

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公開特許公報(A)

(11)公開番号

特開2022-71005

(P2022-71005A)

(43)公開日 令和4年5月13日(2022.5.13)

(51)国際特許分類

F I

A 0 1 N 43/60 (2006.01)

A 0 1 N 43/60

A 6 1 P 33/14 (2006.01)

A 6 1 P 33/14

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/506(2006.01)

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377(2006.01)

A 6 1 K 31/5377

審査請求 有 請求項の数 7 O L (全98頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2022-24895(P2022-24895)  
 (22)出願日 令和4年2月21日(2022.2.21)  
 (62)分割の表示 特願2018-129627(P2018-129627)  
 )の分割  
 原出願日 平成30年7月9日(2018.7.9)  
 (31)優先権主張番号 特願2017-139871(P2017-139871)  
 (32)優先日 平成29年7月19日(2017.7.19)  
 (33)優先権主張国・地域又は機関  
 日本国(JP)

(71)出願人 000004086  
 日本化薬株式会社  
 東京都千代田区丸の内二丁目1番1号  
 (72)発明者 長谷川 慎二  
 茨城県神栖市砂山6番地 日本化薬株式  
 会社 アグロ研究所内  
 (72)発明者 上野 翔太郎  
 茨城県神栖市砂山6番地 日本化薬株式  
 会社 アグロ研究所内  
 (72)発明者 新子 大樹  
 茨城県神栖市砂山6番地 日本化薬株式  
 会社 アグロ研究所内  
 (72)発明者 小林 武  
 茨城県神栖市砂山6番地 日本化薬株式  
 会社 アグロ研究所内  
 最終頁に続く

(54)【発明の名称】 ピラジン化合物

(57)【要約】 (修正有)

【課題】本発明は、種々の有害生物に対してより優れた防除活性を示す、ピラジン化合物又は、その塩を提供することを課題とする。

【解決手段】具体的には、例えば、2 - ( 2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ペンタフルオロプロポキシ ) - 5 - ( ピリジン - 4 - イル ) ピラジン、2 - ( 3 - クロロピリジン - 4 - イル ) - 5 - ( 2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ペンタフルオロプロポキシ ) ピラジン、2 - ( ( 1 , 1 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル ) オキシ ) - 5 - ( ピリジン - 4 - イル ) ピラジンなどが示される。

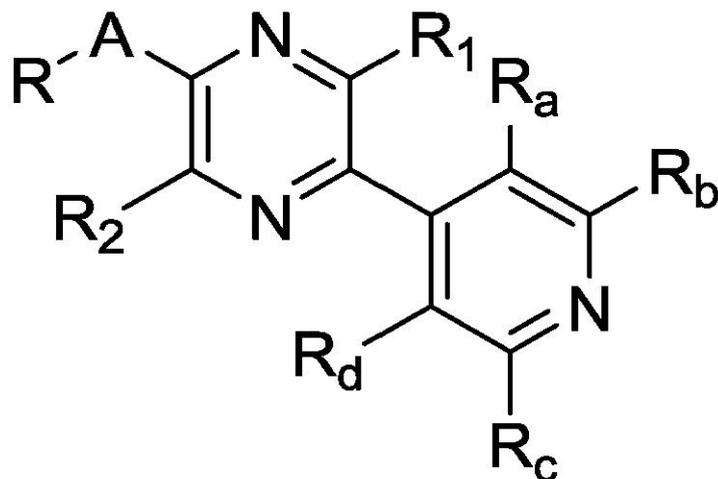
【選択図】なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(1)で表される化合物又は、その塩を有効成分として含む有害生物防除剤。

【化 1】



10

(1)

20

(式(1)中、

Rは、

水素原子

C 1 ~ C 6 のアルキル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、

30

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていても

よいC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基、及び/または、

40

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で置換されるフェニル基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルケニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ

50

ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基、及び/  
 または、  
 独立して1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で置換されるフェニル基により置換されていてもよい  
 )  
 C 2 ~ C 6 のアルキニル基 10  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基及び/または、 20  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基、及び/  
 または、  
 独立して1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で置換されるフェニル基により置換されていてもよい  
 )  
 独立して1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>4</sub> で置換されるフェニル基  
 独立して1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>4</sub> で置換されるピリジル基  
 を表し、  
 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub>は独立して、 30  
 水素原子  
 ハロゲン原子  
 C 1 ~ C 6 のアルキル基  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ 40  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい)  
 C 2 ~ C 6 のアルケニル基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、 50

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルキニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 1 ~ C 6 のアルキルオキシ基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルオキシ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルケニルオキシ基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルオキシ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ

10

20

30

40

50

ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい)  
 C 2 ~ C 6 のアルキニルオキシ基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルオキシ基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい)  
 C 1 ~ C 6 のアルキルチオ基  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキルチオ基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい)  
 C 2 ~ C 6 のアルケニルチオ基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルチオ基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ

10

20

30

40

50

いC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルキニルチオ基

(ここで、C 2 ~ C 6アルキニルチオ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 1 ~ C 6のアルキルスルフィニル基

(ここで、C 1 ~ C 6アルキルスルフィニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルケニルスルフィニル基

(ここで、C 2 ~ C 6アルケニルスルフィニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルキニルスルフィニル基

(ここで、C 2 ~ C 6アルキニルスルフィニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

10

20

30

40

50

- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基、及び/または、
- 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい) 10
- C 1 ~ C 6 のアルキルスルホニル基  
(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基は、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基、及び/または、 20
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基、及び/または、
- 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルケニルスルホニル基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルスルホニル基は、 30
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基、及び/または、
- 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい) 40
- C 2 ~ C 6 のアルキニルスルホニル基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルスルホニル基は、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルオキシ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキルチオ基、及び/または、
- 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ 50

ルスルフィニル基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
換されていてもよい)

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基

10

炭素原子、硫黄原子によりなる5若しくは6員環のアミノ基(ここで、硫黄原子は酸化さ  
れ、スルフィニル基、スルホニル基でもよい)

N, N - ジメチルアセトイミダミド基

1, 1, 3, 3 - テトラメチルグアニジニル基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノカルボニル基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される3つの置換基を有するヒドラジノ基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される3つの置換基を有するヒドラジノカルボ  
ニル基

20

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するヒドロキシルアミ  
ノ基

を表し、

A は、直接結合

を表す。)

30

【請求項2】

R が、

C 1 ~ C 6 のアルキル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/  
または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で場合により置換されていてもよいフェニル基により  
置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルケニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/  
または、

40

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で場合により置換されていてもよいフェニル基により  
置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルキニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/  
または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で場合により置換されていてもよいフェニル基により  
置換されていてもよい)

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>4</sub>で場合により置換されるフェニル基

独立して1 ~ 4個までの置換基R<sub>4</sub>で場合により置換されるピリジル基

であり、

50

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub>が独立して、  
水素原子

ハロゲン原子

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキル基

(ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>のアルケニル基

(ここで、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>のアルキニル基

(ここで、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキルオキシ基

(ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルオキシ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキルチオ基

(ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキルスルフィニル基

(ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキルスルホニル基

(ここで、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルキル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノカルボニル基である、

請求項1に記載の有害生物防除剤。

【請求項3】

界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの成分を含む、請求項1または2に記載の有害生物防除剤。

【請求項4】

少なくとも1つの生物学的に有効な化合物または薬剤をさらに含む、請求項1～3の何れか一項に記載の有害生物防除剤。

【請求項5】

前記の少なくとも1つの生物学的に有効な化合物または薬剤が、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、メトルカルブ、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、エチルチオメトン、クロルエトキシホス、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、デメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミ

10

20

30

40

50

シアホス、イソフェンホス、イソプロピル = O - (メトキシアミンボチオホスホリルサリ  
 チラート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メ  
 ビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトンエチル、パラチオン  
 、パラチオン - メチル、P A P、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホ  
 キシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホスプロベタンホス、プロチオホス、ピラクロ  
 ホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリミホス、テメホス、テ  
 ルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、パミド  
 チオン、クロルピリホス - エチル、ジスルフォトン、スルプロホス、フルピラゾホス、フ  
 ェントエート、ホノホス、トリブホス、エンドスルファン、アルファ - エンドスルファン  
 、ガンマ - H C H、ジコホル、クロルデン、ディルドリン、メトキシクロル、アセトプロ  
 ール、フィプロニル、エチプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、フルフィプロ  
 ール、プロフラニリド、アフォキソラネル、フルララネル、サロララネル、フルキサメタミ  
 ド、アクリナトリン、アレスリン、d - c i s - t r a n sアレスリン、d - t r a n s  
 アレスリン、ピフェントリン、カップ - ピフェントリン、ピオアレスリン S - シクロペン  
 テニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、  
 シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シベルメトリン、アルフ  
 ザ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベル  
 メトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート  
 、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、  
 フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデス  
 リン、ベルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン、レスメトリン、シラフ  
 ルオフエン、テフルトリン、カップ - テフルトリン、フタルスリン、テトラメトリン、ト  
 ラロメトリン、トランスフルトリン、メトキサジアゾン、メトフルトリン、プロフルトリ  
 ン、ピレトラム、テラレトリン、モンフルオロスリン、ヘプタフルトリン、メベルフルス  
 リン、テトラメチルフルスリン、ジメフルトリン、クロロパラレスリン、イブシロン - メ  
 トフルスリン、イブシロン - モンフルオスリン、プロトリフェンブト、アセタミプリド、  
 クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロブリド、ニテンピラム、チアクロブリド、チ  
 アメトキサム、スルホキサフロル、フルピラジフロン、トリフルメゾピリム、ジクロロメ  
 ゾチアズ、フルピリミン、スピノサド、スピネトラム、アバメクチン、イベルメクチン、  
 エマメクチン安息香酸塩、ミルベメクチン、レピメクチン、ヒドロブレン、キノブレン、  
 ジオフェノラン、メトブレン、ピリプロキシフェン、ピメトロジン、フロニカミド、エト  
 キサゾール、ジアフェンチウロン、アゾシクロチン、シヘキサチン、酸化フェンブタスズ  
 、プロバルギット、テトラジホン、クロルフェナピル、トラロピリル、D N O C、ベンス  
 ルタップ、カルタップ、チオシクラム、チオスルタップ、チオスルタップ - ナトリウム、  
 ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フル  
 フェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフ  
 ルベンズロン、トリフルムロン、ビストリフルロン、ブプロフェジン、シロマジン、クロ  
 マフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド、アミトラズ、ヒ  
 ドラメチルノン、アセキノシル、フルアクリピリム、ピリミノストロピン、フルフェノキ  
 シストロピン、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テ  
 ブフェンピラド、トルフェンピラド、ピフルブミド、スピロジクロフェン、スピロテトラ  
 マト、スピロメシフェン、スピロピディオ、シフルメトフェン、シエノピラフェン、フル  
 ベンジアミド、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、シクラニリプロ  
 ール、テトラニリプロール、シハロジアミド、テトラクロラントラニリプロール、キノメ  
 チオナート、ヘキシチアゾクス、ピフェナゼート、フルフェネリム、ピリフルキナゾン、  
 フロメトキン、フルオピラム、フルアザインドリジン、アミドフルメト、チクロピラゾフ  
 ロル、チオキサザフェン、オキサゾスルフィル、ニコチン、クロロピクリン、フッ化スル  
 フリル、クリロチエ、クロフェンテジン、ジフロビダジン、ロテノン、インドキサカルブ  
 、ピペロニルブトキシド、クロルジメホルム、ピリダリル、アザジラクチン、ベンゾキシ  
 メート、アフィドピロペン、フルヘキサホン、フルエンシルホン、ベンクロチアズ、カル

10

20

30

40

50

ゾール、殺虫性石鹼、ジメヒポ、ニチアジン、ホウ酸塩、メタアルデヒド、リアノジン、  
 スルフルアミド、アシノナピル、ベンズピリモキサソール、3 - プロモ - N - ( 2 , 4 - ジク  
 ロロ - 6 - (メチルカルバモイル)フェニルイル) - 1 - ( 3 , 5 - ジクロロピリジン - 2 -  
 イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド、メタラキシル、メタラキシルM、オキ  
 サジキシル、オフラセ、ベナラキシル、ベナラキシル - M、キララキシル、オフラス、  
 フララキシル、シプロフラン、ブプリメート、ジメチリモール、エチリモール、ヒメキサ  
 ゾール、ヒドロキシイソキサゾール、オキサチアピプロリン、オクチリノン、オキソリニ  
 ック酸、ベノミル、チオファネートメチル、カーベンダジム、フベリダゾール、チアベン  
 ダゾール、デバカルブ、ジエトフェンカルブ、ゾキサミド、エタボキサム、ペンシクロ  
 、フルオピコリド、フルオピモミド、ジフルメトリム、ブプリメート、ベノダニル、フル  
 トラニル、メプロニル、イソフェタミド、フェンフラム、オキシカルボキシン、カルボキ  
 シン、チフルザミド、フルキサピロキサド、フラメトピル、ペンフルフェン、ペンチオピ  
 ラド、ベンゾビンジフルピル、ピキサフェン、イソピラザム、セダキサン、インピルフル  
 キサム、フルインダピル、イソフルシプラム、ピラプロポイン、ボスカリド、アゾキシス  
 トロピン、コウメトキシストロピン、クレソキシムメチル、トリフロキシストロピン、ピ  
 コキシストロピン、ピラクロストロピン、ジモキシストロピン、メトミノストロピン、オ  
 リサストロピン、フルオキサストロピン、ピラオキシストロピン、ピラメトストロピン、  
 フルフェノキシストロピン、フェナミンストロピン、エノキサストロピン、クモキシスト  
 ロピン、マンデストロピン、トリクロピリカルブ、ファモキサドン、フェンアミドン、ト  
 リクロピリカルブ、ピリベンカルブ、シアゾファミド、アミスルブロム、ビナバクリル、  
 メブチルジノカルブ、ジノカップ、フルアジナム、フェリムゾン、酢酸 - フェンチン、塩  
 化フェンチン、水酸化フェンチン、水酸化トリフェニルスズ、酢酸トリフェニルスズ、オ  
 キシン銅、シルチオファミン、アメトクトラジン、メパニピリム、ニトラピリン、ピリメサ  
 ニル、シプロジニル、ブラストサイジンS、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和  
 物、ストレプトマイシン、オキシテトラサイクリン、キノキシフェン、プロキナジド、フ  
 ルジオキサニル、フェンピクロニル、フルオロイミド、プロシミドン、イプロジオン、ピ  
 ンクロゾリン、エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン、プロ  
 パモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、ゴセイカユブテ抽出物、トリホリン、ピリフェノ  
 ックス、ピリソキサゾール、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、プロムコナゾ  
 ール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、エポキシコナゾール、フルキンコナゾール、  
 オキスポコナゾール、ペフラゾエート、ジフェノコナゾール、フェンブコナゾール、イミ  
 ベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン  
 、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、イマザリル、ピテルタノール  
 、トリフルミゾール、エタコナゾール、プロピコナゾール、ベンコナゾール、フルシラゾ  
 ール、フルトリアホール、マイクロブタニル、パクロブトラゾール、プロチオコナゾール、  
 シプロコナゾール、テブコナゾール、ヘキサコナゾール、プロクロラズ、シメコナゾール  
 、イブフェントリフルコナゾール、アルジモルフ、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、トリデ  
 モルフ、フェンプロピモルフ、ジメトモルフ、フルモルフ、ピリモルフ、ピペラリン、フ  
 ェンプロピディン、スピロキサミン、フェンヘキサミド、フェンピラザミン、フェルバム  
 、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、チラム、マンゼブ、マンネブ、ジネブ、ジラム  
 、ポリカーバメート、プロビネブ、チウラム、ピリブチカルブ、バリダマイシン、ミルジ  
 オマイシン、ポリオキシン、ベンチアバリカルブ、ベンチアバリカルブイソプロピル、バ  
 リフェナレート、イプロバリカルブ、マンジプロパミド、フェンピコキサミド、フロリル  
 ピコキサミド、フサライド、ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロパミド、ジクロシ  
 メット、フェノキサニル、アシベンゾラル - S - メチル、プロベナゾール、ジクロベンチ  
 アゾクス、チアジニル、イソチアニル、シモキサニル、ホセチル、テクロフタラム、トリ  
 アゾキシド、フルスルファミド、ジクロメジン、シフルフェナミド、メトラフェノン、ピ  
 リオフェノン、フルチアニル、テブフロキン、イブフルフェノキン、ホセチルアルミニウ  
 ム、トルクロホス - メチル、エクロメゾール、トルプロカルブ、イブフェントリフルコナ  
 ゾール、メフェントリフルコナゾール、キノフメリン、ピジフルメトフェン、ボルドー混

10

20

30

40

50

合液、酢酸銅、塩基性硫酸銅、オキシ塩化銅、水酸化第二銅、オキシキノリン銅、銅、硫黄、キャプタン、カプタホール、フォルベット、アニラジン、クロロタロニル、ジクロロフェン、ペンタクロロフェノール及びその塩、ヘキサクロロベンゼン、キントゼン、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン酢酸塩、アルベシレート、ジチアノン、キノメチオネート、フルオリミド、トリルフルアニド、ジクロフルアニド、ジノプトン、ダゾメット、ピラジフルミド、アミノピリフェン、メチルテトラプロール、ピリダクロメチル、ジピメチロン、ピカルブトラゾクス、テクナゼン、ニトルタール - イソプロピル、ジシクロメット、アシベンゾラル、プロヘキサジオン - カルシウム、プロノポール、ジフェニルアミン、フルメトベル、ベントキサジン、ピフェニル、クロロネブ、CNA、ヨードカルブ、プロチオカルブ、Bacillus属、及びそれらにより産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、Bt作物により産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、昆虫病原性バクテリア、昆虫病原性ウイルスおよび昆虫病原性菌類からなる群から選択される、請求項4に記載の有害生物防除剤。

10

【請求項6】

有害生物が外部寄生虫である、請求項1～5の何れか一項に記載の有害生物防除剤。

【請求項7】

動物・鳥類の外部寄生虫に対する動物用外部寄生虫防除用の、請求項6に記載の有害生物防除剤。

【発明の詳細な説明】

20

【技術分野】

【0001】

本発明は、ピラジン化合物、その製造法およびそれを有効成分として含んでなる有害生物防除剤に関する。

【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。例えば、特許文献1には一定の2 - ピリジル基を有するピラジン化合物が殺虫剤として開示されている。また、特許文献2には、一定の4 - ピリジル基を有するキノキサリン化合物が殺虫剤として開示されている。しかしながら、高い有害生物防除活性を有し、実用性の高い化合物は見出されていない。

30

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】WO2017/065228号

【特許文献2】WO2015/059088号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明は、種々の有害生物に対してより優れた防除活性を示す、ピラジン化合物又は、その塩を提供することを課題とする。

40

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明者らは鋭意研究を重ねた結果、式(1)で表される4 - ピリジル基を有するピラジン化合物が、高い有害生物防除活性を有することを見出し、本発明を完成させるに至った。

【0006】

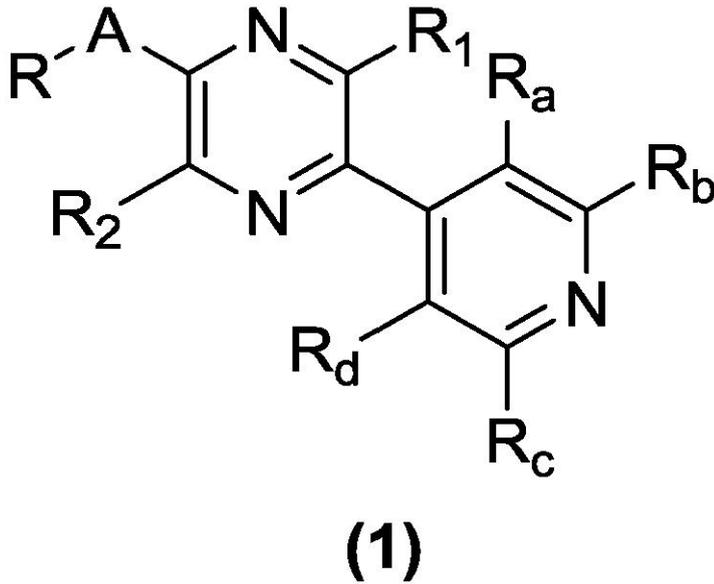
すなわち、本発明は、

< 1 >

式(1)で表される化合物又は、その塩。

50

【化 1】



10

(式(1)中、

Rは、

水素原子

C1～C6のアルキル基

(ここで、C1～C6アルキル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基、及び/または、

独立して1～5個までの置換基R3で置換されるフェニル基により置換されていてもよい);

C2～C6のアルケニル基

(ここで、C2～C6アルケニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルホニル基及び/または、

20

30

40

50

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノ基、及び/または、  
 独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で置換されるフェニル基により置換されていてもよい ) ;  
 C 2 ~ C 6 のアルキニル基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 い C 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノ基、及び/  
 または、  
 独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で置換されるフェニル基により置換されていてもよい  
 )  
 独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>4</sub> で置換されるフェニル基  
 独立して 1 ~ 4 個までの置換基 R<sub>4</sub> で置換されるピリジル基  
 を表し、  
 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub> は独立して、  
 水素原子  
 ハロゲン原子  
 C 1 ~ C 6 のアルキル基  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 い C 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい )  
 C 2 ~ C 6 のアルケニル基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 アルキ  
 10  
 20  
 30  
 40  
 50

ルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルホニル基及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C2～C6のアルキニル基

(ここで、C2～C6アルキニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルホニル基及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C1～C6のアルキルオキシ基

(ここで、C1～C6アルキルオキシ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C2～C6のアルケニルオキシ基

(ここで、C2～C6アルケニルオキシ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1～C6アルキルスルホニル基、及び/または、

10

20

30

40

50

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルキニルオキシ基

(ここで、C 2 ~ C 6アルキニルオキシ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 1 ~ C 6のアルキルチオ基

(ここで、C 1 ~ C 6アルキルチオ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルケニルチオ基

(ここで、C 2 ~ C 6アルケニルチオ基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルオキシ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルチオ基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルフィニル基、及び/または、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6アルキルスルホニル基、及び/または、

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルキニルチオ基

10

20

30

40

50

(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルチオ基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい)

10

C 1 ~ C 6 のアルキルスルフィニル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい)

20

C 2 ~ C 6 のアルケニルスルフィニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルスルフィニル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルチオ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルフィニル基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルスルホニル基、及び/または、  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
 C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
 いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
 換されていてもよい)

30

40

C 2 ~ C 6 のアルキニルスルフィニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルスルフィニル基は、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
 ルオキシ基、及び/または、  
 同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ

50

ルチオ基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルフィニル基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルホニル基、及び/または、  
水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
換されていてもよい)

C 1 ~ C 6 のアルキルスルホニル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルオキシ基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルチオ基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルフィニル基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルホニル基、及び/または、  
水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルケニルスルホニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルスルホニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルオキシ基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルチオ基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルフィニル基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルホニル基、及び/または、  
水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~  
C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ  
いC 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置  
換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルキニルスルホニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルスルホニル基は、

同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルオキシ基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルチオ基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルフィニル基、及び/または、  
同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6 アルキ  
ルスルホニル基、及び/または、

10

20

30

40

50

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基により置換されていてもよい)

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基

炭素原子、硫黄原子によりなる5若しくは6員環のアミノ基(ここで、硫黄原子は酸化され、スルフィニル基、スルホニル基でもよい)

N, N - ジメチルアセトイミダミド基

10

1, 1, 3, 3 - テトラメチルグアニジニル基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノカルボニル基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される3つの置換基を有するヒドラジノ基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される3つの置換基を有するヒドラジノカルボニル基

20

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するヒドロキシルアミノ基

を表し、

A は、直接結合、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sub>3</sub>、NR<sub>3</sub>C=O又はC=ONR<sub>3</sub>

を表す。)

< 2 >

R が、

C 1 ~ C 6のアルキル基

30

(ここで、C 1 ~ C 6アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子及び/または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で置換されるフェニル基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルケニル基

(ここで、C 2 ~ C 6アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で置換されるフェニル基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6のアルキニル基

40

(ここで、C 2 ~ C 6アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で置換されるフェニル基により置換されていてもよい)

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>4</sub>で置換されるフェニル基

独立して1 ~ 4個までの置換基R<sub>4</sub>で置換されるピリジル基

であり、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub>が独立して、

水素原子

ハロゲン原子

50

- C 1 ~ C 6 のアルキル基  
(ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルケニル基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルキニル基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 1 ~ C 6 のアルキルオキシ基 10  
(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルオキシ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルケニルオキシ基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルオキシ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルキニルオキシ基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルオキシ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 1 ~ C 6 のアルキルチオ基 20  
(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルチオ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルケニルチオ基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルチオ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルキニルチオ基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルチオ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 1 ~ C 6 のアルキルスルフィニル基 30  
(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルケニルスルフィニル基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルスルフィニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルキニルスルフィニル基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルスルフィニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 1 ~ C 6 のアルキルスルホニル基  
(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルケニルスルホニル基 40  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニルスルホニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- C 2 ~ C 6 のアルキニルスルホニル基  
(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニルスルホニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)
- 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノ基
- 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノカルボニル基 50

であり、

A が、直接結合、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sub>3</sub>、NR<sub>3</sub>C=O又はC=ONR<sub>3</sub>

である、

< 1 > に記載の化合物又はその塩。

< 3 >

R が、

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキル基

(ここで、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で場合により置換されていてもよいフェニル基により置換されていてもよい)

C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルケニル基

(ここで、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で場合により置換されていてもよいフェニル基により置換されていてもよい)

C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキニル基

(ここで、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び/または、

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>3</sub>で場合により置換されていてもよいフェニル基により置換されていてもよい)

独立して1 ~ 5個までの置換基R<sub>4</sub>で場合により置換されるフェニル基

であり、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub>が独立して、

水素原子

ハロゲン原子

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキル基

(ここで、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルケニル基

(ここで、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキニル基

(ここで、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキルオキシ基

(ここで、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルオキシ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキルチオ基

(ここで、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキルスルフィニル基

(ここで、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキルスルホニル基

(ここで、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基

50

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノカルボニル基であり、

A が、酸素原子である、

< 1 > に記載の化合物又はその塩。

< 4 >

R が、

C 1 ~ C 6 のアルキル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び / または、

独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で場合により置換されていてもよいフェニル基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルケニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び / または、

独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で場合により置換されていてもよいフェニル基により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルキニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び / または、

独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で場合により置換されていてもよいフェニル基により置換されていてもよい)

独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>4</sub> で場合により置換されるフェニル基

であり、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub> が独立して、

水素原子

ハロゲン原子

C 1 ~ C 6 のアルキル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルケニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C 2 ~ C 6 のアルキニル基

(ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C 1 ~ C 6 のアルキルオキシ基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルオキシ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C 1 ~ C 6 のアルキルチオ基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルチオ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C 1 ~ C 6 のアルキルスルフィニル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

C 1 ~ C 6 のアルキルスルホニル基

(ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい)

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよ

10

20

30

40

50

い C 1 ~ C 6 のアシル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノ基  
 水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよい C 1 ~  
 C 6 のアルキル基から独立して選択される 2 つの置換基を有するアミノカルボニル基  
 であり、  
 A が、 $\text{NR}_3\text{C}=\text{O}$  である、  
 < 1 > に記載の化合物又はその塩。  
 < 5 >  
 R が、  
 C 1 ~ C 6 のアルキル基  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び / 10  
 または、  
 独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で場合により置換されていてもよいフェニル基により  
 置換されていてもよい)  
 C 2 ~ C 6 のアルケニル基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び  
 / または、  
 独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で場合により置換されていてもよいフェニル基により  
 置換されていてもよい)  
 C 2 ~ C 6 のアルキニル基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子、及び 20  
 / または、  
 独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>3</sub> で場合により置換されていてもよいフェニル基により  
 置換されていてもよい)  
 独立して 1 ~ 5 個までの置換基 R<sub>4</sub> で場合により置換されるフェニル基  
 独立して 1 ~ 4 個までの置換基 R<sub>4</sub> で場合により置換されるピリジル基  
 であり、  
 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub> が独立して、  
 水素原子  
 ハロゲン原子  
 C 1 ~ C 6 のアルキル基 30  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置  
 換されていてもよい)  
 C 2 ~ C 6 のアルケニル基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルケニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により  
 置換されていてもよい)  
 C 2 ~ C 6 のアルキニル基  
 (ここで、C 2 ~ C 6 アルキニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により  
 置換されていてもよい)  
 C 1 ~ C 6 のアルキルオキシ基 40  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキルオキシ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子に  
 より置換されていてもよい)  
 C 1 ~ C 6 のアルキルチオ基  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキルチオ基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子によ  
 り置換されていてもよい)  
 C 1 ~ C 6 のアルキルスルフィニル基  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルフィニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン  
 原子により置換されていてもよい)  
 C 1 ~ C 6 のアルキルスルホニル基  
 (ここで、C 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原  
 子により置換されていてもよい) 50

