【0032】

## 【化5】



## 【0033】

〔式中、Meはメチルであり、 $R^4$ は $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_2-C_6)$ アルケニル基、 $(C_2-C_6)$ アルキニル基、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキル基又は $(C_1-C_6)$ ハロアルキル基を示す。〕

## 【0034】

本反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、アセトニトリル、ジオキサンのような非プロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。反応温度は、通常約室温から反応混合物が還流する温度の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分～48時間で行うことができる。

## 【0035】

酸としては、塩酸、硫酸などのような無機酸；メタンスルホン酸などのような有機酸などが挙げられる。亜硝酸エステルとしては、亜硝酸イソプロピル、亜硝酸ターシャリーブチルなどが挙げられる。塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのようなアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドのようなアルコキシド類などが挙げられる。

## 【0036】

中間体製法〔3〕

前記一般式(III)中、 $R^2$ が $SR^4$ である式(III-b)の化合物は、3-アミノ-4-メチルピリジンを、無機亜硝酸塩又は亜硝酸エステルと反応させてジアゾニウム化合物とした後、 $R^4SH$ 又は $(R^4S)_2$ を反応させるザンドマイヤー(Sandmeyer)反応により、製造することができる。

## 【0037】

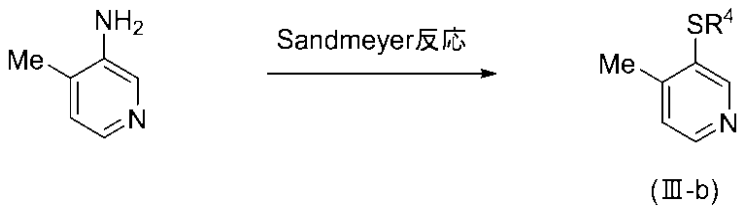
10

20

30

40

## 【化6】



## 【0038】

〔式中、Meはメチルであり、R<sup>4</sup>は前述のとおりである。〕

無機亜硝酸塩としては、例えば亜硝酸ナトリウム、亜硝酸カリウムなどが挙げられる。

10

亜硝酸エステルとしては、例えば亜硝酸ターシャリーブチル、亜硝酸イソアミルなどが挙げられる。

該反応は、必要に応じて銅触媒の存在下で行うことができる。銅触媒としては、酸化銅(I)、硫酸銅(II)五水和物などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて酸の存在下で行うことができる。酸としては、塩酸、硫酸のような無機酸；酢酸、メタンスルホン酸のような有機酸；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；などが挙げられる。

20

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルムのような脂肪族ハロゲン化炭化水素類；トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。

反応温度は通常 -20 ~ 200 の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分~24時間で行うことができる。

## 【0039】

中間体製法〔4〕

前記一般式(III)中、R<sup>2</sup>がXである式(III-c)の化合物は、3-アミノ-4-メチルピリジンを、無機亜硝酸塩又は亜硝酸エステルと反応させてジアゾニウム塩とした後、ハロゲン化剤を反応させるザンドマイヤー(Sandmeyer)反応により、製造することができる。

30

## 【0040】

## 【化7】



40

## 【0041】

〔式中、Meはメチルであり、Xはハロゲン原子を示す。〕

無機亜硝酸塩及び亜硝酸エステルとしては、前記製法〔3〕と同様のものが挙げられる。

ハロゲン化剤としては、例えば塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン；塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸等のハロゲン化水素酸；塩化銅(I)、臭化銅(I)、ヨウ化銅(I)等のハロゲン化銅(I)；塩化銅(II)、臭化銅(II)等のハロゲン化銅(II)；テトラフルオロホウ酸；などが挙げられる。

該反応は必要に応じて銅触媒の存在下で行うことができる。銅触媒としては、前記した

50

ハロゲン化銅 ( I )、ハロゲン化銅 ( I I )、酸化銅 ( I )、硫酸銅 ( I I ) 五水和物などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて酸の存在下で行うことができる。酸としては、前記に挙げたハロゲン化水素酸、硫酸等の無機酸；酢酸、メタンスルホン酸、p - トルエンスルホン酸等の有機酸；などが挙げられる。

該反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、前記製法〔5〕と同様のものが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

反応温度は通常 - 20 ~ 200 の範囲で行うことができる。反応時間は、通常数分 ~ 24 時間で行うことができる。

#### 【0042】

本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば農園芸分野で問題となる害虫、ダニ、線虫又は土壌害虫の防除剤、即ち農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤として有用である。また、動物寄生生物の防除剤、即ち殺動物寄生生物剤として有用である。

#### 【0043】

本発明化合物は、農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤として有用であるが、具体的には、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ等のようなアブラムシ類；コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリング、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、チャノコカクモンハマキ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、ウンカ類、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、タマナヤガ、カブラヤガ、アリ類等のような農業害虫類；ナメクジ、マイマイ等のような腹足類；イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカ等のような衛生害虫類；バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類等のような貯穀害虫類；イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類等のような衣類、家屋害虫類；等の害虫、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リングハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダニ等のような植物寄生性ダニ類；ケナガコナダニ、コナヒョウダニ、ミナミツメダニ等のような屋内塵性ダニ類；等のダニ、ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシガラレセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウ等のような植物寄生性線虫類；等の線虫、ダンゴムシ、ワラジムシのような等脚類；等の土壌害虫の防除に有効である。本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類等の防除に特に有効である。その中でも、植物寄生性ダニ類、農業害虫類の防除にさらに優れた効果を示すため、殺虫剤又は殺ダニ剤として非常に有用である。また、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤、ネオニコチノイド剤等の薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有効である。さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤を土壌に処理することによって土壌有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に茎葉部の害虫類をも防除することができる。

#### 【0044】

本発明化合物を含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤の別の望ましい態様としては、前記した植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類、腹足類、土壌害虫類等を総合的に防除する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤が挙げられる。

#### 【0045】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、通常、該化合物と各種農業上の補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、顆粒水溶剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微

10

20

30

40

50

量散布剤等の種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト、セリサイト、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉等の固型担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコール等の溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチルルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸塩ホルムアルデヒド縮合物のような陰イオン系の界面活性剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチルルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤；オリーブ油、カボック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィン等の植物油や鉱物油；等が挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤、等通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は0.001：99.999～95：5、望ましくは0.005：99.995～90：10である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油等）を添加して使用することができる。

10

20

30

40

50

#### 【0046】

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

#### 【0047】

本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤の種々の製剤、又はその希釈物の施用は、通常、一般に行なわれている施用方法すなわち、散布（例えば、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用等）、土壌施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）、浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害

