

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6828738号
(P6828738)

(45) 発行日 令和3年2月10日(2021.2.10)

(24) 登録日 令和3年1月25日(2021.1.25)

(51) Int.Cl.		F I		
C 0 7 D 4 0 1 / 0 4	(2006.01)	C O 7 D	4 0 1 / 0 4	C S P
A 6 1 K 3 1 / 5 0 1	(2006.01)	A 6 1 K	3 1 / 5 0 1	
A 6 1 K 3 1 / 4 4 4	(2006.01)	A 6 1 K	3 1 / 4 4 4	
C 0 7 D 4 0 1 / 1 4	(2006.01)	C O 7 D	4 0 1 / 1 4	
A 6 1 K 3 1 / 4 9 7	(2006.01)	A 6 1 K	3 1 / 4 9 7	

請求項の数 18 (全 79 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2018-510543 (P2018-510543)
 (86) (22) 出願日 平成29年3月27日 (2017.3.27)
 (86) 国際出願番号 PCT/JP2017/012289
 (87) 国際公開番号 W02017/175613
 (87) 国際公開日 平成29年10月12日 (2017.10.12)
 審査請求日 令和2年1月7日 (2020.1.7)
 (31) 優先権主張番号 特願2016-76517 (P2016-76517)
 (32) 優先日 平成28年4月6日 (2016.4.6)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 日本国 (JP)

(73) 特許権者 000002093
 住友化学株式会社
 東京都中央区新川二丁目27番1号
 (74) 代理人 100113000
 弁理士 中山 亨
 (74) 代理人 100151909
 弁理士 坂元 徹
 (72) 発明者 折本 浩平
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
 (72) 発明者 田邊 貴将
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内

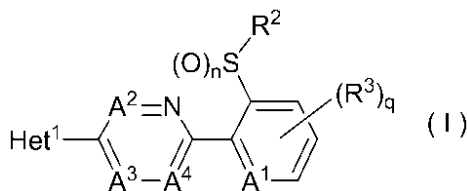
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 複素環化合物

(57) 【特許請求の範囲】

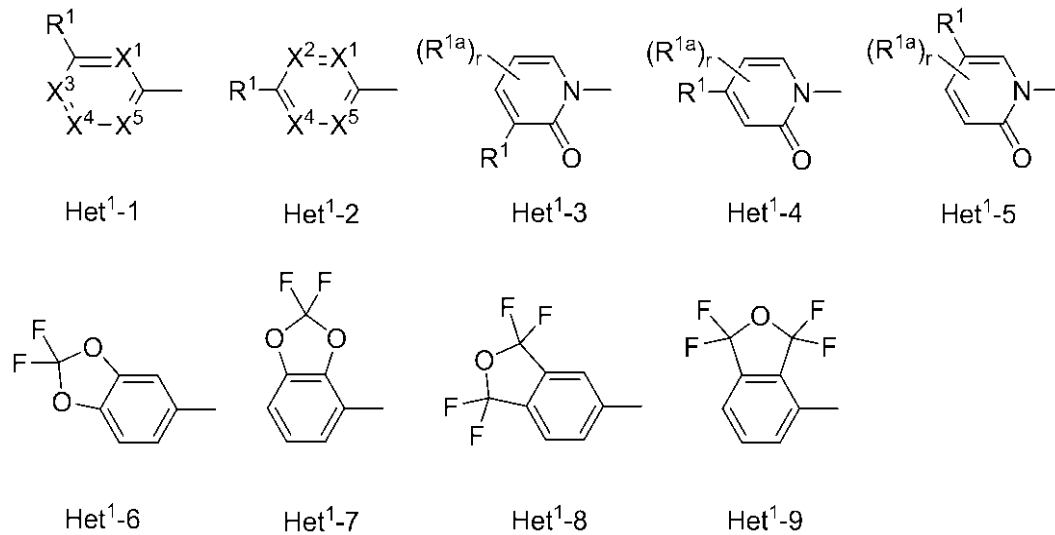
【請求項1】

式(I)



[式中、

Het¹は、Het¹-1、Het¹-2、Het¹-3、Het¹-4、Het¹-5、Het¹-6、Het¹-7、Het¹-8、又はHet¹-9を表し、



10

R¹は、OR⁴、OS(O)₂R⁴、S(O)_mR⁴、NR⁵S(O)₂R⁴、1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子を表し、

R⁴は、1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基を表し、

R⁵は、水素原子、又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基を表し、

20

X¹は、窒素原子、又はCR³⁰を表し、

X²は、窒素原子、又はCR³¹を表し、

X³は、窒素原子、又はCR³²を表し、

X⁴は、窒素原子、又はCR³³を表し、

X⁵は、窒素原子、又はCR³⁴を表し、

R³⁰、R³¹、R³²、R³³、及びR³⁴は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6脂環式炭化水素基、又はハロゲン原子を表し、

R^{1a}は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6脂環式炭化水素基、又はハロゲン原子を表し、

30

rは0、1、2、又は3を表し、rが2又は3を表す場合、複数のR^{1a}は同一でも異なってもよく、

A¹は、窒素原子、又はCR⁹を表し、

A²、A³、及びA⁴の組み合わせは、

A²がCR⁶でありA³がCR⁷でありA⁴がCR⁸である組み合わせか、

A²が窒素原子でありA³がCR⁷でありA⁴がCR⁸である組み合わせか、

A²がCR⁶でありA³が窒素原子でありA⁴がCR⁸である組み合わせか、又は

A²がCR⁶でありA³がCR⁷でありA⁴が窒素原子である組み合わせを表し、

R⁹は、水素原子、又はハロゲン原子を表し、

40

R⁶、R⁷、及びR⁸は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、ニトロ基、OR¹⁸、NR¹⁸R¹⁹、シアノ基、又はハロゲン原子を表し、

nは、0、1、又は2を表し、

R²は、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基を表し、

qは、0、1、2、又は3を表し、

R³は、群Bより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい5もしくは6員芳香族複素環基、ニトロ基、OR¹²、

50

$NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{11a}R^{12a}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}OR^{11}$ 、 $NR^{11}C(O)R^{13}$ 、 $NR^{24}NR^{11}C(O)R^{13}$ 、 $NR^{11}C(O)OR^{14}$ 、 $NR^{24}NR^{11}C(O)OR^{14}$ 、 $NR^{11}C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $NR^{24}NR^{11}C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $N=CHNR^{15}R^{16}$ 、 $N=S(O)_xR^{15}R^{16}$ 、 $S(O)_yR^{15}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 、シアノ基、又はハロゲン原子を表し、 q が2又は3である場合、複数の R^3 は同一でも異なってもよく、

R^{11} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、及び R^{24} は、各々独立して、水素原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基を表し、

R^{12} は、水素原子、 $S(O)_2R^{23}$ 、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は群Fより選ばれる1の置換基を有するC1 - C6アルキル基を表し、

R^{23} は、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基を表し、

R^{11a} 及び R^{12a} はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、群Eより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい3 - 7員非芳香族複素環基{該3 - 7員非芳香族複素環はアジリジン環、アゼチジン環、ピロリジン環、イミダゾリン環、イミダゾリジン環、ピペリジン環、テトラヒドロピリミジン環、ヘキサヒドロピリミジン環、ピペラジン環、アゼパン環、オキサゾリジン環、イソオキサゾリジン環、1,3 - オキサジナン環、モルホリン環、1,4 - オキサゼパン環、チアゾリジン環、イソチアゾリジン環、1,3 - チアジナン環、チオモルホリン環、又は1,4 - チアゼパン環を表す。}を表し、

R^{13} は、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C7シクロアルキル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよい(C3 - C6シクロアルキル)C1 - C3アルキル基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、又は群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい5もしくは6員芳香族複素環基を表し、

R^{14} は、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C7シクロアルキル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよい(C3 - C6シクロアルキル)C1 - C3アルキル基、又はフェニルC1 - C3アルキル基{フェニルC1 - C3アルキル基におけるフェニル部分は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。}を表し、

R^{15} 及び R^{16} は、各々独立して、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基を表し、

m は、0、1、又は2を表し、

x は、0又は1を表し、

y は、0、1、又は2を表す。

群B：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、及びハロゲン原子からなる群。

群C：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルキニルオキシ基、及びハロゲン原子からなる群。

群D：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、ヒドロキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルキニルオキシ基、スルファニル基、1以上のハロゲン原子

10

20

30

40

50

を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキルスルホニル基、アミノ基、NHR²¹、NR²¹R²²、C(O)R²¹、OC(O)R²¹、C(O)OR²¹、シアノ基、ニトロ基、及びハロゲン原子からなる群{R²¹及びR²²は、各々独立して、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキル基を表す}。

群E：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₃ - C₆アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₃ - C₆アルキニルオキシ基、ハロゲン原子、オキソ基、ヒドロキシ基、シアノ基、及びニトロ基からなる群。

10

群F：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルコキシ基、アミノ基、NHR²¹、NR²¹R²²、シアノ基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい5又は6員芳香族複素環基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₃ - C₇シクロアルキル基、及び群Cより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい3 - 7員非芳香族複素環基{該3 - 7員非芳香族複素環はアジリジン環、アゼチジン環、ピロリジン環、イミダゾリン環、イミダゾリジン環、ペペリジン環、テトラヒドロピリミジン環、ヘキサヒドロピリミジン環、ピペラジン環、アゼパン環、オキサゾリジン環、イソオキサゾリジン環、1,3 - オキサジナン環、モルホリン環、1,4 - オキサゼパン環、チアゾリジン環、イソチアゾリジン環、1,3 - チアジナン環、チオモルホリン環、又は1,4 - チアゼパン環を表す。}からなる群。]で示される化合物、又はそのNオキシド化合物。

20

【請求項2】

A²、A³、及びA⁴の組み合わせが、A²がCR⁶でありA³がCR⁷でありA⁴がCR⁸である組み合わせか、A²が窒素原子でありA³がCR⁷でありA⁴がCR⁸である組み合わせか、又はA²がCR⁶でありA³が窒素原子でありA⁴がCR⁸である組み合わせである請求項1記載の化合物。

【請求項3】

A²、A³、及びA⁴の組み合わせが、A²がCR⁶でありA³がCR⁷でありA⁴がCR⁸である組み合わせである請求項1記載の化合物。

30

【請求項4】

A²、A³、及びA⁴の組み合わせが、A²が窒素原子でありA³がCR⁷でありA⁴がCR⁸である組み合わせである請求項1記載の化合物。

【請求項5】

A²、A³、及びA⁴の組み合わせが、A²がCR⁶でありA³が窒素原子でありA⁴がCR⁸である組み合わせである請求項1記載の化合物。

【請求項6】

Het¹がHet¹-1、又はHet¹-2である請求項1～請求項5いずれかに記載の化合物。

【請求項7】

Het¹がHet¹-3、Het¹-4、又はHet¹-5である請求項1～請求項5いずれかに記載の化合物。

40

【請求項8】

Het¹がHet¹-6、又はHet¹-7である請求項1～請求項5いずれかに記載の化合物。

【請求項9】

Het¹がHet¹-8、又はHet¹-9である請求項1～請求項5いずれかに記載の化合物。

【請求項10】

R³が、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁ - C₆アルキル基、群Gより選

50

ばれる 1 以上の置換基を有していてもよいフェニル基、窒素原子を 1 ~ 4 個有する 5 員芳香族複素環基、窒素原子を 1 ~ 2 個有する 6 員芳香族複素環基、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子である請求項 1 ~ 請求項 9 いずれかに記載の化合物。

群 G : ハロゲン原子、及び C 1 - C 6 ハロアルキル基からなる群。

【請求項 1 1】

R^3 が、1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、又はハロゲン原子である請求項 1 ~ 請求項 9 いずれかに記載の化合物。

【請求項 1 2】

R^2 が、エチル基である請求項 1 ~ 請求項 1 1 いずれかに記載の化合物。

【請求項 1 3】

A^1 が窒素原子、又は CH であり、 A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が CR^6 であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、 A^2 が窒素原子であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、又は A^2 が CR^6 であり A^3 が窒素原子であり A^4 が CR^8 である組み合わせであり、 R^1 が 1 以上のハロゲン原子を有する C 1 - C 4 鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、 R^2 がメチル基、又はエチル基であり、 R^3 が 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 G より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよいフェニル基、窒素原子を 1 ~ 4 個有する 5 員芳香族複素環基（該 5 員芳香族複素環基は、群 G より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい。）、窒素原子を 1 ~ 2 個有する 6 員芳香族複素環基（該 6 員芳香族複素環基は、群 G より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい。）、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^{11} 、 R^{12} 及び R^{24} が、各々独立して、水素原子又は 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、又はハロゲン原子であり、 Het^1 が $Het^1 - 1$ 、又は $Het^1 - 2$ であり、 q が 0、又は 1 である請求項 1 記載の化合物。

群 G : ハロゲン原子、及び C 1 - C 6 ハロアルキル基からなる群。

【請求項 1 4】

A^1 が窒素原子、又は CH であり、 A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が CR^6 であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、 A^2 が窒素原子であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、又は A^2 が CR^6 であり A^3 が窒素原子であり A^4 が CR^8 である組み合わせであり、 R^1 が 1 以上のハロゲン原子を有する C 1 - C 4 鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、 R^2 がメチル基、又はエチル基であり、 R^3 が 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、群 G より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよいフェニル基、窒素原子を 1 ~ 4 個有する 5 員芳香族複素環基（該 5 員芳香族複素環基は、群 G より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい。）、窒素原子を 1 ~ 2 個有する 6 員芳香族複素環基（該 6 員芳香族複素環基は、群 G より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい。）、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^{11} 、 R^{12} 及び R^{24} が、各々独立して、水素原子又は 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、又はハロゲン原子であり、 Het^1 が $Het^1 - 1$ 、又は $Het^1 - 2$ であり、 q が 0、又は 1 である請求項 1 記載の化合物。

群 G : ハロゲン原子、及び C 1 - C 6 ハロアルキル基からなる群。

【請求項 1 5】

A^1 が窒素原子、又は CH であり、 A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が CH であり A^3 が CH であり A^4 が CH である組み合わせか、 A^2 が窒素原子であり A^3 が CH であり A^4 が CH である組み合わせか、又は A^2 が CH であり A^3 が窒素原子であり A^4 が CH である組み合わせであり、 R^1 が 1 以上のハロゲン原子を有する C 1 - C 4 鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、 R^2 がエチル基であり、 q が 0、又は 1 であり、 R^3 が 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、又はハロゲン原子であり、He

10

20

30

40

50

t¹がHet¹-1である請求項1記載の化合物。

【請求項16】

請求項1～請求項15いずれかに記載の化合物と、不活性担体とを含有する有害節足動物防除組成物。

【請求項17】

請求項1～請求項15いずれかに記載の化合物の有効量を有害節足動物又は有害節足動物の生息場所に施用する有害節足動物の防除方法（但し、人間の治療方法を除く。）。

【請求項18】

請求項1～請求項15のいずれか1つに記載の化合物、並びに群(a)、群(b)、群(c)及び群(d)からなる群より選ばれる1種以上の成分を含有する組成物。

群(a)：殺虫活性成分、殺ダニ活性成分及び殺線虫活性成分からなる群。

群(b)：殺菌活性成分

群(c)：植物成長調整成分

群(d)：薬害軽減成分

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、複素環化合物及びそれを含有する有害節足動物防除剤に関する。

【背景技術】

【0002】

これまでに有害節足動物の防除を目的として、様々な化合物が検討されており、実用に供されている。

また、ある種の化合物が有害生物防除効果を有することが知られている（例えば、特許文献1参照）。

【先行技術文献】

【非特許文献】

【0003】

【非特許文献1】Pesticide Science, 1987, 18, 179-190

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

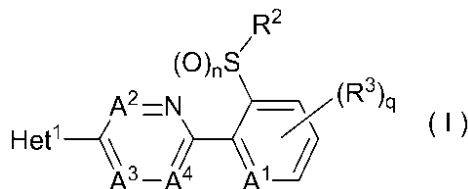
本発明は、有害節足動物に対して優れた防除効力を有する化合物を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明は以下のとおりである。

[1] 式(I)



[式中、

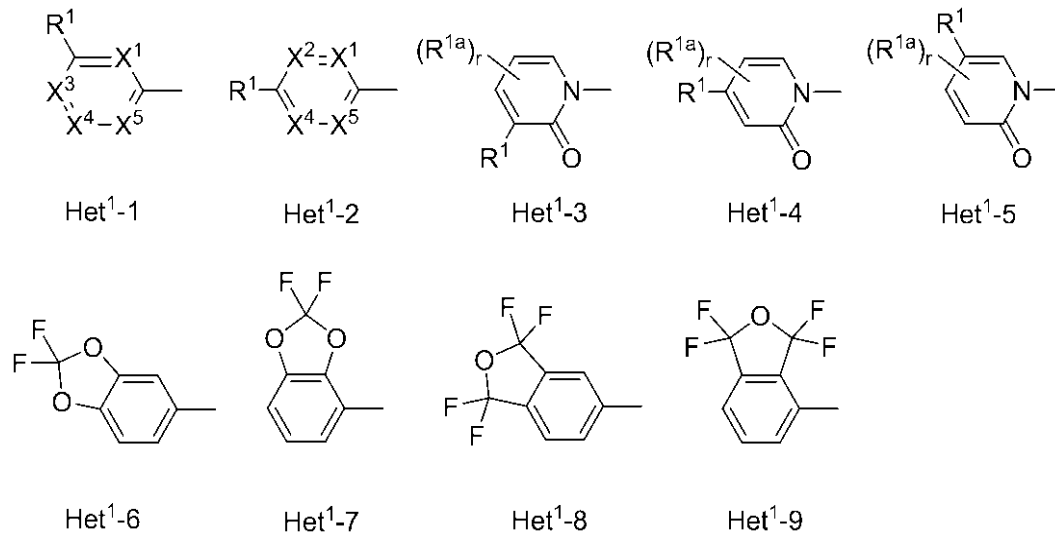
Het¹は、Het¹-1、Het¹-2、Het¹-3、Het¹-4、Het¹-5、Het¹-6、Het¹-7、Het¹-8、又はHet¹-9を表し、

10

20

30

40



10

R^1 は、 OR^4 、 $OS(O)_2R^4$ 、 $S(O)_mR^4$ 、 $NR^5S(O)_2R^4$ 、1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子を表し、

R^4 は、1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基を表し、

R^5 は、水素原子、又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基を表し、

20

X^1 は、窒素原子、又は CR^{30} を表し、

X^2 は、窒素原子、又は CR^{31} を表し、

X^3 は、窒素原子、又は CR^{32} を表し、

X^4 は、窒素原子、又は CR^{33} を表し、

X^5 は、窒素原子、又は CR^{34} を表し、

R^{30} 、 R^{31} 、 R^{32} 、 R^{33} 、及び R^{34} は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6脂環式炭化水素基、又はハロゲン原子を表し、

R^{1a} は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6脂環式炭化水素基、又はハロゲン原子を表し、

30

r は0、1、2、又は3を表し、 r が2又は3を表す場合、複数の R^{1a} は同一でも異なってもよく、

A^1 は、窒素原子、又は CR^9 を表し、

A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせは、

A^2 が CR^6 であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、

A^2 が窒素原子であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、

A^2 が CR^6 であり A^3 が窒素原子であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、又は

A^2 が CR^6 であり A^3 が CR^7 であり A^4 が窒素原子である組み合わせを表し、

R^9 は、水素原子、又はハロゲン原子を表し、

40

R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、ニトロ基、 OR^{18} 、 $NR^{18}R^{19}$ 、シアノ基、又はハロゲン原子を表し、

n は、0、1、又は2を表し、

R^2 は、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基を表し、

q は、0、1、2、又は3を表し、

R^3 は、群Bより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい5もしくは6員芳香族複素環基、ニトロ基、 OR^{12} 、

50

$NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{11a}R^{12a}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}OR^{11}$ 、 $NR^{11}C(O)R^{13}$ 、 $NR^{24}NR^{11}C(O)R^{13}$ 、 $NR^{11}C(O)OR^{14}$ 、 $NR^{24}NR^{11}C(O)OR^{14}$ 、 $NR^{11}C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $NR^{24}NR^{11}C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $N=CHNR^{15}R^{16}$ 、 $N=S(O)_xR^{15}R^{16}$ 、 $S(O)_yR^{15}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 、シアノ基、又はハロゲン原子を表し、 q が2又は3である場合、複数の R^3 は同一でも異なっていてもよく、

R^{11} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、及び R^{24} は、各々独立して、水素原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基を表し、

R^{12} は、水素原子、 $S(O)_2R^{23}$ 、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は群Fより選ばれる1の置換基を有するC1 - C6アルキル基を表し、

R^{23} は、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又は群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基を表し、

R^{11a} 及び R^{12a} はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、群Eより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい3 - 7員非芳香族複素環基{該3 - 7員非芳香族複素環はアジリジン環、アゼチジン環、ピロリジン環、イミダゾリン環、イミダゾリジン環、ピペリジン環、テトラヒドロピリミジン環、ヘキサヒドロピリミジン環、ピペラジン環、アゼパン環、オキサゾリジン環、イソオキサゾリジン環、1,3 - オキサジナン環、モルホリン環、1,4 - オキサゼパン環、チアゾリジン環、イソチアゾリジン環、1,3 - チアジナン環、チオモルホリン環、又は1,4 - チアゼパン環を表す。}を表し、

R^{13} は、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C7シクロアルキル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよい(C3 - C6シクロアルキル)C1 - C3アルキル基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、又は群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい5もしくは6員芳香族複素環基を表し、

R^{14} は、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C7シクロアルキル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよい(C3 - C6シクロアルキル)C1 - C3アルキル基、又はフェニルC1 - C3アルキル基{フェニルC1 - C3アルキル基におけるフェニル部分は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。}を表し、

R^{15} 及び R^{16} は、各々独立して、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基を表し、

m は、0、1、又は2を表し、

x は、0又は1を表し、

y は、0、1、又は2を表す。

群B：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルキニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキルスルホニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、及びハロゲン原子からなる群。

群C：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルキニルオキシ基、及びハロゲン原子からなる群。

群D：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、ヒドロキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC3 - C6アルキニルオキシ基、スルファニル基、1以上のハロゲン原子

10

20

30

40

50

を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルファニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニル基、アミノ基、 NHR^{21} 、 $\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{21}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{21}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{21}$ 、シアノ基、ニトロ基、及びハロゲン原子からなる群{ R^{21} 及び R^{22} は、各々独立して、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表す}。

群E：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3 - C 6 アルケニルオキシ基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3 - C 6 アルキニルオキシ基、ハロゲン原子、オキソ基、ヒドロキシ基、シアノ基、及びニトロ基からなる群。

10

群F：1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルコキシ基、アミノ基、 NHR^{21} 、 $\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、シアノ基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい5又は6員芳香族複素環基、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3 - C 7 シクロアルキル基、及び群Cより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい3 - 7員非芳香族複素環基{該3 - 7員非芳香族複素環はアジリジン環、アゼチジン環、ピロリジン環、イミダゾリン環、イミダゾリジン環、ペペリジン環、テトラヒドロピリミジン環、ヘキサヒドロピリミジン環、ピペラジン環、アゼパン環、オキサゾリジン環、イソオキサゾリジン環、1, 3 - オキサジナン環、モルホリン環、1, 4 - オキサゼパン環、チアゾリジン環、イソチアゾリジン環、1, 3 - チアジナン環、チオモルホリン環、又は1, 4 - チアゼパン環を表す。}からなる群。]で示される化合物、又はそのNオキシド化合物(以下、式(I)で示される化合物及びそのNオキシド化合物を本発明化合物と記す)。

20

[2] A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が CR^6 であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、 A^2 が窒素原子であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせか、又は A^2 が CR^6 であり A^3 が窒素原子であり A^4 が CR^8 である組み合わせである [1] 記載の化合物。

[3] A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が CR^6 であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせである [1] 記載の化合物。

[4] A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が窒素原子であり A^3 が CR^7 であり A^4 が CR^8 である組み合わせである [1] 記載の化合物。

30

[5] A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が CR^6 であり A^3 が窒素原子であり A^4 が CR^8 である組み合わせである [1] 記載の化合物。

[6] Het^1 が $\text{Het}^1 - 1$ 、又は $\text{Het}^1 - 2$ である [1] ~ [5] いずれかに記載の化合物。

[7] Het^1 が $\text{Het}^1 - 3$ 、 $\text{Het}^1 - 4$ 、又は $\text{Het}^1 - 5$ である [1] ~ [5] いずれかに記載の化合物。

[8] Het^1 が $\text{Het}^1 - 6$ 、又は $\text{Het}^1 - 7$ である [1] ~ [5] いずれかに記載の化合物。

[9] Het^1 が $\text{Het}^1 - 8$ 、又は $\text{Het}^1 - 9$ である [1] ~ [5] いずれかに記載の化合物。

40

[10] R^3 が、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、窒素原子を1 ~ 4個有する5員芳香族複素環基、窒素原子を1 ~ 2個有する6員芳香族複素環基、 $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $\text{NR}^{24}\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、又はハロゲン原子である [1] ~ [9] いずれかに記載の化合物。

群G：ハロゲン原子、及びC 1 - C 6 ハロアルキル基からなる群。

[11] R^3 が、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、又はハロゲン原子である [1] ~ [9] いずれかに記載の化合物。

[12] R^2 が、エチル基である [1] ~ [11] いずれかに記載の化合物。

[13] A^1 が窒素原子、又はCHであり、 A^2 、 A^3 、及び A^4 の組み合わせが、 A^2 が

50

C R⁶でありA³がC R⁷でありA⁴がC R⁸である組み合わせか、A²が窒素原子でありA³がC R⁷でありA⁴がC R⁸である組み合わせか、又はA²がC R⁶でありA³が窒素原子でありA⁴がC R⁸である組み合わせであり、R¹が1以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 4鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、R²がメチル基、又はエチル基であり、R³が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6アルキル基、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、窒素原子を1～4個有する5員芳香族複素環基(該5員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。)、窒素原子を1～2個有する6員芳香族複素環基(該6員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。)、NR¹¹R¹²、NR²⁴NR¹¹R¹²、又はハロゲン原子であり、R¹¹、R¹²及びR²⁴が、各々独立して、水素原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 3アルキル基であり、R⁶、R⁷、及びR⁸は、各々独立して、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6アルキル基、又はハロゲン原子であり、Het¹がHet¹-1、又はHet¹-2であり、qが0、又は1である[1]記載の化合物。

10

群G：ハロゲン原子、及びC 1 - C 6ハロアルキル基からなる群。

[14] A¹が窒素原子、又はCHであり、A²、A³、及びA⁴の組み合わせか、A²がC R⁶でありA³がC R⁷でありA⁴がC R⁸である組み合わせか、A²が窒素原子でありA³がC R⁷でありA⁴がC R⁸である組み合わせか、又はA²がC R⁶でありA³が窒素原子でありA⁴がC R⁸である組み合わせであり、R¹が1以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 4鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、R²がメチル基、又はエチル基であり、R³が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6アルキル基、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、窒素原子を1～4個有する5員芳香族複素環基(該5員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。)、窒素原子を1～2個有する6員芳香族複素環基(該6員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。)、NR¹¹R¹²、NR²⁴NR¹¹R¹²、又はハロゲン原子であり、R¹¹、R¹²及びR²⁴が、各々独立して、水素原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 3アルキル基であり、R⁶、R⁷、及びR⁸は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6アルキル基、又はハロゲン原子であり、Het¹がHet¹-1、又はHet¹-2であり、qが0、又は1である[1]記載の化合物。