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基

水素原子、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC 1 ~ C 6のアルキル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノカルボニル基であり、

Aが、直接結合である、

< 1 > に記載の化合物又はその塩。

< 6 >

< 1 > ~ < 5 > に記載の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの成分を含む殺虫組成物。 10

< 7 >

少なくとも1つの生物学的に有効な化合物または薬剤をさらに含む、< 1 > に記載の殺虫組成物。

< 8 >

前記の少なくとも1つの生物学的に有効な化合物または薬剤が、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、メトルカルブ、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、エチルチオメトン、クロロエトキシホス、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフエンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、デメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル = O - (メトキシアミンボチオホスホリルサリチラート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトンエチル、パラチオン、パラチオン - メチル、PAP、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホスプロベタンホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリミホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン、クロルピリホス - エチル、ジスルフォトン、スルプロホス、フルピラゾホス、フェントエート、ホノホス、トリブホス、エンドスルファン、アルファ - エンドスルファン、ガンマ - HCH、ジコホル、クロルデン、ディルドリン、メトキシクロル、アセトプロール、フィプロニル、エチプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、フルフィプロール、プロフラニリド、アフォキサネル、フルララネル、サロララネル、フルキサメタミド、アクリナトリン、アレスリン、d - c i s - t r a n sアレスリン、d - t r a n sアレスリン、ピフェントリン、カッパ - ピフェントリン、ピオアレスリンS - シクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シベルメトリン、アルファ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンベントリン、エスフェンバレレート、エトフェンブロックス、フェンブロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンブロックス、イミプロトリン、カデスリン、ベルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン、レスメトリン、シラフルオフェン、テフルトリン、カッパ - テフルトリン、フタルスリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、メトキサジアゾン、メトフルトリン、プロフルトリ 50

ン、ピレトラム、テラレトリン、モンフルオロスリン、ヘプタフルトリン、メベルフルス  
 リン、テトラメチルフルスリン、ジメフルトリン、クロロパラレスリン、イブシロン - メ  
 トフルスリン、イブシロン - モンフルオスリン、プロトリフェンブト、アセタミプリド、  
 クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、チ  
 アメトキサム、スルホキサフロル、フルピラジフロム、トリフルメゾピリム、ジクロロメ  
 ゾチアズ、フルピリミン、スピノサド、スピネトラム、アバメクチン、イベルメクチン、  
 エマメクチン安息香酸塩、ミルベメクチン、レピメクチン、ヒドロブレン、キノブレン、  
 ジオフェノラン、メトブレン、ピリプロキシフェン、ピメトロジン、フロニカミド、エト  
 キサゾール、ジアフェンチウロン、アゾシクロチン、シヘキサチン、酸化フェンブタスズ  
 、プロバルギット、テトラジホン、クロルフェナピル、トラロピリル、D N O C、ベンス  
 ルタップ、カルタップ、チオシクラム、チオスルタップ、チオスルタップ - ナトリウム、  
 ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フル  
 フェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフ  
 ルベンズロン、トリフルムロン、ビストリフルロン、ブプロフェジン、シロマジン、クロ  
 マフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド、アミトラズ、ヒ  
 ドラメチルノン、アセキノシル、フルアクリピリム、ピリミノストロピン、フルフェノキ  
 シストロピン、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テ  
 ブフェンピラド、トルフェンピラド、ピフルブミド、スピロジクロフェン、スピロテトラ  
 マト、スピロメシフェン、スピロピディオ、シフルメトフェン、シエノピラフェン、フル  
 ベンジアミド、クロラントラニリブロール、シアントラニリブロール、シクラニリブロー  
 ール、テトラニリブロール、シハロジアミド、テトラクロラントラニリブロール、キノメ  
 チオナート、ヘキシチアゾクス、ピフェナゼート、フルフェネリム、ピリフルキナゾン、  
 フロメトキン、フルオピラム、フルアザインドリジン、アミドフルメト、チクロピラゾフ  
 ロル、チオキサザフェン、オキサゾスルフィル、ニコチン、クロロピクリン、フッ化スル  
 フリル、クリロチエ、クロフェンテジン、ジフロビダジン、ロテノン、インドキサカルブ  
 、ピペロニルブトキシド、クロルジメホルム、ピリダリル、アザジラクチン、ベンゾキシ  
 メート、アフィドピロペン、フルヘキサホン、フルエンシルホン、ベンクロチアズ、カル  
 ゴール、殺虫性石鹼、ジメヒポ、ニチアジン、ホウ酸塩、メタアルデヒド、リアノジン、  
 スルフルラミド、アシノナピル、ベンズピリモキサン、3 - プロモ - N - ( 2 , 4 - ジク  
 ロロ - 6 - (メチルカルバモイル)フェニルイル) - 1 - ( 3 , 5 - ジクロロピリジン -  
 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド、メタラキシル、メタラキシルM、  
 オキサジキシル、オフラセ、ベナラキシル、ベナラキシル - M、キララキシル、オフラ  
 ス、フララキシル、シプロフラン、ブプリメート、ジメチリモール、エチリモール、ヒメ  
 キサゾール、ヒドロキシイソキサゾール、オキサチアピプロリン、オクチリノン、オキシ  
 リニク酸、ベノミル、チオフアネートメチル、カーベンダジム、フベリダゾール、チア  
 ベンダゾール、デバカルブ、ジエトフェンカルブ、ゾキサミド、エタボキサム、ペンシク  
 ロン、フルオピコリド、フルオピモミド、ジフルメトリム、ブプリメート、ベノダニル、  
 フルトラニル、メプロニル、イソフェタミド、フェンフラム、オキシカルボキシ、カル  
 ボキシ、チフルザミド、フルキサピロキサド、フラメトピル、ペンフルフェン、ペンチ  
 オピラド、ベンゾピンジフルピル、ピキサフェン、イソピラザム、セダキサン、インピル  
 フルキサム、フルインダピル、イソフルシプラム、ピラプロポイン、ボスカリド、アゾキ  
 シストロピン、コウメトキシストロピン、クレソキシムメチル、トリフロキシストロピン  
 、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、ジモキシストロピン、メトミノストロピン  
 、オリサストロピン、フルオキサストロピン、ピラオキシストロピン、ピラメトストロピ  
 ン、フルフェノキシストロピン、フェナミンストロピン、エノキサストロピン、クモキシ  
 ストロピン、マンデストロピン、トリクロピリカルブ、ファモキサドン、フェンアミドン  
 、トリクロピリカルブ、ピリベンカルブ、シアゾファミド、アミスルプロム、ピナパクリ  
 ル、メブチルジノカルブ、ジノカップ、フルアジナム、フェリムゾン、酢酸 - フェンチン  
 、塩化フェンチン、水酸化フェンチン、水酸化トリフェニルスズ、酢酸トリフェニルスズ  
 、オキシ銅、シルチオフアム、アメトクトラジン、メパニピリム、ニトラピリン、ピリ

10

20

30

40

50

メサニル、シブロジニル、プラストサイジン S、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、ストレプトマイシン、オキシテトラサイクリン、キノキシフェン、プロキナジド、フルジオキシニル、フェンピクロニル、フルオロイミド、プロシミドン、イブロジオン、ピンクロゾリン、エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン、プロバモカルブ、プロバモカルブ塩酸塩、ゴセイカユブテ抽出物、トリホリン、ピリフェノックス、ピリソキサゾール、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、ブロムコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、エポキシコナゾール、フルキンコナゾール、オキシボコナゾール、ペフラゾエート、ジフェノコナゾール、フェンブコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、イマザリル、ピテルタノール、トリフルミゾール、エタコナゾール、プロピコナゾール、ペンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、マイクロブタニル、パクロブトラゾール、プロチオコナゾール、シブロコナゾール、テブコナゾール、ヘキサコナゾール、プロクロラズ、シメコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、アルジモルフ、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、ジメトモルフ、フルモルフ、ピリモルフ、ピペラリン、フェンプロピディン、スピロキサミン、フェンヘキサミド、フェンピラザミン、フェルバム、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、チラム、マンゼブ、マンネブ、ジネブ、ジラム、ポリカーバメート、プロピネブ、チウラム、ピリブチカルブ、バリダマイシン、ミルジオマイシン、ポリオキシニル、ベンチアパリカルブ、ベンチアパリカルブイソプロピル、バリフェナレート、イブロバリカルブ、マンジプロパミド、フェンピコキサミド、フロリルピコキサミド、フサライド、ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル、アシベンゾラル - S - メチル、プロベナゾール、ジクロベンチアゾクス、チアジニル、イソチアニル、シモキサニル、ホセチル、テクロフタラム、トリアゾキシド、フルスルファミド、ジクロメジン、シフルフェナミド、メトラフェノン、ピリオフェノン、フルチアニル、テブフロキン、イブフルフェノキン、ホセチルアルミニウム、トルクロホス - メチル、エクロメゾール、トルプロカルブ、イブフェントリフルコナゾール、メフェントリフルコナゾール、キノフメリン、ピジフルメトフェン、ボルドー混合液、酢酸銅、塩基性硫酸銅、オキシ塩化銅、水酸化第二銅、オキシキノリン銅、銅、硫黄、キャプタン、カプタホール、フォルベット、アニラジン、クロロタロニル、ジクロロフェン、ペンタクロロフェノール及びその塩、ヘキサクロロベンゼン、キントゼン、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジナルベシル酸塩、グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン酢酸塩、アルベシレート、ジチアノン、キノメチオネート、フルオルイミド、トリルフルアニド、ジクロフルアニド、ジノプトン、ダゾメット、ピラジフルミド、アミノピリフェン、メチルテトラプロール、ピリダクロメチル、ジピメチトロン、ピカルブトラゾクス、テクナゼン、ニトルタール - イソプロピル、ジシクロメット、アシベンゾラル、プロヘキサジオン - カルシウム、プロノポール、ジフェニルアミン、フルメトベル、ベントキサジン、ピフェニル、クロロネブ、CNA、ヨードカルブ、プロチオカルブ、Bacillus 属、及びそれらにより産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、Bt 作物により産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、昆虫病原性バクテリア、昆虫病原性ウイルスおよび昆虫病原性菌類からなる群から選択される、< 7 > に記載の組成物。

< 9 >

殺寄生虫的に有効な量の < 1 > に記載の化合物と、少なくとも 1 つの担体を含む、動物・鳥類を有害寄生性無脊椎生物から保護する組成物。

< 10 >

有害無脊椎生物またはその環境に生物学的に有効な量の < 1 > に記載の化合物を接触させる、有害無脊椎生物を防除する方法。

< 11 >

作物の活力を高める方法であって、作物、作物が成長する種子、または作物の胎座に、生物学的に有効な量の < 1 > に記載の化合物を接触させる、上記方法。

10

20

30

40

50

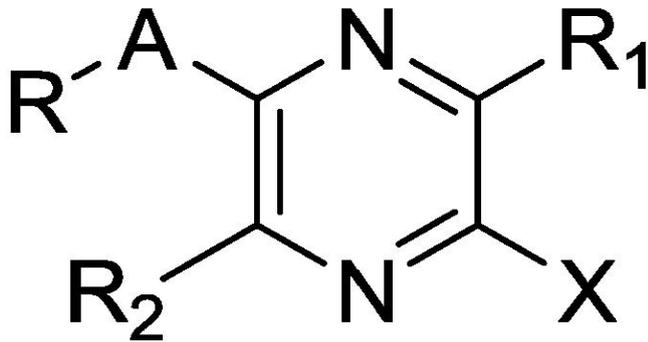
< 1 2 >

処理された種子であって、処理前に、種子の約 0 . 0 0 0 1 ~ 1 重量%の量の < 1 > に記載の化合物を含む、上記種子。

< 1 3 >

式 ( 2 ) :

【化 2】



10

(2)

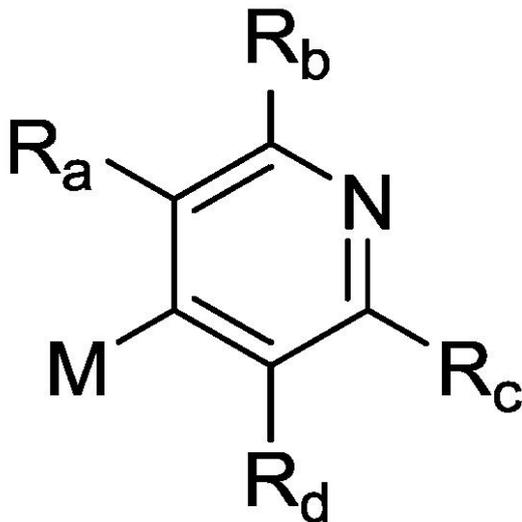
20

{ 式中、R、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>及びAは前記と同じであり、Xはハロゲン原子を示す。 }

で示される化合物と、

式 ( 3 ) :

【化 3】



30

(3)

40

( 式中、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであり、Mはボロニル基、ジアルコキシボロニル基、トリフルオロホウ酸塩、トリアルキルスタニル基或いはハロゲン化亜鉛であることを示す。 )

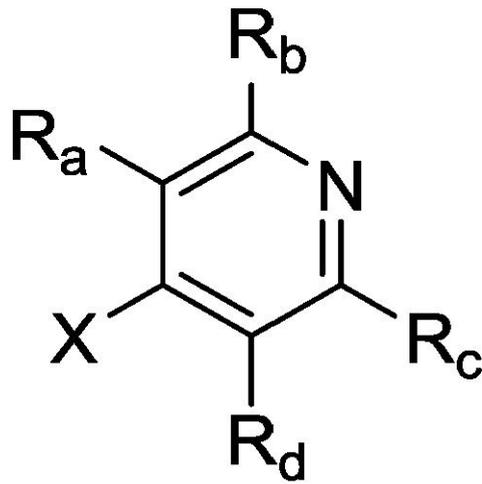
で示される化合物とを反応させることにより得ることを含んでなる、製造方法。

50

&lt; 1 4 &gt;

式 ( 4 ) :

【化 4】



(4)

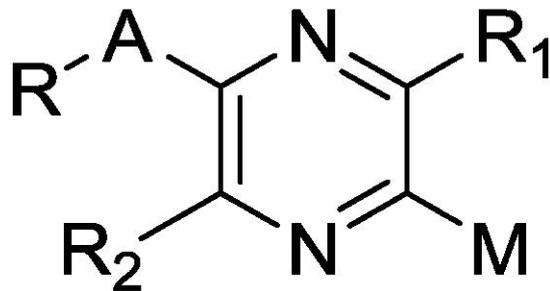
10

20

( 式中、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  は前記と同じであり、 $X$  はハロゲン原子を示す。 )  
 で示される化合物と、

式 ( 5 ) :

【化 5】



(5)

30

( 式中、 $R$ 、 $R_1$ 、 $R_2$  及び  $A$  は前記と同じであり、 $M$  はボロニル基、ジアルコキシボロニル基、トリフルオロホウ酸塩、トリアルキルスタニル基或いはハロゲン化亜鉛であることを示す。 )

40

で示される化合物とを反応させることにより得ることを含んでなる、製造方法。

【 0 0 0 7】

本発明は、式 ( 1 ) の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の成分を含む組成物を提供する。実施形態においては、本発明は、式 ( 1 ) の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の成分を含む有害無脊椎生物を防除するための組成物を提供し、前記組成物は、少なくとも 1 種の生物学的に有効な化合物または薬剤をさらに含む。

【発明の効果】

50

## 【 0 0 0 8 】

本発明による式(1)で表される4-ピリジル基を有するピラジン化合物は、有害生物に対して極めて優れた防除効果を示し、有害生物防除剤として有用である。

## 【 発明を実施するための形態 】

## 【 0 0 0 9 】

式(1)は、本発明による化合物の一般的定義を提供する。式(1)化合物において挙げられる好適な置換基および/または置換基の範囲は、以下に具体的に説明する。

前記式(1)の定義において、「ハロ」とは「ハロゲン原子」を意味し、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はフッ素原子を意味し、「n-」はノルマル、「i-」はイソ、「s-」はセカンダリー、「c-」はシクロ、「t-」はターシャリーを意味し、「Me」はメチル基、「Et」はエチル基、「Pr」はプロピル基、「Bu」はブチル基、「Pen」はペンチル基を意味し、「Ac」はアセチル基を意味する。また「~」を用いて示された数値範囲は、「~」の前後に記載される数値をそれぞれ最小値及び最大値として含む範囲を示す。

10

## 【 0 0 1 0 】

「C1~C6アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、イソペンチル基、ターシャリーペンチル基、ネオペンチル基、2,3-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、ノルマルヘキシル基、イソヘキシル基、2-ヘキシル基、3-ヘキシル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、1,1,2-トリメチルプロピル基、3,3-ジメチルブチル基、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、シクロプロピルメチル基等の直鎖又は分岐鎖、又は環状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、「C2~C6アルケニル基」とは、例えばビニル基、アリル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、ペンテニル基、1-ヘキセニル基、3,3-ジメチル-1-ブテニル基等の直鎖又は分岐鎖、又は環状の炭素原子数2~6個のアルケニル基を示し、「C2~C6アルキニル基」とは、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、3-メチル-1-プロピニル基、2-メチル-3-プロピニル基、ペンチニル基、1-ヘキシニル基、3-メチル-1-ブチニル基、3,3-ジメチル-1-ブチニル基等の直鎖又は分岐鎖、又は環状の炭素原子数2~6個のアルキニル基を示す。

20

30

## 【 0 0 1 1 】

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

40

## 【 0 0 1 2 】

「C1~C6アルキルチオ基」としては、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ター

50

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

10

「C1~C6アルキルスルホニル基」としては、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリーブチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ターシャリーペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、2,3-ジメチルプロピルスルホニル基、1-エチルプロピルスルホニル基、1-メチルブチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基、1,1,2-トリメチルプロピルスルホニル基、シクロプロピルスルホニル基、シクロブチルスルホニル基、シクロペンチルスルホニル基、シクロヘキシルスルホニル基、シクロプロピルメチルスルホニル基等の直鎖又は分岐鎖、又は環状の炭素原子数1~6個のアルキルスルホニル基を示す。

20

【0013】

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

30

【0014】

「C2~C6アルケニルスルフィニル基」としては、例えば、プロペニルスルフィニル基、ブテニルスルフィニル基、ペンテニルスルフィニル基、ヘキセニルスルフィニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルケニルスルフィニル基を示し、「(C2~C6)アルキニルスルフィニル基」としては、例えば、プロピニルスルフィニル基、ブチニルスルフィニル基、ペンチニルスルフィニル基、ヘキシニルスルフィニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルスルフィニル基を示す。

【0015】

「C2~C6アルケニルスルホニル基」としては、例えば、プロペニルスルホニル基、ブテニルスルホニル基、ペンテニルスルホニル基、ヘキセニルスルホニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルケニルスルホニル基を示し、「(C2~C6)アルキニルスルホニル基」としては、例えば、プロピニルスルホニル基、ブチニルスルホニル基、ペンチニルスルホニル基、ヘキシニルスルホニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルスルホニル基を示す。

40

【0016】

上記「C1~C6アルキル基」、「C2~C6アルケニル基」、「C2~C6アルキニル基」、「C1~C6アルキルオキシ基」、「C2~C6アルケニルオキシ基」、「C2~C6アルキニルオキシ基」、「C1~C6アルキルチオ基」、「C1~C6アルキルスル

50

フィニル基」、「C 1 ~ C 6 アルキルスルホニル基」、「C 2 ~ C 6 アルケニルチオ基」、「C 2 ~ C 6 アルキニルチオ基」、「C 2 ~ C 6 アルケニルスルフィニル基」、「C 2 ~ C 6 アルキニルスルフィニル基」、「C 2 ~ C 6 アルケニルスルホニル基」、「C 2 ~ C 6 アルキニルスルホニル基」、「C 1 ~ C 6 アルキルオキシ基」、「C 2 ~ C 6 アルケニルオキシ基」、「C 2 ~ C 6 アルキニルオキシ基」の置換し得る位置に 1 又は 2 以上のハロゲン原子が置換されていても良く、置換されるハロゲン原子が 2 以上の場合は、ハロゲン原子は同一又は異なっても良い。

【 0 0 1 7 】

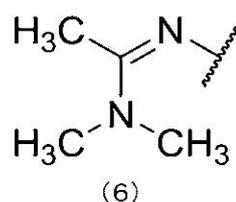
「炭素原子、硫黄原子によりなる 5 若しくは 6 員環のアミノ基」としては、例えば、モルホリノ基、チオモルホリノ基、チオモルホリノ 1 - オキシド基、チオモルホリノ 1 , 1 - ジオキシド基を示す。

10

【 0 0 1 8 】

「N , N - ジメチルアセトイミダミド基」は

【化 6】

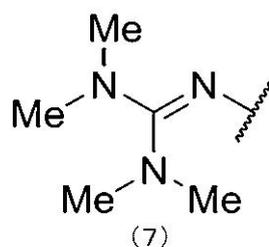


20

を示し、

「1 , 1 , 3 , 3 - テトラメチルグアニジニル基」は

【化 7】



30

を示す。

【 0 0 1 9 】

「( C 1 ~ C 6 )」、「( C 2 ~ C 6 )」、「( C 3 ~ C 6 )」等の表現は各種置換基の炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「( C 1 ~ C 6 ) アルキルオキシ( C 1 ~ C 6 ) アルキル基」の場合は直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1 ~ 6 個のアルキルオキシ基が直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1 ~ 6 個のアルキル基に結合していることを示す。

【 0 0 2 0 】

本発明の式 ( 1 ) で表されるピラジン化合物の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

本発明の式 ( 1 ) で表されるピラジン化合物及びその塩類は、その構造式中に 1 つ又は複数個の不斉中心を有する場合があります。2 種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式 ( 1 ) で表される化合物及びその塩類は、その構造式中に炭素 - 炭素二重結合に由来する 2 種の幾何異性体が存在する場合もある

40

50

が、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

【0021】

本発明の式(1)で表されるピラジン化合物又はその塩類において、好ましくは、Rは、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキル基、又は、独立して1~5個までの置換基R<sub>4</sub>で置換されるフェニル基であり、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub>は独立して、水素原子、又は、ハロゲン原子、又は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキル基、又は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキルオキシ基、又は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキルチオ基、又は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキルスルフィニル基、又は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキルスルホニル基、又は、(水素原子、又は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキル基、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアシル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノ基)、(水素原子、又は、同一もしくは異なる一以上のハロゲン原子により置換されていてもよいC1~C6のアルキル基から独立して選択される2つの置換基を有するアミノカルボニル基)であり、Aは、直接結合、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sub>3</sub>、NR<sub>3</sub>C=O又はC=ONR<sub>3</sub>である。

10

20

【0022】

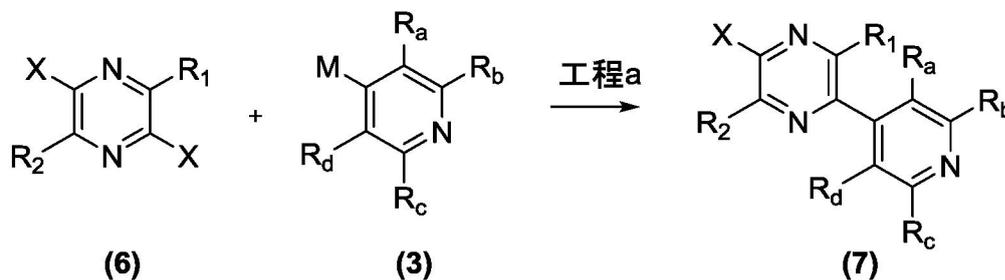
本発明のピラジン化合物又はその塩類は、例えば下記製造方法によって製造することができるが、本発明はこれらに限定されるものではない。また、もう一方の群(B)で表せる化合物は非特許文献1に記載されている。これらの化合物は市販の製剤から得るか、公知の方法により合成することができる。

【0023】

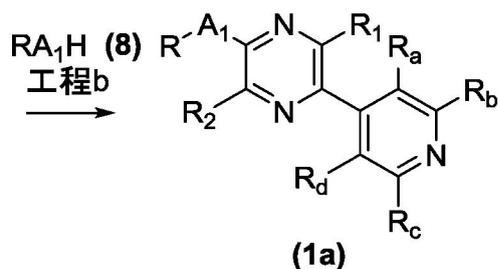
製造方法1

<スキーム1>

【化8】



30



40

【0024】

{式中、R、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであり、Xはハロゲン原子を示し、Mはボロニル基、ジアルコキシボラニル基、トリフルオロホウ酸塩、トリア

50

ルキルスタニル基或いはハロゲン化亜鉛であることを示し、A<sub>1</sub>は酸素原子または硫黄原子を示す。}

【0025】

工程 a の製造方法

式(6)で表されるピラジン化合物と式(3)で表される化合物とを金属触媒、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(7)で表されるピラジン化合物を製造することができる。本反応は文献記載の方法(Journal of Organic Chemistry(2002), vol67, Issue26 p. 9392 - 9396)に準じて行うことができる。

【0026】

本発明で使用できる金属触媒としては、[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)ジクロリド、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム(II)ジクロリド、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)等の0価のパラジウム化合物や、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(アセトニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ベンゾニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、アリルパラジウム(II)クロリド2量体、シクロペンタジエニルアリルパラジウム(II)等公知のパラジウム触媒を挙げるができる。また、必要に応じてそれらのうち2種以上を用いることもできる。本発明におけるパラジウム触媒の使用量は、式(6)で表される化合物に対して通常約0.001倍モル~0.1倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

10

20

【0027】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドライド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、式(6)で表される化合物に対して0.5倍モル~5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

30

40

【0028】

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

【0029】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。また、単離・精製せずに次工程進んでもよい。

【0030】

工程 b の製造方法

式(7)で表されるピラジン化合物と式(8)で表されるアルコール化合物またはチオー

50

ル化合物とを塩基の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより式(1a)で表されるピラジン化合物を製造することができる。

【0031】

本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類；水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化アルカリ金属、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルコキシド類が挙げられる。塩基の使用量は式(7)で表される化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。

【0032】

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

【0033】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。式(8)で表される化合物は式(7)で表されるピラジン化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0034】

製造方法2

<スキーム2>

10

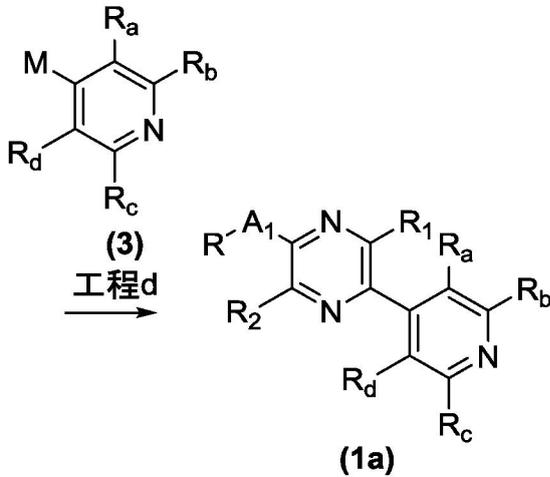
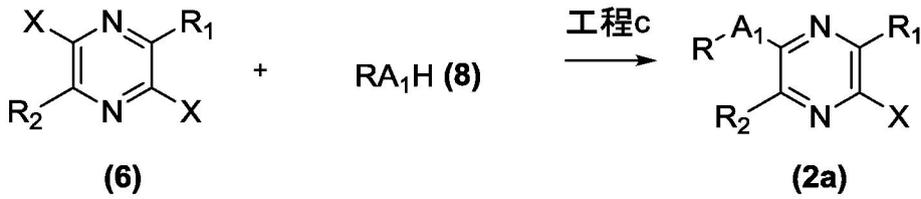
20

30

40

50

【化 9】



10

20

【0035】

{ 式中、R、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであり、X はハロゲン原子を示し、M はボロン酸、ボロン酸エステル、トリフルオロホウ酸塩、トリアルキルスタニル或いは亜鉛であることを示し、A<sub>1</sub> は酸素原子または硫黄原子を示す。 }

【0036】

また、一般式 (1a) の化合物は、スキーム 2 に示されているとおり製造することができる。

【0037】

工程 c の製造方法

式 (6) で表されるピラジン化合物と式 (8) で表されるアルコール化合物またはチオール化合物とを塩基の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより式 (2a) で表されるピラジン化合物を製造することができる。

【0038】

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

40

【0039】

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

50

らの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

【0040】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。式(8)で表される化合物は式(6)で表されるピラジン化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0041】

工程dの製造方法

式(2a)で表されるピラジン化合物と式(3)で表される化合物とを金属触媒、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(1a)で表されるピラジン化合物を製造することができる。

【0042】

本発明で使用できる金属触媒としては、[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)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム(II)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)等の0価のパラジウム化合物や、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(アセトニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ベンゾニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、アリルパラジウム(II)クロリド2量体、シクロペンタジエニルアリルパラジウム(II)等公知のパラジウム触媒を挙げることができる。また、必要に応じてそれらのうち2種以上を用いることもできる。本発明におけるパラジウム触媒の使用量は、一般式(2a)で表される化合物に対して通常約0.001倍モル～0.1倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