昆虫の発生及び生育を阻害することも可能である。また、いわゆる超高濃度少量散布法 (ultra low volume application method) により施用することもできる。この方法においては、活性成分を100%含有することが可能である。

【0048】

また、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤等と混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモンの一種又は二種以上とを混用或は併用した殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壌害虫用組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壌害虫用組成物も含まれる。

10

【0049】

上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤の有効成分化合物 (一般名; 一部申請中を含む、又は日本植物防疫協会試験コード) としては、例えばプロフェノホス (profenofos)、ジクロロボス (dichlorvos)、フェナミホス (fenamiphos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、E P N、ダイアジノン (diazinon)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos methyl)、アセフェート (acephate)、プロチオホス (prothiofos)、ホスチアゼート (fosthiazate)、カズサホス (cadusafos)、ジスルホトン (dislufoton)、イソキサチオン (isoxathion)、イソフェンホス (isofenphos)、エチオン (ethion)、エトリムホス (etrimfos)、キナルホス (quinalphos)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジメトエート (dimethoate)、スルプロホス (sulprofos)、チオメトン (thiometon)、バミドチオン (vamidothion)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリダフェンチオン (pyridaphenthion)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、プロパホス (propaphos)、ホサロン (phosalone)、ホルモチオン (formothion)、馬拉チオン (malathion)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、シアノホス (cyanophos)、トリクロルホン (trichlorfon)、メチダチオン (methidathion)、フェントエート (phenthoate)、E S P、アジンホスメチル (azinhos-methyl)、フェンチオン (fenthion)、ヘプテノホス (heptenophos)、メトキシクロル (methoxychlor)、パラチオン (parathion)、ホスホカルブ (phosphocarb)、デメトン-S-メチル (demeton-S-methyl)、モノクロトホス (monocrotophos)、メタミドホス (methamidophos)、イミシアホス (imicyafos)、パラチオン-メチル (parathion-methyl)、テルブホス (terbufos)、ホスファミドン (phosphamidon)、ホスメット (phosmet)、ホレート (phorate)、ホキシム (phoxim)、トリアゾホス (triazophos) のような有機リン酸エステル系化合物;

20

30

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

40

カルタップ (cartap)、チオシクラム (thiocyclam)、ベンスルタップ (bensultap)、チオスルタップナトリウム (thiosultap-sodium)、チオスルタップジナトリウム (thiosultap-disodium)、モノスルタップ (monosultap)、ビスルタップ (bisultap)、シュウ酸水素チオシクラム (thiocyclam hydrogen oxalate) のようなネライストキシン誘導体;

50

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

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

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

ジフルベンズロン (diflubenzuron)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、トリフルムロン (triflumuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフエヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、ビストリフルロン (bistrifluron)、フルアズロン (fluazuron) のようなベンゾイルウレア系化合物 ;

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

ピリダベン (pyridaben) のようなピリダジノン系化合物 ;

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

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

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

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

スピロジクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロテトラマト (spirotetramat) のような環状ケトエノール系化合物 ;

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

フルフェネリム (flufenerim) のようなピリジナミン系化合物 ;

ジニトロ系化合物、有機硫黄化合物、尿素系化合物、トリアジン系化合物、ヒドラゾン系化合物、また、その他の化合物として、フロメトキン (flometoquin)、ブプロフェジン (buprofezin)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、アミトラズ (amitraz)、クロルジメホルム (chlordimeform)、シラフルオフエン (silaf luofen)、トリアザメイト (triazamate)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、クロルフ

エナピル (chlorfenapyr)、インドキサカルブ (indoxacarb)、アセキノシル (acequinocyl)、エトキサゾール (etoxazole)、シロマジン (cyromazine)、1,3-ジクロロプロペン (1,3-dichloropropene)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、ピフェナゼート (bifenazate)、プロパルギット (propargite)、クロフェンテジン (clofentezine)、メタフルミゾン (metaflumizone)、フルベンジアミド (flubendiamide)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、シクラニリプロール (cyclaniliprole)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazon)、フェナザキン (fenazaquin)、アミドフルメット (amidoflumet)、スルフルアミド (sulfluramid)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、メタルデヒド (metaldehyde)、HGW-86、リアノジン (ryanodine)、ベルブチン (verbutin)、AKD 1022、クロロベンゾエート (chlorobenzoate)、チアゾリルシナノニトリル (thiazolylcinnanonitrile)、スルホキサフロル (sulfoxaflor)、フルエンシルホン (fluensilfone)、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim)、アフィドピロペン (afidopyropen)、フルピラジフロン (flupyradifuron)、テトラニリプロール (tetraniliprole)、3-プロモ-N-(4-クロロ-2-(1-シクロプロピルエチルカルバモイル)-6-メチルフェニル)-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、3-プロモ-N-(2-プロモ-4-クロロ-6-(シクロプロピルメチルカルバモイル)フェニル)-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、3-プロモ-N-(4-クロロ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル)-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、3-プロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-N-(4-シアノ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドのような化合物；等が挙げられる。更に、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*等の*Bacillus thuringiensis*が生成する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原系状菌剤、線虫病原系状菌剤等のような微生物農薬、アベルメクチン (avermectin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin Benzoate)、ミルベメクチン (milbemectin)、ミルベマイシン (milbemycin)、スピノサド (spinosad)、イベルメクチン (ivermectin)、レピメクチン (lepimectin)、DE-175、アバメクチン (abamectin)、エマメクチン (emamectin)、スピネトラム (spinetoram)のような抗生物質及び半合成抗生物質；アザディラクチン (azadirachtin)、ロテノン (rotenone)のような天然物；ディート (deet)のような忌避剤；等と、混用、併用することもできる。

【0050】

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

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

フルアジナム (fluazinam)のようなピリジナミン系化合物；

トリアジメホン (triadimefon)、ピテルタノール (bitertanol)、トリフルミゾール (triflumizole)、エタコナゾール (etaconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、ペンコナゾール (penconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、マイクروباتニル (myclobutanil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ファーコナゾールシス (furconazole cis)、プロクロラズ (prochloraz)、メトコナゾール (metconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、オキスポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、シブコナゾール (sipconazole)、プロチオコナゾール

(prothioconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、フルトリアホル (flutriafol)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、トリシクラゾール (tricyclazole)、プロベナゾール (probenazole)、シメコナゾール (simeconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、イブコナゾール (ipconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole) のようなアゾール系化合物；