20

30

[15] A¹が窒素原子、又はCHであり、A²、A³、及びA⁴の組み合わせか、A²がCHでありA³がCHでありA⁴がCHである組み合わせか、A²が窒素原子でありA³がCHでありA⁴がCHである組み合わせか、又はA²がCHでありA³が窒素原子でありA⁴がCHである組み合わせであり、R¹が1以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 4鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、R²がエチル基であり、qが0、又は1であり、R³が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6アルキル基、又はハロゲン原子であり、Het¹がHet¹-1である[1]記載の化合物。

[16] [1]～[15]いずれかに記載の化合物と、不活性担体とを含有する有害節足動物防除組成物。

[17] [1]～[15]いずれかに記載の化合物の有効量を有害節足動物又は有害節足動物の生息場所に施用する有害節足動物の防除方法。

40

[18] [1]から[14]のいずれか1つに記載の化合物、並びに群(a)、群(b)、群(c)及び群(d)からなる群より選ばれる1種以上の成分を含有する組成物。

群(a)：殺虫活性成分、殺ダニ活性成分及び殺線虫活性成分からなる群。

群(b)：殺菌活性成分

群(c)：植物成長調整成分

群(d)：薬害軽減成分

【発明の効果】

【0006】

本発明化合物は、有害節足動物に対して優れた防除活性を有することから、有害節足動物

50

防除剤の有効成分として有用である。

【発明を実施するための形態】

【0007】

本発明における置換基について説明する。

「1以上のハロゲン原子を有していてもよい」とは、2以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも異なってもよいことを表す。

本明細書における「CX - CY」との表記は、炭素原子数がX乃至Yであることを意味する。例えば「C1 - C6」の表記は、炭素原子数が1乃至6であることを意味する。

【0008】

ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表す。

10

【0009】

「鎖式炭化水素基」とは、アルキル基、アルケニル基及びアルキニル基を表す。

「アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、1, 1 - ジメチルプロピル基、1, 2 - ジメチルプロピル基、1 - エチルプロピル基、ブチル基、tert - ブチル基、ペンチル基及びヘキシル基が挙げられる。

「アルケニル基」としては、例えばビニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、1 - メチル - 1 - プロペニル基、1 - メチル - 2 - プロペニル基、1, 2 - ジメチル - 1 - プロペニル基、1, 1 - ジメチル - 2 - プロペニル基、3 - ブテニル基、4 - ペンテニル基及び5 - ヘキセニル基が挙げられる。

「アルキニル基」としては、例えばエチニル基、1 - プロピニル基、2 - プロピニル基、1 - メチル - 2 - プロピニル基、1, 1 - ジメチル - 2 - プロピニル基、4 - ペンチニル基及び5 - ヘキシニル基が挙げられる。

20

「C1 - C6ハロアルキル基」とは、C1 - C6アルキル基の水素原子がハロゲン原子で置換された基を表し、例えば、C1 - C6フルオロアルキル基が挙げられる。

「C1 - C6ハロアルキル基」としては、例えば、クロロエチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2 - ブロモ - 1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル基、2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピル基、1 - メチル - 2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピル基、及びペルフルオロヘキシル基が挙げられる。

「C1 - C6フルオロアルキル基」としては、例えば、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピル基、1 - メチル - 2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピル基、及びペルフルオロヘキシル基が挙げられる。

30

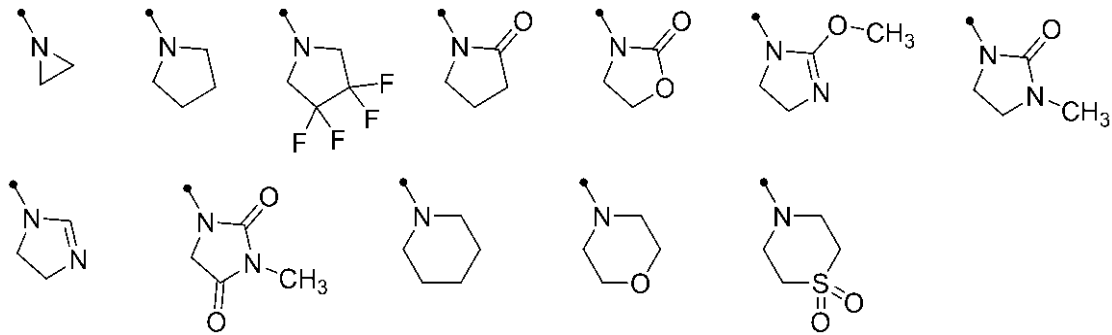
【0010】

「シクロアルキル基」とは、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、シクロヘキシル基及びシクロヘプチル基が挙げられる。

【0011】

「3 - 7員非芳香族複素環基」とは、アジリジン環、アゼチジン環、ピロリジン環、イミダゾリン環、イミダゾリジン環、ピペリジン環、テトラヒドロピリミジン環、ヘキサヒドロピリミジン環、ピペラジン環、アゼパン環、オキサゾリジン環、イソオキサゾリジン環、1, 3 - オキサジナン環、モルホリン環、1, 4 - オキサゼパン環、チアゾリジン環、イソチアゾリジン環、1, 3 - チアジナン環、チオモルホリン環、又は1, 4 - チアゼパン環を表し、群Eより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい3 - 7員非芳香族複素環基としては、例えば下記に示す基が挙げられる。

40



【 0 0 1 2 】

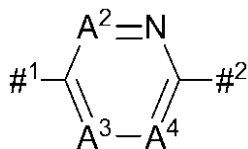
「フェニル C 1 - C 3 アルキル基 {フェニル C 1 - C 3 アルキル基におけるフェニル部分は、群 D より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい。} 」とは、例えばベンジル基、2 - フルオロベンジル基、4 - クロロベンジル基、4 - (トリフルオロメチル) ベンジル基、及び 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基が挙げられる。

「 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい (C 3 - C 6 シクロアルキル) C 1 - C 3 アルキル基 」とは、(C 3 - C 6 シクロアルキル) 部分及び / 又は (C 1 - C 3 アルキル) 部分が 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい基を表し、例えば、(2 , 2 - ジフルオロシクロプロピル) メチル基、2 - シクロプロピル - 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル基、及び 2 - (2 , 2 - ジフルオロシクロプロピル) - 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル基が挙げられる。

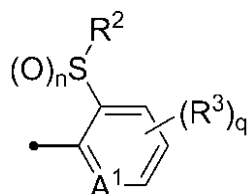
「 5 もしくは 6 員芳香族複素環基 」とは、5 員芳香族複素環基又は 6 員芳香族複素環基を表す。5 員芳香族複素環基とはピロリル基、フリル基、チエニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、オキサジアゾリル基、又はチアジアゾリル基を表す。5 員芳香族複素環基としては、窒素原子を 1 ~ 4 個有する 5 員芳香族複素環基、すなわちピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1 , 2 , 4 - トリアゾリル基、1 , 2 , 3 - トリアゾリル基、又はテトラゾリル基が好ましい。6 員芳香族複素環基とはピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基又はピラジニル基を表す。6 員芳香族複素環基としては、窒素原子を 1 ~ 2 個有する 6 員芳香族複素環基、すなわちピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基又はピラジニル基が好ましい。

【 0 0 1 3 】

本発明化合物において、下式



で示される構造 (以下、Het² と記す。式中、#¹ は Het¹ との結合位置を表し、#² は



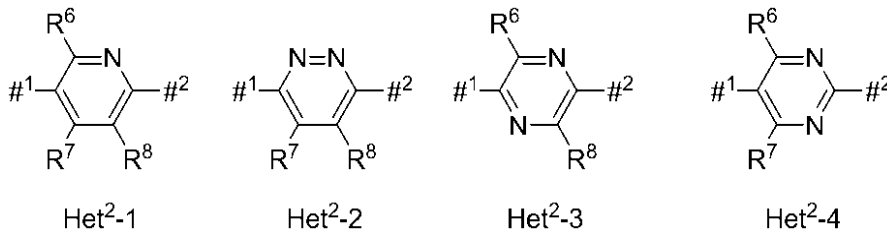
との結合位置を表す。) は、下記 Het² - 1、Het² - 2、Het² - 3、又は Het² - 4 を表す。

10

20

30

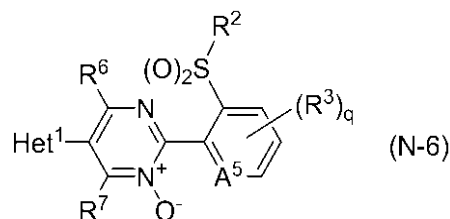
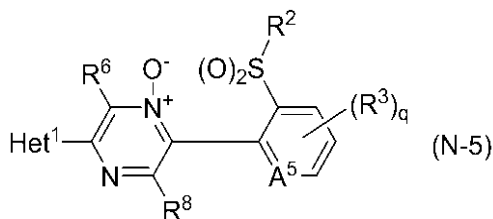
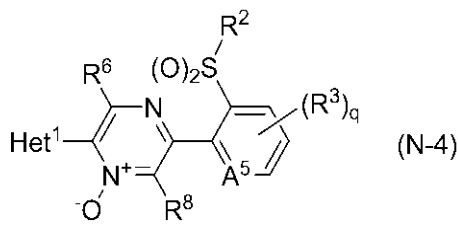
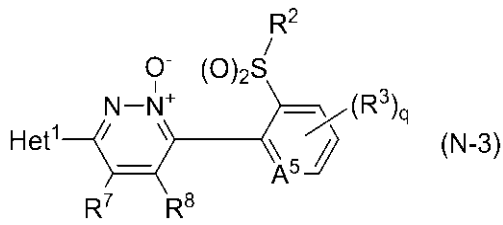
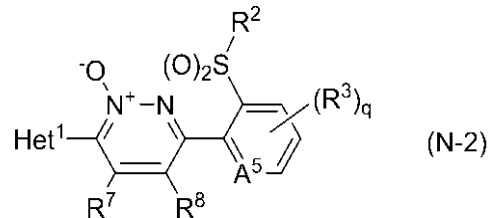
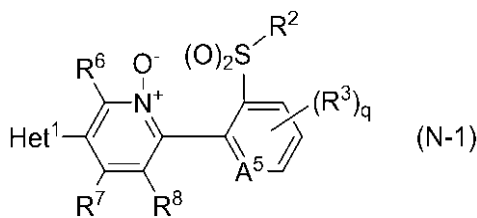
40



(式中、記号は前記と同じ意味を表す。)

【0014】

Nオキシド化合物とは、式(N-1)で示される化合物、式(N-2)で示される化合物、式(N-3)で示される化合物、式(N-4)で示される化合物、式(N-5)で示される化合物、又は式(N-6)で示される化合物を表す。



[式中、A⁵は、窒素原子、N⁺O⁻、又はC R⁹を表し、その他の記号は前記と同じ意味を表す。]

【0015】

本発明化合物の態様としては、以下の化合物が挙げられる。

〔態様1〕本発明化合物において、R¹が1以上のハロゲン原子を有するC₁-C₄鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子である化合物；

〔態様2〕本発明化合物において、R¹が3以上のフッ素原子を有するC₁-C₄アルキル基である化合物；

【0016】

〔態様3〕本発明化合物において、R²がシクロプロピル基、シクロプロピルメチル基又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁-C₃アルキル基である化合物；

〔態様4〕本発明化合物において、R²がメチル基、エチル基、シクロプロピル基、又はシクロプロピルメチル基である化合物；

〔態様5〕本発明化合物において、R²がメチル基、又はエチル基である化合物；

〔態様6〕本発明化合物において、R²がエチル基である化合物；

【0017】

〔態様7〕本発明化合物において、R³が、群Bより選ばれる1以上の置換基を有してい

10

20

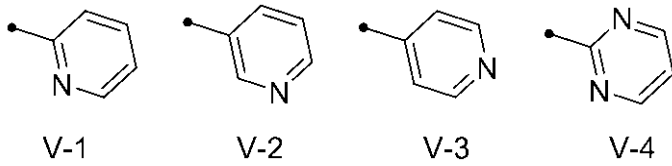
30

40

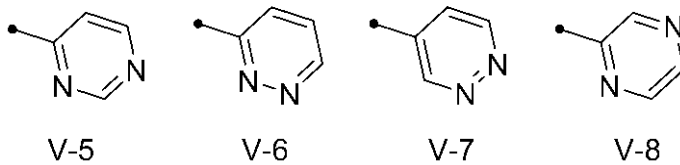
50

てもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1の6員芳香族複素環基（該6員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、群Wより選ばれる1の5員芳香族複素環基（該5員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、 OR^{12} 、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{11a}R^{12a}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子である化合物；

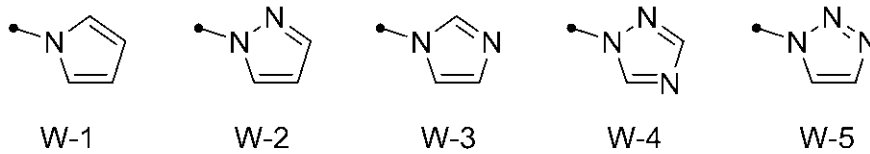
群V：



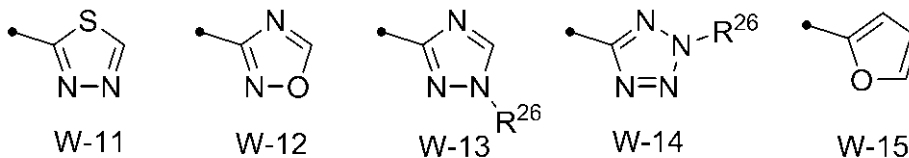
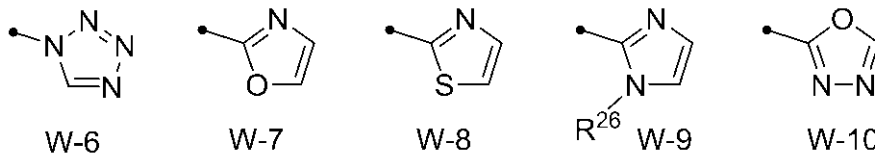
10



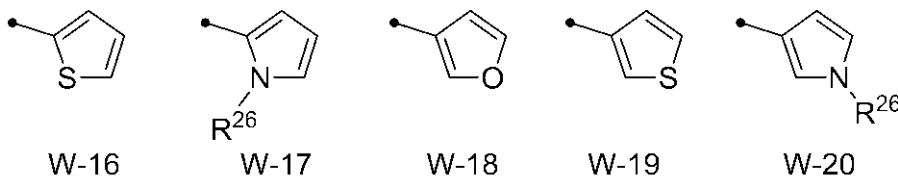
群W：



20



30



{ 図中、 R^{26} は、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基を表す。 }

40

〔態様8〕本発明化合物において、 R^3 が、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1の6員芳香族複素環基（該6員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、W - 1 ~ W - 6より選ばれる1の5員芳香族複素環基（該5員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^{11} 、 R^{12} 及び R^{24} が、各々独立して、水素原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 3 アルキル基である化合物；

〔態様9〕本発明化合物において、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1 - C 6 鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子である化合物；

50

〔態様10〕本発明化合物において、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有するC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

【0018】

〔態様11〕本発明化合物において、 R^6 が水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

【0019】

〔態様12〕本発明化合物において、 q が0又は1である化合物；

〔態様13〕本発明化合物において、 q が0である化合物；

【0020】

〔態様14〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又は CR^9 であり、 R^9 が水素原子、又はハロゲン原子である化合物；

10

〔態様15〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHである化合物；

〔態様16〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子である化合物；

【0021】

〔態様17〕本発明化合物において、 Het^1 が Het^1-1 、 Het^1-2 、 Het^1-3 、 Het^1-4 、又は Het^1-5 である化合物；

〔態様18〕本発明化合物において、 Het^1 が Het^1-1 、又は Het^1-2 である化合物；

〔態様19〕本発明化合物において、 Het^1 が Het^1-1 である化合物；

〔態様20〕本発明化合物において、 Het^1 が Het^1-2 である化合物；

20

〔態様21〕本発明化合物において、 Het^1 が Het^1-5 である化合物；

【0022】

〔態様22〕本発明化合物において、 Het^2 が Het^2-1 、 Het^2-2 、又は Het^2-3 である化合物；

〔態様23〕本発明化合物において、 Het^2 が Het^2-1 である化合物；

〔態様24〕本発明化合物において、 Het^2 が Het^2-2 である化合物；

〔態様25〕本発明化合物において、 Het^2 が Het^2-3 である化合物；

〔態様26〕本発明化合物において、 Het^2 が Het^2-4 である化合物；

【0023】

〔態様27〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHであり、 R^1 が1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、 R^2 がシクロプロピル基、シクロプロピルメチル基又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C3アルキル基、であり、 R^3 が、群Bより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1の6員芳香族複素環基（該6員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、群Wより選ばれる1の5員芳香族複素環基（該5員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、 OR^{12} 、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{11a}R^{12a}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

30

〔態様28〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHであり、 R^1 が3以上のフッ素原子を有するC1 - C4アルキル基であり、 R^2 がシクロプロピル基、シクロプロピルメチル基又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C3アルキル基であり、 R^3 が、群Bより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1の6員芳香族複素環基（該6員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、群Wより選ばれる1の5員芳香族複素環基（該5員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、 OR^{12} 、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{11a}R^{12a}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、

40

50

又はハロゲン原子である化合物；

〔態様 29〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHであり、 R^1 が3以上のフッ素原子を有するC1 - C4アルキル基であり、 R^2 がメチル基、又はエチル基であり、 R^3 が、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1の6員芳香族複素環基（該6員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、W-1 ~ W-6より選ばれる1の5員芳香族複素環基（該5員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^{11} 、 R^{12} 及び R^{24} が各々独立して、水素原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C3アルキル基であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

10

〔態様 30〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHであり、 R^1 が3以上のフッ素原子を有するC1 - C4アルキル基であり、 R^2 がエチル基であり、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

〔態様 31〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子であり、 R^1 が3以上のフッ素原子を有するC1 - C4アルキル基であり、 R^2 がエチル基であり、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

20

〔態様 32〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHであり、 R^1 が、3以上のフッ素原子を有するC1 - C4アルキル基であり、 R^2 がエチル基であり、 R^3 が群Bより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1の6員芳香族複素環基（該6員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、群Wより選ばれる1の5員芳香族複素環基（該5員芳香族複素環基は、群Dより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、 OR^{12} 、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{11a}R^{12a}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

30

【0024】

〔態様 33〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHであり、 R^1 が3以上のフッ素原子を有するC1 - C4アルキル基であり、 R^2 がエチル基であり、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基、群Vより選ばれる1の6員芳香族複素環基（該6員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、W-1 ~ W-6より選ばれる1の5員芳香族複素環基（該5員芳香族複素環基は、群Gより選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。）、 $NR^{11}R^{12}$ 、 $NR^{24}NR^{11}R^{12}$ 、又はハロゲン原子であり、 R^{11} 、 R^{12} 及び R^{24} が、各々独立して、水素原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C3アルキル基であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

40

【0025】

〔態様 34〕 Het^1 が Het^1-1 、 Het^1-2 、 Het^1-3 、 Het^1-4 、又は Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-1 、 Het^2-2 、又は Het^2-3 である〔態様 27〕～〔態様 33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様 35〕 Het^1 が Het^1-1 、 Het^1-2 、 Het^1-3 、 Het^1-4 、又は Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-1 である〔態様 27〕～〔態様 33〕いずれかに

50

記載の化合物；

〔態様36〕 Het^1 が Het^1-1 、 Het^1-2 、 Het^1-3 、 Het^1-4 、又は Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-2 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様37〕 Het^1 が Het^1-1 、 Het^1-2 、 Het^1-3 、 Het^1-4 、又は Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-3 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様38〕 Het^1 が Het^1-1 、 Het^1-2 、 Het^1-3 、 Het^1-4 、又は Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-4 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

10

【0026】

〔態様39〕 Het^1 が Het^1-1 であり、 Het^2 が Het^2-1 、 Het^2-2 、又は Het^2-3 である〔態様27〕～〔態様32〕いずれかに記載の化合物；

〔態様40〕 Het^1 が Het^1-1 であり、 Het^2 が Het^2-1 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様41〕 Het^1 が Het^1-1 であり、 Het^2 が Het^2-2 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様42〕 Het^1 が Het^1-1 であり、 Het^2 が Het^2-3 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様43〕 Het^1 が Het^1-1 であり、 Het^2 が Het^2-4 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

20

【0027】

〔態様44〕 Het^1 が Het^1-2 であり、 Het^2 が Het^2-1 、 Het^2-2 、又は Het^2-3 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様45〕 Het^1 が Het^1-2 であり、 Het^2 が Het^2-1 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様46〕 Het^1 が Het^1-2 であり、 Het^2 が Het^2-2 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様47〕 Het^1 が Het^1-2 であり、 Het^2 が Het^2-3 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

30

〔態様48〕 Het^1 が Het^1-2 であり、 Het^2 が Het^2-4 である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

【0028】

〔態様49〕 Het^1 が Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-1 、 Het^2-2 、又は Het^2-3 であり、 R^{1a} が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4鎖式炭化水素基又はハロゲン原子である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様50〕 Het^1 が Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-1 であり、 R^{1a} が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4鎖式炭化水素基又はハロゲン原子である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様51〕 Het^1 が Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-2 であり、 R^{1a} が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4鎖式炭化水素基又はハロゲン原子である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

40

〔態様52〕 Het^1 が Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-3 であり、 R^{1a} が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4鎖式炭化水素基又はハロゲン原子である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

〔態様53〕 Het^1 が Het^1-5 であり、 Het^2 が Het^2-4 であり、 R^{1a} が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C4鎖式炭化水素基又はハロゲン原子である〔態様27〕～〔態様33〕いずれかに記載の化合物；

【0029】

〔態様54〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子であり、 R^1 が1以上のハロゲン原子

50

を有する C 1 - C 4 鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、R²がエチル基であり、R³が、1以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、又はハロゲン原子であり、Het¹がHet¹ - 1であり、Het²がHet² - 1、Het² - 2、又はHet² - 3であり、R⁶、R⁷及びR⁸が水素原子であり、qが0、又は1である化合物；

【0030】

〔態様55〕Het²がHet² - 1である〔態様54〕に記載の化合物；

〔態様56〕Het²がHet² - 2である〔態様54〕に記載の化合物；

〔態様57〕Het²がHet² - 3である〔態様54〕に記載の化合物；

【0031】

〔態様58〕X¹がCHであり、X³がCR³²であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様55〕に記載の化合物；

〔態様59〕X¹が窒素原子であり、X³がCR³²であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様55〕に記載の化合物；

〔態様60〕X¹がCHであり、X³が窒素原子であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様55〕に記載の化合物；

〔態様61〕X¹がCHであり、X³がCR³²であり、X⁴が窒素原子であり、X⁵がCHである〔態様55〕に記載の化合物；

〔態様62〕X¹がCHであり、X³がCRであり、X⁴がCR³³であり、X⁵が窒素原子である〔態様55〕に記載の化合物；

【0032】

〔態様63〕X¹がCHであり、X³がCR³²であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様56〕に記載の化合物；

〔態様64〕X¹が窒素原子であり、X³がCR³²であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様56〕に記載の化合物；

〔態様65〕X¹がCHであり、X³が窒素原子であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様56〕に記載の化合物；

〔態様66〕X¹がCHであり、X³がCR³²であり、X⁴が窒素原子であり、X⁵がCHである〔態様56〕に記載の化合物；

〔態様67〕X¹がCHであり、X³がCRであり、X⁴がCR³³であり、X⁵が窒素原子である〔態様56〕に記載の化合物；

【0033】

〔態様68〕X¹がCHであり、X³がCR³²であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様57〕に記載の化合物；

〔態様69〕X¹が窒素原子であり、X³がCR³²であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様57〕に記載の化合物；

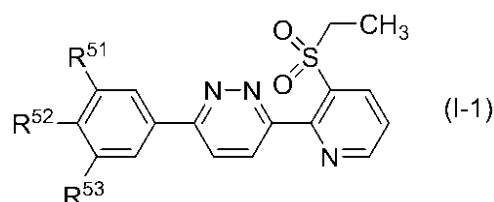
〔態様70〕X¹がCHであり、X³が窒素原子であり、X⁴がCR³³であり、X⁵がCHである〔態様57〕に記載の化合物；

〔態様71〕X¹がCHであり、X³がCR³²であり、X⁴が窒素原子であり、X⁵がCHである〔態様57〕に記載の化合物；

〔態様72〕X¹がCHであり、X³がCR³²であり、X⁴がCR³³であり、X⁵が窒素原子である〔態様57〕に記載の化合物；

【0034】

〔態様73〕式(I-1)



〔式中、R⁵¹、R⁵²及びR⁵³はいずれか1つが1以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 4

10

20

30

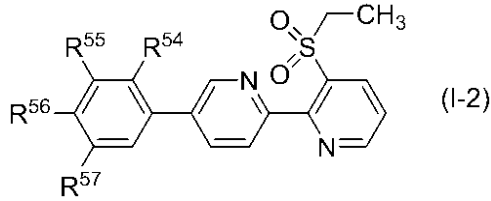
40

50

鎖式炭化水素基を表し、残余が水素原子又はハロゲン原子を表す。]

で示される化合物；

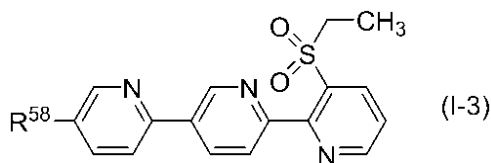
〔態様 74〕式 (I-2)



[式中、 R^{55} 、 R^{56} 及び R^{57} はいずれか1つが OR^4 、1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基又はハロゲン原子を表し、残余が水素原子又はハロゲン原子を表し、 R^{54} は水素原子、ハロゲン原子又は1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基を表す。]

で示される化合物；

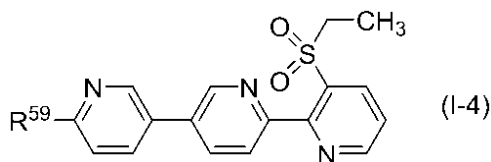
〔態様 75〕式 (I-3)



[式中、 R^{58} はハロゲン原子又は1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基を表す。]

で示される化合物；

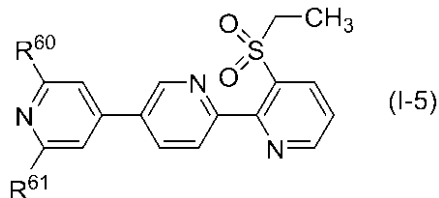
〔態様 76〕式 (I-4)



[式中、 R^{59} はハロゲン原子又は1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基を表す。]

で示される化合物；

〔態様 77〕式 (I-5)



[式中、 R^{60} 及び R^{61} はいずれか一方がハロゲン原子又は1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基を表し、他方が水素原子、ハロゲン原子又は1以上のハロゲン原子を有するC1 - C4鎖式炭化水素基を表す。]

で示される化合物；

〔態様 78〕本発明化合物において、 R^6 、 R^7 、及び R^8 が水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