【0043】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドリド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、一般式(2a)で表される化合物に対して0.5倍モル～5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

【0044】

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

【0045】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応

10

20

30

40

50

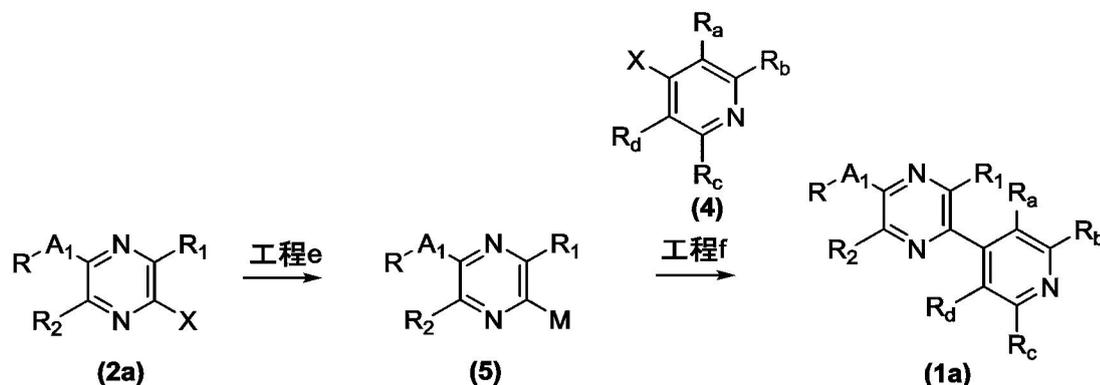
時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0046】

製造方法3

<スキーム3>

【化10】



10

20

【0047】

{ 式中、R、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであり、Xはハロゲン原子を示し、Mはボロニル基、ジアルコキシボランニル基、トリフルオロホウ酸塩、トリアルキルスタニル基或いはハロゲン化亜鉛であることを示し、A<sub>1</sub>は酸素原子または硫黄原子を示す。 }

【0048】

また、式(1a)の化合物は、スキーム3に示されているとおり製造することができる。

【0049】

工程eの製造方法

式(2a)で表されるピラジン化合物とジボランあるいはジボロン、金属触媒、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(5)で表されるピラジン化合物を製造することができる。

30

【0050】

本発明で使用できるジボランあるいはジボロンとしては、テトラヒドロキシジボラン、テトラキス(ジメチルアミノ)ジボロン、ビス(ピナコラト)ジボロン、ビス(ネオペンチルグリコラト)ジボロン、ビス(ヘキシレングリコラト)ジボロン、ビス(カテコラト)ジボロン等のジボランあるいはジボロンが挙げることができる。本発明におけるジボランあるいはジボロンの使用量は、式(2a)で表される化合物に対して通常0.5倍モル～5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

【0051】

本発明で使用できる金属触媒としては、[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)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム(II)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)等の0価のパラジウム化合物や、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(アセトニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ベンゾニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、アリルパラジウム(II)クロリド2量体、シクロペンタジエニルアリルパラジウム(II)等公知のパラジウム触媒を挙げることができる。また、必要に応じてそれらのうち2種以上を用いることもできる。本発明におけるパラジウム触媒の使用量は、式(2a)で表さ

40

50

れる化合物に対して通常約 0.001 倍モル～0.1 倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

【0052】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドリド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、式(2a)で表される化合物に対して0.5倍モル～5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

10

【0053】

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

20

【0054】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。また、単離・精製せずに次工程進んでもよい。

【0055】

30

<工程fの製造方法>

式(5)で表されるピラジン化合物と一般式(4)で表される化合物とを金属触媒、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(1a)で表されるピラジン化合物を製造することができる。

【0056】

本発明で使用できる金属触媒としては、[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)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム(II)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)等の0価のパラジウム化合物や、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(アセトニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ベンゾニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、アリルパラジウム(II)クロリド2量体、シクロペンタジエニルアリルパラジウム(II)等公知のパラジウム触媒を挙げることができる。また、必要に応じてそれらのうち2種以上を用いることもできる。本発明におけるパラジウム触媒の使用量は、式(5)で表される化合物に対して通常約0.001倍モル～0.1倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

40

【0057】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシ

50

ウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドリド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、式(5)で表される化合物に対して0.5倍モル~5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

【0058】

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

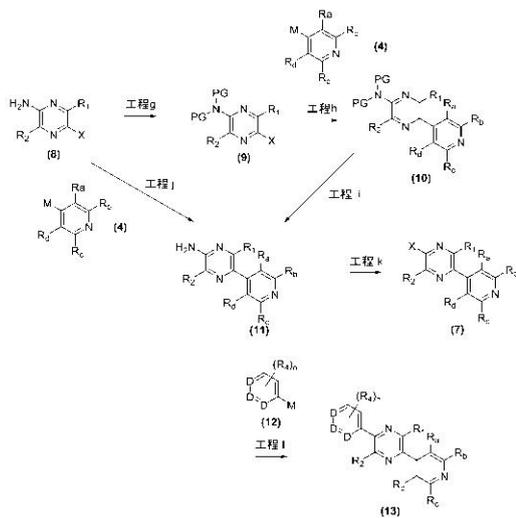
【0059】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

製造方法 4

<スキーム 4 >

【化 1 1】



【0060】

{ 式中、R、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであり、X はハロゲン原子を示し、M はボロニル基、ジアルコキシボラニル基、トリフルオロホウ酸塩、トリアルキルスタニル基或いはハロゲン化亜鉛であることを示し、A<sub>1</sub> は酸素原子または硫黄原子を示し、D は N または C - R<sub>4</sub> を示し、PG は保護基を示し、PG はアミノ基に対して1つまたは2つ結合する。 }

【0061】

工程 g の製造方法

式(8)で表されるピラジン化合物と酸塩化物又は酸無水物とを塩基、触媒及び不活性溶

10

20

30

40

50

媒の存在下、反応させることにより式(9)で表されるピラジン化合物を製造することができる。保護基は、アミノ基に対して1つまたは2つ結合する。

本発明で使用できる保護基としては、塩化アセチル、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸等を反応させたアミド系保護基、クロロギ酸ベンジル、クロロギ酸アリル、クロロ炭酸メチル、クロロギ酸2,2,2-トリクロロエチル、クロロギ酸フルオレニルメチル、N-[2-(トリメチルシリル)エトキシカルボニルオキシ]スクシンイミド、二炭酸ジ-tert-ブチル等を反応させたカルバメート系保護基、ベンジルクロリド、p-メトキシベンジルクロリド等を反応させたベンジル系保護基、2-ニトロベンゼンスルホン基を反応させたスルホンアミド系保護基等が挙げられるが、本反応で使用できる保護基はこれに限らない。その酸塩化物又は酸無水物の使用量は、式(8)で表される化合物に対して通常約1倍モル~3倍モルの範囲で適宜選択すればよい。無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸、二炭酸ジ-tert-ブチルと式(8)の化合物を反応させる際の触媒としては4-ジメチルアミノピリジン等を挙げることができ、その使用量は、式(8)で表される化合物に対して通常約0.1倍モル~1倍モルの範囲で適宜選択すればよい。塩基としてはトリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン等を挙げる事ができ、その使用量は、式(8)で表される化合物に対して通常約1倍モル~5倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

10

#### 【0062】

工程hの製造方法

式(9)で表されるピラジン化合物と式(4)で表される化合物とを金属触媒、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(10)で表されるピラジン化合物を製造することができる。本反応は文献記載の方法(Journal of Organic Chemistry(2002), vol67, Issue26 p. 9392 - 9396)に準じて行うことができる。

20

#### 【0063】

本発明で使用できる金属触媒としては、[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)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム(II)ジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)等の0価のパラジウム化合物や、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(アセトニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ベンゾニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、アリルパラジウム(II)クロリド2量体、シクロペンタジエニルアリルパラジウム(II)等公知のパラジウム触媒を挙げる事ができる。また、必要に応じてそれらのうち2種以上を用いることもできる。本発明におけるパラジウム触媒の使用量は、式(9)で表される化合物に対して通常約0.001倍モル~0.1倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

30

#### 【0064】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドライド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、式(9)で表される化合物に対して0.5倍モル~5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

40

#### 【0065】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、水、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状

50

エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、N, N ジメチルホルムアミド、N, N ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1, 3 ジメチル 2 イミダゾリノン等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することもできる。

【0066】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。また、単離・精製せずに次工程進んでもよい。

10

【0067】

工程 i の製造方法

式(10)で表されるピラジン化合物は、酸もしくは塩基または、2, 3 -ジクロロ - 5, 6 -ジシアノ - p -ベンゾキノンやヘキサニトратセリウム(IV)酸アンモニウム等の酸化剤または、酸及び金属亜鉛粉末または、テトラブチルアンモニウムフルオリドと不活性溶媒の存在下反応させるか、またはパラジウム等の触媒及び不活性溶媒下、水素添加することにより式(11)で表されるピラジン化合物を製造することができる。

【0068】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～24時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。また、単離・精製せずに次工程進んでもよい。

20

【0069】

本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類；水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化アルカリ金属、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルコキシド類；ピペリジン、ピロリジン、モルポリン、ピリジン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量は式(10)で表される化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。

30

【0070】

本反応で使用できる酸としては、例えば、塩酸、硫酸、リン酸、トリフルオロ酢酸等が挙げられる。酸の使用量は式(10)で表される化合物に対して通常約1倍モル～10倍モルの範囲で使用される。

【0071】

本反応で使用できるパラジウム触媒としては、例えば、パラジウム、水酸化パラジウム等が挙げられる。その使用量は式(10)で表される化合物に対して通常約0.05倍モル～1倍モルの範囲で使用される。

40

【0072】

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

50

らの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

【0073】

工程 j の製造方法

(11) で表される化合物は、(8) で表される化合物のアミノ基を、工程 g で保護基により保護し、工程 h で式(10) で表されるピラジン化合物とした後、工程 i で脱保護して化合物(11) を合成できるが、(8) で表される化合物と(4) で表される化合物とを工程 h と同様の条件で反応させることにより、(11) で示される化合物を直接を製造することもできる。

【0074】

工程 k の製造方法

式(11) で表されるピラジン化合物とジアゾ化試薬、ハロゲン化物、酸及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(7) で表されるピラジン化合物を製造することができる。反応によっては酸を加えなくても良い。本反応は文献記載の方法(WO2013/053690A1) に準じて行うことができる。

10

【0075】

本反応で使用できる酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、テトラフルオロオロほう酸、硫酸が挙げられる。その使用量はジアゾ化試薬に対して通常約1倍モル以上使用され、酸を溶媒として使用することもできる。

【0076】

本反応で使用できるハロゲン化物としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、臭素、ヨウ素、ジヨードメタン、塩化銅(I)、ヨウ化銅(I)、ヨウ化銅(II)、ヨウ化ナトリウム(I)、ヨウ化カリウム(I)、ヨウ化セシウム(I)、臭化銅(II)、テトラフルオロオロほう酸、が挙げられる。その使用量は式(11) で表される化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。

20

【0077】

本反応で使用できるジアゾ化試薬としては、例えば、亜硝酸ナトリウム、亜硝酸イソアミル、亜硝酸 tert - ブチル等が挙げられる。その使用量は式(11) で表される化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。

【0078】

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

30

【0079】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

40

【0080】

工程 l の製造方法

式(7) で表されるピラジン化合物と式(12) で表される化合物とを金属触媒、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(13) で表されるピラジン化合物を製造することができる。本反応は文献記載の方法(Journal of Organic Chemistry(2

50

002), vol167, Issue26 p. 9392 - 9396) に準じて行うことができる。

【0081】

本発明で使用できる金属触媒としては、[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)ジクロリド、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム(II)ジクロリド、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)等の0価のパラジウム化合物や、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(アセトニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、ビス(ベンゾニトリル)パラジウム(II)ジクロリド、アリルパラジウム(II)クロリド2量体、シクロペンタジエニルアリルパラジウム(II)等公知のパラジウム触媒を挙げることができる。また、必要に応じてそれらのうち2種以上を用いることもできる。本発明におけるパラジウム触媒の使用量は、式(7)で表される化合物に対して通常約0.001倍モル~0.1倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

10

【0082】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、ナトリウムターシャリーブトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルコキシド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドリド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、式(7)で表される化合物に対して0.5倍モル~5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

20

【0083】

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

30

【0084】

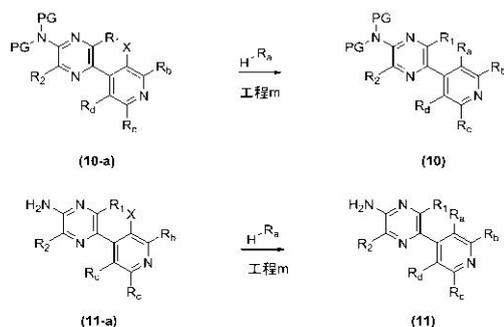
本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すれば良い。反応終了後、目的物は該目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。また、単離・精製せずに次工程進んでもよい。

40

製造方法 5

<スキーム 5 >

## 【化 1 2】



10

## 【0085】

工程 m の製造方法

式 (10) または (11) で示される化合物の  $R_a$  部がハロゲン原子である (10-a) または (11-a) とヒドロキシル基またはアミノ基またはメルカプト基を持つ  $H-R_a$  とを、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式 (10) または式 (11) で表されるピラジン化合物を製造することができる。

## 【0086】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドライド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、式 (10-a) 又は式 (11-a) で表される化合物に対して 0.5 倍モル ~ 5.0 倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

20

## 【0087】

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

30

## 【0088】

本発明は式 (1) の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分を含む組成物を提供する。実施形態においては、本発明は、式 (1) の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分を含む有害無脊椎動物を防除するための組成物を提供し、前記組成物は、少なくとも1種の生物学的に有効な化合物または薬剤をさらに含んでよい。

40

## 【0089】

式 (1) で表される化合物は、以下の実施例で示されるように、農園芸有害害虫に対して優れた防除活性を示すものである。従って、本発明によれば、式 (1) で表される化合物またはその塩を有効成分として含んでなる有害生物防除剤が提供される。また、本発明による有害生物防除剤は、これらの化合物の農園芸上許容可能な酸付加塩を有効成分として含むものとしてもよい。

50

酸付加塩とは、具体的には例えば、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、等の無機酸類、ギ酸塩、酢酸塩、シュウ酸塩、クエン酸塩、コハク酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、酒石酸塩、乳酸塩、安息香酸塩、フタル酸塩、等のカルボン酸塩類、メシル酸塩、トシル酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、等のスルホン酸塩類、等が挙げられる。

【 0 0 9 0 】

本発明において防除の対象とする虫種（式（１）で表される化合物が防除効果を示す虫種）は特に限定されるものではなく、広範な農園芸における有害害虫の防除に用いる事ができる。好ましい防除対象虫種としては、例えば、以下のものが挙げられる。鱗翅目害虫（Lepidoptera）{例えば、ニカメイガ（*Chilo suppressalis*）、Darkheaded stem borer（*Chilo polychrysus*）、White stem borer（*Scirpophaga innotata*）、  
10 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（*Hellula 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（Pylalidae）；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*）、  
20 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  
30 ヨウ科（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*）、コドリंगा（*Cydia pomonella*）、カンシャシンクイハマキ（*Tetramesa schistaceana*）、Bean Shoot Borer（*Epinotia aporema*）、Citrus fruit borer（*Ecdytolopha aurantiana*）等のハマキガ科（Tortricidae）；チャノホソ  
40 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  
50 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（Pluteliidae）；モモキバガ（*Anarsia lineatella*）、イモキバガ（*Helcystogramma triannulella*）、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) }。半翅目害虫 (Hemiptera) { 例えば、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*)、クロフツノウンカ (*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 citricida*)、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 (*Leptocorisa chinensis*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisa acuta*) 等のホソヘリカメムシ科 (Alydidae) ; ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、アシピロヘリカメムシ (*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 (*Caverellius 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 (*Pealius 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 (*Margaronidae*) ; ナスコナカイガラムシ (*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 (*Brevienia 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 ; 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*)。甲虫目害虫 (*Coleoptera*) { 例えば、ウエ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パービートル (*Diabrotica balteata*)、Cucurbit Beetle (*Diabrotica speciosa*)、ピ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*)、グレーブ・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 (*Di cladispa armigera*)、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*) ; Seedcorn 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*)、クロマルコガネ (*Tomarus gibbosus*)、Holotrichia 属 (*Holotr*

ichia 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 call osus*)、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*)、マツノキクイムシ (*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*) ; ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等のテントウムシ科 (*Coccinellidae*) ; ヒラタキクイムシ (*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 (*Agriotes 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 (*Limonius* 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*) }。総翅目害虫 (*Thysanoptera*) { 例えば、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*) }。双翅目害虫 (*Diptera*) { 例えば、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 (*Hydrellia philippina*)、イネクキミギワバエ (*Hydrellia sasakii*) 等のミギワバエ科 (*Ephydriidae*) ; オウトウショウジョウバエ (*Drosophila suzukii*) 等のショウジョウバエ科 ; 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 ; 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*) ; Diop

sis macrophthalma等のシュモクバエ科 (Diopsidae) ; 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) }。膜翅目害虫 (Hymenoptera) { 例え  
 ば、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) ; ファイヤールアント (Solenopsis spp.)科、Brown leaf-cutting ant (Atta capiguara)等のアリ科 (Formicidae)等}。直翅目害虫  
 (Orthoptera) { 例え、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)、Ita 10  
 alian Locust (Calliptamus italicus)、Differential grasshopper (Melanoplus  
 differentialis)、Two striped grasshopper (Melanoplus bivittatus)、  
 Migratory grasshopper (Melanoplus sanguinipes)、Red-Legged grassho  
 pper (Melanoplus femurrubrum)、Clearwinged grasshopper (Camnula p  
 ellucida)、サバクワタリバッタ (Schistocerca gregaria)、Yellow-winged lo  
 cust (Gastrimargus musicus)、Spur-throated locust (Austracris guttulo  
 sa)、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 (Gryll  
 otalpa orientalis)等のケラ科 (Gryllotalpidae) ; ヨーロッパエコオロギ (Ac  
 heta domestica)、エンマコオロギ (Teleogryllus emma)等のコオロギ科 (Gryll  
 idae) ; Mormon cricket (Anabrus simplex)等のキリギリス科 (Tettigoniid  
 ae) }。ゴキブリ目害虫 (Blattodea) { 例え、チャバネゴキブリ (Blattella ger  
 manica)等のチャバネゴキブリ科 (Blattellidae) ; クロゴキブリ (Periplaneta f  
 uliginosa)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、トビイロゴキブリ (Pe  
 riplaneta brunnea)、トウヨウゴキブリ (Blatta orientalis)、ヤマトゴキブリ (P  
 eriplaneta japonica)、コワモンゴキブリ (Periplaneta australasiae)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 mi  
 nor)、ダイコクシロアリ (Cryptotermes domesticus)、タイワンシロアリ (Odo  
 ntotermes formosanus)、コウシュンシロアリ (Neotermes koshunensis)、サ 30  
 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 (Hodoter  
 mopsis 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 (Reticulite  
 rmes 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 cumul  
 ans等のシロアリ科 (Termitidae) }。ダニ目害虫 (Acari) { 例え、ナミハダニ (T  
 etranychus 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 40  
 ハダニ (Panonychus ulmi)、オリゴニカス属 (Oligonychus spp.)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 (Calacarus carinatus)、チャノナガサビダニ (Acaphylla theavag  
 rans)、ニセナシサビダニ (Eriophyes chibaensis)、リンゴサビダニ (Aculus s  
 chlechtendali)、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)等のヒメハダニ科 (Tenuipalpidae) ; ケナ  
 ガハダニ科 (Tuckerellidae) ; フタトゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis 50

)、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*)、ブラックレグドチツク (*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*)；ホツツメダニ (*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 (*Listrophoridae*)；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}。植物寄生性線虫 {例えば、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、イチゴセンチュウ (*Aphelenchoides fragariae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*)、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 等の葉線虫目 (*Aphelenchida*) 線虫、ジャガイモシロシストセンチュウ (*Globodera pallida*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、リンゴネコブセンチュウ (*Meloidogyne mali*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ノコギリネグサレセンチュウ (*Pratylenchus drenatus*)、チャネグサレセンチュウ (*Pratylenchus loosi*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、クルミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus vulnus*)、カンキツネモグリセンチュウ (*Radopholus citrophilus*)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 等のハリセンチュウ目 (*Tylenchida*) }。

10

20

30

40

50

## 【0091】

本発明において防除の対象とする虫種(式(1))で表される化合物が防除効果を示す虫種)は、さらに、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫、寄生虫などの有害生物の防除にも使用できる。特に人獣に害をなす外部寄生虫に対する防除効果に優れる。防除の対象となる外部寄生虫としては、宿主動物の背、脇下、下腹部、内股部などに寄生して動物・鳥類から血液やフケなどの栄養源を得て生息するもの、および宿主動物の背、臀部などに飛来して動物・鳥類から血液やフケなどの栄養源を得て生息するものを包含する。外部寄生虫としては、ダニ類、シラミ類、ノミ類などが挙げられる。

## 【0092】

本発明の防除剤が有効な宿主動物としては、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ハムスター、モルモット、リス、ウサギ、フェレット；愛玩鳥(例えば、ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリア)；ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ；家禽(例えば、アヒル、ニワトリ、ウズラ、ガチョウ)；ミツバチ(例えば、セイヨウミツバチ、ニホンミツバチ)；などが挙げられる。

## 【0093】

すなわち、本発明の有害生物防除剤は、上記の動物・鳥類を保護対象とした動物用外部寄生虫防除剤として有効である。

【0094】

対象となるダニ類 (Acari) としては以下の害虫が挙げられる。中気門目 (Mesostigmata) のダニ類 (mite) {例えば、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等のワクモ科 (*Dermanyssidae*) ; イエダニ属 (*Ornithonyssus* spp.) のトリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、ネッタイトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*)、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*) を含むオオサシダニ科 (*Macronyssidae*) のダニ ; トゲダニ属種 (*Laelaps* spp.) のネズミトゲダニ (*Laelaps echidninus*)、ホクマントゲダニ (*Laelaps jettmari*)、ミツバチトゲダニ (*Tropilaelaps clarae*) を含むトゲダニ科 (*Laelapidae*) のダニ ; ヘギダニ属種 (*Varroa* spp.) のミツバチヘギイタダニ (*Varroa destructor*)、パロアジャコブソニ (*Varroa jacobsoni*)、パロアアンデルウッディ (*Varroa underwoodi*) を含むヘギダニ科 (*Varroidae*) } のダニ。後気門目 (Metastigmata) のマダニ類 (tick) {例えば、ナガヒメダニ属種 (*Argas* spp.) のナガヒメダニ (*Argas persicus*)、アルガス・リフレクサス (*Argas reflexus*)、ヒメダニ属種 (*Ornithodoros* spp.) のオルニトドラス・モウバータ (*Ornithodoros moubata*) を含むヒメダニ科 (*Argasidae*) のマダニ ; チマダニ属種 (*Haemaphysalis* spp.) のヘマフィサリス・コンシナ (*Haemaphysalis concinna*)、ヘマフィサリス・パンクタータ (*Haemaphysalis punctata*)、ヘマフィサリス・シンアバリナ (*Haemaphysalis cinnabarina*)、ヘマフィサリス・オトフィラ (*Haemaphysalis otophila*)、ヘマフィサリス・レアチ (*Haemaphysalis leachi*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、マゲシマチマダニ (*Haemaphysalis mageshimaensis*)、イエンチマダニ (*Haemaphysalis yeni*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、クロウサギチマダニ (*Haemaphysalis pentalagi*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspina*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ダグラスチマダニ (*Haemaphysalis douglasi*)、キララマダニ属種 (*Amblyomma* spp.) のアンブリオマ・アメリカナム (*Amblyomma americanum*)、アンブリオマ・バリエガタム (*Amblyomma variegatum*)、アンブリオマ・マキュラタム (*Amblyomma maculatum*)、アンブリオマ・ヘブラエウム (*Amblyomma hebraeum*)、アンブリオマ・カジェネンス (*Amblyomma cajennense*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、マダニ属種 (*Ixodes* spp.) のマダニ (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ヘキサゴナス (*Ixodes hexagonus*)、イクソデス・キャニスガ (*Ixodes canisuga*)、イクソデス・ピロサス (*Ixodes pilosus*)、イクソデス・ルビキュンダス (*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカプularis (*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス (*Ixodes holocyclus*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツェマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、ウシマダニ亜属種 (*Boophilus* spp.) のオウシマダニ (*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*)、リピセファラス (ブーフイラス) ・デコロラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus*)、リピセファラス (ブーフイラス) ・アニユラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) annulatus*)、リピセファラス (ブーフイラス) ・カルセラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) calceratus*)、コイタマダニ属種 (*Rhipicephalus* spp.) のリピセファラス・エベルトシ (*Rhipicephalus evertsi*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファラス・ブルサ (*Rhipicephalus bursa*)、リピセファラス・アッペンディキュラタス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファラス・キャペンシス (*Rhipicephalus capensis*)、リピセファラス・ツラニカス (*Rhipicephalus turanicus*)、リピセファラス・ザンベジエンシス (*Rhipicephalus zambeziensis*)、カクマダニ属種 (*Dermacentor* spp.) のデルマセントール・マルギナタス (*Dermacentor marginatus*)、デルマセントール・レティキュラタス (*Dermacentor reticulatus*)、デルマセン

10

20

30

40

50

トール・ピクタス (*Dermacentor pictus*)、デルマセントール・アルビピクタス (*Dermacentor albipictus*)、デルマセントール・アンデルソニ (*Dermacentor andersoni*)、デルマセントール・バリアビリス (*Dermacentor variabilis*) を含むマダニ科 (*Ixodidae*) のダニ}。無気門目 (*Astigmata*) のコナダニ類 (*Acaridida*) { 10  
 例えばキュウセンヒゼンダニ属種 (*Psoroptidae* spp.) のヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*)、ウサギキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウマキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes equi*)、シヨクヒヒゼンダニ属種 (*Chorioptes* spp.) のシヨクヒヒゼンダニ (*Chorioptes bovis*)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.) のミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*) を含むキュウセンヒゼンダニ科 (*Psoroptidae*) のダニ；ヒゼンダニ属種 (*Sarcoptes* spp.) のセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、イヌセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes canis*)、ウシセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes bovis*)、ヒツジセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes ovis*)、サルコプテス・ルピカブラエ (*Sarcoptes rupicaprae*)、ウマセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes equi*)、ブタセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes suis*)、ノトエドス属種 (*Notoedres* spp.) のネコシヨウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) を含むヒゼンダニ科 (*Sarcoptidae*) のダニ；トリアシヒゼンダニ属種 (*Knemidokoptes* spp.) のトリアシヒゼンダニ (*Knemidokoptes mutans*) を含むトリヒゼンダニ科 (*Knemidokoptidae*) のダニ}。前気門目 (*Prostigmata*) のケダニ類 (*Actinedida*) { 20  
 例えばニキビダニ属種 (*Demodex* spp.) のイヌニキビダニ (*Demodex canis*)、ウシニキビダニ (*Demodex bovis*)、ヒツジニキビダニ (*Demodex ovis*)、ヤギニキビダニ (*Demodex caprae*)、ウマニキビダニ (*Demodex equi*)、デモデックス・カバリ (*Demodex caballi*)、ブタニキビダニ (*Demodex suis*)、ネコニキビダニ (*Demodex cati*) を含むニキビダニ科 (*Demodixidae*) のダニ；ツツガムシ属種 (*Trombicula* spp.) のトロンビキュラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、トロンビキュラ・アカムシ (*Trombicula akamushi*) を含むツツガムシ科 (*Trombiculidae*) }。シラミ類 (*Phthiraptera*) としては以下の害虫が挙げられる。シラミ亜目 (*Anoplura*) のシラミ類 (*louse*) { 30  
 例えばブタジラミ属種 (*Haematopinus* spp.) のウマジラミ (*Haematopinus asini*)、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*) を含むケモノジラミ科 (*Haematopinidae*) のシラミ；リノグナツス属種 (*Linognathus* spp.) のイヌジラミ (*Linognathus setosus*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、リノグナサス・オビラス (*Linognathus ovillus*)、リノグナサス・オビフォルミス (*Linognathus oviformis*)、リノグナサス・ペダリス (*Linognathus pedalis*)、ヤギホソジラミ (*Linognathus stenopsis*)、ソレノポテス属種 (*Solenopotes* spp.) のケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) を含むケモノホソジラミ科 (*Linognathidae*) のシラミ}。タンカクハジラミ亜目 (*Amblycera*) のハジラミ類 (*biting louse*) { 40  
 例えばメナカンツス属種 (*Menacanthus* spp.) のニワトリオオハジラミ (*Menacanthus stramineus*)、ニワトリツノハジラミ (*Menacanthus cornutus*)、ウスイロニワトリハジラミ (*Menacanthus pallidulus*)、例えばメノポン属種 (*Menopon* spp.) のニワトリハジラミ (*Menopon gallinae*) を含むタンカクハジラミ科 (*Menoponidae*) のハジラミ}。チョウカクハジラミ亜目 (*Ischnocera*) のハジラミ類 (*biting louse*) { 40  
 例えばコランビコーラ属種 (*Columbicola* spp.) のハトナガハジラミ (*Columbicola columbae*)、クルクロトガステル属種 (*Cuclotogaster* spp.) のハバビロナガハジラミ (*Cuclotogaster heterographus*)、ゴニオデス属種 (*Goniodes* spp.) のカクアゴハジラミ (*Goniodes dissimilis*)、マルハジラミ (*Goniodes gigas*)、ヒメニワトリハジラミ (*Goniodes gallinae*)、リペウルス属種 (*Lipeurus* spp.) のニワトリナガハジラミ (*Lipeurus caponis*) を含むチョウカクハジラミ科 (*Philopteriidae*) のハジラミ；ボビコーラ属種 (*Bovicola* spp.) のウシハジラミ (*Bovicola bovis*)、ヒツジハジラミ (*Bovicola ovis*)、ボビコーラ・リンパータ (*Bovicola limbata*)、ヤギハジラミ (*Bovicola caprae*)、ウマハジラミ (*Bovicola equi*)、ケモ 50