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

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

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

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

シモキサニル (cymoxanil) のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシル - M (metalaxyl-M)、メフェノキサム (mefenoxam)、オキサジキシル (oxadixyl)、オフレース (ofurace)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシル - M (benalaxyl-M、別名キララキシル (kiralaxyl、chiralaxyl))、フララキシル (furalaxyl)、シプロフラム (cyprofuram)、カルボキシ (carboxin)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、チフルザミド (thifluzamide)、ボスカリド (boscalid)、ピキサフェン (bixafen)、イソチアニル (isothianil)、チアジニル (tiadinil)、セダキサン (sedaxane) のようなアニリド系化合物；

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

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

ヒメキサゾール (hymexazol) のようなイソキサゾール系化合物；

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

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

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

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

ペンチオピラド (penthioopyrad)、3-(ジフロロメチル)-1-メチル-N-[(1RS,4SR,9RS)-1,2,3,4-テトラヒドロ-9-イソプロピル-1,4-メタノナフタレン-5-イル]ピラゾール-4-カルボキサミドと3-(ジフロロメチル)-1-メチル-N-[(1RS,4SR,9SR)-1,2,3,4-テトラヒドロ-9-イソプロピル-1,4-メタノナフタレン-5-イル]ピラゾール-4-カルボキサミドの混合物 (イソピラザム (isopyrazam))、シルチオフアム (silthiopham)、フェノキサニル (fenoxanil)、フラメトピル (furametpyr) のようなアミド系化合物；

フルオピラム (fluopyram)、ゾキサミド (zoxamide) のようなベンズアミド系化合物；

トリホリン (triforine) のようなピペラジン系化合物；

ピリフェノックス (pyrifenoxy) のようなピリジン系化合物；

フェナリモル (fenarimol) のようなカルピノール系化合物；

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

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

10

20

30

40

50

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

ペンシキュロン (pencycuron) のような尿素系化合物；

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

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

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

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

ファミキサドン (famoxadone) のようなオキサゾリジノン系化合物；

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

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

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

フェナミドン (fenamidone) のようなイミダゾリノン系化合物；

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

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

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

アトラキノン系化合物；

クロトン酸系化合物；

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

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

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

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

その他の化合物として、ピリベンカルブ (pyribencarb)、イソプロチオラン (isoprotiolane)、ピロキノロン (pyroquilon)、ジクロメジン (diclomezine)、キノキシフェン (quinoxifen)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) クロロピクリン (chloropicrin)、ダゾメット (dazomet)、メタムナトリウム塩 (metam sodium)、ニコピフェン (nicobifen)、メトラフェノン (metrafenone)、UBF-307、ジクロシメット (diclocymet)、プロキンアジド (proquinazid)、アミスルブロム (amisulbrom；別名 アミブロードール (amibromdole))、3-(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルベンゾイル)-5-クロロ-2-メトキシ-4-メチルピリジン、4-(2,3,4-トリメトキシ-6-メチルベンゾイル)-2,5-ジクロロ-3-トリフルオロメチルピリジン、ピリオフェノン (pyriofenone)、イソフェタミド (isofetamid) マンジプロパミド (mandipropamid)、フルオピコリド (fluopicolide)、カルプロパミド (carpropamid)、メプチルジノキャップ (meptyldinocap)、N-[(3', 4'-ジクロロ-1,1-ジメチル)フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[(3', 4'-ジクロロ-1,1-ジメチル)フェナシル]-3-メチル-2-チオフエンカルボキサミド、N-[(3', 4'-ジクロロ-1,1-ジメチル)フェナシル]-1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-ピラゾールカルボキサミド、N-[[2'-メチル-4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[[2'-メチル-4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-メチル-2-チオフエンカルボキサミド、

10

20

30

40

50

N-[[2'-メチル-4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-ピラゾールカルボキサミド、N-[[4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[[4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-メチル-2-チオフェンカルボキサミド、N-[[4'-(2-プロピルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-ピラゾールカルボキサミド、N-[[2'-メチル-4'-(2-ペンチルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[[4'-(2-ペンチルオキシ)-1,1-ジメチル]フェナシル]-3-トリフルオロメチル-2-ピリジンカルボキサミド、スピロキサミン (spiroxamine)、S-2188 (fenpyrazamine)、S-2200、ZF-9646、BCF-051、BCM-061、BCM-062等が挙げられる。

10

## 【0051】

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

## 【0052】

殺動物寄生生物剤としては、具体的には、宿主動物の体表(背、腋下、下腹部、内股部等)に寄生する有害な外部寄生虫や、宿主動物の体内(胃、腸管、肺、心臓、肝臓、血管、皮下、リンパ組織など)に寄生する有害な内部寄生虫の防除に有効であるが、中でも、外部寄生虫の防除に有効である。

## 【0053】

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

20

## 【0054】

動物寄生性のダニとしては、例えばオウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campiculata*)、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 jais*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、シュルツェマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanensis*) のようなマダニ類；ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)；トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、ミナミトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*) のようなトリサシダニ類；ナンヨウツツガムシ (*Eutrombicula 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*)、ミヤガワタマツツガムシ (*Helenicula miyagawai*) のようなツツガムシ類；イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*)、ウサギツメダニ (*Cheyletiella parasitivorax*)、ネコツメダニ (*Cheyletiella blakei*) のようなツメダニ類；ウサギキュウセンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウシシヨクヒダニ (*Chorioptes bovis*)、イヌミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、ネコシヨウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) のようなヒゼンダニ類；イヌニキビダニ (*Demodex canis*) のようなニキビダニ類等が挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する殺動物寄生生物剤は、マダニ類等の防除に特に有効である。

30

40

## 【0055】

動物寄生性のノミとしては、例えば、ノミ目 (*Siphonaptera*) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (*Pulicidae*)、ナガノミ科 (*Ceratophyllus*) 等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 (*Cten*

50

ocephalides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、ヒトノミ (Pulex irritans)、ニワトリフトノミ (Echidnophaga gallinacea)、ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis)、メクラネズミノミ (Leptopsylla segnis)、ヨーロッパネズミノミ (Nosopsyllus fasciatus)、ヤマトネズミノミ (Monopsyllus anisus)；等が挙げられる。中でも、本発明化合物を含有する殺動物寄生生物剤は、ヒトノミ科に属するノミ類、特にイヌノミ、ネコノミ等の防除に有効である。