〔態様 79〕本発明化合物において、 A^1 が窒素原子、又はCHであり、 R^1 が3以上のフッ素原子を有するC1 - C4アルキル基であり、 R^2 がエチル基であり、 R^3 が1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6鎖式炭化水素基、又はハロゲン原子であり、 R^6 、 R^7 、及び R^8 は、各々独立して、水素原子、1以上のハロゲン原子を有していてもよいC1 - C6アルキル基、又はハロゲン原子である化合物；

10

20

30

40

50

【 0 0 3 9 】

次に、本発明化合物の製造法について説明する。

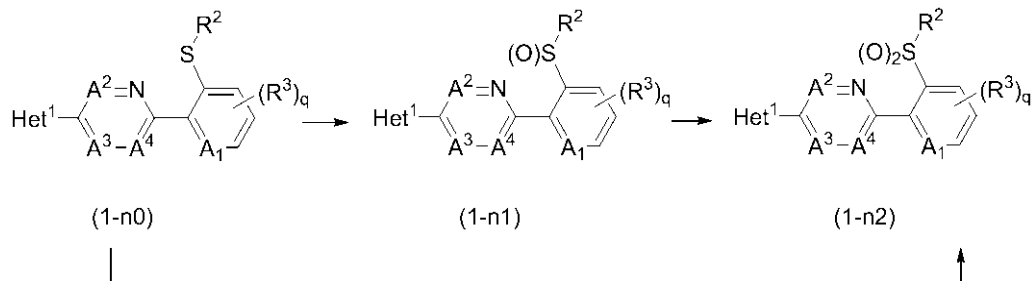
【 0 0 4 0 】

本発明化合物及び製造中間体化合物は、以下の製造法により製造することができる。

【 0 0 4 1 】

製造法 1

本発明化合物において、 n が 1 である化合物（以下、化合物（1 - n 1）と記す）又は n が 2 である化合物（以下、化合物（1 - n 2）と記す）は、 n が 0 である化合物（以下、化合物（1 - n 0）と記す）を酸化することにより製造することができる。



10

[式中、記号は前記と同じ意味を表す。]

【 0 0 4 2 】

まず、化合物（1 - n 0）から化合物（1 - n 1）を製造する方法について記載する。

20

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類（以下、脂肪族ハロゲン化炭化水素類と記す。）、アセトニトリル等のニトリル類（以下、ニトリル類と記す。）、メタノール、エタノール等のアルコール類（以下、アルコール類と記す。）、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば過ヨウ素酸ナトリウム、 m -クロロ過安息香酸（以下、 m C P B A と記す。）、及び過酸化水素が挙げられる。

酸化剤として過酸化水素を用いる場合は、必要に応じて炭酸ナトリウム、又は触媒を加えてもよい。

反応に用いられる触媒としては、例えばタングステン酸、及びタングステン酸ナトリウムが挙げられる。

30

反応には、化合物（1 - n 0）1 モルに対して、酸化剤が通常 1 ~ 1.2 モルの割合、塩基が通常 0.01 ~ 1 モルの割合、触媒が通常 0.01 ~ 0.5 モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常 - 20 ~ 80 の範囲である。反応時間は通常 0.1 ~ 12 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、及び塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄する。有機層を乾燥、濃縮することにより、化合物（1 - n 1）を得ることができる。

40

【 0 0 4 3 】

つぎに、化合物（1 - n 1）から化合物（1 - n 2）を製造する方法について記載する。

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ニトリル類、アルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば m C P B A 及び過酸化水素が挙げられる。

酸化剤として過酸化水素を用いる場合は、必要に応じて塩基又は触媒を加えてもよい。

反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウムが挙げられる。

反応に用いられる触媒としては、例えばタングステン酸ナトリウムが挙げられる。

反応には、化合物（1 - n 1）1 モルに対して、酸化剤が通常 1 ~ 2 モルの割合、塩基

50

が通常 0.01 ~ 1 モルの割合、触媒が通常 0.01 ~ 0.5 モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常 -20 ~ 120 の範囲である。反応時間は通常 0.1 ~ 12 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、及び塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄する。この有機層を乾燥、濃縮することにより、化合物 (1-n2) を得ることができる。

【0044】

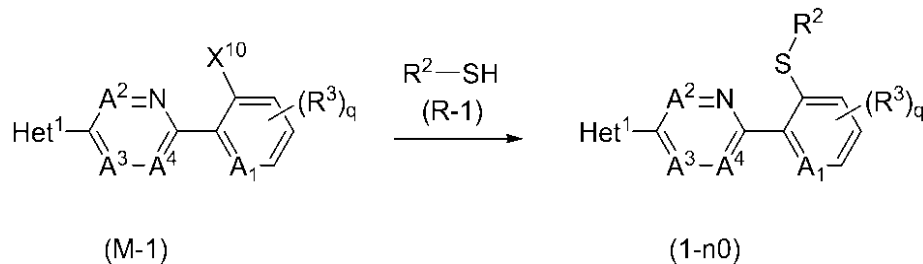
また、化合物 (1-n2) は、化合物 (1-n0) と酸化剤とを反応させることで、一段階反応（ワンポット）で製造することができる。

反応は、酸化剤を化合物 (1-n0) 1 モルに対して通常 2 ~ 5 モルの割合で使い、化合物 (1-n1) から化合物 (1-n2) を製造する方法に準じて実施することができる。

【0045】

製造法 2

化合物 (1-n0) は、式 (M-1) で示される化合物（以下、化合物 (M-1) と記す）と式 (R-1) で示される化合物（以下、化合物 (R-1) と記す）とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、X¹⁰ はハロゲン原子を表し、その他の記号は前記と同じ意味を表す。]

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン（以下、THF と記す。）、エチレングリコールジメチルエーテル（以下、DME と記す。）、メチル tert - ブチルエーテル、1,4 - ジオキサン等のエーテル類（以下、エーテル類と記す。）、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類（以下、芳香族炭化水素類と記す。）、ニトリル類、ジメチルホルムアミド（以下、DMF と記す。）、N - メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒（以下、非プロトン性極性溶媒と記す。）、及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類（以下、アルカリ金属炭酸塩類と記す。）、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類（以下、アルカリ金属水素化物類と記す。）が挙げられる。

反応には、化合物 (M-1) 1 モルに対して、化合物 (R-1) が通常 1 ~ 10 モルの割合、塩基が通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常 -20 ~ 150 の範囲である。反応時間は通常 0.5 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (1-n0) を得ることができる。

反応において、X¹⁰ はフッ素原子又は塩素原子が好ましい。

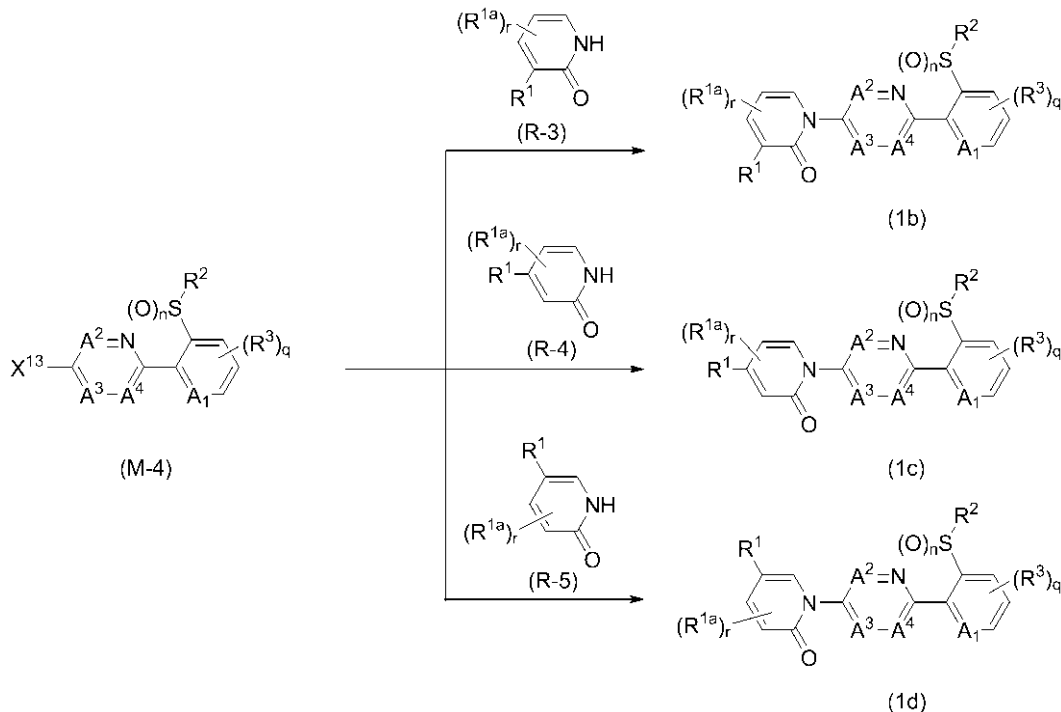
【0046】

製造法 3

式 (1a) で示される化合物（以下、化合物 (1a) と記す。）は、式 (M-3) で示される化合物（以下、化合物 (M-3) と記す。）と式 (R-2) で示される化合物（以下、化合物 (R-2) と記す。）とを、金属触媒の存在下で反応させることにより製造することができる。

製造法 4

式(1b)で示される化合物(以下、化合物(1b)と記す。)は、式(M-4)で示される化合物(以下、化合物(M-4)と記す。)と、式(R-3)で示される化合物(以下、化合物(R-3)と記す。)とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式(1c)で示される化合物(以下、化合物(1c)と記す。)は、化合物(M-4)と、式(R-4)で示される化合物(以下、化合物(R-4)と記す。)とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式(1d)で示される化合物(以下、化合物(1d)と記す。)は、化合物(M-4)と、式(R-5)で示される化合物(以下、化合物(R-5)と記す。)とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。



[式中、 X^{13} は、塩素原子、又はフッ素原子を表し、その他の記号は前記と同じ意味を表す。]

はじめに、化合物(M-4)と化合物(R-3)から化合物(1b)を製造する方法について記す。

化合物(R-3)は、市販の化合物か、既知の方法を用いて製造することができる。

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばエーテル類、芳香族炭化水素類、ニトリル類、非プロトン性極性溶媒、及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えばアルカリ金属炭酸塩類、又はアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

反応には、化合物(M-4)1モルに対して、化合物(R-3)が通常1~10モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常-20~150の範囲である。反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(1b)を得ることができる。

【0050】

化合物(1c)は、化合物(R-3)に代えて化合物(R-4)を用い、化合物(1b)を製造する方法に準じて製造することができる。

化合物(R-4)は、市販の化合物か、既知の方法を用いて製造することができる。

化合物(1d)は、化合物(R-3)に代えて化合物(R-5)を用い、化合物(1b)

10

20

30

40

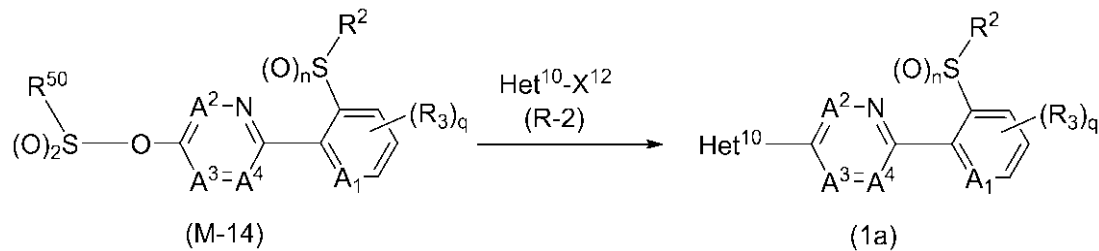
50

)を製造する方法に準じて製造することができる。

化合物 (R - 5) は、市販の化合物か、既知の方法を用いて製造することができる。

製造法 5

化合物 (1 a) は、式 (M - 1 4) で示される化合物 (以下、化合物 (M - 1 4) と記す。) と化合物 (R - 2) とを反応させることにより製造することができる。



10

[式中、R⁵⁰は、1以上のハロゲン原子を有するC1 - C10鎖式炭化水素基、1以上のハロゲン原子を有する(C1 - C5アルコキシ)C2 - C5アルキル基、1以上のハロゲン原子を有する(C1 - C5アルキルスルファニル)C2 - C5アルキル基、1以上のハロゲン原子を有する(C1 - C5アルキルスルフィニル)C2 - C5アルキル基、1以上のハロゲン原子を有する(C1 - C5アルキルスルホニル)C2 - C5アルキル基、群Gより選ばれる1以上の置換基を有する(C3 - C7シクロアルキル)C1 - C3アルキル基、又は群Gより選ばれる1以上の置換基を有するC3 - C7シクロアルキル基を表し、その他の記号は前記と同じ意味を表す。]

20

反応は、製造法3に記載の化合物 (M - 3) と化合物 (R - 2) から化合物 (1 a) を製造する方法に準じて製造することができる。

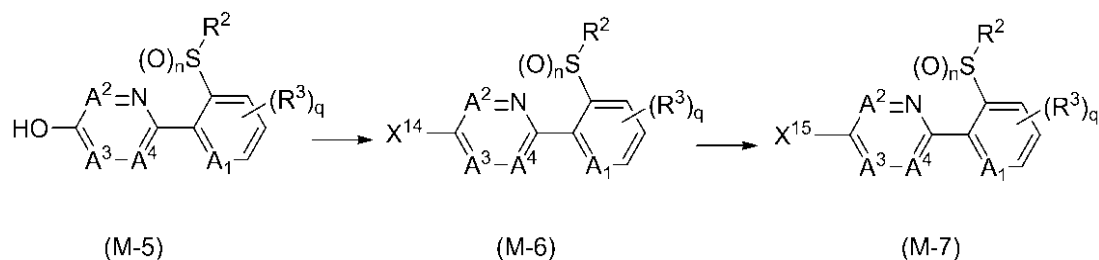
【 0 0 5 1 】

以下に中間体化合物の合成方法について記載する。

【 0 0 5 2 】

参考製造法 1

化合物 (M - 2) 及び化合物 (M - 4) は、下記スキームに従い、式 (M - 6) で示される化合物 (以下、化合物 (M - 6) と記す。) 、又は式 (M - 7) で示される化合物 (以下、化合物 (M - 7) と記す。) として製造することができる。



30

[式中、X¹⁴は塩素原子又は臭素原子を表し、X¹⁵はフッ素原子又はヨウ素原子を表し、その他の記号は前記と同じ意味を表す。]

はじめに、化合物 (M - 5) から化合物 (M - 6) を製造する方法について記載する。化合物 (M - 6) は、化合物 (M - 5) とオキシ塩化リン又はオキシ臭化リンとを反応させることにより製造することができる。

40

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば芳香族炭化水素類が挙げられる。

オキシ塩化リンを用いる場合、オキシ塩化リンを溶媒として用いてもよい。

反応には、化合物 (M - 5) 1モルに対して、オキシ塩化リン又はオキシ臭化リンが通常1 - 10モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常0 - 150の範囲である。反応時間は通常0.5 - 24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M - 6) を得ることができる。

50

【 0 0 5 3 】

つづいて、化合物 (M - 6) から化合物 (M - 7) を製造する方法について記載する。

化合物 (M - 7) は、化合物 (M - 6) と無機フッ化物、又は無機ヨウ化物とを反応させることにより製造することができる。

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばニトリル類、非プロトン性極性溶媒、含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる無機フッ化物としては、例えばフッ化カリウム、フッ化ナトリウム、及びフッ化セシウムが挙げられる。反応に用いられる無機ヨウ化物としては、例えばヨウ化カリウム、及びヨウ化ナトリウムが挙げられる。

反応には、化合物 (M - 6) 1 モルに対して、無機フッ化物又は無機ヨウ化物が通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

10

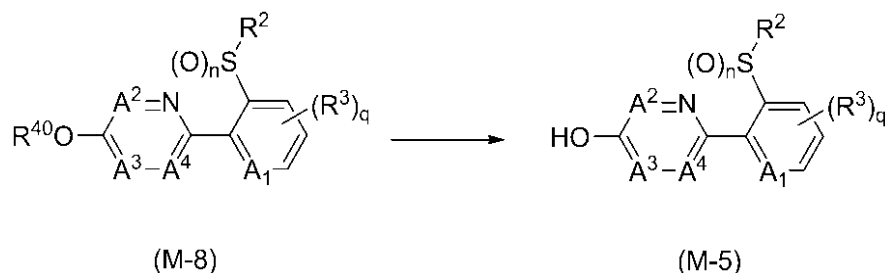
反応温度は、通常 0 ~ 250 の範囲である。反応時間は通常 0.5 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M - 7) を得ることができる。

【 0 0 5 4 】

参考製造法 2

化合物 (M - 5) は、式 (M - 8) で示される化合物 (以下化合物 (M - 8) と記す。) を酸の存在下で脱アルキル化することにより製造することができる。



20

[式中、R⁴⁰はメチル基又はエチル基を表し、その他の記号は前記と同じ意味を表す。]

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば脂肪族ハロゲン化炭化水素類、芳香族炭化水素類、ニトリル類、アルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

30

反応に用いられる酸としては、塩酸等の鉱酸類、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のハロゲン化ホウ素類、塩化チタンや塩化アルミニウム等が挙げられる。

反応には、化合物 (M - 8) 1 モルに対して、酸が通常 0.1 ~ 10 モルの割合で用いられる。反応に、塩酸等の鉱酸類を酸として用いる場合は、鉱酸類を溶媒として用いることもできる。

反応温度は、通常 - 20 ~ 150 の範囲である。反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより化合物 (M - 5) を得ることができる。

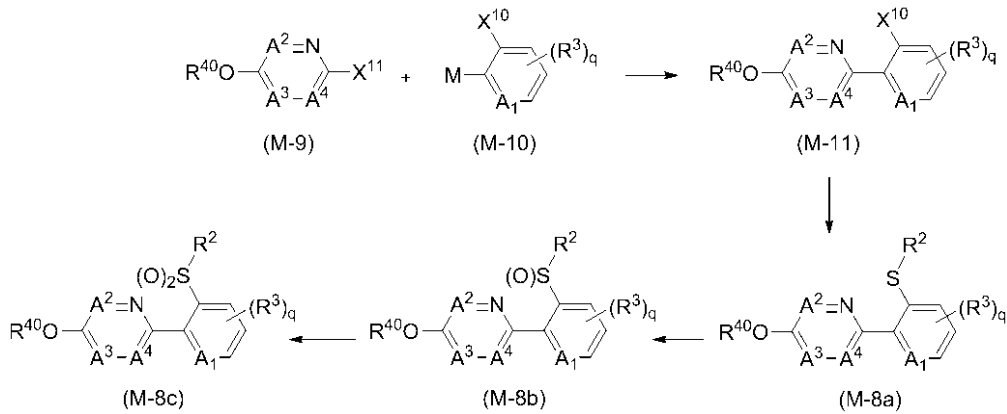
40

【 0 0 5 5 】

参考製造法 3

化合物 (M - 8) において、n が 0 である化合物 (以下、化合物 (M - 8 a) と記す。)、n が 1 である化合物 (以下、化合物 (M - 8 b) と記す。)、及び n が 2 である化合物 (以下、化合物 (M - 8 c) と記す。) は、下記の方法に従って製造することができる。

。



10

[式中の記号は前記と同じ意味を表す。]

はじめに、式 (M - 1 1) で示される化合物 (以下、化合物 (M - 1 1) と記す。) の製造法について記す。

化合物 (R - 2) に代えて化合物 (M - 9) を用い、化合物 (M - 3) に代えて化合物 (M - 1 0) 用い、製造法 3 に記載の方法に準じて実施することができる。

化合物 (M - 1 0) は、国際公開第 0 6 / 0 9 7 6 9 1 号に記載の方法、又は The Journal Of Organic Chemistry, 1995, 60, 7508-7510 に記載の方法に準じて製造することができる。

【 0 0 5 6 】

20

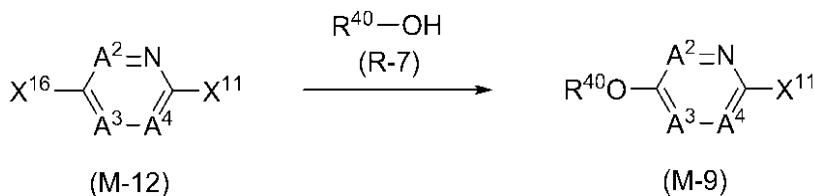
化合物 (M - 8 a) は、化合物 (M - 1) に代えて化合物 (M - 1 1) を用い、製造法 2 に記載の方法に準じて製造することができる。

化合物 (M - 8 b) 及び化合物 (M - 8 c) は、化合物 (1 - n 0) に代えて化合物 (M - 8 a) を用い、製造法 1 に記載の方法に準じて製造することができる。

【 0 0 5 7 】

参考製造法 4

化合物 (M - 9) は、式 (M - 1 2) で示される化合物 (以下、化合物 (M - 1 2) と記す。) と式 (R - 7) で示される化合物 (以下、化合物 (R - 7) と記す。) とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。



30

[式中、X¹⁶ はフッ素原子、塩素原子又は臭素原子を表し、その他の記号は前記と同じ意味を表す。]

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばエーテル類、芳香族炭化水素類、ニトリル類、非プロトン性極性溶媒、及びこれらの混合物が挙げられる。

40

反応に用いられる塩基としては、例えばアルカリ金属炭酸塩類、又はアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

反応には、化合物 (M - 1 2) 1 モルに対して、化合物 (R - 7) が通常 1 ~ 1 0 モルの割合、塩基が通常 1 ~ 1 0 モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常 - 2 0 ~ 1 5 0 の範囲である。反応時間は通常 0 . 5 ~ 2 4 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M - 9) を得ることができる。

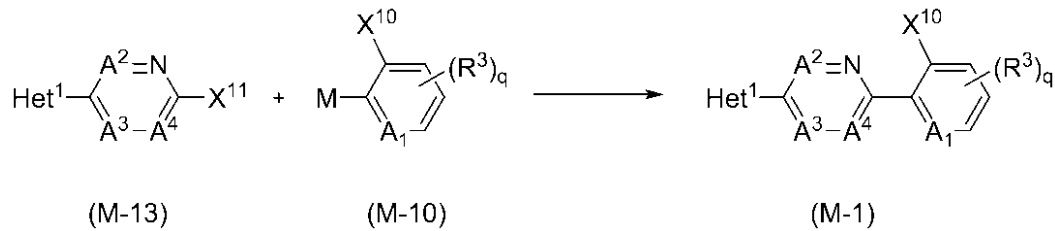
化合物 (M - 1 2) 及び化合物 (R - 7) は、市販の化合物が、又は既知の方法を用いて製造することができる。

50

【 0 0 5 8 】

参考製造法 5

化合物 (M - 1) は、式 (M - 1 3) で示される化合物 (以下、化合物 (M - 1 3) と記す。) と化合物 (M - 1 0) とを、金属触媒の存在下で反応させることにより製造することができる。



10

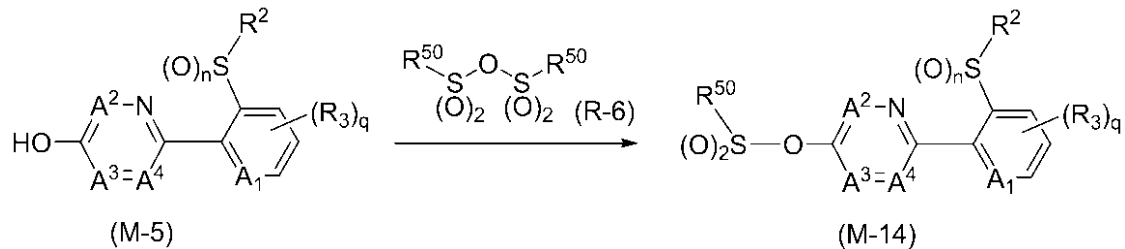
[式中、記号は前記と同じ意味を表す。]

化合物 (M - 1) は、化合物 (M - 9) に代えて (M - 1 3) を用い、参考製造法 3 に記載の化合物 (M - 1 1) を製造する方法に準じて製造することができる。

化合物 (M - 1 3) は、公知の方法に準じて製造することができる。

参考製造法 6

化合物 (M - 1 4) は、化合物 (M - 5) と式 (R - 6) で示される化合物 (以下、化合物 (R - 6)) とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。



20

[式中、記号は前記と同じ意味を表す。]

化合物 (R - 6) は、市販の化合物か、既知の方法を用いて製造することができる。

反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばエーテル類、芳香族炭化水素類、ニトリル類、非プロトン性極性溶媒、及びこれらの混合物が挙げられる。

30

反応に用いられる塩基としては、例えばジイソプロピルエチルアミン、2,6-ルチジン等有機塩基類、アルカリ金属水素化物類、及びアルカリ金属炭酸塩類が挙げられる。

反応には、化合物 (M - 5) 1 モルに対して、化合物 (R - 6) が通常 1 ~ 2 モルの割合、塩基が通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

反応温度は、通常 - 2 0 ~ 1 5 0 の範囲である。反応時間は通常 0 . 5 ~ 2 4 時間の範囲である。

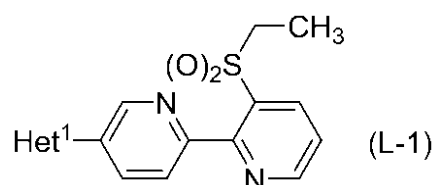
反応終了後は、反応混合物に水を加え、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M - 1 4) を得ることができる。

【 0 0 5 9 】

次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。

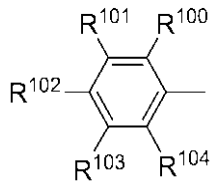
【 0 0 6 0 】

式 (L - 1)



で示される化合物 (以下、化合物 (L - 1) と記す。) において、H e t ¹ が H - 1

40



H-1

であり、 R^{100} 、 R^{101} 、 R^{102} 、 R^{103} 、及び R^{104} が、[表1]～[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX1と記す）。

【0061】

【表1】

R^{100}	R^{101}	R^{102}	R^{103}	R^{104}
H	CF_3	H	H	H
H	H	CF_3	H	H
H	OCF_3	H	H	H
H	H	OCF_3	H	H
H	SCF_3	H	H	H
H	$S(O)CF_3$	H	H	H
H	$S(O)_2CF_3$	H	H	H
H	H	SCF_3	H	H
H	H	$S(O)CF_3$	H	H
H	H	$S(O)_2CF_3$	H	H
H	$OS(O)_2CF_3$	H	H	H
H	H	$OS(O)_2CF_3$	H	H
H	CF_3	CF_3	H	H
H	CF_3	F	H	H
H	CF_3	Cl	H	H
H	CF_3	CN	H	H
H	CF_3	NO_2	H	H
H	CF_3	$COOCH_3$	H	H
H	CF_3	$N(CH_3)_2$	H	H

【0062】

10

20

30

【表 2】

R ¹⁰⁰	R ¹⁰¹	R ¹⁰²	R ¹⁰³	R ¹⁰⁴
H	CF ₃	H	CF ₃	H
H	CF ₃	H	F	H
H	CF ₃	H	Cl	H
H	CF ₃	H	CN	H
H	CF ₃	H	NO ₂	H
H	CF ₃	H	COOCH ₃	H
H	CF ₃	H	N(CH ₃) ₂	H
H	CF ₃	H	H	CF ₃
H	CF ₃	H	H	F
H	CF ₃	H	H	Cl
H	CF ₃	H	H	CN
H	CF ₃	H	H	NO ₂
H	CF ₃	H	H	COOCH ₃
H	CF ₃	H	H	N(CH ₃) ₂

