

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2013年12月19日(19.12.2013)



(10) 国際公開番号
WO 2013/187423 A1

(51) 国際特許分類:

A01N 43/52 (2006.01)	A01N 43/56 (2006.01)
A01N 37/18 (2006.01)	A01N 43/653 (2006.01)
A01N 37/24 (2006.01)	A01N 43/76 (2006.01)
A01N 37/46 (2006.01)	A01N 43/78 (2006.01)
A01N 37/50 (2006.01)	A01N 43/80 (2006.01)
A01N 43/12 (2006.01)	A01N 43/88 (2006.01)
A01N 43/16 (2006.01)	A01N 43/90 (2006.01)
A01N 43/32 (2006.01)	A01N 47/02 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)	A01N 47/04 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)	A01N 47/24 (2006.01)
A01N 43/42 (2006.01)	A01N 57/14 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)	A01P 7/04 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2013/066128

(22) 国際出願日: 2013年6月5日(05.06.2013)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2012-135538 2012年6月15日(15.06.2012) JP

(71) 出願人: 住友化学株式会社(SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁目2番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 鈴木 竜也(SUZUKI, Tatsuya); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号住友化学株式会社内 Hyogo (JP). 岩田 淳(IWATA, Atsushi); 〒1048260 東京都中央区新川二丁目2番1号住

友化学株式会社内 Tokyo (JP). 野倉 吉彦(NOKURA, Yoshihiko); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号住友化学株式会社内 Hyogo (JP).

(74) 代理人: 中山 亨, 外(NAKAYAMA, Tohru et al.); 〒5418550 大阪府大阪市中央区北浜四丁目5番3号住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).

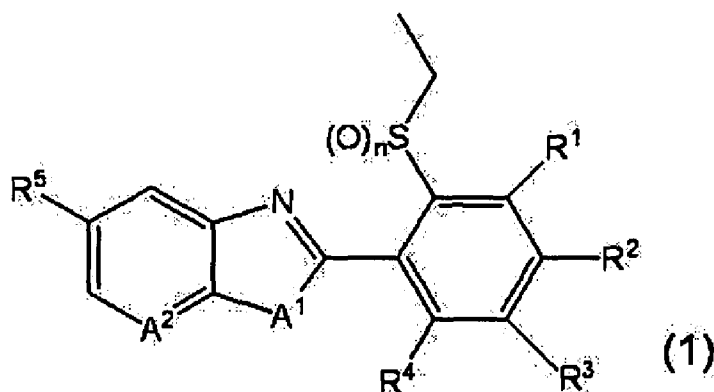
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

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

[続葉有]

(54) Title: PEST CONTROL COMPOSITION FOR HARMFUL ARTHROPODS, AND PEST CONTROL METHOD FOR HARMFUL ARTHROPODS

(54) 発明の名称: 有害節足動物防除組成物及び有害節足動物の防除方法



(57) Abstract: A pest control composition for harmful arthropods containing: a compound represented by formula (1) [in the formula, each symbol indicates the definition provided in the description]; and at least one type of fungicide selected from azoles, strobilurins, phenylamides, compounds for the control of rice blast disease, compounds for the control of rice sheath blight, and other fungicidal compounds. The pest control composition exhibits a superior pest control effect against harmful arthropods.

(57) 要約: 式(1) [式中、各記号は明細書中に記載の定義を表す。] で示される化合物と、アゾール、ストロビルリン、フェニルアミド、イネいもち病防除化合物、イネ紋枯病防除化合物およびその他の殺菌化合物より選ばれる1種以上の殺菌化合物とを含有する有害節足動物防除組成物。有害節足動物に対して優れた防除効力を有する。

WO 2013/187423 A1

添付公開書類:

- 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

明 細 書

[発明の名称]

有害節足動物防除組成物及び有害節足動物の防除方法

5 [技術分野]

[0001]

本発明は、有害節足動物防除組成物及び有害節足動物の防除方法に関する。

[背景技術]

[0002]

10 従来、有害節足動物防除組成物の有効成分として、多くの化合物が知られている(例えば、非特許文献1参照。)

[先行技術文献]

[非特許文献]

[0003]

15 [非特許文献1]The Pesticide Manual - 15th edition (BCPC刊) ISBN 978-1-901396-18-8

[発明の概要]

[発明が解決しようとする課題]

[0004]

20 本発明は、有害節足動物に対する優れた防除効力を有する有害節足動物防除組成物を提供することを課題とする。

[課題を解決するための手段]

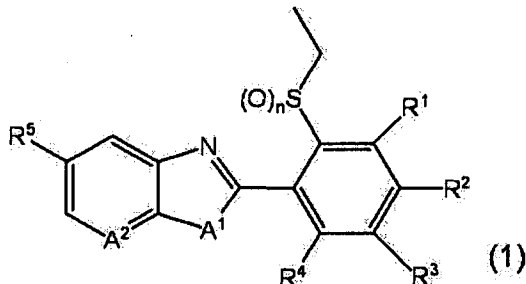
[0005]

25 本発明者等は、有害節足動物に対する優れた防除効力を有する有害節足動物防除組成物を見出すべく検討した結果、下記式(1)で示される化合物と、下記群(A)から選ばれる1種以上の殺菌化合物とを含有する組成物が、有害節足動物に対する優れた防除効力を有することを見出した。

[0006]

本発明は、以下の通りである。

30 [1] 式(1)



[式中、

A1は-NR6-、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A2 は窒素原子又は=CH-を表し、

R1、R2、R3及びR4は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、-OR7、-S(O)_mR7、ハロゲン原子、又は水素原子を表し（但し、R1、R2、R3及びR4のうち、少なくとも2つは水素原子を表す。）、

R5は、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、-OR7、-S(O)_mR7、又はハロゲン原子を表し、

R6は群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基又は水素原子を表し、

R7は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基又は水素原子を表し、

mは0、1又は2を表し、nは0、1又は2を表す。ここで、-S(O)_mR7において、mが1又は2の場合には、R7が水素原子を表すことはない。

群X：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルキニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルホニル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群Z：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基及びハロゲン原子からなる群。

群W：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルキニルオキシ基、ハロゲン原子及びヒドロキシ基からなる群。]

で示される化合物と、群(A)より選ばれる1種以上の殺菌化合物とを含有する有害節足動物防除組成物。

群(A)

A-1：アゾール

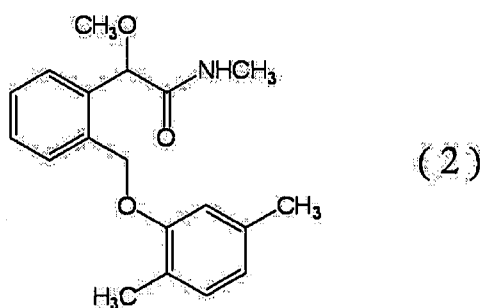
テブコナゾール、メトコナゾール、ジフェノコナゾール、トリチコナゾール、イマザリル、トリアジメノール、フルキンコナゾール、プロクロラズ、プロチオコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾールM、シプロコナゾール、テトラコナゾール、イプロコナゾール、トリホリン、ピリフェノックス、フェナリモール、ヌアリモール、オキシポコナゾールフマル酸塩、ペフラゾエート、トリフルミゾール、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、

エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、マイクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、シメコナゾール及びトリアジメホン

A-2：ストロビルリン

- 5 クレソキシムメチル、アゾキシストロビン、ピラクロストロビン、ピコキシストロビン、エネストロビン、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、フルオキサストロビン、オリサストロビン、ファモキサドン、フェナミドン、メトミノストロビン及び下記式（2）で示される化合物

式（2）



10

A-3：フェニルアミド

メタラキシル、メタラキシル-M、フララキシル-M、ベナラキシル、ベナラキシル-M、オフレース及びオキサジキシル

- 15 A-4：イネいもち病防除化合物

プロベナゾール、チアジニル、トリシクラゾール、ピロキロン、カスガマイシン塩酸塩、フェリムゾン、イソチアニル、フサライド及びテブフロキン

A-5：イネ紋枯病防除化合物

ペンシクロン、フラメトピル及びバリダマイシン

- 20 A-6：カルボキサミド

カルボキシシ、フルトラニル、ペンチオピラド、フルオピラム、ペンフルフェン、セダキサン及びフルキサピロキサド

A-7：その他

フルジオキシニル、エタボキサム、トルクロホスメチル及びキャプタン

- 25 [0007]

[2] 式（1）で示される化合物と群（A）より選ばれる1種以上の殺菌化合物との含有量の比が、重量比で10000：1～1：100である[1]に記載の有害節足動物防除組成物。

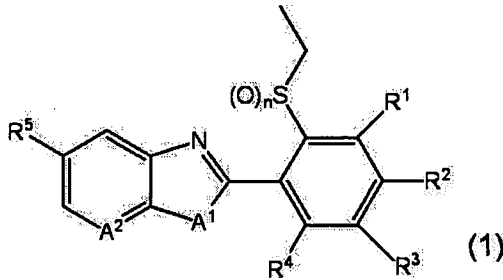
- 30 [3] 式（1）で示される化合物と群（A）より選ばれる1種以上の殺菌化合物との含有量の比が、重量比で1000：1～1：10である[1]に記載の有害節足動物防除組成物。

[4] [1]～[3]のいずれかに記載の有害節足動物防除組成物の有効量を、植物又は植物を栽培する土壤に施用する工程を有する有害節足動物の防除方法。

[発明を実施するための形態]

[0008]

本発明の有害節足動物防除組成物は、式(1)



5 [式中、

A1 は-NR6-、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A2 は窒素原子又は=CH-を表し、

10 R1、R2、R3及びR4は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、-OR7、-S(O)mR7、ハロゲン原子、又は水素原子を表し(但し、R1、R2、R3及びR4のうち、少なくとも2つは水素原子を表す。)、

R5は、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、-OR7、-S(O)mR7、又はハロゲン原子を表し、

15 R6は群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基又は水素原子を表し、

R7は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基又は水素原子を表し、

20 mは0、1又は2を表し、nは0、1又は2を表す。

ここで、-S(O)mR7において、mが1又は2の場合には、R7が水素原子を表すことはない。

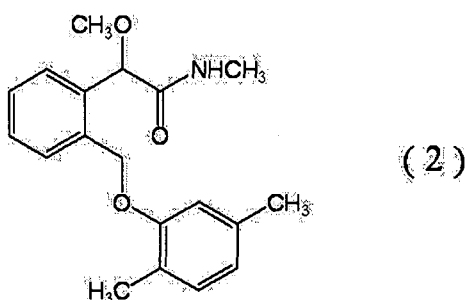
25 群X：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルキニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルホニル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

30 群Z：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基及びハロゲン原子からなる群。

群W：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハ

ロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 3アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2 - C 3アルキニルオキシ基、ハロゲン原子及びヒドロキシ基からなる群。]で示される化合物(以下、本縮合複素環化合物と記す。)と、

- (A-1) テブコナゾール、メトコナゾール、ジフェノコナゾール、トリチコナゾール、イマザリル、トリアジメノール、フルキンコナゾール、プロクロラズ、プロチオコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾールM、シプロコナゾール、テトラコナゾール、イブコナゾール、トリホリン、ピリフェノックス、フェナリモル、ヌアリモール、オキシポコナゾールフマル酸塩、ペフラゾエート、トリフルミゾール、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、ミクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、シメコナゾール及びトリアジメホンなどのアゾール；(A-2) クレソキシムメチル、アゾキシストロビン、ピラクロストロビン、ピコキシストロビン、エネストロビン、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、フルオキサストロビン、オリサストロビン、ファモキサドン、フェナミドン、メトミノストロビン及び下記式(2)で示される化合物式(2)



- などのストロビルリン；(A-3) メタラキシル、メタラキシル-M、フララキシル-M、ベナラキシル、ベナラキシル-M、オフレース及びオキサジキシルなどのフェニルアミド；(A-4) プロベナゾール、チアジニル、トリシクラゾール、ピロキロン、カスガマイシン塩酸塩、フェリムゾン、イソチアニル、フサライド及びテブフロキンなどのイネいもち病防除化合物；(A-5) ペンシクロン、フラメトピル及びバリダマイシンなどのイネ紋枯病防除化合物；(A-6) カルボキシニル、フルトラニル、ペンチオピラド、フルオピラム、ペンフルフェン、セダキサニル及びフルキサピロキサドなどのカルボキサミド；並びに、(A-7) フルジオキシニル、エタボキサム、トルクロホスメチル及びキャプタン等の化合物、からなる群(以下、群(A)と記す場合もある。)より選ばれる1種以上の殺菌化合物(以下、本殺菌化合物と記す。)とを含有する。

[0009]

本明細書の記載において用いられる置換基について、例を挙げて以下に説明する。

- 30 [0010]

本明細書において「C 1 - C 3鎖式炭化水素基」の表記は、炭素原子数が1~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の飽和又は不飽和炭化水素基を表し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基等のC 1 - C 3アルキル基；ビニル基、1-プロペニル基、2-

プロペニル基、1-メチルビニル基等のC₂-C₃アルケニル基；エチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基等のC₂-C₃アルキニル基が挙げられる。「C₁-C₂鎖式炭化水素基」の表記は、メチル基、エチル基、ビニル基、エチニル基を表す。

[0011]

- 5 本明細書において「C₁-C₃アルキル基」の表記は、炭素原子数が1~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基を表し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基が挙げられる。「C₁-C₂アルキル基」の表記は、メチル基又はエチル基を表す。

[0012]

- 10 本明細書において「C₂-C₃アルケニル基」の表記は、炭素原子数が2~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基が挙げられる。

[0013]

- 15 本明細書において「C₂-C₃アルキニル基」の表記は、炭素原子数が2~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル基、プロパルギル基が挙げられる。

[0014]

- 20 本明細書において「C₁-C₃アルコキシ基」の表記は、炭素原子数が1~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-O-で示される基を表し、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基が挙げられる。

[0015]

- 25 本明細書において「C₂-C₃アルケニルオキシ基」の表記は、炭素原子数が2~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有するアルケニル-O-で示される基を表し、例えばビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、2-プロペニルオキシ基、1-メチルビニルオキシ基が挙げられる。

[0016]

- 30 本明細書において「C₂-C₃アルキニルオキシ基」の表記は、炭素原子数が2~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有するアルキニル-O-で示される基を表し、例えばエチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基が挙げられる。

[0017]

- 35 本明細書において「C₁-C₃アルキルスルファニル基」の表記は、炭素原子数が1~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S-で示される基を表し、例えばメチルスルファニル基、エチルスルファニル基、プロピルスルファニル基、イソプロピルスルファニル基が挙げられる。

[0018]

本明細書において「C₁-C₃アルキルスルフィニル基」の表記は、炭素原子数が1~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(O)-で示される基を表し、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィ

ニル基が挙げられる。

[0019]

本明細書において「C1-C3アルキルスルホニル基」の表記は、炭素原子数が1~3個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(O)2-で示される基を表し、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基が

[0020]

本明細書において「C3-C6脂環式炭化水素基」としては、炭素原子数が3~6個よりなる環状の非芳香族炭化水素基を表し、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等のC3-C6シクロアルキル基；シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基等のC3-C6シクロアルケニル基が挙げられる。

[0021]

本明細書において「C3-C6シクロアルキル基」の表記は、炭素原子数が3~6個よりなる環状のアルキル基を表し、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

[0022]

本明細書において「群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい」の表記は、群Xより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Xより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

[0023]

本明細書において「群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい」の表記は、群Zより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Zより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

[0024]

本明細書において「群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい」の表記は、群Wより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Wより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

[0025]

本明細書において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよい」の表記は、2個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

[0026]

本明細書において「6員複素環基」の表記は、環構造において、炭素原子以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる1個以上の原子を含む6員複素環化合物残基を表し、例えば、6員芳香族複素環基、6員非芳香族複素環基が挙げられる。

「6員芳香族複素環基」としては、例えばピラジニル基、ピリミジニル基、ピリジニル基、ピリダジニル基が挙げられる。

「6員非芳香族複素環基」としては、例えばピペリジニル基、モルフォリニル基、ピペラジ

ニル基、チオモルフォリニル基が挙げられる。

[0027]

本明細書において「ハロゲン原子」としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を意味する。

5 [0028]

本縮合複素環化合物において「群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピルオキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-プロピルオキシエチル基、2-イソプロピルオキシエチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロ-1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロパン-2-イル基(-C(C1)(CF3)2)、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、メチルスルファニルエチル基、エチルスルファニルエチル基、メチルスルフィニルエチル基、メチルスルホニルエチル基、メトキシカルボニルメチル基、シアノメチル基等の群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3アルキル基；ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、1, 1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等の群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C3アルケニル基；エチニル基、プロパルギル基等の群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C3アルキニル基が挙げられる。

[0029]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基等の1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基；ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、1, 1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等の1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルケニル基；エチニル基及びプロパルギル基の1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルキニル基が挙げられる。

[0030]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

[0031]

本縮合複素環化合物において「群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していても

よいフェニル基」としては、例えばフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,5-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、3-トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、4-トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-メチルスルフィニルフェニル基及び4-メチルスルホニルフェニル基が挙げられる。

15 [0032]

本縮合複素環化合物において「群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基」としては、例えばピペリジル基、モルフォリル基及びチオモルフォリル基等の群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員非芳香族複素環基；

20 ピラジニル基、2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、2-ピリジニル基、3-ピリジニル基、4-ピリジニル基、3-フルオロ-2-ピリジニル基、4-フルオロ-2-ピリジニル基、5-フルオロ-2-ピリジニル基、6-フルオロ-2-ピリジニル基、2-ピリミジニル基、4-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基等の群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員芳香族複素環基が挙げられる。

30 [0033]

本縮合複素環化合物において「群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピルオキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、プロピルオキシエチル基、イソプロピルオキシエチル基、メチルスルファニルエチル基、エチルスルファニルエチル基、メチルスルフィニルエチル基、及びメチルスルホニルエチル基等の群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3アルキル基；ピニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1,1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等の群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C3アルケニル基；エチニル基及びプロパルギル基等の群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C3アルキニル基が挙げられる。

[0034]

本縮合複素環化合物において「群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基」としては、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、シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基が挙げられる。

[0035]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルファニル基」としては、例えばメチルスルファニル基、エチルスルファニル基、プロピルスルファニル基、イソプロピルスルファニル基、トリフルオロメチルスルファニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル基及びペンタフルオロエチルスルファニル基が挙げられる。

[0036]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3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、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル基及びペンタフルオロエチルスルフィニル基が挙げられる。

[0037]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3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、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル基及びペンタフルオロエチルスルホニル基が挙げられる。

[0038]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基」としては、例えばメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、エトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、プロピルオキシ基及びイソプロピルオキシ基が挙げられる。

[0039]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルケニルオキシ基」としては、例えば2-プロペニルオキシ基、2-メチル-2-プロペニルオキシ基、3, 3-ジフルオロアリルオキシ基及び3, 3-ジクロロアリルオキシ基が挙げられる。

[0040]

本縮合複素環化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルキニルオキシ基」としては、例えばプロパルギルオキシ基が挙げられる。

[0041]

本縮合複素環化合物において「1個以上の」とは、特に断りのない限り、1個以上でありかつ原子もしくは基が結合し得る最大の個数以下を意味する。

[0042]

本縮合複素環化合物としては、例えば、以下の化合物が挙げられる。

式(1)において、A1が-NR6-、酸素原子又は硫黄原子であり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基を1個有しているC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-、酸素原子又は硫黄原子であり、A2がNであり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基を1個有しているC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、A2がNであり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-、酸素原子又は硫黄原子であり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基を1個有しているC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基であり、R6がメチル基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基であり、R6がメチル基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-、酸素原子又は硫黄原子であり、A2がNであり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基を1個有しているC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基であり、R6がメチル基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、A2がNであり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基であり、R6がメチル基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-であり、A2がNであり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C2鎖式炭化水素基であり、R6がメチル基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、R5が-S(O)mR7であり、R7がハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、A2がNであり、R5が-S(O)mR7であり、R7が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、R5が-S(O)mR7であり、R6がメチル基であり、R7が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-又は硫黄原子であり、A2がNであり、R5が-S(O)mR7であり、R6がメチル基であり、R7が1個以上のハロゲン原子を有していて

もよいC1-C3鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、A1が硫黄原子であり、A2がNであり、R5が-S(O)mR7であり、R6がメチル基であり、R7が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C2鎖式炭化水素基である化合物；

- 5 式(1)において、R2、R3及びR4が同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、-OR7、ハロゲン原子又は水素原子であり、R5が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、-OR7、又はハロゲン原子である化合物；

- 10 式(1)において、R2、R3及びR4が同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子もしくは1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C2アルキル基を有していてもよい6員複素環基又は水素原子であり、R5が1個以上のハロゲン原子もしくは1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C2アルキル基を有していてもよい6員複素環基である化合物；

- 15 式(1)において、R2、R3及びR4が同一又は相異なり、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基又は水素原子であり、R5がメチル基、エチル基、トリフルオロメチル基又はトリフルオロメトキシ基である化合物；

式(1)において、R2、R3及びR4が同一又は相異なり、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子であり、R5がフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

- 20 式(1)において、R2、R3及びR4が同一又は相異なり、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基、ペンタフルオロエチル基又は水素原子であり、R5がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基又はペンタフルオロエチル基である化合物；

式(1)において、A1が-NR6-である化合物；

- 25 式(1)において、A1が酸素原子である化合物；

式(1)において、A1が硫黄原子である化合物；

式(1)において、A2が窒素原子である化合物；

式(1)において、A2が=CH-である化合物；

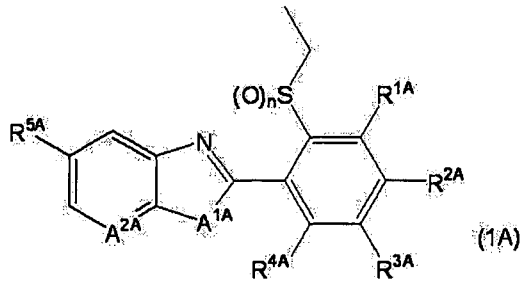
- 30 式(1)において、R1、R3及びR4が同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、R2が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有するC1-C3アルキル基を有していてもよい6員芳香族複素環基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

- 35 式(1)において、R1、R3及びR4が同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子であり、R2が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有するC1-C3アルキル基を有していてもよい6員芳香族複素環基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

[0043]

式(1A)



5 [式中、

A^{1A}は-NR_{6A}-、酸素原子又は硫黄原子を表し、A^{2A}は窒素原子又は=CH-を表し、R^{1A}、R^{3A}及びR^{4A}は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し（但し、R^{1A}、R^{3A}及びR^{4A}のうち、少なくとも2つは水素原子を表す）、

10 R^{2A}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁-C₃アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁-C₃アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有するC₁-C₃アルキル基を有していてもよい6員芳香族複素環基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

15 R^{5A}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁-C₃アルキル基、又は-S(O)_mR_{7A}を表し、

R_{6A}はC₁-C₃アルキル基又はC₃-C₆シクロアルキル基を表し、R_{7A}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC₁-C₃アルキル基を表し、

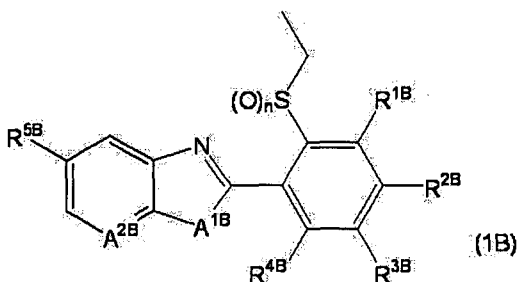
mは0、1又は2を表し、nは0、1又は2を表す。]

で示される化合物；

20 式(1A)において、A^{1A}が-NR_{6A}-である化合物；式(1A)において、A^{1A}が酸素原子である化合物；式(1A)において、A^{1A}が硫黄原子である化合物；式(1A)において、A^{2A}が窒素原子である化合物；式(1A)において、A^{2A}が=CH-である化合物；

25 [0044]

式(1B)



[式中、

A 1 Bは-NR 6 B-、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A 2 Bは窒素原子又は=CH-を表し、

R 1 B、R 3 B及びR 4 Bは同一又は相異なり、フッ素原子、塩素原子又は水素原子を表し
(但し、R 1 B、R 3 B及びR 4 Bのうち、少なくとも2つは水素原子を表す)、

- 5 R 2 BはC 1 - C 3アルキル基 (特に、メチル基、エチル基又はイソプロピル基)、1個以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 3アルキル基 (特に、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基等)、1個以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 3アルコキシ基 (特に、トリフルオロメトキシ基等)、含窒素6員芳香族複素環基 (特に、2-、3-又は4-ピリジル基、2-ピリミジニル基等)、ハロゲン原子 (特に、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等) 又は水素原子を表し、

R 5 Bは1個以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 3アルキル基 (特に、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロ-1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロパン-2-イル基 (-C (C 1) (CF 3) 2)、ヘプタフルオロイソプロピル基等)、又は-S (O) mR 7 Bを表し、

- 15 R 6 BはC 1 - C 3アルキル基 (メチル基、エチル基、プロピル基又はイソプロピル基、特にメチル基) を表し、

R 7 Bは1個以上のハロゲン原子を有するC 1 - C 3アルキル基 (トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等、特にトリフルオロメチル基) を表し、

mは0、1又は2を表し、nは0、1又は2を表す。]

- 20 で示される化合物；

式 (1 B) において、A 1 Bが-NR 6 B-である化合物；

式 (1 B) において、A 1 Bが酸素原子である化合物；

式 (1 B) において、A 1 Bが硫黄原子である化合物；

式 (1 B) において、A 2 Bが窒素原子である化合物；

- 25 式 (1 B) において、A 2 Bが=CH-である化合物。

上記一般式 (1 A) 及び (1 B) で示される化合物は、一般式 (1) で示される化合物に包含される。

[0 0 4 5]

次に、本縮合複素環化合物の製造法について説明する。

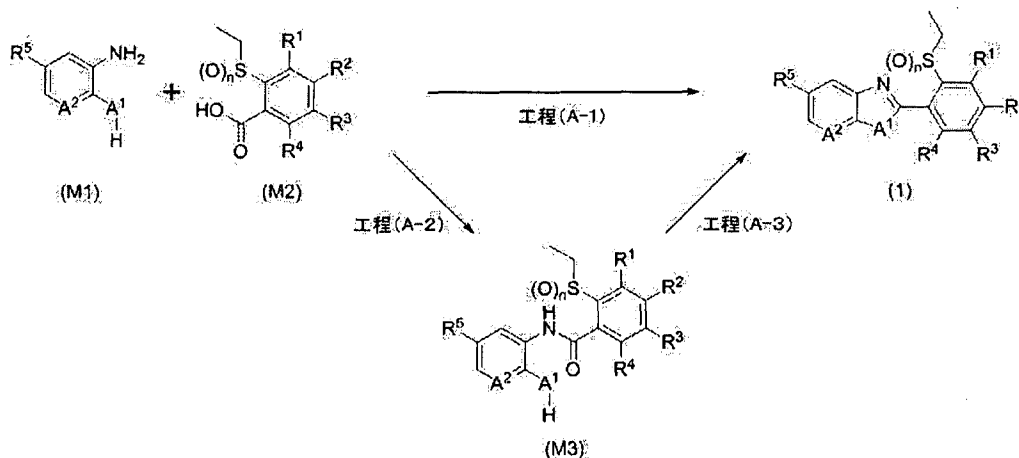
- 30 [0 0 4 6]

本縮合複素環化合物は、例えば、以下の (製造法A) ~ (製造法F) により製造することができる。

[0 0 4 7]

(製造法A)

- 35 本縮合複素環化合物 (1) は、化合物 (M 1) と化合物 (M 2) とを反応させることにより製造できる。または化合物 (M 1) と化合物 (M 2) とを反応させることにより化合物 (M 3) を製造し、化合物 (M 3) を環化させることにより製造できる。

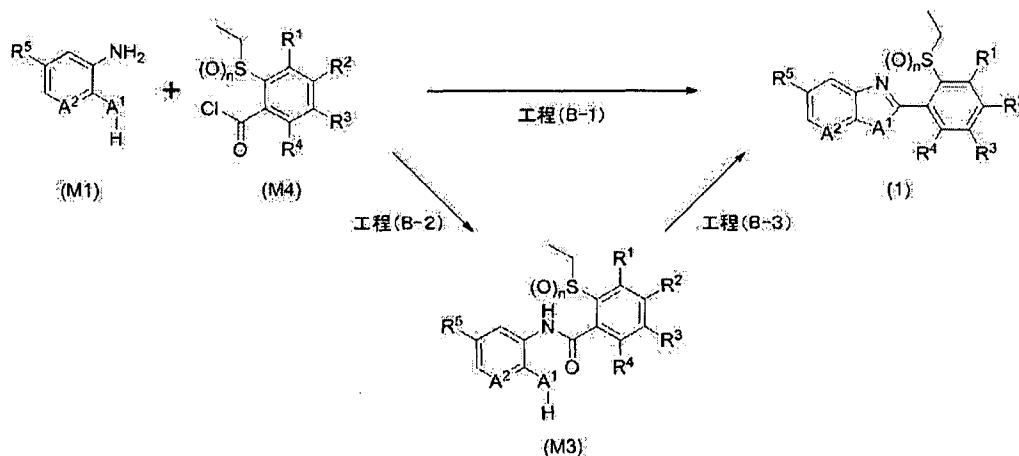


[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A¹、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

[0048]

5 (製造法B)

本縮合複素環化合物(1)は、化合物(M1)と化合物(M4)とを反応させることにより製造できる。または化合物(M1)と化合物(M4)とを反応させることにより化合物(M3)を製造し、化合物(M3)を環化させることにより製造できる。



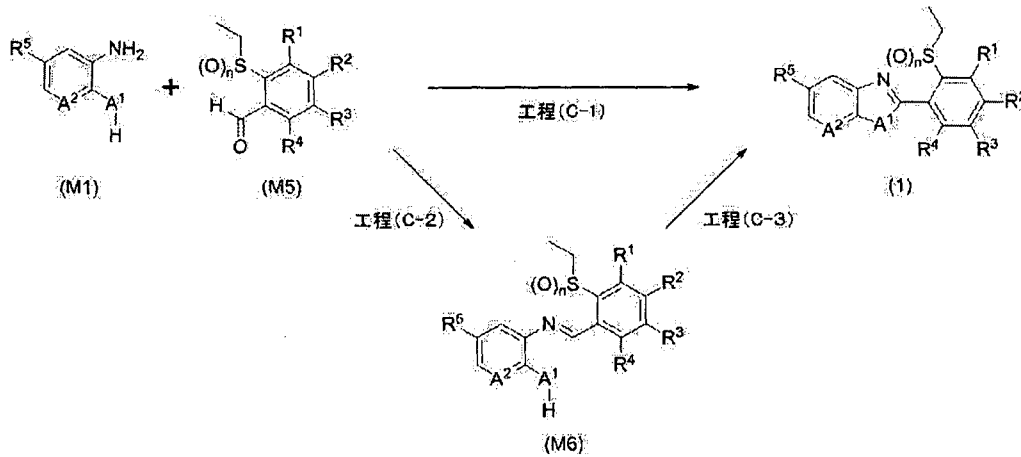
10

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A¹、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

[0049]

(製造法C)

15 本縮合複素環化合物(1)は、化合物(M1)と化合物(M5)とを反応させることにより製造できる。または化合物(M1)と化合物(M5)とを反応させることにより化合物(M6)を製造し、化合物(M6)を環化させることにより製造できる。

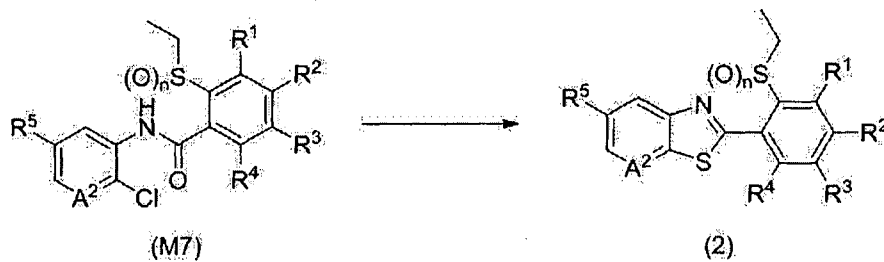


[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A¹、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

[0050]

5 (製造法D)

式(1)においてA¹が硫黄原子である化合物(2)は、化合物(M7)と硫化剤とを反応させることにより製造することができる。

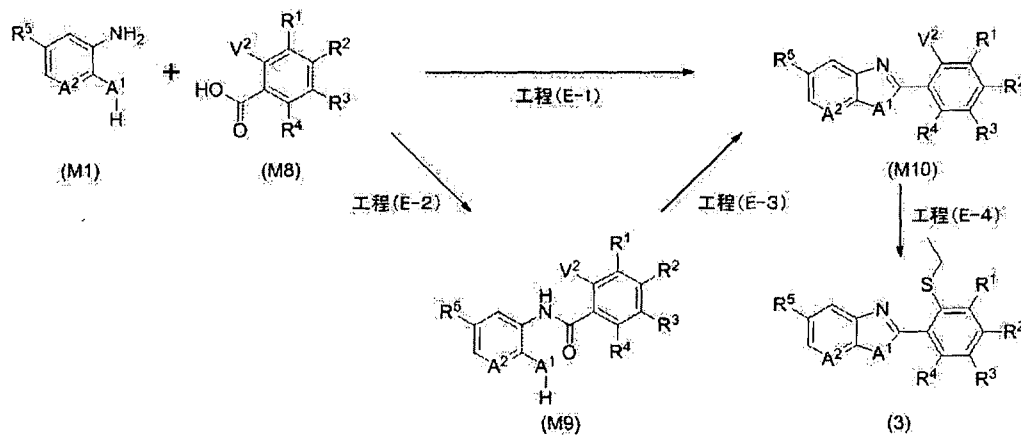


10 [式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

[0051]

(製造法E)

式(1)においてnが0である化合物(3)は、例えば以下の方法により製造することができる。



15

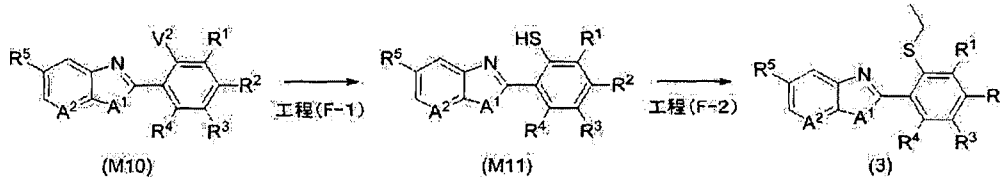
[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A¹及びA²は前記と同じ意味を表し、V²はフ

ッ素原子又は塩素原子を表す。]

[0052]

(製造法F)

式(1)においてnが0である化合物(3)は、例えば以下の方法により製造することができる。



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A¹、A²及びV²は前記と同じ意味を表す。]