ノハジラミ属種 (*Trichodectes* spp.) のイヌハジラミ (*Trichodectes canis*)、フェリコラ属種 (*Felicola* spp.) のネコハジラミ (*Felicola subrostrata*) を含むケモノハジラミ科 (*Trichodectidae*) のハジラミ}。ノミ類 (*Siphonaptera*) としては以下の害虫が挙げられる。例えばスナノミ属種 (*Tunga* spp.) のスナノミ (*Tunga penetrans*) を含むスナノミ科 (*Tungidae*) のノミ; イヌノミ属種 (*Ctenocephalides* spp.) のイヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、アルカエオプシラ属種 (*Archaeopsylla* spp.) のハリネズミノミ (*Archaeopsylla erinacei*)、ネズミノミ属種 (*Xenopsylla* spp.) の東洋ネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、ヒトノミ属種 (*Pulex* spp.) のヒトノミ (*Pulex irritans*)、エチドノファガ属種 (*Echidnophaga* spp.) のニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea*) を含むヒトノミ科 (*Pulicidae*) のノミ; ナガノミ属種 (*Ceratophyllus* spp.) のトリノミ (*Ceratophyllus gallinae*)、ヤマトネズミノミ (*Ceratophyllus anisus*)、ノソプスルラス属種 (*Nosopsyllus* spp.) のヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*) を含むナガノミ科 (*Ceratophyllidae*) のノミ; ホソノミ属種 (*Leptopsylla* spp.) のメクラネズミノミ (*Leptopsylla segnis*) を含むホソノミ科 (*Leptopsyllidae*) のノミ。その他にも、対象となる外部寄生虫としては、半翅目 (*Hemiptera*) の害虫が挙げられる。半翅目 (*Hemiptera*) の害虫としては以下の害虫が挙げられる。例えば、シメックス属種 (*Cimex* spp.) のトコジラミ (*Cimex lectularius*) を含むトコジラミ科 (*Cimicidae*) の昆虫; パンストロンギラス属種 (*Panstrongylus* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.) のベネズエラサシガメ (*Rhodnius prolixus*)、サシガメ属種 (*Triatoma* spp.) のサシガメ (*Triatoma infestans*) を含むサシガメ科 (*Reduviidae*) の昆虫。その他にも、刺咬性昆虫 (咀嚼性ハエ、吸血成虫ハエ、移動性双翅類の幼虫、寄生バエのウジ) である双翅目 (*Diptera*) 害虫にも有効である。ハエ類 (*Diptera*) の害虫としては以下の害虫が挙げられる。長角亜目 (*Nematocera*) {例えば (a) イエカ属種 (*Culex* spp.) のネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、キュレックス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、チカイエカ (*Culex pipiens molestus*)、ネッタイエカ (*Culex pipiens fatigans*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus summorosus*)、アルミグレス属種 (*Armigeres* spp.) のオオクロヤブカ (*Armigeres subalbatus*)、ハマダラカ属種 (*Anopheles* spp.) のガンビアハマダラカ (*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・マキュリペニス (*Anopheles maculipennis*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、オオツルハマダラカ (*Anopheles lesteri*)、ヤブカ属種 (*Aedes* spp.) のネッタيشマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、イーデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、トウゴウヤブカ (*Aedes togoi*)、キンイロヤブカ (*Aedes vexans nipponii*) を含むカ科 (*Culicidae*) のカ; (b) ブユ属種 (*Simulium* spp.) のシムリウム・レプタンス (*Simulium reptans*)、ツメトゲブユ (*Simulium ornatum*)、ヒメアシマダラブユ (*Simulium venustum*)、ウマブユ (*Simulium salopiense*)、プロシムリウム属種 (*Prosimulium* spp.) のキアシオオブユ (*Prosimulium yezoense*) を含むブユ科 (*Simuliidae*) のブユ; クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.) のニワトリヌカカ (*Culicoides arakawae*)、ウスシロフヌカカ (*Culicoides pictimargo*)、キブネヌカカ (*Culicoides kibunensis*)、セマダラヌカカ (*Culicoides homotomus*)、ウシヌカカ (*Culicoides oxystoma*)、ニッポンヌカカ (*Culicoides nipponensis*)、ホシヌカカ (*Culicoides punctatus*)、ミヤマヌカカ (*Culicoides maculatus*)、マツザワヌカカ (*Culicoides matsuzawai*) を含むヌカカ科 (*Ceratopogonidae*) のヌカカ。}。短角亜目 {例えば、(a) 例えバブ属種 (*Tabanus* spp.) のタバヌス・プロミウス (*Tabanus bromius*)、タバヌス・スポドプテルス (*Tabanus spodopterus*)、タバヌス・アトラタス (*Tabanus atratus*)、タバヌス・ステチカス (*Tabanus sudeticus*)、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、アカウシアブ (*Tabanus*

chrysurus)、シロフアブ (*Tabanus trigeminus*)、キスジアブ (*Tabanus fulvi medioides*)、イヨシロオビアブ (*Tabanus iyoensis*)、メクラアブ属種 (*Chrysops spp.*) のクリソプス・カエキュチエンス (*Chrysops caecutiens*)、クリソプス・レリクタス (*Chrysops relictus*)、キンメアブ (*Chrysops suavis*)、クロキンメアブ (*Chrysops japonicus*) を含むアブ科 (*Tabanidae*) のアブ；イエバエ属種 (*Muscina spp.*) のイエバエ (*Musca domestica*)、クロイエバエ (*Musca bezzii*)、ノイエバエ (*Musca hervei*)、ウスイロイエバエ (*Musca conducens*)、オオイエバエ (*Musca stabulans*)、サシバエ属種 (*Stomoxys spp.*) のサシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、ノサシバエ属種 (*Haematobia spp.*) のノサシバエ (*Haematobia irritans*)、ヘマトビア・イリタンス・エクシグア (*Haematobia irritans exigua*)、ヘマトビア・スティミュランス (*Haematobia stimulans*)、ヒメイエバエ属種 (*Fannia spp.*) のヒメイエバエ (*Fannia canisularis*) を含むイエバエ科 (*Muscidae*) のハエ；シェシェバエ属種 (*Glossina spp.*) を含むツエツエバエ科 (*Glossinidae*) のハエ；メロファガス属種 (*Melophagus spp.*) のシラミバエ (*Melophagus ovinus*) を含むシラミバエ科 (*Hippoboscidae*) のハエ；クロバエ属種 (*Calliphora*) の、オオクロバエ (*Calliphora lata*)；、キンバエ属種 (*Lucilia spp.*) のヒツジキンバエ (*Lucilia (Phaenicia) cuprina*) ヒロズキンバエ (*Lucilia (Phaenicia) sericata*)、ミドリキンバエ (*Lucilia illustris*)、オビキンバエ属 (*Chrysomya spp.*) のラセンウジバエ (*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・クロロピガ (*Chrysomya chloropyga*)、クリソミア・ベジアナ (*Chrysomya bezziana*) を含むクロバエ科 (*Calliphoridae*) のハエ；カワモグリバエ亜科 (*Cuterebrinae*) のウサギヒフバエ属種 (*Cuterebra spp.*)、ウシバエ亜科 (*Hypodermatinae*) のさらにはウシバエ属種 (*Hypoderma spp.*) のウシバエ (*Hypoderma bovis*)、キスジウシバエ (*Hypoderma lineatum*)、ウマバエ亜科 (*Gasterophilinae*) のさらにはウマバエ属種 (*Gasterophilus spp.*) のウマバエ (*Gasterophilus intestinalis*)、アトアカウマバエ (*Gasterophilus haemorrhoidalis*)、ガステロフィラス・イネルミス (*Gasterophilus inermis*)、ムネアカウマバエ (*Gasterophilus nasalis*)、ガステロフィラス・ニグリコルニス (*Gasterophilus nigricornis*)、アカウマバエ (*Gasterophilus pecorum*)、ヒツジバエ亜科 (*Oestrinae*) のさらにはヒツジバエ属種 (*Oestrus spp.*) のヒツジバエ (*Oestrus ovis*) を含むヒツジバエ科 (*Oestridae*) のハエ)。

10

20

30

## 【0095】

式(1)で表される化合物を農園芸用殺虫剤として用いる場合、式(1)で表される化合物をそのまま用いても良いが、適当な固体担体、液体担体、ガス状担体等、界面活性剤、分散剤、その他の製剤用補助剤、等とともに混合して農薬製剤を調製して用いても良い。前記農薬製剤として、好ましくは、乳剤、EW剤、液剤、懸濁剤、水和剤、顆粒水和剤、粉剤、DL粉剤、粉粒剤、粒剤、錠剤、油剤、エアゾル、フロアブル剤、ドライフロアブル剤、マイクロカプセル剤、等を挙げる事ができる。これら農薬製剤として任意に選択される剤型として用いることができる。本発明での担体とは固体担体、液体担体、ガス状担体等を指す。

40

## 【0096】

前記固体担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、ケイソウ土、パーミキュライト、ホワイトカーボン、炭酸カルシウム、酸性白土、珪砂、珪石、ゼオライト、パーライト、アタパルジャイト、軽石、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、尿素等が挙げられる。

前記液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、n-ヘキサノール、エチレングリコール、プロピレングリコール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、n-ヘキサン、ケロシン、灯油等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリ

50

ル、イソブチロニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ダイズ油、綿実油等の植物油類、ジメチルスルホキシド、水等が挙げられる。

また、前記ガス状担体としてはLPG、空気、窒素、炭酸ガス、ジメチルエーテル等があげられる。

前記界面活性剤および前記分散剤としては、例えば、アルキル硫酸エステル類、アルキル（アリアル）スルホン酸塩類、ポリオキシアルキレンアルキル（アリアル）エーテル類、多価アルコールエステル類、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルマリン縮合物、ポリカルボン酸塩、POEポリスチリルフェニルエーテル硫酸塩およびリン酸塩、POE・POPブロックポリマー等が挙げられる。

10

さらに、前記製剤用補助剤としては、例えば、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール、キサントガム、化デンプン、アラビアガム、ポリビニルピロリドン、エチレン-アクリル酸共重合体、エチレン-酢酸ビニル共重合体、ポリエチレングリコール、流動パラフィン、ステアリン酸カルシウム、及び消泡剤、防腐剤等が挙げられる。

上記の各種担体、界面活性剤、分散剤、および製剤用補助剤は、必要に応じて各々単独で、あるいは組み合わせて用いることができる。

#### 【0097】

当該農薬製剤中における有効成分である式(1)で表される化合物の含有量は、特に限定されないが、好ましくは、乳剤で1~75重量%、粉剤では0.3~25重量%、水和剤では1~90重量%、粒剤では0.1~10重量%である。

20

#### 【0098】

式(1)で表される化合物をウシ、ブタなどの家畜類、イヌ、ネコなどのペット類の動物に寄生するダニ類の防除用殺ダニ剤とする場合には、宿主動物1kgに対して、有効成分が、0.01~1000mgの割合となる量で使用することができる。

防除用殺ダニ剤は、公知の獣医学的手法で施用することができる。その方法として、例えば、全身的抑制を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など）などにより動物に投与方法などが挙げられ、非全身的抑制を目的とする場合は、油性または水性液剤を噴霧、注ぎかけ（pour-on）、滴下（spot-on）などにより投与方法、樹脂に殺ダニ剤を練り込み、該混練物を首輪、耳札などの適当な形状に成形し、それを動物に装着する方法などが挙げられる。

30

#### 【0099】

本発明による有害生物防除剤は、そのまま、または希釈して用いることができる。また、本発明による有害生物防除剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合または併用することができる。混合または併用することができる薬剤としては、例えば、ペスティサイドマニュアル（第17版、The British Crop Protection Council発行）およびシブヤインデックス（SHIBUYA INDEX 第17版、2014年、SHIBUYA INDEX RESEARCH GROUP発行）およびアイラックモードオブアクションクラシフィケーションスキーム（Mode of Action Classification Scheme Version 8.2版、IRAC発行）、エフラックコードリスト（FRAC Code List 2017: Fungicides sorted by mode of action、2017年度版、FRAC発行）に記載のものやインターネットで構造が特定できるもの（<http://www.alanwood.net/pesticides/sitemap.html>）が挙げられる。

40

#### 【0100】

より具体的には、殺虫剤は、例えば、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、プトカルボキシム(butocarboxim)、プトキシカルボキシム(butoxycarboxim)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルフアン(carbosulfan)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenob

50

ucarb)、ホルメタネート(formetanate)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メチオカルブ(methiocarb)、メソミル(methomyl)、オキサミル(oxamyl)、ピリミカルブ(pirimicarb)、プロボキスル(propoxur)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオフアノックス(thiofanox)、トリアザメート(triazamate)、トリメタカルブ(trimethacarb)、X M C、キシリルカルブ(xylylcarb)、メトルカルブ(metolcarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)のようなカーバメート系化合物、

アセフェート(acephate)、アザメチホス(azamethiphos)、アジンホス - エチル(azinphos-ethyl)、アジンホス - メチル(azinphos-methyl)、エチルチオメトン(ethylthiometon)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、カズサホス(cadusafos)、クロレトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルメホス(chlormephos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル(chlorpyrifos-methyl)、クマホス(coumaphos)、シアノホス(cyanophos)、デメトン - S - メチル(demeton-S-methyl)、ダイアジノン(diazinon)、ジクロルボス(dichlorvos)、ジクロトホス(dicrotophos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、E P N、エチオン(ethion)、エトプロホス(etoprophos)、ファミフル(famphur)、フェナミホス(fenamifos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、フェンチオン(fenthion)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ヘプテノホス(heptenophos)、イミシアホス(imicyafos)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロピル = O - (メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート[isopropyl O - (methoxyaminothiophosphoryl)salicylate]、イソキサチオン(isoxathion)、マラチオン(malathion)、メカルバム(mecarbam)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレド(naled)、オメトエート(omethoate)、オキシジメトンエチル(dioxydemeton ethyl)、パラチオン(parathion)、パラチオン - メチル(parathion-methyl)、P A P、ホレート(phorate)、ホサロン(phosalone)、ホスメット(phosmet)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホキシム(phoxim)、ピリミホス - メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス(profenofos)、プロペタンホス(propetamphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、キナルホス(quinalphos)、スルホテップ(sulfotep)、テブピリミホス(tebupirimfos)、テムホス(temephos)、テルブホス(terbufos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、チオメトン(thiometon)、トリアゾホス(triazophos)、トリクロルホン(trichlorfon)、パミドチオン(vamidothion)、クロルピリホス - エチル(chlorpyrifos-ethyl)、ジスルフトン(disulfoton)、スルプロホス(sulprofos)、フルピラゾホス(flupyrzophos)、フェントエート(phenthoate)、ホノホス(fonofos)、トリブホス(tribufos)のような有機リン酸エステル系化合物、

エンドスルファン(endosulfan)、アルファ - エンドスルファン(alpha-endosulfan)、ガンマ - H C H(gamma-HCH)、ジコホル(dicofol)、クロルデン(chlordane)、ディルドリン(diieldrin)、メトキシクロル(methoxyclor)のような有機塩素系化合物、アセトプロール(acetoprole)、フィプロニル(fipronil)、エチプロール(ethiprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)、ピリプロール(pyriprole)、フルフィプロール(flufiprole)のようなフェニルピラゾール系化合物、

プロフラニリド(broflanilide)のようなメタジアミド系化合物、

アフォキサネル(afoxolaner)、フルララネル(fluralaner)、サロラネル(sarolaner)、フルキサメタミド(fluxametamide)のようなイソキサゾリン系化合物、

アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、d - c i s - t r a n sアレスリン、d - t r a n sアレスリン(d-cis-trans allethrin)、ビフェントリン(bifenthrin)、カッパ - ビフェントリン(kappa-bifenthrin)、ピオアレスリン S - シクロペンテニル(bioallethrin S-cyclopentenyl)、ピオレスメトリン(bioresmethrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ベータ - シフルトリン

10

20

30

40

50

(beta-cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、ラムダ - シハロトリン(ramda-cyhalothrin)、ガンマ - シハロトリン(gamma-cyhalothrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、アルファ - シペルメトリン(alpha-cypermethrin)、ベータ - シペルメトリン(beta-cypermethrin)、シータ - シペルメトリン(theta-cypermethrin)、ゼータ - シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エンペントリン(empenthrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルメトリン(flumethrin)、タウ - フルバリネート(tau-fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、イミプロトリン(imiprothrin)、カデスリン(kadethrin)、ペルメトリン(permethrin)、フェノトリン(phenothrin)、プラレトリン(prallethrin)、ピレトリン(pyrethrin)、レスメトリン(resmethrin)、シラフルオフェン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、カッパ - テフルトリン(kappa-tefluthrin)、フタルスリン(phthalthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、メトフルトリン(metofluthrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ピレトラム(pyrethrum)、テラレトリン(terallethrin)、モンフルオロスリン(momfluorothrin)、ヘプタフルトリン(heptafluthrin)、メペルフルスリン(meperfluthrin)、テトラメチルフルスリン(tetramethylfluthrin)、ジメフルトリン(dimefluthrin)、プロトリフエンブト(protrifenbut)のようなピレスロイド系化合物、

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

スルホキサフロル(sulfoxaflor)のようなスルホキサミン系化合物、

フルピラジフロン(flupyradifurone)のようなブテナリド系化合物、

トリフルメゾピリム(triflumezopyrim)、ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)のようなメソイオン系化合物、

フルピリミン(flupyrimin)のような2 - アミノピリジン系化合物

スピノサド(spinosad)、スピネトラム(spinetoram)のようなスピノシン系化合物、

アバメクチン(abamectin)、イベルメクチン(ivermectin)、エマメクチン安息香酸塩(emamectin benzoate)、ミルベメクチン(milbemectin)、レピメクチン(lepimectin)のようなマクロライド系化合物、

ヒドロブレン(hydroprene)、キノブレン(quinoprene)、ジオフェノラン(Diofenolan)、メトブレン(methoprene)のような幼若ホルモン様化合物、

ピリプロキシフェン(pyriproxifene)のような4 - フェノキシフェノキシ系化合物、

ピメトロジン(pymetrozine)のようなピリジンアゾメチン系化合物、

フロニカミド(flonicamid)のようなピリジんカルボキサミド系化合物、

エトキサゾール(ethoxazole)のようなオキサゾール系化合物、

B.t. subsp. israelensis、B.t. subsp. aizawai、B.t. subsp. kurstaki、B.t. subsp. tenebrionisのようなBacillus thuringiensisおよびBacillus sphaericus剤及びそれらが産生する殺虫性タンパク、

上記に該当する B t 作物が産生する殺虫性タンパク、

ジアフェンチウロン(diafenthiuron)のようなチオウレア系化合物、

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

プロパルギット(propargite)のような亜硫酸エステル系・ジフェニルエーテル系化合物、

テトラジホン(tetradifon)のようなジフェニルスルホン系化合物、

クロルフェナピル(chlorfenapyr)、トラロピリル(tralopyril)のようなピロール系化

合物、DNOCのようなジニトロ系化合物、  
 ベンスルタップ(bensultap)、カルタップ(cartap)、チオシクラム(thiocyclam)、チ  
 オスルタップ(thiosultap)、チオスルタップ - ナトリウム(thiosultap sodium)のよ  
 うなネライストキシン類縁体、  
 ビストリフルロン(bistrifluron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ジフルベ  
 ンズロン(diflubenzuron)、フルシクロクスロン(flucyclooxuron)、フルフェノクス  
 ロン(flufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフェヌロン(lufenuro  
 n)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(t  
 eflubenzuron)、トリフルムロン(triflumuron)、ビストリフルロン(bistrifluron)  
 のようなベンゾイルウレア系化合物、  
 ブプロフェジン(buprofezin)のようなチアジアジン系化合物、  
 シロマジン(cyromazine)のようなトリアゾール系化合物、  
 クロマフェノジド(chromafenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、メトキシフ  
 エノジド(methoxyfenozide)、テブフェノジド(tebufenozide)のようなジアシルヒ  
 ドラジン系化合物、  
 アミトラズ(amitraz)のようなアミジン系化合物、  
 ヒドラメチルノン(hydramethylnon)のようなアミジノヒドラゾン系化合物、  
 アセキノシル(acequinocyl)のようなナフトキノン系化合物、  
 フルアクリピリム(flucacrypyrim)、ピリミノストロビン(pyriminostrobin)、フルフ  
 エノキシストロビン(Flufenoxystrobin)のようなストロビルリン系化合物、  
 フェナザキン(fenazaquin)のようなキナゾリン系化合物、  
 フェンピロキシメート(fenpyroxymate)のようなフェノキシピラゾール系化合物、  
 ピリミジフェン(pyrimidifen)のようなフェノキシエチルアミン系化合物、  
 ピリダベン(pyridaben)のようなピリダジノン系化合物、  
 テブフェンピラド(tebufenpyrad)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、ピフルブミド(  
 pyflubumide)のようなピラゾールカルボキサミド系化合物、  
 メタフルミゾン(metaflumizone)のようなヒドラジンカルボキサミド系化合物、  
 スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetaramat)、スピロ  
 メシフェン(spiromesifen)、スピロピディオソ(spiropidion)のようなテトロン酸お  
 よびテトラミン酸系化合物、  
 シフルメトフェン(cyflumetofen)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)のようなベ  
 タ - ケトニトリル系化合物、  
 フルベンジアミド(flubendiamide)のようなフタル酸アミド系化合物、  
 クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール(cyantr  
 aniliprole)、シクラニリプロール(cyclaniliprole)、テトラニリプロール(tetranili  
 prole)、シハロジアミド(cyhalodiamide)、テトラクロラントラニリプロール(tetrac  
 hlorantraniliprole)のようなアントラニル酸アミド系化合物、  
 キノメチオネート(quinomethionate)のようなキノキサリン系化合物、  
 ヘキシチアゾクス(hexythiazox)のようなチアゾリジノン系化合物、  
 ビフェナゼート(bifenazate)のようなヒドラジン系化合物、  
 フルフェネリム(flufenerim)のようなピリジナミン系化合物、  
 ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)のようなアミノキナゾリン系化合物、  
 フロメトキン(flometoquin)のような6 - フェノキシキノリン系化合物、  
 フルオピラム(flupyram)のようなピリジニルエチルベンズアミド系化合物、  
 フルアザインドリジン(fluzaindolizine)、アミドフルメト(amidoflumet)のような  
 スルホンアミド系化合物  
 チクロピラゾフロル(tyclopyrazoflor)のようなピリジルピラゾール系化合物  
 チオキサザフェン(tioxazafen)のようなオキサジアゾール系化合物、  
 オキサゾスルフィル(oxazosulfyl)のようなベンゾオキサゾール系化合物  
 であり得る。

10

20

30

40

50

また、その他の殺虫剤として、ニコチン(nicotine)、クロロピクリン(chloropicrin)、フッ化スルフリル(sulfuryl fluoride)、クリロチエ(crylotie)、クロフェンテジン(clofentezine)、ジフロビダジン(diflovidazin)、ロテノン(rotenone)、インドキサカルブ(indoxacarb)、ピペロニルブトキシド(piperonyl butoxide)、クロルジメホルム(chlordimeform)、ピリダリル(pyridalyl)、アザジラクチン(azadirachtin)、ベンゾキシメート(benzoxymate)、アフィドピロペン(afidopyropen)、フルヘキサホン(fluhexafon)、フルエンスルホン(fluensulfone)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、カルゾール(carzole)、殺虫性石鹼、ジメヒポ(dimehypo)、ニチアジン(nithiazine)、ホウ酸塩(borate salt)、メタアルデヒド(metaaldehyde)、リアノジン(ryandine)、スルフルラミド(sulfluramid)、アシノナピル(acynonapyr)、ベンズピリモキサン(benzpyrimoxan)、3 - プロモ - N - ( 2 , 4 - ジクロロ - 6 - (メチルカルバモイル)フェニルイル) - 1 - ( 3 , 5 - ジクロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミドのような化合物が挙げられる。更に、本発明による有害生物防除剤は、昆虫病原性バクテリア、昆虫病原性ウイルスおよび昆虫病原性菌類などのような微生物農薬とも、混用または併用することもできる。

10

20

30

40

50

【 0 1 0 1 】

用いられる殺菌剤は、例えば、メタラキシル(metalaxyl)、メタラキシル-M(metalaxyl-M)、オキサジキシル(oxadixyl)、オフラセ(ofurase)、ベナラキシル(benalaxyl)、ベナラキシル-M(benalaxyl-M)、キララキシル(kiralaxyl)、オフラース(ofurace)、フララキシル(furalaxyl)、シプロフラン(cyprofuram)のようなフェニルアミド系化合物、

ブプリメート(bupyrimate)、ジメチリモール(dimethilimol)、エチリモール(ethilimol)のようなヒドロキシピリミジン系化合物、

ヒメキサゾール(hymexazole)、ヒドロキシイソキサゾール(hydroxyisoxazole)のようなイソキサゾール系化合物、

オキサチアピプロリン(oxathiapiprolin)のようなピペリジニルチアゾールイソキサゾリン系化合物、

オクチリノン(octhilinone)のようなイソチアゾロン系化合物、

オキシリニック酸(oxolinic acid)のようなカルボン酸系化合物、

ベノミル(benomyl)、チオファネートメチル(thiophanate-methyl)、カーベンダジム(carbendazole)、フベリダゾール(fuberidazole)、チアベンダゾール(thiabendazole)、デバカルブ(debacarb)のようなベンズイミダゾール・チオファネート系化合物

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

ゾキサミド(zoxamide)のようなトルアミド系化合物、

エタボキサム(ethaboxam)のようなエチルアミノチアゾールカルボキサミド系化合物、

ペンシクロン(pencycuron)のようなフェニルウレア系化合物、

フルオピコリド(fluopicolide)、フルオピモミド(fluopimomide)のようなピリジニルメチルベンズアミド系化合物、

ジフルメトリム(diflumetorim)、ブピリメート(bupirimate)、のようなピリミジンアミン系化合物、

ベノダニル(benodanil)、フルトラニル(flutolanil)、メプロニル(mepronil)のようなベンズアニリド系化合物、

イソフェタミド(isofetamid)のようなフェニルオキソエチルチオフェンアミド系化合物

、フルオピラム(fluopyram)のようなピリジニルエチルベンズアミド系化合物、

フェンフラム(fenfuram)のようなフランカルボキサミド系化合物、

オキシカルボキシ(oxycarboxin)、カルボキシ(carboxin)のようなオキサチンカルボキサミド系化合物、

チフルザミド(thifluzamide)のようなチアゾールカルボキサミド系化合物、

フルキサピロキサド(fluxapyroxad)、フラメトピル(furametpyr)、ペンフルフェン(penflufen)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、ベンゾビンジフルピル(benzovindiflupyr)、ビキサフェン(bixafen)、イソピラザム(isopyrazam)、セダキサン(sedaxane)、インピルフルキサム(inpyrfluxam)、フルインダピル(fluidapyr)、イソフルシプラム(isoflucypram)、ピラプロポイン(pyrapropoyne)のようなピラゾール - 4 - カルボキサミド系化合物、

ボスカリド(boscalid)のようなピリジンカルボキサミド系化合物、

アゾキシストロビン(azoxystrobin)、コウメトキシストロビン(coumetoxystrobin)、クレソキシムメチル(kresoxym-methyl)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)、ピコキシストロビン(picoxystrobin)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin)、メトミノストロビン(metominostrobin)、オリサストロビン(orysastrobin)、フルオキサストロビン(fluxastrobin)、ピラオキシストロビン(pyraoxystrobin)、ピラメトストロビン(pyrametostrobin)、フルフェノキシストロビン(flufenoxystrobin)、フェナミンストロビン(fenaminstrobin)、エノキサストロビン(enoxastrobin)、クモキシストロビン(coumoxystrobin)、マンドエストロビン(mandestrobin)、トリクロピリカルブ(triclopyricarb)のようなストロビルリン系化合物、