10

20

【 0 0 6 3 】

【表 3】

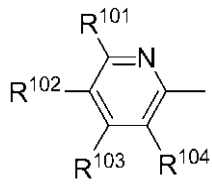
R ¹⁰⁰	R ¹⁰¹	R ¹⁰²	R ¹⁰³	R ¹⁰⁴
H	F	CF ₃	H	H
H	Cl	CF ₃	H	H
H	CN	CF ₃	H	H
H	NO ₂	CF ₃	H	H
H	COOCH ₃	CF ₃	H	H
H	N(CH ₃) ₂	CF ₃	H	H
CF ₃	H	CF ₃	H	H
F	H	CF ₃	H	H
Cl	H	CF ₃	H	H
CN	H	CF ₃	H	H
NO ₂	H	CF ₃	H	H
COOCH ₃	H	CF ₃	H	H
N(CH ₃) ₂	H	CF ₃	H	H
H	F	H	F	H
H	F	F	F	H
H	Cl	H	Cl	H
H	Cl	Cl	Cl	H

30

40

【 0 0 6 4 】

化合物 (L - 1) において、H e t¹が H - 2



H-2

であり、 R^{101} 、 R^{102} 、 R^{103} 、及び R^{104} が[表4]～[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX2と記す)。

【0065】

10

【表4】

R^{101}	R^{102}	R^{103}	R^{104}
CF_3	H	H	H
H	CF_3	H	H
H	H	CF_3	H
OCF_3	H	H	H
H	OCF_3	H	H
H	H	OCF_3	H
SCF_3	H	H	H
$S(O)CF_3$	H	H	H
$S(O)_2CF_3$	H	H	H
H	SCF_3	H	H
H	$S(O)CF_3$	H	H
H	$S(O)_2CF_3$	H	H
H	H	SCF_3	H
H	H	$S(O)CF_3$	H
H	H	$S(O)_2CF_3$	H
$OS(O)_2C$ F_3	H	H	H
H	$OS(O)_2C$ F_3	H	H
H	H	$OS(O)_2C$ F_3	H

20

30

【0066】

40

【表 5】

R ¹⁰¹	R ¹⁰²	R ¹⁰³	R ¹⁰⁴
CF ₃	CF ₃	H	H
CF ₃	F	H	H
CF ₃	Cl	H	H
CF ₃	CN	H	H
CF ₃	H	CF ₃	H
CF ₃	H	F	H
CF ₃	H	Cl	H
CF ₃	H	CN	H
H	CF ₃	CF ₃	H
H	CF ₃	F	H
H	CF ₃	Cl	H
H	CF ₃	CN	H
H	F	CF ₃	H
H	Cl	CF ₃	H
H	CN	CF ₃	H

10

20

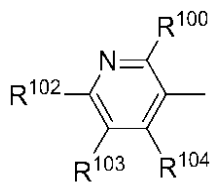
【 0 0 6 7 】

【表 6】

R ¹⁰¹	R ¹⁰²	R ¹⁰³	R ¹⁰⁴
F	CF ₃	H	H
Cl	CF ₃	H	H
CN	CF ₃	H	H
F	H	CF ₃	H
Cl	H	CF ₃	H
CN	H	CF ₃	H
F	H	F	H
F	F	F	H
Cl	H	Cl	H
Cl	Cl	Cl	H

30

【 0 0 6 8 】

化合物 (L - 1) において、Het¹がH - 3

H-3

40

であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表 7] ~ [表 8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX3と記す)。

【 0 0 6 9 】

【表 7】

R ¹⁰⁰	R ¹⁰²	R ¹⁰³	R ¹⁰⁴
H	CF ₃	H	H
H	OCF ₃	H	H
H	SCF ₃	H	H
H	S(O)CF ₃	H	H
H	S(O) ₂ CF ₃	H	H
H	OS(O) ₂ C F ₃	H	H
H	H	CF ₃	H
H	H	OCF ₃	H
H	H	SCF ₃	H
H	H	S(O)CF ₃	H
H	H	S(O) ₂ CF ₃	H
H	H	OS(O) ₂ C F ₃	H

10

20

【 0 0 7 0 】

【表 8】

R ¹⁰⁰	R ¹⁰²	R ¹⁰³	R ¹⁰⁴
H	Cl	CF ₃	H
H	Cl	OCF ₃	H
H	Cl	SCF ₃	H
H	Cl	S(O)CF ₃	H
H	Cl	S(O) ₂ CF ₃	H
H	Cl	OS(O) ₂ C F ₃	H
H	CF ₃	Cl	H
H	OCF ₃	Cl	H
H	SCF ₃	Cl	H
H	S(O)CF ₃	Cl	H
H	S(O) ₂ CF ₃	Cl	H
H	OS(O) ₂ C F ₃	Cl	H
H	F	H	H
H	H	F	H
H	F	F	H
H	Cl	H	H
H	H	Cl	H
H	Cl	Cl	H

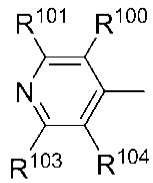
30

40

【 0 0 7 1 】

50

化合物 (L - 1) において、H e t¹が H - 4



H-4

であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が [表 9] に記載のいずれかの置換基である化合物 (以下、化合物群SX4と記す) 。

10

【 0 0 7 2 】

【 表 9 】

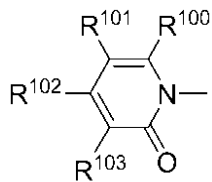
R ¹⁰⁰	R ¹⁰¹	R ¹⁰³	R ¹⁰⁴
H	CF ₃	H	H
H	OCF ₃	H	H
H	SCF ₃	H	H
H	S(O)CF ₃	H	H
H	S(O) ₂ CF ₃	H	H
H	OS(O) ₂ C F ₃	H	H
H	CF ₃	CF ₃	H
H	CF ₃	F	H
H	CF ₃	Cl	H
H	F	H	H
H	Cl	H	H
H	F	F	H
H	Cl	Cl	H

20

30

【 0 0 7 3 】

化合物 (L - 1) において、H e t¹が H - 5



H-5

であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が [表 1 0] ~ [表 1 1] に記載のいずれかの置換基である化合物 (以下、化合物群SX5と記す) 。

40

【 0 0 7 4 】

【表 10】

R ¹⁰⁰	R ¹⁰¹	R ¹⁰²	R ¹⁰³
H	CF ₃	H	H
H	OCF ₃	H	H
H	SCF ₃	H	H
H	S(O)CF ₃	H	H
H	S(O) ₂ CF ₃	H	H
H	OS(O) ₂ C F ₃	H	H
H	H	CF ₃	H
H	H	OCF ₃	H
H	H	SCF ₃	H
H	H	S(O)CF ₃	H
H	H	S(O) ₂ CF ₃	H
H	H	OS(O) ₂ C F ₃	H
H	H	H	CF ₃
H	H	H	OCF ₃
H	H	H	SCF ₃
H	H	H	S(O)CF ₃
H	H	H	S(O) ₂ CF ₃
H	H	H	OS(O) ₂ C F ₃

10

20

【 0 0 7 5 】

30

【表 1 1】

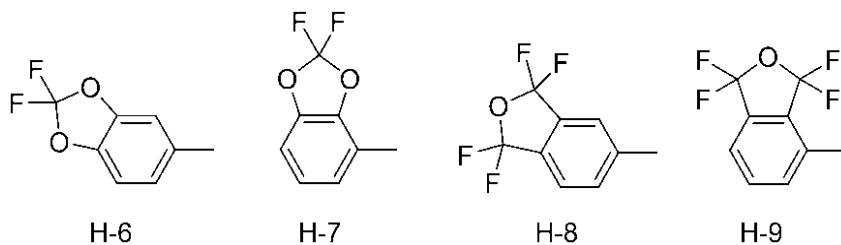
R ¹⁰⁰	R ¹⁰¹	R ¹⁰²	R ¹⁰³
H	CF ₃	CF ₃	H
H	CF ₃	H	CF ₃
H	CF ₃	F	H
H	CF ₃	Cl	H
H	CF ₃	H	F
H	CF ₃	H	Cl
H	H	CF ₃	CF ₃
H	H	CF ₃	F
H	H	CF ₃	Cl
H	F	CF ₃	H
H	Cl	CF ₃	H
H	F	H	CF ₃
H	Cl	H	CF ₃
H	H	F	CF ₃
H	H	Cl	CF ₃

10

20

【0076】

化合物(L-1)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物

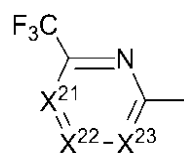


30

(以下、化合物群SX6と記す)。

【0077】

化合物(L-1)において、Het¹がH-10



H-10

40

であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]に記載のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX7と記す)。

【0078】

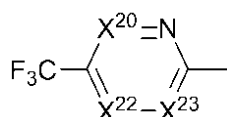
【表 1 2】

X ²¹	X ²²	X ²³
N	CH	CH
CH	N	CH
CH	CH	N
N	N	CH
CH	N	N
N	CH	N
N	N	N

10

【0079】

化合物(L-1)において、Het¹がH-11



H-11

20

であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX8と記す)。

【0080】

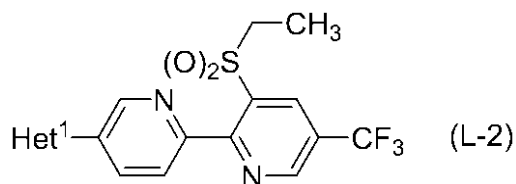
【表 1 3】

X ²⁰	X ²²	X ²³
N	CH	CH
CH	N	CH
CH	CH	N
N	N	CH
CH	N	N
N	CH	N
N	N	N

30

【0081】

式(L-2)



40

で示される化合物(以下、化合物(L-2)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX9と記す)。

化合物(L-2)において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が、[表4]~[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX10と記す)。

50

化合物(L-2)において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]~[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX11と記す)。

化合物(L-2)において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX12と記す)。

化合物(L-2)において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]~[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX13と記す)。

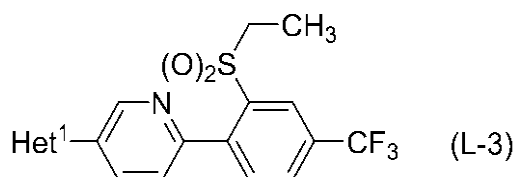
化合物(L-2)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物(以下、化合物群SX14と記す)。

化合物(L-2)において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX15と記す)。

化合物(L-2)において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX16と記す)。

【0082】

式(L-3)



で示される化合物(以下、化合物(L-3)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX17と記す)。

化合物(L-3)において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]~[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX18と記す)。

化合物(L-3)において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]~[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX19と記す)。

化合物(L-3)において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX20と記す)。

化合物(L-3)において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]~[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX21と記す)。

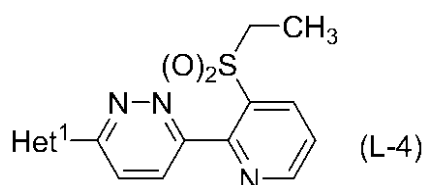
化合物(L-3)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物(以下、化合物群SX22と記す)。

化合物(L-3)において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX23と記す)。

化合物(L-3)において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX24と記す)。

【0083】

式(L-4)



で示される化合物(以下、化合物(L-4)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの

置換基である化合物（以下、化合物群SX25と記す）。

化合物（L - 4）において、Het¹がH - 2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]～[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX26と記す）。

化合物（L - 4）において、Het¹がH - 3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]～[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX27と記す）。

化合物（L - 4）において、Het¹がH - 4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX28と記す）。

化合物（L - 4）において、Het¹がH - 5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]～[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX29と記す）。

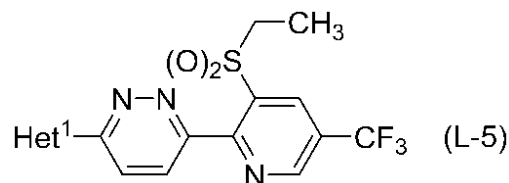
化合物（L - 4）において、Het¹がH - 6、H - 7、H - 8、又はH - 9のいずれかである化合物（以下、化合物群SX30と記す）。

化合物（L - 4）において、Het¹がH - 10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物（以下、化合物群SX31と記す）。

化合物（L - 4）において、Het¹がH - 11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物（以下、化合物群SX32と記す）。

【0084】

式（L - 5）



で示される化合物（以下、化合物（L - 5）と記す。）において、Het¹がH - 1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]～[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX33と記す）。

化合物（L - 5）において、Het¹がH - 2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]～[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX34と記す）。

化合物（L - 5）において、Het¹がH - 3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]～[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX35と記す）。

化合物（L - 5）において、Het¹がH - 4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX36と記す）。

化合物（L - 5）において、Het¹がH - 5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]～[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX37と記す）。

化合物（L - 5）において、Het¹がH - 6、H - 7、H - 8、又はH - 9のいずれかである化合物（以下、化合物群SX38と記す）。

化合物（L - 5）において、Het¹がH - 10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物である化合物（以下、化合物群SX39と記す）。

化合物（L - 5）において、Het¹がH - 11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物である化合物（以下、化合物群SX40と記す）。

【0085】

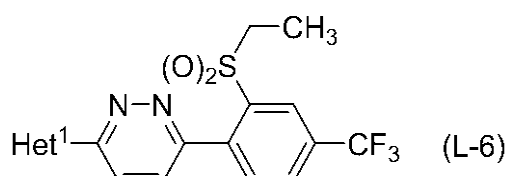
式（L - 6）

10

20

30

40



で示される化合物（以下、化合物（L-6）と記す。）において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]～[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX41と記す）。

化合物（L-6）において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]～[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX42と記す）。 10

化合物（L-6）において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]～[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX43と記す）。

化合物（L-6）において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX44と記す）。

化合物（L-6）において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]～[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX45と記す）。

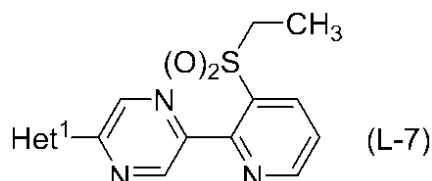
化合物（L-6）において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物である化合物（以下、化合物群SX46と記す）。 20

化合物（L-6）において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物（以下、化合物群SX47と記す）。

化合物（L-6）において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物（以下、化合物群SX48と記す）。

【0086】

式（L-7）



で示される化合物（以下、化合物（L-7）と記す。）において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]～[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX49と記す）。

化合物（L-7）において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]～[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX50と記す）。 30

化合物（L-7）において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]～[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX51と記す）。 40

化合物（L-7）において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX52と記す）。

化合物（L-7）において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]～[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物（以下、化合物群SX53と記す）。

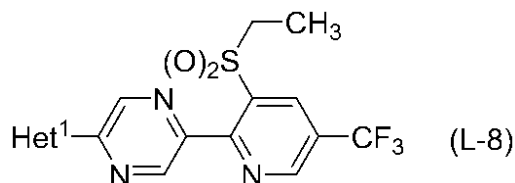
化合物（L-7）において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物である化合物（以下、化合物群SX54と記す）。

化合物（L-7）において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物（以下、化合物群SX55と記す）。 50

化合物 (L-7) において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX56と記す)。

【0087】

式(L-8)



で示される化合物(以下、化合物(L-8)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX57と記す)。

化合物(L-8)において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]~[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX58と記す)。

化合物(L-8)において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]~[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX59と記す)。

化合物(L-8)において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX60と記す)。

化合物(L-8)において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]~[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX61と記す)。

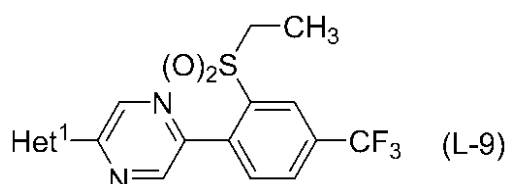
化合物(L-8)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物である化合物(以下、化合物群SX62と記す)。

化合物(L-8)において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX63と記す)。

化合物(L-8)において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX64と記す)。

【0088】

式(L-9)



で示される化合物(以下、化合物(L-9)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX65と記す)。

化合物(L-9)において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]~[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX66と記す)。

化合物(L-9)において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]~[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX67と記す)。

化合物(L-9)において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX68と記す)。

化合物(L-9)において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]~[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX69と記す)。

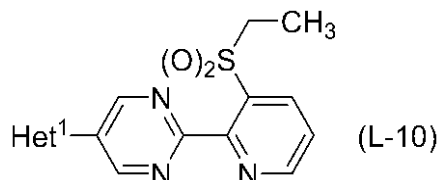
化合物(L-9)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物で(以下、化合物群SX70と記す)。

化合物(L-9)において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX71と記す)。

化合物(L-9)において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX72と記す)。

【0089】

式(L-10)



10

で示される化合物(以下、化合物(L-10)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX73と記す)。

化合物(L-10)において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]~[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX74と記す)。

化合物(L-10)において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]~[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX75と記す)。

20

化合物(L-10)において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX76と記す)。

化合物(L-10)において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]~[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX77と記す)。

化合物(L-10)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物である化合物(以下、化合物群SX78と記す)。

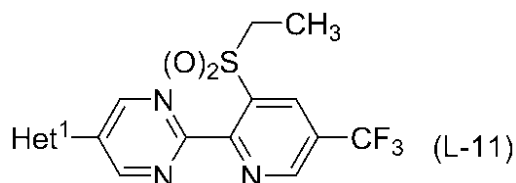
化合物(L-10)において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX79と記す)。

30

化合物(L-10)において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX80と記す)。

【0090】

式(L-11)



40

で示される化合物(以下、化合物(L-11)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX81と記す)。

化合物(L-11)において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]~[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX82と記す)。

化合物(L-11)において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]~[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX83と記す)。

化合物(L-11)において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR

50

¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX84と記す)。

化合物(L-11)において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]~[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX85と記す)。

化合物(L-11)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物である化合物(以下、化合物群SX86と記す)。

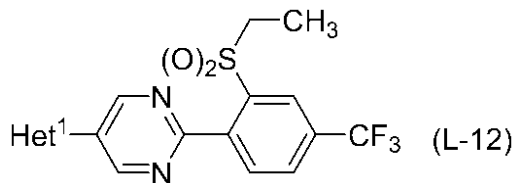
化合物(L-11)において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物である化合物(以下、化合物群SX87と記す)。

化合物(L-11)において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX88と記す)。

10

【0091】

式(L-12)



で示される化合物(以下、化合物(L-12)と記す。)において、Het¹がH-1であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表1]~[表3]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX89と記す)。

20

化合物(L-12)において、Het¹がH-2であり、R¹⁰¹、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表4]~[表6]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX90と記す)。

化合物(L-12)において、Het¹がH-3であり、R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表7]~[表8]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX91と記す)。

化合物(L-12)において、Het¹がH-4であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰³、及びR¹⁰⁴が[表9]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX92と記す)。

化合物(L-12)において、Het¹がH-5であり、R¹⁰⁰、R¹⁰¹、R¹⁰²、及びR¹⁰³が[表10]~[表11]に記載のいずれかの置換基である化合物(以下、化合物群SX93と記す)。

30

化合物(L-12)において、Het¹がH-6、H-7、H-8、又はH-9のいずれかである化合物である化合物(以下、化合物群SX94と記す)。

化合物(L-12)において、Het¹がH-10であり、X²¹、X²²、及びX²³が[表12]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX95と記す)。

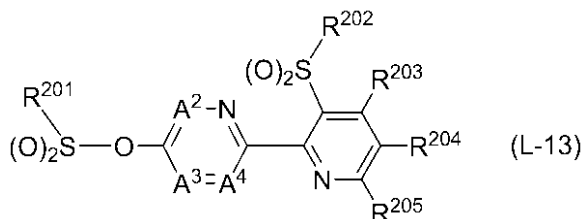
化合物(L-12)において、Het¹がH-11であり、X²⁰、X²²、及びX²³が[表13]のいずれかで示される化合物(以下、化合物群SX96と記す)。

【0092】

次に、製造中間体の具体例を以下に示す。

式(L-13)

40



で示される化合物において、A²、A³及びA⁴がCHであり、R²⁰¹、R²⁰²、R²⁰³、R²⁰⁴及びR²⁰⁵が[表14]~[表17]に記載のいずれかの置換基である化合物。

式(L-13)で示される化合物において、A²及びA⁴がCHであり、A³がC(CH₃)であり、R²⁰¹、R²⁰²、R²⁰³、R²⁰⁴及びR²⁰⁵が[表14]~[表17]に記載のい

50

ずれかの置換基である化合物。

式(L-13)で示される化合物において、 A^2 及び A^4 がCHであり、 A^3 がC(OC₃H₇)であり、 R^{201} 、 R^{202} 、 R^{203} 、 R^{204} 及び R^{205} が[表14]～[表17]に記載のいずれかの置換基である化合物。

式(L-13)で示される化合物において、 A^2 及び A^4 がCHであり、 A^3 がC(NO₂)であり、 R^{201} 、 R^{202} 、 R^{203} 、 R^{204} 及び R^{205} が[表14]～[表17]に記載のいずれかの置換基である化合物。

式(L-13)で示される化合物において、 A^2 が窒素原子、 A^3 及び A^4 がCHであり、 R^{201} 、 R^{202} 、 R^{203} 、 R^{204} 及び R^{205} が[表14]～[表17]に記載のいずれかの置換基である化合物。

式(L-13)で示される化合物において、 A^2 及び A^4 がCHであり、 A^3 が窒素原子であり、 R^{201} 、 R^{202} 、 R^{203} 、 R^{204} 及び R^{205} が[表14]～[表17]に記載のいずれかの置換基である化合物。

式(L-13)で示される化合物において、 A^2 及び A^3 がCHであり、 A^4 が窒素原子であり、 R^{201} 、 R^{202} 、 R^{203} 、 R^{204} 及び R^{205} が[表14]～[表17]に記載のいずれかの置換基である化合物。

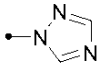
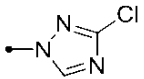
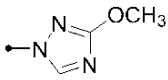
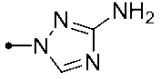
【0093】

【表14】

R^{201}	R^{202}	R^{203}	R^{204}	R^{205}
CF ₃	CH ₃	H	H	H
CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H
CF ₂ CF ₃	CH ₃	H	H	H
CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃	H	H	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃	H	H	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H

【0094】

【表15】

R^{201}	R^{202}	R^{203}	R^{204}	R^{205}
CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	NH ₂
CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	NHCH ₃
CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	N(CH ₃) ₂
CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	

【0095】

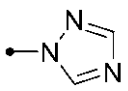
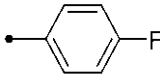
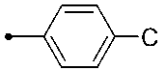
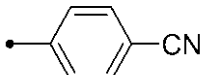
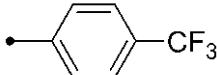
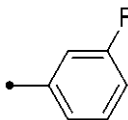
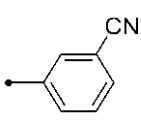
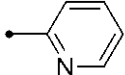
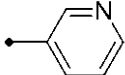
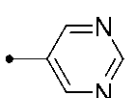
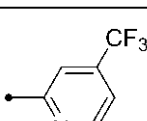
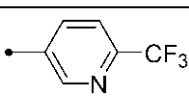
10

20

30

40

【表 16】

R ²⁰¹	R ²⁰²	R ²⁰³	R ²⁰⁴	R ²⁰⁵
CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H

10


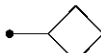
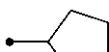
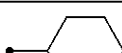


20

30

【0096】

40

【表 17】

R ²⁰¹	R ²⁰²	R ²⁰³	R ²⁰⁴	R ²⁰⁵
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH(CH ₃) ₂	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CF ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₂ H	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CF ₂ CF ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCF ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	OCF ₂ CF ₂ H	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	CF ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₂ H	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H		H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	NC 	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	F ₃ C 	H

10

20

30

【0097】

本発明化合物は、下記群（a）、群（b）、群（c）及び群（d）からなる群より選ばれる1以上の成分（以下、本成分と記す）と混用又は併用することができる。

前記混用又は併用とは、本発明化合物と本成分とを、同時に、別々に又は時間間隔をおいて使用することを意味する。

本発明化合物と本成分とを同時に使用する場合、本発明化合物及び本成分が、それぞれ別個の製剤に含まれていてもよく、1つの製剤に含まれていてもよい。

本発明の1つの側面は、群（a）、群（b）、群（c）及び群（d）からなる群より選ばれる1以上の成分（すなわち、本成分）、並びに本発明化合物を含有する組成物である。

【0098】

群（a）は、下記亜群 a - 1 乃至亜群 a - 10 からなる、殺虫活性成分、殺ダニ活性成分及び殺線虫活性成分の群である。

亜群 a - 1 : カーバメート系アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤

亜群 a - 2 : 有機リン系アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤

亜群 a - 3 : GABA 作動性塩素イオンチャネルブロッカー

40

50

- 亜群 a - 4 : G A B A 作動性塩素イオンチャンネルアロステリックモジュレーター
- 亜群 a - 5 : ナトリウムチャンネルモジュレーター
- 亜群 a - 6 : ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) 競合的モジュレーター
- 亜群 a - 7 : リアノジン受容体モジュレーター
- 亜群 a - 8 : 微生物資材
- 亜群 a - 9 : 殺線虫活性成分
- 亜群 a - 10 : その他の殺虫活性成分・殺ダニ活性成分

【 0 0 9 9 】

群 (b) は、下記亜群 b - 1 乃至亜群 b - 1 8 からなる、殺菌活性成分の群である。

- 亜群 b - 1 : P A 殺菌剤 (フェニルアミド) 10
- 亜群 b - 2 : M B C 殺菌剤 (メチルベンゾイミダゾールカーバメート)
- 亜群 b - 3 : チアゾールカルボキサミド
- 亜群 b - 4 : S D H I (コハク酸脱水素酵素阻害剤)
- 亜群 b - 5 : Q o I 殺菌剤 (Q o 阻害剤)
- 亜群 b - 6 : Q i I 殺菌剤 (Q i 阻害剤)
- 亜群 b - 7 : チオフェンカルボキサミド
- 亜群 b - 8 : A P 殺菌剤 (アニリノピリミジン)
- 亜群 b - 9 : P P 殺菌剤 (フェニルピロール)
- 亜群 b - 10 : A H 殺菌剤 (芳香族炭化水素)
- 亜群 b - 11 : D M I - 殺菌剤 (脱メチル化阻害剤) 20
- 亜群 b - 12 : C C A 殺菌剤 (カルボン酸アミド)
- 亜群 b - 13 : ピペリジニルチアゾールイソキサゾリン
- 亜群 b - 14 : テトラゾリルオキシム
- 亜群 b - 15 : ジチオカーバメート
- 亜群 b - 16 : フタルイミド
- 亜群 b - 17 : 微生物殺菌剤
- 亜群 b - 18 : その他の殺菌剤