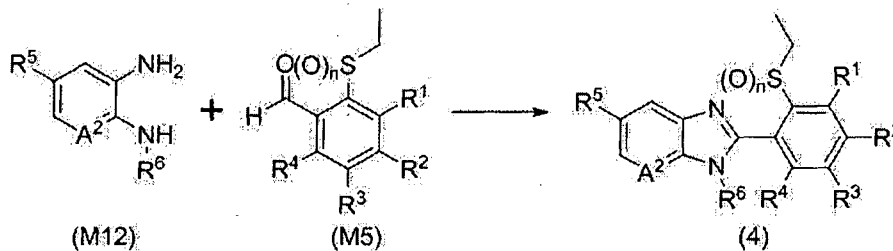
[0053]

10 本縮合複素環化合物の製造法(製造法A)～(製造法F)について、以下さらに詳しく説明する。また本縮合複素環化合物から別の本縮合複素環化合物への製造法についても説明する。本縮合複素環化合物は、例えば、以下の(製造法1)～(製造法23)により製造することができる。

[0054]

15 (製造法1)(工程(C-1))

式(1)においてA¹が-NR⁶-である化合物(4)は、工程(C-1)に従い、化合物(M12)と化合物(M5)とを反応させることにより製造することができる。



20

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常塩基、酸、亜硫酸塩あるいは二亜硫酸塩の存在下で行われる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

25 反応に用いられる塩基としては、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸水素塩類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸としては、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸類、酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

反応に用いられる亜硫酸塩としては、亜硫酸ナトリウム、亜硫酸カリウム等が挙げられる。

30 反応に用いられる二亜硫酸塩としては、二亜硫酸ナトリウム、二亜硫酸カリウム等が挙げられる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン(以下、THFと記す。)、エ

チレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド(以下、DMFと記す。)、N-メチルピロリドン(以下、NMPと記す。)等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド(以下、DMSOと記す。)等のスルホキシド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて酸化剤を加えて行うこともできる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば酸素、塩化銅(II)、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノン等が挙げられる。

該反応には、化合物(M12)1モルに対して、化合物(M5)が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~5モルの割合、酸が通常1~5モルの割合、亜硫酸塩が通常1~5モルの割合、二亜硫酸塩が通常1~5モルの割合、酸化剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

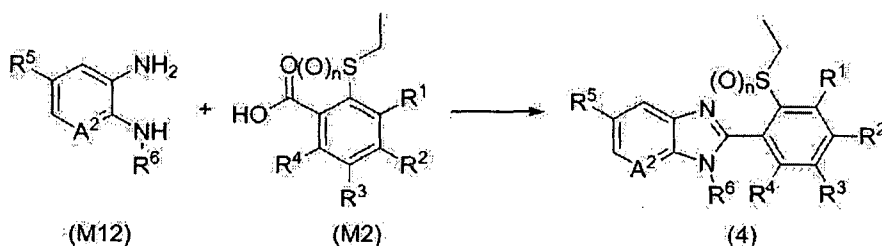
該反応の反応温度は、通常30~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(4)を単離することができる。単離された化合物(4)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0055]

(製造法2)(工程A-1)

式(1)においてA1が-NR6-である化合物(4)は、工程(A-1)に従い、化合物(M12)と化合物(M2)とを、脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、R6、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、*tert*-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキシド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる脱水縮合剤としては、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩(以下、WSCと記す。)、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド

等のカルボジイミド類、(ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ) トリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロリン酸塩(以下、BOP試薬と記す。)等が挙げられる。

該反応は、必要に応じて触媒を加えて行うこともできる。

5 反応に用いられる触媒としては、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(以下、HOBTと記す。)等が挙げられる。

該反応には、化合物(M12)1モルに対して、化合物(M2)が通常1~3モルの割合、脱水縮合剤が通常1~5モルの割合、触媒が通常0.01~0.1モルの割合で用いられる。

10 該反応の反応温度は、通常30~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(4)を単離することができる。単離された化合物(4)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

また、工程(B-1)に従い、化合物(M2)に代えて化合物(M4)を用い、上記方法に準じて化合物(4)を製造することもできる。

15 化合物(M4)を用いる場合は、通常脱水縮合剤を加えずに行われる。必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

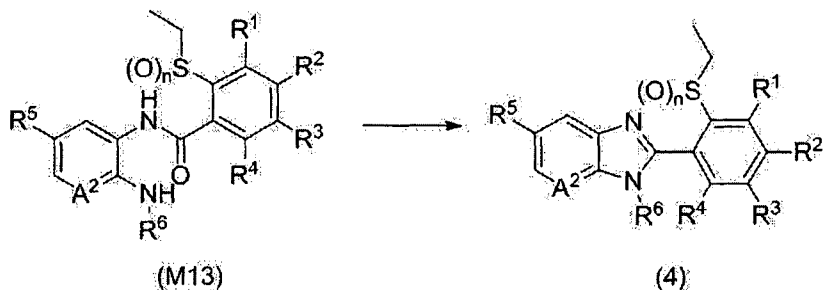
塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

20 該反応には、化合物(M12)1モルに対して、化合物(M4)が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

[0056]

(製造法3)(工程(A-3)、工程(B-3))

25 式(1)においてA1が-NR6-である化合物(4)は、工程(A-3)又は工程(B-3)に従い、化合物(M13)を脱水縮合することにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、R6、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

30 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、メタノ

ール、エタノール、プロパノール、ブタノール、ペンタノール等のアルコール類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて、酸又は脱水剤を用いることができる。反応に用いられる酸としては、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸類、酢酸等のカルボン酸類が挙げられ、反応に
5 用いられる脱水剤としては、オキシ塩化リン、無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物等が挙げられる。

該反応には、化合物 (M13) 1モルに対して、酸又は脱水剤が通常1モル～10モルの割合で用いられる。

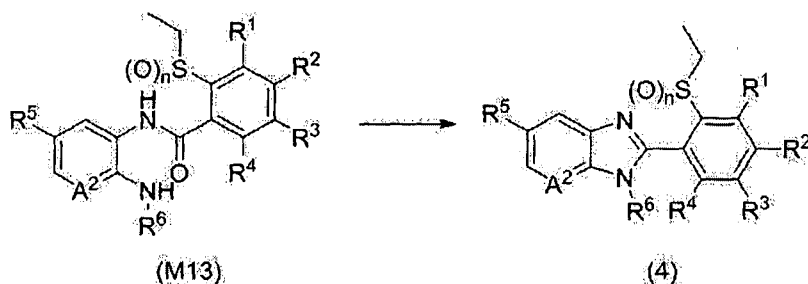
該反応の反応温度は、通常30～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1
10 ～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(4)を単離することができる。単離された化合物(4)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0057]

15 (製造法4)(工程(A-3)、工程(B-3))

式(1)においてA1が-NR6-である化合物(4)は、工程(A-3)又は工程(B-3)に従い、化合物(M13)を塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



20

[式中、R1、R2、R3、R4、R5、R6、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、
25 オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキシド類、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、ペンタノール等のアルコール類及びこれらの混合物が挙げられる。

30 反応に用いられる塩基としては、リン酸三カリウム等が挙げられる。

該反応には、化合物(M13)1モルに対して、塩基が通常1モル～10モルの割合で用いられる。

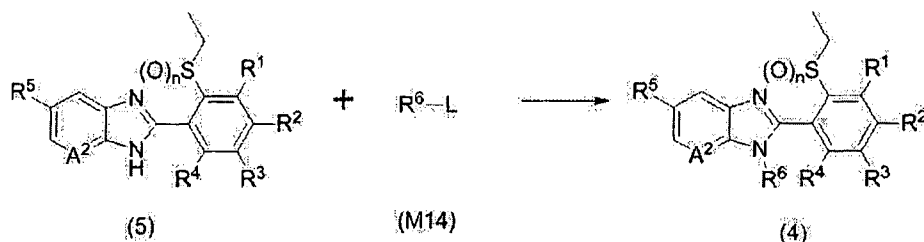
該反応の反応温度は、通常30～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1
～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(4)を単離することができる。単離された化合物(4)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0058]

5 (製造法5)

式(1)においてA1が-NR6-である化合物(4)は、化合物(5)と化合物(M14)とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



- 10 [式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表し、Lは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基及びメチルスルホニルオキシ基等の脱離基を表し、ここでR6は群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 15 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、及びこれらの混合物が挙げられる。

- 20 反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。

該反応には、化合物(5)1モルに対して、化合物(M14)が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応には、化合物(5)1モルに対して、塩基が通常1~3モルの割合で用いられる。

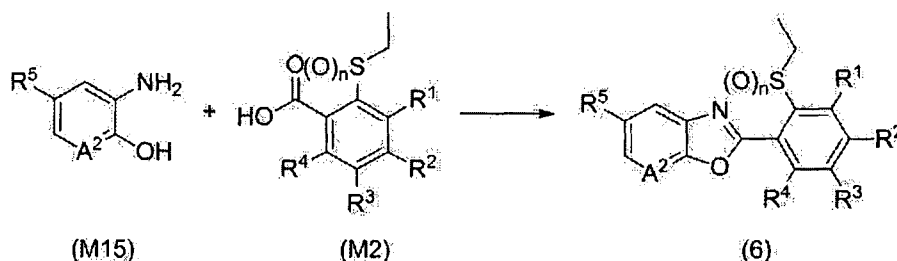
- 25 該反応の反応温度は、通常0~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(4)を単離することができる。単離された化合物(4)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

30 [0059]

(製造法6)(工程(A-1))

式(1)においてA1が酸素原子である化合物(6)は、工程(A-1)に従い、化合物(M15)と化合物(M2)とを、酸の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

5 該反応は、通常溶媒の存在下または非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

10 反応に用いられる酸としては、ポリリン酸やトリメチルシリルポリホスフェート等が挙げられる。

該反応は、酸としてポリリン酸を用いる場合は通常無溶媒で行うが、溶媒中で行ってもよい。

15 該反応には、化合物(M15)1モルに対して、化合物(M2)が通常1~3モルの割合、酸が通常1~10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

20 反応終了後は、反応混合物を水に注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(6)を単離することができる。単離された化合物(6)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

また、化合物(M2)に代えて化合物(M4)を用い、工程(B-1)に従い、上記方法に準じて化合物(6)を製造することもできる。

化合物(M4)を用いる場合は、通常脱水縮合剤を加えずに行われる。必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

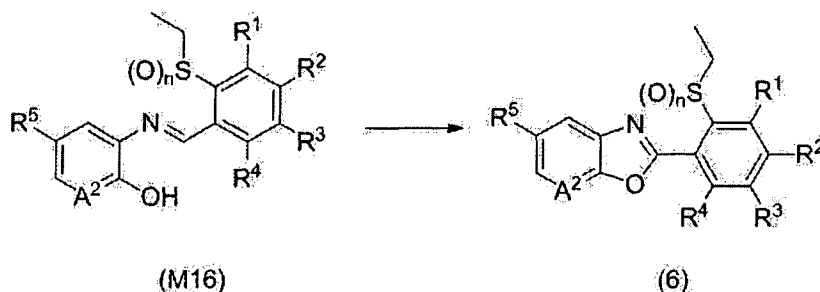
25 塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、化合物(M15)1モルに対して、化合物(M4)が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

30 [0060]

(製造法7)(工程(C-3))

式(1)においてA1が酸素原子である化合物(6)は、工程(C-3)に従い、化合物(M16)を酸化反応に付すことにより製造することができる。



[式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、A₂及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 5 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、酢酸及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、酢酸鉛（IV）、酸化鉛（IV）等の金属酸化剤、ヨードベンゼンジアセタート等の超原子価ヨウ素化合物等が挙げられる。

- 15 該反応には、化合物（M16）1モルに対して、酸化剤が通常1～3モルの割合で用いられる。

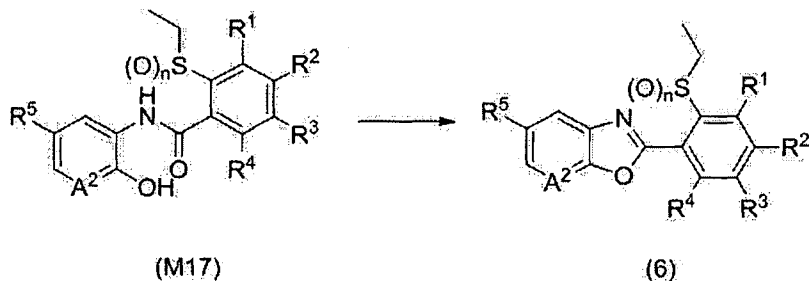
該反応の反応温度は、通常0～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～2.4時間の範囲である。

- 20 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物（6）を単離することができる。単離された化合物（6）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0061]

（製造法8）（工程（A-3）、工程（B-3））

- 25 式（1）においてA₁が酸素原子である化合物（6）は、工程（A-3）又は工程（B-3）に従い、化合物（M17）を脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、A₂及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニ

5 トリル類及びこれらの混合物が挙げられる。このうち、四塩化炭素は、脱水縮合剤としても用いることができる。

反応に用いられる脱水縮合剤としては、トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素もしくは四臭化炭素との混合物、トリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルエステル等のアゾジエステル類との混合物等が挙げられる。

10 反応に用いられる塩基としては、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類等が挙げられる。

該反応には、化合物(M17)1モルに対して、脱水縮合剤が通常1~3モルの割合で用いられる。塩基を用いる場合は、化合物(M17)1モルに対して、塩基が通常1~5モルの割合で用いられる。

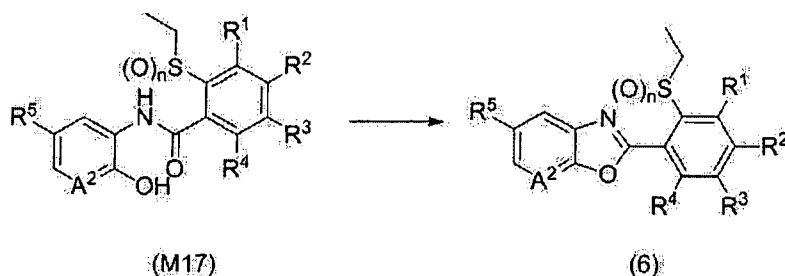
15 該反応の反応温度は、通常-30~100°Cの範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(6)を単離することができる。単離された化合物(6)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

20 [0062]

(製造法9)(工程(A-3)、工程(B-3))

式(1)においてA1が酸素原子である化合物(6)は、工程(A-3)又は工程(B-3)に従い、化合物(M17)を酸の存在下に反応させることにより製造することができる。



25

[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシ

30 レン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

上記酸としては、*p*-トルエンスルホン酸等のスルホン酸類、ポリリン酸等が挙げられる。

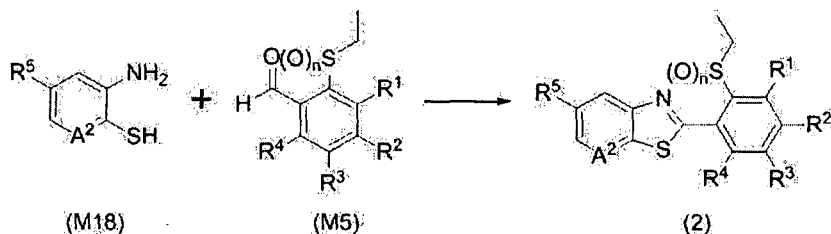
該反応には、化合物(M17)1モルに対して、酸が通常0.1~3モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常1～24時間の範囲である。

5 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(6)を単離することができる。単離された化合物(6)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。 [0063]

(製造法10)(工程(C-1))

式(1)においてA1が硫黄原子である化合物(2)は、工程(C-1)に従い、化合物(M18)と化合物(M5)とを反応させることにより製造することができる。



10

[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常塩基、酸、亜硫酸塩あるいは二亜硫酸塩の存在下で行われる。反応に用いられる塩基としては、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸水素塩類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類及びこれらの混合物が挙げられる。

15 反応に用いられる酸としては、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸類、酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

反応に用いられる亜硫酸塩としては、亜硫酸ナトリウム、亜硫酸カリウム等が挙げられる。

反応に用いられる二亜硫酸塩としては、二亜硫酸ナトリウム、二亜硫酸カリウム等が挙げられる。

20 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

25 反応に用いられる溶媒としては、例えば、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、N-、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて酸化剤を加えて行うこともできる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば酸素、塩化銅(II)、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノン等が挙げられる。

30 該反応には、化合物(M18)1モルに対して、化合物(M5)が通常1～3モルの割合、塩基が1～5モルの割合、酸が通常1～5モルの割合、亜硫酸塩が通常1～5モルの割合、二亜硫酸塩が通常1～5モルの割合、酸化剤が通常1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

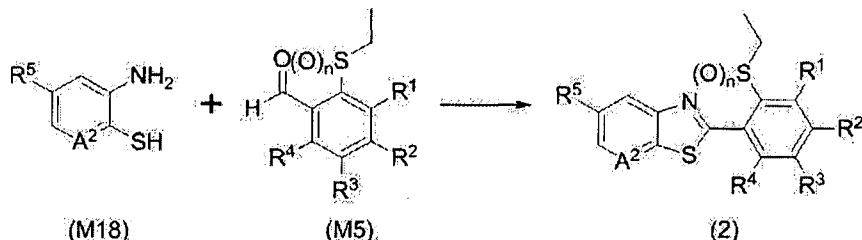
35 反応終了後は、反応混合物を水に加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する

等の後処理操作を行うことにより、化合物(2)を単離することができる。単離された化合物(2)は、クロマトグラフィー、再結晶等により精製することもできる。

[0064]

(製造法11)(工程(C-1))

- 5 式(1)においてA1が硫黄原子である化合物(2)は、工程(C-1)に従い、化合物(M18)の塩酸塩と化合物(M5)とを反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

- 10 該反応は、塩基の存在下、通常溶媒の存在下で行われる。
反応に用いられる塩基としては、例えばジイソプロピルエチルアミン、トリエチルアミン等の第三級アミンが挙げられる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばDMSO等のスルホキシド類、ニトロベンゼン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 15 該反応には、化合物(M18)1モルに対して、化合物(M5)が通常0.5~3モルの割合で用いられ、塩基が通常1~2モルの割合で用いられる。

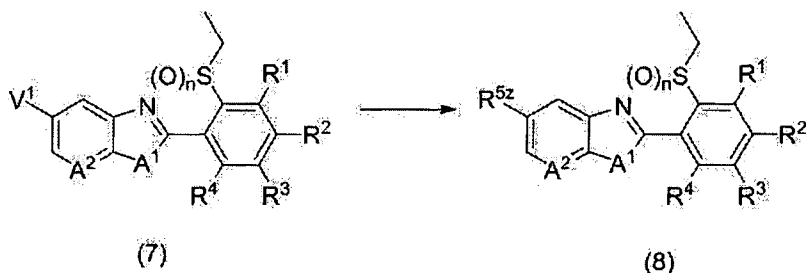
該反応の反応温度は、通常50~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

- 20 反応終了後は、反応混合物を水に加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(2)を単離することができる。単離された化合物(2)は、クロマトグラフィー、再結晶等により精製することもできる。

[0065]

(製造法12)

- 25 式(1)においてR5がシアノ基又はC1-C3アルキル基である化合物(8)は、化合物(7)とシアノ化剤又はジ(C1-C3アルキル)亜鉛とを、パラジウム化合物の存在下に反応させることにより製造することができる。



- 30 [式中、R1、R2、R3、R4、A1、A2及びnは前記と同じ意味を表し、V1は臭素原子又はヨウ素原子等の脱離基を表し、R5zはシアノ基又はC1-C3アルキル基を表

す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキ

シンド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるシアノ化剤としては、例えばシアニ化亜鉛が挙げられ、ジ(C1-C3アルキル)亜鉛としては、例えば、ジメチル亜鉛、ジエチル亜鉛、ジイソプロピル亜鉛が挙げられる。

反応に用いられるパラジウム化合物としては、テトラキス(トリフェニルフォスフィン)パラジウム等が挙げられる。

該反応には、化合物(7)1モルに対して、シアノ化剤又はジ(C1-C3アルキル)亜鉛が通常1~5モルの割合、パラジウム化合物が通常0.01~0.5モルの割合で用いられる。

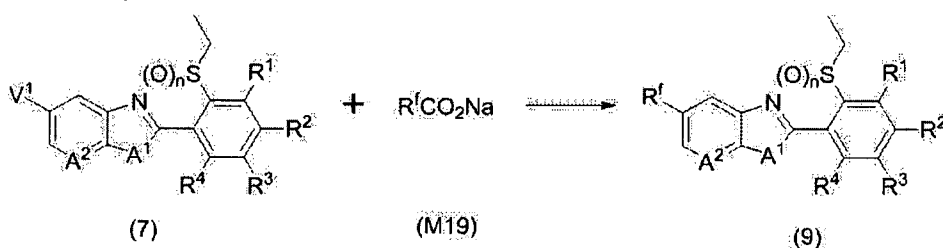
該反応の反応温度は、通常50~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(8)を単離することができる。単離された化合物(8)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0066]

(製造法13)

式(1)においてR5がC1-C3パーフルオロアルキル基である化合物(9)は、化合物(7)と化合物(M19)とを、ヨウ化銅の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、A1、A2、n及びV1は前記と同じ意味を表し、RfはC1-C3パーフルオロアルキル基を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF、NMP等の酸アミド類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、化合物(7)1モルに対して、化合物(M19)が通常1~10モルの割合、ヨウ化銅が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5

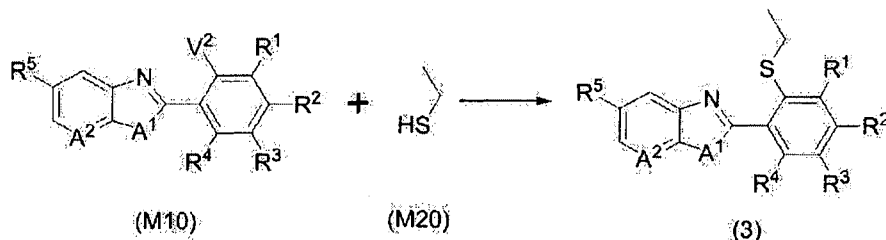
～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(9)を単離することができる。単離された化合物(9)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

5 [0067]

(製造法14)(工程(E-4))

式(1)においてnが0である化合物(3)は、工程(E-4)に従い、化合物(M10)と化合物(M20)とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



10

[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A1、A2及びV2は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば水、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類及びこれらの混合物が挙げられる。

15

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

20

該反応には、化合物(M10)1モルに対して、化合物(M20)が通常1～10モルの割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～150℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(3)を単離することができる。単離された化合物(3)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

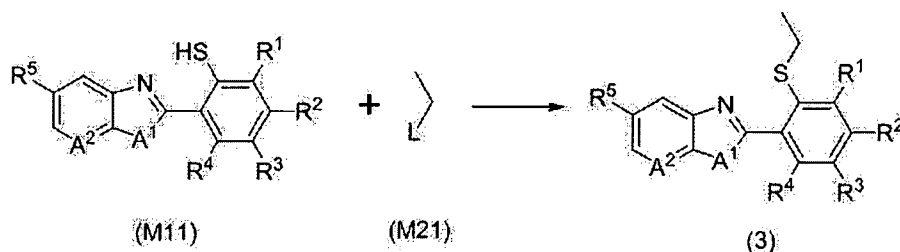
25

[0068]

(製造法15)(工程(F-2))

式(1)においてnが0である化合物(3)は、工程(F-2)に従い、化合物(M11)と化合物(M21)とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

30



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A¹、A²及びLは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 5 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキンド類、及びこれらの混合物が挙げられる。

- 10 反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

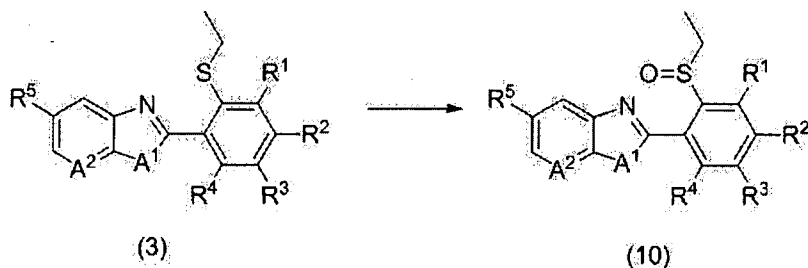
該反応には、化合物(M11)1モルに対して、塩基が通常1~3モルの割合、化合物(M21)が通常1~3モルの割合で用いられる。

- 15 該反応の反応温度は、通常0~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(3)を単離することができる。単離された化合物(3)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0069]

(製造法16)

- 20 式(1)においてnが1である化合物(10)は、化合物(3)を酸化反応に付すことにより製造することができる。



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A¹及びA²は前記と同じ意味を表す。]

- 25 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば過ヨウ素酸ナトリウム又はm-クロロ過安息香

酸が挙げられる。

該反応には、化合物(3) 1モルに対して、酸化剤が通常1～3モルの割合で用いられる。好ましくは、化合物(3) 1モルに対して、酸化剤が1～1.2モルの割合で用いられる。

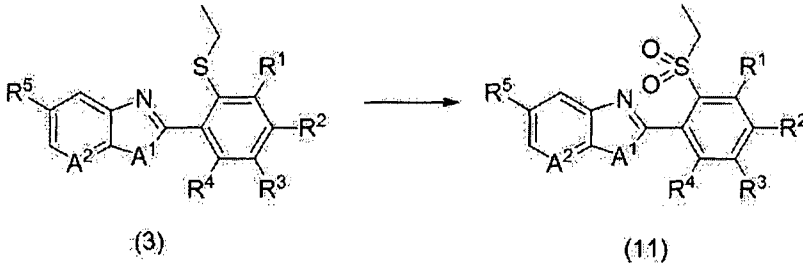
該反応の反応温度は、通常-20～80℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～1.2時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(10)を単離することができる。単離された化合物(10)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0070]

(製造法17)

式(1)においてnが2である化合物(11)は、化合物(3)を酸化剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A1及びA2は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。

該反応には、化合物(3) 1モルに対して、酸化剤が通常2～5モルの割合で用いられる。好ましくは、化合物(3) 1モルに対して、酸化剤が2～3モルの割合で用いられる。

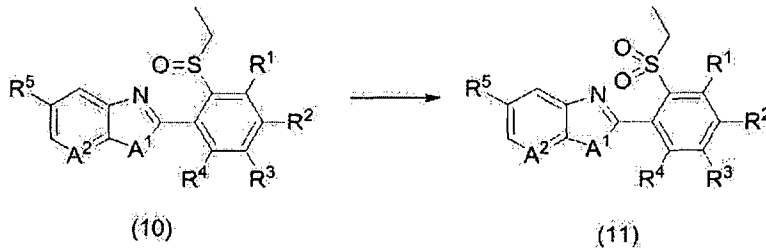
該反応の反応温度は、通常-20～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～1.2時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(11)を単離することができる。単離された化合物(11)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0071]

(製造法18)

式(1)においてnが2である化合物(11)は、化合物(10)を酸化剤の存在下に反応させることにより製造することができる。

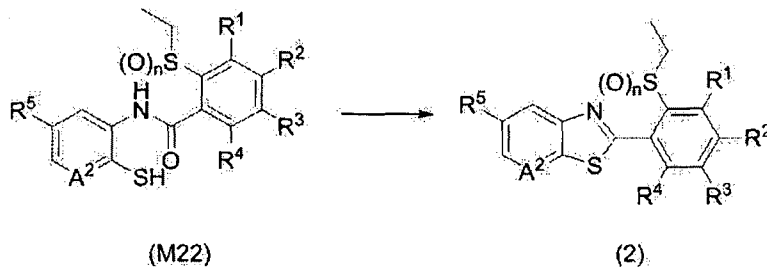


- 5 [式中、R1、R2、R3、R4、R5、A1及びA2は前記と同じ意味を表す。]
 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。
 反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。
- 10 反応に用いられる酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。
 該反応には、化合物(10)1モルに対して、酸化剤が通常1~4モルの割合で用いられる。好ましくは、化合物(10)1モルに対して、酸化剤が1~2モルの割合で用いられる。
 該反応の反応温度は、通常-20~120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~1.2時間の範囲である。
- 15 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(11)を単離することができる。単離された化合物(11)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさら
- 20 に精製することもできる。

[0072]

(製造法19)(工程(A-3)、工程(B-3))

式(1)においてA1が硫黄原子である化合物(2)は、工程(A-3)又は工程(B-3)に従い、化合物(M22)を酸の存在下に反応させることにより製造することができる。



25

[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、

t e r t -ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

5 反応に用いられる酸としては、例えばp-トルエンスルホン酸等のスルホン酸類、ポリリン酸が挙げられる。

該反応には、化合物 (M22) 1モルに対して、酸が通常0. 1~3モルの割合で用いられる。

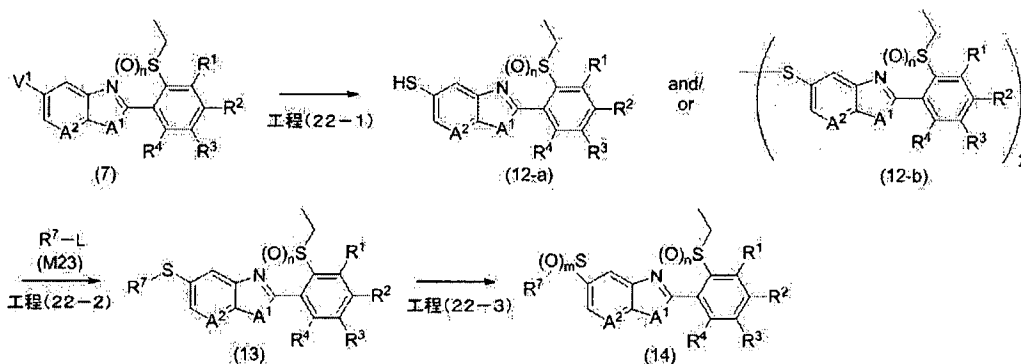
該反応の反応温度は、通常50~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常1~24時間の範囲である。

10 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (2) を単離することができる。単離された化合物 (2) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0073]

(製造法20)

15 式 (1) において、R5が-SHで示される化合物 (12-a)、化合物 (12-a) のジスルフィド体化合物である化合物 (12-b)、R5が-SR7で示される化合物 (13)、R5が-S(O)mR7で示される化合物 (14) は、例えば以下の方法により製造することができる。



20

[式中、R1、R2、R3、R4、R7、A1、A2、n、m、V1及びLは前記と同じ意味を表す。]

工程 (22-1)

25 化合物 (12-a) 及び/又は化合物 (12-b) は、化合物 (7) とチオール化剤とを、触媒の存在下反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、及びこれらの混合物が挙げられる。

30 反応に用いられるチオール化剤としては、例えば硫化ナトリウム、硫化ナトリウム9水和物、チオウレアが挙げられる。

反応に用いられる触媒としては、例えば塩化銅 (I)、臭化銅 (I)、ヨウ化銅 (I) が挙

げられる。

該反応は必要に応じて塩基の存在下で行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウム、トリエチルアミンが挙げられる。

- 5 該反応には、化合物(7) 1モルに対して、チオール化剤が通常1～10モルの割合、触媒が通常0.1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

- 10 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(12-a)及び/又は化合物(12-b)を単離することができる。単離された化合物(12-a)及び/又は化合物(12-b)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0074]

工程(22-2)

- 15 化合物(13)は、化合物(12-a)及び/又は化合物(12-b)と化合物(M23)とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 20 反応に用いられる溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類、水およびこれらの混合物が挙げられる。

- 25 反応に用いられる塩基としては、例えばピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、ジアザビシクロウンデセン(以下、DBUと記す。)、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-5-ノネン等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等の第3級アミン、リン酸三カリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の無機塩基が挙げられる。

- 30 該反応には、化合物(12-a)及び/又は化合物(12-b) 1モルに対して、化合物(M23)が通常1～10モルの割合、塩基が通常1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

- 35 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(13)を単離することができる。単離された化合物(13)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0075]

工程(22-3)

化合物(14)において、mが1又は2である化合物は、化合物(13)を酸化反応に付

すことにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えばタングステン酸ナトリウムが挙げられる。

10 該反応には、化合物(13) 1モルに対して、酸化剤が通常1～5モルの割合で用いられる。

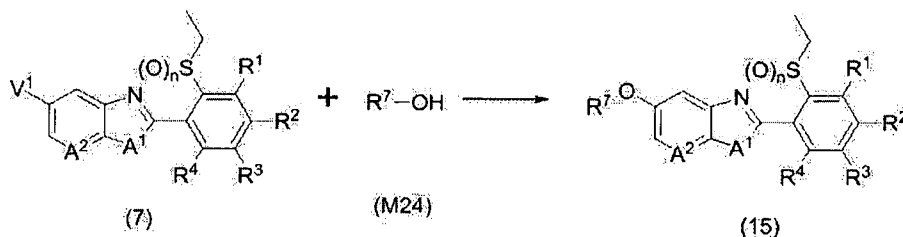
該反応の反応温度は、通常-20～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～12時間の範囲である。

15 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤(例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム)の水溶液、塩基(例えば炭酸水素ナトリウム)の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(14)を単離することができる。単離された化合物(14)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0076]

20 (製造法21)

式(1)において、R5が-OR7である化合物(15)は、例えば以下の方法により製造することができる。



25 [式中、R1、R2、R3、R4、R7、A1、A2、V1及びnは前記と同じ意味を表す。]

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキソド類、及びこれらの混合物が挙げられる。

30 反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

該反応は、必要に応じて銅化合物を加えて行うこともできる。

35 反応に用いられる銅化合物としては、例えば銅、ヨウ化銅(I)、臭化銅(I)、塩化銅(I)が挙げられる。

該反応には、化合物 (7) 1 モルに対して、化合物 (M24) が通常 1 ~ 5 モルの割合で用いられ、塩基が通常 1 ~ 3 モルの割合で用いられる。

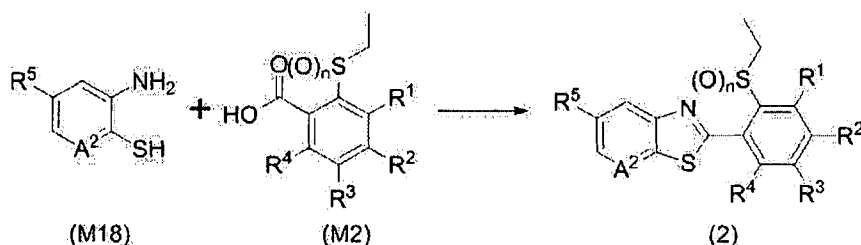
該反応の反応温度は、通常 20 ~ 250 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 48 時間の範囲である。

- 5 反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；または、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより化合物 (15) を単離することができる。単離された化合物 (15) は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0077]

- 10 (製造法 22) (工程 (A-1))

式 (1) において A1 が硫黄原子である化合物 (2) は、工程 (A-1) に従い、化合物 (M18) と化合物 (M2) とを反応させることにより製造することができる。



- 15 [式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2 及び n は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、tert-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP 等の酸アミド類、DMSO 等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる脱水縮合剤としては、WSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、BOP 試薬等が挙げられる。

- 25 該反応は、必要に応じて触媒を加えて行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、HOBt 等が挙げられる。