ファミキサドン(famoxadon)のようなオキサゾリジンジオン系化合物、

フェンアミドン(fenamidone)のようなイミダゾリノン系化合物、

トリクロピリカルブ(triclopyricarb)、ピリベンカルブ(pyribencarb)のようなベンジルカーバメート系化合物、

シアゾファミド(cyazofamid)のようなシアノイミダゾール系化合物、

アミスルブロム(amisulbrom)のようなスルファモイルトリアゾール系化合物、

ビナバクリル(binapacryl)、メプチルジノカルブ(meptyldinocap)、ジノカップ(dinocap)のようなジニトロフェニルクロトン系化合物、

フルアジナム(fluzinam)のような2, 6 - ジニトロアニリン系化合物、

フェリムゾン(ferimzone)のようなピリミジノンヒドラゾン系化合物、

酢酸 - フェンチン(fentin-acetate)、塩化フェンチン(fentin chloride)、水酸化フェンチン(fentin hydroxide)、水酸化トリフェニルスズ(fenthin hydroxide)、酢酸トリフェニルスズ(fenthin acetate)、オキシ銅(oxine copper)のような有機・無機金属系化合物、

シルチオファミン(silthiofam)のようなチオフェンカルボキサミド系化合物、

アメトクトラジン(ametoctradin)のようなトリアゾロピリミジンアミン系化合物、

メパニピリム(mepanipyrim)、ニトラピリン(nitrapyrin)、ピリメサニル(pyrimethanil)、シプロジニル(cyprodinil)のようなアニリノピリミジン系化合物、

ブラストサイジンS(blasticidin-S)のようなエノピラヌロン酸抗生物質、

カスガマイシン(kasugamycin)、カスガマイシン塩酸塩水和物(kasugamycin hydrochloride hydrate)のようなヘキソピラノシル抗生物質、

ストレプトマイシン(streptomycin)のようなグルコピラノシル抗生物質、

オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)のようなテトラサイクリン抗生物質、

キノキシフェン(quinoxyfen)のようなアリルオキシキノリン系化合物、

プロキナジド(proquinazid)のようなキナゾリン系化合物、

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

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

エジフェンホス(edifenphos)、イプロベンホス(iprobenfos)、ピラゾホス(pyrazophos)のようなホスホロチオレート系化合物、

イソプロチオラン(isoprothiolane)のようなジチオラン系化合物、

プロパモカルブ(propamocarb)、プロパモカルブ塩酸塩(propamocarb hydrochloride) 50

ide)のようなプロピルカーバメート系化合物、  
 Bacillus subtilis (QST713、FZB24、MBI600、D747株)のようなBacillus属および  
 産生された殺菌性タンパク類、および、  
 上記B t作物により産生された殺菌性タンパク類、  
 ゴセイカユブテの抽出物のようなテルペン炭化水素類とテルペンアルコール類、  
 トリホリン(triforine)のようなピペラジン系化合物、  
 ピリフェノックス(pyrifenoxy)、ピリソキサゾール(pyrisoxazole)のようなピリジン  
 系化合物、  
 フェナリモル(fenarimol)、ヌアリモル (nuarimol)のようなピリミジン系化合物、  
 アザコナゾール(azaconazole)、ブロムコナゾール(bromuconazole)、ジニコナゾール 10  
 (diniconazole)、ジニコナゾール - M(diniconazole - M)、エポキシコナゾール(e  
 poxyconazole)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、オキシポコナゾール(oxp  
 oconazole)、ペフラゾエート(pefurazoate)、ジフェノコナゾール(difenoconazole  
 )、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、イミベンコナゾール(imibenconazole)、  
 イブコナゾール(ipconazole)、メトコナゾール(metconazole)、テトラコナゾール(te  
 traconazole)、トリアジメホン(triadimefon)、トリアジメノール(triadimenol)、  
 トリチコナゾール(triticonazole)、ウニコナゾール(uniconazole)、イマザリル(ima  
 zalil)、ピテルタノール(bitertanol)、トリフルミゾール(triflumizole)、エタコナゾ  
 ール(etaconazole)、プロピコナゾール(propiconazole)、ペンコナゾール(pencona  
 zole)、フルシラゾール(flusilazole)、フルトリアホール(flutriafol)、ミクロブタニ  
 ル(myclobutanil)、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、プロチオコナゾール(pro  
 thioconazole)、シプロコナゾール(cyproconazole)、テブコナゾール(tebuconazo  
 le)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、プロクロラズ(prochloraz)、シメコナゾ  
 ール(simeconazole)、イプフェントリフルコナゾール(ipfentrifluconazole)のような  
 アゾール系化合物、  
 アルジモルフ(aldimorph)、ドデモルフ(dodemorph)、酢酸ドデモルフ(dodemorph  
 acetate)、トリデモルフ(tridemorph)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、ジ  
 メトモルフ(dimethomorph)、フルモルフ(flumorph)、ピリモルフ(pyrimorph)の  
 ようなモルフォリン系化合物、  
 ピペラリン(piperalin)、フェンプロピディン(fenpropidin)のようなピペリジン系化 30  
 合物、  
 スピロキサミン(spiroxamine)のようなスピロケタールアミン系化合物、  
 フェンヘキサミド(fenhexamid)のようなヒドロキシアニリド系化合物、  
 フェンピラザミン(fenpyrazamine)のようなアミノピラゾリノン系化合物、  
 フェルバム(ferbam)、メタム(metam)、メタスルホカルブ(metasulphocarb)、メチ  
 ラム(metiram)、チラム(thiram)、マンゼブ(mancozeb)、マンネブ(maneb)、ジネ  
 ブ(zineb)、ジラム(ziram)、ポリカーバメート(polycarbamate)、プロビネブ(prop  
 ineb)、チウラム(thiuram)、ピリブチカルブ(pyributicarb)のようなチオカーバメ  
 ート・ジチオカーバメート系化合物、  
 バリダマイシン(validamycin)のようなグルコピラノシル抗生物質、 40  
 ミルジオマイシン(mildiomycin)、ポリオキシシン(polyoxin)のようなヌクレオシド系  
 抗生物質、  
 ベンチアバリカルブ(benthiavalicarb)、ベンチアバリカルブイソプロピル(benthiav  
 alicarb-isopropyl)、バリフェナレート(valifenalate)、イプロバリカルブ(iproval  
 icarb)のようなバリンアミドカーバメート系化合物、  
 マンジプロバミド(mandipropamid)のようなマンデル酸アミド系化合物、  
 フェンピコキサミド(fenpicoxamid)、フロリルピコキサミド(florylpicoxamid)のよ  
 うなピコリナミド系化合物、  
 フサライド(ftthalide)のようなイソベンゾフラノン系化合物、  
 ピロキロン(pyroquilon)のようなピロロキノリノン系化合物、 50

トリシクラゾール(tricyclazole)のようなトリアゾロベンゾチアゾール系化合物、  
カルプロパミド(carpropamid)のようなシクロプロパンカルボキサミド系化合物、  
ジクロシメット(diclocymet)のようなカルボキサミド系化合物、  
フェノキサニル(fenoxanil)のようなプロピオンアミド系化合物、  
アシベンゾラル S - メチル(acibenzolar-S-methyl)のようなベンゾチアジアゾール系  
化合物、  
プロベナゾール(probenazole)、ジクロベンチアゾクス(dichlobentiazox)のような  
ベンゾイソチアゾール系化合物、  
チアジニル(tiadinil)のようなチアジアゾールカルボキサミド系化合物、  
イソチアニル(isotianil)のようなイソチアゾールカルボキサミド系化合物、  
シモキサニル(cymoxanil)のようなシアノアセトアミド=オキシム系化合物、  
ホセチル(fosetyl)のようなエチルホスホネート系化合物、  
テクロフタラム(trechlophthalam)のようなフタラミン酸系化合物、  
トリアゾキシド(triazoxide)のようなベンゾトリアジン系化合物、  
フルスルファミド(flusulfamide)のようなベンゼンスルホン酸系化合物、  
ジクロメジン(diclomezine)のようなピリダジノン系化合物、  
シフルフェナミド(cyflufenamide)のようなフェニルアセトアミド系化合物、  
メトラフェノン(metrafenopne)のようなベンゾフェノン系化合物、  
ピリオフェノン(pyriofenone)のようなベンゾイルピリジン系化合物、  
フルチアニル(flutianil)のようなシアノメチレンチアゾリジン系化合物、  
テブフロキン(tebufloquin)のような 4 - キノリル酢酸系化合物、  
イプフルフェノキン(ipflufenquin)のような 3 - フェノキシキノリン系化合物、  
ホセチルアルミニウム(fosetyl-aluminium)、トルクロホス - メチル(tolclofos-met  
hyl)のような有機リン系化合物、  
エクロメゾール(echlomezole)のような 1 , 2 , 4 - チアジアゾール系化合物、  
トルプロカルブ(tolprocarb)のようなトリフルオロエチルカーバメート系化合物、  
ボルドー(Bordeaux)混合液、酢酸銅(copper acetate)、塩基性硫酸銅(basic coppe  
r sulfate)、オキシ塩化銅(oxy copper chloride)、水酸化第二銅(copper hydroxi  
de)、オキシキノリン銅(oxine-copper)のような銅系化合物、  
銅、硫黄のような無機化合物、  
キャプタン(captan)、カプタホル(captafol)、フォルペット(folpet)のような N -  
ハロゲノチオアルキル系化合物、  
アニラジン(anilazine)、クロロタロニル(chlorothalonil)、ジクロロフェン(dichlo  
rophen)、ペンタクロロフェノール(pentachlorophenol)及びその塩、ヘキサクロロ  
ベンゼン(hexachlorobenzene)、キントゼン(quintozene)のような有機塩素系化合  
物、  
イミノクタジン酢酸塩(iminoctadine triacetate salt)、イミノクタジンアルベシル  
酸塩(iminoctadine albesilate)、グアニジン(guanidine)、ドジン(dodine)、ドジ  
ン遊離塩基(dodine free base)、グアザチン(guazatine)、グアザチン酢酸塩(guaza  
tine acetate salt)、アルベシレート(albesilate)のようなグアニジン系化合物、  
ジチアノン(dithianon)のようなアントラキノン系化合物、  
キノメチオネート(quinomethionate)のようなキノキサリン系化合物、  
フルオルイミド(fluoroimide)のようなマレイミド系化合物、  
トリルフルアニド(tolylfluanid)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)のようなスルフ  
エン酸系化合物、  
ジノブトン(dinobuton)のようなジニトロフェノール系化合物、  
ダゾメット(dazomet)のような環状ジチオカーバメート系化合物  
ピラジフルミド(pyraziflumid)のようなアニリド系化合物、  
アミノピリフェン(aminopyrifen)のようなニコチン酸エステル系化合物、  
メチルテトラプロール(metyltetraprole)のようなテトラゾリノン系化合物、

10

20

30

40

50

ピリダクロメチル(pyridachlometyl)のようなピリダジン系化合物、があり得る。  
 また、その他の殺菌剤として、ジピメチトロン(dipymetitrone)、ピカルブトラゾクス(picarbutrazox)、テクナゼン(tecnazen)、ニトルタール - イソプロピル(nitrthal-isopropyl)、ジシクロメット(dicyclomet)、アシベンゾラル(acibenzolar)、プロヘキサジオン - カルシウム(prohexadione-calcium)、プロノポール(bronopol)、ジフェニルアミン(diphenylamine)、フルメトベル(flumetover)、ベントキサジン(bethoxazin)、ビフェニル(biphenyl)、クロロネブ(chloroneb)、CNA、ヨードカルブ(iodcarb)、プロチオカルブ(prothiocarb)などが挙げられる。

【0102】

本発明の式(1)で表される化合物またはその農園芸上及び動物薬上許容可能な酸付加塩は、その有効量を、植物、土壌または動物に適用することにより、対象の有害生物の防除に使用することができる。すなわち、これらの分野の有害生物の防除方法が提供される。ここで、本発明による防除方法には、式(1)で表される化合物またはそれらの農園芸上許容可能な酸付加塩を、密閉された空間において燻煙処理によって適用する方法も含まれる。

10

本発明の式(1)で表される化合物またはその農園芸上許容可能な酸付加塩はまた、生物学的に有効な量で作物、作物が成長する種子、または作物の胎座に処理又は接触されることにより、作物の活力を高める。

処理又は接触の対象が種子である場合、本発明の式(1)で表される化合物またはその農園芸上許容可能な酸付加塩の量は限定されないが、処理後の種子全体の約0.0001～約1質量%の量で本発明の式(1)で表される化合物またはその農園芸上許容可能な酸付加塩が含まれることは好ましい。

20

本発明によりさらに、本発明の式(1)で表される化合物またはその酸付加塩の、動物・鳥類を有害寄生性無脊椎生物から保護する組成物の有効成分としての使用が提供される。該組成物は、本発明の式(1)で表される化合物またはその酸付加塩を、殺寄生虫的に有効でありかつ対象である動物・鳥類に害を与えない量で、含む。前記使用において本発明の式(1)で表される化合物またはその酸付加塩は、有害無脊椎生物またはその生育環境に生物学的に有効な量で接触され、有害無脊椎生物を防除する。

【0103】

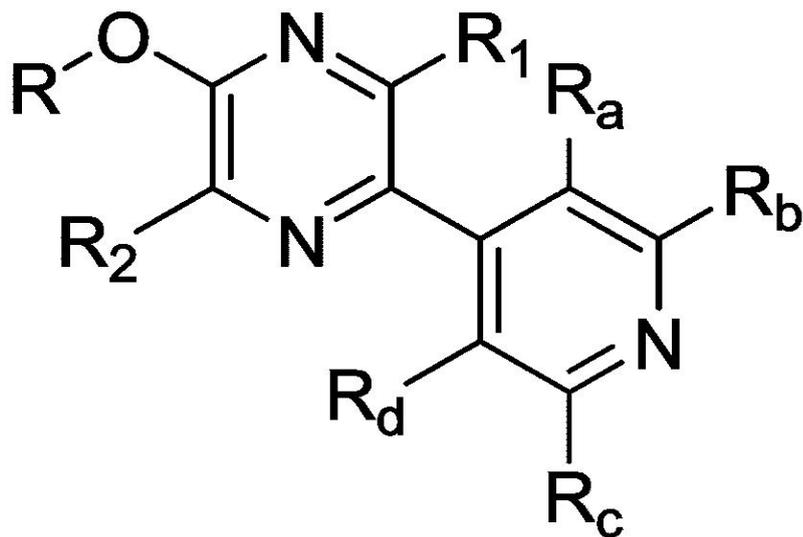
次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。下記の表において、Meはメチル基を表し、Etはエチル基を表し、n-Prはノルマルプロピル基を表し、i-Prはイソプロピル基を表し、c-Prはシクロプロピル基を表し、c-Pentはシクロペンチル基を表す。

30

40

50

【化 1 3】



(A-1)

10

20

【 0 1 0 4】

式 ( A - 1 ) において、R が  $CF_3CF_2CH_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

30

40

50

【表 1】

R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>a</sub>	R <sub>b</sub>	R <sub>c</sub>	R <sub>d</sub>
H	H	H	H	H	H
H	H	Me	H	H	H
H	H	H	Me	H	H
H	H	OMe	H	H	H
H	H	H	OMe	H	H
H	H	Br	H	H	H
H	H	H	Br	H	H
H	H	Cl	H	H	H
H	H	H	Cl	H	H
H	H	F	H	H	H
H	H	H	F	H	H
H	H	SMe	H	H	H
H	H	H	SMe	H	H
H	H	SOMe	H	H	H
H	H	H	SOMe	H	H
H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	H	H
H	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	H
H	H	SEt	H	H	H
H	H	H	SEt	H	H
H	H	SOEt	H	H	H
H	H	H	SOEt	H	H
H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
H	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H
H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H
H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H
H	H	CONMe <sub>2</sub>	H	H	H
H	H	H	CONMe <sub>2</sub>	H	H
H	H	NMeCOMe	H	H	H
H	H	H	NMeCOMe	H	H
H	H	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H
H	H	H	CO <sub>2</sub> Me	H	H
H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H
H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H
H	H	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H
H	H	H	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H
H	H	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H
H	H	H	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H
H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H
H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H
Me	H	H	H	H	H
H	Me	H	H	H	H
OMe	H	H	H	H	H
H	OMe	H	H	H	H
COOMe	H	H	H	H	H
H	COOMe	H	H	H	H
OiPr	H	H	H	H	H
H	OiPr	H	H	H	H
OnBu	H	H	H	H	H
H	OnBu	H	H	H	H
CN	H	H	H	H	H
H	CN	H	H	H	H
CONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
H	CONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
NMeCOMe	H	H	H	H	H
H	NMeCOMe	H	H	H	H
SMe	H	H	H	H	H
H	SMe	H	H	H	H
SOMe	H	H	H	H	H
H	SOMe	H	H	H	H
SO <sub>2</sub> Me	H	H	H	H	H
H	SO <sub>2</sub> Me	H	H	H	H
F	H	H	H	H	H
H	F	H	H	H	H
Cl	H	H	H	H	H
H	Cl	H	H	H	H
Br	H	H	H	H	H
H	Br	H	H	H	H
CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H
SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
H	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H
SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
H	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H
SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H

10

20

30

40

## 【0105】

式(A-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

## 【0106】

式(A-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0107】

式(A-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

50

## 【0108】

式(A-1)において、Rが(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0109】

式(A-1)において、RがCH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0110】

式(A-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0111】

式(A-1)において、RがCF<sub>2</sub>HCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

10

## 【0112】

式(A-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0113】

式(A-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>Ph-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0114】

式(A-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

20

## 【0115】

式(A-1)において、Rが3-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0116】

式(A-1)において、Rが2-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0117】

式(A-1)において、Rが4-tBuOPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

## 【0118】

式(A-1)において、Rが4-PhOPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0119】

式(A-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>PhCH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

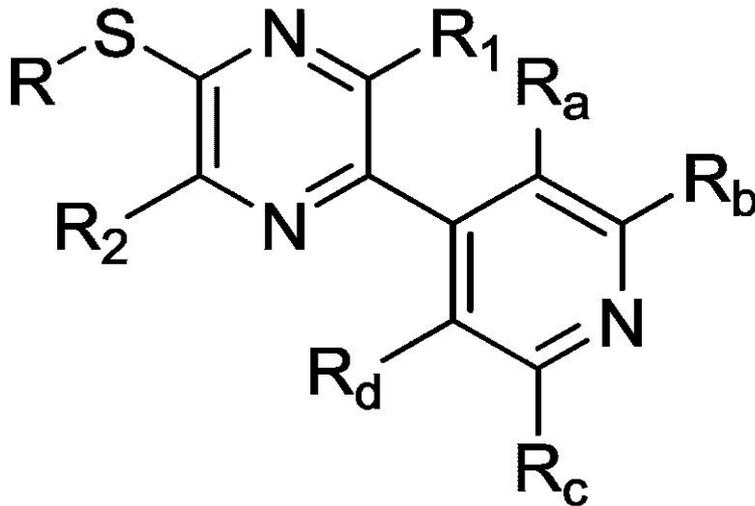
## 【0120】

式(A-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>OPhCH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0121】

40

【化 1 4】



(B-1)

10

【0 1 2 2】

20

式 (B - 1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

【0 1 2 3】

式 (B - 1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

【0 1 2 4】

式 (B - 1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

【0 1 2 5】

式 (B - 1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 1 2 6】

式 (B - 1) において、R が  $(\text{CF}_3)_2\text{CH}-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 1 2 7】

式 (B - 1) において、R が  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 1 2 8】

40

式 (B - 1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 1 2 9】

式 (B - 1) において、R が  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 1 3 0】

式 (B - 1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 1 3 1】

式 (B - 1) において、R が 4 -  $\text{CF}_3\text{Ph}-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub>

50

が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 3 2 】

式 ( B - 1 ) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 3 3 】

式 ( B - 1 ) において、R が 3 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 3 4 】

式 ( B - 1 ) において、R が 2 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

10

【 0 1 3 5 】

式 ( B - 1 ) において、R が 4 - t B u O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 3 6 】

式 ( B - 1 ) において、R が 4 - P h O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 3 7 】

式 ( B - 1 ) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

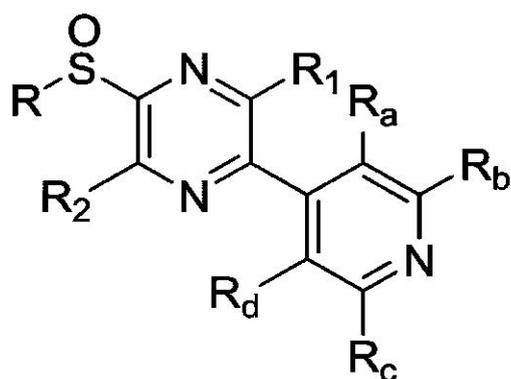
【 0 1 3 8 】

式 ( B - 1 ) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

20

【 0 1 3 9 】

【 化 1 5 】



30

( C - 1 )

【 0 1 4 0 】

式 ( C - 1 ) において、R が C F <sub>3</sub> C F <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 { 式中、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

40

【 0 1 4 1 】

式 ( C - 1 ) において、R が C F <sub>3</sub> C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 { 式中、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

【 0 1 4 2 】

式 ( C - 1 ) において、R が C F <sub>3</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 4 3 】

式 ( C - 1 ) において、R が C F <sub>3</sub> C F <sub>2</sub> C F <sub>2</sub> C F <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R

50

b、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0144】

式(C-1)において、Rが(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0145】

式(C-1)において、RがCH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0146】

式(C-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

10

【0147】

式(C-1)において、RがCF<sub>2</sub>HCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0148】

式(C-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0149】

式(C-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>Ph-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0150】

式(C-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

20

【0151】

式(C-1)において、Rが3-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0152】

式(C-1)において、Rが2-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0153】

式(C-1)において、Rが4-tBuOPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

【0154】

式(C-1)において、Rが4-PhOPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0155】

式(C-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>PhCH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

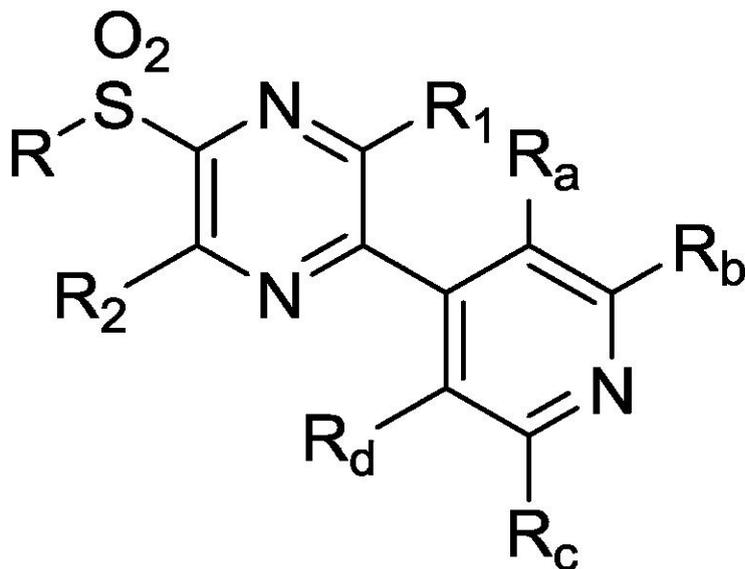
【0156】

式(C-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>OPhCH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

40

【0157】

【化 1 6】



(D-1)

10

20

【0158】

式(D-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

【0159】

式(D-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

【0160】

式(D-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

【0161】

式(D-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0162】

式(D-1)において、Rが(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0163】

式(D-1)において、RがCH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

40

【0164】

式(D-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0165】

式(D-1)において、RがCF<sub>2</sub>HCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0166】

式(D-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0167】

50

式 (D - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 6 8 】

式 (D - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 6 9 】

式 (D - 1) において、R が 3 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 7 0 】

式 (D - 1) において、R が 2 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 10

【 0 1 7 1 】

式 (D - 1) において、R が 4 - t B u O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 7 2 】

式 (D - 1) において、R が 4 - P h O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 7 3 】

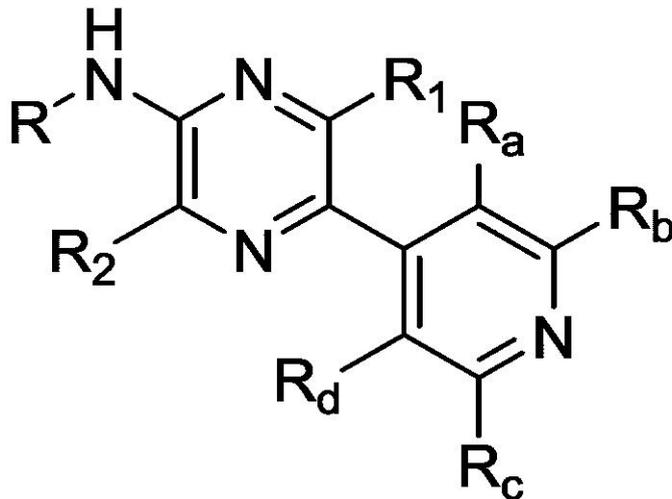
式 (D - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 20

【 0 1 7 4 】

式 (D - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 1 7 5 】

【 化 1 7 】



30

(E - 1)

40

【 0 1 7 6 】

式 (E - 1) において、R が C F <sub>3</sub> C F <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 { 式中、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

【 0 1 7 7 】

式 (E - 1) において、R が C F <sub>3</sub> C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 { 式中、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R 50

$c$  及び  $R_d$  は前記と同じであることを示す。}

【0178】

式 (E - 1) において、 $R$  が  $CF_3CH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0179】

式 (E - 1) において、 $R$  が  $CF_3CF_2CF_2CF_2CH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0180】

式 (E - 1) において、 $R$  が  $(CF_3)_2CH-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

10

【0181】

式 (E - 1) において、 $R$  が  $CH_3CH_2CH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0182】

式 (E - 1) において、 $R$  が  $CF_3CF_2CF_2CH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0183】

式 (E - 1) において、 $R$  が  $CF_2HCF_2CH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0184】

式 (E - 1) において、 $R$  が  $CF_3CF_2CF_2CF_2CF_2CH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

20

【0185】

式 (E - 1) において、 $R$  が 4 -  $CF_3Ph-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0186】

式 (E - 1) において、 $R$  が 4 -  $CF_3OPh-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0187】

式 (E - 1) において、 $R$  が 3 -  $CF_3OPh-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

【0188】

式 (E - 1) において、 $R$  が 2 -  $CF_3OPh-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0189】

式 (E - 1) において、 $R$  が 4 -  $tBuOPh-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0190】

式 (E - 1) において、 $R$  が 4 -  $PhOPh-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

40

【0191】

式 (E - 1) において、 $R$  が 4 -  $CF_3PhCH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

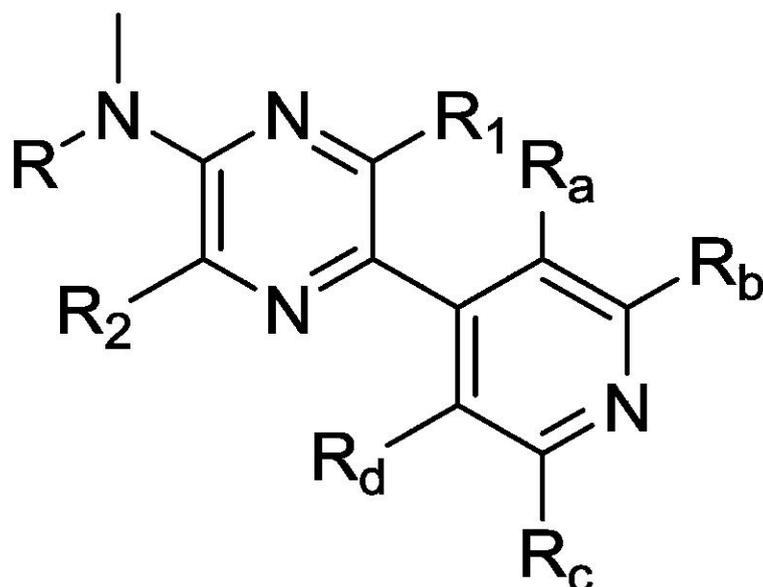
【0192】

式 (E - 1) において、 $R$  が 4 -  $CF_3OPhCH_2-$  で  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$  及び  $R_d$  が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0193】

50

【化 1 8】



10

(F-1)

20

【0194】

式(F-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

【0195】

式(F-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

【0196】

式(F-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

【0197】

式(F-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0198】

式(F-1)において、Rが(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0199】

式(F-1)において、RがCH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

40

【0200】

式(F-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0201】

式(F-1)において、RがCF<sub>2</sub>HCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0202】

式(F-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0203】

50

式 (F - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0204】

式 (F - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0205】

式 (F - 1) において、R が 3 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0206】

式 (F - 1) において、R が 2 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 10

【0207】

式 (F - 1) において、R が 4 - t B u O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0208】

式 (F - 1) において、R が 4 - P h O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0209】