【 0 1 0 0 】

群 (c) は、下記亜群 c - 1、亜群 c - 2 及び亜群 c - 3 からなる植物成長調整成分の群である。

- 亜群 c - 1 : 植物成長調整成分 30
- 亜群 c - 2 : 菌根菌
- 亜群 c - 3 : 根粒菌

【 0 1 0 1 】

群 (d) は、薬害軽減剤の群である。

【 0 1 0 2 】

前記本成分及び本発明化合物を含有する組成物は、前記組成物における、前記本成分又は前記本発明化合物の含有量又は含有率に応じて、前記組成物の効果が発現される。したがって、前記組成物が発現する効果に応じて、前記組成物の用途を決定することができる。前記組成物は 1 又は 2 以上の用途を有していてもよい。

前記組成物の 1 つの側面は農薬組成物である。

前記組成物の別の側面は有害節足動物防除組成物である。

前記組成物のまた別の側面は殺虫、殺ダニ又は殺線虫組成物である。

前記組成物のまた別の側面は殺菌組成物である。

前記組成物のまた別の側面は植物成長調整組成物である。

前記組成物の更にまた別の側面は薬害軽減組成物である。

【 0 1 0 3 】

以下に、本成分と本発明化合物の組合せの例を記載する。例えば、アラニカルブ (alanycarb) +SX はアラニカルブ (alanycarb) と SX との組合せを意味する。

なお、SX の略号は「化合物群 SX1 ~ SX96 から選ばれるいずれか 1 つの本発明化合物」を意

味する。また、以下に記載する本成分はいずれも公知の成分であり、市販の製剤から得るか、公知の方法により製造することができる。本成分が微生物の場合は、菌寄託機関から入手することもできる。なお、括弧内の数字はC A S登録番号を表す。

【 0 1 0 4 】

上記亜群 a - 1 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アラニカルブ (alanycarb) +SX、アルジカルブ (aldicarb) +SX、ベンダイオカルブ (bendiocarb) +SX、ベンフラカルブ (benfuracarb) +SX、プトカルボキシム (butocarboxim) +SX、プトキシカルボキシム (butoxycarboxim) +SX、カルバリル (carbaryl : NAC) +SX、カルボフラン (carbofuran) +SX、カルボスルファン (carbosulfan) +SX、エチオフエンカルブ (ethiofencarb) +SX、フェノブカルブ (fenobucarb : BPMC) +SX、ホルメタネート (formetanate) +SX、フラチオカルブ (furathiocarb) +SX、イソプロカルブ (isoproc carb : MIPC) +SX、メチオカルブ (methiocarb) +SX、メソミル (methomyl) +SX、メトルカルブ (metolcarb) +SX、オキサミル (oxamyl) +SX、ピリミカーブ (pirimicarb) +SX、プロポキスル (propoxur ; PHC) +SX、チオジカルブ (thiodicarb) +SX、チオフアノックス (thiofanox) +SX、トリアザメート (triazamate) +SX、トリメタカルブ (trimethacarb) +SX、XMC+SX、キシリルカルブ (xylylcarb) +SX。

10

【 0 1 0 5 】

上記亜群 a - 2 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アセフェート (acephate) +SX、アザメチホス (azamethiphos) +SX、アジンホスエチル (azinphos-ethyl) +SX、アジンホスメチル (azinphos-methyl) +SX、カズサホス (cadusafos) +SX、クロレトキシホス (chlorethoxyfos) +SX、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos) +SX、クロルメホス (chlormephos) +SX、クロルピリホス (chlorpyrifos) +SX、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl) +SX、クマホス (coumaphos) +SX、シアノホス (cyanophos : CYAP) +SX、デメトン - S - メチル (demeton-S-methyl) +SX、ダイアジノン (diazinon) +SX、ジクロルボス (dichlorvos : DDVP) +SX、ジクロトホス (dicrotophos) +SX、ジメトエート (dimethoate) +SX、ジメチルビンホス (dimethylvinphos) +SX、ジスルホトン (disulfoton) +SX、EPN+SX、エチオン (ethion) +SX、エトプロホス (ethoprophos) +SX、ファンフル (famphur) +SX、フェナミホス (fenamiphos) +SX、フェントロチオン (fenitrothion : MEP) +SX、フェンチオン (fenthion : MPP) +SX、ホスチアゼート (fosthiazate) +SX、ヘプテノホス (heptenophos) +SX、イミシアホス (imicyafos) +SX、イソフェンホス (isofenphos) +SX、イソプロピル - O - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチラート (isopropyl-O- (methoxyaminothiophosphoryl) salicylate) +SX、イソキサチオン (isoxathion) +SX、マラチオン (malathion) +SX、メカルバム (mecarbam) +SX、メタミドホス (methamidophos) +SX、メチダチオン (methidathion : DMTP) +SX、メビンホス (mevinphos) +SX、モノクロトホス (monocrotophos) +SX、ナレド (naled : BRP) +SX、オメトエート (omethoate) +SX、オキシジメトンメチル (oxydemeton-methyl) +SX、パラチオン (parathion) +SX、パラチオンメチル (parathion-methyl) +SX、フェントエート (phenthoate : PAP) +SX、ホレート (phorate) +SX、ホサロン (phosalone) +SX、ホスメット (phosmet : PMP) +SX、ホスファミドン (phosphamidon) +SX、ホキシム (phoxim) +SX、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl) +SX、プロフェノホス (profenofos) +SX、プロペタムホス (propetamphos) +SX、プロチオホス (prothiofos) +SX、ピラクロホス (pyraclofos) +SX、ピリダフェンチオン (pyridaphenthion) +SX、キナルホス (quinalphos) +SX、スルホテップ (sulfotep) +SX、テブピリムホス (tebupirimfos) +SX、テムホス (temephos) +SX、テルブホス (terbufos) +SX、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos) +SX、チオメトン (thiometon) +SX、トリアゾホス (triazophos) +SX、トリクロルホン (trichlorfon : DEP) +SX、バミドチオン (vamidothion) +SX。

20

30

40

【 0 1 0 6 】

上記亜群 a - 3 の本成分と本発明化合物との組合せ：

エチプロール (ethiprole) +SX、フィプロニル (fipronil) +SX、フルフィプロール (flufiprole) +SX、クロルデン (chlordane) +SX、エンドスルファン (endosulfan) +SX、

50

アルファエンドスルファン (alpha-endosulfan) +SX。

【 0 1 0 7 】

上記亜群 a - 4 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アフォキサネル (afoxolaner) +SX、フルララネル (fluralaner) +SX、プロフラニリド (broflanilide) +SX、フルキサメタミド (fluxametamide) +SX。

【 0 1 0 8 】

上記亜群 a - 5 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アクリナトリン (acrinathrin) +SX、アレスリン (allethrin) +SX、ビフェントリン (bifenthrin) +SX、カップ - ビフェントリン (kappa-bifenthrin) +SX、ピオアレスリン (bioallethrin) +SX、ピオレスメトリン (bioresmethrin) +SX、シクロプロトリン (cycloprothrin) +SX、シフルトリン (cyfluthrin) +SX、ベータ - シフルトリン (beta-cyfluthrin) +SX、シハロトリン (cyhalothrin) +SX、ガンマ - シハロトリン (gamma-cyhalothrin) +SX、ラムダ - シハロトリン (lambda-cyhalothrin) +SX、シペルメトリン (cypermethrin) +SX、アルファ - シペルメトリン (alpha-cypermethrin) +SX、ベータ - シペルメトリン (beta-cypermethrin) +SX、シータ - シペルメトリン (theta-cypermethrin) +SX、ゼータ - シペルメトリン (zeta-cypermethrin) +SX、シフェノトリン (cyphenothrin) +SX、デルタメトリン (deltamethrin) +SX、エンペントリン (empenthrin) +SX、エスフェンバレレート (esfenvalerate) +SX、エトフェンプロックス (etofenprox) +SX、フェンプロパトリン (fenpropathrin) +SX、フェンバレレート (fenvalerate) +SX、フルシトリネート (flucythrinate) +SX、フルメトリン (flumethrin) +SX、フルバリネート (fluvalinate) +SX、タウフルバリネート (tau-fluvalinate) +SX、ハルフェンプロックス (halfenprox) +SX、ヘプタフルトリン (heptafluthrin) +SX、イミプロトリン (imiprothrin) +SX、カデスリン (kadethrin) +SX、メペルフルトリン (mepherfluthrin) +SX、モンフルオロトリン (momfluorothrin) +SX、ペルメトリン (permethrin) +SX、フェノトリン (phenothrin) +SX、プラレトリン (prallethrin) +SX、ピレトリン (pyrethrins) +SX、レスメトリン (resmethrin) +SX、シラフルオフエン (silaflofen) +SX、テフルトリン (tefluthrin) +SX、カップテフルトリン (kappa-tefluthrin) +SX、テトラメトリン (tetramethrin) +SX、テトラメチルフルトリン (tetramethylfluthrin) +SX、トラロメトリン (tralomethrin) +SX、トランスフルトリン (transfluthrin) +SX、ベンフルトリン (benfluthrin) +SX、フルフェンプロックス (flufenoprox) +SX、フルメスリン (flumethrin) +SX、シグマ - シペルメトリン (sigma-cypermethrin) +SX、フラメトリン (furamethrin) +SX、メトフルトリン (metofluthrin) +SX、プロフルトリン (profluthrin) +SX、ジメフルトリン (dimefluthrin) +SX、イプシロン - メトフルトリン (epsilon-metofluthrin) +SX、イプシロン - モンフルオロトリン (epsilon-momfluorothrin) +SX、メトキシクロル (methoxychlor) +SX。

【 0 1 0 9 】

上記亜群 a - 6 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アセタミプリド (acetamiprid) +SX、クロチアニジン (clothianidin) +SX、ジノテフラン (dinotefuran) +SX、イミダクロプリド (imidacloprid) +SX、ニテンピラム (nitenpyram) +SX、チアクロプリド (thiacloprid) +SX、チアメトキサム (thiamethoxam) +SX、スルホキサフロル (sulfoxaflor) +SX、フルピラジフロン (flupyradifurone) +SX、トリフルメゾピリン (triflumezopyrim) +SX、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、シクロキサプリド (cycloxadiprid) +SX、(E) - N - { 1 - [(6 - クロロピリジン - 3 - イル) メチル] ピリジン - 2 (1 H) - イリデン } - 2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトアミド (1689566-03-7) +SX。

【 0 1 1 0 】

上記亜群 a - 7 の本成分と本発明化合物との組合せ：

クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole) +SX、シアントラニルプロール (cyantraniliprole) +SX、シクラニリプロール (cycloniliprole) +SX、フルベンジアミド (flubendiamide) +SX、テトラニリプロール (tetraniliprole) +SX、シハロジアミド (cyh

10

20

30

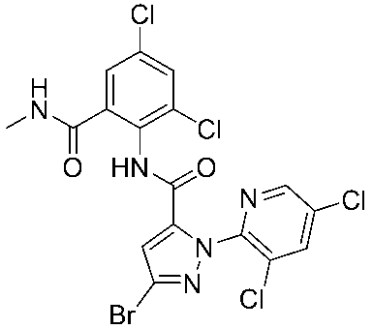
40

50

alodiamide)+SX、下記式

【0111】

【化1】



で示される化合物(1104384-14-6)+SX。

【0112】

上記亜群 a - 8 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ボーベリア・バシアーナ (*Beauveria bassiana*)+SX、ボーベリア・ブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*)+SX、ペキロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*)+SX、ペキロマイセス・リラシナス (*Paecilomyces lilacinus*)+SX、ペキロマイセス・テヌイペス (*Paecilomyces tenuipes*)+SX、バーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecani*)+SX、アルスロボトリス・ダクチロイデス (*Arthrobotrys dactyloides*)+SX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)+SX、バチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*)+SX、バチルス・メガテリウム (*Bacillus megaterium*)+SX、ヒルステラ・ロッシリエンシス (*Hirsutella rhossiliensis*)+SX、ヒルステラ・ミネソテンシス (*Hirsutella minnesotensis*)+SX、モナクロスボリウム・フィマトパガム (*Monacrosporium phymatopagus*)+SX、パストゥーリア・ニシザウエ (*Pasteuria nishizawae*)+SX、パストゥーリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)+SX、パストゥーリア・ウスガエ (*Pasteuria usgae*)+SX、バーティシリウム・クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*)+SX。

【0113】

上記亜群 a - 9 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アバメクチン (*abamectin*)+SX、フルアザインドリジン (*fluazaindolizine*)+SX、フルエンシルホン (*fluensulfone*)+SX、フルオピラム (*fluopyram*)、チオキサザフェン (*tioxazafen*)+SX。

【0114】

上記亜群 a - 10 の本成分と本発明化合物との組合せ：

スピネトラム (*spinetoram*)+SX、スピノサド (*spinosad*)+SX、エマメクチン安息香酸塩 (*emamectin-benzoate*)+SX、レピメクチン (*lepimectin*)+SX、ミルベメクチン (*milbemectin*)+SX、ヒドロプレレン (*hydroprene*)+SX、キノプレレン (*kinoprene*)+SX、メトプレレン (*methoprene*)+SX、フェノキシカルブ (*fenoxycarb*)+SX、ピリプロキシフェン (*pyriproxyfen*)+SX、臭化メチル (*methyl bromide*)+SX、クロルピクリン (*chloropicrin*)+SX、フッ化スルフルル (*sulfuryl fluoride*)+SX、弗化アルミニウムナトリウム (*sodium aluminium fluoride or chiolite*)+SX、ホウ砂 (*borax*)+SX、ホウ酸 (*boric acid*)+SX、八ホウ酸二ナトリウム (*disodium octaborate*)+SX、ホウ酸ナトリウム (*sodium borate*)+SX、メタホウ酸ナトリウム (*sodium metaborate*)+SX、吐酒石 (*tartar emetic*)+SX、ダゾメット (*dazomet*)+SX、メタム (*metam*)+SX、ピメトロジン (*pymetrozine*)+SX、ピリフルキナゾン (*pyrifluquinazone*)+SX、クロフェンテジン (*clofentezine*)+SX、ヘキシチアゾクス (*hexythiazox*)+SX、ジフロビダジン (*diflovidazin*)+SX、エトキサゾール (*etoxazole*)+SX、ジアフェンチウロン (*diafenthiuron*)+SX、アゾシクロチン (*azocyclotin*)+SX、シヘキサチン (*cyhexatin*)+SX、酸化フェンブタスズ (*fenbutatin oxide*)+SX、プロパルギット (*propargite*)+SX、テトラジホン (*tetradifon*)+SX、クロ

10

20

30

40

50

ルフェナピル (chlorfenapyr) +SX、DNOC+SX、スルフルラミド (sulfluramid) +SX、ベンスルタップ (bensultap) +SX、カルタップ (cartap) +SX、カルタップ塩酸塩 (cartap hydrochloride) +SX、チオシクラム (thiocyclam) +SX、チオスルタップ - 2 ナトリウム塩 (thiosultap-disodium) +SX、チオスルタップ - 1 ナトリウム塩 (thiosultap-monosodium) +SX、ピストリフルロン (bistrifluron) +SX、クロルフルアズロン (chlorfluazuron) +SX、ジフルベンズロン (diflubenzuron) +SX、フルアズロン (fluazuron) +SX、フルシクロクスロン (flucycloxuron) +SX、フルフェノクスロン (flufenoxuron) +SX、ヘキサフルムロン (hexaflumuron) +SX、ルフェヌロン (lufenuron) +SX、ノバルロン (novaluron) +SX、ノビフルムロン (noviflumuron) +SX、テフルベンズロン (teflubenzuron) +SX、トリフルムロン (triflumuron) +SX、ブプロフェジン (buprofezin) +SX、シロマジン (cyromazine) +SX、クロマフェノジド (chromafenozide) +SX、ハロフェノジド (halofenozide) +SX、メトキシフェノジド (methoxyfenozide) +SX、テブフェノジド (tebufenozide) +SX、アミトラズ (amitraz) +SX、ヒドラメチルノン (hydramethylnon) +SX、アセキノシル (acequinocyl) +SX、フルアクリピリム (fluacrypyrim) +SX、ピフェナゼート (bifenazate) +SX、フェナザキン (fenazaquin) +SX、フェンピロキシメート (fenpyroximate) +SX、ピリダベン (pyridaben) +SX、ピリミジフェン (pyrimidifen) +SX、テブフェンピラド (tebufenpyrad) +SX、トルフェンピラド (tolfenpyrad) +SX、ロテノン (rotenone) +SX、インドキサカルブ (indoxacarb) +SX、メタフルミゾン (metaflumizone) +SX、スピロジクロフェン (spirodiclofen) +SX、スピロメシフェン (spiromesifen) +SX、スピロテトラマト (spirotetramat) +SX、リン化アルミニウム (aluminium phosphide) +SX、リン化カルシウム (calcium phosphide) +SX、りん化水素 (phosphine) +SX、リン化亜鉛 (zinc phosphide) +SX、シアン化カルシウム (calcium cyanide) +SX、シアン化カリウム (potassium cyanide) +SX、シアン化ナトリウム (sodium cyanide) +SX、シエノピラフェン (cyenopyrafen) +SX、シフルメトフェン (cyflumetofen) +SX、ピフルブミド (pyflubumide) +SX、フロニカミド (flonicamid) +SX、アザジラクチン (azadirachtin) +SX、ベンゾキシメート (benzoximate) +SX、ブロモプロピレート (bromopropylate) +SX、キノメチオナート (chinomethionat) +SX、ジコホル (dicofol) +SX、ピリダリル (pyridalyl) +SX、石灰硫黄合剤 (lime sulfur) +SX、硫黄 (sulfur) +SX、マシン油 (machine oil) +SX、ニコチン (nicotine) +SX、硫酸ニコチン (nicotine-sulfate) +SX、アフィドピロペン (afidopyropen) +SX、フロメトキン (flometoquin) +SX、メトキサジアゾン (metoxadiazone) +SX、ピリミノストロビン (pyriminostrobin) +SX、N - [3 - クロロ - 1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - N - エチル - 3 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピルスルファニル) プロパンアミド (1477919-27-9) +SX、N - [3 - クロロ - 1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - N - エチル - 3 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロプロパンスルフィニル) プロパンアミド (1477919-27-9) +SX、5 - (1 , 3 - ジオキサン - 2 - イル) - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) ベンジルオキシ] ピリミジン (1449021-97-9) +SX。

【 0 1 1 5 】

上記亜群 b - 1 の本成分と本発明化合物との組合せ：

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

【 0 1 1 6 】

上記亜群 b - 2 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ベノミル (benomyl) +SX、カルベンダジム (carbendazim) +SX、フベリダゾール (fuberidazole) +SX、チアベンダゾール (thiabendazole) +SX、チオファネート (thiophanate) +SX、チオファネートメチル (thiophanate-methyl) +SX。

【 0 1 1 7 】

上記亜群 b - 3 の本成分と本発明化合物との組合せ：

エタボキサム (ethaboxam) +SX。

【 0 1 1 8 】

上記亜群 b - 4 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ベノダニル (benodanil) +SX、フルトラニル (flutolanil) +SX、メプロニル (mepronil) +SX、イソフェタミド (isofetamid) +SX、フェンフラム (fenfuram) +SX、カルボキシ
ン (carboxin) +SX、オキシカルボキシ (oxycarboxin) +SX、チフルザミド (thi fluzam
ide) +SX、ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr) +SX、ビキサフェン (bixafen) +S
X、フルキサピロキサド (fluxapyroxad) +SX、フラメトピル (furametpyr) +SX、イソピ
ラザム (isopyrazam) +SX、ペンフルフェン (penflufen) +SX、ペンチオピラド (penthi
opyrad) +SX、セダキサ (sedaxane) +SX、ピジフルメトフェン (pydiflumetofen) +SX、
ボスカリド (boscalid) +SX、ピラジフルミド (pyraziflumid) +SX、3 - ジフルオロメチ
ル - N - メトキシ - 1 - メチル - N - [(1 R) - 1 - メチル - 2 - (2 , 4 , 6 - トリ
クロロフェニル) エチル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (1639015-48-7) +SX、3 -
ジフルオロメチル - N - メトキシ - 1 - メチル - N - [(1 S) - 1 - メチル - 2 - (2
 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) エチル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (1639015-49
-8) +SX、N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 -
クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサ
ミド (1255734-28-1) +SX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - ト
リメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド (141573-94-6) +SX、3
 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン -
4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (1352994-67-2) +SX、3 - ジフルオロメチ
ル - N - (7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) - 1 - メチルピ
ラゾール - 4 - カルボキサミド (1383809-87-7) +SX、3 - ジフルオロメチル - N - [(3
 R) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] - 1 - メチルピラ
ゾール - 4 - カルボキサミド (1513466-73-3) +SX。

10

20

【 0 1 1 9 】

上記亜群 b - 5 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アゾキシストロビン (azoxystrobin) +SX、クモキシストロビン (coumoxystrobin) +SX
、エノキサストロビン (enoxastrobin) +SX、フルフェノキシストロビン (flufenoxystro
bin) +SX、ピコキシストロビン (picoxystrobin) +SX、ピラオキシストロビン (pyraoxys
trobin) +SX、マンデストロビン (mandestrobin) +SX、ピラクロストロビン (pyraclostr
obin) +SX、ピラメトストロビン (pyrametostrobin) +SX、トリクロピリカルブ (triclop
yricarb) +SX、クレソキシム - メチル (kresoxim-methyl) +SX、トリフロキシストロビン
 (trifloxystrobin) +SX、ジモキシストロビン (dimoxystrobin) +SX、フェナミンストロ
ビン (fenaminstrobin) +SX、メトミノストロビン (metominostrobin) +SX、オリサスト
ロビン (orysastrobin) +SX、ファミキサドン (famoxadone) +SX、フルオキサストロビン
 (fluoxastrobin) +SX、フェンアミドン (fenamidone) +SX、ピリベンカルブ (pyribenca
rb) +SX。

30

【 0 1 2 0 】

上記亜群 b - 6 の本成分と本発明化合物との組合せ：

シアゾファミド (cyazofamid) +SX、アミスルブロム (amisulbrom) +SX、ピナパクリル
 (binapacryl) +SX、メプチルジノカップ (meptyldinocap) +SX、ジノカップ (dinocap)
+SX、フルアジナム (fluazinam) +SX。

40

【 0 1 2 1 】

上記亜群 b - 7 の本成分と本発明化合物との組合せ：

シルチオフアム (silthiofam) +SX。

【 0 1 2 2 】

上記亜群 b - 8 の本成分と本発明化合物との組合せ：

シプロジニル (cyprodinil) +SX、メパニピリム (mepanipirim) +SX、ピリメタニル (p
yrimethanil) +SX。

【 0 1 2 3 】

50

上記亜群 b - 9 の本成分と本発明化合物との組合せ：

フェンピクロニル (fenpiclonil) +SX、フルジオキシニル (fludioxonil) +SX。

【 0 1 2 4 】

上記亜群 b - 1 0 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ビフェニル (biphenyl) +SX、クロロネブ (chloroneb) +SX、ジクロラン (dicloran) +SX、キントゼン (quintozene) +SX、テクナゼン (tecnazene) +SX、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl) +SX。

【 0 1 2 5 】

上記亜群 b - 1 1 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アザコナゾール (azaconazole) +SX、ビテルタノール (bitertanol) +SX、ブロムコナゾール (bromuconazole) +SX、シプロコナゾール (cyproconazole) +SX、ジフェノコナゾール (difenoconazole) +SX、ジニコナゾール (diniconazole) +SX、ジニコナゾールM (diniconazole - M) +SX、エポキシコナゾール (epoxiconazole) +SX、エタコナゾール (etaconazole) +SX、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole) +SX、フルシラゾール (flusilazole) +SX、フルトリアホル (flutriafol) +SX、ヘキサコナゾール (hexaconazole) +SX、イミベンコナゾール (imibenconazole) +SX、イブコナゾール (ipconazole) +SX、イプフェントリフルコナゾール (ipfentrifluconazole) +SX、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole) +SX、メトコナゾール (metconazole) +SX、ミクロブタニル (myclobutanil) +SX、ペンコナゾール (penconazole) +SX、プロピコナゾール (propiconazole) +SX、シメコナゾール (simeconazole) +SX、テブコナゾール (tebuconazole) +SX、テトラコナゾール (tetraconazole) +SX、トリアジメホン (triadimefon) +SX、トリアジメノール (triadimenol) +SX、トリチコナゾール (triticonazole) +SX、プロチオコナゾール (prothioconazole) +SX、トリホリン (triforine) +SX、ピリフェノックス (pyrifenox) +SX、ピリソキサゾール (pyrisoxazole) +SX、フェナリモル (fenarimol) +SX、ヌアリモール (nuarimol) +SX、イマザリル (imazalil) +SX、オキスポコナゾール (oxpoconazole) +SX、オキスポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate) +SX、ペフラゾエート (pefurazoate) +SX、プロクロラズ (prochloraz) +SX、トリフルミゾール (triflumizole) +SX。

【 0 1 2 6 】

上記亜群 b - 1 2 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ジメトモルフ (dimethomorph) +SX、フルモルフ (flumorph) +SX、ピリモルフ (pyrimorph) +SX、ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb) +SX、ベンチアバリカルブイソプロピル (benthivalicarb-isopropyl) +SX、イプロバリカルブ (iprovalicarb) +SX、バリフェナレート (valifenalate) +SX、マンジプロパミド (mandipropamid) +SX。

【 0 1 2 7 】

上記亜群 b - 1 3 の本成分と本発明化合物との組合せ：

オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin) +SX。

【 0 1 2 8 】

上記亜群 b - 1 4 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ピカルブトラゾクス (picarbutrazox) +SX。

【 0 1 2 9 】

上記亜群 b - 1 5 の本成分と本発明化合物との組合せ：

フェルバム (ferbam) +SX、マンコゼブ (mancozeb) +SX、マンネブ (maneb) +SX、メチラム (metiram) +SX、プロピネブ (propineb) +SX、チウラム (thiram) +SX、ジネブ (zineb) +SX、ジラム (ziram) +SX。

【 0 1 3 0 】

上記亜群 b - 1 6 の本成分と本発明化合物との組合せ：

キャプタン (captan) +SX、キャプタホル (captafol) +SX、ホルペット (folpet) +SX。

【 0 1 3 1 】

10

20

30

40

50

上記亜群 b - 17 の本成分と本発明化合物との組合せ：

アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobactor、ストレイン 84 (strain84) 等)+SX、バチルス・アミロリクエファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens)+SX、バチルス・アミロリクエファシエンスQST713株+SX、バチルス・アミロリクエファシエンスFZB24株+SX、バチルス・アミロリクエファシエンスMB1600株+SX、バチルス・アミロリクエファシエンスD747株+SX、バチルス・アミロリクエファシエンスAT332株+SX、バチルス・アミロリクエファシエンスPTA4838株+SX、バチルス・プミルス (Bacillus pumilus)+SX、バチルス・シンプレクス (Bacillus simplex、CGF2856株等)+SX、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis)+SX、バチルス・ズブチリスQST713株+SX、バチルス・ズブチリスHAI0404株+SX、バチルス・ズブチリスY1336株+SX、バリオボラックス・パラドクス (Variovorax paradoxus、CGF4526株等)+SX、エルビニア・カロトボラ (Erwinia carotovora、CGE234M403株等)+SX、シュードモナス・フルオレッセンス (Pseudomonas fluorescens、G7090株等)+SX、タラロマイセス・フラバス (Talaromyces flavus、SA Y-Y-94-01株等)+SX、トリコデルマ・アトロピリデ (Trichoderma atroviride、SKT-1株等)+SX、トリコデルマ・ハルジアナム (Trichoderma harzianum)+SX、ハーピンタンパク (Harpin protein)+SX。