該反応には、化合物 (M18) 1 モルに対して、化合物 (M2) が通常 1 ~ 3 モルの割合、脱水縮合剤が通常 1 ~ 5 モルの割合、触媒が通常 0.01 ~ 0.1 モルの割合で用いられる。

- 30 該反応の反応温度は、通常 30 ~ 200 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (2) を単離することができる。単離された化合物 (2) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

- 35 また、化合物 (M2) に代えて化合物 (M4) を用い、工程 (B-1) に従い、上記方法に準じて化合物 (2) を製造することもできる。

化合物 (M4) を用いる場合は、通常脱水縮合剤を加えずに行われる。必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

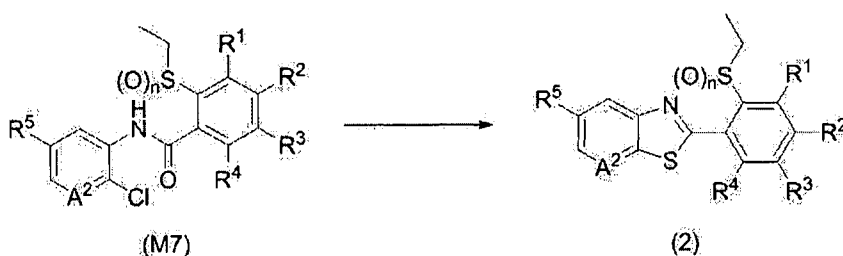
塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、化合物 (M18) 1モルに対して、化合物 (M4) が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

[0078]

(製造法23) (製造法D)

10 式(1)においてA1が硫黄原子である化合物(2)は、(製造法D)に従い化合物(M7)と硫化剤とを反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

15 該反応は、溶媒の存在下または非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、tert-ブチルメチルエーテル、ジグリム等のエーテル、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素、トルエン、ベンゼン、キシレン等の炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、ピリジン、ピコリン、ルチジン等のピリジンおよびこれらの混合物が挙げられる。

20 該反応に用いられる硫化剤としては、五硫化ニリン、ローソン試薬(2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3-ジチア-2,4-ジホスフェタン-2,4-ジスルフィド)等が挙げられる。

25 該反応に用いられる硫化剤の量は、化合物(M7)1モルに対して、通常1モル以上である。

該反応の反応温度は、通常、0℃~200℃の範囲であり、反応時間は、通常、1~24時間の範囲である。

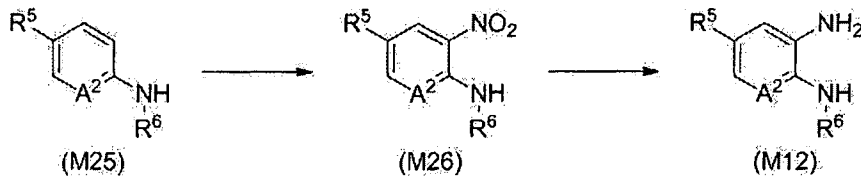
30 反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；または、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより化合物(2)を単離することができる。単離された化合物(2)は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0079]

本発明の中間体は、例えば下記の方法により製造することができる。

(中間体製造法1)

化合物 (M12) は、以下の方法により製造することができる。



[式中、R5、R6及びA2は前記と同じ意味を表す。]

5 (工程1)

化合物 (M26) は、化合物 (M25) をニトロ化剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

10 反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、酢酸、濃硫酸、濃硝酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるニトロ化剤としては、例えば濃硝酸が挙げられる。

該反応には、化合物 (M25) 1モルに対して、ニトロ化剤が通常1～3モルの割合で用いられる。

15 該反応の反応温度は、通常-10～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M26) を単離することができる。単離された化合物 (M26) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0080]

20 (工程2)

化合物 (M12) は、化合物 (M26) と水素とを、水素添加触媒の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常、1～100気圧の水素雰囲気下、溶媒の存在下で行われる。

25 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる水素添加触媒としては、例えばパラジウム炭素、水酸化パラジウム、ラネーニッケル、酸化白金等の遷移金属化合物が挙げられる。

30 該反応には、化合物 (M26) 1モルに対して、水素が通常3モルの割合、水素添加触媒が通常0.001～0.5モルの割合で用いられる。

該反応は、必要に応じて酸 (塩基等) を加えて行うこともできる。

該反応の反応温度は、通常-20～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

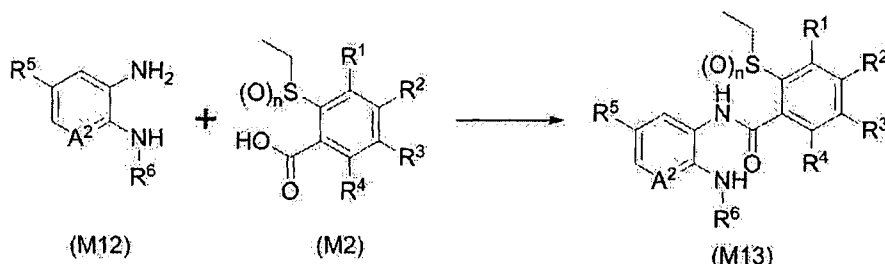
35 反応終了後は、反応混合物をろ過し、必要に応じて有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M12) を単離することができる。単離

された化合物 (M12) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0081]

(中間体製造法2) (工程 (A-2))

- 5 化合物 (M13) は、化合物 (M12) と化合物 (M2) とを、工程 (A-2) に従い、脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、R6、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

- 10 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

15

反応に用いられる脱水縮合剤としては、例えばWSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、BOP試薬が挙げられる。

- 20 該反応には、化合物 (M12) 1モルに対して、化合物 (M2) が通常1~3モルの割合、脱水縮合剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

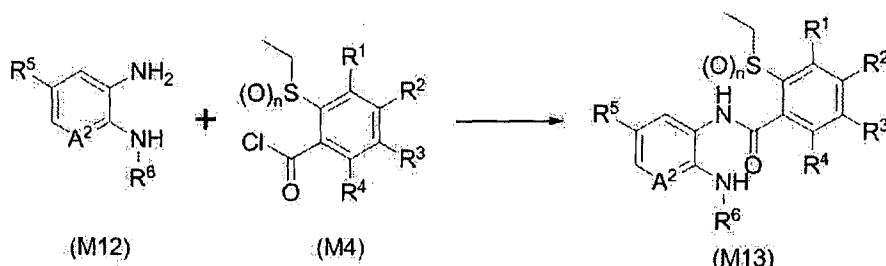
該反応の反応温度は、通常0~140℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

- 25 反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M13) を単離することができる。単離された化合物 (M13) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0082]

(中間体製造法3) (工程 (B-2))

化合物 (M13) は、化合物 (M12) と化合物 (M4) とを、工程 (B-2) に従い、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 5 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類及びこれらの混合物が挙げられる。

上記塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

- 15 該反応には、化合物(M12)1モルに対して、化合物(M4)が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

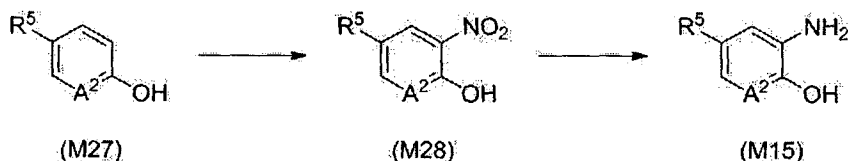
該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

- 20 反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M13)を単離することができる。単離された化合物(M13)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0083]

(中間体製造法4)

化合物(M15)は、以下の方法により製造することができる。



25

[式中、R⁵及びA²は前記と同じ意味を表す。]

(工程1)

化合物(M28)は、化合物(M27)をニトロ化剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

- 30 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばクロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、

酢酸、濃硫酸、濃硝酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるニトロ化剤としては、例えば濃硝酸が挙げられる。

該反応には、化合物 (M27) 1モルに対して、ニトロ化剤が通常1～3モルの割合で用いられる。

- 5 該反応の反応温度は、通常-10～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M28) を単離することができる。単離された化合物 (M28) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

10 [0084]

(工程2)

化合物 (M15) は、化合物 (M28) と水素とを、水素添加触媒の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常1～100気圧の水素雰囲気下、溶媒の存在下で行われる。

- 15 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

- 20 反応に用いられる水素添加触媒としては、例えばパラジウム炭素、水酸化パラジウム、ラネーニッケル、酸化白金等の遷移金属化合物が挙げられる。

該反応には、化合物 (M28) 1モルに対して、水素が通常3モルの割合、水素添加触媒が通常0.001～0.5モルの割合で用いられる。

該反応は、必要に応じて酸 (塩基等) を加えて行うこともできる。

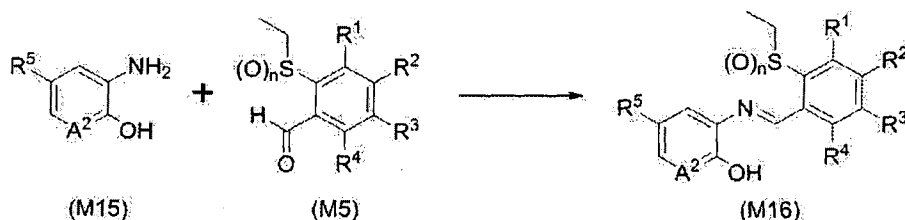
- 25 該反応の反応温度は、通常-20～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物をろ過し、必要に応じて有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M15) を単離することができる。単離された化合物 (M15) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

30 [0085]

(中間体製造法5) (工程(C-2))

化合物 (M16) は、化合物 (M15) と化合物 (M5) とを、工程 (C-2) に従い、反応させることにより製造することができる。



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

5 反応に用いられる溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、化合物(M15)1モルに対して、化合物(M5)が通常1~3モルの割合で用いられる。

該反応は、必要に応じて酸や塩基等を加えて行うこともできる。

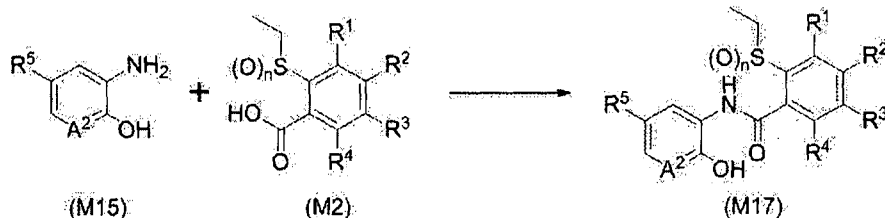
10 該反応の反応温度は、通常0~150℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M16)を単離することができる。単離された化合物(M16)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

15 [0086]

(中間体製造法6)(工程(A-2))

化合物(M17)は、化合物(M15)と化合物(M2)とを、工程(A-2)に従い、脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



20

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

25 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

30 反応に用いられる脱水縮合剤としては、例えばWSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、BOP試薬が挙げられる。

該反応には、化合物(M15)1モルに対して、化合物(M2)が通常1~3モルの割合、脱水縮合剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~140℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

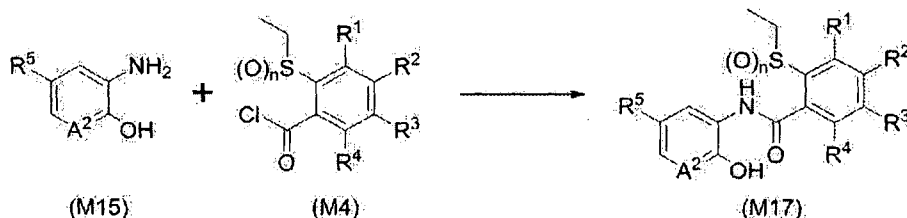
35 反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮す

る等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M17) を単離することができる。単離された化合物 (M17) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0087]

(中間体製造法7) (工程 (B-2))

- 5 化合物 (M17) は、化合物 (M15) と化合物 (M4) とを、工程 (B-2) に従い、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びnは前記と同じ意味を表す。]

- 10 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 15

反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

- 20 該反応には、化合物 (M15) 1モルに対して、化合物 (M4) が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

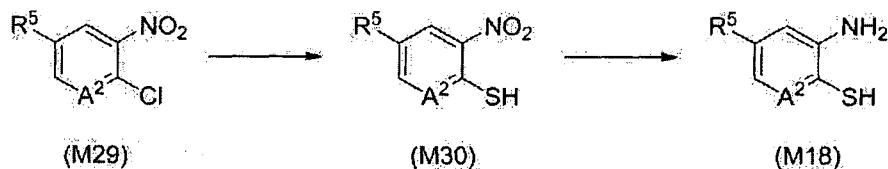
該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

- 25 反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M17) を単離することができる。単離された化合物 (M17) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0088]

(中間体製造法8)

化合物 (M18) は、以下の方法により製造することができる。



30

[式中、R5及びA2は前記と同じ意味を表す。]

(工程 1)

化合物 (M30) は、化合物 (M29) とチオウレアとを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 5 反応に用いられる溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物が挙げられる。

- 10 該反応には、化合物 (M29) 1 モルに対して、チオウレアが通常 0.5 ~ 3 モルの割合、塩基が通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

- 15 反応終了後は、反応混合物に酸を加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M30) を単離することができる。単離された化合物 (M30) は、クロマトグラフィー、再結晶等により精製することもできる。

[0089]

(工程 2)

化合物 (M18) は、化合物 (M30) を還元反応に付すことにより製造することができる。

- 20 該還元反応は、例えば鉄粉、亜鉛粉等の還元剤；塩酸、酢酸等の酸；および水の存在下で行うことができる。

該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

- 25 該反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、DMF、NMP 等の酸アミド類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、化合物 (M30) 1 モルに対して、還元剤が通常 3 ~ 10 モルの割合で用いられる。

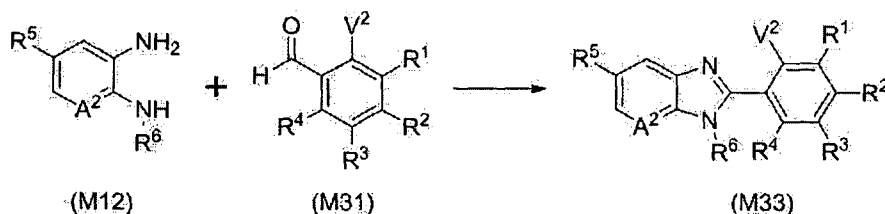
- 30 該反応の反応温度は通常 0 ~ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M18) を単離することができる。単離された化合物 (M18) は、クロマトグラフィー、再結晶等により精製することもできる。

[0090]

- 35 (中間体製造法 9)

化合物 (M10) において、A1 が -NR6- である化合物 (M33) は、化合物 (M12) と化合物 (M31) とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R 1、R 2、R 3、R 4、R 5、R 6、A 2及びV 2は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 5 反応に用いられる塩基としては、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸水素塩類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩類、亜硫酸ナトリウム、亜硫酸カリウム等の亜硫酸塩類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 10 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 15 該反応には、化合物 (M 1 2) 1モルに対して、化合物 (M 3 1) が通常1～3モルの割合、塩基が通常1～5モルの割合で用いられる。

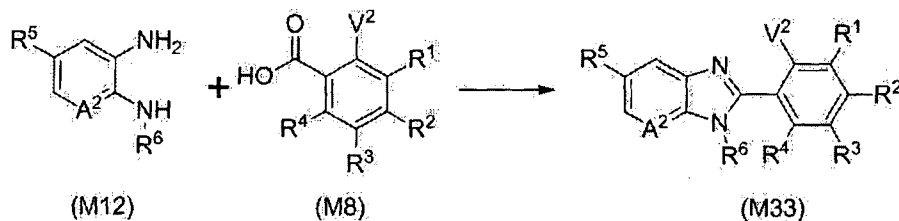
該反応の反応温度は、通常30～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

- 20 反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M 3 3) を単離することができる。単離された化合物 (M 3 3) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0091]

(中間体製造法10)(工程(E-1))

- 25 化合物 (M 1 0) において、A 1が-NR 6-である化合物 (M 3 3) は、化合物 (M 1 2) と化合物 (M 8) とを、工程 (E-1) に従い、脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R 1、R 2、R 3、R 4、R 5、R 6、A 2及びV 2は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 30 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、tert-ブチルメチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタ

ン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 5 反応に用いられる脱水縮合剤としては、WSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、BOP試薬等が挙げられる。該反応は、必要に応じて触媒を加えて行うこともできる。反応に用いられる触媒としては、HOBt等が挙げられる。

該反応には、化合物(M12)1モルに対して、化合物(M8)が通常1~3モルの割合、脱水縮合剤が通常1~5モルの割合、触媒が通常0.01~0.1モルの割合で用いられる。

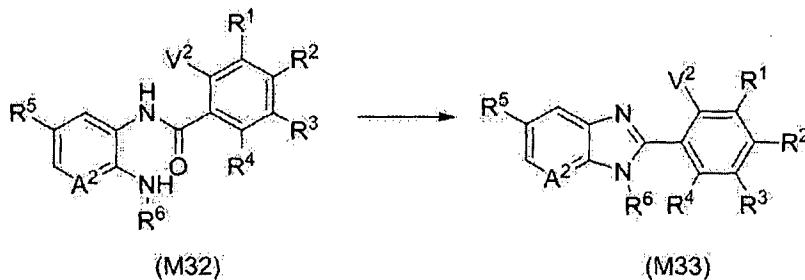
- 10 該反応の反応温度は、通常30~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M33)を単離することができる。単離された化合物(M33)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

- 15 [0092]

(中間体製造法11)(工程(E-3))

化合物(M10)において、A1が-NR6-である化合物(M32)は、工程(E-3)に従い、化合物(M32)を脱水縮合することにより製造することができる。



- 20

[式中、R1、R2、R3、R4、R5、R6、A2及びV2は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、ペンタノール等のアルコール類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 25 30 該反応は必要に応じて、酸又は脱水剤を用いることができる。反応に用いられる酸としては、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸類、酢酸等のカルボン酸類が挙げられ、反応に用いられる脱水剤としては、オキシ塩化リン、無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物等が挙げられる。

該反応には、化合物(M32)1モルに対して、酸又は脱水剤が通常1モル~10モルの

割合で用いられる。

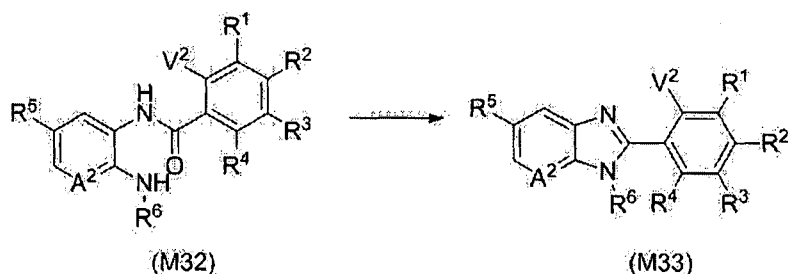
該反応の反応温度は、通常30～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

- 5 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M33)を単離することができる。単離された化合物(M33)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0093]

(中間体製造法12)(工程(E-3))

- 10 化合物(M10)において、A1が-NR6-である化合物(M32)は、工程(E-3)に従い、化合物(M32)を塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、R6、A2及びV2は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 15 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、ペンタノール等のアルコール類及びこれらの混合物が挙げられる。
- 20

反応に用いられる塩基としては、リン酸三カリウム等が挙げられる。

該反応には、化合物(M32)1モルに対して、塩基が通常1モル～10モルの割合で用いられる。

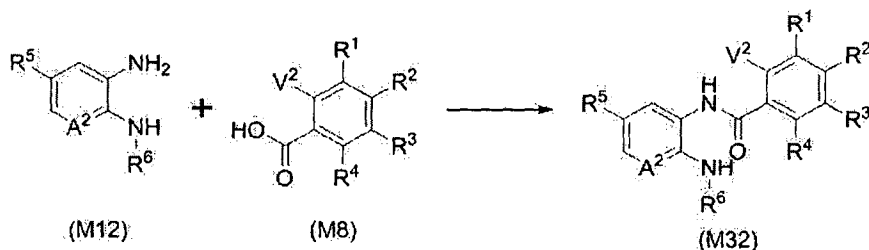
- 25 該反応の反応温度は、通常30～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M33)を単離することができる。単離された化合物(M33)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

30 [0094]

(中間体製造法13)(工程(E-2))

化合物(M32)は、化合物(M12)と化合物(M8)とを、工程(E-2)に従い、脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、A²及びV²は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

- 5 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

10 反応に用いられる脱水縮合剤としては、例えばWSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、BOP試薬が挙げられる。

該反応には、化合物(M12)1モルに対して、化合物(M8)が通常1~3モルの割合、脱水縮合剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

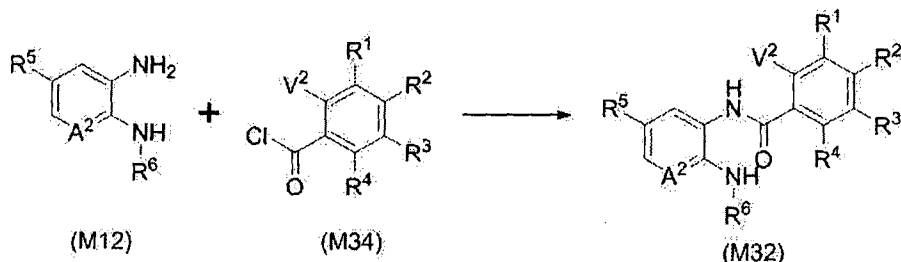
- 15 該反応の反応温度は、通常0~140℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M32)を単離することができる。単離された化合物(M32)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

20 [0095]

(中間体製造法14)

化合物(M32)は、化合物(M12)と化合物(M34)とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



25

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、A²及びV²は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタ

ン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキンド類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 5 上記塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、化合物 (M12) 1モルに対して、化合物 (M34) が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

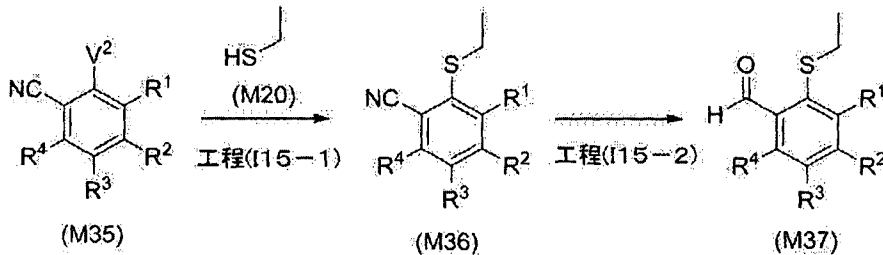
- 10 該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M32) を単離することができる。単離された化合物 (M32) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

15 [0096]

(中間体製造法15)

化合物 (M5) のうち、nが0である化合物 (M37) は、以下の方法により製造することができる。



20

[式中、R¹、R²、R³、R⁴及びV²は前記と同じ意味を表す。]

(工程I15-1)

化合物 (M36) は、化合物 (M35) と化合物 (M20) とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

- 25 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキンド類及びこれらの混合物が挙げられる。

- 30 反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

該反応には、化合物 (M35) 1モルに対して、化合物 (M20) が通常1~10モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~150℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~

24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M36) を単離することができる。単離された化合物 (M36) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

5 [0097]

(工程 I 15-2)

化合物 (M37) は、化合物 (M36) を還元反応に付すことにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

10 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ジイソブチルアルミニウムが挙げられる。

15 該反応には、化合物 (M36) 1モルに対して、還元剤が通常1~2モルの割合で用いられる。

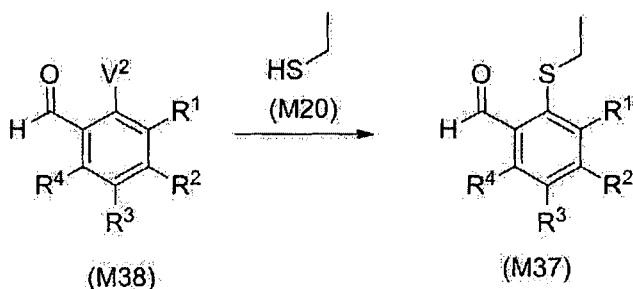
該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

20 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M37) を単離することができる。単離された化合物 (M37) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0098]

(中間体製造法16)

25 化合物 (M5) のうち、nが0である化合物 (M37) は、化合物 (M38) と化合物 (M20) とを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4及びV2は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

30 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキンド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等

が挙げられる。

該反応には、化合物 (M38) 1モルに対して、化合物 (M20) が通常 1～10モルの割合、塩基が通常 1～10モルの割合で用いられる。

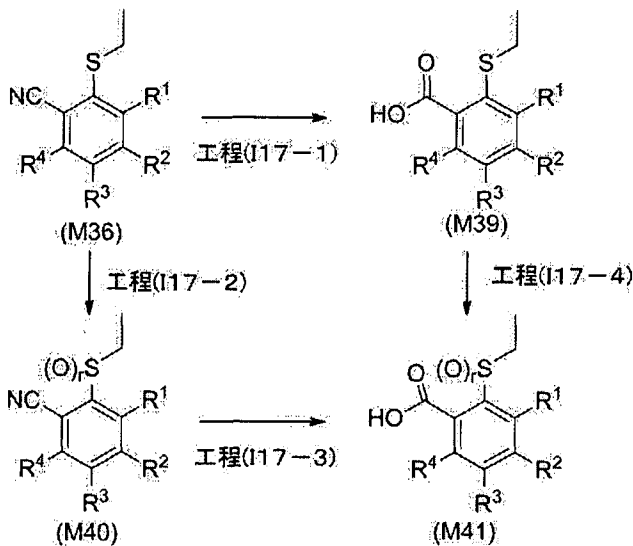
該反応の反応温度は、通常 0～150℃の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.5～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M37) を単離することができる。単離された化合物 (M37) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0099]

10 (中間体製造法 17)

化合物 (M2) のうち、nが0である化合物 (M39) は、化合物 (M36) を塩基の存在下、加水分解反応させることにより製造することができ、nが1又は2である化合物 (M41) は下記の方法で製造することができる。



15

[式中、R1、R2、R3及びR4は前記と同じ意味を表し、rは1又は2を表す。]

(工程 I 17-1)

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

20 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物が挙げられる。

25 該反応には、化合物 (M36) 1モルに対して、塩基が通常 1～10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 0～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応液を酸性にした後、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、

濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M39) を単離することができる。単離された化合物 (M39) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0100]

5 (工程 I 17-2)

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

10 反応に用いられる酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えばタングステン酸ナトリウムが挙げられる。

15 該反応には、化合物 (M36) 1モルに対して、酸化剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-20~120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~1.2時間の範囲である。

20 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤 (例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム) の水溶液、塩基 (例えば炭酸水素ナトリウム) の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M40) を単離することができる。単離された化合物 (M40) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0101]

(工程 I 17-3)

25 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

30 反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物が挙げられる。

該反応には、化合物 (M40) 1モルに対して、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~2.4時間の範囲である。

35 反応終了後は、反応液を酸性にした後、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M41) を単離することができる。単離された化合物 (M41) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0102]

(工程 I 1 7 - 4)

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えばタングステン酸ナトリウムが挙げられる。

10 該反応には、化合物 (M 3 9) 1 モルに対して、酸化剤が通常 1 ~ 5 モルの割合で用いられる。

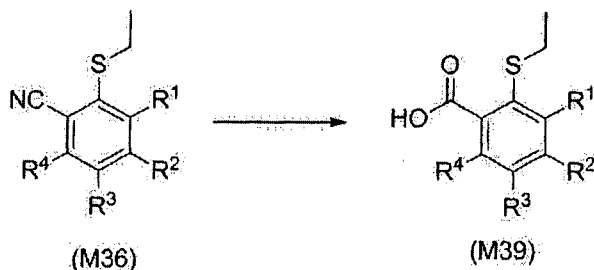
該反応の反応温度は、通常 - 2 0 ~ 1 2 0 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0 . 1 ~ 1 2 時間の範囲である。

15 反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤 (例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム) の水溶液、塩基 (例えば炭酸水素ナトリウム) の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M 4 1) を単離することができる。単離された化合物 (M 4 1) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0 1 0 3]

20 (中間体製造法 1 8)

化合物 (M 2) のうち、n が 0 である化合物 (M 3 9) は、化合物 (M 3 6) を酸の存在下、加水分解反応させることにより製造することができる。



25 [式中、R 1、R 2、R 3 及び R 4 は前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常酸の水溶液を溶媒として行われる。

反応に用いられる酸としては、例えば塩酸、硝酸、リン酸、硫酸等の鉱酸類、酢酸、トリフルオロ酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

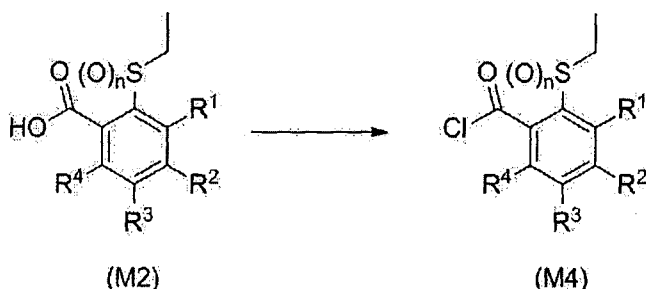
30 該反応の反応温度は、通常 0 ~ 1 0 0 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0 . 1 ~ 2 4 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M 3 9) を単離することができる。単離された化合物 (M 3 9) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0 1 0 4]

(中間体製造法 19)

化合物 (M4) は、化合物 (M2) を塩素化剤の存在下、塩素化させることにより製造することができる。



5

[式中、R1、R2、R3、R4及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩素化剤としては、塩化チオニル、二塩化オキサリル等が挙げられる。

該反応には、化合物 (M2) 1モルに対して、塩素化剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

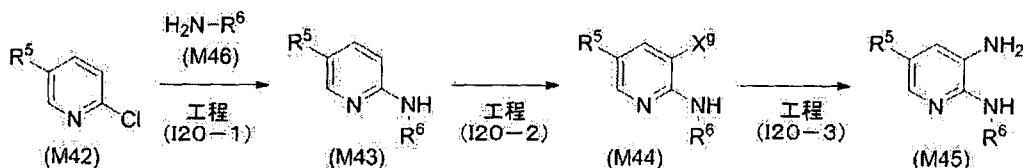
15 該反応の反応温度は、通常0~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、溶媒を留去することにより、化合物 (M4) を単離することができる。

[0105]

(中間体製造法 20)

20 化合物 (M12) のうち、A2が窒素原子である化合物 (M45) は、例えば以下の方法により製造することができる。



25 [式中、R5及びR6は前記と同じ意味を表し、Xgは塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子等のハロゲン原子を表す。]

(工程 I 20-1)

化合物 (M43) は、化合物 (M42) と化合物 (M46) とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下あるいは非存在下で行われる。

30 反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル

等のエステル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、アセトニトリル等のニトリル、DMF、NMP、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類およびこれらの混合物が挙げられる。

5 該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、例えばピリジン、ピコリン、2, 6-ルチジン、DBU、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]-5-ノネン等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等の第3級アミン、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。

10 化合物(M42) 1モルに対して、化合物(M46) が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~200℃の範囲であり、反応時間は通常0. 1~24時間の範囲である。

15 反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；または、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより化合物(M43) を単離することができる。単離された化合物(M43) は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0106]

(工程I20-2)

20 化合物(M44) は、化合物(M43) とハロゲン化剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

25 反応に用いられる溶媒としては、例えば水、酢酸、1, 4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の非プロトン性極性溶媒およびこれらの混合物が挙げられる。

30 反応に用いられるハロゲン化剤としては、例えばN-クロロスクシンイミド、塩素等の塩素化剤、N-ブロモスクシンイミド、臭素等の臭素化剤、N-ヨードスクシンイミド、ヨウ素等の塩素化剤が挙げられる。

化合物(M43) 1モルに対して、ハロゲン化剤が通常1~3モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-10~100℃の範囲であり、反応時間は通常0. 1~24時間の範囲である。

35 反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；または、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより化合物(M44) を単離することができる。単離された化合物(M44) は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0107]

(工程I20-3)

化合物 (M45) は、化合物 (M44) とアミノ化剤とを銅化合物の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

5 反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、ジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類およびこれらの混合物が挙げられる。

10 反応に用いられるアミノ化剤としては、例えばアンモニア、アンモニア水、リチウムアミドが挙げられる。

反応に用いられる銅化合物としては、例えば銅、ヨウ化銅 (I)、酸化銅 (I)、酸化銅 (II)、アセチルアセトン銅 (II)、酢酸銅 (II)、硫酸銅 (II) が挙げられる。

該反応は、必要に応じて配位子を加えて行うこともできる。

15 反応に用いられる配位子としては、例えばアセチルアセトン、サレン、フェナントロリンが挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

20 反応に用いられる塩基としては、例えばピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、DBU、1,5-ジアザビシクロ [4.3.0] -5-ノネン等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等の第3級アミン、りん酸三カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。

化合物 (M44) 1モルに対して、アミノ化剤が通常1~5モルの割合で用いられ、銅化合物が通常0.02~0.5モルの割合で用いられ、必要に応じて配位子が0.02~2モルの割合で用いられ、必要に応じて塩基が1~5モルの割合で用いられる。

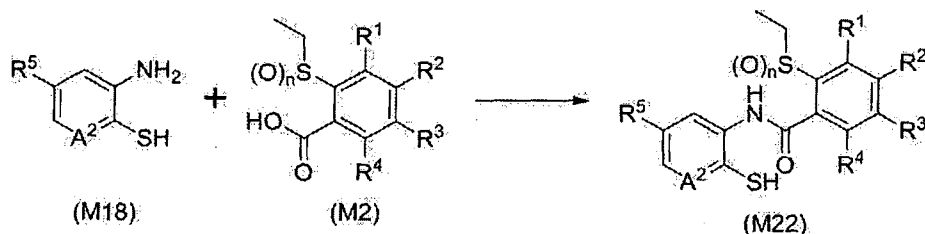
25 該反応の反応温度は、通常30~200℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~48時間の範囲である。

30 反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；または、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより化合物 (M45) を単離することができる。単離された化合物 (M45) は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0108]

(中間体製造法21)(工程(A-2))

化合物 (M22) は、化合物 (M18) と化合物 (M2) とを、工程 (A-2) に従い、脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

5 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

10 反応に用いられる脱水縮合剤としては、例えばWSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、BOP試薬が挙げられる。

該反応には、化合物(M18)1モルに対して、化合物(M2)が通常1~3モルの割合、脱水縮合剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

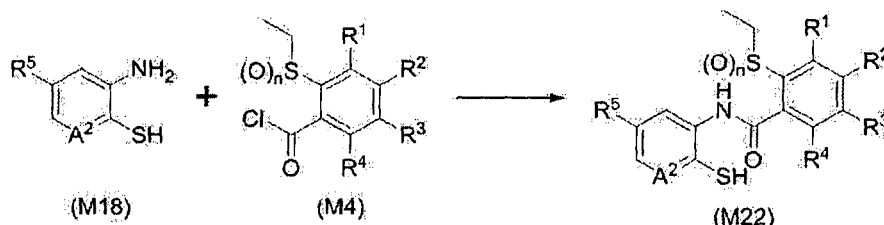
15 該反応の反応温度は、通常0~140℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M22)を単離することができる。単離された化合物(M22)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0109]

20 (中間体製造法22)(工程(B-2))