【0056】

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

【0057】

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

【0058】

本発明化合物を殺動物寄生生物剤として使用する際、そのまま使用してもよく、また、適当な補助剤と共に粉剤、粒剤、錠剤、散剤、カプセル剤、液状剤、乳剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤等の種々の形態に製剤して使用することもできる。尚、前記製剤形態以外にも、本発明の目的に適合するかぎり、通常当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、前記した農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤の製剤用補助剤として例示した陰イオン系の界面活性剤や非イオン系の界面活性剤；セチルトリメチルアンモニウムブロミドのような陽イオン系の界面活性剤；水、アセトン、アセトニトリル、N-メチルアセトアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、2-ピロリドン、N-メチル-2-ピロリドン、ケロシン、トリアセチン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、液体ポリオキシエチレングリコール、ブチルジグリコール、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールノルマルブチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールノルマルブチルエーテルのような溶剤；ブチルヒドロキシアニソール、ブチルヒドロキシトルエン、アスコルビン酸、メタ亜硫酸水素ナトリウム、プロピル没食子酸塩、チオ硫酸ナトリウムのような酸化防止剤；ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、酢酸ビニルとビニルピロリドンのコポリマーのような被膜形成剤；前記した農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤の製剤用補助剤として例示した植物油や鉱物油；乳糖、蔗糖、ブドウ糖、澱粉、麦粉、コーン粉、大豆油粕、脱脂米糠、炭酸カルシウム、その他市販の飼料原料のような担体；等が挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選択して使用することもでき、更には、前記した農園芸分野で使用される各種補助剤等から適宜選択して使用することもできる。

【0059】

本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は、通常、0.1：99.9～90：10程度

である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油等）を添加して使用することができる。

【0060】

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

10

【0061】

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

【0062】

本発明には、前記したような投与方法又は投与量による動物寄生生物の防除方法、特に外部寄生虫又は内部寄生虫の防除方法も含まれる。

【0063】

また、本発明においては、前述のようにして有害な動物寄生生物を防除することにより、それらに起因する宿主動物の各種疾患を予防又は治療できる場合がある。このように、本発明には、本発明化合物を有効成分として含有する寄生虫起因動物疾患の予防剤又は治療剤並びに、寄生虫起因動物疾患を予防又は治療する方法も含まれる。

20

【0064】

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

30

【0065】

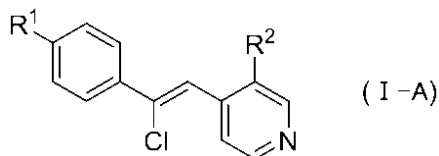
次に、本発明の 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩の望ましい実施形態のいくつかを例示するが、これらは本発明を限定するものではない。

(1) 前記式 (I) の 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩。

(2) 式 (I-A) :

【0066】

【化 8】



40

【0067】

〔式中、R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は前述の通りである〕で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩で表される 4 - (フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩。

【0068】

(3) R<sup>1</sup> がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基であり、R<sup>2</sup> がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基

50

、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基である(1)又は(2)に記載の4-(フェニルエテニル)ピリジン誘導体又はその塩で表される4-(フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩。

(4) R<sup>1</sup>がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基である(3)に記載の4-(フェニルエテニル)ピリジン系化合物又はその塩。

【0069】

一方、本発明の4-(フェニルエテニル)ピリジン系化合物の製造用中間体である式(I)の化合物の望ましい実施形態のいくつかを例示するが、これらは本発明を限定するものではない。

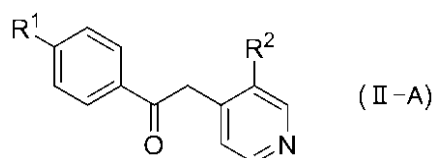
(1) 前記式(II)の化合物。

10

(2) 式(II-A)：

【0070】

【化9】



【0071】

〔式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は前述の通りである〕で表される化合物。

20

【0072】

(3) R<sup>1</sup>がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ基であり、R<sup>2</sup>がハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基である(1)又は(2)の化合物。

【実施例】

【0073】

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

【0074】

30

合成例1

(Z)-4-(2-(4-(tert-ブチル)フェニル)-2-クロロビニル)-3-ヨードピリジン(化合物No. I-41)の合成

【0075】

(1) 3-ヨード-4-メチルピリジンの合成

3-アミノ-4-メチルピリジン(15.0g、138.7mmol)のアセトニトリル(550mL)溶液にp-トルエンスルホン酸一水和物(79.2g、416.1mmol)を加え、10-15℃で亜硝酸ナトリウム(19.1g、277.4mmol)及びヨウ化カリウム(69.1g、277.4mmol)を水(110mL)に溶かした溶液を滴下した後、室温で1時間攪拌させた。反応溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で中和した後、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液(200mL)を加えた。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液：n-ヘプタン/酢酸エチル=4/1・容量比)で精製し、3-ヨード-4-メチルピリジン(23.3g、収率77%)を得た。

40

【0076】

(2) 1-(4-(tert-ブチル)フェニル)-2-(3-ヨードピリジン-4-イル)エタン-1-オン(化合物No. II-41)の合成

3-ヨード-4-メチルピリジン(14.0g、63.9mmol)、4-tert-ブチル安息香酸メチル(12.3g、63.9mmol)のテトラヒドロフラン(320m

50

L) 溶液に、室温にてリチウムビス(トリメチルシリル)アミド (約 26% テトラヒドロフラン溶液, 約 1.3 mol/L) (100 mL、128 mmol) を加え、室温で 3 時間攪拌した。1 規定塩酸にて反応溶液を中和後、反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた結晶をヘプタンで洗浄し 1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - ヨードピリジン - 4 - イル) エタン - 1 - オン (21.0 g、収率 87%) を得た。

【0077】

(3) 目的物の合成

1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - ヨードピリジン - 4 - イル) エタン - 1 - オン (5.0 g、13.2 mmol) のトルエン (26 mL) 溶液中にオキシ塩化リン (2.5 mL、26.4 mmol)、ジイソプロピルエチルアミン (4.5 mL、26.4 mmol) を順に加え、90 で 1 時間攪拌した。室温まで放冷した後、反応混合物を水 (260 mL) に投入し、1 規定水酸化ナトリウム水溶液にて中和した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘプタン/酢酸エチル = 2/1・容量比) で精製し、目的物 (3.5 g、収率 67%) を得た。

10

【0078】

合成例 2

20

(Z) - 4 - (2 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - クロロビニル) - 3 - エトキシピリジン (化合物 No. I - 64) の合成