【 0 1 3 2 】

上記亜群 b - 18 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ブピリメート (bupirimate)+SX、ジメチリモール (dimethirimol)+SX、エチリモール (ethirimol)+SX、ヒメキサゾール (hymexazole)+SX、オクチリノン (octhilinone)+SX、オキシリニック酸 (oxolinic acid)+SX、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)+SX、ゾキサミド (zoxamide)+SX、ペンシクロン (pencycuron)+SX、フルオピコリド (flupicolide)+SX、フェナマクリル (phenamacril)+SX、ジフルメトリム (diflumerimol)+SX、トルフェンピラド (tolfenpyrad)+SX、酢酸トリフェニル錫 (fentin acetate)+SX、塩化トリフェニル錫 (fentin chloride)+SX、水酸化トリフェニル錫 (fentin hydroxide)+SX、アメトクトラジン (ametoctradin)+SX、ブラストサイジンS (blasticidin-S)+SX、カスガマイシン (kasugamycin)+SX、ストレプトマイシン (streptomycin)+SX、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)+SX、キノキシフェン (quinoxifen)+SX、プロキナジド (proquinazid)+SX、クロゾリネート (chlorzoxin)+SX、ジメタクロン (dimethachlone)+SX、イプロジオン (iprodison)+SX、プロシミドン (procymidone)+SX、ビクロゾリン (vinclozolin)+SX、エジフェンホス (edifenphos)+SX、イプロベンホス (iprobenfos)+SX、ピラゾホス (pyrazophos)+SX、イソプロチオラン (isoprothiolane)+SX、エトリジアゾール (etridiazole)+SX、ヨードカルブ (iodocarb)+SX、プロパモカルブ (propamocarb)+SX、プロチオカルブ (prothiocarb)+SX、アルジモルフ (aldimorph)+SX、ドデモルフ (dodemorph)+SX、フェンプロピジン (fenpropidin)+SX、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)+SX、ピペラリン (piperalin)+SX、スピロキサミン (spiroxamine)+SX、トリデモルフ (tridemorph)+SX、フェンヘキサミド (fenhexamid)+SX、フェンピラザミン (fenpyrazamine)+SX、ピリブチカルブ (pyributicarb)+SX、ナフチフィン (naftifine)+SX、テルビナフィン (terbinafine)+SX、ポリオキシシン (polyoxins)+SX、フサライド (phthalide)+SX、ピロキロン (pyroquilon)+SX、トリシクラゾール (tricyclazole)+SX、カルプロパミド (carpropamid)+SX、ジクロシメット (diclocymet)+SX、フェノキサニル (fenoxanil)+SX、トルプロカルブ (tolprocarb)+SX、アシベンゾラルSメチル (acibenzolar-S-methyl)+SX、プロベナゾール (probenazole)+SX、チアジニル (tiadinil)+SX、イソチアニル (isotianil)+SX、ラミナリン (laminarin)+SX、シモキサニル (cymoxanil)+SX、ホセチル (fosetyl)+SX、テクロフタラム (teclofthalam)+SX、トリアゾキシド (triazoxide)+SX、フルスルファミド (flusulfamid)+SX、ジクロメジン (diclomezine)+SX、メタスルホカルブ (methasulfocarb)+SX、シフルフェナミド (cyflufenamid)+SX、メトラフェノン (metrafenone)+SX、ピリオフェノン (pyriofenone)+SX、ドジン (dodine)+SX、フルチアニル (flutianil)+SX、フェリムゾン (ferimzone)+SX、テブフロキン (tebufloquin)+SX、バリダマイシン (va

10

20

30

40

50

lidamycin)+SX、塩基性塩化銅+SX、水酸化第二銅+SX、塩基性硫酸銅+SX、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 [11] (Dodecylbenzenesulphonic acid bis ethylenediamine copper [11] salt, DBEDC)+SX、有機銅+SX、硫黄 (sulfur)+SX、クロロタロニル (chlorothalonil)+SX、ジクロフルアニド (dichlofluanid)+SX、トリルフルアニド (tolylfluanid)+SX、グアザチン (guazatine)+SX、イミノクタジン (iminoctadine)+SX、アニラジン (anilazine)+SX、ジチアノン (dithianon)+SX、キノメチオナート (chinomethionat)+SX、フルオルイミド (fluoroimide)+SX、ジピメティロン (dipymetitrone)+SX、キノフメリン (quinofumelin)+SX、ジクロベンチアゾクス (dichlobentiazox)+SX、3-クロロ-5-フェニル-6-メチル-4-(2,6-ジフルオロフェニル)ピリダジン (1358061-55-8)+SX、フェンピコキサミド (fempicoxamid)+SX、N'-[4-({ 3-[(4-クロロフェニル)メチル] - 1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル } オキシ) - 2, 5-ジメチルフェニル] - N-エチル - N-メチルメタンイミドアミド (1202781-91-6)+SX、2-{ 3-[2-(1-{ [3, 5-ビス(ジフルオロメチル) - 1H-ピラゾール-1-イル] アセチル } ピペリジン-4-イル) - 1, 3-チアゾール-4-イル] - 4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-5-イル} - 3-クロロフェニル = メタンスルホナート (1360819-11-9)+SX、4-(2-プロモ-4-フルオロフェニル) - N-(2-クロロ-6-フルオロフェニル) - 1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン (1362477-26-6)+SX、2, 2-ジメチル-9-フルオロ-5-(キノリン-3-イル) - 2, 3-ジヒドロベンゾ [f] [1, 4] オキサゼピン (1207749-50-5)+SX、2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル) - 5-メチルピリジン-2-イル] キナゾリン (1257056-97-5)+SX、5-フルオロ-2-[(4-メチルフェニル)メトキシ] - 4-ピリミジンアミン (1174376-25-0)+SX、5-フルオロ-4-イミノ-3-メチル-1-トシル-3, 4-ジヒドロピリミジン-2(1H)-オン (1616664-98-2)+SX、N'-(2, 5-ジメチル-4-フェノキシフェニル) - N-エチル - N-メチルメタンイミドアミド (1052688-31-9)+SX、N'-{ 4-[(4, 5-ジクロロチアゾール-2-イル) オキシ] - 2, 5-ジメチルフェニル } - N-エチル - N-メチルメタンイミドアミド (929908-57-6)+SX、(2Z) - 3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチル (39491-78-6)+SX、N-[(2-クロロチアゾール-5-イル)メチル] - N-エチル-6-メトキシ-3-ニトロピリジン-2-アミン (1446247-98-8)+SX、1-[2-({ [1-(4-クロロフェニル) - 1H-ピラゾール-3-イル] オキシ } メチル) - 3-メチルフェニル] - 4-メチル-5-オキソ-4, 5-ジヒドロ-1H-テトラゾール (1472649-01-6)+SX。

【 0 1 3 3 】

上記亜群 c - 1 の本成分と本発明化合物との組合せ：

エテホン (ethephon)+SX、クロルメコート (chlormequat)+SX、クロルメコートクロリド (chlormequat-chloride)+SX、メピコート (mepiquat)+SX、メピコートクロリド (mepiquat-chloride)+SX、ジベレリン A 3 (Gibberellin A3)+SX、アブシシン酸 (abscisic acid)+SX、カイネチン (Kinetin)+SX、ベンジルアデニン (benzyladenine)+SX、ホルクロルフエヌロン (forchlorfenuron)+SX、チジアズロン (thidiazuron)+SX。

【 0 1 3 4 】

上記亜群 c - 2 の本成分と本発明化合物との組合せ：

グロマス属菌 (Glomus spp.)+SX、グロマス・イントララディセス (Glomus intraradices)+SX、グロマス・モッセ (Glomus mosseae)+SX、グロマス・アグリゲイツム (Glomus aggregatum)+SX、グロマス・エツニカツム (Glomus etunicatum)+SX。

【 0 1 3 5 】

上記亜群 c - 3 の本成分と本発明化合物との組合せ：

ブラディリゾビウム・エルカニ (Bradyrhizobium elkani)+SX、ブラディリゾビウム・ジャポニカム (Bradyrhizobium japonicum)+SX、ブラディリゾビウム・ルピニ (Bradyrhizobium lupini)+SX、リゾビウム・レグミノサルム bv. トリフォリ (Rhizobium leguminosarum bv. trifolii)+SX、リゾビウム・レグミノサルム bv. ファゼオリ (Rhizobium

10

20

30

40

50

leguminosarum bv. phaseoli)+SX、リゾビウム・レグミノサルム bv.ピシアエ (Rhizobium leguminosarum bv. viciae)+SX、シノリゾビウム・メリロティ (Sinorhizobium meliloti)+SX、リゾビウム属菌 (Rhizobium spp.)+SX。

【0136】

上記群(d)の本成分と本発明化合物との組合せ：

ベノキサコール (benoxacor)+SX、クロキントセットメキシル (cloquintocet-mexyl)+SX、シオメトリニル (cyometrinil)+SX、ジクロルミド (dichlormid)+SX、フェンクロラゾールエチル (fenchlorazole-ethyl)+SX、フェンクロリム (fencloirim)+SX、フルラゾール (flurazole)+SX、フリラゾール (furilazole)+SX、メフェンピルジエチル (mefenpyr-diethyl)+SX、MG191 (2-(dichloromethyl)-2-methyl-1,3-dioxolane)+SX、オキサベトリニル (oxabetrinil)+SX、アリドクロール (allidochlor)+SX、イソキサジフェンエチル (isoxadifen-ethyl)+SX、シプロスルファミド (cyprosulfamide)+SX、フルクソフェニム (fluxofenim)+SX、1,8-ナフタル酸無水物 (1,8-naphthalic anhydride)+SX、AD-67 (4-(dichloroacetyl)-1-oxa-4-azaspiro [4.5] decane)+SX。

【0137】

本発明化合物が効力を有する有害節足動物としては、例えば、有害昆虫類や有害ダニ類等が挙げられる。かかる有害節足動物としては、具体的には例えば、以下のものが挙げられる。

【0138】

半翅目害虫 (Hemiptera)：ヒメトビウンカ (Laodelphax striatellus)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens)、セジロウンカ (Sogatella furcifera)、トウモロコシウンカ (Peregrinus maidis)、キタウンカ (Javesella pellucida)、クロフツノウカ (Perkinsiella saccharicida)、Tagosodes orizicolus等のウンカ科 (Delphacidae)；ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps)、タイワンツマグロヨコバイ (Nephotettix virescens)、クロスジツマグロヨコバイ (Nephotettix nigropictus)、イナズマヨコバイ (Recilia dorsalis)、チャノミドリヒメヨコバイ (Empoasca onukii)、ジャガイモヒメヨコバイ (Empoasca fabae)、コーンリーフホッパー (Dalbulus maidis)、シロオオヨコバイ (Cofana spectra)等のヨコバイ科 (Cicadellidae)；Mahanarva posticata、Mahanarva fimbriolata等のコガシラアワフキムシ科 (Cercopidae)；マメクロアブラムシ (Aphis fabae)、ダイズアブラムシ (Aphis glycines)、ワタアブラムシ (Aphis gossypii)、ヨーロッパリンゴアブラムシ (Aphis pomi)、ユキヤナギアブラムシ (Aphis spiraeicola)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)、ムギワラギクオマルアブラムシ (Brachycaudus helichrysi)、ダイコンアブラムシ (Brevicoryne brassicae)、Rosy apple aphid (Dysaphis plantaginea)、ニセダイコンアブラムシ (Lipaphis erysimi)、チューリップヒゲナガアブラムシ (Macrosiphum euphorbiae)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (Aulacorthum solani)、レタスヒゲナガアブラムシ (Nasonovia ribisnigri)、ムギクビレアブラムシ (Rhopalosiphum padi)、トウモロコシアブラムシ (Rhopalosiphum maidis)、ミカンクロアブラムシ (Toxoptera citricidus)、モモコフキアブラムシ (Hyalopterus pruni)、ヒエノアブラムシ (Melanaphis sacchari)、オカボノクロアブラムシ (Tetraneura nigriabdominalis)、カンシャワタアブラムシ (Ceratovacuna lanigera)、リンゴワタムシ (Eriosoma lanigerum)等のアブラムシ科 (Aphididae)；ブドウネアブラムシ (Daktulosphaira vitifoliae)、Pecan phylloxera (Phylloxera devastatrix)、Pecan leaf phylloxera (Phylloxera notabilis)、Southern pecan leaf phylloxera (Phylloxera russellae)等のネアブラムシ科 (Phylloxeridae)；ツガカサアブラムシ (Adelges tsugae)、Adelges piceae、ヒメカサアブラムシ (Aphrastasia pectinatae)等のカサアブラムシ科 (Adelgidae)；イネクロカメムシ (Scotinophara lurida)、Malayan rice black bug (Scotinophara coarctata)、アオクサカメムシ (Nezara antennata)、トゲシラホシカメムシ (Eysarcoris aeneus)、オオトゲシラホシカメムシ (Eysarcoris lewisi)、シラホシカメムシ (Eysarcoris ventralis)、ムラサキシラホシカメムシ (Eysarcoris annamita)、クサギカメムシ (Halyomorpha halys)、ミナミアオカ

10

20

30

40

50

メムシ (*Nezara viridula*)、Brown stink bug (*Euschistus heros*)、Red banded stink bug (*Piezodorus guildinii*)、*Oebalus pugnax*、*Dichelops melacanthus*等のカメムシ科 (*Pentatomidae*) ; Burrower brown bug (*Scaptocoris castanea*) 等のツチカメムシ科 (*Cydnidae*) ; ホソヘリカメムシ (*Riptortus pedestris*)、クモヘリカメムシ (*Leptocoris chinensis*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocoris acuta*) 等のホソヘリカメムシ科 (*Alydidae*) ; ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、アシビロヘリカメムシ (*Leptoglossus australis*) 等のヘリカメムシ科 (*Coreidae*) ; カンシャコバネナガカメムシ (*Caverellus saccharivorus*)、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、アメリカコバネナガカメムシ (*Blissus leucopterus*) 等のナガカメムシ科 (*Lygaeidae*) ; アカヒゲホソミドリカスミカメ (*Trigonotylus caelestialium*)、アカスジカスミカメ (*Stenotus rubrovittatus*)、フタトゲムギカスミカメ (*Stenodema calcarata*)、サビイロカスミカメ (*Lygus lineolaris*) 等のカスミカメムシ科 (*Miridae*) ; オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、チャトゲコナジラミ (*Aleurocanthus camelliae*)、ヒサカキワタフキコナジラミ (*Petalium euryae*) 等のコナジラミ科 (*Aleyrodidae*) ; シュロマルカイガラムシ (*Abgrallaspis cyanophylli*)、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、ナシマルカイガラムシ (*Diaspidiotus perniciosus*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、ニセヤノネカイガラムシ (*Unaspis citri*)、等のマルカイガラムシ科 (*Diaspididae*) ; ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*) 等のカタカイガラムシ科 (*Coccidae*) ; イセリアカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、キイロワタフキカイガラムシ (*Icerya seychellarum*) 等のワタフキカイガラムシ科 (*Margarodidae*) ; ナスコナガイガラムシ (*Phenacoccus solani*)、クロテンコナカイガラムシ (*Phenacoccus solenopsis*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、ガハニコナカイガラムシ (*Pseudococcus calceolariae*)、ナガオコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinus*)、タトルミーリーバグ (*Brevinnia rehi*) 等のコナカイガラムシ科 (*Pseudococcidae*) ; ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ミカントガリキジラミ (*Trioza erytrae*)、ナシキジラミ (*Cacopsylla pyrisuga*)、チュウゴクナシキジラミ (*Cacopsylla chinensis*)、ジャガイモトガリキジラミ (*Bactericera cockerelli*)、Pear psylla (*Cacopsylla pyricola*) 等のキジラミ科 (*Psyllidae*) ; プラタナスグンバイ (*Corythucha ciliata*)、アワダチソウグンバイ (*Corythucha marmorata*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*) 等のグンバイムシ科 (*Tingidae*) ; トコジラミ (*Cimex lectularius*) 等のトコジラミ科 (*Cimicidae*) 及び Giant Cicada (*Quesada gigas*) 等のセミ科 (*Cicadidae*)。

【 0 1 3 9 】

鱗翅目害虫 (*Lepidoptera*) : ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、Darkheaded stem borer (*Chilo polychrysus*)、White stem borer (*Scirpophaga innotata*)、イッテンオオメイガ (*Scirpophaga incertulas*)、*Rupela albina*、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、*Marasmia patnalis*、イネハカジノメイガ (*Marasmia exigua*)、ワタノメイガ (*Notarcha derogata*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、European corn borer (*Ostrinia nubilalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellicula undalis*)、モンキクロノメイガ (*Herpetogramma luctuosale*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*)、ライスケー スワーム (*Nymphula depunctalis*)、Sugarcane borer (*Diatraea saccharalis*) 等のツトガ科 (*Crambidae*) ; モロコシマダラメイガ (*Elasmopalpus lignosellus*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*) 等のメイガ科 (*Pyrallidae*) ; ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Mythimna separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、シロナヨトウ (*Spodoptera mauritia*)、フタオビコヤガ (*Naranga aenescens*)、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*)、アフリカシロナヨトウ (*Spodoptera exempta*)

、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、タマナギンウワバ (*Autographa nigrisigna*)、イネキンウワバ (*Plusia festucae*)、Soybean looper (*Chrysodeixis includens*)、トリコプルシア属 (*Trichoplusia* spp.)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) 等のヘリオティス属 (*Heliothis* spp.)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 等のヘリコベルバ属 (*Helicoverpa* spp.)、Velvetbean caterpillar (*Anticarsia gemmatalis*)、Cotton leafworm (*Alabama argillacea*)、Hop vine borer (*Hydraecia immanis*) 等のヤガ科 (*Noctuidae*)；モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ科 (*Pieridae*)；ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、スモモヒメシンクイ (*Grapholita dimorpha*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、アズキサヤムシガ (*Matsumuraeses azukivora*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、コドリング (*Cydia pomonella*)、カンシャシンクイハマキ (*Tetramoera schistaceana*)、Bean Shot Borer (*Epinotia aporema*)、Citrus fruit borer (*Ecdytolopha aurantiana*) 等のハマキガ科 (*Tortricidae*)；チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*) のホソガ科 (*Gracillariidae*)；モモシンクイガ (*Carposina sasakii*) 等のシンクイガ科 (*Carposinidae*)；Coffee Leaf miner (*Leucoptera coffeella*)、モモハモグリガ (*Lyonetia clerkella*)、ギンモンハモグリガ (*Lyonetia prunifoliella*) 等のハモグリガ科 (*Lyonetiidae*)；マイマイガ (*Lymantria dispar*) 等のリマントリア属 (*Lymantria* spp.)、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*) 等のユープロクティス属 (*Euproctis* spp.) 等のドクガ科 (*Lymantriidae*)；コナガ (*Plutella xylostella*) 等のコナガ科 (*Plutellidae*)；モモキバガ (*Anarsia lineatella*)、イモキバガ (*Helcystogramma triannulellum*)、ワタアカミムシガ (*Pectinophora gossypiella*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、Tuta absoluta 等のキバガ科 (*Gelechiidae*)；アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ科 (*Arctiidae*)；Giant Sugarcane borer (*Telchin licus*) 等のカストニアガ科 (*Castniidae*)；ヒメボクトウ (*Cossus insularis*) 等のボクトウガ科 (*Cossidae*)；ヨモギエダシャク (*Ascotis selenaria*) 等のシャクガ科 (*Geometridae*)；ヒロヘリアオイラガ (*Parasa lepida*) 等のイラガ科 (*Limacodidae*)；カキノヘタムシガ (*Stathmopoda masinissa*) 等のニセマイコガ科 (*Stathmopodidae*)；クロメンガタスズメ (*Acherontia lachesis*) 等のスズメガ科 (*Sphingidae*)；キクビスカシバ (*Nokona feralis*) 等のスカシバガ科 (*Sesiidae*)；イネツトムシ (*Parnara guttata*) 等のセセリチョウ科 (*Hesperiidae*)。

【0140】

総翅目害虫 (*Thysanoptera*)：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*)、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、モトジロアザミウマ (*Echinothrips americanus*) 等のアザミウマ科 (*Thripidae*)；イネクダアザミウマ (*Haplothrips aculeatus*) 等のクダアザミウマ科 (*Phlaeothripidae*)。

【0141】

双翅目害虫 (*Diptera*)：タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*) 等のハナバエ科 (*Anthomyiidae*)；シュガービートルルートマゴット (*Tetanops myopaeformis*) 等のハネフリバエ科 (*Ulidiidae*)；イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、トマトハモグリバエ (*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*) 等のハモグリバエ科 (*Agromyzidae*)；イネキモグリバエ (*Chlorops oryzae*) 等のキモグリバエ科 (*Chloropidae*)；ウリミバエ (*Bactrocera cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Bactrocera dorsalis*)、ナスミバエ (*Bactrocera latifrons*)、オリーブミバエ (*Bactrocera oleae*)、クインスランドミバエ (*Bactrocera tryoni*)、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*) 等のミバエ科 (*Tephritidae*)；イネヒメハモグリバエ (*Hydrellia griseola*)、トウヨウイネクキミギワバエ (*Hydr*

ellia philippina)、イネクキミギワバエ (*Hydrellia sasakii*) 等のミギワバエ科 (Ephyridae); オウトウシヨウジョウバエ (*Drosophila suzukii*) 等のシヨウジョウバエ科 (Drosophilidae); オオキモンノミバエ (*Megaselia spiracularis*) 等のノミバエ科 (Phoridae); オオチヨウバエ (*Clogmia albipunctata*) 等のチヨウバエ科 (Psychodidae); チビクロバネキノコバエ (*Bradysia difformis*) 等のクロバネキノコバエ科 (Sciaridae); ヘシアンバエ (*Mayetiola destructor*)、イネノシントメタマバエ (*Orseolia oryzae*) 等のタマバエ科 (Cecidomyiidae); *Diopsis macrophthalma* 等のシュモクバエ科 (Diosipidae); キリウジガガンボ (*Tipula aino*)、Common crane fly (*Tipula oleracea*)、European crane fly (*Tipula paludosa*) 等のガガンボ科 (Tipulidae)。

【 0 1 4 2 】

鞘翅目害虫 (Coleoptera): ウェスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ノザンコーンルートワーム (*Diabrotica barberi*)、メキシカンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera zea*)、バンデッドキューカンバービートル (*Diabrotica balteata*)、Cucurbit Beetle (*Diabrotica speciosa*)、ビーンリーフビートル (*Cerotoma trifurcata*)、クビアカクビホソハムシ (*Oulema melanopus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、Cabbage flea beetle (*Phyllotreta cruciferae*)、Western black flea beetle (*Phyllotreta pusilla*)、Cabbage stem flea beetle (*Psylliodes chrysocephala*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、グレープ・コラスピス (*Colaspis brunnea*)、コーン・フレアビートル (*Chaetocnema pulicaria*)、サツマイモヒサゴトビハムシ (*Chaetocnema confinis*)、ポテト・フレアビートル (*Epitrix cucumeris*)、イネトゲハムシ (*Dicladispa armigera*)、Grape Colaspis (*Colaspis brunnea*)、southern corn leaf beetle (*Myochrous denticollis*)、ヨツモンカメノコハムシ (*Lacoptera quadrimaculata*)、タバコノミハムシ (*Epitrix hirtipennis*) 等のハムシ科 (Chrysomelidae); Seed corn beetle (*Stenolophus lecontei*)、Slender seedcorn beetle (*Clivina impressifrons*) 等のオサムシ科 (Carabidae); ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、アオドウガネ (*Anomala albopilosa*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*)、European Chafer (*Rhizotrogus majalis*)、クマルコガネ (*Tomarus gibbosus*)、Holotrichia 属 (*Holotrichia* spp.)、ジューン・ビートル (*Phyllophaga crinita*) 等の *Phyllophaga* 属 (*Phyllophaga* spp.)、*Diloboderus abderus* 等の *Diloboderus* 属 (*Diloboderus* spp.) 等のコガネムシ科 (Scarabaeidae); ワタミヒゲナガゾウムシ (*Araecerus coffeae*)、アリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*)、イモゾウムシ (*Euscepes postfasciatus*)、アルファルファタコゾウムシ (*Hypera postica*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、シロスジオサゾウムシ (*Rhabdoscelus lineatocollis*)、ワタミハナゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus*)、Southern Corn Billbug (*Sphenophorus callosus*)、Soybean stalk weevil (*Sternechus subsignatus*)、Sugarcane weevil (*Sphenophorus levis*)、サビヒョウタンゾウムシ (*Scepticus griseus*)、トビイロヒョウタンゾウムシ (*Scepticus uniformis*)、ブラジルマメゾウムシ (*Zabrotes subfasciatus*)、マツノクイムシ (*Tomicus piniperda*)、Coffee Berry Borer (*Hypothenemus hampei*)、*Aracanthus mourei* 等の *Aracanthus* 属 (*Aracanthus* spp.)、cotton root borer (*Eutinobothrus brasiliensis*) 等のゾウムシ科 (Curculionidae); コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、ヒラタコクヌストモドキ (*Tribolium confusum*) 等のゴミムシダマシ科 (Tenebrionidae); ニジユウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等のテントウムシ科 (Coccinellidae); ヒラタクイムシ (*Lyctus brunneus*) 等のナガシクイムシ科 (Bostrychidae); ヒョウホンムシ科 (Ptinidae); ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、*Migdolus fryanus* 等のカミキリムシ科 (Cerambycidae); オキナワカンシャクシコメツキ (*Melanotus okinawensis*)、トビイロムナボソコメツキ (*Agr*

10

20

30

40

50

iotes fuscicollis)、クシコメツキ (*Melanotus legatus*)、アシプトコメツキ属 (*Anchastus* spp.)、コノデルス属 (*Conoderus* spp.)、クテニセラ属 (*Ctenicera* spp.)、リモニウス属 (*Limoniuss* spp.)、*Aeolus*属 (*Aeolus* spp.)等のコメツキムシ科 (*Elateridae*) ; アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*)等のハネカクシ科 (*Staphylinidae*)。

【0143】

直翅目害虫 (*Orthoptera*) : トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、モロッコトビバッタ (*Dociostaurus maroccanus*)、オーストラリアトビバッタ (*Chortoicetes terminifera*)、アカトビバッタ (*Nomadacris septemfasciata*)、Brown Locust (*Locustana pardalina*)、Tree Locust (*Anacridium melanorhodon*)、Italian Locust (*Calliptamus italicus*)、Differential grasshopper (*Melanoplus differentialis*)、Two striped grasshopper (*Melanoplus bivittatus*)、Migratory grasshopper (*Melanoplus sanguinipes*)、Red-Legged grasshopper (*Melanoplus femurrubrum*)、Clearwinged grasshopper (*Camnula pellucida*)、サバクワタリバッタ (*Schistocerca gregaria*)、Yellow-winged locust (*Gastrimargus musicus*)、Spur-throated locust (*Austracris guttulosa*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、ハネナガイナゴ (*Oxya japonica*)、タイワンツチイナゴ (*Patanga succincta*)等のバッタ科 (*Acrididae*) ; ケラ (*Gryllotalpa orientalis*)等のケラ科 (*Gryllotalpidae*) ; ヨーロッパイエコオロギ (*Acheta domesticus*)、エンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)等のコオロギ科 (*Gryllidae*) ; Mormon cricket (*Anabrus simplex*)等のキリギリス科 (*Tettigoniidae*)。