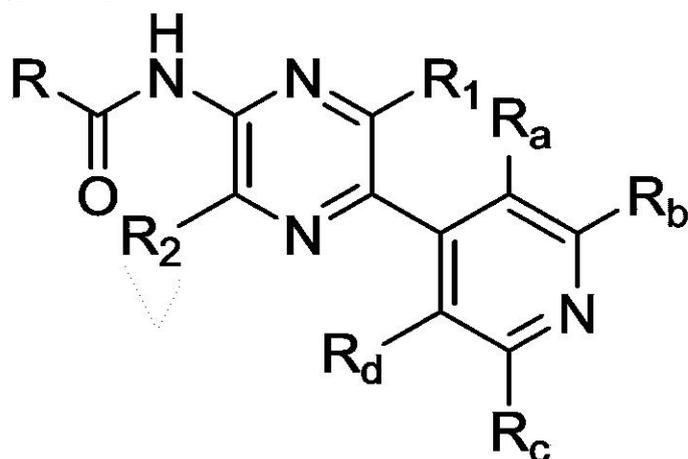
式 (F - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 20

【0210】

式 (F - 1) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0211】

【化19】



30

(G-1)

40

【0212】

式 (G - 1) において、R が C F <sub>3</sub> C F <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

【0213】

式 (G - 1) において、R が C F <sub>3</sub> C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

【0214】

式 (G - 1) において、R が C F <sub>3</sub> C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が 50

表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 1 5 】

式 ( G - 1 ) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 1 6 】

式 ( G - 1 ) において、R が  $(\text{CF}_3)_2\text{CH}$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 1 7 】

式 ( G - 1 ) において、R が  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 10

【 0 2 1 8 】

式 ( G - 1 ) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 1 9 】

式 ( G - 1 ) において、R が  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CH}_2$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 2 0 】

式 ( G - 1 ) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 2 1 】

式 ( G - 1 ) において、R が 4 -  $\text{CF}_3\text{Ph}$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 20

【 0 2 2 2 】

式 ( G - 1 ) において、R が 4 -  $\text{CF}_3\text{OPh}$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 2 3 】

式 ( G - 1 ) において、R が 3 -  $\text{CF}_3\text{OPh}$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 2 4 】

式 ( G - 1 ) において、R が 2 -  $\text{CF}_3\text{OPh}$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 30

【 0 2 2 5 】

式 ( G - 1 ) において、R が 4 -  $t\text{BuOPh}$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 2 6 】

式 ( G - 1 ) において、R が 4 -  $\text{PhOPh}$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 2 7 】

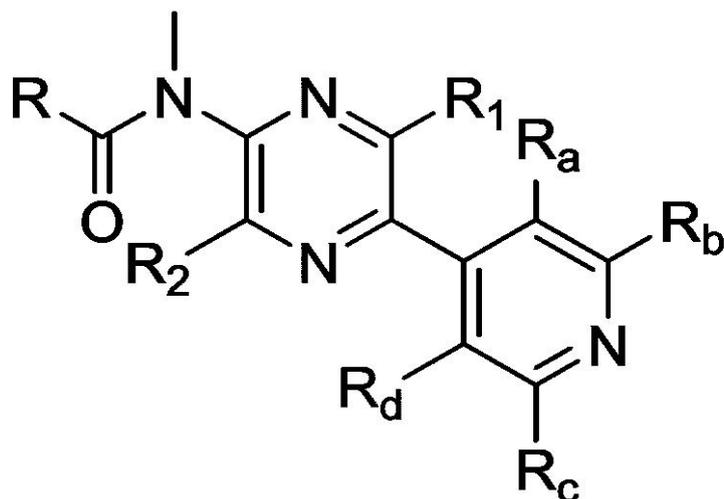
式 ( G - 1 ) において、R が 4 -  $\text{CF}_3\text{PhCH}_2$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 40

【 0 2 2 8 】

式 ( G - 1 ) において、R が 4 -  $\text{CF}_3\text{OPhCH}_2$  - で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 2 9 】

【化 2 0】



(H-1)

10

【0 2 3 0】

式 (H-1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。}

20

【0 2 3 1】

式 (H-1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。}

【0 2 3 2】

式 (H-1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 2 3 3】

式 (H-1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

【0 2 3 4】

式 (H-1) において、R が  $(\text{CF}_3)_2\text{CH}-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 2 3 5】

式 (H-1) において、R が  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 2 3 6】

式 (H-1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

40

【0 2 3 7】

式 (H-1) において、R が  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 2 3 8】

式 (H-1) において、R が  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0 2 3 9】

式 (H-1) において、R が  $4-\text{CF}_3\text{Ph}-$  で R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

50

## 【0240】

式(H-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0241】

式(H-1)において、Rが3-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0242】

式(H-1)において、Rが2-CF<sub>3</sub>OPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0243】

式(H-1)において、Rが4-tBuOPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

10

## 【0244】

式(H-1)において、Rが4-PhOPh-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0245】

式(H-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>PhCH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

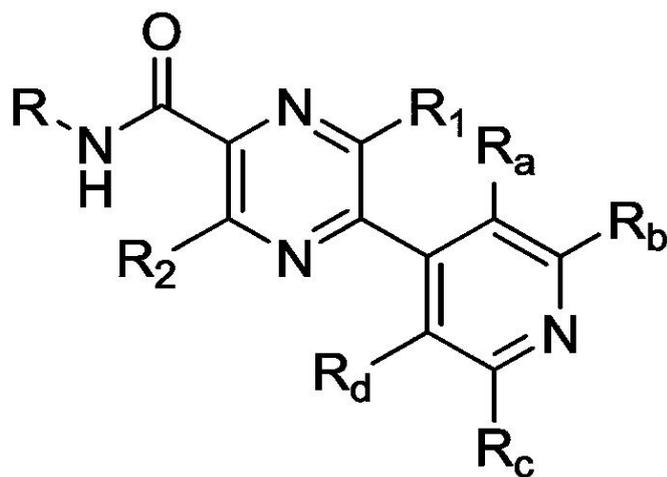
## 【0246】

式(H-1)において、Rが4-CF<sub>3</sub>OPhCH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

20

## 【0247】

## 【化21】



30

(I-1)

## 【0248】

式(I-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

40

## 【0249】

式(I-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

## 【0250】

式(I-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

50

## 【0251】

式(I-1)において、Rが $CF_3CF_2CF_2CF_2CH_2-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0252】

式(I-1)において、Rが $(CF_3)_2CH-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0253】

式(I-1)において、Rが $CH_3CH_2CH_2-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0254】

式(I-1)において、Rが $CF_3CF_2CF_2CH_2-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

10

## 【0255】

式(I-1)において、Rが $CF_2HCF_2CH_2-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0256】

式(I-1)において、Rが $CF_3CF_2CF_2CF_2CF_2CH_2-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0257】

式(I-1)において、Rが4- $CF_3Ph-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

20

## 【0258】

式(I-1)において、Rが4- $CF_3OPh-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0259】

式(I-1)において、Rが3- $CF_3OPh-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0260】

式(I-1)において、Rが2- $CF_3OPh-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

## 【0261】

式(I-1)において、Rが4- $tBuOPh-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0262】

式(I-1)において、Rが4- $PhOPh-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

## 【0263】

式(I-1)において、Rが4- $CF_3PhCH_2-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

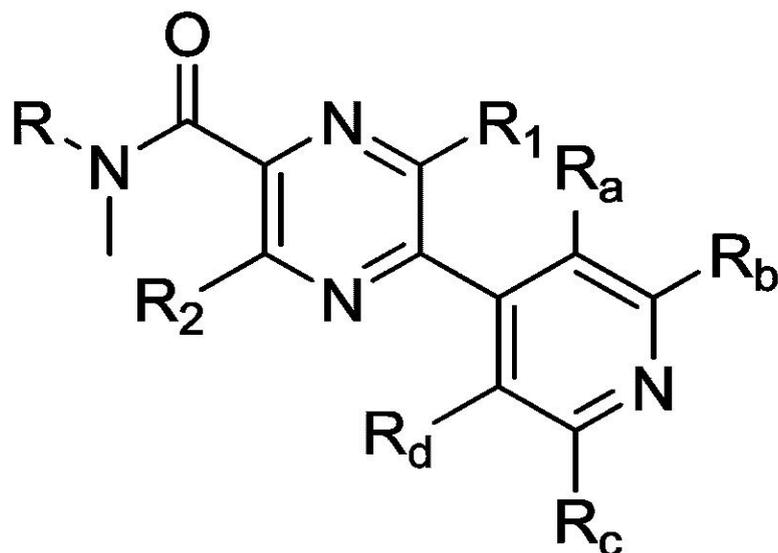
## 【0264】

式(I-1)において、Rが4- $CF_3OPhCH_2-$ で $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_a$ 、 $R_b$ 、 $R_c$ 及び $R_d$ が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

40

## 【0265】

【化 2 2】



10

(J-1)

20

【0266】

式(J-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

【0267】

式(J-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

【0268】

式(J-1)において、RがCF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

30

【0269】

式(J-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0270】

式(J-1)において、Rが(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0271】

式(J-1)において、RがCH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

40

【0272】

式(J-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0273】

式(J-1)において、RがCF<sub>2</sub>HCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0274】

式(J-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。

【0275】

50

式 ( J - 1 ) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 7 6 】

式 ( J - 1 ) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 7 7 】

式 ( J - 1 ) において、R が 3 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 7 8 】

式 ( J - 1 ) において、R が 2 - C F <sub>3</sub> O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 10

【 0 2 7 9 】

式 ( J - 1 ) において、R が 4 - t B u O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 8 0 】

式 ( J - 1 ) において、R が 4 - P h O P h - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 8 1 】

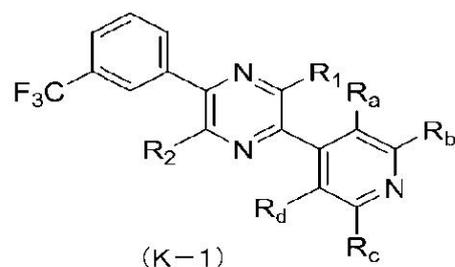
式 ( J - 1 ) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 20

【 0 2 8 2 】

式 ( J - 1 ) において、R が 4 - C F <sub>3</sub> O P h C H <sub>2</sub> - で R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 8 3 】

【 化 2 3 】



30

【 0 2 8 4 】

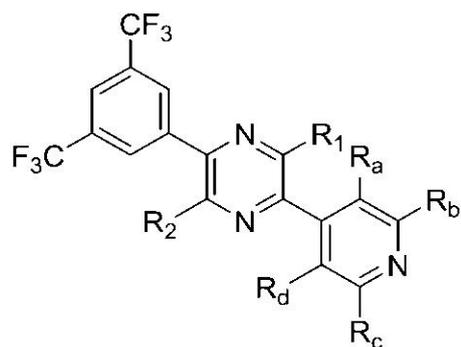
式 ( K - 1 ) において、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。 { 式中、R <sub>1</sub>、R <sub>2</sub>、R <sub>a</sub>、R <sub>b</sub>、R <sub>c</sub> 及び R <sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

【 0 2 8 5 】

40

50

## 【化 2 4】



(L-1)

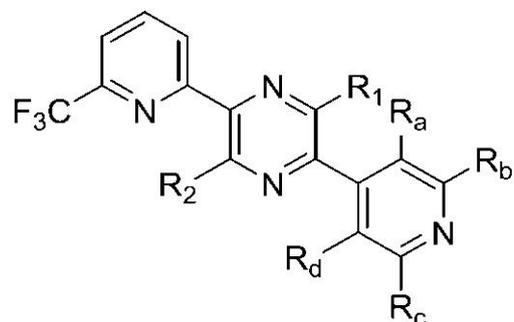
10

## 【 0 2 8 6】

式 (L-1) において、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

## 【 0 2 8 7】

## 【化 2 5】



(M-1)

20

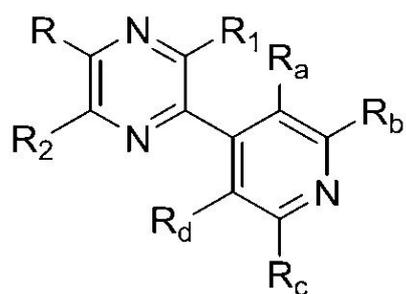
30

## 【 0 2 8 8】

式 (M-1) において、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> が表 1 に記載の組み合わせである本発明化合物。{ 式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub> 及び R<sub>d</sub> は前記と同じであることを示す。 }

## 【 0 2 8 9】

## 【化 2 6】



(N-1)

40

50

## 【0290】

式(N-1)において、RがCF<sub>3</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

## 【0291】

式(N-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。{式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>は前記と同じであることを示す。}

## 【0292】

式(N-1)において、RがCF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>-でR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>及びR<sub>d</sub>が表1に記載の組み合わせである本発明化合物。 10

## 【0293】

本発明の化合物は、立体障害により引き起こされる結合の回転の制限により1種以上の配座異性体として存在することが可能である。例えば、4-ピリジル基が、オルト位で嵩高いアルキル基(例えば、イソプロピル)で置換されている式(1)の化合物は、4-ピリジル基-ピラジニウム環結合に対する制限された回転により2種の回転異性体として存在し得る。本発明は、配座異性体の混合物を含む。

## 【0294】

## &lt;合成実施例&gt;

以下、実施例を挙げて本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。NMRデータの「s」はシングレット(一重線)、「d」はダブレット(二重線)、「t」はトリプレット(三重線)、「q」はカルテット(四重線)、「quin」はクインテット(五重線)、「sext」はセクテット(六重線)、「sept」はセプテット(七重線)、「m」はマルチプレット(多重線)を示す。 20

## 【0295】

合成実施例1-1: 2-プロモ-5-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)ピラジンの調整

2、5-ジプロモピラジン(5.00g、21.02mmol)をジメチルホルムアミド(75ml)に溶解し、室温で2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロパン-1-オール(3.78g、25.19mmol)を加えた。その後、0で水素化ナトリウム(1.09g、24.98mmol)を加え、室温で終夜攪拌した。水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、飽和食塩水で3回洗浄した。抽出した酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、酢酸エチルをエバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、2-プロモ-5-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)ピラジン(6.09g、94.4%、薄黄色油状)を得た。 30

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) 8.22(1H, d, J=2.9Hz), 8.16(1H, d, J=2.9Hz), 4.82(2H, ddd, J=14.9Hz, 12.0Hz, 3.0Hz)

## 【0296】

合成実施例1-2: 2-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)-5-(ピリジン-4-イル)ピラジン(化合物番号-1)の調整 40

合成実施例1-1で製造された2-プロモ-5-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)ピラジン(0.57g、1.86mmol)をジオキサン(60ml)に溶解し、窒素雰囲気下、室温でビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド(0.13g、0.19mmol)を加え、60に昇温した。その後、60で4-ピリジルボロン酸(0.27g、2.2mmol)、2M-炭酸水素ナトリウム水溶液(6ml)を順次加え、4時間攪拌した。室温まで冷却後、ジオキサンをエバポレーターで減圧留去し、酢酸エチル及び水で薄め濾過助剤を用いて濾過し、固形物を取り除いた。ろ液を酢酸エチルで2回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過後、ろ液をエバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して2-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)-5-(ピリジン-4-イル)ピラジ 50

ン(0.39 g、68.8%、白色固体)を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.74(2H, d,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 8.61(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 8.46(1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ ), 7.85(2H, dd,  $J=4.8\text{Hz}$ ,  $1.5\text{Hz}$ ), 4.92(2H, td,  $J=12.8$ ,  $0.9\text{Hz}$ )

【0297】

合成実施例2-1: 2-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ)-5-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボラン-2-イル)ピラジンの調整  
合成実施例1-1で製造された2-プロモ-5-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ)ピラジン(3.74 g、12.18 mmol)をジオキサン(55 ml)に溶解し、窒素雰囲気下、室温でビス(ピナコラト)ジボロン(3.10 g、12.21 mmol)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド(0.50 g、0.61 mmol)、酢酸カリウム(3.59 g、36.58 mmol)を順次加え、昇温し還流条件下、2時間撹拌した。室温まで冷却後、酢酸エチルで薄め濾過助剤を用いて濾過し、固形物を取り除いた。ろ液をエバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物2-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ)-5-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボラン-2-イル)ピラジン(4.31 g、100%、茶色油状)、を精製することなく次の反応に用いた。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.52(1H, d,  $J=2.9\text{Hz}$ ), 8.50(1H, d,  $J=2.9\text{Hz}$ ), 4.87(2H, ddd,  $J=14.9\text{Hz}$ ,  $12.0\text{Hz}$ ,  $3.0\text{Hz}$ ), 1.39(12H, s)

【0298】

合成実施例2-2: 2-(3-クロロピリジン-4-イル)-5-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ)ピラジンの調整

3-クロロ-4-ヨードピリジン(0.57 g、2.381 mmol)をジオキサン(45 ml)に溶解し、窒素雰囲気下、室温でビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド(0.17 g、0.24 mmol)を加え、60 に昇温した。その後、60 で合成実施例2-1で製造された2-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ)-5-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボラン-2-イル)ピラジン(1.1 g、1.2 mmol)、2M-炭酸水素ナトリウム水溶液(6 ml)を順次加え、2時間撹拌した。室温まで冷却後、酢酸エチル及び水で薄め濾過助剤を用いて濾過し、固形物を取り除いた。ろ液を酢酸エチルで2回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過後、ろ液をエバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して2-(3-クロロピリジン-4-イル)-5-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ)ピラジン(0.39 g、91.6%、茶色油状)を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.73(1H, s), 8.65(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 8.61(1H, d,  $J=5.1\text{Hz}$ ), 8.49(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.61(1H, d,  $J=5.1\text{Hz}$ ), 4.93(2H, td,  $J=12.9\text{Hz}$ ,  $0.9\text{Hz}$ )

【0299】

合成実施例3-1: 2-プロモ-5-(ピリジン-4-イル)ピラジンの調整

2, 5-ジプロモピラジン(0.50 g、2.102 mmol)をジオキサン(50 ml)に溶解し、窒素雰囲気下、室温でビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド(0.13 g、0.19 mmol)を加え、60 に昇温した。その後、60 で4-ピリジルボロン酸(0.26 g、2.1 mmol)、2M-炭酸水素ナトリウム水溶液(5 ml)を順次加え、3時間撹拌した。室温まで冷却後、酢酸エチル及び水で薄め濾過助剤を用いて濾過し、固形物を取り除いた。ろ液を酢酸エチルで2回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過後、ろ液をエバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して2-プロモ-5-(ピリジン-4-イル)ピラジン(0.11 g、22.2%、薄黄色固体)を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.86(1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ ), 8.83-8.74(3H, m), 7.90(2H, dd,  $J=4.5\text{Hz}$ ,  $1.8\text{Hz}$ )

【0300】

10

20

30

40

50

合成実施例 3 - 2 : 2 - ( ( 1 , 1 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イ  
 ル ) オキシ ) - 5 - ( ピリジン - 4 - イル ) ピラジン ( 化合物番号 - 19 ) の調整

合成実施例 3 - 1 で製造された 2 - ブロモ - 5 - ( ピリジン - 4 - イル ) ピラジン ( 0 .  
 96 g、0 . 41 mmol ) をジメチルホルムアミド ( 2 ml ) に溶解し、室温で 1 , 1  
 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - オール ( 0 . 83 g、0 . 4939 m  
 mol )、炭酸カリウム ( 0 . 11 g、0 . 82 mmol )、18 - クラウン - 6 - エー  
 テル ( 触媒量 ) を順次加え、室温で終夜撹拌した。水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、  
 飽和食塩水で 3 回洗浄した。抽出した酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過  
 後、酢酸エチルをエバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマ  
 トグラフィーで精製し、2 - ( ( 1 , 1 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2  
 - イル ) オキシ ) - 5 - ( ピリジン - 4 - イル ) ピラジン ( 0 . 66 g、50 . 2 %、薄  
 茶色固体 ) を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.78(1H, s), 8.76(1H, s), 8.63(1H, d, J=1.2 Hz), 8.58  
 (1H, d, J=1.5 Hz), 7.87(1H, d, J=1.8 Hz), 7.85(1H, d, J=1.5 Hz), 6.50-6.38  
 (1H, m)

【 0301 】

合成実施例 4 - 1 : tert - ブチル N - ( 5 - プロモピラジン - 2 - イル ) - N - [ ( 2 - メチルプロパン - 2 - イル ) オキシカルボニル ] カーバメートの調整

2 - アミノ - 5 - プロモピラジン ( 5 . 00 g、28 . 74 mmol )、N , N - ジイソ  
 プロピルエチルアミン ( 14 . 6 mL、85 . 86 mmol )、4 - ジメチルアミノピリ  
 ジン ( 3 . 51 g、28 . 73 mmol ) をテトラヒドロフラン ( 50 mL ) に溶解し、  
 激しく発泡しないように二炭酸ジ - tert - ブチル ( 13 . 22 g、60 . 57 mmol )  
 をゆっくり加えた。室温で 2 時間撹拌した後水を加え、酢酸エチルで 2 度抽出し、硫  
 酸マグネシウムを加え脱水した。吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃  
 縮し、茶色い固体の組成性物を得、シリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合  
 物を得た。( 7 . 60 g、収率 70 . 7 %、白色固体 )

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.54(1H, s), 8.36(1H, s), 1.46(18H, s)

【 0302 】

合成実施例 4 - 2 : tert - ブチル N - ( 5 - ( 3 - フルオロピリジン - 4 - イル )  
 ピラジン - 2 - イル ) - N - [ ( 2 - メチルプロパン - 2 - イル ) オキシカルボニル ]  
 カーバメートの調整

tert - ブチル N - ( 5 - プロモピラジン - 2 - イル ) - N - [ ( 2 - メチルプロパ  
 ン - 2 - イル ) オキシカルボニル ] カーバメート ( 3 . 00 g、8 . 02 mmol )、  
 3 - フルオロ - 4 - ピリジンボロン酸ピナコールエステル ( 2 . 15 g、9 . 64 mmol )  
 を 1 , 4 - ジオキサソ ( 60 mL ) に溶解し、そこに炭酸カリウム ( 3 . 32 g、2  
 4 . 02 mmol ) を加え、反応器内を窒素ガスで置換した。そこに [ 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 ) ジクロリド ジクロロメタン付  
 加物 ( 0 . 65 g、0 . 80 mmol ) を加え、加熱還流下、5 時間撹拌した。放冷後、  
 水、酢酸エチルを適量加え、セライトを使用して吸引ろ過し、不溶解物を取り除き、ろ液  
 を減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化  
 合物 ( 1 . 08 g、収率 34 . 5 %、微褐色固体 ) を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.05(1H, s), 8.77(1H, d, J=1.2 Hz), 8.64(1H, d, J=2.  
 7 Hz), 8.58(1H, d, J=4.8 Hz), 8.05(1H, t, J=5.7 Hz), 1.50(18H, s)

【 0303 】

合成実施例 4 - 3 : 5 - ( 3 - フルオロピリジン - 4 - イル ) ピラジン - 2 - アミンの調整

tert - ブチル N - ( 5 - ( 3 - フルオロピリジン - 4 - イル ) ピラジン - 2 - イル )  
 - N - [ ( 2 - メチルプロパン - 2 - イル ) オキシカルボニル ] カーバメート ( 3 .  
 12 g、7 . 99 mmol ) をメタノール ( 50 mL ) に溶解し、撹拌下、濃塩酸 ( 25  
 mL ) を加え、50 で 2 時間撹拌した。放冷後、反応物に水酸化ナトリウム水溶液を加え

10

20

30

40

50

塩基性とし、減圧濃縮によりメタノールを除去した。得られた水層は酢酸エチルで3回抽出して水層を除去し、硫酸マグネシウムを加え有機層を脱水した。吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃縮し、表題の化合物(1.39g、収率91.5%、微褐色固体)を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.68(1H, s), 8.54(1H, d,  $J=3.0\text{Hz}$ ), 8.48(1H, d,  $J=4.8\text{Hz}$ ), 8.12(1H, s), 7.95(1H, t,  $J=5.7\text{Hz}$ ), 4.83(2H, s)

【0304】

合成実施例4-4:5-[3-(エチルチオ)ピリジン-4-イル]ピラジン-2-アミンの調整

N,N-ジメチルホルムアミド(13mL)にエタンチオール(1.12mL、15.14mmol)を加え、氷浴で冷却下、水素化ナトリウム(0.70g、55%、16.04mmol)を加え、同温度で30分撹拌した。そこにN,N-ジメチルホルムアミド(13mL)に溶解した5-(3-フルオロピリジン-4-イル)ピラジン-2-アミン(1.39g、7.309mmol)を加え、室温で2時間撹拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムを加え有機層を脱水した。その後吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃縮し、薄い黄色固体の組成性物を得、これをシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物を得た。表題の化合物(1.12g、収率66.0%、微褐色固体)を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.65(1H, s), 8.48(1H, d,  $J=4.8\text{Hz}$ ), 8.43(1H, s), 8.10(1H, s), 7.42(1H, d,  $J=5.1\text{Hz}$ ), 4.77(2H, s), 2.92(2H, q,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 1.26(3H, t,  $J=7.5\text{Hz}$ )

【0305】

合成実施例4-5:2-[3-(エチルチオ)ピリジン-4-イル]-5-ヨードピラジンの調整

テトラヒドロフラン(55mL)に5-[3-(エチルチオ)ピリジン-4-イル]ピラジン-2-アミン(1.12g、4.82mmol)を加え、続いて亜硝酸イソアミル(2.1mL、15.78mmol)、ジヨードメタン(0.43mL、5.35mmol)、ヨウ化銅(II)(1.01g、5.30mmol)を加え、加熱還流下、3時間撹拌した。放冷後、水、酢酸エチルを適量加え、セライトを使用して吸引ろ過し、不溶解物を取り除き、ろ液を減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物(0.97g、収率58.6%、茶色固体)を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.97(1H, s), 8.85-8.45(3H, m), 7.43(1H, d,  $J=4.2\text{Hz}$ ), 2.93(2H, q,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 1.26(3H, t,  $J=7.5\text{Hz}$ )

【0306】

合成実施例4-6:2-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-[3-(エチルチオ)ピリジン-4-イル]-ピラジン(化合物番号-88)の調整

テトラヒドロフラン(55mL)に2-[3-(エチルチオ)ピリジン-4-イル]-5-ヨードピラジン(0.20g、0.58mmol)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)(42mg、0.06mmol)を1,4-ジオキサソランに溶解し、反応器内を窒素ガスで置換後、60°Cで10分加熱撹拌した。放冷し、[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ボロン酸(133mg、0.70mmol)を加え、さらに加熱還流下、5時間撹拌した。放冷し、水、酢酸エチルを適量加え、セライトを使用して吸引ろ過し、不溶解物を取り除いた。ろ液を酢酸エチルで2回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、吸引ろ過で除去後、減圧濃縮により、組成生物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物(173mg、収率81.7%、茶色固体)を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.24(1H, s), 9.10(1H, d,  $J=0.9\text{Hz}$ ), 8.77(1H, s), 8.64-8.56(3H, m), 8.02(1H, s), 7.53(1H, d,  $J=4.8\text{Hz}$ ), 2.96(2H, q,  $J=7.5\text{Hz}$ ), 1.27(3H, t,  $J=7.5\text{Hz}$ )

【0307】

10

20

30

40

50

合成実施例 4 - 7 : 2 - [ 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル ] - 5 - [ 3 - (エチルスルホニル) ピリジン - 4 - イル ] - ピラジン (化合物番号 - 90) の調整  
 2 - [ 3 - (エチルチオ) ピリジン - 4 - イル ] - 5 - [ 3 - (トリフルオロメチル) フェニル ] ピラジン ( 111 mg、0.31 mmol ) をジクロロメタン ( 3 mL ) に溶解し、氷冷下、3 - クロロ過安息香酸 ( 約 30% 含水、183 mg、0.69 mmol ) を加え、室温で 2 時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、吸引ろ過で除去後、減圧濃縮により、組成生物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物 ( 87 mg、収率 71.9%、微褐色アモルファス ) を得た。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.37(1H, s), 9.18(1H, d,  $J=1.2\text{ Hz}$ ), 9.04(1H, d,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 8.89(1H, d,  $J=1.5\text{ Hz}$ ), 8.59(2H, s), 8.03(1H, s), 7.51(1H, d,  $J=4.8\text{ Hz}$ ) 3.61(2H, q,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 1.39(3H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )

10

## 【 0308 】

合成実施例 5 - 1 : 2 - ( 3 - メトキシピリジン - 4 - イル ) - 5 - ( 2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ペンタフルオロプロポキシ ) ピラジン (化合物番号 - 4) の調整

合成実施例 1 - 1 に記載の 2 - プロモ - 5 - ( 2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ペンタフルオロプロポキシ ) ピラジン ( 0.50 g、1.63 mmol ) をジオキササン ( 50 mL ) に溶解し、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム ( II ) ( 114 mg、0.16 mmol ) を加え、窒素雰囲気下、60 で 10 分間加熱攪拌した。放冷後、4 - プロモ - 3 - メトキシピリジン ( 0.30 g、1.97 mmol )、2 M - 炭酸ナトリウム水溶液を 5 mL 加え、加熱還流下、2 時間攪拌した。放冷後、水、酢酸エチルを適量加え、セライトを使用して吸引ろ過し、不溶解物を取り除き、ろ液を減圧濃縮した。その後、酢酸エチルで 2 回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、吸引ろ過で除去後、減圧濃縮により、組成生物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物 ( 0.29 g、収率 53.3%、無色オイル ) を得た。