化合物(M22)は、化合物(M18)と化合物(M4)とを、工程(B-2)に従い、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



25 [式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

30 反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類及びこれらの混合物が挙げられる。

35 反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、化合物 (M18) 1モルに対して、化合物 (M4) が通常1～3モルの割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

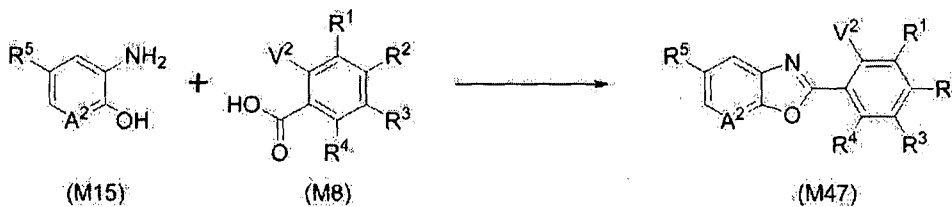
該反応の反応温度は、通常-20～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

- 5 反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物 (M22) を単離することができる。単離された化合物 (M22) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0110]

(中間体製造例23) (工程(E-1))

- 10 化合物 (M10) においてA1が酸素原子である化合物 (M47) は、工程(E-1)に従い、化合物 (M15) と化合物 (M8) とを反応させることにより製造することができる。



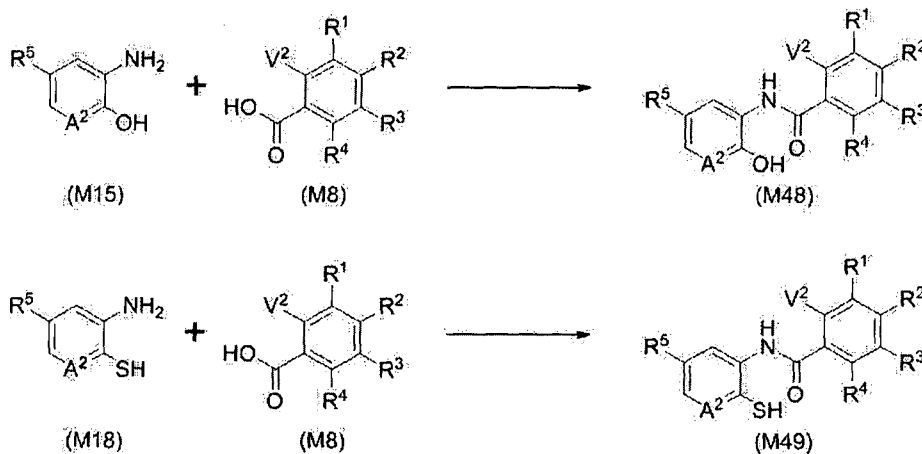
[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2、n及びV2は前記と同じ意味を表す。]

- 15 化合物 (M2) に代えて化合物 (M8) を用い、(製造法6) 記載の方法に準じて、化合物 (M47) を製造することができる。

[0111]

(中間体製造例24) (工程(E-2))

- 20 化合物 (M9) においてA1が酸素原子である化合物 (M48) は、工程(E-2)に従い、化合物 (M15) と化合物 (M8) とを反応させることにより製造することができる。また化合物 (M9) においてA1が硫黄原子である化合物 (M49) は、化合物 (M18) と化合物 (M8) とを反応させることにより製造することができる。



- 25 [式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びV2は前記と同じ意味を表す。]

化合物 (M2) に代えて化合物 (M8) を用い、(中間体製造法6) 記載の方法に準じて、

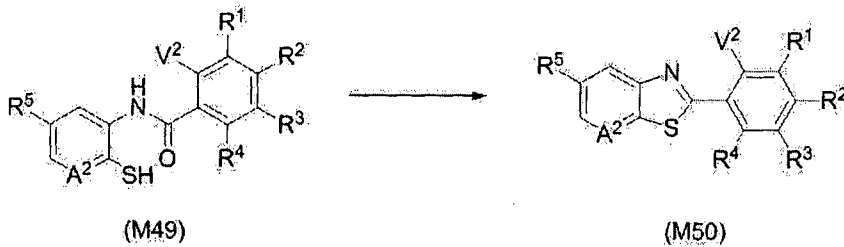
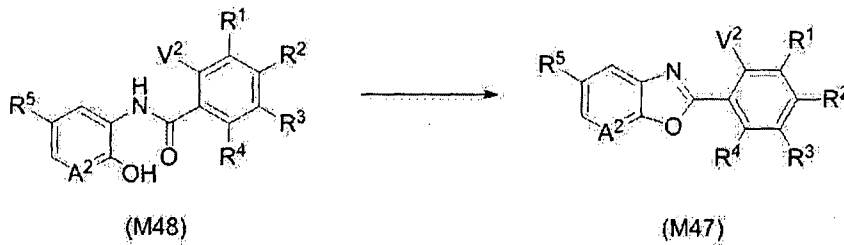
化合物 (M48) を製造することができる。

化合物 (M2) に代えて化合物 (M8) を用い、(中間体製造法 21) 記載の方法に準じて、化合物 (M49) を製造することができる。

[0112]

5 (中間体製造例 25) (工程 (E-3))

化合物 (M10) において A1 が酸素原子である化合物 (M47) は、工程 (E-3) に従い、化合物 (M48) を環化させることにより製造することができる。また化合物 (M10) において A1 が硫黄原子である化合物 (M50) は、工程 (E-3) に従い、化合物 (M49) を環化させることにより製造することができる。



10

[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A2及びV2は前記と同じ意味を表す。]

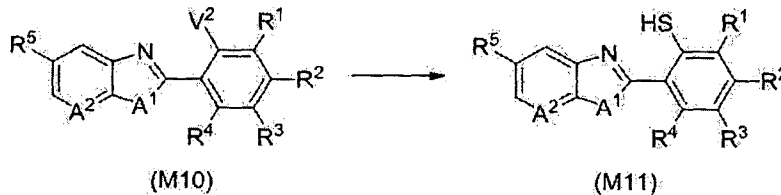
化合物 (M17) に代えて化合物 (M48) を用い、(製造法 8) あるいは (製造法 9) 記載の方法に準じて、化合物 (M47) を製造することができる。

15 化合物 (M22) に代えて化合物 (M49) を用い、(製造法 21) 記載の方法に準じて、化合物 (M50) を製造することができる。

[0113]

(中間体製造法 26) (工程 (F-1))

20 化合物 (M11) は、工程 (F-1) に従い、化合物 (M10) と硫化ナトリウム、硫化水素ナトリウム又は硫化水素とを反応させることにより製造することができる。



[式中、R1、R2、R3、R4、R5、A1、A2及びV2は前記と同じ意味を表す。]

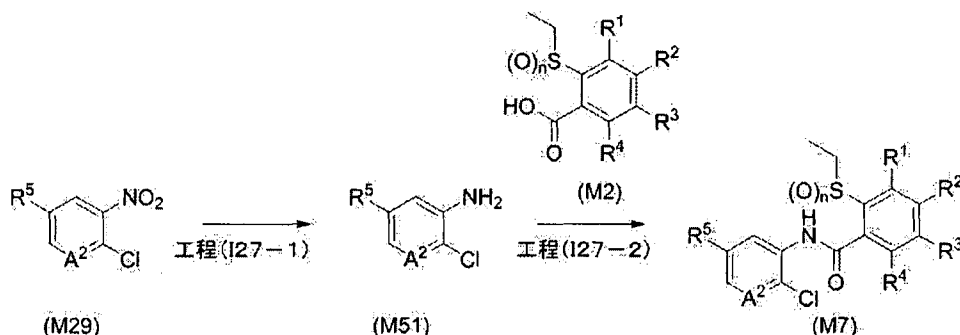
25 化合物 (M20) に代えて硫化ナトリウム、硫化水素ナトリウム又は硫化水素を用い、(製造法 16) 記載の方法に準じて、化合物 (M11) を製造することができる。

硫化ナトリウム、硫化水素ナトリウムを用いる場合は、通常塩基を加えずに行われる。

[0114]

(中間体製造法27)(製造法D)

化合物(M7)は、化合物(M51)と化合物(M2)とを反応させることにより製造することができる。



5

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A²及びnは前記と同じ意味を表す。]

(工程I27-1)

化合物(M51)は、化合物(M29)を還元反応に付すことにより製造することができる。

10

該還元反応は、例えば鉄粉、亜鉛粉等の還元剤；塩酸、酢酸等の酸；および水の存在下で行うことができる。

該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

15

該反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、DMF、NMP等の酸アミド類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、化合物(M29)1モルに対して、還元剤が通常3~10モルの割合で用いられる。

20

該反応の反応温度は通常0~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M51)を単離することができる。単離された化合物(M51)は、クロマトグラフィー、再結晶等により精製することもできる。

25

(工程I27-2)

該反応は、通常溶媒の存在下あるいは非存在下で行われる。

30

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP等の酸アミド類、DMSO等のスルホキド類、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる脱水縮合剤としては、例えばWSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボ

ジイミド等のカルボジイミド類、BOP試薬が挙げられる。

該反応には、化合物(M51) 1モルに対して、化合物(M2)が通常1～3モルの割合、脱水縮合剤が通常1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～140℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～2.4時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(M7)を単離することができる。単離された化合物(M7)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

また、化合物(M2)に代えて化合物(M4)を用い、上記方法に準じて化合物(M7)を製造することもできる。

化合物(M4)を用いる場合は、通常脱水縮合剤を加えずに行われる。必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

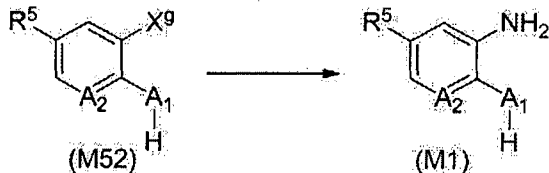
塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、化合物(M51) 1モルに対して、化合物(M4)が通常1～3モルの割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

[0115]

(中間体製造法28)

化合物(M1)は、化合物(M52)とアミノ化剤とを反応させることにより製造することができる。



[式中、X^g、R⁵、A₁及びA₂は前記と同じ意味を表す。]

化合物(M44)に代えて化合物(M52)を用い、(中間体製造法20)の工程(I20-3)記載の方法に準じて、化合物(M1)を製造することができる。

[0116]

次に、本縮合複素環化合物の具体例を以下に示す。表中、R₁～R₅、A₁、A₂及びnは、式(1)で示される化合物中の記号を示す。

30

[0 1 1 7]

表 1

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A ¹	A ²	n
1	H	H	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0
2	H	H	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
3	H	H	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
4	H	H	H	H	CF ₃	-NEt-	N	0
5	H	H	H	H	CF ₃	-NEt-	N	1
6	H	H	H	H	CF ₃	-NEt-	N	2
7	H	H	H	H	CF ₃	-NiPr-	N	0
8	H	H	H	H	CF ₃	-NiPr-	N	1
9	H	H	H	H	CF ₃	-NiPr-	N	2
10	H	H	H	H	CF ₃	-NCycPr-	N	0
11	H	H	H	H	CF ₃	-NCycPr-	N	1
12	H	H	H	H	CF ₃	-NCycPr-	N	2
13	H	H	H	H	CF ₂ H	-NMe-	N	0
14	H	H	H	H	CF ₂ H	-NMe-	N	1
15	H	H	H	H	CF ₂ H	-NMe-	N	2
16	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	0
17	H	H	H	H	CF ₃	-NMe-	=CH-	0
18	H	H	H	H	CF ₃	-NMe-	=CH-	1
19	H	H	H	H	CF ₃	-NMe-	=CH-	2
20	H	H	H	H	CF ₃	O	=CH-	0
21	H	H	H	H	CF ₃	O	=CH-	1
22	H	H	H	H	CF ₃	O	=CH-	2
23	H	H	H	H	CF ₃	O	N	0
24	H	H	H	H	CF ₃	O	N	1
25	H	H	H	H	CF ₃	O	N	2
26	H	H	H	H	CF ₃	S	=CH-	0
27	H	H	H	H	CF ₃	S	=CH-	1
28	H	H	H	H	CF ₃	S	=CH-	2
29	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	1
30	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	2
31	H	F	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0
32	H	F	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
33	H	F	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
34	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0

[0118]

表 2

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A ¹	A ²	n
35	H	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	0
36	H	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	1
37	H	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	2
38	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
39	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
40	H	H	H	H	CF ₃	S	N	0
41	H	H	H	H	CF ₃	S	N	1
42	H	H	H	H	CF ₃	S	N	2
43	H	H	H	H	SCF ₃	-NMe-	N	2
44	H	H	H	H	SCF ₃	-NMe-	N	1
45	H	H	H	H	SOCF ₃	-NMe-	N	2
46	H	H	H	H	SO ₂ CF ₃	-NMe-	N	2
47	H	CF ₃	H	H	CF ₃	S	N	0
48	H	CF ₃	H	H	CF ₃	S	N	2
49	H	H	H	H	SMe	-NMe-	N	0
50	H	H	H	H	SO ₂ Me	-NMe-	N	2
51	H	CF ₃	H	H	SCF ₃	-NMe-	N	0
52	H	CF ₃	H	H	SCF ₃	-NMe-	N	2
53	H	CF ₃	H	H	SO ₂ CF ₃	-NMe-	N	2
54	H	CF ₃	H	H	CF(CF ₃) ₂	-NH-	N	0
55	H	Br	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0
56	H	Br	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
57	H	Br	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
58	H	2-pyrimidyl	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
59	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NH-	N	0
60	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NH-	N	2
61	H	H	H	H	CF ₃	-NH-	N	0
62	H	H	H	H	CF ₃	-NH-	N	2
63	H	OCF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
64	H	OCF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
65	H	OCF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0

[0119]

表 3

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A ¹	A ²	n
66	H	H	H	H	CHFCF ₃	-NMe-	N	0
67	H	H	H	H	CHFCF ₃	-NMe-	N	1
68	H	H	H	H	CHFCF ₃	-NMe-	N	2
69	Cl	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	0
70	Cl	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	1
71	H	H	Cl	H	CF ₃	-NMe-	N	0
72	H	H	Cl	H	CF ₃	-NMe-	N	1
73	H	H	Cl	H	CF ₃	-NMe-	N	2
74	F	H	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0
75	F	H	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
76	F	H	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
77	H	H	H	F	CF ₃	-NMe-	N	0
78	H	H	H	F	CF ₃	-NMe-	N	1
79	H	H	H	F	CF ₃	-NMe-	N	2
80	H	CH ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0
81	H	CH ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
82	H	CH ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
83	H	CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	0
84	H	CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	1
85	H	CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
86	H	H	H	H	SEt	-NMe-	N	0
87	H	H	H	H	SO ₂ Et	-NMe-	N	2
88	H	H	H	H	SiPr	-NMe-	N	0
89	H	H	H	H	SO ₂ iPr	-NMe-	N	2
90	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	0

[0120]

表 4

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A ¹	A ²	n
91	H	Cl	H	H	CF ₃	S	N	2
92	H	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	-NMe-	=CH-	0
93	H	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	-NMe-	=CH-	1
94	H	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	-NMe-	=CH-	2
95	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	2
96	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	=CH-	0
97	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	=CH-	1
98	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	=CH-	2
99	H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	0
100	H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	1
101	H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	2
102	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	S	N	0
103	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	S	N	0
104	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	S	N	2
105	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	S	N	2
106	H	H	H	Cl	CF ₃	S	N	0
107	H	H	H	Cl	CF ₃	S	N	2
108	H	C ₂ H ₅	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
109	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
110	H	H	H	H	CF ₃	-NH-	N	1
111	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NEt-	N	2
112	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	=CH-	0
113	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	=CH-	1
114	H	CF ₃	H	H	CF ₃	-NMe-	=CH-	2
115	H	2-pyridyl	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
116	H	iPr	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
117	H	CF ₂ H	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
118	H	OCF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	0
119	H	OCF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	1
120	H	OCF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	N	2
121	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	=CH-	0
122	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	=CH-	1
123	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	-NMe-	=CH-	2
124	H	4-trifluoromethyl-2-pyridyl	H	H	CF ₃	-NMe-	N	2
125	H	OCF ₃	H	H	SCF ₃	-NMe-	N	0
126	H	OCF ₃	H	H	SCF ₃	-NMe-	N	1
127	H	OCF ₃	H	H	SCF ₃	-NMe-	N	2

[表4] (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A ¹	A ²	n
128	H	CF ₃	H	H	SCF ₃	O	=CH-	2
129	H	CF ₃	H	H	SOCF ₃	O	=CH-	2
130	H	CF ₃	H	H	CF ₃	O	=CH-	2
131	H	H	H	H	SOCF ₃	O	=CH-	2

[0121]

(上記の〔表1〕～〔表4〕において、Meはメチル基を表し、Etはエチル基を表し、iPrはイソプロピル基を表し、CycPrはシクロプロピル基を表す。)

[0122]

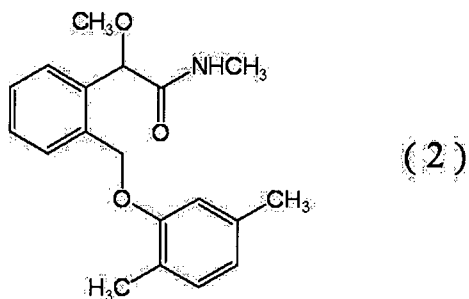
本発明に用いられるテブコナゾール、メトコナゾール、ジフェノコナゾール、トリチコナゾール、イマザリル、トリアジメノール、フルキンコナゾール、プロクロラズ、プロチオコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾールM、シプロコナゾール、テトラコナゾール、イプロコナゾール、トリホリン、ピリフェノックス、フェナリモル、ヌアリモール、オキシポコナゾールフマル酸塩、ペフラゾエート、トリフルミゾール、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、マイクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、シメコナゾール及びトリアジメホンのアゾールは公知の化合物であり、例えば「The Pesticide Manual-15th edition (BCPC刊); ISBN 978-1-901396-18-8」の1072、749、354、1182、629、1147、543、928、965、384、384、287、1096、663、1177、1255、465、1250、854、868、1171、52、116、134、429、468、554、560、611、643、801、869、952、1033及び1145ページに記載されている。これらの化合物は市販の製剤から得るか、公知の方法により製造することにより得られる。

[0123]

本発明に用いられるクレソキシムメチル、アゾキシストロビン、ピラクロストロビン、ピコキシストロビン、エネストロビン、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、フルオキサストロビン、オリサストロビン、ファモキサドン、フェナミドン及びメトミノストロビンのストロビルリンは公知の化合物であり、例えば「The Pesticide Manual-15th edition (BCPC刊); ISBN 978-1-901396-18-8」の688、62、971、910、1068、1167、383、538、840、458、462及び783ページに記載されている。これらの化合物は、市販の製剤から得るか、公知の方法により製造することができる。

本発明に用いられる式(2)で示される化合物は、公知のストロビルリン化合物であり、例えば、国際公開第95/27693号パンフレットに記載された化合物であり、当該公報に記載の方法で製造することができる。

式(2)



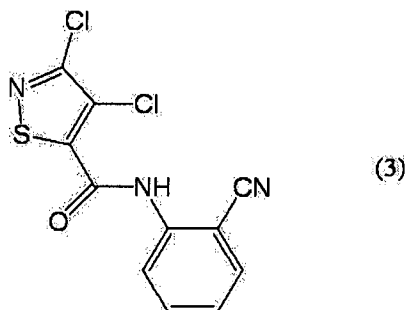
[0124]

本発明に用いられるメタラキシル、メタラキシル-M、フララキシル-M、ベナラキシル、ベナラキシル-M、オフレース及びオキサジキシルのフェニルアミドは公知の化合物であり、
 5 例えば「The Pesticide Manual-15th edition (BCPC刊); ISBN 978-1-901396-18-8」の737、739、579、74、76、834及び847ページに記載されている。これらの化合物は市販の製剤から得るか、公知の方法により製造することにより得られる。

[0125]

10 本発明に用いられるプロベナゾール、チアジニル、トリシクラゾール、ピロキロン、カスガマイシン塩酸塩及びフェリムゾンのイネいもち病防除化合物はいずれも公知の化合物であり、例えば「The Pesticide Manual-15th edition (BCPC刊); ISBN 978-1-901396-18-8」の927、1134、1163、999、685及び497ページ等に記載されている。これらの化合物は市販の製剤
 15 から得るか、公知の方法により製造することにより得られる。

本発明に用いられるイソチアニルは下記式(3)で示される公知の化合物であり、例えば国際公開第99/024413号パンフレットに記載された方法で製造することができる。
 式(3)

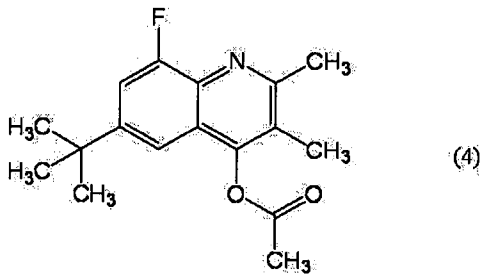


20

本発明に用いられるフサライドは公知の化合物であり、例えば「SHIBUYA INDEX (Index of Pesticides) 13th Edition 2008 (SHIBUYA INDEX RESEARCH GROUP刊) ISBN 9784881371435」の147ページに記載されている。

25 本発明に用いられるテブフロキンは下記式(4)で示される公知の化合物であり、例えば国際公開第2001/092231号パンフレットに記載された方法で製造することができる。

式 (4)



[0126]

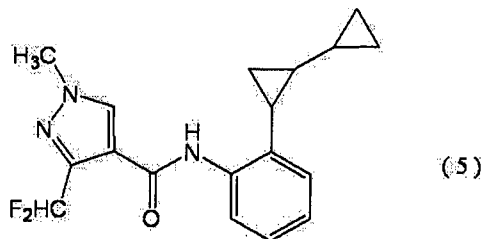
本発明に用いられるペンシクロン、フラメトピル及びバリダマイシンのイネ紋枯病防除化合物はいずれも公知の化合物であり、例えば「The Pesticide Manual-15th edition (BCPC刊); ISBN 978-1-901396-18-8」の871、580及び1187ページ等に記載されている。これらの化合物は市販の製剤から得るか、公知の方法により製造することにより得られる。

[0127]

10 本発明に用いられるカルボキシシン、フルトラニル、ペンチオピラド及びフルオピラムのカルボキサミドはいずれも公知の化合物であり、例えば「The Pesticide Manual-15th edition (BCPC刊); ISBN 978-1-901396-18-8」の164、559、877及び535ページ等に記載されている。これらの化合物は市販の製剤から得るか、公知の方法により製造することにより得られる。

15 本発明に用いられるセダキサンは、下記式 (5) で示される公知の化合物であり、例えば国際公開第03/74491号パンフレットに記載されている。この化合物は当該公報に記載された方法で製造することにより得ることができる。

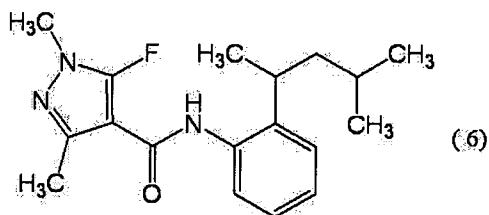
式 (5)



20

本発明に用いられるペンフルフェンは、下記式 (6) で示される公知の化合物であり、例えば国際公開第03/10149号パンフレットに記載されている。この化合物は当該公報に記載された方法で製造することにより得ることができる。

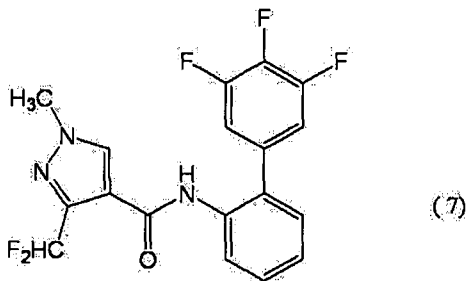
式 (6)



25

本発明に用いられるフルキサピロキサドは、下記式(7)で示される公知の化合物であり、例えば国際公開第06/087343号パンフレットに記載されている。この化合物は当該公報に記載された方法で製造することにより得ることができる。

式(7)



[0128]

本発明に用いられるフルジオキサニル、エタボキサム、トルクロホスメチル及びキャプタンは公知の化合物であり、例えば「The Pesticide Manual・15th edition (BCPC刊); ISBN 978-1-901396-18-8」の520、435、1135及び154ページに記載されている。これらの化合物は市販の製剤から得るか、公知の方法により製造することにより得られる。

10

[0129]

本発明の有害節足動物防除組成物は、本縮合複素環化合物と本殺菌化合物とを単に混合したものでよいが、通常は、本縮合複素環化合物と本殺菌化合物と不活性担体とを混合し、必要に応じて界面活性剤やその他の製剤用補助剤を添加して、油剤、乳剤、フロアブル剤、水和剤、顆粒水和剤、粉剤、粒剤等に製剤化されたものが用いられる。

15

また、前記の製剤化された有害節足動物防除組成物は、そのまま又はその他の不活性成分を添加して有害節足動物防除剤として使用することができる。

本発明の有害節足動物防除組成物における、本縮合複素環化合物と本殺菌化合物の合計量は、通常0.1%~100重量%、好ましくは0.2~90重量%、より好ましくは1~80重量%の範囲である。

20

[0130]

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

25

30

[0131]

液体担体としては、例えば水、アルコール類(メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、フェノキシエタノール等)、ケトン類(アセトン、メチルエチルケトン、

シクロヘキサノン等)、芳香族炭化水素類 (トルエン、キシレン、エチルベンゼン、ドデシルベンゼン、フェニルキシリルエタン、メチルナフタレン等)、脂肪族炭化水素類 (ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等)、エステル類 (酢酸エチル、酢酸ブチル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸エチル、アジピン酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソブチル、
 5 プロピレングリコールモノメチルエーテルアセテート等)、ニトリル類 (アセトニトリル、イソブチロニトリル等)、エーテル類 (ジイソプロピルエーテル、1, 4-ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、3-メトキシ-3-メチル-1-ブタノール等)、酸アミ
 10 ド類 (N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等)、ハロゲン化炭化水素類 (ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等)、スルホキシド類 (ジメチルスルホキシド等)、炭酸プロピレン及び植物油 (大豆油、綿実油等) が挙げられる。

[0132]

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

[0133]

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

[0134]

本発明の有害節足動物防除組成物における、本縮合複素環化合物と本殺菌化合物との含有割合は、特に限定されるものではないが、本縮合複素環化合物1000重量部に対して、本殺菌化合物が、通常0.1~100000重量部、好ましくは1~10000重量部である。
 30 即ち、本縮合複素環化合物と本殺菌化合物との含有量の比は、通常、重量比で10000:1~1:100であり、特に1000:1~1:10である。

[0135]

本発明の有害節足動物防除組成物の有効量を、植物又は植物を栽培する土壤に施用することにより有害節足動物を防除することができる。

35 [0136]

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

[0137]

半翅目害虫: ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイ

5 ロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) 等のウンカ類、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、タイワソツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*) 等のヨコバイ類、
 10 ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、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*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*) 等のアブラムシ類、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavetus*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*) 等のカメムシ類、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*) 等のコナジラミ類。

[0138]

20 鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、サンカメイガ (*Tryporyza incertulas*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ワタノメイガ (*Notarcha derogata*)、ノシメダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*) 等のメイガ類、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 (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、タマナギンウワバ (*Plusia nigrisigna*)、トリコプルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、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*)、コドリリング (*Cydia pomonella*) 等のハマキガ類、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoneella*) のホソガ類、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*) 等のシ

ンクイガ類、リオネティア属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユープロクティス属等の
ドクガ類、コナガ (*Plutella xylostella*) 等のスガ類、ワタアカミム
シ (*Pectinophora gossypiella*) ジャガイモガ (*Phthorima*
maea operculella) 等のキバガ類、アメリカシロヒトリ (*Hyphan-*
tria cunea) 等のヒトリガ類、およびイガ (*Tinea translucens*)。 5

[0139]

アザミウマ目害虫: ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occide-*
ntalis)、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*) 10
等のアザミウマ類。

[0140]

双翅目害虫: タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia an-*
tiqua) 等のハナバエ類、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、イ
ネヒメハモグリバエ (*Hydrellia griseola*)、トマトハモグリバエ、(*L-*
iriomyza sativae)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trif-*
olii)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*) 等のハモグ
リバエ類、イネキモグリバエ (*Chlorops oryzae*) 等のキモグリバエ類、ウ
リミバエ (*Dacus cucurbitae*)、チチュウカイミバエ (*Ceratiti-*
s capitata) 等のミバエ類、ショウジョウバエ類。 20

[0141]

鞘翅目害虫: ウェスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera*
virgifera)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undeci-*
mpunctata howardi) 等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ (*A-*
nomala cuprea)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マ
メコガネ (*Popillia japonica*) 等のコガネムシ類、メイヅウィービル (*S-*
itophilus zeamais)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus*
oryzophilus)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、
ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、シバオサゾウムシ (*Sphe-*
nophorus venatus) 等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ (*T-*
enebrio molitor)、コクヌストモドキ (*Tribolium casta-*
neum) 等のゴミムシダマシ類、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、ウ
リハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyl-*
lotreta striolata)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa d-*
ecemlineata) 等のハムシ類、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna v-*
igintioctopunctata) 等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ (*Lyc-*
tus brunne-
s)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*) 等のキクイムシ類、ナガ
シンクイムシ類、ヒョウホンムシ類、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora mal* 35

a s i a c a) 等のカミキリムシ類、コメツキムシ類 (A g r i o t e s s p p .)、およびアオバアリガタハネカクシ (P a e d e r u s f u s c i p e s)。

[0 1 4 2]

5 本発明の有害節足動物防除剤を用いる場合、その施用量は1 0 0 0 0 m²あたりの本縮合複素環化合物量で通常1 ~ 1 0 0 0 0 gである。本発明の有害節足動物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常、有効成分濃度が0. 0 1 ~ 1 0 0 0 0 p p mとなるように水で希釈して施用し、粒剤、粉剤等は、通常、そのまま施用する。

[0 1 4 3]

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

[0 1 4 4]

本発明の有害節足動物防除剤は、下記「作物」が栽培されている農地で使用することができる。

- 15 農作物：トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等。
- 野菜；ナス科野菜（ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス）、セリ科野菜（ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等）、アカザ科野菜（ハウレンソウ、フダンソウ等）、シソ科野菜（シソ、ミント、バジル等）、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等。
- 20 果樹：仁果類（リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等）、液果類（ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等）、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ、アブラヤシ等。
- 30 果樹以外の樹木：チャ、クワ、花木類（サツキ、ツバキ、アジサイ、サザンカ、シキミ、サクラ、ユリノキ、サルスベリ、キンモクセイ等）、街路樹（トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチョウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ、ニレ、トチノキ等）、サンゴジュ、イヌマキ、スギ、ヒノキ、クロトン、マサキ、カナメモチ、等。
- 35 芝生：シバ類（ノシバ、コウライシバ等）、バミューダグラス類（ギョウギシバ等）、ベントグラス類（コヌカグサ、ハイコヌカグサ、イトコヌカグサ等）、ブルーグラス類（ナガハグサ、オオスズメノカタビラ等）、フェスク類（オニウシノケグサ、イトウシノケグサ、ハイウシノケグサ等）、ライグラス類（ネズミムギ、ホソムギ等）、カモガヤ、オオアワガエリ等。

その他：花卉類（バラ、カーネーション、キク、トルコギキョウ、カスミソウ、ガーベラ、マリーゴールド、サルビア、ペチュニア、バーベナ、チューリップ、アスター、リンドウ、ユリ、パンジー、シクラメン、ラン、スズラン、ラベンダー、ストック、ハボタン、プリムラ、ポインセチア、グラジオラス、カトレア、デージー、シンビジューム、ベゴニア等）、
5 観葉植物等。

[0145]

「作物」には、遺伝子組換え作物も含まれる。

[実施例]

[0146]

10 以下、本発明を製造例、参考製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

まず、本縮合複素環化合物の製造について、製造例を示す。

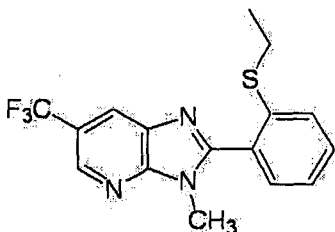
[0147]

15 以下、本縮合複素環化合物の製造例を示すが、本縮合複素環化合物はこれらの例のみに限定されるものではない。

[0148]

製造例 1

20 N2-メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン 1.0 g、2-エチルスルファニルベンズアルデヒド 0.96 g、亜硫酸水素ナトリウム 1.80 g 及び DMF 10 ml の混合物を、160°C で 5 時間加熱攪拌した。反応混合物を氷冷し、水を添加し析出した結晶をろ取り、水、次いでヘキサンで洗浄した。得られた結晶を、減圧下乾燥し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本縮合複素環化合物 1 と記す。） 1.09 g を得た。
本縮合複素環化合物 1



1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.72-8.70 (1H, m), 8.33-8.31 (1H, m), 7.56-7.49 (2H, m), 7.47-7.43 (1H, m), 7.39-7.34 (1H, m), 3.77 (3H, s), 2.87 (2H, q), 1.24 (3H, t)

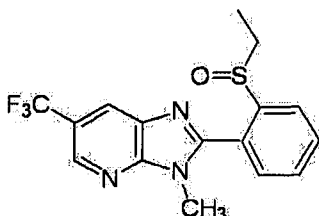
30 [0149]

製造例 2

35 2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 0.25 g、過ヨウ素酸ナトリウム 0.24 g、メタノール 6 ml、水 2 ml 及び THF 0.8 ml の混合物を室温で 20 分間攪拌した後、50°C まで昇温し、さらに 1.5 時間加熱攪拌した。氷冷した反応混合物に、水を添加した後、析

出した結晶をろ取した。ろ取した結晶を酢酸エチルに溶解し、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をヘキサンで洗浄し、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物2と記す。) 0.20gを得た。

本縮合複素環化合物2



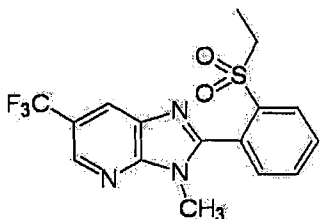
1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.76-8.74 (1H, m), 8.32-8.30 (1H, m), 8.27-8.24 (1H, m), 7.86-7.81 (1H, m), 7.72-7.68 (1H, m), 7.62-7.59 (1H, m), 3.89 (3H, s), 3.42-3.31 (1H, m), 3.02-2.92 (1H, m), 1.31 (3H, t)

[0150]

製造例3

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン0.25g及びクロロホルム3mlの混合物に、氷冷下3-クロロ過安息香酸(純度65%以上)0.43gを加えた後、室温まで昇温し、1時間攪拌した。氷冷下、反応混合物にクロロホルムを加えた後、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、次いで飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた結晶をヘキサン、次いでメチルtert-ブチルエーテルで洗浄し、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物3と記す。) 0.27gを得た。

本縮合複素環化合物3



25

1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.75-8.73 (1H, m), 8.29-8.27 (1H, m), 8.25-8.21 (1H, m), 7.87-7.79 (2H, m), 7.58-7.55 (1H, m), 3.72 (3H, s), 3.42 (2H, q), 1.26 (3H, t)