10

20

【0144】

膜翅目害虫 (*Hymenoptera*) : カブラハバチ (*Athalia rosae*)、ニホンカブラバチ (*Athalia japonica*)等のハバチ科 (*Tenthredinidae*) ; ファイヤークアント (*Solenopsis* spp.)科、Brown leaf-cutting ant (*Atta capiguara*)等のアリ科 (*Formicidae*)等。

【0145】

ゴキブリ目害虫 (*Blattodea*) : チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)等のチャバネゴキブリ科 (*Blattellidae*) ; クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)等のゴキブリ科 (*Blattidae*) ; ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、アメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*)、コウシュンシロアリ (*Neotermes koshunensis*)、サツマシロアリ (*Glyptotermes satsumensis*)、ナカジマシロアリ (*Glyptotermes nakajimai*)、カタンシロアリ (*Glyptotermes fuscus*)、オオシロアリ (*Hodotermopsis sjostedti*)、コウシュウイエシロアリ (*Coptotermes guangzhouensis*)、アマミシロアリ (*Reticulitermes amamianus*)、ミヤタケシロアリ (*Reticulitermes miyatakei*)、カンモンシロアリ (*Reticulitermes kanmonensis*)、タカサゴシロアリ (*Nasutitermes takasagoensis*)、ニトベシロアリ (*Pericapritermes nitobei*)、ムシャシロアリ (*Sinocapritermes mushae*)、*Cornitermes cumulans*等のシロアリ科 (*Termitidae*)。

30

【0146】

ダニ目害虫 (*Acari*) : ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミツユビナミハダニ (*Tetranychus evansi*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、オリゴニカス属等のハダニ科 (*Tetranychidae*) ; ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、リュウキュウミカンサビダニ (*Phyllocoptruta citri*)、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、チャノサビダニ (*Calacar carinatus*)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*)、カキサビダニ (*Aceria diospyri*)、*Aceria tosichella*、シソサビダニ (*Shevtchenkella* sp.)等のフシダニ科 (*Eriophyidae*) ; チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)等のホコリダニ科 (*Tarsonemidae*) ; ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*)等のヒメハダニ

40

50

科 (Tenuipalpidae) ; ケナガハダニ科 (Tuckerellidae) ; フタトゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis)、キチマダニ (Haemaphysalis flava)、タイワンカクマダニ (Dermacentor taiwanensis)、アメリカイヌカクマダニ (Dermacentor variabilis)、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)、アメリカキララマダニ (Amblyomma americanum)、オウシマダニ (Boophilus microplus)、クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus) 等のマダニ科 (Ixodidae) ; ケナガコナダニ (Tyrophagus putrescentiae)、ハウレンソウケナガコナダニ (Tyrophagus similis) 等のコナダニ科 (Acaridae) ; コナヒョウヒダニ (Dermatophagoides farinae)、ヤケヒョウヒダニ (Dermatophagoides pteronyssinus) 等のチリダニ科 (Pyroglyphidae) ; ホソツメダニ (Cheyletus eruditus)、クワガタツメダニ (Cheyletus malaccensis)、ミナミツメダニ (Cheyletus moorei)、イヌツメダニ (Cheyletiella yasguri) 等のツメダニ科 (Cheyletidae) ; ミミヒゼンダニ (Otodectes cynotis)、ヒゼンダニ (Sarcoptes scabiei) 等のヒゼンダニ科 (Sarcoptidae) ; イヌニキビダニ (Demodex canis) 等のニキビダニ科 (Demodicidae) ; ズツキダニ科 (Lisstrophiidae) ; イエササラダニ科 (Haplochthoniidae) ; イエダニ (Ornithonyssus bacoti)、トリサシダニ (Ornithonyssus sylviarum) 等のオオサシダニ科 (Macronyssidae) ; ワクモ (Dermanyssus gallinae) 等のワクモ科 (Dermanyssidae) ; アカツツガムシ (Leptotrombidium akamushi) 等のツツガムシ科 (Trombiculidae) 等。

10

【0147】

化合物 (M - 14) は、有害節足動物に対して防除効力を有する。

20

【0148】

本発明の有害節足動物防除剤は、本発明化合物と不活性担体とを含有する。本発明の有害節足動物防除剤は、通常、本発明化合物と固体担体、液体担体、ガス状担体等の不活性担体とを混合し、必要に応じて界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、乳剤、油剤、粉剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤、樹脂製剤、シャンプー剤、ペースト状製剤、泡沫剤、炭酸ガス製剤、錠剤等に製剤化されている。これらの製剤は蚊取り線香、電気蚊取りマット、液体蚊取り製剤、燻煙剤、燻蒸剤、シート製剤、スポットオン剤、経口処理剤に加工されて、使用されることもある。また、本発明の有害節足動物防除剤は、他の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物成長調節剤、除草剤及び共力剤と混用することもできる。

30

本発明の有害節足動物防除剤は、本発明化合物を通常 0.01 ~ 95 重量% 含有する。

【0149】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類 (カオリンクレー、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等)、合成含水酸化珪素、タルク、セラミック、その他の無機鉱物 (セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等)、化学肥料 (硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等) 等の微粉末及び粒状物等、並びに合成樹脂 (ポリプロピレン、ポリアクリロニトリル、ポリメタクリル酸メチル、ポリエチレンテレフタレート等のポリアエステル樹脂、ナイロン - 6、ナイロン - 11、ナイロン - 66 等のナイロン樹脂、ポリアミド樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、塩化ビニル - プロピレン共重合体等) があげられる。

40

【0150】

液体担体としては、例えば水、アルコール類 (メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、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、フェノキシエタノール等)、ケトン類 (アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等)、芳香族炭化水素類 (トルエン、キシレン、エチルベンゼン、ドデシルベンゼン、フェニルキシリルエタン、メチルナフタレン等)、脂肪族炭化水素類 (ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等)、エステル類 (酢酸エチル、酢酸ブチル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸エチル、アジピン酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソブチル、プロピレングリコールモノメチルエーテルアセテート等)、ニトリル類 (アセトニトリル、イソブチロニトリル等)、エーテル類 (ジイソプロピルエーテル、1

50

、4 - ジオキサン、DME、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、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モノメチルエーテル、3 - メトキシ - 3 - メチル - 1 - ブタノール等)、酸アミド類(DMF、ジメチルアセトアミド等)、ハロゲン化炭化水素類(ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等)、スルホキシド類(DMSO等)、炭酸プロピレン及び植物油(大豆油、綿実油等)が挙げられる。

【0151】

ガス状担体としては、例えばフルオロカーボン、ブタンガス、LPG(液化石油ガス)、ジメチルエーテル及び炭酸ガスがあげられる。

【0152】

界面活性剤としては、例えば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アルエーテル、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤、及びアルキルスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキル硫酸塩等の陰イオン界面活性剤が挙げられる。

【0153】

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤、着色剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼイン、ゼラチン、糖類(でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等)、リグニン誘導体、ペントナイト、合成水溶性高分子(ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等)、PAP(酸性りん酸イソプロピル)、BHT(2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール)、BHA(2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物)が挙げられる。

【0154】

樹脂製剤の基材としては、例えば塩化ビニル系重合体、ポリウレタン等を挙げることができ、これらの基材には必要によりフタル酸エステル類(フタル酸ジメチル、フタル酸ジオクチル等)、アジピン酸エステル類、ステアリン酸等の可塑剤が添加されていてもよい。樹脂製剤は該基材中に化合物を通常の混練装置を用いて混練した後、射出成型、押出成型、プレス成型等により成型することにより得られ、必要により更に成型、裁断等の工程を経て、板状、フィルム状、テープ状、網状、ひも状等の樹脂製剤に加工できる。これらの樹脂製剤は、例えば動物用首輪、動物用イヤータッグ、シート製剤、誘引ひも、園芸用支柱として加工される。

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等が挙げられ、更に必要に応じて、ジブチルヒドロキソトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料等が添加される。

【0155】

本発明の有害節足動物防除方法は、本発明化合物の有効量を有害節足動物に直接、及び/又は、有害生物の生息場所(植物、土壌、家屋内、動物体等)に施用することにより行われる。本発明の有害節足動物防除方法には、通常、本発明の有害節足動物防除剤の形態で用いられる。

【0156】

本発明の有害節足動物防除剤を農業分野の有害生物防除に用いる場合、その施用量は、10000m²あたりの本発明化合物量で通常1~10000gである。本発明の有害節足動物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常、有効成分濃度が0.01~10000ppmとなるように水で希釈して施用し、粒剤、粉剤等は、通常、そのまま施用する。

【0157】

これらの製剤や製剤の水希釈液は、有害節足動物又は有害節足動物から保護すべき作物等の植物に直接散布処理してもよく、また耕作地の土壌に生息する有害生物を防除するために、該土壌に処理してもよい。

10

20

30

40

50

【 0 1 5 8 】

また、シート状やひも状に加工した樹脂製剤を作物に巻き付ける、作物近傍に張り渡す、株元土壌に敷く等の方法により処理することもできる。

【 0 1 5 9 】

本発明の有害節足動物防除剤を家屋内に生息する有害生物の防除に用いる場合、その施用量は、面上に処理する場合は処理面積 1 m^2 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01 \sim 1000 \text{ mg}$ であり、空間に処理する場合は処理空間 1 m^3 あたりの本発明化合物量で、通常、 $0.01 \sim 500 \text{ mg}$ である。本発明の有害節足動物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常有効成分濃度が $0.1 \sim 10000 \text{ ppm}$ となるように水で希釈して施用し、油剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤等はそのまま施用する。

10

【 0 1 6 0 】

本発明の有害節足動物防除剤をウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、ニワトリ用の家畜、イヌ、ネコ、ラット、マウス等の小動物の外部寄生虫防除に用いる場合は、獣医学的に公知の方法で動物に使用することができる。具体的な使用方法としては、全身抑制を目的とする場合には、例えば錠剤、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）により投与され、非全身的抑制を目的とする場合には、例えば油剤若しくは水性液剤を噴霧する、ポアオン処理若しくはスポットオン処理を行う、シャンプー製剤で動物を洗う又は樹脂製剤を首輪や耳札にして動物に付ける等の方法により用いられる。動物体に投与する場合の本発明化合物の量は、通常動物の体重 1 kg に対して、 $0.1 \sim 1000 \text{ mg}$ の範囲である。

20

【実施例】

【 0 1 6 1 】

以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等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。

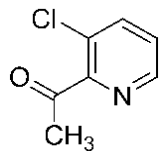
まず、本発明化合物の製造について、製造例を示す。

【 0 1 6 2 】

製造例 1

3 - クロロピリジン - 2 - カルボニトリル 5.4 g 及び THF 300 mL の混合物に、氷冷下 1 M メチルマグネシウムブロミド THF 溶液 500 mL を滴下した。この反応混合物を氷冷下 2 時間攪拌した。得られた反応混合物を氷冷下で 2 N 塩酸に加え、30 分間攪拌した。この混合物に 1 N 水酸化ナトリウム水溶液を加え、 pH 8 とした後に、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。有機層を減圧下濃縮することにより、中間体 1 を 5.8 g 得た。

30



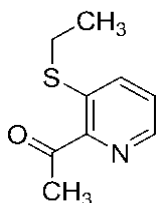
中間体 1 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.55 (1H, dd), 7.80 (1H, dd), 7.38 (1H, dd), 2.70 (3H, s).

40

【 0 1 6 3 】

製造例 2

水素化ナトリウム（油状、 60% ） 5.7 g 及び DMF 560 mL の懸濁液に、氷冷下エタンチオール 100 mL を滴下した。得られた混合物に、氷冷下、 20.4 g の中間体 1 及び 190 mL の DMF の混合物を滴下した。得られた反応混合物を、氷冷下 1 時間攪拌した後、氷水に加えた。析出した固体を濾過し、水で洗浄した。得られた固体を酢酸エチルに溶解し、この溶液を飽和食塩水で洗浄した後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥した。得られた有機層を減圧下濃縮した後、得られた固体をヘキサンで洗浄し、中間体 2 を 16.0 g 得た。



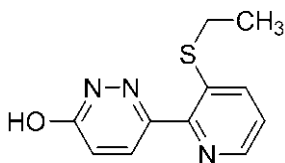
中間体 2 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.40 (1H, dd), 7.69 (1H, dd), 7.37 (1H, dd), 2.92 (2H, q), 2.72 (3H, s), 1.40 (3H, t).

【 0 1 6 4 】

製造例 3

5.4 g の中間体 2、グリオキシル酸一水和物 2.8 g 及びメタノール 90 mL の混合物に、氷冷下水酸化ナトリウム 2.4 g 及びメタノール溶液 60 mL の混合物を滴下した。この反応混合物を、60 で 2 時間攪拌した。この反応混合物を室温まで放冷後、酢酸 1 mL 及びヒドラジン一水和物 2.3 g を順次加えた。得られた混合物を、100 で 19 時間攪拌した。得られた混合物を室温まで放冷後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、中間体 3 を 3.8 g 得た。

10



中間体 3 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 10.60 (1H, br s), 8.43 (1H, dd), 8.13 (1H, d), 7.71 (1H, dd), 7.29 (1H, dd), 7.05 (1H, d), 2.95 (2H, q), 1.35 (3H, t).

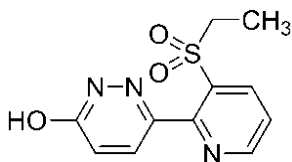
【 0 1 6 5 】

製造例 4

4.2 g の中間体 3、及びクロロホルム 60 mL の混合物に、氷冷下で 70% mCPBA 8.7 g を加えた。室温に昇温後、12 時間攪拌した。得られた反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、及びチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することで、下式で示される中間体 4 を 4.7 g 得た。

20

30



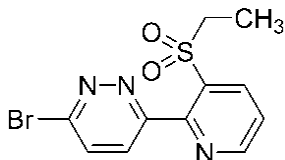
中間体 4 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 11.66 (1H, s), 8.90 (1H, dd), 8.49 (1H, dd), 7.78 (1H, d), 7.61 (1H, dd), 7.10 (1H, d), 3.66 (2H, q), 1.38 (3H, t).

【 0 1 6 6 】

製造例 5

2.0 g の中間体 4、及びトルエン 8 mL の混合物に、室温で 1 滴の DMF 及びオキシ臭化リン 4.3 g を順次加えた。この混合物を、100 で 9 時間攪拌した。得られた混合物を室温まで放冷後、水を加え、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を、水及び飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式で示される中間体 5 を 2.1 g 得た。

40



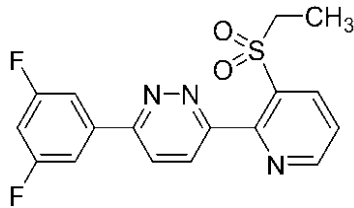
50

中間体 5 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.93 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 7.88-7.81 (2H, m), 7.66 (1H, dd), 3.89 (2H, q), 1.40 (3H, t).

【 0 1 6 7 】

製造例 6

300 mg の中間体 5、3, 5 - ジフルオロフェニルボロン酸 170 mg、42 mg のトリス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、4, 5 - ビス(ジフェニルホスフィノ) - 9, 9 - ジメチルキサンテン 53 mg、1.0 g のリン酸三ナトリウム・12水和物、及びジメトキシエタン 2 mL の混合物を、80 にて 7.5 時間加熱攪拌した。得られた反応混合物を室温まで放冷後、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。得られた有機層を、水及び飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式で示される化合物 2 を 230 mg 得た。



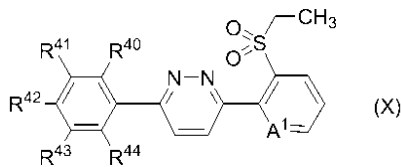
化合物 2 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.97-8.95 (1H, m), 8.58-8.55 (1H, m), 8.07 (1H, d), 8.00 (1H, d), 7.74-7.64 (3H, m), 7.02-6.96 (1H, m), 3.97 (2H, q), 1.44 (3H, t).

【 0 1 6 8 】

製造例 7

製造例 6 に記載の方法に準じて製造した化合物及びその物性値を以下に示す。

式 (X)



で示される化合物において、 A^1 、 R^{40} 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} 、及び R^{44} が [表 1 8] で示される化合物。

【 0 1 6 9 】

【 表 1 8 】

化合物	A^1	R^{40}	R^{41}	R^{42}	R^{43}	R^{44}
1	N	H	CF_3	H	CF_3	H
3	N	H	Cl	H	Cl	H
4	N	H	CF_3	H	H	H
5	N	H	H	CF_3	H	H

化合物 1 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.98 (1H, dd), 8.64 (2H, s), 8.58 (1H, dd), 8.17-8.11 (2H, m), 8.06 (1H, s), 7.69 (1H, dd), 3.98 (2H, q), 1.45 (3H, t).

化合物 3 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.96 (1H, d), 8.56 (1H, d), 8.09-7.98 (4H, m), 7.66 (1H, dd), 7.53 (1H, d), 3.97 (2H, q), 1.43 (3H, t).

化合物 4 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.97 (1H, dd), 8.57 (1H, dd), 8.44 (1H, s), 8.32 (1H, d), 8.11-8.05 (2H, m), 7.81 (1H, d), 7.74-7.64 (2H, m), 3.98 (2H, q), 1.44 (3H, t).

化合物 5 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.96 (1H, d), 8.57 (1H, d), 8.26 (2H, d), 8.08 (2

10

20

30

40

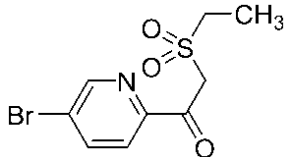
50

H, s), 7.83 (2H, d), 7.67 (1H, dd), 3.98 (2H, q), 1.44 (3H, t).

【 0 1 7 0 】

製造例 8

54 mL の 1.6 M ブチルリチウム - ヘキサン溶液、及び THF 41 mL の混合物に、
- 78 でエチルメチルスルホン 9.3 g 及び THF 24 mL の混合物を滴下した。この
反応混合物に、- 78 で 5 - プロモ - 2 - シアノピリジン 12 g 及び THF 41 mL の
混合物を滴下した。室温まで徐々に昇温した後、この反応混合物に 2 N 塩酸を加え、30
分間攪拌した。得られた混合物を酢酸エチルで抽出し、得られた有機層を飽和食塩水で洗
浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後に、減圧下濃縮することによ
り、下式で示される中間体 6 を 13 g 得た。



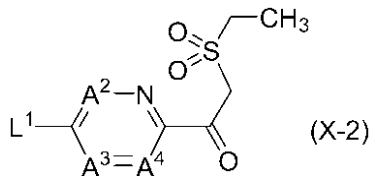
中間体 6 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.79 (1H, d), 8.04-7.98 (2H, m), 4.97 (2H, s), 3.28 (2H, q), 1.46 (3H, t).

【 0 1 7 1 】

製造例 9

製造例 8 に記載の方法に準じて製造した化合物及びその物性値を以下に示す。

式 (X - 2)



で示される化合物において、 L^1 、 A^2 、 A^3 、及び A^4 が [表 1 9] で示される化合物。

【 0 1 7 2 】

【 表 1 9 】

中間体	L^1	A^2	A^3	A^4
7	Br	CH	CH	N

中間体 7 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 9.04 (2H, s), 4.96 (2H, s), 3.29 (2H, q), 1.47 (3H, t)

【 0 1 7 3 】

製造例 10

8.9 mL のオキサリルクロリド、及びクロロホルム 68 mL の混合物に、氷冷下 8 mL
の DMF を滴下した。氷冷下 30 分間攪拌した後、室温で 1.5 時間攪拌した。この混合
物を、氷浴を用いて冷却した後に、26 mL のブチルビニルエーテルを滴下した。室温に
昇温して 2 時間攪拌した後、この混合物に氷冷下 10 g の中間体 1、33 mL のトリエチ
ルアミン、及びクロロホルム 23 mL の混合物を滴下した。室温に昇温後 1.5 時間攪
拌した。得られた混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液に加え、クロロホルムで抽出した。
得られた有機層を水及び飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮
した。得られた残渣をエタノール 10 mL で希釈した後、室温で 28% アンモニア水溶液
10 mL を加えた。この混合物を 60 に昇温して 3 時間加熱攪拌した後、室温まで放冷
し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を無
水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフ

10

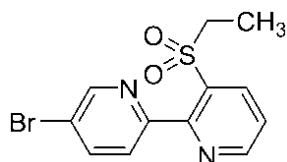
20

30

40

50

ィーに付し、下式で示される中間体 8 を 4 . 5 g 得た。



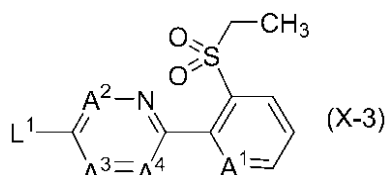
中間体 8 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.87 (1H, dd), 8.68 (1H, d), 8.49 (1H, dd), 8.01-7.98 (m, 1H), 7.74 (1H, d), 7.56 (1H, dd), 3.86 (2H, q), 1.37 (3H, t).

【 0 1 7 4 】

製造例 1 1

製造例 1 0 に記載の方法に準じて製造した化合物及びその物性値を以下に示す。

式 (X - 3)



で示される化合物において、 L^1 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、及び A^4 が [表 2 0] で示される化合物。

【 0 1 7 5 】

【 表 2 0 】

中間体	L^1	A^1	A^2	A^3	A^4
9	OCH_3	N	CH	N	CH
1 0	Br	N	CH	CH	N

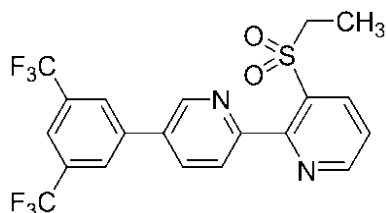
中間体 9 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.74 (1H, dd), 8.66 (1H, dd), 8.49 (1H, d), 8.20 (1H, d), 7.55 (1H, dd), 4.05 (3H, s), 3.85 (2H, q), 1.38 (3H, t).

中間体 1 0 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.98 (1H, dd), 8.95 (2H, s), 8.46 (1H, dd), 7.65 (1H, dd), 3.75 (2H, q), 1.38 (3H, t).

【 0 1 7 6 】

製造例 1 2

1 . 3 g の中間体 8 、 1 . 3 g の 3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニルボロン酸、0 . 4 6 g のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、2 M の炭酸ナトリウム水溶液 1 1 m L、及びトルエン 4 0 m L の混合物を、1 3 0 で 1 4 時間加熱撹拌した。得られた反応混合物を室温まで放冷後、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。得られた有機層を、水及び飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式で示される化合物 2 1 を 5 4 0 m g 得た。



化合物 2 1 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.92 (1H, dd), 8.59 (1H, d), 8.53 (1H, dd), 8.07 (1H, brs), 7.96-7.91 (2H, m), 7.85 (1H, dd), 7.62-7.58 (2H, m), 3.90 (2H, q), 1.38 (3H, t).

10

20

30

40

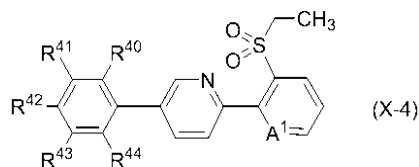
50

【 0 1 7 7 】

製造例 1 3

製造例 1 2 に記載の方法に準じて製造した化合物及びその物性値を以下に示す。

式 (X - 4)



で示される化合物において、 A^1 、 R^{40} 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{43} 、及び R^{44} が [表 2 1] で示される化合物。

【 0 1 7 8 】

【 表 2 1 】

化合物	A^1	R^{40}	R^{41}	R^{42}	R^{43}	R^{44}
6	N	H	H	CF_3	H	H
7	N	H	CF_3	H	H	H
8	N	H	CF_3	Cl	H	H
9	N	CF_3	H	Cl	H	H
10	N	H	Cl	H	Cl	H
11	N	H	F	H	F	H
12	N	H	F	F	F	H
13	N	H	OCF_3	H	H	H
14	N	H	Cl	H	H	H
15	N	F	H	CF_3	H	H
20	N	CF_3	H	CF_3	H	H

化合物 6 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.92-8.86 (2H, m), 8.52 (1H, dd), 8.08 (1H, dd), 7.97-7.95 (1H, m), 7.77 (4H, brs), 7.58 (1H, dd), 3.95 (2H, q), 1.40 (3H, t).

化合物 7 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.92-8.86 (2H, m), 8.52 (1H, dd), 8.09 (1H, dd), 8.09 (1H, dd), 7.97 (1H, dd), 7.90-7.83 (1H, m), 7.71-7.64 (1H, m), 7.62-7.26 (2H, m), 3.96 (2H, q), 1.40 (3H, t).

化合物 8 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.92-8.89 (1H, dd), 8.84 (1H, d), 8.52 (1H, dd), 8.05 (1H, dd), 7.96 (2H, dd), 7.75 (1H, dd), 7.65 (1H, d), 7.58 (1H, dd), 3.94 (2H, q), 1.40 (3H, t).

化合物 9 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.92 (1H, dd), 8.57-8.51 (2H, m), 7.93-7.91 (1H, m), 7.84-7.8 (2H, m), 7.64-7.57 (2H, m), 7.39 (1H, d), 3.96 (2H, q), 1.38 (3H, t).

化合物 10 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.90 (1H, dd), 8.84 (1H, d), 8.52 (1H, dd), 8.02 (1H, dd), 7.95 (1H, d), 7.57 (1H, dd), 7.53 (2H, d), 7.44-7.43 (1H, m), 3.93 (2H, q), 1.40 (3H, t).

化合物 11 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.90 (1H, dd), 8.82 (1H, d), 8.52 (1H, dd), 8.03 (1H, dd), 7.95 (1H, dd), 7.55 (1H, dd), 7.18 (2H, dd), 6.91-6.86 (1H, m), 3.94 (2H, q), 1.40 (3H, t).

化合物 12 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.90 (1H, dd), 8.78-8.77 (1H, m), 8.51 (1H, dd), 7.99-7.93 (2H, m), 7.58 (1H, dd), 7.31-7.23 (2H, m), 3.95 (2H, q), 1.39 (3H, t).

化合物 13 : 1H NMR ($CDCl_3$): 8.91 (1H, dd), 8.84 (1H, dd), 8.52 (1H, dd), 8.06 (1H, dd), 7.95 (1H, dd), 7.6-7.5 (4H, m), 7.31-7.26 (1H, m), 3.96 (2H, q), 1

10

20

30

40

50

.40 (3H, t).

化合物 14 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.9 (1H, dd), 8.83 (1H, dd), 8.51 (1H, dd), 8.04 (1H, dd), 7.94 (1H, dd), 7.65-7.64 (1H, m), 7.59-7.52 (2H, m), 7.46-7.39 (2H, m), 3.95 (2H, q), 1.40 (3H, t).

化合物 15 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.91 (1H, dd), 8.82 (1H, brs), 8.52 (1H, dd), 8.1-8.06 (1H, m), 7.97 (1H, d), 7.67 (1H, t), 7.61-7.48 (3H, m), 3.94 (2H, q), 1.4 (3H, t).