【0079】

(1) 3 - エトキシ - 4 - メチルピリジンの合成

3 - アミノ - 4 - メチルピリジン (25.0 g、231.2 mmol) のエタノール (250 mL) 溶液にメタンスルホン酸 (24.4 g、254.3 mmol) を加え、氷冷した。氷冷下、亜硝酸 tert-ブチル (31.8 g、277.4 mmol) を加えた後、室温で 30 分、80 で 1 時間攪拌した。反応溶液を氷冷した後、水 (100 mL)、ナトリウムエトキシド (52.4 g、693.5 mmol) を順に加え、室温にて 3 時間攪拌した。エタノールを減圧下留去し、残渣を水 (250 mL) に投入した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘプタン/酢酸エチル = 1/1・容量比) で精製し、3 - エトキシ - 4 - メチルピリジン (16.0 g、収率 50%) を得た。

30

【0080】

(2) 1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - エトキシピリジン - 4 - イル) エタン - 1 - オン (化合物 No. II - 64) の合成

3 - エトキシ - 4 - メチルピリジン (1.0 g、7.3 mmol)、4 - tert-ブチル安息香酸メチル (1.8 g、9.5 mmol) のテトラヒドロフラン (25 mL) 溶液に、室温にてリチウムビス(トリメチルシリル)アミド (約 26% テトラヒドロフラン溶液, 約 1.3 mol/L) (17 mL、21.9 mmol) を加え、40 で 2 時間攪拌した。1 規定塩酸にて反応溶液を中和後、反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘプタン/酢酸エチル = 2/1・容量比) で精製し、1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - エトキシピリジン - 4 - イル) エタン - 1 - オン (1.25 g、収率 58%) を得た。

40

【0081】

(3) 目的物の合成

50

1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - エトキシピリジン - 4 - イル)エタン - 1 - オン (35.0 g、117.7 mmol) のトルエン (240 mL) 溶液中にオキシ塩化リン (21.9 mL、235.4 mmol)、ジイソプロピルエチルアミン (40.2 mL、235.4 mmol) を順に加え、90 で1時間攪拌した。室温まで放冷した後、反応混合物を水 (1200 mL) に投入し、10 規定水酸化ナトリウム水溶液にて中和した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘプタン/酢酸エチル = 1/1・容量比) で精製し、目的物 (26.5 g、収率71%) を得た。

10

## 【0082】

## 合成例3

(Z) - 4 - (2 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - クロロビニル) - 3 - (エチルチオ)ピリジン (化合物 No. I - 84) の合成

## 【0083】

(1) 3 - (エチルチオ) - 4 - メチルピリジンの合成

3 - アミノ - 4 - メチルピリジン (5.0 g、46.2 mmol) のアセトニトリル (50 mL) 溶液に、1, 2 - ジエチルスルファン (11.3 g、92.4 mmol)、亜硝酸 tert-ブチル (7.2 g、69.3 mmol) を加えた後、加熱還流しながら16時間攪拌した。室温まで放冷した後、反応混合物を水に投入し、酢酸エチルで抽出した。発生した不溶性の沈殿物をセライトでろ過した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘプタン/酢酸エチル = 7/3・容量比) で精製し、3 - (エチルチオ) - 4 - メチルピリジン (2.6 g、収率36%) を得た。

20

## 【0084】

(2) 1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - (エチルチオ)ピリジン - 4 - イル)エタン - 1 - オン (化合物 No. II - 84) の合成

3 - (エチルチオ) - 4 - メチルピリジン (1.0 g、6.5 mmol)、4 - tert-ブチル安息香酸メチル (1.3 g、6.9 mmol) のテトラヒドロフラン (10 mL) 溶液に、室温にてリチウムビス(トリメチルシリル)アミド (約26%テトラヒドロフラン溶液、約1.3 mol/L) (15 mL、19.5 mmol) を加え、50 で3時間攪拌した。室温まで放冷した後、反応混合物を水に投入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘプタン/酢酸エチル = 3/2・容量比) で精製し、1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - (エチルチオ)ピリジン - 4 - イル)エタン - 1 - オン (1.9 g、収率92%) を得た。

30

## 【0085】

(3) 目的物の合成

1 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - (3 - (エチルチオ)ピリジン - 4 - イル)エタン - 1 - オン (1.0 g、3.2 mmol) のトルエン (10 mL) 溶液中にオキシ塩化リン (0.98 g、6.4 mmol)、ジイソプロピルエチルアミン (0.82 g、6.4 mmol) を順に加え、90 で1時間攪拌した。水を加えた後、氷冷し、1 規定水酸化ナトリウム水溶液にて中和した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: n-ヘプタン/酢酸エチル = 4/1・容量比) で精製し、(Z) - 4 - (2 - (4 - (tert-ブチル)フェニル) - 2 - クロロビニル) - 3 - (エチルチオ)ピリジン (0.91 g、収率85%) を得た。

40

50

## 【 0 0 8 6 】

## 合成例 4

( Z ) - 4 - ( 2 - ( 4 - ( t e r t - ブチル ) フェニル ) - 2 - クロロビニル ) - 3 - ( エチルスルフィニル ) ピリジン ( 化合物 No . 1 - 9 4 ) 及び ( Z ) - 4 - ( 2 - ( 4 - ( t e r t - ブチル ) フェニル ) - 2 - クロロビニル ) - 3 - ( エチルスルホニル ) ピリジン ( 化合物 No . 1 - 1 0 4 ) の合成

## 【 0 0 8 7 】

( Z ) - 4 - ( 2 - ( 4 - ( t e r t - ブチル ) フェニル ) - 2 - クロロビニル ) - 3 - ( エチルチオ ) ピリジン ( 0 . 6 8 g 、 2 . 1 m m o l ) のクロロホルム ( 1 0 m L ) 溶液に、3 - クロロ過安息香酸 ( 0 . 5 3 g 、 3 . 1 m m o l ) を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物に炭酸水素ナトリウム水溶液を加えた後、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加え乾燥した。無水硫酸ナトリウムをろ過で取り除いた後、溶媒を減圧下留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( 溶離液 : n - ヘプタン / 酢酸エチル = 7 / 3 及び 1 / 1 ・ 容量比 ) で精製し、化合物 No . 1 - 9 4 ( 0 . 1 5 g 、 収率 2 1 % ) 及び化合物 No . 1 - 1 0 4 ( 0 . 2 3 g 、 収率 3 0 % ) を得た。