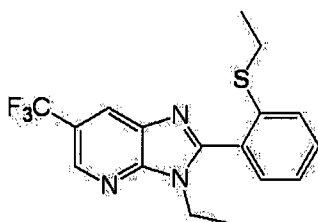
30 [0151]

製造例4

N2-エチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2, 3-ジアミン700mg、2-エチルスルファニル安息香酸690mg及びピリジン20mlの混合物に、室温下、WSC720mgを加え、95℃に昇温した後に10時間加熱撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に、飽和炭酸ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。

得られた残渣をキシレン20mlに溶解し、p-トルエンスルホン酸一水和物1.6gを加えた。この混合物を170℃まで昇温し、9.5時間加熱撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-エチル-2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物4と記す。)295mgを得た。

本縮合複素環化合物4



15

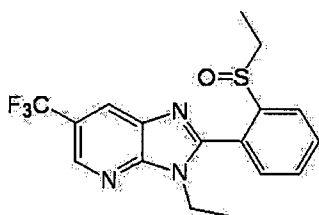
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.70 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.60-7.30 (4H, m), 4.25 (2H, q), 2.89 (2H, q), 1.35-1.30 (3H, m), 1.27-1.21 (3H, m)

[0152]

20 製造例5及び6

2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて3-エチル-2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用いて、製造例32及び33記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-3-エチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物5と記す。)140mg、及び2-(2-エチルスルホニルフェニル)-3-エチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物6と記す。)60mgを得た。

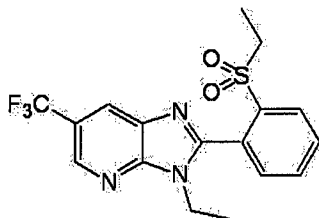
本縮合複素環化合物5



30

¹H-NMR (CDC 13) δ: 8.75 (1H, d), 8.31 (1H, d), 8.24 (1H, dd), 7.84 (1H, dt), 7.70 (1H, dt), 7.58 (1H, dd), 4.35 (2H, q), 3.43-3.30 (1H, m), 3.06-2.94 (1H, m), 1.41 (3H, t), 1.30 (3H, t)

5 本縮合複素環化合物6



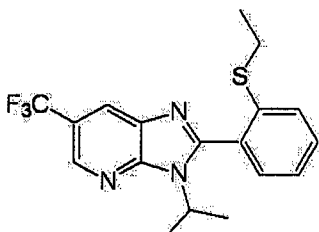
¹H-NMR (CDC 13) δ: 8.71 (1H, d), 8.32 (1H, d), 7.56-7.47 (2H, m), 7.43 (1H, dd), 7.39-7.31 (1H, m), 4.25 (2H, q), 2.89 (2H, q), 1.32 (3H, t), 1.25 (3H, t)

[0153]

製造例7

N2-エチル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2,3-ジアミンに代えてN2-イソプロピル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2,3-ジアミンを用い、製造例4記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-イソプロピル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物7と記す。) 130mgを得た。

本縮合複素環化合物7



20

¹H-NMR (CDC 13) δ: 8.68 (1H, d), 8.28 (1H, d), 7.55-7.47 (2H, m), 7.39-7.31 (2H, m), 4.40-4.33 (1H, m), 2.91 (2H, q), 1.77-1.66 (6H, m), 1.25 (3H, t)

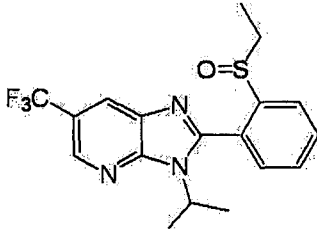
25 [0154]

製造例8および9

2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-イソプロピル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用い、製造例32及び33記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-3-イソプロピル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]

ピリジン（以下、本縮合複素環化合物 8 と記す。） 60 mg、及び 2-（2-エチルスルホニルフェニル）-3-イソプロピル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本縮合複素環化合物 9 と記す。） 55 mg を得た。

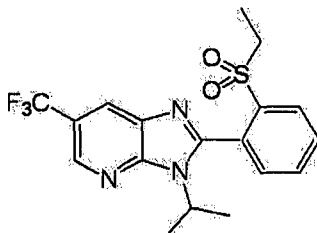
本縮合複素環化合物 8



1H-NMR (CDC13) δ : 8.73 (1H, d), 8.28 (1H, d), 8.22 (1H, dd), 7.83 (1H, td), 7.69 (1H, td), 7.50 (1H, dd), 4.60-4.48 (1H, m), 3.38-3.26 (1H, m), 3.05-2.95 (1H, m), 1.77-1.71 (6H, m), 1.27 (3H, t)

10

本縮合複素環化合物 9



1H-NMR (CDC13) δ : 8.71 (1H, d), 8.24-8.22 (2H, m), 7.85-7.78 (2H, m), 7.55-7.52 (1H, m), 4.33-4.26 (1H, m), 3.72-3.62 (1H, m), 3.44-3.34 (1H, m), 1.77-1.69 (6H, m), 1.28 (3H, t)

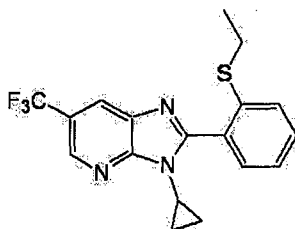
15

[0155]

製造例 10

20 N2-エチル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2,3-ジアミンに代えて N2-シクロプロピル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2,3-ジアミンを用い、製造例 4 記載の方法に準じて、3-シクロプロピル-2-（2-エチルスルファニルフェニル）-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本縮合複素環化合物 10 と記す。） 280 mg を得た。

25 本縮合複素環化合物 10



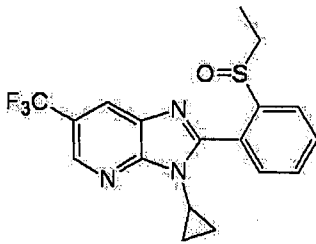
$^1\text{H-NMR}$ (CDC 13) δ : 8.74 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.53–7.47 (3H, m), 7.39–7.31 (1H, m), 3.55–3.49 (1H, m), 2.90 (2H, q), 1.25 (3H, t), 1.01–0.94 (2H, m), 0.93–0.86 (2H, m)

5 [0156]

製造例11および12

2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて3-シクロプロピル-2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用い、製造例32及び33記載の方法に準じて、3-シクロプロピル-2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物11と記す。) 114mg、及び3-シクロプロピル-2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物12と記す。) 109mgを得た。

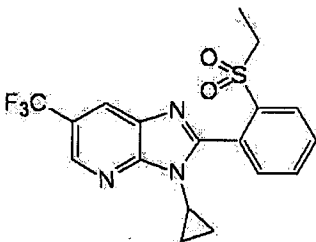
15 本縮合複素環化合物11



$^1\text{H-NMR}$ (CDC 13) δ : 8.77 (1H, d), 8.29–8.26 (2H, m), 7.85–7.79 (2H, m), 7.72–7.67 (1H, m), 3.57–3.51 (1H, m), 3.49–3.39 (1H, m), 3.09–2.95 (1H, m), 1.34 (3H, t), 1.29–1.16 (1H, m), 1.09–0.92 (2H, m), 0.80–0.65 (1H, m)

20

本縮合複素環化合物12



25

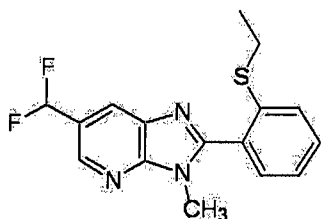
$^1\text{H-NMR}$ (CDC 13) δ : 8.76 (1H, s), 8.27–8.22 (2H, m), 7.87–7.78 (2H, m), 7.65 (1H, dd), 3.60 (2H, brs), 3.39–3.33 (1H, m), 1.29 (3H, t), 1.11–1.11 (2H, m), 0.93 (2H, brs).

30 [0157]

製造例13

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-6-カルバルデヒド 122 mg、クロロホルム 3 ml の混合物に、氷冷下、ビス(2-メトキシエチル)アミノサルファトリフルオリド 700 μ l を加えた。室温まで昇温し、3時間攪拌した。反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルム及び酢酸エチルで順次抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、6-ジフルオロメチル-2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 13 と記す。) 49 mg を得た。

本縮合複素環化合物 13



10

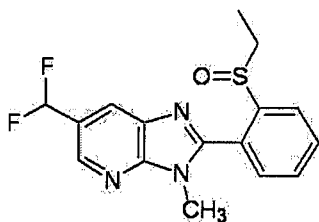
$^1\text{H-NMR}$ (CDC 13) δ : 8.59 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.56-7.43 (3H, m), 7.38-7.33 (1H, m), 6.88 (1H, t), 3.77 (3H, s), 2.87 (2H, q), 1.23 (3H, t)

15 [0158]

製造例 14 および 15

2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて 6-ジフルオロメチル-2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用い、製造例 32 及び 33 記載の方法に準じて、6-ジフルオロメチル-2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 14 と記す。) 110 mg 及び 6-ジフルオロメチル-2-(2-エチルスルホニルフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 15 と記す。) 101 mg を得た。

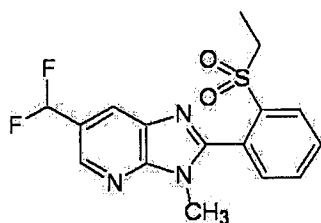
25 本縮合複素環化合物 14



$^1\text{H-NMR}$ (CDC 13) δ : 8.62 (1H, s), 8.26-8.23 (2H, m), 7.83 (1H, td), 7.70 (1H, td), 7.62 (1H, dd), 6.90 (1H, t), 3.89 (3H, s), 3.42-3.32 (1H, m), 3.02-2.92 (1H, m), 1.30 (3H, t)

30

本縮合複素環化合物 1 5



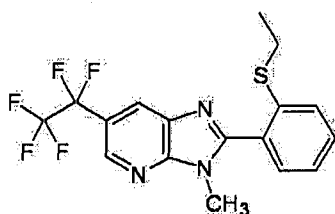
1H-NMR (CDC13) δ : 8.61 (1H, s), 8.24–8.19 (2H, m), 7.87–7.78 (2H, m), 7.58 (1H, dd), 6.89 (1H, t), 3.71 (3H, s), 3.43 (2H, q), 1.25 (3H, t)

[0159]

製造例 1 6

6-ブロモ-2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 500mg、NMP 24ml、キシレン 10ml、ヨウ化銅 1.1g 及びペンタフルオロプロピオン酸ナトリウム 1.1g の混合物を 170°C に加熱し、3日間加熱攪拌した。室温まで冷却した反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 16 と記す。) 43mg を得た。

本縮合複素環化合物 1 6



1H-NMR (CDC13) δ : 8.66 (1H, d), 8.30 (1H, d), 7.56–7.49 (2H, m), 7.47–7.43 (1H, m), 7.38–7.34 (1H, m), 3.78 (3H, s), 2.88 (2H, q), 1.24 (3H, t)

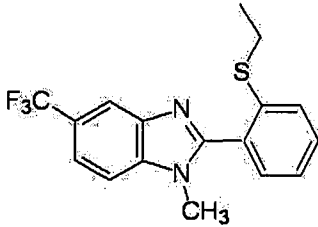
[0160]

製造例 1 7

2-エチルスルファニル-N-(2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルフェニル)-ベンズアミド 1.64g、p-トルエンスルホン酸一水和物 1.76g 及びキシレン 50ml の混合物を 150°C で 1時間、加熱還流下攪拌した。室温まで冷却した反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール

(以下、本縮合複素環化合物 17 と記す。) 1.40 g を得た。

本縮合複素環化合物 17



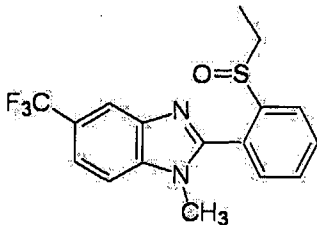
- 5 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.12–8.10 (1H, m), 7.61–7.58 (1H, m), 7.53–7.44 (4H, m), 7.38–7.32 (1H, m), 3.69 (3H, s), 2.84 (2H, q), 1.22 (3H, t)

[0161]

製造例 18

- 10 2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾールを用いて、製造例2記載の方法に準じて2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、本縮合複素環化合物 18 と記す。) 0.30 g を
- 15 得た。

本縮合複素環化合物 18



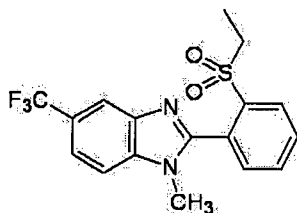
- 20 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.24–8.20 (1H, m), 8.10–8.07 (1H, m), 7.83–7.78 (1H, m), 7.70–7.62 (2H, m), 7.57–7.51 (2H, m), 3.79 (3H, s), 3.36–3.26 (1H, m), 2.98–2.88 (1H, m), 1.26 (3H, t)

[0162]

製造例 19

- 25 2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾールを用いて、製造例3記載の方法に準じて2-(2-エチルスルホニルフェニル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、本縮合複素環化合物 19 と記す。) 0.24 g を得
- 30 た。

本縮合複素環化合物 19



1H-NMR (CDC13) δ : 8.24–8.20 (1H, m), 8.07–8.05 (1H, m), 7.84–7.77 (2H, m), 7.64–7.61 (1H, m), 7.57–7.54 (1H, m), 7.53–7.49 (1H, m), 3.63 (3H, s), 3.46–3.34 (2H, m), 1.23 (3H, t)

[0163]

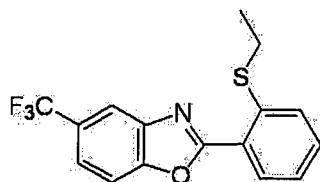
製造例 20

2-アミノ-4-トリフルオロメチルフェノール 0.97 g、2-エチルスルファニル安息香酸 1.10 g、WSC 1.27 g、HOBt 37 mg 及びピリジン 5 ml の混合物を、115°C で 2.5 時間加熱還流下撹拌した。一晩静置した後、再び 115°C で 6 時間加熱還流下撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に、水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。

15 得られた残渣、p-トルエンスルホン酸一水和物 2.09 g 及びキシレン 50 ml の混合物を、153°C で 2 時間加熱還流下撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、10%クエン酸溶液、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラム

20 クロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール (以下、本縮合複素環化合物 20 と記す。) 0.98 g を得た。

本縮合複素環化合物 20



25 1H-NMR (CDC13) δ : 8.19–8.15 (2H, m), 7.71–7.67 (1H, m), 7.66–7.63 (1H, m), 7.52–7.47 (1H, m), 7.45–7.42 (1H, m), 7.31–7.27 (1H, m), 3.06 (2H, q), 1.44 (3H, t)

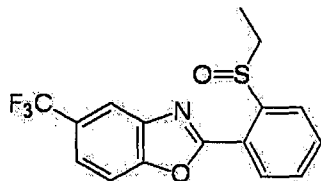
[0164]

30 製造例 21

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンに代えて 2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-

ートリフルオロメチルベンズオキサゾールを用い、製造例2記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール(以下、本縮合複素環化合物21と記す。)0.27gを得た。

本縮合複素環化合物21



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.35-8.30 (2H, m), 8.12-8.10 (1H, m), 7.85-7.79 (1H, m), 7.75-7.66 (3H, m), 3.48-3.38 (1H, m), 3.00-2.90 (1H, m), 1.41 (3H, t)

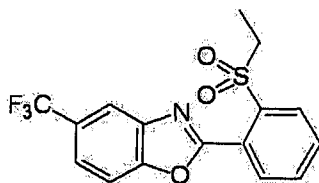
10 [0165]

製造例22

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾールを用い、製造例3記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール(以下、本縮

15

本縮合複素環化合物22



20 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.28-8.24 (1H, m), 8.11-8.09 (1H, m), 7.99-7.95 (1H, m), 7.85-7.77 (2H, m), 7.72-7.70 (2H, m), 3.82 (2H, q), 1.40 (3H, t)

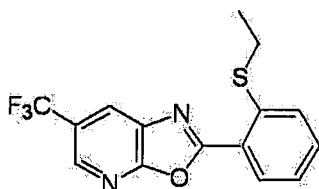
[0166]

製造例23

25 2-エチルスルファニルフェニル-N-(2-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-ベンズアミド0.92g、オキシ塩化リン5mlの混合物を120℃まで昇温し、加熱還流下撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に、一晚静置した。再び120℃まで昇温し、2時間加熱還流下撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に、水を注加し、析出した固体をろ取し、水及びヘキサンで洗浄した後、乾燥させ、2-(2-エチルスル

30

本縮合複素環化合物23



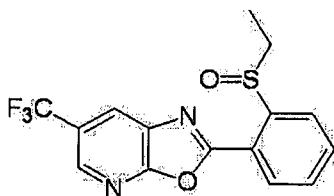
1H-NMR (CDC13) δ : 8.67 (1H, s), 8.40 (1H, s), 8.25 (1H, d), 7.53 (1H, t), 7.45 (1H, d), 7.32 (1H, t), 3.08 (2H, q), 1.45 (3H, t)

[0167]

製造例24

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-トリフルオロメチルオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを用い、製造例2記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-6-トリフルオロメチルオキサゾロ[5,4-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物24と記す。) 0.17gを得た。

本縮合複素環化合物24



15

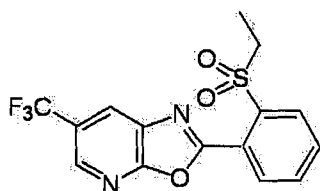
1H-NMR (CDC13) δ : 8.73-8.72 (1H, m), 8.41-8.38 (2H, m), 8.36-8.33 (1H, m), 7.90-7.84 (1H, m), 7.74-7.69 (1H, m), 3.45-3.35 (1H, m), 3.00-2.90 (1H, m), 1.40 (3H, t)

20 [0168]

製造例25

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチルオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを用い、製造例3記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチルオキサゾロ[5,4-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物25と記す。) 0.19gを得た。

本縮合複素環化合物25



30 1H-NMR (CDC13) δ : 8.75-8.73 (1H, m), 8.40-8.37 (1

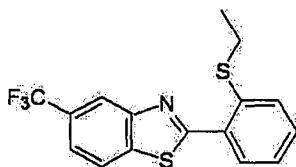
H, m), 8.29–8.26 (1H, m), 8.05–8.02 (1H, m), 7.89–7.81 (2H, m), 3.81 (2H, q), 1.43 (3H, t)

[0169]

製造例 26

- 5 2-アミノ-4-トリフルオロメチルベンゼンチオール塩酸塩 1.08 g、2-エチルスルファニル安息香酸塩化物 1.04 g 及び THF 10 mL の混合物を、室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に炭酸水素ナトリウム 0.43 g を加え、室温で 8 時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-トリフルオロメチル
- 10 ベンゾチアゾール (以下、本縮合複素環化合物 26 と記す。) 0.50 g を得た。

本縮合複素環化合物 26



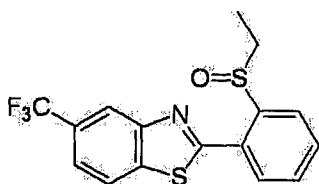
- 15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.41–8.39 (1H, m), 8.06–8.00 (2H, m), 7.66–7.62 (1H, m), 7.55–7.51 (1H, m), 7.48–7.42 (1H, m), 7.37–7.32 (1H, m), 2.96 (2H, q), 1.33 (3H, t)

[0170]

20 製造例 27

- 2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンに代えて 2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンゾチアゾールを用い、製造例 2 記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンゾチアゾール (以下、本縮合
- 25 複素環化合物 27 と記す。) 0.25 g を得た。

本縮合複素環化合物 27



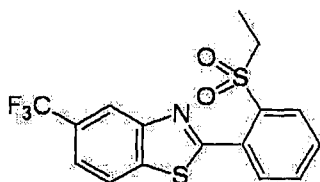
- 30 ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.36–8.32 (1H, m), 8.32–8.30 (1H, m), 8.08–8.05 (1H, m), 7.97–7.94 (1H, m), 7.80–7.75 (1H, m), 7.71–7.68 (1H, m), 7.66–7.61 (1H, m), 3.56–3.45 (1H, m), 3.02–2.93 (1H, m), 1.46 (3H, t)

[0171]

製造例 28

- 2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンゾチアゾールを用い、製造例3記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンゾチアゾール(以下、本縮合複素環化合物28と記す。)0.30gを得た。

本縮合複素環化合物28



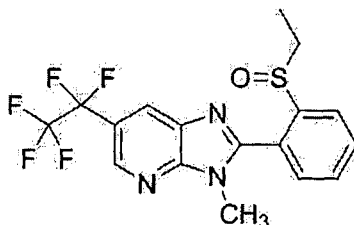
- 10 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.33-8.31 (1H, m), 8.26-8.23 (1H, m), 8.10-8.06 (1H, m), 7.81-7.69 (4H, m), 3.75 (2H, q), 1.36 (3H, t)

[0172]

製造例29及び30

- 15 2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用い、製造例32及び33記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物29と記す。)27mg及び2-(2-エチルスルホニルフェニル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物30と記す。)31mgを得た。

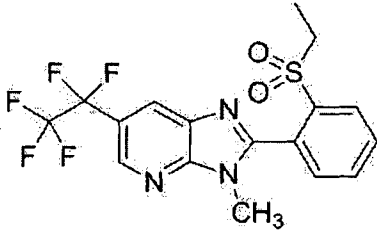
本縮合複素環化合物29



25

- ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.70 (1H, d), 8.29 (1H, d), 8.27 (1H, d), 7.84 (1H, t), 7.71 (1H, t), 7.60 (1H, d), 3.90 (3H, s), 3.43-3.33 (1H, m), 3.04-2.94 (1H, m), 1.31 (3H, t)

30 本縮合複素環化合物30



1H-NMR (CDC13) δ : 8.69 (1H, s), 8.25 (1H, s), 8.23-8.22 (1H, m), 7.88-7.79 (2H, m), 7.59-7.52 (1H, m), 3.72 (3H, s), 3.43 (2H, q), 1.26 (3H, t)

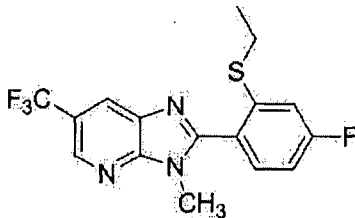
[0173]

製造例31

N2-メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン1.14g、2-エチルスルファニル-4-フルオロ安息香酸1.44g、WSC1.02g及びピリジン12mlの混合物を、120°Cで1.5時間加熱撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に、水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。

得られた残渣にp-トルエンスルホン酸3.42g、キシレン10ml及びNMP2mlを加え、Dean-Stark装置を用いて水を除去しながら150°Cで4.5時間加熱還流下撹拌した。室温まで冷却した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物31と記す。)1.05gを得た。

20 本縮合複素環化合物31



1H-NMR (CDC13) δ : 8.70-8.68 (1H, m), 8.31-8.28 (1H, m), 7.43-7.38 (1H, m), 7.17-7.13 (1H, m), 7.04-6.98 (1H, m), 3.75 (3H, s), 2.89 (2H, q), 1.26 (3H, t)

[0174]

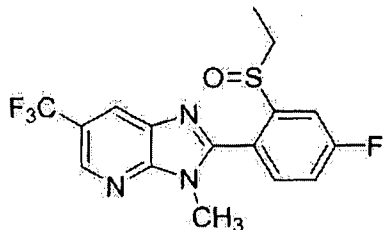
製造例32及び33

2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン0.85g及びクロロホルム12mlの混合物に、氷冷下3-クロロ過安息香酸(純度65%以上)0.81gを添加した後、室温まで昇温し、30分間撹拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ

硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、

- 2-(2-エチルスルホニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物32と記す。) 0.33g、及び2-(2-エチルスルホニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物33と記す。) 0.52gを得た。

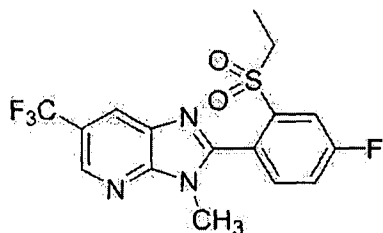
本縮合複素環化合物32



10

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.76-8.75 (1H, m), 8.31-8.30 (1H, m), 8.01-7.98 (1H, m), 7.65-7.61 (1H, m), 7.41-7.36 (1H, m), 3.90 (3H, s), 3.47-3.37 (1H, m), 3.04-2.94 (1H, m), 1.33 (3H, t)

- 15 本縮合複素環化合物33



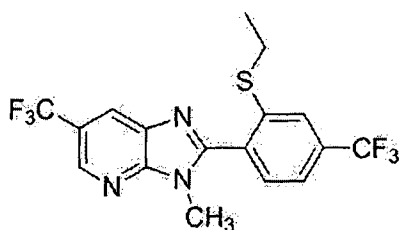
- 20 ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.76-8.74 (1H, m), 8.29-8.27 (1H, m), 7.97-7.94 (1H, m), 7.60-7.51 (2H, m), 3.72 (3H, s), 3.44 (2H, q), 1.28 (3H, t)

[0175]

製造例34

- エチルメルカプタンナトリウム塩(80%) 0.35g及びDMF 9mlの混合物に、氷冷下、2-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン1.0gのDMF溶液を滴下した後、室温まで昇温し、室温で30分間攪拌した。反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物34と記す。) 1.10gを得た。

本縮合複素環化合物 3 4



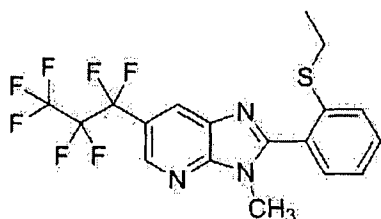
1H-NMR (CDC13) δ : 8.75–8.73 (1H, m), 8.35–8.33 (1
5 H, m), 7.70–7.68 (1H, m), 7.62–7.56 (2H, m), 3.79 (3
H, s), 2.95 (2H, q), 1.28 (3H, t)

[0176]

製造例 3 5

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ
10 [4, 5-b]ピリジン 311 mg、ヨウ化銅 1.5 g、ヘプタフルオロ酪酸ナトリウム 1.
8 g、NMP 5 mL 及びキシレン 25 mL の混合物を、150°C にて 12 時間加熱攪拌した。
室温まで冷却した反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び 28% アンモニア水を
注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで
15 乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-
(2-エチルスルファニルフェニル)-6-ヘプタフルオロプロピル-3-メチル-3H-
イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 3 5 と記す。) 118 mg
を得た。

本縮合複素環化合物 3 5



20

1H-NMR (CDC13) δ : 8.65 (1H, d), 8.29 (1H, d), 7.56–7.
51 (2H, m), 7.48–7.43 (1H, m), 7.38–7.34 (1H, m), 3.
78 (3H, s), 2.89 (2H, q), 1.25 (3H, t)

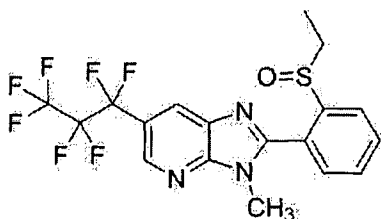
[0177]

25 製造例 3 6 及び 3 7

2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオ
ロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンに代えて 2-(2-エチルスルファニル
20 -フェニル)-6-ヘプタフルオロプロピル-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b]
ピリジンを用い、製造例 3 2 及び 3 3 記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニル
30 -フェニル)-6-ヘプタフルオロプロピル-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b]
ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 3 6 と記す。) 及び 2-(2-エチルスルホニルフェ

ニル) -6-ヘプタフルオロプロピル-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物37と記す。)を得た。

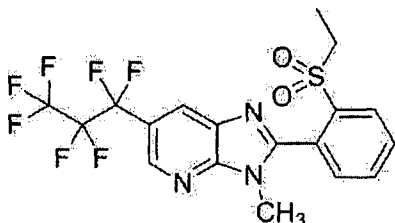
本縮合複素環化合物36



5

$^1\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 8.68 (1H, d), 8.29-8.24 (2H, m), 7.87-7.81 (1H, m), 7.74-7.68 (1H, m), 7.61 (1H, dd), 3.91 (3H, s), 3.43-3.32 (1H, m), 3.05-2.94 (1H, m), 1.31 (3H, t)

10 本縮合複素環化合物37



$^1\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 8.67 (1H, d), 8.26-8.22 (2H, m), 7.87-7.81 (2H, m), 7.59-7.55 (1H, m), 3.73 (3H, s), 3.43 (2H, q), 1.26 (3H, t).

15

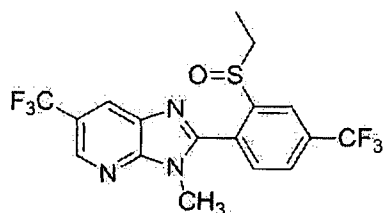
[0178]

製造例38及び39

2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用い、製造例32及び33記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物38と記す。) 0.51g、及び2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物39と記す。) 0.26gを得た。

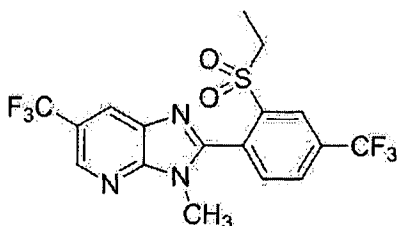
25

本縮合複素環化合物38



5 1H-NMR (CDC13) δ : 8.79–8.78 (1H, m), 8.57–8.55 (1H, m), 8.35–8.34 (1H, m), 7.97–7.94 (1H, m), 7.77 (1H, d), 3.94 (3H, s), 3.53–3.43 (1H, m), 3.07–2.98 (1H, m), 1.36 (3H, t)

本縮合複素環化合物 39



10 1H-NMR (CDC13) δ : 8.78–8.76 (1H, m), 8.51–8.49 (1H, m), 8.31–8.30 (1H, m), 8.12–8.09 (1H, m), 7.74 (1H, d), 3.74 (3H, s), 3.48 (2H, q), 1.29 (3H, t)

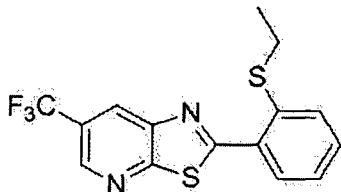
[0179]

製造例 40

15 3-アミノ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-チオール 0.56 g、2-エチルスルファニル安息香酸 0.52 g、WSC 0.80 g、HOBt 39 mg 及びピリジン 6 ml の混合物を、60°C で 2 時間攪拌した。放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。

20 得られた残渣、p-トルエンスルホン酸一水和物 0.65 g 及び N-メチルピロリジノン 5 mL の混合物を、150°C で 2 時間加熱攪拌した。放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 40 と記す。) 0.38 g を得た。

25 本縮合複素環化合物 40



1H-NMR (CDC13) δ : 8.86 (1H, d), 8.57 (1H, d), 8.03 (1

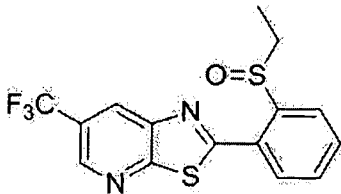
H, d d), 7. 55 (1H, d d), 7. 48 (1H, t d), 7. 36 (1H, t d), 2. 98 (2H, q), 1. 34 (3H, t).

[0180]

製造例41および42

- 5 2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジンを用い、製造例32及び33記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物41と記す。) 10 0.13g、及び2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物42と記す。) 0.14gを得た。

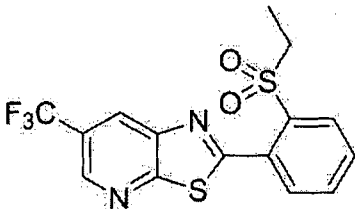
本縮合複素環化合物41



15

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.90 (1H, d), 8.49 (1H, d), 8.37 (1H, d d), 7.99 (1H, d d), 7.81 (1H, t d), 7.67 (1H, t d), 3.52-3.42 (1H, m), 3.01-2.92 (1H, m), 1.45 (3H, t).

本縮合複素環化合物42



20

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.92 (1H, d), 8.52 (1H, d), 8.25 (1H, d d), 7.84-7.71 (3H, m), 3.73 (2H, q), 1.37 (3H, t).

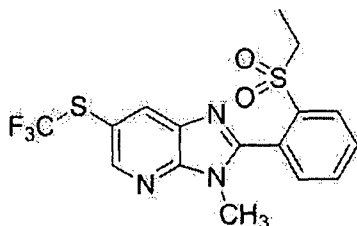
[0181]

25 製造例43および44

- 2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用い、製造例32及び33記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチルスルファニル-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物43と記す。)及び2-(2-エチルスルフィニルフェニル)-6-トリフルオロメチルスルファニル-3-メチル-3H-イ

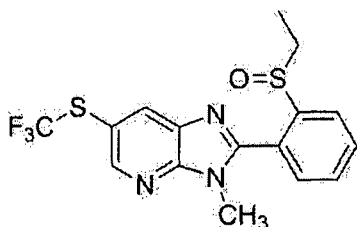
ミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 4 4 と記す。) を得た。

本縮合複素環化合物 4 3



- 5 $^1\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 8.68 (1H, d), 8.36 (1H, d), 8.21 (1H, dd), 7.87–7.77 (2H, m), 7.59 (1H, dd), 3.71 (3H, s), 3.44 (2H, q), 1.24 (3H, t)

本縮合複素環化合物 4 4



10

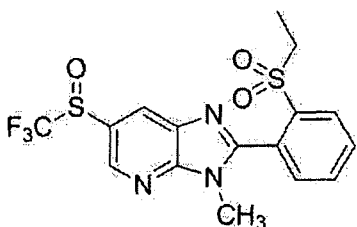
- $^1\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 8.69 (1H, d), 8.38 (1H, d), 8.25 (1H, dd), 7.86–7.80 (1H, m), 7.72–7.67 (1H, m), 7.60 (1H, dd), 3.88 (3H, s), 3.43–3.31 (1H, m), 3.03–2.92 (1H, m), 1.31 (3H, t)

15 [0182]

製造例 4 5 および 4 6

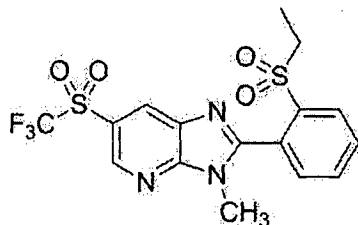
- 2-(2-エチルスルファニル-4-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンに代えて 2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチルスルファニル-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンを用い、製造例 3 2 及び 3 3 記載の方法に準じて、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチルスルフィニル-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 4 5 と記す。) 及び 2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチルスルホニル-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 4 6 と記す。) を得た。

25 本縮合複素環化合物 4 5



¹H-NMR (CDC 13) δ: 8.77 (1H, d), 8.55 (1H, d), 8.24 (1H, dd), 7.90–7.83 (2H, m), 7.61 (1H, dd), 3.75 (3H, s), 3.43 (2H, q), 1.26 (3H, t)

本縮合複素環化合物 46



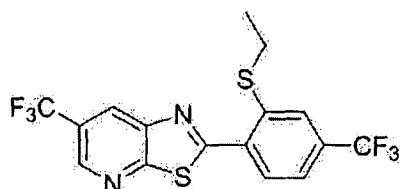
¹H-NMR (CDC 13) δ: 9.05 (1H, d), 8.65 (1H, d), 8.26–8.23 (1H, m), 7.90–7.85 (2H, m), 7.61–7.57 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.41 (2H, q), 1.27 (3H, t)

10 [0183]

製造例 47

2-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン 0.18 g と DMF 2 ml の混合物に、氷冷下、ナトリウムチオメトキシド 63 mg を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-[2-エチルスルファニル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 47 と記す。) 0.11 g を得た。

本縮合複素環化合物 47



¹H-NMR (CDC 13) δ: 8.90 (1H, d), 8.61 (1H, d), 8.14 (1H, d), 7.75 (1H, s), 7.58 (1H, d), 3.04 (2H, q), 1.38 (3H, t).