化合物 20 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 8.92 (1H, dd), 8.59 (1H, d), 8.53 (1H, dd), 8.07 (1H, brs), 7.96-7.91 (2H, m), 7.85 (1H, dd), 7.62-7.58 (2H, m), 3.90 (2H, q), 1.38 (3H, t).

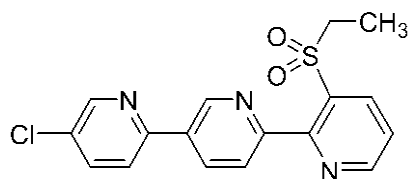
10

【0179】

製造例 14

1.0 g の中間体 8、1.3 g の 5 - クロロ - 2 - (トリブチルスタンニル)ピリジン、ヨウ化銅 0.13 g、塩化リチウム 0.19 g、0.14 g のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、及びトルエン 50 mL の混合物を、110 で 12 時間加熱撹拌した。得られた反応混合物を室温まで放冷後、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。得られた有機層を、水及び飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式で示される化合物 16 を 500 mg 得た。

20



化合物 16 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): 9.24 (1H, d), 8.9 (1H, dd), 8.7 (1H, d), 8.51 (1H, dd), 8.45 (1H, dd), 7.96 (1H, d), 7.79 (2H, d), 7.57 (1H, dd), 3.94 (2H, q), 1.39 (3H, t).

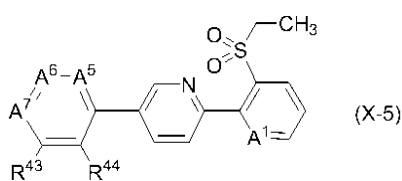
【0180】

製造例 15

製造例 14 に記載の方法に準じて製造した化合物及びその物性値を以下に示す。

30

式 (X-5)



で示される化合物において、 A^1 、 A^5 、 A^6 、 A^7 、 R^{43} 、及び R^{44} が [表 22] で示される化合物。

【0181】

【表 22】

40

化合物	A^1	A^5	A^6	A^7	R^{43}	R^{44}
17	N	CH	N	CCl	H	H
18	N	CH	CCl	N	H	H
19	N	CH	CCl	N	Cl	H

化合物 17 : $^1\text{H NMR}$ (DMSO-d_6): 9.07 (1H, d), 8.99 (1H, dd), 8.92 (1H, d), 8.47 (1H, dd), 8.4-8.35 (2H, m), 7.93 (1H, d), 7.82-7.79 (1H, m), 7.70 (1H, d), 3.

50

95 (2H, q), 1.26 (3H, t).

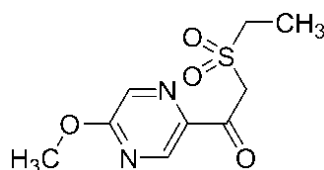
化合物 18 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8.91 (2H, dd), 8.88 (1H, dd), 8.50 (1H, dd), 8.10 (1H, dd), 7.99 (1H, dd), 7.63-7.59 (2H, m), 7.51 (1H, dd), 3.92 (2H, q), 1.40 (3H, t).

化合物 19 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8.92-8.86 (2H, m), 8.52 (1H, d), 8.08 (1H, dd), 8.01 (1H, d), 7.62-7.55 (1H, m), 7.59 (2H, s), 3.92 (2H, q), 1.40 (3H, t).

【 0 1 8 2 】

製造例 16

10 g の 5 - クロロ - 2 - ピラジンカルボン酸メチル、ナトリウムメトキシド (28%メタノール溶液) 28 mL、及び THF 100 mL の混合物を氷冷下で 3 時間攪拌した。得られた反応混合物に、氷冷下でエチルメチルスルホン 18 mL を加えた。この反応混合物を 80 に昇温し、24 時間加熱攪拌した。得られた反応混合物を室温まで放冷後、2 N 塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、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に付し、下式で示される中間体 11 を 11 g 得た。

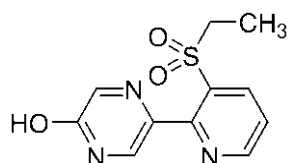


中間体 11 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.91 (1H, d), 8.25 (1H, d), 4.87 (2H, s), 4.08 (3H, s), 3.29 (2H, q), 1.47 (3H, t).

【 0 1 8 3 】

製造例 17

4.5 g の中間体 9、及び 12 N 塩酸 20 mL の混合物を、100 で 1 時間加熱攪拌した。この反応混合物を室温まで放冷後、100 mL の氷水を加えた。この混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にし、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下記で示される中間体 12 を 4.3 g 得た。

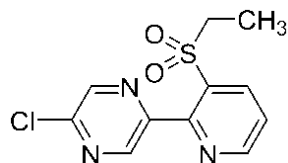


中間体 12 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.81 (1H, dd), 8.47 (1H, dd), 8.21 (1H, d), 7.97 (1H, d), 7.52 (1H, dd), 3.83 (2H, q), 1.39 (3H, t).

【 0 1 8 4 】

製造例 18

4.3 g の中間体 12、オキシ塩化リン 12 mL、及びトルエン 60 mL の混合物を、100 で 2 時間加熱攪拌した。得られた反応混合物を室温まで放冷した後、減圧下濃縮した。得られた残渣に水を加え、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮し、下記で示される中間体 13 を 4.6 g 得た。

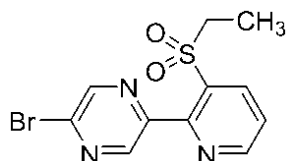


中間体 13 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.94 (1H, dd), 8.90 (1H, dd), 8.59 (1H, d), 8.52 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 3.81 (2H, q), 1.39 (3H, t).

【 0 1 8 5 】

製造例 19

2.0 g の中間体 12、及びトルエン 8 mL の混合物に、室温で 1 滴の DMF 及びオキシ臭化リン 4.3 g を順次加えた。この混合物を、100 で 9 時間攪拌した。得られた混合物を室温まで放冷後、水を加え、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を、水及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式で示される中間体 14 を 2.1 g 得た。



10

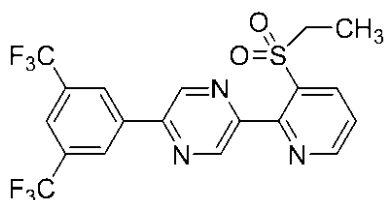
中間体 14 : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.91 (1H, d), 8.87 (1H, s), 8.67 (1H, s), 8.50 (1H, d), 7.62 (1H, q), 3.78 (2H, q), 1.37 (3H, t).

【0186】

製造例 20

1.0 g の中間体 14、1.04 g の 3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニルボロン酸、0.22 g のジクロロ[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム(II)ジクロロメタン付加物、0.96 g の炭酸ナトリウム、DME 15 mL、及び水 3 mL の混合物を、アルゴン雰囲気下 80 で 16 時間攪拌した。得られた混合物を室温まで放冷後、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。得られた有機層を、水及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式で示される化合物 22 を 460 mg 得た。

20



化合物 22 : $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) : 1.42 (3H, t), 3.89 (2H, q), 7.65 (1H, dd), 8.00 (1H, s), 8.54 (1H, d), 8.59 (2H, s), 8.97 (1H, d), 9.11 (1H, s), 9.22 (1H, s).

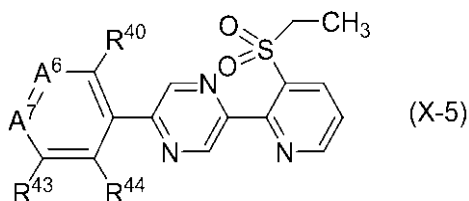
30

【0187】

製造例 21

製造例 20 に記載の方法に準じて製造した化合物及びその物性値を以下に示す。

式 (X-5)



40

で示される化合物において、 A^6 、 A^7 、 R^{40} 、 R^{43} 及び R^{44} が[表23]で示される化合物。

【0188】

【表 2 3】

化合物	A ⁶	A ⁷	R ⁴⁰	R ⁴³	R ⁴⁴
2 3	CH	CH	H	CF ₃	H
2 4	CH	CCF ₃	H	H	H
2 5	N	CH	H	CF ₃	H
2 6	N	CCF ₃	H	H	H
2 7	CH	N	H	CF ₃	H
2 8	CH	CH	H	OCF ₃	H
2 9	CH	C(OCF ₃)	H	H	H

10

化合物 2 3 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.41 (3H, t), 3.91 (2H, q), 7.61-7.70 (2H, m), 7.76 (1H, d), 8.30 (1H, d), 8.38 (1H, s), 8.50-8.57 (1H, m), 8.92-8.99 (1H, m), 9.03-9.09 (1H, m), 9.16-9.22 (1H, m).

化合物 2 4 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.41 (3H, t), 3.90 (2H, q), 7.63 (1H, dd), 7.79 (2H, d), 8.22 (2H, d), 8.54 (1H, d), 8.96 (1H, d), 9.05 (1H, s), 9.19 (1H, s).

化合物 2 5 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.42 (3H, t), 3.89 (2H, q), 7.65 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 8.70 (1H, s), 8.95-8.98 (1H, m), 9.01 (1H, s), 9.11 (1H, d), 9.22 (1H, d), 9.51 (1H, s).

20

化合物 2 6 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.42 (3H, t), 3.89 (2H, q), 7.65 (1H, dd), 7.87 (1H, d), 8.54 (1H, dd), 8.62 (1H, d), 8.97 (1H, dd), 9.09 (1H, d), 9.23 (1H, d), 9.41 (1H, s)

化合物 2 7 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.42 (3H, t), 3.88 (2H, q), 7.64-7.67 (1H, m), 8.20 (1H, d), 8.41 (1H, s), 8.53 (1H, d), 8.92 (1H, d), 8.97 (1H, d), 9.13 (1H, s), 9.23 (1H, s).

化合物 2 8 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.42 (3H, t), 3.90 (2H, q), 7.35 (1H, d), 7.57 (1H, t), 7.62-7.64 (1H, m), 7.99 (1H, s), 8.03 (1H, d), 8.52 (1H, d), 8.95 (1H, d), 9.01 (1H, s), 9.17 (1H, s).

化合物 2 9 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.40 (3H, t), 3.90 (2H, q), 7.37 (2H, d), 7.58-7.63 (1H, m), 8.14 (2H, d), 8.53 (1H, d), 8.95 (1H, d), 9.00 (1H, s), 9.16 (1H, s).

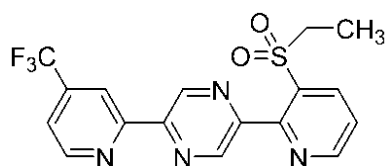
30

【 0 1 8 9 】

製造例 2 2

0.8 g の中間体 1 4、1.04 g のLithium trihydroxy[4-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]borate、24 mg の塩化銅 (I)、332 mg の塩化亜鉛、178 mg のジクロロ [1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム (II) ジクロロメタン付加物、1.58 g の炭酸セシウム及びDMF 15 mLの混合物を、アルゴン雰囲気下100度で16時間攪拌した。得られた混合物を室温まで放冷後、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を、水及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、下式で示される化合物 3 0 を 250 mg 得た。

40



化合物 3 0 : ¹H NMR (CDCl₃) 1.40 (3H, t), 3.89 (2H, q), 7.61-7.64 (2H, m), 8.53 (1H, d), 8.72 (1H, s), 8.87-8.96 (2H, m), 9.15 (1H, s), 9.67 (1H, s).

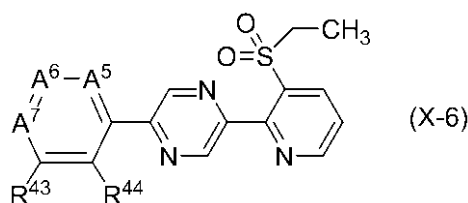
【 0 1 9 0 】

50

製造例 15

製造例 22 に記載の方法に準じて製造した化合物及びその物性値を以下に示す。

式 (X-6)



で示される化合物において、 A^5 、 A^6 、 A^7 、 R^{43} 、及び R^{44} が [表 24] で示される化合物。

【0191】

【表 24】

化合物	A^5	A^6	A^7	R^{43}	R^{44}
31	N	CCF_3	CH	H	H

化合物 31 : 1H NMR ($CDCl_3$) 1.28 (3H, t), 3.92 (2H, q), 7.61-7.64 (1H, m), 7.76 (1H, d), 8.05 (1H, t), 8.53 (1H, d), 8.66 (1H, d), 8.94 (1H, d), 9.14 (1H, s), 9.71 (1H, s).

【0192】

次に本発明化合物の製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

【0193】

製剤例 1

化合物 1 ~ 31 のいずれか 1 種 10 部を、キシレン 35 部と DMF 35 部との混合物に混合し、そこにポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部及びドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、混合して各々の製剤を得る。

【0194】

製剤例 2

ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部及び珪藻土 54 部を混合し、更に化合物 1 ~ 31 のいずれか 1 種 20 部を加え、混合して各々の水和剤を得る。

【0195】

製剤例 3

化合物 1 ~ 31 のいずれか 1 種 2 部に、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ペントナイト 30 部及びカオリンクレー 65 部を加え混合する。ついで、この混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で造粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

【0196】

製剤例 4

化合物 1 ~ 31 のいずれか 1 種 1 部を適量のアセトンに混合し、これに合成含水酸化珪素微粉末 5 部、酸性りん酸イソプロピル 0.3 部及びカオリンクレー 93.7 部を加え、充分攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の粉剤を得る。

【0197】

製剤例 5

ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩及びホワイトカーボンの混合物 (重量比 1 : 1) 35 部と、化合物 1 ~ 31 のいずれか 1 種 10 部と、水 55 部とを混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々のフロアブル剤を得る。

【0198】

10

20

30

40

50

製剤例 6

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 0 . 1 部をキシレン 5 部及びトリクロロエタン 5 部の混合物に混合し、これをケロシン 8 9 . 9 部に混合して各々の油剤を得る。

【 0 1 9 9 】

製剤例 7

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 1 0 m g をアセトン 0 . 5 m l に混合し、この溶液を、動物用固形飼料粉末（飼育繁殖用固形飼料粉末 C E - 2、日本クレア株式会社商品）5 g に滴下し、均一に混合する。ついでアセトンを蒸発乾燥させて各々の毒餌剤を得る。

【 0 2 0 0 】

製剤例 8

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 0 . 1 部、ネオチオゾール（中央化成株式会社製）4 9 . 9 部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、ジメチルエーテル 2 5 部、L P G 2 5 部を充填し振とうを加え、アクチュエータを装着することにより油剤エアゾールを得る。

【 0 2 0 1 】

製剤例 9

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 0 . 6 部、B H T（2, 6 - ジ - t e r t - ブチル - 4 - メチルフェノール）0 . 0 1 部、キシレン 5 部、ケロシン 3 . 3 9 部及び乳化剤 { レオドール M O - 6 0（花王株式会社製）} 1 部を混合したものと、蒸留水 5 0 部とをエアゾール容器に充填し、バルブを装着した後、該バルブを通じて噴射剤（L P G）4 0 部を加圧充填して水性エアゾールを得る。

【 0 2 0 2 】

製剤例 1 0

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 0 . 1 g を、プロピレングリコール 2 m l に混合し、4 . 0 x 4 . 0 c m、厚さ 1 . 2 c m のセラミック板に含浸させて、加熱式くん煙剤を得る。

【 0 2 0 3 】

製剤例 1 1

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 5 部とエチレン - メタクリル酸メチル共重合体（共重合体中のメタクリル酸メチルの割合：1 0 重量%、アクリフト（登録商標）W D 3 0 1、住友化学製）9 5 部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で熔融混練し、得られた混練物を押し成型機から成型ダイスを介して押し出し、長さ 1 5 c m、直径 3 m m の棒状成型体を得る。

【 0 2 0 4 】

製剤例 1 2

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 5 部及び軟質塩化ビニル樹脂 9 5 部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で熔融混練し、得られた混練物を押し成型機から成型ダイスを介して押し出し、長さ 1 5 c m、直径 3 m m の棒状成型体を得る。

【 0 2 0 5 】

製剤例 1 3

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 1 0 0 m g、ラクトース 6 8 . 7 5 m g、トウモロコシデンブ 2 3 7 . 5 m g、微結晶性セルロース 4 3 . 7 5 m g、ポリビニルピロリドン 1 8 . 7 5 m g、ナトリウムカルボキシメチルデンブ 2 8 . 7 5 m g、及びステアリン酸マグネシウム 2 . 5 m g を混合し、得られた混合物を適切な大きさに圧縮して、錠剤を得る。

【 0 2 0 6 】

製剤例 1 4

化合物 1 ~ 3 1 のいずれか 1 種 2 5 m g、ラクトース 6 0 m g、トウモロコシデンブ 2 5 m g、カルメロースカルシウム 6 m g、及び 5 % ヒドロキシプロピルメチルセルロース適量を混合し、得られた混合物をハードシェルゼラチンカプセル又はヒドロキシプロ

10

20

30

40

50

ピルメチルセルロースカプセルに充填し、カプセル剤を得る。

【0207】

製剤例15

化合物1～31のいずれか1種 100mg、フマル酸500mg、塩化ナトリウム2000mg、メチルパラベン150mg、プロピルパラベン50mg、顆粒糖25000mg、ソルビトール(70%溶液)13000mg、Veegum K(Vanderbilt Co.)100mg、香料35mg、及び着色料500mgに、最終容量が100mlとなるよう蒸留水を加え、混合して、経口投与用サスペンションを得る。

【0208】

製剤例16

化合物1～31のいずれか1種 5重量%を、乳化剤 5重量%、ベンジルアルコール3重量%、及びプロピレングリコール30重量%に混合し、この溶液のpHが6.0～6.5となるようにリン酸塩緩衝液を加えた後、残部として水を加えて、経口投与用液剤を得る。

【0209】

製剤例17

分留ヤシ油57重量%及びポリソルベート85 3重量%中にジステアリン酸アルミニウム5重量%を加え、加熱により分散させる。これを室温に冷却し、その油状ビヒクル中にサッカリン25重量%を分散させる。これに化合物1～31のいずれか1種 10重量%を配分し、経口投与用ペースト状製剤を得る。

【0210】

製剤例18

化合物1～31のいずれか1種 5重量%を石灰石粉95重量%と混合し、湿潤顆粒形成法を使用して経口投与用粒剤を得る。

【0211】

製剤例19

化合物1～31のいずれか1種 5部をジエチレングリコールモノエチルエーテル80部に混合し、これに炭酸プロピレン15部を混合して、スポットオン液剤を得る。

【0212】

製剤例20

化合物1～31のいずれか1種 10部をジエチレングリコールモノエチルエーテル70部に混合し、これに2-オクチルドデカノール20部を混合して、ポアオン液剤を得る。

【0213】

製剤例21

化合物1～31のいずれか1種 0.5部に、ニッコール(登録商標)TEALS-42(日光ケミカルズ・ラウリル硫酸トリエタノールアミンの42%水溶液)60部、及びプロピレングリコール20部を添加し、均一溶液になるまで充分攪拌混合した後、水19.5部を加えてさらに充分攪拌混合し、均一溶液のシャンプー剤を得る。

【0214】

製剤例22

化合物1～31のいずれか1種 0.15重量%、動物飼料95重量%、並びに、第2リン酸カルシウム、珪藻土、Aerosil、及びカーボネート(又はチョーク)からなる混合物4.85重量%を充分攪拌混合し、動物用飼料プレミックスを得る。

【0215】

製剤例23

化合物1～31のいずれか1種 7.2g、及びホスコ(登録商標)S-55(丸石製薬株式会社製)92.8gを100で混合し、坐剤形に注いで、冷却固化して、坐剤を得る。

【0216】

10

20

30

40

50

次に、本発明化合物の有害節足動物に対する効力を試験例により示す。下記試験例において、試験は、虫の逃亡防止を行い、気温は25で行った。

【0217】

試験例1

供試化合物を製剤例5に記載の方法に準じて製剤とし、これに展着剤0.03容量%含有する水を加え、供試化合物を所定濃度含有する希釈液を調製する。

容器に植えたキュウリ(*Cucumis sativus*)苗(第2本葉展開期)にワタアブラムシ(全ステージ)約30頭を接種する。1日後、この苗に、該希釈液を10mL/苗の割合で散布する。更に5日後、生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求める。

$$\text{防除価}(\%) = \{ 1 - (C_b \times T_{a_i}) / (C_{a_i} \times T_b) \} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b : 無処理区の供試虫数

C_{a_i} : 無処理区の調査時の生存虫数

T_b : 処理区の供試虫数

T_{a_i} : 処理区の調査時の生存虫数

ここで無処理区とは、供試化合物を使用しないこと以外は処理区と同じ操作をする区を意味する。

【0218】

所定濃度を500ppmとし、下記の化合物を供試化合物として用いて試験例1に従って試験を行った結果、下記の化合物はいずれも死虫率90%以上を示した。

化合物: 1、2、4、5、7、9、10、11、12、13、16、17、19、21、22、23、24、25、26、27、28、29、及び31

【0219】

試験例2

供試化合物を製剤例5に記載の方法に準じて製剤とし、これに展着剤0.03容量%含有する水を加え、供試化合物を所定濃度含有する希釈液を調製する。

容器に植えたイネ(*Oryza sativa*)苗(第2葉展開期)に該希釈液を10mL/苗の割合で散布する。その後、トビイロウンカ3齢幼虫を20頭放す。6日後、生存虫数を調査し、以下の式により死虫率を求める。

$$\text{死虫率}(\%) = \{ 1 - \text{生存虫数} / 20 \} \times 100$$

【0220】

所定濃度を500ppmとし、下記の化合物を供試化合物として用いて試験例2に従って試験を行った結果、下記の化合物はいずれも死虫率90%以上を示した。

化合物: 7、11、18、23、25、及び26

【0221】

試験例3

供試化合物を製剤例5に記載の方法に準じて製剤とし、これに水を加え、供試化合物を所定濃度含有する希釈液を調製する。

容器に、7.7gの人工飼料(インセクタLF、日本農産工業)を置き、これに該希釈液2mLを灌注する。該人工飼料上にハスモンヨトウ4齢幼虫5頭を放す。5日後、生存虫数を数え次式より死虫率を求める。

$$\text{死虫率}(\%) = (1 - \text{生存虫数} / 5) \times 100$$

【0222】

所定濃度を500ppmとし、下記の化合物を供試化合物として用いて試験例3に従って試験を行った結果、下記の化合物はいずれも死虫率80%以上を示した。

化合物: 1、10、22

【0223】

試験例4

供試化合物を製剤例5に記載の方法に準じて製剤とし、これに展着剤0.03容量%含

10

20

30

40

50

有する水を加え、供試化合物を所定濃度含有する希釈液を調製する。

容器に植えたキャベツ (*Brassica oleracea*) 苗 (第2~3本葉展開期) に該希釈液を20 mL / 苗の割合で散布する。その後、この苗の茎葉部を切り取り、ろ紙を敷いた容器内に入れる。これにコナガ2齢幼虫5頭を放す。5日後、生存虫数を数え、次式より死虫率を求める。

$$\text{死虫率} \% = (1 - \text{生存虫数} / 5) \times 100$$

【0224】

所定濃度を500 ppmとし、下記の化合物を供試化合物として用いて試験例4に従って試験を行った結果、下記の化合物はいずれも死虫率80%以上を示した。

化合物：1、3、4、5、6、7、8、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、22、23、24、25、26、27、30、及び31

10

【0225】

試験例5

供試化合物1 mgあたり、ポリオキシエチレンソルビタンモノココエート：アセトン = 5：95 (容量比) の混合溶液50 μLに溶解させる。これに展着剤0.03容量%含有する水を加え、供試化合物を所定濃度含有する希釈液を調製する。

湿らせたキムワイプを敷いたトレイにトウモロコシ (*Zea mays*) の種子を播種する。5日間生育させた後、実生全体を該希釈液に30秒間浸漬する。その後、実生2つをシャーレ (90 mm径) に入れ、これにウエスタンコーンルートワーム2齢幼虫10頭を放す。5日後、死亡虫数を数え、次式より死虫率を求める。

20

$$\text{死虫率} (\%) = (\text{死亡虫数} / 10) \times 100$$

【0226】

所定濃度を500 ppmとし、下記の化合物を供試化合物として用いて試験例5に従って試験を行った結果、下記の化合物はいずれも死虫率80%以上を示した。

化合物：1、6、7、8、10、12、13、21、22、23、24、25、26、及び31

【0227】

試験例6

供試化合物1 mgあたり、キシレン：DMF：界面供試剤 = 4：4：1 (容量比) の混合溶液10 μLに溶解させる。これに展着剤0.03容量%含有する水を加え、供試化合物を所定濃度含有する希釈液を調製する。

30

容器に植えたキュウリ (*Cucumis sativus*) 苗 (第2~3本葉展開期) に、該希釈液を10 mL / 苗の割合で散布する。その後、第2葉部を切り取って容器に入れ、ウリハムシ2齢幼虫10頭を放す。5日後、死亡虫数を数え、次式より死虫率を求める。

$$\text{死虫率} (\%) = (\text{死亡虫数} / 10) \times 100$$

【0228】

所定濃度を500 ppmとし、下記の化合物を供試化合物として用いて試験例6に従って試験を行った結果、下記の化合物はいずれも死虫率80%以上を示した。

化合物：4、及び5

40

【0229】

試験例7

供試化合物を製剤例5に記載の方法に準じて製剤とし、これに水を加え、供試化合物を所定濃度含有する希釈液を調製する。

容器に直径5.5 cmのろ紙を敷き、ろ紙上にショ糖30 mgを入れ、次に該希釈液0.7 mLを滴下する。該容器にイエバエ雌成虫10頭を放す。24時間後、死亡虫数を数え、次式より死虫率を求める。

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

【0230】

所定濃度を500 ppmとし、下記の化合物を供試化合物として用いて試験例7に従っ

50

て試験を行った結果、下記の化合物はいずれも死虫率100%を示した。

化合物：3、4、及び5

【産業上の利用可能性】

【0231】

本発明化合物は、有害節足動物に対して優れた防除効果を示す。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 K 45/00	(2006.01)	A 6 1 K 45/00	
A 6 1 P 43/00	(2006.01)	A 6 1 P 43/00	1 2 1
A 6 1 P 33/14	(2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 0 1 N 43/58	(2006.01)	A 0 1 N 43/58	A
A 0 1 N 43/54	(2006.01)	A 0 1 N 43/54	B
A 0 1 N 43/60	(2006.01)	A 0 1 N 43/60	
A 0 1 N 43/40	(2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 2
A 0 1 N 47/02	(2006.01)	A 0 1 N 47/02	
A 0 1 P 7/04	(2006.01)	A 0 1 P 7/04	

- (72)発明者 野倉 吉彦
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
- (72)発明者 中嶋 祐二
 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内

審査官 高森 ひとみ

- (56)参考文献 特表2014-515039(JP,A)
 特表2002-543191(JP,A)
 BROOKER, P. J. et al., Acaricidal 1,2,4,5-tetrazines, Pesticide Science, 1987年, Vol.18, No.3, pp.179-90
 CHALLIS, I. R. et al., Comparative metabolism of the acaricide clofentezine in animals, British Crop Protection Conference-Pests and Diseases, 1986年, Vol.2, pp.483-8

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
 C 0 7 D
 C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)