20

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  8.86(1H, d,  $J=1.2\text{ Hz}$ ), 8.45(1H, d,  $J=1.5\text{ Hz}$ ), 8.45(1H, s), 8.39(1H, d,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 7.85(1H, d,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 4.92(2H, td,  $J=12.8, 0.9\text{ Hz}$ ), 4.04(3H, s)

## 【 0309 】

合成実施例 6 - 1 : 2 - ( 3 - (エチルチオ) ピラジン - 4 - イル ) - 5 - ( パーフルオロプロピル ) ピラジン (化合物番号 - 83) の調整

塩化銅 ( I ) ( 0.29 g、2.91 mmol )、tert - ブトキシカリウム ( 0.33 g、2.91 mmol )、1,10 - フェナントリン ( 0.53 g、2.91 mmol ) を N, N - ジメチルホルムアミド ( 6 mL ) に溶解、脱気後、窒素置換し、30 分間室温で攪拌した。トリメチル (ヘプタフルオロプロピル) シラン ( 0.71 g、2.91 mmol ) を室温に加え、再度、反応器内を窒素置換し、室温で 1 時間攪拌した。そこに合成実施例 4 - 5 に記載の 2 - [ 3 - (エチルチオ) ピリジン - 4 - イル ] - 5 - ヨードピラジン ( 0.50 g、1.46 mmol ) を加え、50 で 14 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチルを適量加え、セライトを使用して吸引ろ過し、不溶解物を取り除き、ろ液に水を加えて。その後、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、吸引ろ過で除去後、減圧濃縮により、粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物 ( 0.19 g、収率 33.8%、黄色固体 ) を得た。

40

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.13(1H, s), 9.06(1H, s), 8.79(1H, s), 8.62(1H, d,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 7.50(1H, d,  $J=5.1\text{ Hz}$ ) 2.94(2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 1.26(3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

## 【 0310 】

合成実施例 7 - 1 : 5 - クロロ - N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピラジン - 2 - カルボキシアミドの調整

5 - クロロピラジン - 2 - カルボン酸 ( 1.00 g、6.31 mmol )、2,2,2 - トリフルオロエチルアミン ( 687.52 mg、6.94 mmol )、N, N - ジイソプロピルエチルアミン ( 3.56 mL、20.81 mmol )、O - ( 7 - アザベンゾトリ

50

アゾール - 1 - イル) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスファートを塩化メチレン ( 3 0 m L ) に溶解し、窒素雰囲気下、室温で終夜攪拌した。その後、飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムを加え脱水した。吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃縮し、組成性物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物を得た。( 1 . 1 0 g、収率 7 2 . 8 %、白色固体)  
 $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.20(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 8.56(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.94 (1 H, bs), 4.14(2H, ddd,  $J=15.9\text{Hz}$ ,  $9.0\text{Hz}$ ,  $6.6\text{Hz}$ )

## 【 0 3 1 1 】

合成実施例 7 - 2 : 5 - ( 3 - フルオロピリジン - 4 - イル ) - N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピラジン - 2 - カルボキシアミド ( 化合物番号 - 6 1 ) の調整 10  
 5 - クロロ - N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピラジン - 2 - カルボキシアミド ( 2 . 9 8 g、1 2 . 4 4 m m o l )、3 - フルオロ - 4 - ピリジンボロン酸ピナコールエステル ( 2 . 9 8 g、2 1 . 1 5 m m o l ) をアセトニトリル ( 4 8 m L ) に溶解し、そこに水 ( 5 m L ) に溶解した酢酸カリウム ( 3 . 6 6 g、3 7 . 3 1 m m o l ) を加え、反応器内を窒素ガスで置換した。そこにジクロロビス [ ジ - t - ブチル ( p - ジメチルアミノフェニル ) ホスフィノ ] パラジウム ( I I ) ( 0 . 8 8 g、1 . 2 4 m m o l ) を加え、加熱還流下、1 9 時間攪拌した。放冷後、水、酢酸エチルを適量加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムを加え脱水した。吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃縮し、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物 ( 1 . 6 6 g、収率 4 4 . 5 %、黄色固体 ) を得た。 20  
 $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.54(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 8.69(1H, d,  $J=2.7\text{Hz}$ ), 8.64(1H, dd,  $J=5.1\text{Hz}$ ,  $0.9\text{Hz}$ ), 8.14(1H, s), 8.10(2H, dd,  $J=6.6\text{Hz}$ ,  $5.1\text{Hz}$ ), 4.17(2H, dtd,  $J=17.7\text{Hz}$ ,  $9.0\text{Hz}$ ,  $6.6\text{Hz}$ )

## 【 0 3 1 2 】

合成実施例 8 - 1 : 5 - ( 3 - ( エチルチオ ) ピリジン - 4 - イル ) - N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピラジン - 2 - カルボキシアミド ( 化合物番号 - 5 9 ) の調整  
 5 - ( 3 - フルオロピリジン - 4 - イル ) - N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピラジン - 2 - カルボキシアミド ( 化合物番号 - 6 1 ) ( 0 . 1 2 g、0 . 4 0 m m o l ) を塩化メチレン ( 1 0 m L ) に溶解し、室温でエタンチオール ( 7 3  $\mu\text{L}$ 、0 . 8 0 m m o l ) を加えた後、水素化ナトリウム ( 3 4 . 9 0 m g、0 . 8 0 m m o l ) を加えて、 30  
 そのまま終夜攪拌した。その後、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムを加え脱水した。吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃縮し、組成性物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物 ( 0 . 1 2 g、収率 9 2 . 6 %、薄茶色アモルファス ) を得た。  
 $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.53(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 8.95(1H, d,  $J=1.5\text{Hz}$ ), 7.78(1H, s), 8.61(1H, s), 8.12(1H, s), 7.50(1H, d,  $J=1.8\text{Hz}$ ), 4.18(2H, tdd,  $J=9.0\text{Hz}$ ,  $9.0\text{Hz}$ ,  $6.9\text{Hz}$ ), 2.92(2H, td,  $J=7.8\text{Hz}$ ,  $7.8\text{Hz}$ ), 1.25(3H, t,  $J=7.8\text{Hz}$ )

## 【 0 3 1 3 】

合成実施例 9 - 1 : 5 - ( 3 - ( エチルスルフォニル ) ピリジン - 4 - イル ) - N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピラジン - 2 - カルボキシアミド ( 化合物番号 - 6 8 ) の調整 40  
 5 - ( 3 - ( エチルチオ ) ピリジン - 4 - イル ) - N - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピラジン - 2 - カルボキシアミド ( 化合物番号 - 5 9 ) ( 0 . 1 5 g、0 . 4 4 m m o l ) を塩化メチレン ( 4 . 5 m l ) に溶解し、氷浴で冷却下、m - クロロ過安息香酸 ( 0 . 2 6 g、7 0 %、0 . 9 6 m m o l ) を加え、室温で 5 時間攪拌した。反応終了後、飽和重曹水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、硫酸マグネシウムを加え有機層を脱水した。その後吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃縮し、組成性物を得、これをシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物 ( 0 . 0 9 g、収率 5 6 . 7 %、白色アモルファス ) を得た。  
 $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$  9.45(1H, s), 9.35(1H, s), 9.03(1H, d,  $J=5.1\text{Hz}$ ), 8.73 50

(1H, s), 8.12(1H, m), 7.46(1H, d, J=4.8Hz), 4.18(2H, m), 3.49(2H, d, J=7.5Hz), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)

【0314】

合成実施例10-1: 5-(3-(ジメチルアミノ)ピリジン-4-イル)-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピラジン-2-カルボキシアミド(化合物番号-65)の調整

5-(3-フルオロピリジン-4-イル)-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピラジン-2-カルボキシアミド(化合物番号-61)(0.36g、1.20mmol)を50%ジメチルアミン水溶液(10mL)に溶解させ、そのまま終夜攪拌し、その後、加熱還流下、7時間攪拌した。放冷後、減圧濃縮し、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物(0.35g、収率89.7%、黄色固体)を得た。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) 9.50(1H, d, J=1.2Hz), 9.20(1H, d, J=1.2Hz), 8.51(1H, s), 8.39(1H, d, J=5.1Hz), 8.11(1H, t, J=5.7Hz), 7.53(1H, d, J=4.8Hz), 4.17(2H, dq, J=9.0Hz, 6.6Hz), 2.72(6H, s)

【0315】

合成実施例11-1: 5-(3-(ジメチルアミノ)ピリジン-4-イル)-N-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピラジン-2-カルボキシアミド(化合物番号-66)の調整

テトラヒドロフラン(10mL)に5-(3-(ジメチルアミノ)ピリジン-4-イル)-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピラジン-2-カルボキシアミド(化合物番号-65)溶解した後、窒素雰囲気下、0℃で水素化ナトリウム(0.12g、4.80mmol)、ヨウ化メチル(299.2μL、4.80mmol)を順次加えた。室温で終夜攪拌後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸マグネシウムを加え脱水し、吸引ろ過により、硫化マグネシウムを取り除き、減圧濃縮し、得られた組成性物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、表題の化合物(42.7mg、収率13.6%、黄色油状)を得た。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) 9.23(0.5H, s), 9.19(0.5H, s), 9.15(0.5H, s), 9.12(0.5H, s), 8.49(1H, s), 8.38(1H, d, J=4.8Hz), 7.57-7.50(1H, m), 4.64(1H, q, J=8.1Hz), 4.27(1H, q, J=8.7Hz), 3.36(1.5H, s), 3.30(1.5H, s), 2.72(3H, s), 2.71(3H, s)

【0316】

上記と同様の方法より合成した式(1)化合物のプロトンNMRスペクトルデータ及び融点は表2、3の通りであった。

【0317】

10

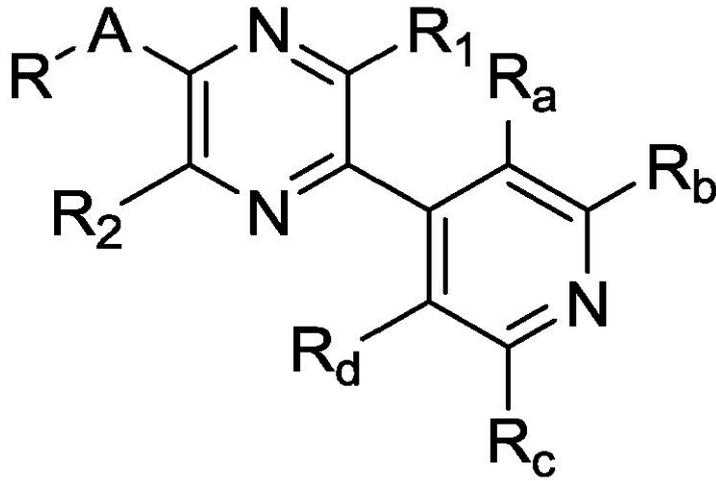
20

30

40

50

【化 2 7】

**(1)**

10

20

30

40

50

【表 2 - 1】

化合物 番号	R	A	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>b</sub>	R <sub>c</sub>	R <sub>d</sub>
1	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
2	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	Me	H	H	H
3	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	Me	H	H
4	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	OMe	H	H	H
5	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	OMe	H	H
6	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	Cl	H	H	H
7	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	Cl	H	H
8	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	F	H	H	H
9	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	F	H	H
10	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	OMe	H	H	H	H	H
11	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	OMe	H	H	H	H
12	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	H	H
13	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	CO <sub>2</sub> Me	H	H	H	H
14	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	OiPr	H	H	H	H	H
15	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	OiPr	H	H	H	H
16	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
17	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
18	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
19	(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	O	H	H	H	H	H	H
20	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
21	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
22	4-CF <sub>3</sub> Ph	O	H	H	H	H	H	H
23	4-CF <sub>3</sub> OPh	O	H	H	H	H	H	H
24	4- <i>t</i> -BuOPh	O	H	H	H	H	H	H
25	4-PhO-Ph	O	H	H	H	H	H	H
26	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
27	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	S	H	H	H	H	H	H
28	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO	H	H	H	H	H	H
29	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
30	Me	NMe	C=ONMe	H	H	H	H	H
31	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	H	H	H	H
32	CF <sub>3</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O	H	H	H	H	H	H
33	CHF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	H	H	H
34	2-CF <sub>3</sub> OPh	O	H	H	H	H	H	H
35	3-CF <sub>3</sub> OPh	O	H	H	H	H	H	H
36	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	S	H	H	Cl	H	H	H
37	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	S	H	H	SEt	H	H	H
38	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	NHAc	H	H
39	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H
40	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	SMe	H	H	H	H	H
41	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	SMe	H	H	H	H
42	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	SEt	H	H	H
43	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
44	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H
45	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	NHAc	H	H	H
46	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	NMeAc	H	H	H

10

20

30

40

50

【表 2 - 2】

化合物 番号	R	A	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>a</sub>	R <sub>b</sub>	R <sub>c</sub>	R <sub>d</sub>
47	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	NHMe	H	H	H
48	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>	C=ONH	H	H	H	H	H	H
49	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	OEt	H	H	H
50	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	SMe	H	H	H
51	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	O <i>i</i> Pr	H	H	H
52	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	O <i>n</i> Pr	H	H	H
53	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H
54	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	SMe	H	H	H
55	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	S <i>i</i> Pr	H	H	H
56	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	S <i>n</i> Pr	H	H	H
57	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	H	H	H	H
58	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	O	H	H	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H
59	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	SEt	H	H	H
60	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	SEt	H	H	H
61	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	F	H	H	H
62	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	OMe	H	H	H
63	4-CF <sub>3</sub> OPh	O	H	H	OMe	H	H	H
64	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	F	H	H	H
65	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H
66	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H
67	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	OMe	H	H	H
68	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
69	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
70	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
71	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	NHMe	H	H	H
72	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	NHEt	H	H	H
73	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	NEtMe	H	H	H
74	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	pyrrolidin-1-yl	H	H	H
75	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	pyrrolidin-1-yl	H	H	H
76	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	Morpholinyl	H	H	H
77	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	Morpholinyl	H	H	H
78	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	Thiomorpholinyl	H	H	H
79	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	Thiomorpholinyl	H	H	H
80	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	Thiomorpholinyl 1-oxide	H	H	H
81	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NHC=O	H	H	Thiomorpholinyl 1, 1-dioxide	H	H	H
82	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	NMeC=O	H	H	Thiomorpholinyl 1, 1-dioxide	H	H	H
83	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub>	直接結合	H	H	SEt	H	H	H
84	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub>	直接結合	H	H	SOEt	H	H	H
85	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub>	直接結合	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
86	3-(trifluoromethyl)phenyl	直接結合	H	H	SEt	H	H	H
87	3-(trifluoromethyl)phenyl	直接結合	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
88	3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl	直接結合	H	H	SEt	H	H	H
89	3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl	直接結合	H	H	SOEt	H	H	H
90	3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl	直接結合	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H
91	6-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl	直接結合	H	H	SEt	H	H	H
92	6-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl	直接結合	H	H	SO <sub>2</sub> Et	H	H	H

10

20

30

40

50

【表 3 - 1】

化合物番号	重溶媒	1H NMR 300MHz, δppm	融点 /°C
1	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, d, J=6.0Hz), 8.61(1H, d, J=1.5Hz), 8.46(1H, d, J=1.2Hz), 7.85(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 4.92(2H, td, J=12.8, 0.9Hz)	75~83
2	CDCl <sub>3</sub>	8.57(1H, s), 8.56(1H, d, J=5.1Hz), 8.47(1H, d, J=1.2Hz), 8.28(1H, d, J=1.2Hz), 7.35(1H, d, J=4.8Hz), 4.91(2H, td, J=12.8, 0.9Hz), 2.45(s, 3H)	—
3	CDCl <sub>3</sub>	8.62(1H, d, J=5.1Hz), 8.56(1H, d, J=1.5Hz), 8.45(1H, d, J=1.5Hz), 7.77(1H, s), 7.62(1H, dd, J=5.4Hz, 1.2Hz), 4.91(2H, td, J=12.8, 0.9Hz), 2.66(3H, s)	—
4	CDCl <sub>3</sub>	8.86(1H, d, J=1.2Hz), 8.45(1H, d, J=1.5Hz), 8.45(1H, s), 8.39(1H, d, J=5.1Hz), 7.85(1H, d, J=4.8Hz), 4.92(2H, td, J=12.8, 0.9Hz), 4.04(3H, s)	63~65
5	CDCl <sub>3</sub>	8.56(1H, d, J=1.2Hz), 8.44(1H, d, J=1.2Hz), 8.27(1H, d, J=5.4Hz), 7.42(1H, dd, J=5.4Hz, 1.5Hz), 7.29(1H, d, J=0.6Hz), 4.91(2H, td, J=12.8, 0.9Hz), 4.00(3H, s)	97~101
6	CDCl <sub>3</sub>	8.73(1H, s), 8.63(1H, d, J=1.5Hz), 8.61(1H, d, J=5.1Hz), 8.49(1H, d, J=1.5Hz), 7.61(1H, d, J=5.1Hz), 4.93(2H, td, J=12.9Hz, 0.9Hz)	—
7	CDCl <sub>3</sub>	8.61(1H, d, J=1.2Hz), 8.50(1H, d, J=5.1Hz), 8.46(1H, d, J=1.5Hz), 7.92(1H, d, J=0.9Hz), 7.77(1H, dd, J=5.1, 1.5Hz), 4.93(2H, td, J=12.8, 0.9Hz)	91~94
8	CDCl <sub>3</sub>	8.76(1H, t, J=1.5Hz), 8.61(1H, d, J=3.0Hz), 8.55(1H, dd, J=5.1, 0.9Hz), 8.49(1H, d, J=1.2Hz), 8.01(1H, dd, J=6.6, 5.1Hz), 4.93(2H, td, J=12.8, 0.9Hz)	75~78
9	CDCl <sub>3</sub>	8.61(1H, d, J=1.5Hz), 8.46(1H, d, J=1.5Hz), 8.34(1H, d, J=5.4Hz), 7.73(1H, dd, J=5.4, 1.5Hz), 7.52(1H, s), 4.93(2H, td, J=12.8Hz)	75~83
10	CDCl <sub>3</sub>	8.69(1H, d, J=1.8Hz), 8.68(1H, d, J=1.5Hz), 8.07(1H, s), 7.99(1H, d, J=1.5Hz), 7.97(1H, d, J=1.5Hz), 4.91(2H, td, J=12.6, 0.9Hz), 4.09(3H, s)	118~119
11	CDCl <sub>3</sub>	8.71(2H, d, J=6.0Hz), 8.17(1H, s), 7.89(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.94(2H, td, J=12.9, 0.9Hz), 2.66(3H, s)	118~120
12	CDCl <sub>3</sub>	8.73(2H, d, J=4.5Hz, 1.5Hz), 8.56(1H, s), 7.49(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.93(2H, td, J=12.6, 0.9Hz), 3.83(3H, s)	—
13	CDCl <sub>3</sub>	8.8(2H, bs), 8.73(1H, s), 7.90(2H, d, J=5.1Hz), 4.98(2H, d, J=12.3, 0.9Hz), 4.03(3H, s)	60~64
14	CDCl <sub>3</sub>	8.67(2H, d, J=5.7Hz), 8.03(1H, s), 8.00(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 5.55-5.44(1H, m), 4.86(2H, td, J=12.6, 0.6Hz), 1.47(6H, d, J=6.0)	38~39
15	CDCl <sub>3</sub>	8.69(2H, d, J=6.0Hz), 8.12(1H, s), 7.80(2H, dd, J=4.5Hz, 1.8Hz), 5.55-5.44(1H, m), 4.93(2H, td, J=12.9, 0.9Hz), 1.47(6H, d, J=6.0)	96~98
16	CDCl <sub>3</sub>	8.71(2H, d, J=6.0Hz), 8.59(1H, d, J=1.5Hz), 8.31(1H, d, J=1.5Hz), 7.82(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.35(2H, t, J=6.6Hz), 1.91-1.79(2H, m), 1.06(3H, t, J=7.35)	77~80
17	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 8.61(1H, d, J=1.5Hz), 8.47(1H, d, J=1.5Hz), 7.84(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.92(2H, q, J=8.3Hz)	87~92
18	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, d, J=6.0Hz), 8.62(1H, d, J=1.5Hz), 8.46(1H, d, J=1.5Hz), 7.85(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.98(2H, t, J=13.5Hz)	84~87
19	CDCl <sub>3</sub>	8.73(1H, s), 8.76(1H, s), 8.63(1H, d, J=1.2Hz), 8.58(1H, d, J=1.5Hz), 7.87(1H, d, J=1.8Hz), 7.85(1H, d, J=1.5Hz), 6.50-6.38(1H, m)	88~92
20	CDCl <sub>3</sub>	8.72(2H, d, J=5.7Hz), 8.60(1H, d, J=1.2Hz), 8.35(1H, d, J=1.5Hz), 7.83(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.64(2H, t, J=6.5Hz), 2.75-2.61(2H, m)	73~76
21	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 8.61(1H, d, J=1.2Hz), 8.46(1H, d, J=1.5Hz), 7.85(2H, dd, J=4.5Hz, 1.8Hz), 4.96(2H, td, J=13.4, 2.4Hz)	69~72
22	CDCl <sub>3</sub>	8.75(2H, d, J=6.0Hz), 8.61(1H, d, J=1.2Hz), 8.59(1H, d, J=1.5Hz), 7.85(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 7.73(2H, d, J=8.7Hz), 7.33(2H, d, J=8.4Hz)	107~110
23	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 8.60(1H, d, J=1.5Hz), 8.55(1H, d, J=1.5Hz), 7.84(2H, dd, J=4.5Hz, 1.8Hz), 7.31(2H, d, J=6.0Hz), 7.24(2H, dd, J=6.9Hz, 2.4Hz)	110~112
24	CDCl <sub>3</sub>	8.73(2H, d, J=6.3Hz), 8.61(1H, d, J=1.2Hz), 8.50(1H, d, J=1.2Hz), 7.83(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 7.48(2H, dd, J=6.6Hz, 2.1Hz), 7.13(2H, d, J=6.6Hz, 2.1Hz), 1.37(9H, s)	97~100
25	CDCl <sub>3</sub>	8.73(2H, d, J=6.0Hz), 8.61(1H, d, J=1.5Hz), 8.51(1H, d, J=1.5Hz), 7.84(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 7.40-7.33(2H, m), 7.18-7.05(7H, m)	126~131
26	CDCl <sub>3</sub>	8.72(2H, d, J=6.0Hz), 8.61(1H, d, J=1.5Hz), 8.41(1H, d, J=1.5Hz), 7.84(2H, dd, J=4.8Hz, 1.8Hz), 7.67(2H, s), 7.59(2H, d=8.1Hz), 5.52(2H, s)	139~144
27	CDCl <sub>3</sub>	8.90(1H, d, J=1.5Hz), 8.75(2H, d, 5.1Hz), 8.55(1H, d, J=1.8Hz), 7.87(2H, d, J=6.3Hz), 3.43-3.38(2H, m), 2.67-2.52(2H, m)	73~76
28	CDCl <sub>3</sub>	9.27(1H, d, J=1.2Hz), 9.11(1H, d, 1.5Hz), 8.85(2H, d, J=6.0Hz), 7.99(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 3.53-3.43(1H, m), 3.32-3.22(1H, m), 2.90-2.69(1H, m), 2.37-2.16(1H, m)	133~136
29	CDCl <sub>3</sub>	9.39(1H, d, J=1.2Hz), 9.20(1H, d, 1.5Hz), 8.88(2H, s), 7.99(2H, d, J=5.4Hz), 3.71-3.66(2H, m), 2.83-2.67(2H, m)	—
30	CDCl <sub>3</sub>	8.62(2H, d, J=4.5Hz, 1.8Hz), 8.15(1H, s), 7.64(2H, J=4.8Hz, 1.8Hz), 3.21(6H, s), 3.06(3H, s), 2.63(3H, s)	177~182
31	CDCl <sub>3</sub>	9.51(1H, d, J=1.2Hz), 9.04(1H, d, J=1.2Hz), 8.83(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 8.09(1H, bs), 7.98(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.20(1H, dd, J=8.7Hz, 6.6Hz), 4.14(1H, dd, J=9.0Hz, 6.6Hz)	166~172
32	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, dd, J=4.5Hz, 1.8Hz), 8.62(1H, d, J=1.5Hz), 8.46(1H, d, J=1.5Hz), 7.84(1H, d, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.98(2H, t, J=13.5Hz)	84~88
33	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 8.62(1H, d, J=1.5Hz), 8.44(1H, d, J=1.5Hz), 7.85(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 6.03(1H, tt, J=5.3, 1Hz, 4.2Hz), 4.34(2H, tt, J=12.6Hz, 1.5Hz)	69~74
34	CDCl <sub>3</sub>	8.74(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 7.85(1H, d, J=1.8Hz), 7.83(1H, d, J=1.5Hz), 7.58(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 7.43-7.31(4H, m)	126~129
35	CDCl <sub>3</sub>	8.75(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 8.61(1H, d, J=1.5Hz), 8.55(1H, d, J=1.2Hz), 7.85(2H, dd, J=4.5Hz, 1.8Hz), 7.48(1H, t, J=8.1Hz), 7.19-7.13(3H, m)	98~104
36	CDCl <sub>3</sub>	8.89(1H, d, J=1.5Hz), 8.72(1H, s), 8.60(1H, d, J=4.8Hz), 8.55(1H, d, J=1.8Hz), 7.63(1H, d, J=4.8Hz), 3.24(2H, q, J=7.3Hz), 1.43(3H, t, J=7.3Hz)	45~48
37	CDCl <sub>3</sub>	8.76(1H, d, J=1.8Hz), 8.70(1H, s), 8.54(1H, d, J=1.5Hz), 8.52(1H, d, J=5.1Hz), 7.44(1H, d, J=4.8Hz), 3.25(2H, q, J=7.4Hz), 2.93(2H, q, J=7.4Hz), 1.43(3H, t, J=7.3Hz), 1.26(3H, t, J=7.3Hz)	93~98
38	CDCl <sub>3</sub>	8.74(1H, s), 8.65(1H, d, J=1.5Hz), 8.44(1H, d, J=1.5Hz), 8.37(1H, d, J=5.1Hz), 8.03(1H, s), 7.65(1H, dd, J=5.1Hz, 1.5Hz), 4.91(2H, td, J=12.9Hz, 1.2Hz), 2.25(3H, s)	170~172
39	CDCl <sub>3</sub>	8.54(1H, d, J=1.5Hz), 8.42(1H, d, 1.5Hz), 8.27(1H, dd, J=5.1Hz, 0.6Hz), 7.11(1H, s), 7.00(1H, dd, J=5.4Hz, 1.5Hz), 4.90(2H, td, J=12.9Hz, 0.9Hz), 3.17(6H, s)	54~56
40	CDCl <sub>3</sub>	8.72(2H, dd, J=4.5Hz, 1.2Hz), 8.19(1H, s), 7.67(2H, dd, J=4.5Hz, 1.8Hz), 4.95(2H, td, J=12.6Hz, 0.9Hz), 2.55(3H, s)	—
41	CDCl <sub>3</sub>	8.72(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz), 8.25(1H, s), 7.86(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 4.95(2H, td, J=12.3Hz, 0.9Hz), 2.65(3H, s)	79~81
42	CDCl <sub>3</sub>	8.70(1H, s), 8.53(1H, d, 5.1Hz), 8.47(2H, d, J=1.5Hz), 7.44(1H, d, J=5.1Hz), 4.91(2H, td, J=12.9Hz, 0.9Hz), 2.93(2H, q, J=7.2Hz), 1.26(3H, t, 7.2Hz)	—
43	CDCl <sub>3</sub>	9.32(1H, s), 8.96(1H, d, d=4.8Hz), 8.39(1H, d, J=1.5Hz), 8.31(1H, d, J=1.5Hz), 7.43(1H, d, J=4.8Hz), 4.91(2H, td, J=12.6Hz, 0.9Hz), 3.55(2H, q, J=4.5Hz), 1.35(3H, t, 4.5Hz)	—
44	CDCl <sub>3</sub>	8.58(1H, d, J=1.5Hz), 8.38(1H, d, 1.5Hz), 8.20(1H, s), 8.05(1H, d, J=5.4Hz), 7.37(1H, d, J=5.4Hz), 5.47(2H, s), 4.97(2H, td, J=12.9Hz, 0.9Hz)	125~127
45	CDCl <sub>3</sub>	10.70(1H, s), 9.71(1H, s), 8.64(1H, d, J=1.2Hz), 8.47(1H, d, J=5.4Hz), 8.44(1H, d, J=1.2Hz), 7.50(1H, t, J=5.1Hz), 4.95(2H, td, J=12.6Hz, 0.9Hz), 2.20(3H, s)	141~143
46	CDCl <sub>3</sub>	8.75(1H, s), 8.62(1H, s), 8.46(1H, d, J=1.5Hz), 8.32(1H, d, J=1.5Hz), 7.67(1H, d, J=1.2Hz), 4.90(2H, t, J=12.9Hz), 3.11(3H, s), 1.82(3H, s)	—