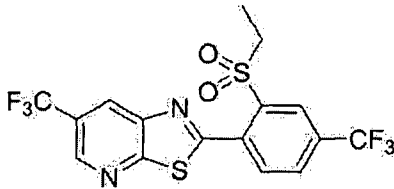
25 [0184]

製造例 48

2-[2-エチルスルファニル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン 0.11 g 及びクロロホルム 3 ml の混合物に、3-クロロ過安息香酸 (純度 65% 以上) 0.13 g を添加した後、室温で 12 時間攪拌した。反応混合物をクロロホルムで希釈し、10%チオ硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-[2-エチルスル

ホニル4-(トリフルオロメチル)フェニル]-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物48と記す。)0.11gを得た。

本縮合複素環化合物48



5

¹H-NMR (CDC13) δ: 8.95 (1H, s), 8.55 (1H, s), 8.52 (1H, s), 8.07 (1H, d), 7.88 (1H, d), 3.77 (2H, q), 1.40 (3H, t).

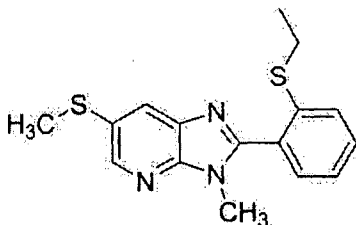
[0185]

10 製造例49

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-6-チオール535mg、ヨードメタン166μL及びエタノール5mLの混合物に、室温下水酸化カリウム200mgを加え5時間攪拌した。この反応混合物に、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-メチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物49と記す。)515mgを得た。

15

本縮合複素環化合物49



20

¹H-NMR (CDC13) δ: 8.46 (1H, d), 8.10 (1H, d), 7.52-7.42 (3H, m), 7.37-7.26 (1H, m), 3.73 (3H, s), 2.86 (2H, q), 2.54 (3H, s), 1.22 (3H, t)

25 [0186]

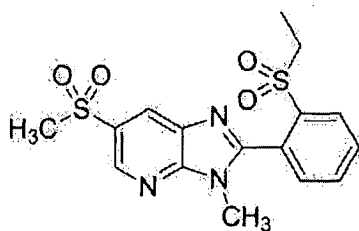
製造例50

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-メチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン363mg、クロロホルム5mLの混合物に、氷冷下69~75%3-クロロ過安息香酸1.13gを加えた。混合物を室温まで昇温し、5時間攪拌した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加注し、クロロホルムで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルホニルフェ

30

ニル) - 6 - メチルスルホニル 3 - メチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 50 と記す。) 356 mg を得た。

本縮合複素環化合物 50



5

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 9.02 (1H, d), 8.58 (1H, d), 8.23 (1H, dd), 7.90-7.81 (2H, m), 7.59 (1H, dd), 3.74 (3H, s), 3.42 (2H, q), 3.19 (3H, s), 1.26 (3H, t).

[0187]

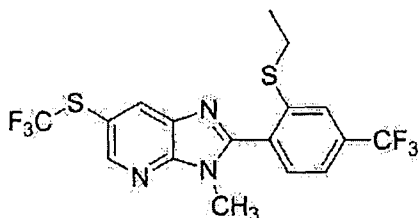
10 製造例 51

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンに代えて 2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンを用い、製造例 103 記載の方法に準じて、化合物 301A を得た。

15 化合物 301A を 0.94 g、DMF 13 ml の混合物を -50°C まで冷却し、CF₃I ガスを過剰量バブリングし、DMF に溶解させた。内温が -40°C を超えない速度でテトラキスジメチルアミノエチレンジアミン 1.2 ml を滴下した。その後、1 時間かけて -10°C まで昇温し、-10°C でさらに 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、室温まで昇温後、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 51 と記す。) 0.68 g を得た。

20

本縮合複素環化合物 51



25

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.66 (1H, d) 8.39 (1H, d), 7.67-7.64 (1H, m), 7.59-7.52 (2H, m), 3.75 (3H, s), 2.94 (2H, q), 1.27 (3H, t).

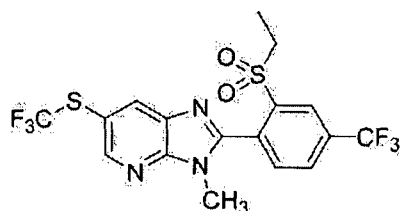
30

[0188]

製造例 52

2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルホニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン及びクロロホルム5mlの混合物に、氷冷下、69%3-クロロ過安息香酸1.05gを加えた後、室温まで昇温し、1.5時間攪拌した。その後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルホニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物52と記す。)0.20gを得た。

10 本縮合複素環化合物52



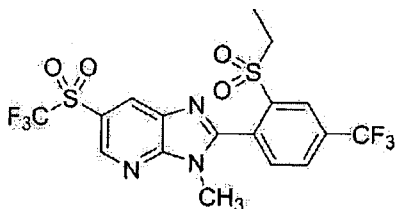
1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.71-8.70 (1H, m), 8.50-8.49 (1H, m), 8.38-8.36 (1H, m), 8.12-8.08 (1H, m), 7.74-7.71 (1H, m), 3.72 (3H, s), 3.49 (2H, q), 1.29 (3H, t).

[0189]

製造例53

2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルフィニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン0.26g、タングステン酸ナトリウム二水和物36mg、30%過酸化水素水1ml及びアセトニトリル5mlの混合物を、加熱還流下4.5時間攪拌した。室温まで冷却した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルホニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物53と記す。)0.24gを得た。

本縮合複素環化合物53



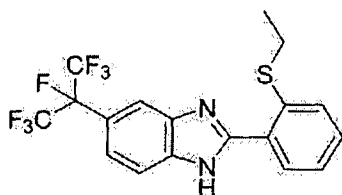
30 1H-NMR (CDCl₃) δ: 9.08-9.07 (1H, m), 8.68-8.66 (1H, m), 8.52-8.50 (1H, m), 8.16-8.12 (1H, m), 7.76-

7. 73 (1H, m), 3. 78 (3H, s), 3. 46 (2H, q), 1. 30 (3H, t)
[0190]

製造例54

4-(1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチル-エチル)-ベンゼン
5-1, 2-ジアミン552mg、2-エチルスルファニル安息香酸401mg、ピリジン27mLの混合物に、室温下1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩422mg、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール27mgを加えた。室温下5時間した後、この反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をDMF7.5mLとトルエン30mLの混合溶液に溶解し、室温下、p-トルエンスルホン酸837mgを加えた。この混合物を130℃にて8時間加熱攪拌した後、室温まで放冷した。この反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-(1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチル-エチル)-1H-ベンゾイミダゾール(以下、本縮合複素環化合物54と記す。)97mgを得た。

本縮合複素環化合物54



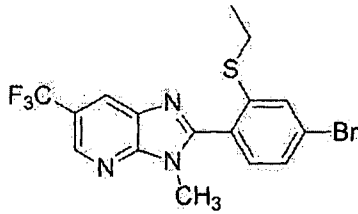
20 1H-NMR (CDCl₃) δ: 12.08-11.87 (1H, m), 8.31 (1H, s), 8.12-7.44 (4H, m), 7.42-7.30 (2H, m), 2.86 (2H, q), 1.22 (3H, t).

[0191]

製造例55

25 エチルメルカプタンナトリウム塩(80%)0.63g及びDMF10mLの混合物に、氷冷下、2-(4-ブromo-2-フルオロフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン2.08gのDMF溶液を滴下した後、室温まで昇温し、30分間攪拌した。反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(4-ブromo-2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物55と記す。)1.57gを得た。

本縮合複素環化合物55



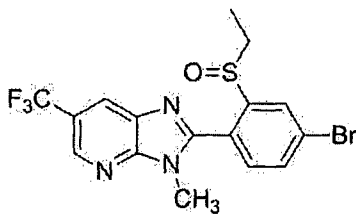
1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.73–8.71 (1H, m), 8.33–8.32 (1H, m), 7.59 (1H, d), 7.50–7.47 (1H, m), 7.30 (1H, d),
5 3.77 (3H, s), 2.91 (2H, q), 1.27 (3H, t).

[0192]

製造例56および57

2-(4-ブロモ-2-エチルスルファニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロ
メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン0.40g及びクロロホルム5mlの混合
10 物に、氷冷下3-クロロ過安息香酸(純度65%以上)0.29gを添加した後、室温まで
昇温し、2時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナ
トリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで
15 乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付
し、2-(4-ブロモ-2-エチルスルフィニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオ
ロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物56と記す。)
0.26g、及び2-(4-ブロモ-2-エチルスルホニルフェニル)-3-メチル-6-
トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物
57と記す。)0.17gを得た。

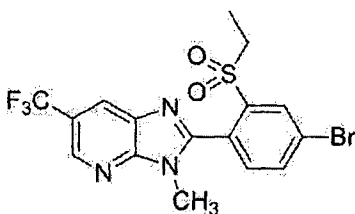
本縮合複素環化合物56



20

1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.77–8.75 (1H, m), 8.39 (1H, d), 8.
32–8.31 (1H, m), 7.84–7.81 (1H, m), 7.49 (1H, d), 3.
91 (3H, s), 3.50–3.40 (1H, m), 3.06–2.96 (1H, m), 1.
25 35 (3H, t).

本縮合複素環化合物57



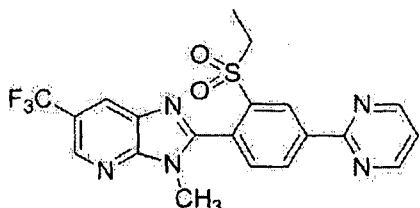
$^1\text{H-NMR}$ (CDC 13) δ : 8.77–8.75 (1H, m), 8.37 (1H, d), 8.31–8.29 (1H, m), 7.99–7.96 (1H, m), 7.44 (1H, d), 3.72 (3H, s), 3.44 (2H, q), 1.28 (3H, t).

5 [0193]

製造例 58

2-(4-ブロモ-2-エチルスルホニルフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 0.20 g、2-トリブチルスタンニルピリミジン 0.17 g、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 27 mg 及びトルエン 5 ml の混合物を、窒素雰囲気下、5.5時間加熱還流した。室温まで冷却した後、2-トリブチルスタンニルピリミジン 0.17 g、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 27 mg を添加し、加熱還流下さらに8時間攪拌した。室温まで冷却した後、水を注加し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-[2-エチルスルホニル-4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル]-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 58 と記す。) 0.20 g を得た。

本縮合複素環化合物 58



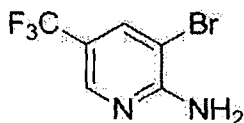
20

$^1\text{H-NMR}$ (CDC 13) δ : 8.77–8.74 (1H, m), 8.38–8.36 (1H, m), 8.30–8.27 (1H, m), 8.00–7.95 (1H, m), 7.63–7.55 (1H, m), 7.43 (1H, d), 7.41–7.30 (2H, m), 3.72 (3H, s), 3.44 (2H, q), 1.28 (3H, t).

25 [0194]

製造例 59-1

5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イルアミン 65 g およびクロロホルム 100 mL 混合物に、氷水冷却下 N-ブロモスクシンイミド 71 g を 5 回に分けて加えた。室温まで昇温し 1 時間攪拌した後に、80°C まで加熱し 30 分間加熱攪拌した。室温まで放冷後、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液および飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、3-ブロモ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イルアミン 96 g を得た。3-ブロモ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イルアミン



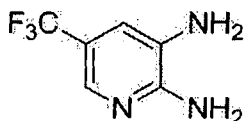
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.27 (1H, d), 7.86 (1H, d), 5.38 (2H, br s).

[0195]

5 製造例59-2

3-ブロモ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イルアミン40g、アセチルアセトン銅(II)2.2g、アセチルアセトン6.6g、炭酸セシウム59g、NMP105mLをオートクレーブ反応装置に加え、氷冷下28%アンモニア水溶液25mLを加えた。密封後、110°Cまで昇温し、12時間加熱攪拌した。室温まで氷冷後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-トリフルオロメチル-ピリジン-2,3-ジアミン15gを得た。

5-トリフルオロメチル-ピリジン-2,3-ジアミン



15

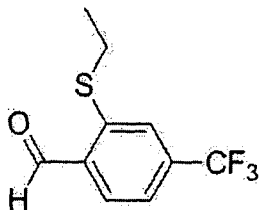
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 7.93 (1H, d), 7.04 (1H, d), 4.71 (2H, br s), 3.46 (2H, br s).

[0196]

製造例59-3

20 2-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド15.1g及びDMF61mLの混合物に、氷冷下ナトリウムエタンチオラート(90%)7.35gを加え、室温で6時間攪拌した。反応混合物を水に注加し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-ホルミル-5-トリフルオロメチルフェニルエチルスルフィド11.8gを得た。

25 2-ホルミル-5-トリフルオロメチルフェニルエチルスルフィド



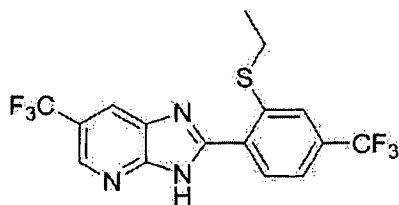
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 10.41 (1H, s), 7.94 (1H, d), 7.63 (1H, s), 7.53 (1H, d), 3.04 (2H, q), 1.41 (3H, t).

30 [0197]

製造例59-4

5-トリフルオロメチル-ピリジン-2,3-ジアミン 8.6 g、2-ホルミル-5-トリフルオロメチルフェニルエチルスルフィド 11 g、および DMF 67 mL の混合物に、室温下にて亜硫酸水素ナトリウム 6.1 g を加えた。100°C にて 3 時間加熱攪拌した後、塩化銅 (I) 二水和物 1 g を加え、さらに 100°C にて 1 時間加熱攪拌した。室温まで放冷後、この反応混合物を水に加え、酢酸エチル抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、黄色い粉末固体を得た。これを熱ヘキサンで洗浄することで 2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4,5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 59 と記す。) 12 g を得た。

10 本縮合複素環化合物 59



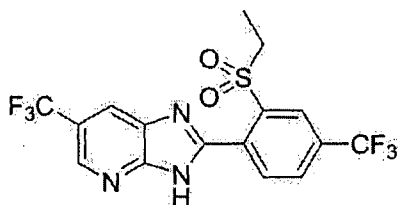
1H-NMR (CDCl₃) δ: 12.79 (1H, br s), 8.72 (1H, br s), 8.49-8.34 (2H, m), 7.79 (1H, s), 7.64 (1H, d), 3.00 (2H, q), 1.31 (3H, t).

[0198]

製造例 60

2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4,5-b] ピリジン 12 g および クロロホルム 111 mL の混合物に、氷冷下 69~75% 3-クロロ過安息香酸 8.0 g を加えた。混合物を室温まで昇温し、0.5 時間攪拌した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4,5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 60 と記す。) 9.1 g を得た。

本縮合複素環化合物 60



1H-NMR (DMSO-d₆) δ: 14.15 (1H, br s), 8.83 (1H, s), 8.58 (1H, s), 8.41 (1H, d), 8.37 (1H, s), 8.19 (1H, d),

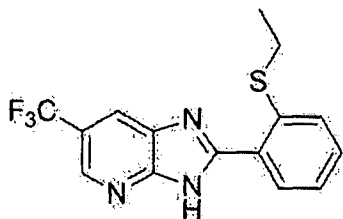
3. 97 (2H, q), 1. 23 (3H, t).

[0199]

製造例61

N-(2-アミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-2-エチルスルファ
 5 ニル-ベンズアミド200mg、tert-ブチルアルコール1ml及びTHF9mlの混
 合物を80℃で加熱攪拌し、ここに、60%水素化ナトリウム(油性)56mgを加えた。
 この混合物を80℃で2時間加熱攪拌した後、60%水素化ナトリウム(油性)56mgを
 加えた。さらに同温で2時間加熱攪拌した後、60%水素化ナトリウム(油性)56mgを
 10 加え、同温で2時間加熱攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、溶媒を留去し、飽和
 塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥さ
 せた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2
 -(2-エチルスルファニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,
 5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物61と記す。)132mgを得た。

本縮合複素環化合物61



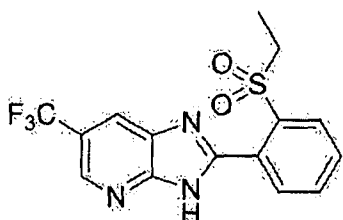
1H-NMR (CDCl₃) δ: 8. 67 (1H, d), 8. 51-8. 48 (1H, m),
 8. 33 (1H, d), 7. 66-7. 61 (1H, m), 7. 51-7. 46 (2H, m),
 2. 93 (2H, q), 1. 27 (3H, t)

20 [0200]

製造例62

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,
 5-b]ピリジン2. 28g及びクロロホルム20mlの混合物に、氷冷下69~75℃
 3-クロロ過安息香酸8. 0gを加えた。混合物を室温まで昇温し、0. 5時間攪拌した後、
 25 飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルム
 で抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣
 をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、得られた結晶をヘキサンで洗浄すること
 により、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダ
 ゴ[4, 5-b]ピリジン(以下、本縮合複素環化合物62と記す。)2. 5gを得た。

30 本縮合複素環化合物62



$^1\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 8.63 (1H, s), 8.35 (1H, s), 8.24 (1H, d), 8.09 (1H, d), 7.83 (1H, t), 7.76 (1H, t), 3.33 (2H, q), 0.88 (3H, t).

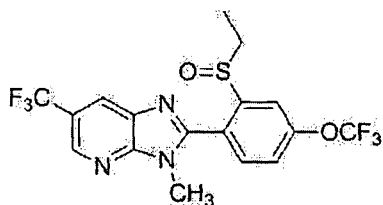
5 [0201]

製造例63および64

エチルメルカプタンナトリウム塩 (80%) 0.31g 及びDMF 9ml の混合物に、氷冷下、2-(2-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 1.02g を添加した後、室温まで昇温し、2時間攪拌した。反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンと 2-(2-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンの混合物 (約 3:1) 0.82g を得た。

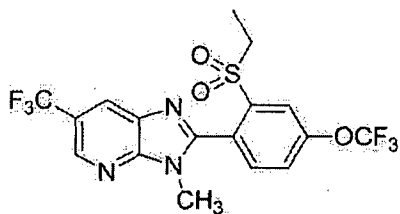
得られた混合物及びクロロホルム 4ml の混合物に、氷冷下 3-クロロ過安息香酸 (純度 65%以上) 0.45g を添加した後、室温まで昇温し、2時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルフィニル-4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 63 と記す。) 0.47g、2-(2-エタンスルフォニル-4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 64 と記す。) 0.14g を得た。

本縮合複素環化合物 63



30 $^1\text{H-NMR}$ (CDC13) δ : 8.78-8.76 (1H, m), 8.33-8.31 (1H, m), 8.14-8.12 (1H, m), 7.68 (1H, d), 7.54-7.50 (1H, m), 3.93 (3H, s), 3.49-3.39 (1H, m), 3.06-2.96 (1H, m), 1.33 (3H, t).

本縮合複素環化合物 64



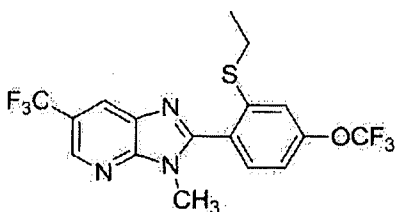
1H-NMR (CDC13) δ : 8.77–8.75 (1H, m), 8.30–8.28 (1H, m), 8.09–8.07 (1H, m), 7.70–7.66 (1H, m), 7.63 (1H, d), 3.74 (3H, s), 3.46 (2H, q), 1.28 (3H, t).

[0202]

製造例65

2-(2-エチルスルフィニル-4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 0.34 g、塩化ジルコニウム 0.36 g、ヨウ化ナトリウム 0.47 g 及びアセトニトリル 8 ml の混合物を 2 時間、加熱還流下撹拌した。室温まで冷却した後、反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメトキシフェニル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本縮合複素環化合物 65 と記す。) 0.29 g を得た。

本縮合複素環化合物 65

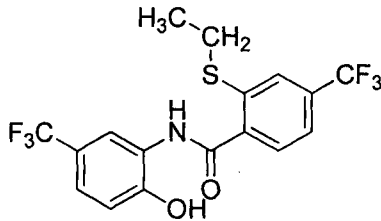


1H-NMR (CDC13) δ : 8.74–8.72 (1H, m), 8.33–8.32 (1H, m), 7.48 (1H, d), 7.29–7.27 (1H, m), 7.21–7.17 (1H, m), 3.79 (3H, s), 2.92 (2H, q), 1.29 (3H, t).

製造例66-1

2-アミノ-4-トリフルオロメチルフェノール 0.50 g、2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチル安息香酸 0.71 g、WSC 0.65 g 及びクロロホルム 6 ml の混合物を、室温で 3 時間半撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和塩水で水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチル-N-[2-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルフェニル]ベンズアミド 0.57 g を得た。

2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチル-N-[2-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルフェニル]ベンズアミド

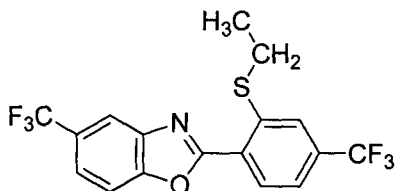


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.33 (1H, br s), 8.87 (1H, s), 8.03 (1H, d), 7.75 (1H, s), 7.62 (1H, d), 7.57 (1H, s), 7.44 (1H, d), 7.14 (1H, d), 3.05 (2H, q), 1.36 (3H, t)

製造例 66-2

2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチル-N-[2-ヒドロキシ-5-トリフルオロメチルフェニル]ベンズアミド 0.56 g、ジ-2-メトキシエチルアゾジカルボキシレート (以下、DMEADと記す) 0.40 g、トリフェニルホスフィン 0.39 g 及び THF 15 ml の混合物を、室温で 30 分間及び 50°C で 1 時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮した後に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和塩水で水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール 0.52 g を得た。

2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール



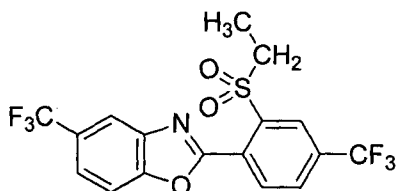
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.29 (1H, d), 8.19 (1H, d), 7.75-7.66 (2H, m), 7.63 (1H, s), 7.51 (1H, dd), 3.10 (2H, q), 1.47 (3H, t).

製造例 66-3

2-(2-エチルスルファニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール 0.35 g 及びクロロホルム 10 ml の混合物に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸 (純度 65% 以上) 0.46 g を添加した後、室温で 1 時間半攪拌した。反応混合物に 10% 亜硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルホニル-4-トリフルオロメチルフェニル)-5-トリフルオロメチルベンズオキサゾール (以下、

本縮合複素環化合物130と記す。) 0.34 gを得た。

本縮合複素環化合物130

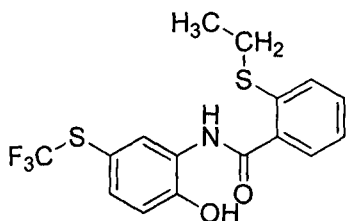


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.54 (1H, s), 8.18–8.12 (2H, m),
 5 8.08 (1H, dd), 7.77–7.74 (2H, m), 3.90 (2H, q), 1.44 (3H, t).

製造例67-1

2-エチルスルファニル安息香酸1.2 g、クロロホルム10 ml及びDMF 0.1 ml
 10 の混合物に、塩化オキサリル1.1 mlを加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、反応混合物にTHF 10 mlを加えた。これを2-アミノ-4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェノール1.38 g及びTHF 15 mlの混合物に氷冷下に加え、室温で2時間攪拌した。反応混合物に水を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、2-エチルスルファニル-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]ベンズアミド1.78 gを得た。

2-エチルスルファニル-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]ベンズアミド

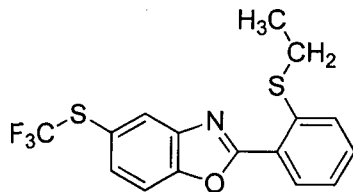


20 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.89 (1H, s), 9.71 (1H, s), 8.05 (1H, dd), 7.58 (1H, dd), 7.51 (1H, ddd), 7.48–7.41 (3H, m), 7.12 (1H, d), 2.99 (2H, q), 1.31 (3H, t).

製造例67-2

25 2-エチルスルファニル-N-[2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル]ベンズアミド1.78 g、DMEAD 1.79 g、トリフェニルホスフィン1.88 g及びTHF 20 mlの混合物を、室温で30分間及び50℃で1時間攪拌した。室温まで放冷した反応混合物を減圧下濃縮した後に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和塩水で水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズオキサゾール1.33 gを得た。

2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズオキサゾール

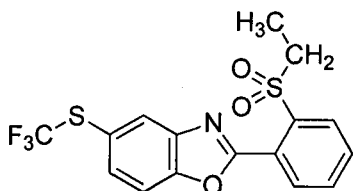


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.21 (1H, d), 8.17 (1H, dd), 7.67 (1H, dd), 7.64 (1H, d), 7.52-7.46 (1H, m), 7.43 (1H, dd), 7.31-7.27 (1H, m), 3.07 (2H, q), 1.45 (3H, t).

製造例 67-3

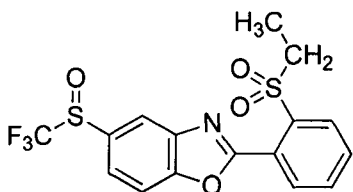
2-(2-エチルスルファニルフェニル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズオキサゾール 1.15 g 及びクロロホルム 25 ml の混合物に、氷冷下、*m*-クロロ過安息香酸 (純度 65% 以上) 2.04 g を添加した後、室温で 1 日間半撹拌した。反応混合物に 10% 亜硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(2-エチルスルホニルフェニル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズオキサゾール (以下、本縮合複素環化合物 131 と記す。) 0.55 g を得た。

2-(2-エチルスルホニルフェニル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズオキサゾール



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.28-8.24 (1H, m), 8.16-8.13 (1H, m), 7.99-7.95 (1H, m), 7.85-7.76 (2H, m), 7.73 (1H, dd), 7.66 (1H, d), 3.83 (2H, q), 1.40 (3H, t).

本縮合複素環化合物 131



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.30-8.25 (2H, m), 8.01-7.97 (1H, m), 7.87-7.79 (4H, m), 3.82 (2H, q), 1.41 (3H, t).

[0203]

以下、表3および表4に記載の本縮合複素環化合物の¹H-NMRデータを示す。

本縮合複素環化合物66

5 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.51 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.55-7.50 (2H, m), 7.47-7.43 (1H, m), 7.38-7.32 (1H, m), 5.81 (1H, dq), 3.76 (3H, s), 2.88 (2H, q), 1.24 (3H, t).

本縮合複素環化合物67

10 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.55 (1H, d), 8.26 (1H, d), 8.21 (1H, d), 7.83 (1H, t), 7.69 (1H, t), 7.60 (1H, d), 5.84 (1H, dq), 3.88 (3H, s), 3.42-3.30 (1H, m), 3.03-2.91 (1H, m), 1.33-1.25 (3H, m).

本縮合複素環化合物68

15 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.53 (1H, s), 8.26-8.16 (2H, m), 7.88-7.78 (2H, m), 7.59-7.53 (1H, m), 5.82 (1H, dq), 3.70 (3H, s), 3.44 (2H, q), 1.26 (3H, t).

本縮合複素環化合物69

20 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.68 (1H, d), 8.29 (1H, d), 7.74-7.68 (1H, m), 7.49-7.40 (2H, m), 3.73 (3H, s), 2.74 (2H, q), 1.06 (3H, t).

本縮合複素環化合物70

¹H-NMR (CDC13) δ: 8.64 (1H, s), 8.24 (1H, s), 7.65 (1H, d), 7.58 (1H, t), 7.39 (1H, d), 3.72 (3H, s), 3.63-3.47 (1H, m), 3.37-3.22 (1H, m), 1.38-1.30 (3H, m).

25 本縮合複素環化合物71

¹H-NMR (CDC13) δ: 8.74-8.72 (1H, m), 8.33-8.32 (1H, m), 7.52-7.49 (1H, m), 7.47-7.43 (2H, m), 3.79 (3H, s), 2.85 (2H, q), 1.23 (3H, t).

本縮合複素環化合物72

30 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.78-8.76 (1H, m), 8.33-8.31 (1H, m), 8.20 (1H, d), 7.81-7.78 (1H, m), 7.60 (1H, d), 3.93 (3H, s), 3.42-3.32 (1H, m), 3.02-2.92 (1H, m), 1.31 (3H, t).

本縮合複素環化合物73

35 ¹H-NMR (CDC13) δ: 8.76-8.75 (1H, m), 8.29-8.28 (1H, m), 8.16 (1H, d), 7.80-7.77 (1H, m), 7.57 (1H, d), 3.75 (3H, s), 3.40 (2H, q), 1.26 (3H, t).

本縮合複素環化合物74

¹H-NMR (CDC13) δ: 8.74-8.72 (1H, m), 8.33-8.31 (1

H, m), 7.51–7.45 (1H, m), 7.36–7.31 (2H, m), 3.75 (3H, s), 2.78 (2H, q), 1.10 (3H, t).

本縮合複素環化合物75

5 1H-NMR (CDC13) δ : 8.73–8.71 (1H, m), 8.29–8.27 (1H, m), 7.70–7.64 (1H, m), 7.44–7.38 (1H, m), 7.33 (1H, d), 3.81 (3H, s), 3.53–3.43 (1H, m), 3.42–3.31 (1H, m), 1.33 (3H, t).

本縮合複素環化合物76

10 1H-NMR (CDC13) δ : 8.73–8.72 (1H, m), 8.28–8.26 (1H, m), 7.84–7.78 (1H, m), 7.55–7.49 (1H, m), 7.38–7.35 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.50–3.34 (2H, m), 1.34 (3H, t).

本縮合複素環化合物77

15 1H-NMR (CDC13) δ : 8.74–8.72 (1H, m), 8.37–8.35 (1H, m), 7.54–7.48 (1H, m), 7.27–7.24 (1H, m), 7.09–7.03 (1H, m), 3.77 (3H, d), 2.93 (2H, q), 1.28 (3H, t).

本縮合複素環化合物78

20 1H-NMR (CDC13) δ : 8.79–8.76 (1H, m), 8.35–8.32 (1H, m), 8.03 (1H, d), 7.87–7.80 (1H, m), 7.43 (1H, t), 3.84 (3H, d), 3.51–3.40 (1H, m), 3.13–3.02 (1H, m), 1.33 (3H, t).

本縮合複素環化合物79

25 1H-NMR (CDC13) δ : 8.77–8.75 (1H, m), 8.32–8.30 (1H, m), 8.07–8.04 (1H, m), 7.86–7.80 (1H, m), 7.62–7.57 (1H, m), 3.76 (3H, s), 3.69–3.58 (1H, m), 3.41–3.31 (1H, m), 1.29 (3H, t).

本縮合複素環化合物80

30 1H-NMR (CDC13) δ : 8.71–8.69 (1H, m), 8.31–8.30 (1H, m), 7.35–7.31 (2H, m), 7.19–7.15 (1H, m), 3.76 (3H, s), 2.85 (2H, q), 2.46 (3H, s), 1.22 (3H, t).

本縮合複素環化合物81

35 1H-NMR (CDC13) δ : 8.74–8.73 (1H, m), 8.30–8.28 (1H, m), 8.06–8.05 (1H, m), 7.49–7.48 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.42–3.32 (1H, m), 3.00–2.90 (1H, m), 2.58 (3H, s), 1.32 (3H, t).

本縮合複素環化合物82

1H-NMR (CDC13) δ : 8.74–8.72 (1H, m), 8.27–8.26 (1H, m), 8.03–8.02 (1H, m), 7.64–7.61 (1H, m), 7.44 (1H, d), 3.70 (3H, s), 3.41 (2H, q), 2.59 (3H, s), 1.26 (3H, t).

H, t).

本縮合複素環化合物 8 3

1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 75-8. 74 (1H, m), 8. 35-8. 34 (1
H, m), 7. 66-7. 65 (1H, m), 7. 61-7. 55 (2H, m), 3. 80 (3
5 H, s), 2. 95 (2H, q), 1. 28 (3H, t).

本縮合複素環化合物 8 4

1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 80-8. 78 (1H, m), 8. 54-8. 53 (1
H, m), 8. 35-8. 34 (1H, m), 7. 95-7. 91 (1H, m), 7. 79 (1
H, d), 3. 95 (3H, s), 3. 52-3. 41 (1H, m), 3. 09-2. 99 (1
10 H, m), 1. 33 (3H, t).

本縮合複素環化合物 8 5

1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 78-8. 76 (1H, m), 8. 47-8. 46 (1
H, m), 8. 31-8. 30 (1H, m), 8. 10-8. 07 (1H, m), 7. 76 (1
H, d), 3. 76 (3H, s), 3. 48 (2H, q), 1. 28 (3H, t).

15 本縮合複素環化合物 8 6

1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 51 (1H, d), 8. 19 (1H, d), 7. 53-7.
42 (3H, m), 7. 38-7. 29 (1H, m), 3. 73 (3H, s), 2. 97-2.
83 (4H, m), 1. 33-1. 19 (6H, m).

本縮合複素環化合物 8 7

20 1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 96 (1H, d), 8. 54 (1H, d), 8. 28-8.
18 (1H, m), 7. 91-7. 80 (2H, m), 7. 63-7. 55 (1H, m), 3.
74 (3H, s), 3. 43 (2H, q), 3. 24 (2H, q), 1. 38 (3H, t), 1.
26 (3H, t).

本縮合複素環化合物 8 8

25 1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 53 (1H, d), 8. 23 (1H, d), 7. 54-7.
42 (3H, m), 7. 38-7. 29 (1H, m), 3. 74 (3H, s), 3. 33-3.
22 (1H, m), 2. 87 (2H, q), 1. 30 (6H, d), 1. 24 (3H, t).

本縮合複素環化合物 8 9

30 1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 92 (1H, d), 8. 51 (1H, d), 8. 22 (1
H, dd), 7. 92-7. 81 (2H, m), 7. 62 (1H, dd), 3. 75 (3H,
s), 3. 43 (2H, q), 3. 36-3. 26 (1H, m), 1. 38 (6H, d), 1.
26 (3H, t).