10

## 【 0 0 8 8 】

次に、本発明に係る式 ( I ) の化合物の代表例を第 1 表に挙げる。また、式 ( I ) の化合物の製造用中間体である式 ( I I ) の化合物の代表例を第 2 表に挙げる。これらの化合物は、前記合成例或いは前記した種々の製造方法に基づいて合成することができる。第 1 表及び第 2 表中、物性欄に記載の数値は融点 ( ) を示し、融点が表示されていない化合物についてはそれらの<sup>1</sup>H-NMRスペクトルデータを各々第 3 表及び第 4 表に挙げる。尚、第 1 表 ~ 第 4 表中のNo. は化合物番号を示す。また、表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、n-Prはノルマルプロピル基を、i-Prはイソプロピル基を、i-Buはイソブチル基を、tert-Buはターシャリーブチル基を表す。また、R<sup>1</sup>の欄において、例えば「4 - F」と記載された化合物は、表中の化学構造式に付与した置換位置のみがR<sup>1</sup>で置換されていること、即ち、4位のみがフッ素原子にて置換されていることを表し、「2, 4 - F<sub>2</sub>」と記載された化合物は、2位及び4位がフッ素原子にて置換されていることを表し、他の同様の記載もこれに準じる。

20

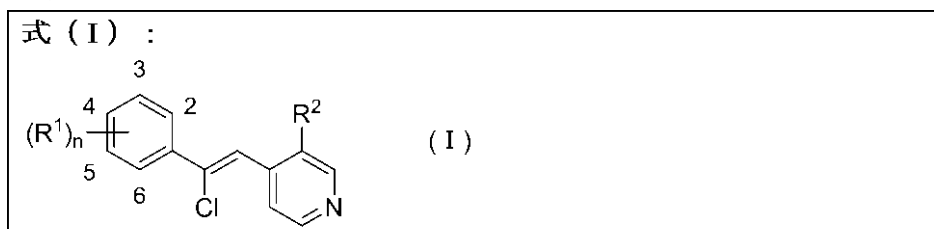
30

40

50

【 0 0 8 9 】

【表 1】



第1表

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物性
I-1	4-F	Cl	1	
I-2	4-Cl	Cl	1	
I-3	4-Br	Cl	1	
I-4	4-I	Cl	1	
I-5	4-i-Pr	Cl	1	
I-6	4-i-Bu	Cl	1	
I-7	4-tert-Bu	Cl	1	
I-8	4-OMe	Cl	1	
I-9	4-OEt	Cl	1	
I-10	4-O-n-Pr	Cl	1	
I-11	4-O-i-Pr	Cl	1	
I-12	4-O-tert-Bu	Cl	1	
I-13	4-O-i-Bu	Cl	1	
I-14	4-CF <sub>3</sub>	Cl	1	
I-15	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	1	
I-16	4-OCF <sub>3</sub>	Cl	1	
I-17	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	1	
I-18	4-F	Br	1	
I-19	4-Cl	Br	1	
I-20	4-Br	Br	1	
I-21	4-I	Br	1	
I-22	4-i-Pr	Br	1	
I-23	4-i-Bu	Br	1	
I-24	4-tert-Bu	Br	1	93.2
I-25	4-OMe	Br	1	
I-26	4-OEt	Br	1	
I-27	4-O-n-Pr	Br	1	
I-28	4-O-i-Pr	Br	1	
I-29	4-O-tert-Bu	Br	1	
I-30	4-O-i-Bu	Br	1	

10

20

30

40

【表 2】

第 1 表 続 ぎ				
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物 性
I-31	4-CF <sub>3</sub>	Br	1	
I-32	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Br	1	
I-33	4-OCF <sub>3</sub>	Br	1	
I-34	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	1	
I-35	4-F	I	1	
I-36	4-Cl	I	1	
I-37	4-Br	I	1	103.5
I-38	4-I	I	1	134.5
I-39	4-i-Pr	I	1	
I-40	4-i-Bu	I	1	oil
I-41	4-tert-Bu	I	1	144.4
I-42	4-OMe	I	1	
I-43	4-OEt	I	1	
I-44	4-O-n-Pr	I	1	
I-45	4-O-i-Pr	I	1	
I-46	4-O-tert-Bu	I	1	
I-47	4-O-i-Bu	I	1	
I-48	4-CF <sub>3</sub>	I	1	
I-49	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	1	
I-50	4-OCF <sub>3</sub>	I	1	50.3
I-51	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	1	
I-52	4-i-Pr	OMe	1	
I-53	4-i-Bu	OMe	1	
I-54	4-tert-Bu	OMe	1	
I-55	4-O-i-Pr	OMe	1	
I-56	4-O-tert-Bu	OMe	1	
I-57	4-O-i-Bu	OMe	1	
I-58	4-CF <sub>3</sub>	OMe	1	
I-59	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OMe	1	
I-60	4-OCF <sub>3</sub>	OMe	1	

10

20

30

40

50

【表 3】

第 1 表 続 き				
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物性
I-61	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	1	
I-62	4-i-Pr	OEt	1	
I-63	4-i-Bu	OEt	1	
I-64	4-tert-Bu	OEt	1	67.6
I-65	4-O-i-Pr	OEt	1	
I-66	4-O-tert-Bu	OEt	1	
I-67	4-O-i-Bu	OEt	1	
I-68	4-CF <sub>3</sub>	OEt	1	
I-69	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OEt	1	
I-70	4-OCF <sub>3</sub>	OEt	1	
I-71	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OEt	1	
I-72	4-i-Pr	O-n-Pr	1	
I-73	4-i-Bu	O-n-Pr	1	
I-74	4-tert-Bu	O-n-Pr	1	
I-75	4-O-i-Pr	O-n-Pr	1	
I-76	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	1	
I-77	4-O-i-Bu	O-n-Pr	1	
I-78	4-CF <sub>3</sub>	O-n-Pr	1	
I-79	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O-n-Pr	1	
I-80	4-OCF <sub>3</sub>	O-n-Pr	1	
I-81	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	O-n-Pr	1	
I-82	4-i-Pr	SEt	1	
I-83	4-i-Bu	SEt	1	
I-84	4-tert-Bu	SEt	1	oil
I-85	4-O-i-Pr	SEt	1	
I-86	4-O-tert-Bu	SEt	1	
I-87	4-O-i-Bu	SEt	1	
I-88	4-CF <sub>3</sub>	SEt	1	
I-89	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SEt	1	
I-90	4-OCF <sub>3</sub>	SEt	1	