10

20

30

40

50

【表 3 - 2】

化合物番号	重溶媒	1H NMR 300MHz, 8ppm	融点 /°C
47	CDCl <sub>3</sub>	8.61(1H, d, J=1.5Hz), 8.36(1H, d, 1.5Hz), 8.21(1H, s), 8.04(1H, d, J=5.1Hz), 7.86(1H, d, J=5.1Hz), 4.91(2H, rd, J=12.6Hz, 1.2Hz), 3.00(3H, d, J=5.1Hz)	58~60
48	CDCl <sub>3</sub>	9.63(1H, d, J=1.5Hz), 8.85(1H, d, J=1.5Hz), 8.79(3H, d, J=5.1Hz), 7.92(2H, dd, J=4.8Hz, 1.5Hz)	193~198
49	CDCl <sub>3</sub>	8.94(1H, d, J=1.5Hz), 8.49(1H, d, J=1.5Hz), 8.43(1H, s), 8.37(1H, d, J=4.8Hz), 7.87(1H, d, J=5.1Hz), 4.91(2H, rd, J=12.9Hz, 1.2Hz), 4.28(2H, q, J=6.9Hz), 1.51(3H, t, J=6.9Hz)	58~62
50	CDCl <sub>3</sub>	8.61(1H, s), 8.49(1H, d, J=5.1Hz), 8.45(1H, d, J=1.5Hz), 8.32(1H, d, J=1.5Hz), 7.49(1H, d, J=4.8Hz), 4.46(2H, q, J=7.2Hz), 2.50(3H, s), 1.46(3H, t, J=7.2Hz)	113~117
51	CDCl <sub>3</sub>	8.94(1H, d, J=1.5Hz), 8.45(1H, d, J=1.2Hz), 8.43(1H, s), 8.34(1H, d, J=5.1Hz), 7.86(1H, d, J=4.8Hz), 4.91(2H, rd, J=12.9Hz, 1.2Hz), 4.79(1H, sep, 6.0Hz), 1.43(3H, s), 1.41(3H, s)	—
52	CDCl <sub>3</sub>	8.92(1H, d, J=1.2Hz), 8.46(1H, d, J=1.2Hz), 8.43(1H, s), 8.37(1H, d, J=4.8Hz), 7.87(1H, d, J=4.8Hz), 4.91(2H, t, J=9.9Hz), 4.17(2H, t, J=6.3Hz), 1.91(2H, sext, J=7.2Hz), 1.68(3H, t, J=7.2Hz)	56~58
53	CDCl <sub>3</sub>	8.84(1H, d, J=1.5Hz), 8.46(1H, d, J=1.5Hz), 8.44(1H, s), 8.34(1H, d, J=4.8Hz), 7.48(1H, d, J=4.8Hz), 4.90(2H, rd, J=12.9Hz, 1.2Hz), 2.70(6H, s)	—
54	CDCl <sub>3</sub>	8.65(1H, s), 8.57-8.49(2H, m), 8.48(1H, dd, J=1.5Hz, 1.2Hz), 7.42(1H, d, J=4.8Hz), 4.91(2H, rd, J=12.6Hz, 0.9Hz), 2.51(3H, s)	—
55	CDCl <sub>3</sub>	8.78(1H, s), 8.57(1H, d, J=4.5Hz), 8.54(1H, d, J=1.5Hz), 8.47(1H, d, J=1.5Hz), 7.49(1H, d, J=5.1Hz), 4.92(2H, t, J=12.9Hz), 3.32(1H, sep, J=6.6Hz), 1.20(6H, d, J=6.9Hz)	—
56	CDCl <sub>3</sub>	8.71(1H, s), 8.58-8.50(1H, m), 8.51(1H, d, J=1.5Hz), 8.48(1H, d, J=1.5Hz), 7.44(1H, d, J=4.8Hz), 4.92(2H, rd, J=12.9Hz, 1.2Hz), 2.87(2H, t, J=7.2Hz), 1.59(2H, sext, J=7.2Hz), 0.95(3H, t, J=7.2Hz)	—
57	CDCl <sub>3</sub>	9.20(6H, d, J=1.2Hz), 9.11(5H, d, J=1.2Hz), 9.06(5H, d, J=1.2Hz), 9.01(5H, d, J=1.2Hz), 8.82(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 7.96(2H, d, J=6.0Hz), 4.60(1H, q, J=8.4Hz), 4.27(1H, q, J=8.7Hz), 3.33(1.5H, s), 3.30(1.5H, s)	87~89
58	CDCl <sub>3</sub>	8.81(1H, d, J=1.5Hz), 8.49(1H, d, J=5.1Hz), 8.47(1H, d, J=1.5Hz), 8.42(1H, s), 7.91(1H, d, J=5.1Hz), 4.92(2H, rd, J=12.9Hz, 1.2Hz), 4.56(2H, q, J=7.8Hz)	82~88
59	CDCl <sub>3</sub>	9.53(1H, d, J=1.5Hz), 8.95(1H, d, J=1.5Hz), 7.78(1H, s), 8.61(1H, s), 8.12(1H, s), 7.50(1H, d, J=1.5Hz), 4.18(2H, tdd, J=9.0Hz, 9.0Hz, 6.9Hz), 2.92(2H, rd, J=7.8Hz, 7.8Hz), 1.25(3H, t, J=7.8Hz)	—
60	CDCl <sub>3</sub>	9.21(6H, s), 9.13(6H, s), 9.11(5H, d, J=1.2Hz), 8.93(5H, d, J=1.2Hz), 8.91(5H, s), 8.77(1H, s), 8.59(1H, s), 7.50(1H, t, J=4.8Hz), 4.62(1H, q, J=8.7Hz), 4.27(1H, q, J=8.7Hz), 3.38(1.5H, s), 3.31(1.5H, s), 3.00-2.84(2H, m), 1.26(1.5H, t, J=7.5Hz), 1.23(1.5H, t, J=7.5Hz)	—
61	CDCl <sub>3</sub>	9.54(1H, d, J=1.5Hz), 8.69(1H, d, J=2.1Hz), 8.64(1H, dd, J=5.1Hz, 0.9Hz), 8.14(1H, s), 8.10(2H, dd, J=6.6Hz, 5.1Hz), 4.17(2H, dtd, J=17.7Hz, 9.9Hz, 6.6Hz)	88~90
62	CDCl <sub>3</sub>	9.50(1H, s), 9.25(1H, d, J=0.9Hz), 8.32(1H, s), 8.46(1H, d, J=4.8Hz), 8.14(1H, s), 7.91(1H, d, J=5.1Hz), 4.25-4.10(2H, m), 4.07(3H, s)	—
63	CDCl <sub>3</sub>	8.87(1H, d, J=0.9Hz), 8.55(1H, d, J=0.9Hz), 8.45(1H, s), 8.40(1H, d, J=4.8Hz), 7.87(1H, d, J=4.8Hz), 7.33-7.21(4H, m), 4.00(3H, s)	58~76
64	CDCl <sub>3</sub>	9.15(1H, d, J=5.1Hz), 8.68(1H, s), 8.62(1H, d, J=4.8Hz), 8.10(6H, t, J=6.6Hz), 8.08(5H, t, J=5.7Hz), 8.02(1H, s), 4.35(1H, q, J=7.2Hz), 4.27(1H, q, J=9.0Hz), 3.37(1.5H, s), 3.31(1.5H, s)	—
65	CDCl <sub>3</sub>	9.50(1H, d, J=1.2Hz), 9.20(1H, d, J=1.2Hz), 8.51(1H, s), 8.39(1H, d, J=5.1Hz), 8.11(1H, t, J=5.7Hz), 7.53(1H, d, J=4.8Hz), 4.17(2H, dq, J=9.0Hz, 6.6Hz), 2.72(6H, s)	153~159
66	CDCl <sub>3</sub>	9.23(5H, s), 9.19(5H, s), 9.15(5H, s), 9.12(5H, s), 8.49(1H, s), 8.38(1H, d, J=4.8Hz), 7.57-7.50(1H, m), 4.64(1H, q, J=8.1Hz), 4.27(1H, q, J=8.7Hz), 3.36(1.5H, s), 3.30(1.5H, s), 2.72(3H, s), 2.71(3H, s)	—
67	CDCl <sub>3</sub>	9.27(5H, s), 9.23(5H, s), 9.19(5H, s), 9.11(5H, s), 8.51(1H, s), 8.45(1H, d, J=5.1Hz), 7.93(5H, d, J=4.8Hz), 7.91(5H, d, J=4.5Hz), 4.63(1H, q, J=9.0Hz), 4.27(1H, q, J=9.0Hz), 4.07(3H, s), 3.63(1.5H, s), 3.30(1.5H, s)	—
68	CDCl <sub>3</sub>	9.45(1H, s), 9.35(1H, s), 9.03(1H, d, J=5.1Hz), 8.73(1H, s), 8.12(1H, m), 7.46(1H, d, J=4.8Hz), 4.18(2H, m), 3.49(2H, d, J=7.5Hz), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)	—
69	CDCl <sub>3</sub>	9.41(1H, d, J=0.9Hz), 9.35(1H, s), 9.03(1H, d, J=5.1Hz), 8.73(1H, d, J=0.9Hz), 8.10(1H, t, J=6.3Hz), 7.46(1H, d, J=4.8Hz), 4.23(2H, rd, J=14.7, 6.9Hz), 3.50(2H, q, J=7.5Hz), 1.33(3H, t, J=7.5Hz)	—
70	CDCl <sub>3</sub>	9.34(1H, s), 9.11(1H, d, J=3.3Hz), 9.02(1H, d, J=4.8Hz), 8.70(1H, d, J=1.9Hz), 7.46(1H, d, J=4.8Hz), 4.70(6H, t, J=15.3Hz), 4.32(1.22H, t, J=15.0Hz), 3.65-3.25(5H, m), 1.45-1.25(3H, m)	—
71	CDCl <sub>3</sub>	9.38(1H, s), 9.09(1H, s), 8.32(1H, broad), 8.19(1H, broad), 8.03(2H, broad), 7.56(1H, d, J=4.8Hz), 4.17(2H, m), 3.12(3H, d, J=4.8Hz)	221-227
72	CDCl <sub>3</sub>	9.38(1H, s), 9.08(1H, s), 8.32(1H, s), 8.20-8.06(2H, m), 7.54(1H, d, J=5.1Hz), 4.17(2H, m), 3.40(2H, m), 1.37(3H, t, J=7.2Hz)	210-213
73	CDCl <sub>3</sub>	9.49(1H, d, J=1.5Hz), 9.23(1H, d, J=0.9Hz), 8.51(1H, s), 8.41(1H, d, J=5.1Hz), 8.11(1H, m), 7.54(1H, d, J=4.8Hz), 4.17(2H, m), 2.96(2H, q, J=7.2Hz), 2.74(3H, s), 1.03(3H, t, J=7.2Hz)	166-113
74	CDCl <sub>3</sub>	9.46(1H, s), 8.72(1H, s), 8.37(1H, s), 8.17(1H, d, J=4.8Hz), 8.10(1H, t, J=6.6Hz), 7.30(1H, d, J=4.8Hz), 4.17(2H, m), 3.03(4H, m), 1.89(4H, m)	165-173
75	CDCl <sub>3</sub>	9.12(1H, d, J=2.4Hz), 8.71(1H, d, J=1.8Hz), 8.35(1H, s), 8.17(1H, d, J=4.8Hz), 7.31(1H, s), 4.63(1H, q, J=8.7Hz), 4.27(1H, q, J=8.7), 3.03(3H, d, J=1.9Hz), 3.15-2.85(4H, m), 2.60-1.80(4H, m)	—
76	CDCl <sub>3</sub>	9.50(1H, s), 9.40(1H, d, J=2.5, 1.2Hz), 8.60-8.47(2H, m), 8.10(1H, t, J=6.0Hz), 4.65(1H, d, J=4.8Hz), 4.17(2H, m), 3.73(4H, t, J=4.5Hz), 2.98(4H, t, J=4.5Hz)	148-153
77	CDCl <sub>3</sub>	9.88(1H, d, J=2.4Hz), 9.16(1H, d, J=2.5, 2Hz), 8.51(2H, m), 7.57(1H, d, J=3.8Hz), 4.65(1H, q, J=8.4Hz), 4.27(1H, q, J=8.7Hz), 3.80-3.60(4H, m), 3.39(3H, d, J=1.3, 5Hz), 3.05-2.90(4H, m)	—
78	CDCl <sub>3</sub>	9.51(1H, d, J=1.2Hz), 9.30(1H, d, J=1.2Hz), 8.53(1H, s), 8.51(1H, d, J=4.8Hz), 8.10(1H, m), 7.57(1H, d, J=4.8Hz), 4.18(2H, m), 3.26(4H, t, J=4.8Hz), 2.64(4H, t, J=4.8Hz)	163 - 168
79	CDCl <sub>3</sub>	9.42(1H, d, J=7.2Hz), 9.07(1H, d, J=2.1Hz), 8.57(1H, s), 8.48(1H, s), 7.61(1H, d, J=4.8Hz), 4.82(1H, q, J=9.0Hz), 4.44(1H, q, J=9.3Hz), 3.40-3.20(7H, m), 2.75-2.60(4H, m)	163 - 168
80	CDCl <sub>3</sub>	9.53(1H, d, J=0.6Hz), 9.20(1H, d, J=0.6Hz), 8.65(1H, s), 8.57(1H, d, J=4.8Hz), 8.09(1H, t, J=6.0Hz), 7.58(1H, d, J=4.8Hz), 4.18(2H, m), 3.82(2H, t, J=12.0Hz), 3.18-3.03(2H, m), 2.98-2.65(4H, m)	230-237
81	CDCl <sub>3</sub>	9.54(1H, d, J=1.2Hz), 9.12(1H, d, J=1.2Hz), 8.75-8.53(2H, m), 8.18-8.02(1H, m), 7.57(1H, d, J=4.8Hz), 4.19(2H, m), 3.62-3.48(4H, m), 3.15-3.00(4H, m)	—
82	CDCl <sub>3</sub>	9.30-9.05(2H, m), 8.60(2H, s), 7.57(1H, s), 4.67(1H, q, J=8.7Hz), 4.28(1H, q, J=8.7Hz), 3.55(4H, broad), 3.35(3H, d, J=18.6Hz), 3.05(4H, broad)	—
83	CDCl <sub>3</sub>	9.13(1H, s), 9.06(1H, s), 8.79(1H, s), 8.62(1H, d, J=4.8Hz), 7.50(1H, d, J=5.1Hz), 2.94(2H, q, J=7.2Hz), 1.26(3H, t, J=7.2Hz)	51-55
84	CDCl <sub>3</sub>	9.50(1H, s), 9.20(1H, s), 9.05(1H, s), 8.97(1H, d, J=5.1Hz), 7.74(1H, d, J=5.1Hz), 3.46(1H, m), 3.09(1H, m), 1.47(3H, t, 7.5Hz)	95-99
85	CDCl <sub>3</sub>	9.36(1H, s), 9.06(1H, s), 8.99(1H, s), 8.90(1H, s), 7.49(1H, d, J=4.8Hz), 3.51(2H, q, J=7.5Hz), 1.36(3H, t, 7.5Hz)	—
86	CDCl <sub>3</sub>	9.20(1H, s), 9.07(1H, s), 8.76(1H, s), 8.59(1H, s), 8.42(1H, s), 8.29(1H, d, J=9.9Hz), 7.77(1H, d, J=8.1Hz), 7.68(1H, t, J=7.5Hz), 7.53(1H, d, J=4.8Hz), 2.95(2H, q, J=7.5Hz), 1.27(3H, t, J=7.5Hz)	50-54
87	CDCl <sub>3</sub>	9.36(1H, s), 9.12(1H, s), 9.02(1H, d, J=5.1Hz), 8.86(1H, d, J=1.2Hz), 8.39(1H, s), 8.31(1H, d, J=7.8Hz), 7.79(1H, d, J=7.5Hz), 7.69(1H, t, J=7.8Hz), 7.51(1H, d, J=4.8Hz), 3.62(2H, q, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	—
88	CDCl <sub>3</sub>	9.24(1H, s), 9.10(1H, d, J=0.9Hz), 8.77(1H, s), 8.64-8.56(3H, m), 8.02(1H, s), 7.53(1H, d, J=4.8Hz), 2.96(2H, q, J=7.5Hz), 1.27(3H, t, J=7.5Hz)	85-90
89	CDCl <sub>3</sub>	9.48(1H, s), 9.23(2H, s), 8.94(1H, d, J=5.1Hz), 8.61(2H, s), 8.05(1H, s), 7.75(1H, d, J=5.1Hz), 3.50(1H, m), 3.11(1H, m), 1.49(3H, t, J=7.5Hz)	205-208
90	CDCl <sub>3</sub>	9.37(1H, s), 9.18(1H, d, J=1.2Hz), 9.04(1H, d, J=4.8Hz), 8.89(1H, d, J=1.5Hz), 8.59(2H, s), 8.03(1H, s), 7.51(1H, d, J=4.8Hz), 3.61(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	136-143
91	CDCl <sub>3</sub>	9.83(1H, d, J=0.9Hz), 9.63(1H, d, J=0.9Hz), 8.77(1H, s), 8.65(1H, d, J=5.1Hz), 8.60(1H, d, J=4.2Hz), 8.07(1H, t, J=7.8Hz), 7.78(1H, d, J=7.8Hz), 7.54(1H, d, J=5.1Hz), 2.93(2H, q, J=7.2Hz), 1.26(3H, t, 7.2Hz)	—
92	CDCl <sub>3</sub>	9.77(1H, d, J=0.9Hz), 9.37(1H, broad), 9.02(1H, broad), 8.82(1H, d, J=0.9Hz), 8.66(1H, d, J=8.1Hz), 8.08(1H, t, J=7.8Hz), 7.79(1H, d, J=7.8Hz), 7.51(1H, d, J=4.8Hz), 3.63(2H, q, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, 7.5Hz)	136-143

10

20

30

40

50

【 0 3 1 8 】

< 製剤例 >

また、本発明に係る式(1)で表される化合物を有効成分として含有する農薬製剤例を以下に挙げる。

製剤例1〔水和剤〕

化合物	30重量%
クレー	30重量%
ケイソウ土	35重量%
サンエキスP252	4重量%
(リグニンスルホン酸カルシウム：日本製紙(株)の商品名)	
ソルボール8070	1重量%

(ラウリル硫酸ナトリウム：東邦化学工業(株)の商品名)

上記成分を均一に混合し、粉碎して水和剤を得た。

【0319】

製剤例2〔粉剤〕

化合物	2重量%
クレー	90重量%
タルク	7重量%
ステアリン酸カルシウム	1重量%

上記成分を均一に混合して粉剤を得た。

【0320】

製剤例3〔乳剤〕

化合物	20重量%
N, N - ジメチルホルムアミド	20重量%
T - S O L 150	50重量%

(芳香族系溶剤：J X T G エネルギー株式会社の製品名)

ニューカルゲンCL - H 10重量%

(POEアルキルフェニルエーテル：竹本油脂(株)の製品名)上記成分を均一に混合し、溶解して乳剤を得た。

【0321】

製剤例4〔乳剤2〕

化合物	5重量%
キシレン	42.5重量%
D M S O	42.5重量%
ニューカルゲン2003	10重量%

(POEアリルフェニルエーテルホルムアルデヒド縮合物とアルキルベンゼンスルホン酸金属塩の混合物：竹本油脂(株)の製品名)

上記成分を均一に混合し、溶解して乳剤を得た。

製剤例5〔粒剤〕

化合物	5重量%
ベントナイト	40重量%
タルク	10重量%
クレー	43重量%
サンエキスP252	2重量%

(リグニンスルホン酸カルシウム：日本製紙(株)の商品名)

上記成分を均一に粉碎・混合し、水を加えてよく練合した後、造粒乾燥して粒剤を得た。

【0322】

製剤例6〔フロアブル剤〕

化合物	25重量%
ソルボール7556	5重量%
(POEスチリルフェニルエーテル硫酸塩：東邦化学工業(株)の製品名)	
プロピレングリコール	6重量%
ベントナイト	1重量%
キサンタンガム1%水溶液	3重量%
水	60重量%

キサンタンガム1%水溶液および適当量の水を除いた上記処方の全量を予備混合した後、湿式粉碎機にて粉碎した。その後、得られた粉碎物にキサンタンガム1%水溶液および残りの水を加え、100重量%のフロアブル剤を得た。

【0323】

製剤例7〔粒剤〕

化合物	5重量%
-----	------

10

20

30

40

50

ベントナイト	40重量%
タルク	10重量%
クレー	43重量%
サンエキスP252	2重量%

(リグニンスルホン酸カルシウム：日本製紙(株)の商品名)

上記成分を均一に粉碎・混合し、水を加えてよく練合した後、造粒乾燥して粒剤を得た。

#### 【0324】

<生物試験例>

以下の試験が、本発明の化合物の特定の有害生物に対する防除効力を実証する。「防除効力」は、摂食を著しく低減させる有害無脊椎生物の発育の阻害(死亡率を含む)を表す。化合物によって達成される有害生物の防除保護は、しかしながら、これらの種に限定されない。化合物番号は表2の化合物を指す。

#### 【0325】

生物試験例1：ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)防除試験(葉片散布処理)

キュウリ葉を直径3.5cmに切り、水で湿らせた脱脂綿の上に置いた。ここにワタアブラムシ成虫2頭を放虫し、24時間産仔させた後、成虫を除去した。このキュウリ葉に200ppmになるように希釈した供試化合物の希釈液2mLを、散布塔を用いて散布した。風乾後、脱脂綿とともにプラスチックカップに入れ、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に生死を観察し、死虫率(%)を算出した。

その結果、本発明化合物1、2、4、6、8、12、16、17、18、19、20、21、23、27、31、32、33、34、36、37、39、42、43、44、46、47、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、64、65、66、67、70、71、72、74、75、76、80、85、86、87、88、89、90、93、94は80%以上の死虫率を示した。

#### 【0326】

生物試験例2：ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)防除試験(根部浸漬処理)

キュウリ苗1本(子葉期)を、3.1ppmに希釈した薬液10mLを入れたバイアル瓶(内径2.7cm×6cm)に根部が浸るようウレタンにて固定した。浸漬1日後にワタアブラムシ1令幼虫5頭を放虫し、25℃の定温室にて飼育した。放虫5~7日後に虫の生死、異常を調査した。

その結果、本発明化合物1、2、4、20、43、45、47、50、53、54、57、59、60、61、62、65、66は80%以上の死虫率を示した。

#### 【0327】

生物試験例3：タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)防除試験(葉片散布処理)

ポット植えのキュウリにタバココナジラミ成虫を放虫し6時間産卵させる。その後成虫を取り除き、十分な光がある条件で保持する。孵化した幼虫が定着した後、幼虫を含むように葉を4cm角の正方形に切り取り、水で湿らせた脱脂綿の上に葉裏を上にして置く。このキュウリ葉に200ppmになるように希釈した供試化合物の希釈液2mLを散布塔を用いて散布した。風乾後、脱脂綿とともにプラスチックカップに入れ、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理7日後に生死を観察し、死虫率(%)を算出した。

その結果、本発明化合物1、2、4、8、19、31、43、66、70、71、72、75、89、90、92は80%以上の死虫率を示した。

#### 【0328】

生物試験例4：コナガ(*Plutella xylostella*)防除試験(葉片浸漬処理)

キャベツ葉を直径5.0cmに切り、このキャベツ葉片を200ppmになるように希釈した供試化合物の希釈液20mLに浸漬し、風乾した。風乾後、キャベツ葉片をプラスチックカップ内に入れ、10頭のコナガ3令幼虫を放虫し、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に幼虫の生死を観察し、死虫率(%)を算出した。

その結果、本発明化合物2、6、11、84、89、90、94は80%以上の死虫率を示した。

10

20

30

40

50

## 【0329】

生物試験例5：トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) 防除試験 (茎葉浸漬処理)  
イネ幼苗を10本取り、200ppmになるように希釈した供試化合物の薬液20mLに浸漬し、風乾した。風乾後、ガラス円筒 (内径4.5cm×14cm) 内にウレタンを用いて保持し、水40mLを入れたプラスチックカップに立てる。これにトビイロウンカ3令幼虫を放飼し、薬包紙にて蓋をし、25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に幼虫の生死を観察し、死虫率 (%) を算出した。

その結果、本発明化合物1、2、4、6、10、11、14、15、16、17、18、20、21、30、31、33、34、37、40、42、43、46、49、51、52、53、54、55、56、57、59、60、61、62、63、64、65、66、70、72、75、76、79、85、86、87、88、89、90、93、94は80%以上の死虫率を示した。

10

## 【0330】

生物試験例6：トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) 防除試験 (根部浸漬処理)  
イネ幼苗を10本取り、ガラス円筒 (内径4.5cm×14cm) 内にウレタンを用いて保持し、50ppmに希釈した薬液40mLを入れたプラスチックカップ (90mL入り、円筒が立つよう中央に穴をあけた蓋をしてある) に立てた。2日後にトビイロウンカ3令幼虫10頭を放虫し、薬包紙にて蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理5~7日後に虫の生死、異常を調査した。

その結果、本発明化合物1、4、20、31、42、43、57、60、62は80%以上の死虫率を示した。

20

## 【0331】

生物試験例7：ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) 防除試験 (茎葉浸漬処理)  
イネ幼苗を10本取り、200ppmになるように希釈した供試化合物の薬液20mLに浸漬し、風乾した。風乾後、ガラス円筒 (内径4.5cm×14cm) 内にウレタンを用いて保持し、水40mLを入れたプラスチックカップに立てる。これにツマグロヨコバイ3令幼虫を放飼し、薬包紙にて蓋をし、25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に幼虫の生死を観察し、死虫率 (%) を算出した。

その結果、本発明化合物1、6、12、13、18、27は80%以上の死虫率を示した。

30

## 【0332】

生物試験例8：ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*) 防除試験 (葉片散布処理)  
キュウリ葉を2cm角に切り、水で湿らせた脱脂綿の上に置いた。このキュウリ葉に200ppmになるように希釈した供試化合物の希釈液2mLを、散布塔を用いて散布した。風乾後、10頭のミカンコナカイガラムシ1令幼虫を放虫した。その後、脱脂綿とともにプラスチックカップに入れ、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理10日後に生死を観察し、死虫率 (%) を算出した。

その結果、本発明化合物1、2、6は80%以上の死虫率を示した。

## 【0333】

生物試験例9：ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) 防除試験 (葉片浸漬処理)  
プラスチック容器 (径6cm×3cm) 内に水で十分湿らせた脱脂綿を入れ、その上にろ紙を敷く。ろ紙の上に2cm角のインゲン葉片を置き、ナミハダニ成虫5頭を放虫し、24時間産卵させる。翌日、成虫を除いたインゲン葉片を200ppmになるように希釈した供試化合物の希釈液20mLに10秒間浸漬する。風乾後、インゲン葉片をプラスチックカップ内に戻し、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理7日後に幼虫の生死を観察し、未孵化卵数を調査し、死虫率 (%) を算出した。

その結果、本発明化合物10、11、15、23、24、22、25、31、32、34、35、58、93は80%以上の死虫率を示した。

40

## 【0334】

生物試験例10：サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 防除試験

50

## (液浸試験)

サツマイモの根部に着生した卵のうちから、ベルマン法にてサツマイモネコブセンチュウ 2 期幼虫の懸濁液を得た。このセンチュウ含有液を 48 穴プレートに 1 穴あたり 100  $\mu$ L (センチュウ約 50 頭) ずつ分注した。その後、センチュウ含有液と同量の供試薬液を加え、26 恒温条件で 3 日間静置し、センチュウの生死を実体顕微鏡下で調査し、センチュウの生死を実体顕微鏡下で調査し、補正死虫率を算出した。

補正死虫率 (%) =

$$\{ (\text{処理区死虫率} - \text{無処理区死虫率}) / (100 - \text{無処理区死虫率}) \} \times 100$$

その結果、本発明化合物 3、22 は 80 % 以上の補正死虫率を示した。

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

(51)国際特許分類		F I		
A 6 1 K	31/541 (2006.01)	A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	31/36 (2006.01)	A 6 1 K	31/36	
A 6 1 K	31/343 (2006.01)	A 6 1 K	31/343	
A 6 1 K	31/27 (2006.01)	A 6 1 K	31/27	
A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 P	7/02	
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04	
A 0 1 N	43/84 (2006.01)	A 0 1 N	43/84	1 0 1
A 0 1 N	47/02 (2006.01)	A 0 1 N	43/84	1 0 2
		A 0 1 N	47/02	

- (72)発明者 三宅 孝明  
茨城県神栖市砂山 6 番地 日本化薬株式会社 アグロ研究所内
- (72)発明者 浅野 周  
茨城県神栖市砂山 6 番地 日本化薬株式会社 アグロ研究所内
- (72)発明者 角 拓人  
茨城県神栖市砂山 6 番地 日本化薬株式会社 アグロ研究所内