本縮合複素環化合物 9 0

35 1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 69-8. 68 (1H, m), 8. 33-8. 31
(1H, m), 7. 70-7. 68 (1H, m), 7. 62-7. 55 (2H, m), 3. 7
9 (3H, s), 2. 97 (2H, q), 1. 29 (3H, t).

本縮合複素環化合物 9 1

1H-NMR (CDC 13) δ : 8. 93 (1H, d), 8. 52 (1H, d), 8. 25 (1
H, d), 7. 78 (1H, dd), 7. 67 (1H, d), 3. 76 (2H, q), 1. 40

(3H, t).

本縮合複素環化合物92

1H-NMR (CDC13) δ : 8.89 (1H, d), 8.56 (1H, d), 7.56-7.42 (3H, m), 7.39-7.33 (1H, m), 3.77 (3H, s), 2.89
5 (2H, q), 1.25 (3H, t).

本縮合複素環化合物93

1H-NMR (CDC13) δ : 8.93 (1H, d), 8.53 (1H, d), 8.26 (1H, dd), 7.84 (1H, td), 7.71 (1H, td), 7.60 (1H, dd), 3.89 (3H, s), 3.42-3.32 (1H, m), 3.05-2.96 (1H, m), 1.
10 31 (3H, t).

本縮合複素環化合物94

1H-NMR (CDC13) δ : 8.91 (1H, d), 8.50 (1H, d), 8.23 (1H, dd), 7.87-7.80 (2H, m), 7.56 (1H, dd), 3.71 (3H, s), 3.45 (2H, q), 1.26 (3H, t).

15 本縮合複素環化合物95

1H-NMR (CDC13) δ : 8.72-8.70 (1H, m), 8.51-8.49 (1H, m), 8.29-8.27 (1H, m), 8.13-8.09 (1H, m), 7.74-7.71 (1H, m), 3.74 (3H, s), 3.49 (2H, q), 1.29 (3H, t).

本縮合複素環化合物96

20 1H-NMR (CDC13) δ : 8.09 (1H, s), 7.59-7.42 (5H, m), 7.37-7.31 (1H, m), 3.69 (3H, s), 2.85 (2H, q), 1.23 (3H, t).

本縮合複素環化合物97

1H-NMR (CDC13) δ : 8.22 (1H, d), 8.07 (1H, s), 7.80 (1H, t), 7.67 (1H, t), 7.62-7.52 (3H, m), 3.79 (3H, s),
25 3.37-3.26 (1H, m), 3.01-2.89 (1H, m), 1.27 (3H, t).

本縮合複素環化合物98

1H-NMR (CDC13) δ : 8.20-8.18 (1H, m), 8.06 (1H, s), 7.82-7.74 (2H, m), 7.59-7.52 (3H, m), 3.61 (3H, s),
30 3.43 (2H, br s), 1.22 (3H, t).

本縮合複素環化合物99

1H-NMR (CDC13) δ : 8.65-8.64 (1H, m), 8.29-8.28 (1H, m), 7.35-7.31 (2H, m), 7.18-7.15 (1H, m), 3.76 (3H, s), 2.86 (2H, q), 2.46 (3H, s), 1.23 (3H, t).

35 本縮合複素環化合物100

1H-NMR (CDC13) δ : 8.69-8.68 (1H, m), 8.28-8.26 (1H, m), 8.07-8.05 (1H, m), 7.50-7.48 (2H, m), 3.89 (3H, s), 3.44-3.33 (1H, m), 3.01-2.92 (1H, m), 2.58 (3H, s), 1.32 (3H, t).

本縮合複素環化合物101

1H-NMR (CDC13) δ : 8.68–8.66 (1H, m), 8.25–8.23 (1H, m), 8.04–8.02 (1H, m), 7.65–7.61 (1H, m), 7.45–7.42 (1H, m), 3.71 (3H, s), 3.47–3.38 (2H, m), 2.59 (3H, s), 1.26 (3H, t).

本縮合複素環化合物102

1H-NMR (CDC13) δ : 8.81 (1H, d), 8.55 (1H, d), 8.07–8.00 (1H, m), 7.59–7.53 (1H, m), 7.52–7.45 (1H, m), 7.41–7.33 (1H, m), 2.99 (2H, q), 1.35 (3H, t).

10 本縮合複素環化合物103

1H-NMR (CDC13) δ : 8.85 (1H, d), 8.59 (1H, d), 8.15 (1H, d), 7.75 (1H, s), 7.59 (1H, d), 3.05 (2H, q), 1.38 (3H, t).

本縮合複素環化合物104

15 1H-NMR (CDC13) δ : 8.87 (1H, d), 8.50 (1H, d), 8.28–8.22 (1H, m), 7.85–7.76 (2H, m), 7.74–7.70 (1H, m), 3.74 (2H, q), 1.37 (3H, t).

本縮合複素環化合物105

20 1H-NMR (CDC13) δ : 8.90 (1H, s), 8.57–8.49 (2H, m), 8.07 (1H, d), 7.88 (1H, d), 3.77 (2H, q), 1.40 (3H, t).

本縮合複素環化合物106

1H-NMR (CDC13) δ : 8.93 (1H, d), 8.61 (1H, d), 7.45–7.34 (3H, m), 2.91 (2H, q), 1.27 (3H, t).

本縮合複素環化合物107

25 1H-NMR (CDC13) δ : 8.95 (1H, d), 8.55 (1H, d), 8.14 (1H, dd), 7.86 (1H, dd), 7.73 (1H, t), 3.40 (2H, q), 1.28 (3H, t).

本縮合複素環化合物108

30 1H-NMR (CDC13) δ : 8.74–8.72 (1H, m), 8.28–8.26 (1H, m), 8.05–8.03 (1H, m), 7.67–7.64 (1H, m), 7.46 (1H, d), 3.71 (3H, s), 3.41 (2H, q), 2.88 (2H, q), 1.37 (3H, t), 1.26 (3H, t).

本縮合複素環化合物109

35 1H-NMR (CDC13) δ : 8.78–8.76 (1H, m), 8.46–8.44 (1H, m), 8.31–8.30 (1H, m), 8.09–8.05 (1H, m), 7.76 (1H, d), 3.75 (3H, s), 3.48 (2H, q), 1.27 (3H, t).

本縮合複素環化合物110

1H-NMR (CDC13) δ : 8.69 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.25 (1H, dd), 8.21 (1H, dd), 7.73–7.58 (2H, m), 3.47–3.3

6 (1H, m), 3.13–3.01 (1H, m), 1.57–0.71 (3H, m).

本縮合複素環化合物111

1H-NMR (CDC13) δ : 8.76 (1H, d), 8.51 (1H, d), 8.29 (1H, d), 8.10 (1H, dd), 7.74 (1H, d), 4.22 (2H, q), 3.55 (2H, q), 1.42 (3H, t), 1.30 (3H, t).

本縮合複素環化合物112

1H-NMR (CDC13) δ : 8.13 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.62 (1H, d), 7.59–7.57 (2H, m), 7.52 (1H, d), 3.70 (3H, s), 2.92 (2H, q), 1.27 (3H, t).

10 本縮合複素環化合物113

1H-NMR (CDC13) δ : 8.53 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.93 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.65 (1H, d), 7.57 (1H, d), 3.85 (3H, s), 3.52–3.41 (1H, m), 3.05–2.95 (1H, m), 1.32 (3H, t).

15 本縮合複素環化合物114

1H-NMR (CDC13) δ : 8.48 (1H, s), 8.10–8.05 (2H, m), 7.74 (1H, d), 7.62 (1H, d), 7.53 (1H, d), 3.63 (3H, s), 3.47 (2H, q), 1.25 (3H, t).

本縮合複素環化合物115

20 1H-NMR (CDC13) δ : 8.83–8.74 (3H, m), 8.54 (1H, dd), 8.31–8.29 (1H, m), 7.95–7.86 (2H, m), 7.68 (1H, d), 7.41–7.37 (1H, m), 3.75 (3H, s), 3.49 (2H, q), 1.30 (3H, t).

本縮合複素環化合物116

25 1H-NMR (CDC13) δ : 8.74–8.72 (1H, m), 8.28–8.25 (1H, m), 8.07–8.05 (1H, m), 7.69–7.66 (1H, m), 7.47 (1H, d), 3.72 (3H, s), 3.41 (2H, q), 3.18–3.10 (1H, m), 1.37 (6H, d), 1.26 (3H, t).

本縮合複素環化合物117

30 1H-NMR (CDC13) δ : 8.77–8.75 (1H, m), 8.38–8.36 (1H, m), 8.31–8.29 (1H, m), 8.02–7.99 (1H, m), 7.69 (1H, d), 6.85 (1H, t), 3.73 (3H, s), 3.54–3.33 (2H, m), 1.28 (3H, t).

本縮合複素環化合物118

35 1H-NMR (CDC13) δ : 8.68–8.66 (1H, m), 8.31–8.30 (1H, m), 7.48 (1H, d), 7.29–7.26 (1H, m), 7.21–7.17 (1H, m), 3.80 (3H, s), 2.93 (2H, q), 1.29 (3H, t).

本縮合複素環化合物119

1H-NMR (CDC13) δ : 8.72–8.71 (1H, m), 8.30–8.29

(1H, m), 8.14–8.12 (1H, m), 7.68 (1H, d), 7.55–7.51 (1H, m), 3.93 (3H, s), 3.50–3.40 (1H, m), 3.08–2.98 (1H, m), 1.33 (3H, t).

本縮合複素環化合物120

5 1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.71–8.69 (1H, m), 8.27–8.26 (1H, m), 8.09–8.07 (1H, m), 7.70–7.66 (1H, m), 7.62 (1H, d), 3.74 (3H, s), 3.47 (2H, q), 1.28 (3H, t).

本縮合複素環化合物121

10 1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.11 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.61–7.56 (3H, m), 7.53 (1H, d), 3.70 (3H, s), 2.93 (2H, q), 1.28 (3H, t).

本縮合複素環化合物122

15 1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.53 (1H, d), 8.09 (1H, s), 7.93 (1H, dd), 7.74 (1H, d), 7.64 (1H, d), 7.59 (1H, d), 3.85 (3H, s), 3.51–3.40 (1H, m), 3.06–2.97 (1H, m), 1.32 (3H, t).

本縮合複素環化合物123

20 1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.49 (1H, d), 8.10–8.04 (2H, m), 7.73 (1H, d), 7.60 (1H, d), 7.55 (1H, d), 3.64 (3H, s), 3.47 (2H, q), 1.25 (3H, t).

本縮合複素環化合物124

25 1H-NMR (CDCl₃) δ: 9.06–9.04 (1H, m), 8.87 (1H, d), 8.77–8.75 (1H, m), 8.59 (1H, dd), 8.31–8.30 (1H, m), 8.14–8.11 (1H, m), 8.07–8.04 (1H, m), 7.72 (1H, d), 3.76 (3H, s), 3.51 (2H, q), 1.31 (3H, t).

本縮合複素環化合物125

30 1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.67–8.66 (1H, m), 8.40–8.39 (1H, m), 7.47 (1H, d), 7.29–7.26 (1H, m), 7.21–7.16 (1H, m), 3.78 (3H, s), 2.93 (2H, q), 1.29 (3H, t).

35 本縮合複素環化合物126

1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.71 (1H, d), 8.39 (1H, d), 8.13–8.12 (1H, m), 7.67 (1H, d), 7.54–7.50 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.49–3.39 (1H, m), 3.06–2.96 (1H, m), 1.33 (3H, t).

本縮合複素環化合物127

1H-NMR (CDCl₃) δ: 8.70 (1H, d), 8.36 (1H, d), 8.09–8.07 (1H, m), 7.70–7.66 (1H, m), 7.62 (1H, d), 3.72 (3H, s), 3.46 (2H, q), 1.28 (3H, t).

本縮合複素環化合物128

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.53 (1H, s), 8.19–8.13 (2H, m), 8.07 (1H, dd), 7.77 (1H, dd), 7.69 (1H, d), 3.91 (2H, q), 1.44 (3H, t).

本縮合複素環化合物129

- 5 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.54 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.17 (1H, d), 8.10 (1H, d), 7.89 (2H, s), 3.91 (2H, q), 1.45 (3H, t).

[0204]

まず、製剤例を示す。

- 10 [0205]

製剤例1

- 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、テブコナゾール10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0206]

製剤例2

- 20 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、メトコナゾール10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0207]

製剤例3

- 25 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、ジフェノコナゾール10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0208]

製剤例4

- 30 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、トリチコナゾール10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0209]

- 35 製剤例5

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、トリアジメノール10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0210]

製剤例6

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、フルキンコナゾール10部、ホワイト
トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合
5 物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
ることにより、各々の製剤を得る。

[0211]

製剤例7

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、プロチオコナゾール10部、ホワイト
10 トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合
物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
ることにより、各々の製剤を得る。

[0212]

製剤例8

15 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、シプロコナゾール10部、ホワイト
トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物
(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
ることにより、各々の製剤を得る。

[0213]

20 製剤例9

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、テトラコナゾール10部、ホワイト
トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物
(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
ることにより、各々の製剤を得る。

25 [0214]

製剤例10

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、イプコナゾール10部、ホワイトカ
トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重
量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
ることにより、各々の製剤を得る。
30

[0215]

製剤例11

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、エポキシコナゾール10部、ホワイト
トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合
35 物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
ることにより、各々の製剤を得る。

[0216]

製剤例12

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、ヘキサコナゾール10部、ホワイト

カーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合1：1）35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々の製剤を得る。

[0217]

5 製剤例13

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、テブコナゾール0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0218]

製剤例14

15 本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、メトコナゾール0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0219]

製剤例15

20 本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、ジフェノコナゾール0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

25 [0220]

製剤例16

30 本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、トリチコナゾール0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0221]

製剤例17

35 本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、トリアジメノール0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0222]

製剤例 18

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 10部、フルキンコナゾール 0.1部、ソルビタントリオレエート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を 90部とし、さらにプロピレングリコール 10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0223]

製剤例 19

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 10部、プロチオコナゾール 0.1部、ソルビタントリオレエート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を 90部とし、さらにプロピレングリコール 10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0224]

15 製剤例 20

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 10部、シプロコナゾール 0.1部、ソルビタントリオレエート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を 90部とし、さらにプロピレングリコール 10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0225]

製剤例 21

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 10部、テトラコナゾール 0.1部、ソルビタントリオレエート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を 90部とし、さらにプロピレングリコール 10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0226]

製剤例 22

30 本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 10部、イプロコナゾール 0.1部、ソルビタントリオレエート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を 90部とし、さらにプロピレングリコール 10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

35 [0227]

製剤例 23

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 10部、エポキシコナゾール 0.1部、ソルビタントリオレエート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05部及びアルミニウ

ムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0228]

製剤例24

- 5 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、ヘキサコナゾール0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

10 [0229]

製剤例25

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、テブコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

15 [0230]

製剤例26

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、メトコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

20 [0231]

製剤例27

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、ジフェノコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

25 [0232]

製剤例28

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、トリチコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

30 [0233]

製剤例29

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、トリアジメノール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

35 [0234]

製剤例30

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルキンコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0235]

製剤例31

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、プロチオコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0236]

製剤例32

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、シプロコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0237]

製剤例33

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、テトラコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0238]

製剤例34

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、イプコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0239]

製剤例35

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、エポキシコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0240]

製剤例36

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、ヘキサコナゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0241]

製剤例37

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、テブコナゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0242]

製剤例38

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、メトコナゾール0.5部、合成含水

酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0243]

5 製剤例39

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、ジフェノコナゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

10 [0244]

製剤例40

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、トリチコナゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

15

[0245]

製剤例41

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、トリアジメノール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

20

[0246]

製剤例42

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、フルキンコナゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

25

[0247]

製剤例43

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、プロチオコナゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

30

[0248]

35 製剤例44

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、シプロコナゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0249]

製剤例 45

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1 種を 1 部、テトラコナゾール 0.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部およびカ
5 オリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0250]

製剤例 46

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1 種を 1 部、イプコナゾール 0.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部およびカ
10 オリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0251]

製剤例 47

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1 種を 1 部、エポキシコナゾール 0.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部および
15 カオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0252]

20 製剤例 48

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1 種を 1 部、ヘキサコナゾール 0.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部およびカ
オリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

25 [0253]

製剤例 49

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1 種を 5 部、アゾキシストロビン 10 部、ホワイト
トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合 1：1）35 部並びに水を混合し全量を 100 部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
30 ることにより、各々の製剤を得る。

[0254]

製剤例 50

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1 種を 5 部、ピラクロストロビン 10 部、ホワイト
トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合 1：1）35 部並びに水を混合し全量を 100 部とし、湿式粉碎法で微粉碎す
35 ることにより、各々の製剤を得る。

[0255]

製剤例 51

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1 種を 5 部、ピコキシストロビン 10 部、ホワイト

トカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合1：1）35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0256]

5 製剤例52

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を5部、トリフロキシストロビン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合1：1）35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

10 [0257]

製剤例53

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を5部、フルオキサストロビン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合1：1）35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

15 製剤例54

[0258]

製剤例54

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を5部、オリサストロビン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合1：1）35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

20 製剤例55

[0259]

製剤例55

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を5部、本アミド化合物（式（2）で示される化合物：以下同じ）10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物（重量割合1：1）35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0260]

製剤例56

30 本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、アゾキシストロビン0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

35 [0261]

製剤例57

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、ピラクロストロビン0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウ

ムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0262]

製剤例58

- 5 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、ピコキシストロビン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

10 [0263]

製剤例59

- 15 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、トリフロキシストロビン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0264]

製剤例60

- 20 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルオキサストロビン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0265]

25 製剤例61

- 30 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、オリサストロビン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0266]

製剤例62

- 35 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、本アミド化合物0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0267]

製剤例63

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、アゾキシストロビン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0268]

5 製剤例64

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、ピラクロストロビン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0269]

10 製剤例65

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、ピコキシストロビン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0270]

15 製剤例66

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、トリフロキシストロビン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0271]

20 製剤例67

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、フルオキサストロビン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0272]

25 製剤例68

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、オリサストロビン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0273]

30 製剤例69

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、本アミド化合物10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0274]

35 製剤例70

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を1部、アゾキシストロビン0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0275]

製剤例 7 1

5 本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 1部、ピラクロストロビン 0.5部、合成含水酸化珪素微粉末 1部、リグニンスルホン酸カルシウム 2部、ベントナイト 30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0276]

製剤例 7 2

10 本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 1部、ピコキシストロビン 0.5部、合成含水酸化珪素微粉末 1部、リグニンスルホン酸カルシウム 2部、ベントナイト 30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0277]

製剤例 7 3

15 本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 1部、トリフロキシストロビン 0.5部、合成含水酸化珪素微粉末 1部、リグニンスルホン酸カルシウム 2部、ベントナイト 30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0278]

20 製剤例 7 4

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 1部、フルオキサストロビン 0.5部、合成含水酸化珪素微粉末 1部、リグニンスルホン酸カルシウム 2部、ベントナイト 30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

25 [0279]

製剤例 7 5

30 本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 1部、オリサストロビン 0.5部、合成含水酸化珪素微粉末 1部、リグニンスルホン酸カルシウム 2部、ベントナイト 30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0280]

製剤例 7 6

35 本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 1部、本アミド化合物 0.5部、合成含水酸化珪素微粉末 1部、リグニンスルホン酸カルシウム 2部、ベントナイト 30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0281]

製剤例 7 7

本縮合複素環化合物 1～131のうち 1種を 5部、メタラキシル 10部、ホワイトカー

ボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々の製剤を得る。

[0282]

5 製剤例78

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、メタラキシル-M10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々の製剤を得る。

10 [0283]

製剤例79

15 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、メタラキシル0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0284]

製剤例80

20 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、メタラキシル-M0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0285]

25 製剤例81

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、メタラキシル10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉砕混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0286]

30 製剤例82

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、メタラキシル-M10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素残部をよく粉砕混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0287]

35 製剤例83

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、メタラキシル0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0288]

製剤例84

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、メタラキシル-MO、5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ペントナイト30部およびカ
5 オリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、
造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0289]

製剤例85

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、プロベナゾール10部、ホワイトカー
10 ボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重
量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎すること
により、各々の製剤を得る。

[0290]

製剤例86

15 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、トリシクラゾール10部、ホワイト
カーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物
(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎する
ことにより、各々の製剤を得る。

[0291]

20 製剤例87

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、ピロキロン10部、ホワイトカー
ボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割
合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することによ
り、各々の製剤を得る。

25 [0292]

製剤例88

30 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、カスガマイシン塩酸塩10部、ホワ
イトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混
合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎
することにより、各々の製剤を得る。

[0293]

製剤例89

35 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、フェリムゾン10部、ホワイトカー
ボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重
量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎すること
により、各々の製剤を得る。

[0294]

製剤例90

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、イソチアニル10部、ホワイトカー

ボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々の製剤を得る。

[0295]

5 製剤例91

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、フサライド10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々の製剤を得る。

10 [0296]

製剤例92

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、テブフロキン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々の製剤を得る。

15 [0297]

[0297]

製剤例93

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、プロベナゾール0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

20

[0298]

製剤例94

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、トリシクラゾール0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

25

[0299]

製剤例95

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、ピロキロン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

30

[0300]

製剤例96

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、カスガマイシン塩酸塩0.1部、

ソルビタントリオレエート 1.5 部、並びにポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液を加え全量を 90 部とし、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

5 [0301]

製剤例 97

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、フェリムゾン 0.1 部、ソルビタントリオレエート 1.5 部、並びにポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液を加え全量を 90 部とし、さらにプロピレングリ

10 [0302]

製剤例 98

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、イソチアニル 0.1 部、ソルビタントリオレエート 1.5 部、並びにポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液を加え全量を 90 部とし、さらにプロピレングリ

15 [0303]

20 製剤例 99

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、フサライド 0.1 部、ソルビタントリオレエート 1.5 部、並びにポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液を加え全量を 90 部とし、さらにプロピレングリ

25 [0304]

製剤例 100

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、テブフロキン 0.1 部、ソルビタントリオレエート 1.5 部、並びにポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントランガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液を加え全量を 90 部とし、さらにプロピレングリ

30 [0305]

製剤例 101

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、プロベナゾール 10 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤 100 部を得る。

35 [0306]

製剤例 102

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、トリシクラゾール10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0307]

5 製剤例103

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、ピロキロン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0308]

10 製剤例104

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、カスガマイシン塩酸塩10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0309]

15 製剤例105

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、フェリムゾン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0310]

20 製剤例106

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、イソチアニル10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0311]

25 製剤例107

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、フサライド10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0312]

30 製剤例108

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を10部、テブフロキン10部、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0313]

35 製剤例109

本縮合複素環化合物1～131のうち1種を1部、プロベナゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0314]

製剤例110

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、トリシクラゾール0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0315]

製剤例111

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、ピロキロン0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0316]

製剤例112

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、カスガマイシン塩酸塩0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0317]

製剤例113

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、フェリムゾン0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0318]

製剤例114

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、イソチアニル0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0319]

製剤例115

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、フサライド0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0320]

製剤例116

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、テブフロキン0.5部、合成含水酸

化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0321]

5 製剤例117

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、ペンシクロン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

10 [0322]

製剤例118

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、フラメトピル10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

15 [0323]

製剤例119

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、バリダマイシン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0324]

製剤例120

25 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、ペンシクロン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0325]

30 製剤例121

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フラメトピル0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリ

35 コール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0326]

製剤例122

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、バリダマイシン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混

合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液を加え全量を 90 部とし、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0327]

5 製剤例 123

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、ペンシクロン 10 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤 100 部を得る。

[0328]

10 製剤例 124

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、フラメトピル 10 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤 100 部を得る。

[0329]

15 製剤例 125

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 10 部、バリダマイシン 10 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤 100 部を得る。

[0330]

20 製剤例 126

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 1 部、ペンシクロン 0.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

25 [0331]

製剤例 127

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 1 部、フラメトピル 0.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

30

[0332]

製剤例 128

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 1 部、バリダマイシン 0.5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

35

[0333]

製剤例 129

本縮合複素環化合物 1~131 のうち 1 種を 5 部、フルトラニル 10 部、ホワイトカー

ボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0334]

5 製剤例130

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、フルオピラム10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

10 [0335]

製剤例131

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、セダキサン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

15

[0336]

製剤例132

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、ペンフルフェン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

20

[0337]

製剤例133

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、フルキサピロキサド10部、ホワイトトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

25

[0338]

製剤例134

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルトラニル0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサンタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

30

[0339]

製剤例135

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルオピラム0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサンタンガム0.05部及びアルミニウムマグ

35

ネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0340]

製剤例136

- 5 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、セダキサン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

10 [0341]

製剤例137

- 15 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、ペンフルフェン0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0342]

製剤例138

- 20 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルキサピロキサド0.1部、ソルビタントリオレート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0343]

25 製剤例139

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルトラニル10部、リグニンシルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0344]

30 製剤例140

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルオピラム10部、リグニンシルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0345]

35 製剤例141

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、セダキサン10部、リグニンシルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸ナトリウム2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤100部を得る。

[0346]

製剤例 1 4 2

本縮合複素環化合物 1 ~ 1 3 1 のうち 1 種を 1 0 部、ペンフルフェン 1 0 部、リグニン
スルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部、並びに合成含水酸化珪素 残部
をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤 1 0 0 部を得る。

5 [0 3 4 7]

製剤例 1 4 3

本縮合複素環化合物 1 ~ 1 3 1 のうち 1 種を 1 0 部、フルキサピロキサド 1 0 部、リグ
ニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部、並びに合成含水酸化珪素 残
部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤 1 0 0 部を得る。

10 [0 3 4 8]

製剤例 1 4 4

本縮合複素環化合物 1 ~ 1 3 1 のうち 1 種を 1 部、フルトラニル 0. 5 部、合成含水酸
化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 3 0 部およびカオリ
ンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造
15 粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0 3 4 9]

製剤例 1 4 5

本縮合複素環化合物 1 ~ 1 3 1 のうち 1 種を 1 部、フルオピラム 0. 5 部、合成含水酸
化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 3 0 部およびカオリ
ンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造
20 粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0 3 5 0]

製剤例 1 4 6

本縮合複素環化合物 1 ~ 1 3 1 のうち 1 種を 1 部、セダキサン 0. 5 部、合成含水酸化
珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 3 0 部およびカオリ
ンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造
25 粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0 3 5 1]

製剤例 1 4 7

本縮合複素環化合物 1 ~ 1 3 1 のうち 1 種を 1 部、ペンフルフェン 0. 5 部、合成含水
酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 3 0 部およびカオ
リンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、
30 造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0 3 5 2]

35 製剤例 1 4 8

本縮合複素環化合物 1 ~ 1 3 1 のうち 1 種を 1 部、フルキサピロキサド 0. 5 部、合成
含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 3 0 部および
カオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌
し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0353]

製剤例149

- 5 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、フルジオキソニル10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0354]

製剤例150

- 10 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、エタボキサム10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0355]

製剤例151

- 15 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、トルクロホスメチル10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0356]

- 20 製剤例152

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を5部、キャプタン10部、ホワイトカーボンとポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩との混合物(重量割合1:1)35部並びに水を混合し全量を100部とし、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

- 25 [0357]

製剤例153

- 30 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、フルジオキソニル0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0358]

製剤例154

- 35 本縮合複素環化合物1~131のうち1種を10部、エタボキサム0.1部、ソルビタントリオレエート1.5部、並びにポリビニルアルコール2部を含む水溶液28部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中にキサントタンガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液を加え全量を90部とし、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0359]

製剤例 155

本縮合複素環化合物 1~131のうち 1種を 10部、トルクロホスメチル 0.1部、ソルビタン トリオレート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム 0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を 90部とし、さらにプロピレングリコール 10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0360]

製剤例 156

10 本縮合複素環化合物 1~131のうち 1種を 10部、キャプタン 0.1部、ソルビタン トリオレート 1.5部、並びにポリビニルアルコール 2部を含む水溶液 28部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕した後、この中にキサントガム 0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1部を含む水溶液を加え全量を 90部とし、さらにプロピレングリコール 10部を加えて攪拌混合し、各々の製剤を得る。

[0361]

15 製剤例 157

本縮合複素環化合物 1~131のうち 1種を 10部、フルジオキソニル 10部、リグニンスルホン酸カルシウム 3部、ラウリル硫酸ナトリウム 2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉砕混合することにより、各々の水和剤 100部を得る。

[0362]

20 製剤例 158

本縮合複素環化合物 1~131のうち 1種を 10部、エタボキサム 10部、リグニンスルホン酸カルシウム 3部、ラウリル硫酸ナトリウム 2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉砕混合することにより、各々の水和剤 100部を得る。

[0363]

25 製剤例 159

本縮合複素環化合物 1~131のうち 1種を 10部、トルクロホスメチル 10部、リグニンスルホン酸カルシウム 3部、ラウリル硫酸ナトリウム 2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉砕混合することにより、各々の水和剤 100部を得る。

[0364]

30 製剤例 160

本縮合複素環化合物 1~131のうち 1種を 10部、キャプタン 10部、リグニンスルホン酸カルシウム 3部、ラウリル硫酸ナトリウム 2部、並びに合成含水酸化珪素 残部をよく粉砕混合することにより、各々の水和剤 100部を得る。

[0365]

35 製剤例 161

本縮合複素環化合物 1~131のうち 1種を 1部、フルジオキソニル 0.5部、合成含水酸化珪素微粉末 1部、リグニンスルホン酸カルシウム 2部、ベントナイト 30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0366]

製剤例162

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、エタボキサム0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0367]

製剤例163

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、トルクロホスメチル0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0368]

製剤例164

本縮合複素環化合物1~131のうち1種を1部、キャプタン0.5部、合成含水酸化珪素微粉末1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部およびカオリンクレー残部を加え混合する。ついで、この混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

[0369]

次に、本発明組成物の有害節足動物防除効力を試験例により示す。

[0370]

試験例1

本縮合複素環化合物3、23、27、31、39、41、42、46、48、51、56、58、64、69、72、74、78、83、91、97、104、105、107、108、109、118、119、120、127、130及び131をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

テブコナゾール（商品名：Horizon EW、Bayer Crop Science製）、プロチオコナゾール（商品名：Joao、Bayer Crop Science製）、メトコナゾール（商品名：Sunorg Pro、BASF製）、ジフェノコナゾール（商品名：スコア顆粒水和剤、Syngenta製）、テトラコナゾール（商品名：サルバトーレME、アリストライフサイエンス製）及びヘキサコナゾール（商品名：アンビルフロアブル、住友化学製）の各市販製剤をそれぞれ所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

イブコナゾール（和光純薬製）及びトリチコナゾール（和光純薬製）をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所

定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

上記本縮合複素環化合物の水希釈液と、テブコナゾール、プロチオコナゾール、メトコナゾール、ジフェノコナゾール、テトラコナゾール、ヘキサコナゾール、イプコナゾール又は
5 トリチコナゾールの水希釈液とを混合し、試験用薬液を調製した。

キャベツ (*Brassicae oleracea*) リーフディスク（直径1.5cm）を24穴マイクロプレート（Becton Dickinson製）の各ウェルに収容し、1ウェルあたり該試験用薬液40 μ Lを散布処理した。なお、展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水を40 μ L散布したウェルを無処理区とした。

10 風乾後、1ウェルあたりコナガ2齢幼虫 (*Plutella xylostella*) を5頭放飼し、ペーパータオルで各ウェルを覆った後、蓋をした。放飼2日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の死虫率を下記式1)より算出した。なお、試験は1反復で行った。
式1) 死虫率 (%) = (供試虫数 - 生存虫数) / 供試虫数 \times 100

15

[0371]

表5

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物3 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + トリチコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0372]

表6

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物39 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0373]

表7

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物83 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0374]

表8

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物31 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0375]

表9

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物46 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物105 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0376]

表10

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物91 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0377]

表11

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物51 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0378]

表12

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物108 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0379]

表13

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物97 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0380]

表14

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物109 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0381]

表15

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物78 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0382]

表16

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物120 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0383]

表17

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物42 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0384]

表18

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物104 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0385]

[表19]

表19

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物119 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + メトコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + メトコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + メトコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + イブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + イブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	—	0

[表 19] (続き)

供試化合物	濃度(ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物130 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + メコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + メコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + メコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + イプコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + イプコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + テブコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + テブコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + テブコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + プロチオコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + プロチオコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + メコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + メコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + メコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + イプコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + イプコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + トリチコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + トリチコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + ジフェノコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + ジフェノコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + テトラコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + テトラコナゾール	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + ヘキサコナゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + ヘキサコナゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + ヘキサコナゾール	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0386]

試験例 2

- 5 本縮合複素環化合物 3、23、27、31、39、41、42、46、48、51、56、58、64、69、72、74、78、83、91、97、104、105、107、108、109、118、119、120、127、130 及び 131 をそれぞれ 1 mg あたり、容量比がそれぞれ 4 : 4 : 1 であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒 10 μ L で溶解した後、所定濃度

になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

5 アゾキシストロビン（商品名：Amistar、Syngenta製）、ピラクロストロビン（商品名：Comet、BASF製）及びトリフロキシストロビン（商品名：Flint、Bayer Crop Science製）の各市販製剤をそれぞれ所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

10 フルオキサストロビン、本アミド化合物（式（2）で示される化合物：以下同じ）及びオリサストロビン（和光純薬製）をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4：4：1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10μLで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

上記本縮合複素環化合物の水希釈液と、アゾキシストロビン、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン、フルオキサストロビン、本アミド化合物又はオリサストロビンの水希釈液とを混合し、試験用薬液を調製した。

15 キャベツ（*Brassicae oleracea*）リーフディスク（直径1.5cm）を24穴マイクロプレート（Becton Dickinson製）の各ウェルに収容し、1ウェルあたり該試験用薬液40μLを散布処理した。なお、展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水を40μL散布したウェルを無処理区とした。

20 風乾後、1ウェルあたりコナガ2齢幼虫（*Plutella xylostella*）を5頭放飼し、ペーパータオルで各ウェルを覆った後、蓋をした。放飼2日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の死虫率を下記式1)より算出した。なお、試験は1反復で行った。
式1) 死虫率(%) = (供試虫数 - 生存虫数) / 供試虫数 × 100

[0387]

表20

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物3 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物3 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物39 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0388]

表 2 1

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 2 3 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 3 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 3 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 3 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 2 3 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 3 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 2 3 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 2 3 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 7 4 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 7 4 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 7 4 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 8 3 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 8 3 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 8 3 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 8 3 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 8 3 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 8 3 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 8 3 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 8 3 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 8 3 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 8 3 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 8 3 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 8 3 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 8 3 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 8 3 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 8 3 + オリサストロピン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0389]

表 2 2

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 5 8 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 8 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 8 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 8 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 8 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 8 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 8 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 8 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 8 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 8 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 8 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 8 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 8 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 5 8 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 8 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 1 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 1 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 3 1 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 1 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 1 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 1 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 1 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 1 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 1 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 1 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 1 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 3 1 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 1 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 3 1 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 3 1 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 6 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 6 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 6 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 6 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 6 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 6 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 6 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0390]