10

20

30

40

50

【表 4】

第 1 表続き				
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物性
I-91	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SEt	1	
I-92	4-i-Pr	SOEt	1	
I-93	4-i-Bu	SOEt	1	
I-94	4-tert-Bu	SOEt	1	oil
I-95	4-O-i-Pr	SOEt	1	
I-96	4-O-tert-Bu	SOEt	1	
I-97	4-O-i-Bu	SOEt	1	
I-98	4-CF <sub>3</sub>	SOEt	1	
I-99	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SOEt	1	
I-100	4-OCF <sub>3</sub>	SOEt	1	
I-101	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SOEt	1	
I-102	4-i-Pr	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-103	4-i-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-104	4-tert-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	106.6
I-105	4-O-i-Pr	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-106	4-O-tert-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-107	4-O-i-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-108	4-CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-109	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-110	4-OCF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-111	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
I-112	4-i-Pr	Me	1	
I-113	4-i-Bu	Me	1	
I-114	4-tert-Bu	Me	1	69.6
I-115	4-O-i-Pr	Me	1	
I-116	4-O-tert-Bu	Me	1	
I-117	4-O-i-Bu	Me	1	
I-118	4-CF <sub>3</sub>	Me	1	
I-119	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Me	1	
I-120	4-OCF <sub>3</sub>	Me	1	
I-121	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	1	

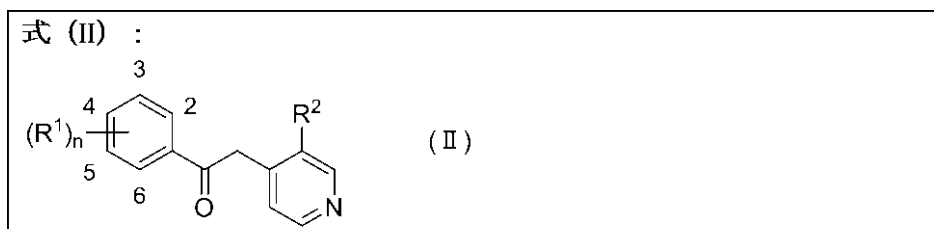
10

20

30

40

【表 5】



第2表

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物性
II-1	4-F	Cl	1	
II-2	4-Cl	Cl	1	
II-3	4-Br	Cl	1	
II-4	4-I	Cl	1	
II-5	4-i-Pr	Cl	1	
II-6	4-i-Bu	Cl	1	
II-7	4-tert-Bu	Cl	1	
II-8	4-OMe	Cl	1	
II-9	4-OEt	Cl	1	
II-10	4-O-n-Pr	Cl	1	
II-11	4-O-i-Pr	Cl	1	
II-12	4-O-tert-Bu	Cl	1	
II-13	4-O-i-Bu	Cl	1	
II-14	4-CF <sub>3</sub>	Cl	1	
II-15	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	1	
II-16	4-OCF <sub>3</sub>	Cl	1	
II-17	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	1	
II-18	4-F	Br	1	
II-19	4-Cl	Br	1	
II-20	4-Br	Br	1	
II-21	4-I	Br	1	
II-22	4-i-Pr	Br	1	
II-23	4-i-Bu	Br	1	
II-24	4-tert-Bu	Br	1	104.2
II-25	4-OMe	Br	1	
II-26	4-OEt	Br	1	
II-27	4-O-n-Pr	Br	1	
II-28	4-O-i-Pr	Br	1	
II-29	4-O-tert-Bu	Br	1	
II-30	4-O-i-Bu	Br	1	

10

20

30

40

50

【 0 0 9 4 】

【 表 6 】

第2表続き				
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物性
II-31	4-CF <sub>3</sub>	Br	1	
II-32	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Br	1	
II-33	4-OCF <sub>3</sub>	Br	1	
II-34	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	1	
II-35	4-F	I	1	109.9
II-36	4-Cl	I	1	90.2
II-37	4-Br	I	1	117.5
II-38	4-I	I	1	136.9
II-39	4-i-Pr	I	1	
II-40	4-i-Bu	I	1	90.5
II-41	4-tert-Bu	I	1	120.4
II-42	4-OMe	I	1	
II-43	4-OEt	I	1	
II-44	4-O-n-Pr	I	1	
II-45	4-O-i-Pr	I	1	
II-46	4-O-tert-Bu	I	1	
II-47	4-O-i-Bu	I	1	
II-48	4-CF <sub>3</sub>	I	1	130.3
II-49	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	1	
II-50	4-OCF <sub>3</sub>	I	1	85.3
II-51	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	1	
II-52	4-i-Pr	OMe	1	
II-53	4-i-Bu	OMe	1	
II-54	4-tert-Bu	OMe	1	
II-55	4-O-i-Pr	OMe	1	
II-56	4-O-tert-Bu	OMe	1	
II-57	4-O-i-Bu	OMe	1	
II-58	4-CF <sub>3</sub>	OMe	1	
II-59	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OMe	1	
II-60	4-OCF <sub>3</sub>	OMe	1	

10

20

30

40

50

【 0 0 9 5 】

【 表 7 】

第2表続き				
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物性
II-61	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	1	
II-62	4-i-Pr	OEt	1	
II-63	4-i-Bu	OEt	1	
II-64	4-tert-Bu	OEt	1	oil
II-65	4-O-i-Pr	OEt	1	
II-66	4-O-tert-Bu	OEt	1	
II-67	4-O-i-Bu	OEt	1	
II-68	4-CF <sub>3</sub>	OEt	1	
II-69	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OEt	1	
II-70	4-OCF <sub>3</sub>	OEt	1	
II-71	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OEt	1	
II-72	4-i-Pr	O-n-Pr	1	
II-73	4-i-Bu	O-n-Pr	1	
II-74	4-tert-Bu	O-n-Pr	1	
II-75	4-O-i-Pr	O-n-Pr	1	
II-76	4-O-tert-Bu	O-n-Pr	1	
II-77	4-O-i-Bu	O-n-Pr	1	
II-78	4-CF <sub>3</sub>	O-n-Pr	1	
II-79	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O-n-Pr	1	
II-80	4-OCF <sub>3</sub>	O-n-Pr	1	
II-81	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	O-n-Pr	1	
II-82	4-i-Pr	SEt	1	
II-83	4-i-Bu	SEt	1	
II-84	4-tert-Bu	SEt	1	60.2
II-85	4-O-i-Pr	SEt	1	
II-86	4-O-tert-Bu	SEt	1	
II-87	4-O-i-Bu	SEt	1	
II-88	4-CF <sub>3</sub>	SEt	1	
II-89	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SEt	1	
II-90	4-OCF <sub>3</sub>	SEt	1	