表 2 3

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 5 6 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 6 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 6 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 6 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 6 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 6 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 5 6 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 6 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 6 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 4 6 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 6 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 6 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 6 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 6 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 4 6 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 6 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 4 6 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 1 0 5 + オリサストロピン	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0391]

表24

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物91 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物91 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物91 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物107 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物107 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物51 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0392]

表 2 5

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 5 1 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 1 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 1 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 5 1 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 1 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 5 1 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 5 1 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 5 1 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 7 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 7 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 2 7 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 7 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 7 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 7 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 7 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 7 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 7 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 7 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 7 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 2 7 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 7 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 2 7 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 2 7 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 1 0 8 + オリサストロピン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0393]

表 2 6

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 4 8 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 8 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 4 8 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 8 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 8 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 8 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 8 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 8 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 8 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 8 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 8 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 4 8 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 8 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 4 8 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 4 8 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 9 7 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 9 7 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 9 7 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 9 7 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 9 7 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 9 7 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 9 7 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 9 7 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 9 7 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 9 7 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 9 7 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 9 7 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 9 7 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 9 7 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 9 7 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 6 9 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 6 9 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 6 9 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 6 9 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 6 9 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 6 9 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 6 9 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 6 9 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 6 9 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0394]

表 27

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 69 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 69 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 69 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 69 + オリサストロビン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 69 + オリサストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 69 + オリサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 109 + アゾキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 109 + アゾキシストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 109 + アゾキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 109 + ピラクロストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 109 + ピラクロストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 109 + トリフロキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 109 + トリフロキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 109 + フルオキサストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 109 + フルオキサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 109 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 109 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 109 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 109 + オリサストロビン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 109 + オリサストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 109 + オリサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 72 + アゾキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 72 + アゾキシストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 72 + アゾキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 72 + ピラクロストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 72 + ピラクロストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 72 + トリフロキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 72 + トリフロキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 72 + フルオキサストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 72 + フルオキサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 72 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 72 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 72 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 72 + オリサストロビン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物 72 + オリサストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 72 + オリサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 78 + アゾキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 78 + アゾキシストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 78 + アゾキシストロビン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0395]

表28

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物78 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物78 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物64 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + 本アミド化合物	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0396]

表29

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物120 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物120 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物127 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物42 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + ピラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + ピラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
無処理区	—	0

[0397]

表30

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物41 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物41 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物104 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + ビラクロストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + ビラクロストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + トリフロキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + トリフロキシストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + フルオキサストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + フルオキサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + オリサストロピン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物118 + オリサストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + オリサストロピン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + アゾキシストロピン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + アゾキシストロピン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + アゾキシストロピン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0398]

表31

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物119 + ピラクロストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + ピラクロストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + トリフロキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + トリフロキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + フルオキサストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + フルオキサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + オリサストロビン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物119 + オリサストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + オリサストロビン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[表31] (続き)

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物130 + アゾキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + アゾキシストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + アゾキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + ピラクロストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + ピラクロストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + トリフロキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + トリフロキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + フルオキサストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + フルオキサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + オリサストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + オリサストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + オリサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + アゾキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + アゾキシストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + アゾキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + ピラクロストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + ピラクロストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + トリフロキシストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + トリフロキシストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + フルオキサストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + フルオキサストロビン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + 本アミド化合物	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + 本アミド化合物	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + 本アミド化合物	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + オリサストロビン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + オリサストロビン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + オリサストロビン	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0399]

試験例3

5 本縮合複素環化合物3、23、27、31、39、41、42、46、48、51、56、58、64、69、72、74、78、83、91、97、104、105、107、108、109、118、119、120、127、130及び131をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4：4：1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

10 メタラキシル（和光純薬製）を1mgあたり、容量比がそれぞれ4：4：1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

15 メタラキシル-M（商品名：Ridmil Gold EC、Syngenta製）の市販製剤を所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

上記本縮合複素環化合物の水希釈液と、メタラキシル又はメタラキシル-Mの水希釈液とを混合し、試験用薬液を調製した。

20 キャベツ（*Brassicae oleracea*）リーフディスク（直径1.5cm）を24穴マイクロプレート（Becton Dickinson製）の各ウェルに収容し、1ウェルあたり該試験用薬液40 μ Lを散布処理した。なお、展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水を40 μ L散布したウェルを無処理区とした。

25 風乾後、1ウェルあたりコナガ2齢幼虫（*Plutella xylostella*）を5頭放飼し、ペーパータオルで各ウェルを覆った後、蓋をした。放飼2日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の死虫率を下記式1）より算出した。なお、試験は1反復で行った。
式1） 死虫率（%）＝（供試虫数－生存虫数）／供試虫数×100

[0400]

表32

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物3 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物3 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物39 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物23 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物74 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + メタラキシル-M	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0401]

表 3 3

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 4 6 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 4 6 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 4 6 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 4 6 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 105 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 105 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 105 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 105 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 105 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 91 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 91 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 91 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 91 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 91 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 107 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 107 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 107 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 107 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 107 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 51 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 51 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 51 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 51 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 51 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 27 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 27 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 27 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 27 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 27 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 108 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 108 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 108 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 108 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 108 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 48 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 48 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 48 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 48 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 48 + メタラキシル-M	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0402]

表34

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物97 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + メタラキシル-M	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0403]

表35

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物42 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + メタラキシル-M	500 + 5	100
無処理区	-	0

[表35] (続き)

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物130 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + メタラキシル-M	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + メタラキシル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + メタラキシル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + メタラキシル-M	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + メタラキシル-M	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + メタラキシル-M	500 + 5	100
無処理区	-	0

5

[0404]

試験例4

本縮合複素環化合物3、23、27、31、39、41、42、46、48、51、56、58、64、69、72、74、78、83、91、97、104、105、107、108、109、118、119、120、127、130及び131をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

10 トリシクラゾール（和光純薬製）、イソチアニル、プロベナゾール（和光純薬製）、フサライド（和光純薬製）、カスガマイシン塩酸塩（和光純薬製）、フェリムゾン、テブフロキン及びピロキロン（和光純薬製）をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

上記本縮合複素環化合物の水希釈液と、トリシクラゾール、イソチアニル、プロベナゾール、フサライド、カスガマイシン塩酸塩、フェリムゾン、テブフロキン又はピロキサロンの水希釈液とを混合し、試験用薬液を調製した。

20 キャベツ (*Brassicae oleracea*) リーフディスク（直径1.5cm）を24穴マイクロプレート（Becton Dickinson製）の各ウェルに収容し、1ウェルあたり該試験用薬液40 μ Lを散布処理した。なお、展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水を40 μ L散布したウェルを無処理区とした。

25 風乾後、1ウェルあたりコナガ2齢幼虫 (*Plutella xylostella*) を5頭放飼し、ペーパータオルで各ウェルを覆った後、蓋をした。放飼2日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の死虫率を下記式1)より算出した。なお、試験は1反復で行った。

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

[0405]

表36

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物3 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物3 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物3 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物3 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物3 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物3 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物3 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物3 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物3 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物39 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物39 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物39 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物39 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
無処理区	-	0

[0406]

表37

供試化合物			濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物39	+	フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物39	+	フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物39	+	テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39	+	テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39	+	ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物39	+	ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物23	+	トリシクラゾール	200 + 2000	80
本縮合複素環化合物23	+	トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23	+	イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23	+	イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物23	+	イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23	+	プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物23	+	プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物23	+	フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物23	+	フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物23	+	カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	80
本縮合複素環化合物23	+	カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23	+	フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物23	+	フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物23	+	テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23	+	テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23	+	ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物23	+	ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74	+	トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74	+	トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74	+	イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74	+	イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74	+	イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74	+	プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物74	+	プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74	+	フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物74	+	フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74	+	カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74	+	カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74	+	フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物74	+	フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74	+	テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74	+	テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74	+	ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物74	+	ピロキロン	500 + 500	100
無処理区			—	0

[0407]

表38

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物83 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物83 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物83 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物83 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物83 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物83 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物83 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物83 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + ビロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物83 + ビロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物58 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物58 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物58 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + ビロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物58 + ビロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物31 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物31 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物31 + プロベナゾール	500 + 500	100
無処理区	-	0

[0408]

表39

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物31 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物31 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物31 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物31 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物31 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物31 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物56 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物56 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物56 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物56 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物46 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物46 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物46 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物46 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物46 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物46 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物46 + フェリムゾン	500 + 500	100
無処理区	—	0

[0409]

表40

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物46 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物46 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物105 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物105 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物105 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物105 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物91 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物91 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物91 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物91 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + トリシクラゾール	500 + 50	100
無処理区	—	0

[0410]

表41

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物107 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物107 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物107 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物107 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物107 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物51 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物51 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物51 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物51 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物51 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物51 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物51 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物51 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物51 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物27 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物27 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物27 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物27 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物27 + フサライド	500 + 500	100
無処理区	-	0

[0411]

表42

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物27 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物27 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物27 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + ビロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物27 + ビロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物108 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物108 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物108 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + ビロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物108 + ビロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物48 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物48 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物48 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + テブフロキン	500 + 50	100
無処理区	-	0

[0412]

表43

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物48 + ビロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物48 + ビロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物97 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物97 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物97 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物97 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物97 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物97 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物97 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物97 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + ビロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物97 + ビロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物69 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物69 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物69 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物69 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物69 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物69 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物69 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物69 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + ビロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物69 + ビロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物109 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物109 + イソチアニル	500 + 50	100
無処理区	—	0

[0413]

表44

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物109 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物109 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物109 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物109 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物109 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物109 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物109 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物109 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物72 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物72 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物72 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物72 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物72 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物72 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物72 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物72 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物72 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物78 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物78 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物78 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物78 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物78 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物78 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
無処理区	-	0

[0414]

表45

供試化合物		濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物78	+ フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物78	+ フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物78	+ テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78	+ テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78	+ ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物78	+ ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物64	+ トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64	+ トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64	+ イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64	+ イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物64	+ イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64	+ プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物64	+ プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物64	+ フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物64	+ フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物64	+ カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64	+ カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64	+ フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物64	+ フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物64	+ テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64	+ テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64	+ ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物64	+ ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物120	+ トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120	+ トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120	+ イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120	+ イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物120	+ イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120	+ プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物120	+ プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物120	+ フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物120	+ フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物120	+ カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120	+ カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120	+ フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物120	+ フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物120	+ テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120	+ テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120	+ ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物120	+ ピロキロン	500 + 500	100
無処理区		-	0

[0415]

表46

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物127 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物127 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物127 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物127 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物127 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物127 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物127 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物127 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物127 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物42 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物42 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物42 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物42 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物42 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物42 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物42 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物42 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物42 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物41 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物41 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物41 + プロベナゾール	500 + 500	100
無処理区	—	0

[0416]

表47

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物41 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物41 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物41 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物41 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物41 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物41 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物104 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物104 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物104 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物104 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物104 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物104 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物104 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物104 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物104 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物118 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物118 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物118 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物118 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物118 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物118 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物118 + フェリムゾン	500 + 500	100
無処理区	-	0

[0417]

表48

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物118 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物118 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物119 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物119 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物119 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物119 + ピロキロン	500 + 500	100
無処理区	—	0

[表 48] (続き)

供試化合物	濃度(ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物130 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物130 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物130 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物130 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物130 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物130 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物130 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物130 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物130 + ピロキロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + トリシクラゾール	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + トリシクラゾール	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + イソチアニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + イソチアニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + イソチアニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + プロベナゾール	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物131 + プロベナゾール	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + フサライド	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物131 + フサライド	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + カスガマイシン塩酸塩	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + カスガマイシン塩酸塩	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + フェリムゾン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物131 + フェリムゾン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + テブフロキン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + テブフロキン	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + ピロキロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物131 + ピロキロン	500 + 500	100
無処理区	-	0

[0418]

5 試験例 5

本縮合複素環化合物 3、23、27、31、39、41、42、46、48、51、56、58、64、69、72、74、78、83、91、97、104、105、107、108、109、118、119、120、127、130及び131をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤(商品名:ソルポール 3005X、東邦化学工業製)の混合溶媒10μLで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤(商品名:シンダイン、住友化学製)0.02容量%を含有する水で希釈した。

バリダマイシンA (商品名: バリダシン液剤5、住友化学性) の市販製剤を所定濃度になるよう展着剤 (商品名: シンダイン、住友化学製) 0.02容量%を含有する水で希釈した。

- 5 フラメトピル (和光純薬製) 及びペンシクロン (和光純薬製) をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤 (商品名: ソルポール 3005X、東邦化学工業製) の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤 (商品名: シンダイン、住友化学製) 0.02容量%を含有する水で希釈した。

上記本縮合複素環化合物の水希釈液とバリダマイシンA、フラメトピル又はペンシクロンの水希釈液とを混合し、試験用薬液を調製した。

- 10 キャベツ (*Brassicae oleracea*) リーフディスク (直径1.5cm) を24穴マイクロプレート (Becton Dickinson製) の各ウェルに収容し、1ウェルあたり該試験用薬液40 μ Lを散布処理した。なお、展着剤 (商品名: シンダイン、住友化学製) 0.02容量%を含有する水を40 μ L散布したウェルを無処理区とした。

- 15 風乾後、1ウェルあたりコナガ2齢幼虫 (*Plutella xylostella*) を5頭放飼し、ペーパータオルで各ウェルを覆った後、蓋をした。放飼2日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の死虫率を下記式1)より算出した。なお、試験は1反復で行った。

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

[0419]

表49

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物3 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物3 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物3 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物3 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物39 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物39 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物39 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物23 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物23 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物23 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物23 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物74 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物74 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物83 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物83 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物83 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + バリダマイシンA	500 + 50	100
無処理区	—	0

[0420]

表50

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物58 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物58 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物31 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物31 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物56 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物46 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物46 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物105 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物105 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物91 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物91 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物107 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物107 + ペンシクロン	500 + 500	100
無処理区	—	0

[0421]

表51

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物51 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物51 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物51 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物27 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物27 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物27 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物108 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物48 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物97 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物97 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物69 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物69 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物109 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + フラメトピル	500 + 50	100
無処理区	-	0

[0422]

表52

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物109 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物109 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物72 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物72 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物78 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物78 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物64 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物64 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物120 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物120 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物127 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物127 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物42 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物42 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物41 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + バリダマイシンA	500 + 50	100
無処理区	—	0

[0423]

表53

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物41 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物41 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物104 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物104 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物118 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物118 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物119 + ペンシクロン	500 + 500	100
無処理区	—	0

[表53] (続き)

供試化合物	濃度(ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物130 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物130 + ペンシクロン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + バリダマイシンA	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + バリダマイシンA	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + フラメトピル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + フラメトピル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + ペンシクロン	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物131 + ペンシクロン	500 + 500	100
無処理区	—	0

5

[0424]

試験例6

本縮合複素環化合物3、23、27、31、39、41、42、46、48、51、56、58、64、69、72、74、78、83、91、97、104、105、107、108、109、118、119、120、127、130及び131をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤(商品

名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製)の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤(商品名：シンダイン、住友化学製)0.02容量%を含有する水で希釈した。

フルトラニル(和光純薬製)、フルオピラム、ペンフルフェン、セダキサシ及びフルキサ
5 ピロキサドをそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤(商品名：ソルポール 3005X、東邦化学工業製)の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤(商品名：シンダイン、住友化学製)0.02容量%を含有する水で希釈した。

上記本縮合複素環化合物の水希釈液とフルトラニル、フルオピラム、ペンフルフェン、セ
10 ダキサシ又はフルキサピロキサドの水希釈液とを混合し、試験用薬液を調製した。キャベツ(Brassicae oleracea)リーフディスク(直径1.5cm)を24穴マイクロプレート(Becton Dickinson製)の各ウェルに収容し、1ウェルあたり該試験用薬液40 μ Lを散布処理した。なお、展着剤(商品名：シンダイン、住友化学製)0.02容量%を含有する水を40 μ L散布したウェルを無処理区とした。

15 風乾後、1ウェルあたりコナガ2齢幼虫(Plutella xylostella)を5頭放飼し、ペーパータオルで各ウェルを覆った後、蓋をした。放飼2日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の死虫率を下記式1)より算出した。なお、試験は1反復で行った。
式1) 死虫率(%) = (供試虫数 - 生存虫数) / 供試虫数 \times 100

[0425]

表54

供試化合物			濃度 (ppm)	死出率
本縮合複素環化合物3	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物3	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物39	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物39	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物23	+	フルトラニル	200 + 5000	80
本縮合複素環化合物23	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物74	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物83	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物83	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物58	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物31	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物31	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物56	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物46	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物46	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物105	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物91	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物107	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物51	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物51	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物27	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物27	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物108	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48	+	フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物48	+	フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物97	+	フルトラニル	200 + 5000	80
本縮合複素環化合物97	+	フルトラニル	500 + 500	100
無処理区			-	0

[0 4 2 6]

表 5 5

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 6 9 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 6 9 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 9 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 9 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 7 2 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	8 0
本縮合複素環化合物 7 2 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 7 8 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	8 0
本縮合複素環化合物 7 8 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 6 4 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 6 4 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 0 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 0 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 4 2 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 4 2 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 4 1 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	8 0
本縮合複素環化合物 4 1 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + フルトラニル	2 0 0 + 5 0 0 0	8 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + フルトラニル	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + フルオピラム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + フルオピラム	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + ペンフルフェン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + ペンフルフェン	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + ペンフルフェン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + セダキサン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + セダキサン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + フルキサピロキサド	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 7 + フルキサピロキサド	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + フルオピラム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + フルオピラム	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + ペンフルフェン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + ペンフルフェン	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + ペンフルフェン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + セダキサン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + セダキサン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + フルキサピロキサド	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 4 + フルキサピロキサド	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + フルオピラム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + フルオピラム	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
無処理区	-	0

[0427]

表56

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物105 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物105 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物105 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物105 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物105 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物107 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物107 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物107 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物107 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物107 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物107 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物108 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物108 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物108 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物108 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物108 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物109 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物109 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物109 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物109 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物109 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物58 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物58 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物58 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
無処理区	-	0

[0428]

表57

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物58 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物58 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物64 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物64 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物64 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物64 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物64 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物118 + フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物118 + フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物118 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物118 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物118 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物118 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物118 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物119 + フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物119 + フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物119 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物119 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物119 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物119 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物120 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物120 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物120 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
無処理区	-	0

[0 4 2 9]

表 5 8

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 1 2 0 + セダキサン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 0 + セダキサン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 0 + フルキサピロキサド	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 0 + フルキサピロキサド	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + フルオピラム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + フルオピラム	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + ペンフルフェン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + ペンフルフェン	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + ペンフルフェン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + セダキサン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + セダキサン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + フルキサピロキサド	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 2 7 + フルキサピロキサド	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + フルオピラム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + フルオピラム	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + ペンフルフェン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + ペンフルフェン	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + ペンフルフェン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + セダキサン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + セダキサン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + フルキサピロキサド	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 3 + フルキサピロキサド	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + フルオピラム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + フルオピラム	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + ペンフルフェン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + ペンフルフェン	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + ペンフルフェン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + セダキサン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + セダキサン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + フルキサピロキサド	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 3 + フルキサピロキサド	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + フルオピラム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + フルオピラム	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + ペンフルフェン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + ペンフルフェン	5 0 0 + 5 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + ペンフルフェン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + セダキサン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + セダキサン	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + フルキサピロキサド	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + フルキサピロキサド	5 0 0 + 0 . 5	1 0 0
無処理区	—	0

[0430]

表59

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物31 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物31 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物31 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物31 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物31 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物69 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物69 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物69 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物69 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物69 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物72 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物72 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物72 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物72 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物72 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物74 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物74 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物74 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物74 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物74 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物74 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物78 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + フルオピラム	500 + 0.5	100
無処理区	—	0

[0431]

表60

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物78 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物78 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物78 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物78 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物39 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物39 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物39 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物39 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物39 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物39 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物41 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物41 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物41 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物41 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物41 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物42 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物42 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物42 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物42 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物42 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物46 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物46 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物46 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
無処理区	-	0

[0432]

表61

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物46 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物46 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物56 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物56 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物56 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物56 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物56 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物83 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物83 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物83 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物83 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物83 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物48 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物48 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物48 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物48 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物48 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物91 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物91 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物91 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物91 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物91 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物91 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
無処理区	—	0

[0433]

表62

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物51 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物51 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物51 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物51 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物51 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物51 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
無処理区	-	0

[表62] (続き)

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物130 + フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物130 + フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物130 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物130 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物130 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物130 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物130 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物131 + フルトラニル	200 + 5000	100
本縮合複素環化合物131 + フルトラニル	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + フルオピラム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + フルオピラム	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物131 + ペンフルフェン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + ペンフルフェン	500 + 500	100
本縮合複素環化合物131 + ペンフルフェン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物131 + セダキサン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + セダキサン	500 + 0.5	100
本縮合複素環化合物131 + フルキサピロキサド	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + フルキサピロキサド	500 + 0.5	100
無処理区	-	0

5

[0434]

試験例7

本縮合複素環化合物3、23、27、31、39、41、42、46、48、51、56、58、64、69、72、74、78、83、91、97、104、105、107、108、109、118、119、120、127、130及び131をそれぞれ1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤(商品名:ソルポール3005X、東邦化学工業製)の混合溶媒10μLで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤(商品名:シンダイン、住友化学製)0.02容量%を含有する水で希釈

した。

- フルジオキサニル（商品名：GEOXE、Syngenta製）、トルクロフホスメチル（商品名：リゾレックス水和剤、住友化学製）及びキャプタン（商品名：オーソサイド水和剤、日産化学工業製）の各市販製剤をそれぞれ所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

- エタボキサムを1mgあたり、容量比がそれぞれ4:4:1であるキシレン、ジメチルホルムアミド及び界面活性剤（商品名：ソルポール3005X、東邦化学工業製）の混合溶媒10 μ Lで溶解した後、所定濃度になるよう展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水で希釈した。

上記本縮合複素環化合物の水希釈液と、フルジオキサニル、トルクロホスメチル、キャプタン又はエタボキサムの水希釈液とを混合し、試験用薬液を調製した。

- キャベツ（*Brassicae oleracea*）リーフディスク（直径1.5cm）を24穴マイクロプレート（Becton Dickinson製）の各ウェルに収容し、1ウェルあたり該試験用薬液40 μ Lを散布処理した。なお、展着剤（商品名：シンダイン、住友化学製）0.02容量%を含有する水を40 μ L散布したウェルを無処理区とした。

- 風乾後、1ウェルあたりコナガ2齢幼虫（*Plutella xylostella*）を5頭放飼し、ペーパータオルで各ウェルを覆った後、蓋をした。放飼2日後に、各ウェルの生存虫数を観察した。

処理区及び無処理区の死虫率を下記式1)より算出した。なお、試験は1反復で行った。

式1) 死虫率(%) = (供試虫数 - 生存虫数) / 供試虫数 × 100

[0 4 3 5]

表 6 3

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 3 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 3 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 9 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 9 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 3 9 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 9 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 9 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 9 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 9 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 3 9 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 3 9 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 3 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 3 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 2 3 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 3 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 3 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 3 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 3 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 2 3 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 2 3 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 7 4 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 7 4 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 7 4 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物 8 3 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物 8 3 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物 8 3 + フルジオキソニル	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0436]

表64

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物83 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物83 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物83 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物58 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物58 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物58 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物31 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物31 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物31 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物56 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物56 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物56 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物46 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物46 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物46 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0 4 3 7]

表 6 5

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物 4 6 + キャプタン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 4 6 + キャプタン	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + フルジオキシニル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + エタボキサム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + エタボキサム	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + トルクロホスメチル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + トルクロホスメチル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + キャプタン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 5 + キャプタン	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + フルジオキシニル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + エタボキサム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + エタボキサム	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + トルクロホスメチル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + トルクロホスメチル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + キャプタン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 9 1 + キャプタン	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + フルジオキシニル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + エタボキサム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + エタボキサム	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + トルクロホスメチル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + トルクロホスメチル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + キャプタン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 1 0 7 + キャプタン	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + フルジオキシニル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + エタボキサム	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + エタボキサム	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + トルクロホスメチル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + トルクロホスメチル	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + キャプタン	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 5 1 + キャプタン	5 0 0 + 5	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + フルジオキシニル	2 0 0 + 2 0 0 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5 0	1 0 0
本縮合複素環化合物 2 7 + フルジオキシニル	5 0 0 + 5	1 0 0
無処理区	—	0

[0438]

表66

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物27 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物27 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物27 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物108 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物108 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物108 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物48 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物48 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物48 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物97 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物97 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物97 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + フルジオキサニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + フルジオキサニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物69 + フルジオキサニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物69 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0439]

表67

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物69 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物69 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + フルジオキシニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + フルジオキシニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物109 + フルジオキシニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物109 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物109 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + フルジオキシニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + フルジオキシニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物72 + フルジオキシニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物72 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物72 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + フルジオキシニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + フルジオキシニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物78 + フルジオキシニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物78 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物78 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + フルジオキシニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + フルジオキシニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物64 + フルジオキシニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物64 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物64 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + フルジオキシニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + フルジオキシニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物120 + フルジオキシニル	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0440]

表68

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物120 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物120 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物120 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物127 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物127 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物127 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物42 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物42 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物42 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物41 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物41 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物41 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物104 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物104 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
無処理区	-	0

[0441]

表69

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物104 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物104 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物118 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物118 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物118 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物119 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物119 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物119 + キャプタン	500 + 5	100
無処理区	—	0

[表69] (続き)

供試化合物	濃度 (ppm)	死虫率
本縮合複素環化合物130 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物130 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物130 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物130 + キャプタン	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + フルジオキソニル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + フルジオキソニル	500 + 50	100
本縮合複素環化合物131 + フルジオキソニル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + エタボキサム	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + エタボキサム	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + トルクロホスメチル	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + トルクロホスメチル	500 + 5	100
本縮合複素環化合物131 + キャプタン	200 + 2000	100
本縮合複素環化合物131 + キャプタン	500 + 5	100
無処理区	—	0

5

[産業上の利用可能性]

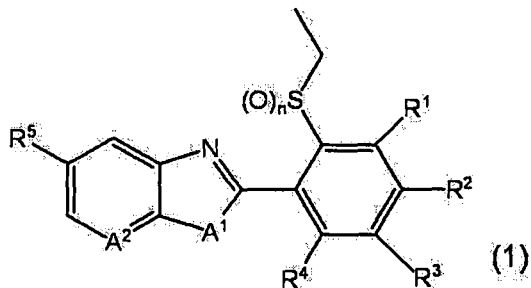
[0442]

本発明の有害節足動物防除組成物によれば、有害節足動物を防除することが可能となる。

請求の範囲

[請求項1]

式(1)



5

[式中、

A1は-NR6-、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A2は窒素原子又は=CH-を表し、

10 R1、R2、R3及びR4は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、-OR7、-S(O)mR7、ハロゲン原子、又は水素原子を表し(但し、R1、R2、R3及びR4のうち、少なくとも2つは水素原子を表す。)、

15 R5は、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、-OR7、-S(O)mR7、又はハロゲン原子を表し、

R6は群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基又は水素原子を表し、

20 R7は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基又は水素原子を表し、

mは0、1又は2を表し、nは0、1又は2を表す。

ここで、-S(O)mR7において、mが1又は2の場合には、R7が水素原子を表すことはない。

25 群X：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルキニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルホニル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

30 群Z：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基及びハロゲン原子からなる群。

群W：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C3アルキニルオキシ基、ハロゲン原子及びヒドロキシ基からなる群。]

- 5 示される化合物と、群(A)より選ばれる1種以上の殺菌化合物とを含有する有害節足動物防除組成物。

群(A)

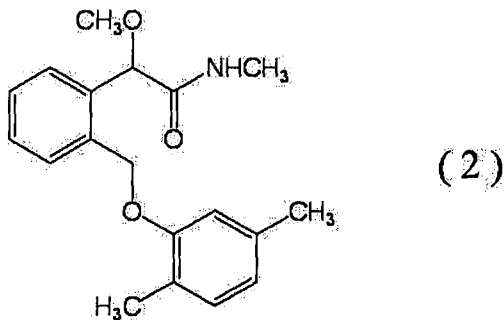
A-1：アゾール

- 10 テブコナゾール、メトコナゾール、ジフェノコナゾール、トリチコナゾール、イマザリル、
 トリアジメノール、フルキンコナゾール、プロクロラズ、プロチオコナゾール、ジニコナゾール、
 ジニコナゾールM、シプロコナゾール、テトラコナゾール、イブコナゾール、トリホ
 リン、ピリフェノックス、フェナリモル、ヌアリモール、オキシポコナゾールフマル酸塩、
 ペフラゾエート、トリフルミゾール、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、
 15 エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、ヘキサコ
 ナゾール、イミベンコナゾール、マイクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、シ
 メコナゾール及びトリアジメホン

A-2：ストロビルリン

- 20 クレソキシムメチル、アゾキシストロビン、ピラクロストロビン、ピコキシストロビン、エ
 ネストロビン、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、フルオキサストロビン、オ
 リサストロビン、ファモキサドン、フェナミドン、メトミノストロビン及び下記式(2)で
 示される化合物

式(2)



- 25 A-3：フェニルアミド

メタラキシル、メタラキシル-M、フララキシル-M、ベナラキシル、ベナラキシル-M、
 オフレース及びオキサジキシル

A-4：イネいもち病防除化合物

- 30 プロベナゾール、チアジニル、トリシクラゾール、ピロキロン、カスガマイシン塩酸塩、フ
 ェリムゾン、イソチアニル、フサライド及びテブフロキン

A-5：イネ紋枯病防除化合物

ペンシクロン、フラメトピル及びバリダマイシン

A-6：カルボキサミド

カルボキシン、フルトラニル、ペンチオピラド、フルオピラム、ペンフルフェン、セダキサ
ン及びフルキサピロキサド

A-7：その他

フルジオキソニル、エタボキサム、トルクロホスメチル及びキャプタン

5 [請求項2]

式(1)で示される化合物と群(A)より選ばれる1種以上の殺菌化合物との含有量の比が、
重量比で10000：1～1：100である請求項1に記載の有害節足動物防除組成物。

[請求項3]

- 10 式(1)で示される化合物と群(A)より選ばれる1種以上の殺菌化合物との含有量の比が、
重量比で1000：1～1：10である請求項1に記載の有害節足動物防除組成物。

[請求項4]

請求項1～3のいずれかに記載の有害節足動物防除組成物の有効量を、植物又は植物を栽培
する土壤に施用する工程を有する有害節足動物の防除方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/066128

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

See extra sheet.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A01N43/52, A01N37/18, A01N37/24, A01N37/46, A01N37/50, A01N43/12, A01N43/16, A01N43/32, A01N43/36, A01N43/40, A01N43/42, A01N43/54, A01N43/56, A01N43/653, A01N43/76, A01N43/78, A01N43/80, A01N43/88, A01N43/90, A01N47/02, A01N47/04,

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

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2013
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2013	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2013

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

CAplus/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2012/086848 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.), 28 June 2012 (28.06.2012), claims; paragraph [0307] & TW 201234965 A	1-4
A	JP 2008-308448 A (Sankyo Agro Co., Ltd.), 25 December 2008 (25.12.2008), claims (Family: none)	1-4
A	JP 2005-505524 A (Syngenta Ltd.), 24 February 2005 (24.02.2005), claims; paragraph [0036] & US 2004/0209776 A1 & EP 1414818 A1 & WO 2003/011861 A1	1-4

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date

“L” document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

“&” document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
01 July, 2013 (01.07.13)

Date of mailing of the international search report
09 July, 2013 (09.07.13)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2013/066128

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(International Patent Classification (IPC))

A01N43/52(2006.01)i, A01N37/18(2006.01)i, A01N37/24(2006.01)i,
A01N37/46(2006.01)i, A01N37/50(2006.01)i, A01N43/12(2006.01)i,
A01N43/16(2006.01)i, A01N43/32(2006.01)i, A01N43/36(2006.01)i,
A01N43/40(2006.01)i, A01N43/42(2006.01)i, A01N43/54(2006.01)i,
A01N43/56(2006.01)i, A01N43/653(2006.01)i, A01N43/76(2006.01)i,
A01N43/78(2006.01)i, A01N43/80(2006.01)i, A01N43/88(2006.01)i,
A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01N47/04(2006.01)i,
A01N47/24(2006.01)i, A01N57/14(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national
classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (International Patent Classification (IPC))

A01N47/24, A01N57/14, A01P7/04

Minimum documentation searched (classification system followed by
classification symbols)

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. 特別ページ参照

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A01N43/52, A01N37/18, A01N37/24, A01N37/46, A01N37/50, A01N43/12, A01N43/16, A01N43/32, A01N43/36, A01N43/40, A01N43/42, A01N43/54, A01N43/56, A01N43/653, A01N43/76, A01N43/78, A01N43/80, A01N43/88, A01N43/90, A01N47/02, A01N47/04, A01N47/24, A01N57/14, A01P7/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2013年
日本国実用新案登録公報	1996-2013年
日本国登録実用新案公報	1994-2013年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
P, X	WO 2012/086848 A1 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 2012.06.28 請求の範囲, [0307] & TW 201234965 A	1-4
A	JP 2008-308448 A (三共アグロ株式会社) 2008.12.25 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-4
A	JP 2005-505524 A (シンジェンタ リミテッド) 2005.02.24 特許請求の範囲, [0036] & US 2004/0209776 A1 & EP 1414818 A1 & WO 2003/011861 A1	1-4

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献
 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

01.07.2013

国際調査報告の発送日

09.07.2013

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)
 郵便番号100-8915
 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

爾見 武志

電話番号 03-3581-1101 内線 3443

4H

9547

発明の属する分野の分類

A01N43/52(2006.01)i, A01N37/18(2006.01)i, A01N37/24(2006.01)i, A01N37/46(2006.01)i,
A01N37/50(2006.01)i, A01N43/12(2006.01)i, A01N43/16(2006.01)i, A01N43/32(2006.01)i,
A01N43/36(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01N43/42(2006.01)i, A01N43/54(2006.01)i,
A01N43/56(2006.01)i, A01N43/653(2006.01)i, A01N43/76(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i,
A01N43/80(2006.01)i, A01N43/88(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i,
A01N47/04(2006.01)i, A01N47/24(2006.01)i, A01N57/14(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i