10

20

30

40

50

【 0 0 9 6 】

【 表 8 】

第2表続き				
No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	物性
II-91	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SEt	1	
II-92	4-i-Pr	SOEt	1	
II-93	4-i-Bu	SOEt	1	
II-94	4-tert-Bu	SOEt	1	
II-95	4-O-i-Pr	SOEt	1	
II-96	4-O-tert-Bu	SOEt	1	
II-97	4-O-i-Bu	SOEt	1	
II-98	4-CF <sub>3</sub>	SOEt	1	
II-99	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SOEt	1	
II-100	4-OCF <sub>3</sub>	SOEt	1	
II-101	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SOEt	1	
II-102	4-i-Pr	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-103	4-i-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-104	4-tert-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-105	4-O-i-Pr	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-106	4-O-tert-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-107	4-O-i-Bu	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-108	4-CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-109	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-110	4-OCF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-111	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Et	1	
II-112	4-i-Pr	Me	1	
II-113	4-i-Bu	Me	1	
II-114	4-tert-Bu	Me	1	113.0
II-115	4-O-i-Pr	Me	1	
II-116	4-O-tert-Bu	Me	1	
II-117	4-O-i-Bu	Me	1	
II-118	4-CF <sub>3</sub>	Me	1	
II-119	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Me	1	
II-120	4-OCF <sub>3</sub>	Me	1	
II-121	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	1	

10

20

30

40

50

【 0 0 9 7 】

【 表 9 】

第3表	
No	$^1\text{H-NMR}$ $\delta$ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒: $\text{CDCl}_3$
I-40	0.92 (6H, d), 1.89 (1H, m), 2.52 (2H, d), 6.97 (1H, s), 7.22 (2H, d), 7.65 (2H, d), 7.72 (1H, d), 8.54 (2H, d), 8.98 (1H, s)
I-84	1.28 (3H, t), 1.34 (9H, s), 2.91 (2H, q), 7.29 (1H, s), 7.45 (2H, d), 7.68 (2H, d), 7.73 (1H, d), 8.48 (1H, d), 8.62 (1H, s)
I-94	1.22 (3H, t), 1.35 (9H, s), 2.79-2.83 (1H, m), 2.93-2.97 (1H, m), 7.16 (1H, s), 7.47 (2H, d), 7.64 (2H, d), 7.68 (1H, d), 8.77 (1H, d), 9.07 (1H, s)

10

【 0 0 9 8 】

【 表 1 0 】

第4表	
No	$^1\text{H-NMR}$ $\delta$ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz)、溶媒: $\text{CDCl}_3$
II-64	1.34 (12H, m), 4.10 (2H, q), 4.25 (2H, s), 7.11 (1H, d), 7.48 (2H, d), 7.95 (2H, d), 8.18 (1H, d), 8.23 (1H, s)

20

【 0 0 9 9 】

試験例 1 トビイロウンカに対する効果試験

本発明化合物の濃度が 200 ppm となるよう調製した薬液に、イネ幼苗を浸漬処理した。薬液が風乾した後に、湿った脱脂綿で根部を包んで試験管に入れた。この中にトビイロウンカ 2 ~ 3 齢幼虫を約 10 頭放ち、管口をガーゼでふたをして 25 の照明付恒温室内に放置した。放虫 5 日後にトビイロウンカの生死を判定し、下記の計算式により死虫率 (%) を求めた。その結果、前記化合物 No. I 41、I 64、II 41 及び II 64 が 90 % 以上の死虫率を示した。

30

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

【 0 1 0 0 】

試験例 2 タバココナジラミに対する効果試験

タバココナジラミ 1 ~ 2 齢幼虫が寄生したポット植えのキュウリ苗に、本発明化合物の濃度が 200 ppm となるよう調製した薬液を、ハンドスプレーを用いて散布処理した。薬液が風乾した後に、25 の照明付恒温室内に放置した。処理 10 日後に老齢幼虫数を調査し、下記計算式により防除価を求めた。その結果、前記化合物 No. I 41、I 64 及び II 41 が 90 以上の防除価を示した。

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

Ta: 処理キュウリ苗における処理後の老齢幼虫数

40

Tb: 処理キュウリ苗における処理前の 1 ~ 2 齢幼虫数

Ca: 無処理キュウリ苗における処理後の老齢幼虫数

Cb: 無処理キュウリ苗における処理前の 1 ~ 2 齢幼虫数

【 0 1 0 1 】

次に製剤例を記載する。

製剤例 1

(1) 本発明化合物 20 重量部

(2) クレー 70 重量部

(3) ホワイトカーボン 5 重量部

(4) ポリカルボン酸ナトリウム 3 重量部

50

(5) アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム 2 重量部

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

【0102】

製剤例 2

(1) 本発明化合物 5 重量部

(2) タルク 60 重量部

(3) 炭酸カルシウム 34.5 重量部

(4) 流動パラフィン 0.5 重量部

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

【0103】

製剤例 3

(1) 本発明化合物 20 重量部

(2) N,N-ジメチルアセトアミド 20 重量部

(3) ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル 10 重量部

(4) ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 2 重量部

(5) キシレン 48 重量部

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

【0104】

製剤例 4

(1) クレー 68 重量部

(2) リグニンスルホン酸ナトリウム 2 重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルアリアルサルフェート 5 重量部

(4) ホワイトカーボン 25 重量部

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

【0105】

製剤例 5

(1) 本発明化合物 50 重量部

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

(3) シリコンオイル 0.2 重量部

(4) 水 47.8 重量部

以上のものを均一に混合、粉砕した原液に更に

(5) ポリカルボン酸ナトリウム 5 重量部

(6) 無水硫酸ナトリウム 42.8 重量部

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

【0106】

製剤例 6

(1) 本発明化合物 5 重量部

(2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル 1 重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル 0.1 重量部

(4) 粒状炭酸カルシウム 93.9 重量部

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

【0107】

製剤例 7

(1) 本発明化合物 2.5 重量部

(2) N,N-ジメチルアセトアミド 2.5 重量部

(3) 大豆油 95.0 重量部

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

【0108】

製剤例 8

10

20

30

40

50

( 1 ) 本発明化合物 10 重量部

( 2 ) ジエチレングリコールモノエチルエーテル 80 重量部

( 3 ) ポリオキシエチレンアルキルエーテル 10 重量部

以上の成分を均一に混合し、液剤とする。

---

フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I	テーマコード (参考)
<i>C 0 7 D 213/61</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 D 213/61	
<i>C 0 7 D 213/65</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 D 213/65	
<i>C 0 7 D 213/70</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 D 213/70	
<i>C 0 7 D 213/71</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 D 213/71	
<i>C 0 7 D 213/50</i>	<i>(2006.01)</i>	C 0 7 D 213/50	