

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2012-180339

(P2012-180339A)

(43) 公開日 平成24年9月20日(2012.9.20)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
C07D 261/04 (2006.01)	C07D 261/04 C S P	4C056
A61P 33/14 (2006.01)	A61P 33/14	4C086
A61K 31/42 (2006.01)	A61K 31/42	4H011
A01N 43/80 (2006.01)	A01N 43/80 I O I	
A01P 7/02 (2006.01)	A01P 7/02	

審査請求 未請求 請求項の数 10 O L (全 43 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2011-278013 (P2011-278013)
 (22) 出願日 平成23年12月20日(2011.12.20)
 (31) 優先権主張番号 特願2010-283357 (P2010-283357)
 (32) 優先日 平成22年12月20日(2010.12.20)
 (33) 優先権主張国 日本国(JP)
 (31) 優先権主張番号 特願2011-24462 (P2011-24462)
 (32) 優先日 平成23年2月7日(2011.2.7)
 (33) 優先権主張国 日本国(JP)

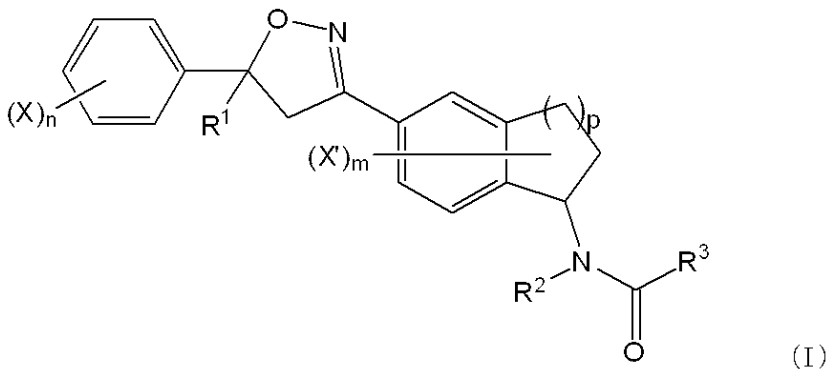
(71) 出願人 000004307
 日本曹達株式会社
 東京都千代田区大手町2丁目2番1号
 (74) 代理人 100109508
 弁理士 菊間 忠之
 (72) 発明者 久保田 靖
 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社内
 (72) 発明者 明石 真也
 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社内
 Fターム(参考) 4C056 AA01 AB01 AC01 AD01 AE02
 FA07 FA13 FB01 FC01
 4C086 AA01 AA02 AA03 BC67 MA01
 MA04 NA14 ZB37 ZC61
 最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 イソオキサゾリン化合物および有害生物防除剤

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】工業的に有利に合成でき、効果が確実で、特に安全に使用でき、安定な製剤化が可能な化合物、これを有効成分とする有害生物防除剤の提供。

【解決手段】式(I)で表されるイソオキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーからなる結晶。

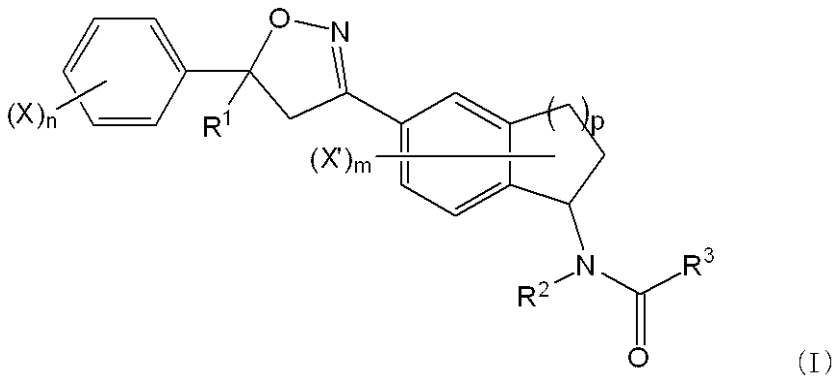


(Xはハロゲン原子などを、nはXの置換数を、X'はハロゲン原子などを、mはX'の置換数を、R¹はC1~6ハロアルキル基を、R²は水素原子などを、R³は水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基などを示す。pは括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ1または2のいずれかの整数である。)

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1)



10

(式 (1) 中、X は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

n は、X の置換数を示し且つ 0 ~ 5 のいずれかの整数である。n が 2 以上のとき、X 同士は互いに同一でも異なってもよい。

X' は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

20

m は、X' の置換数を示し且つ 0 ~ 6 のいずれかの整数である。m が 2 以上のとき、X' 同士は互いに同一でも異なってもよい。

R¹ は、C 1 ~ 6 ハロアルキル基を示す。

R² は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。

R³ は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有する C 6 ~ 10 アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

30

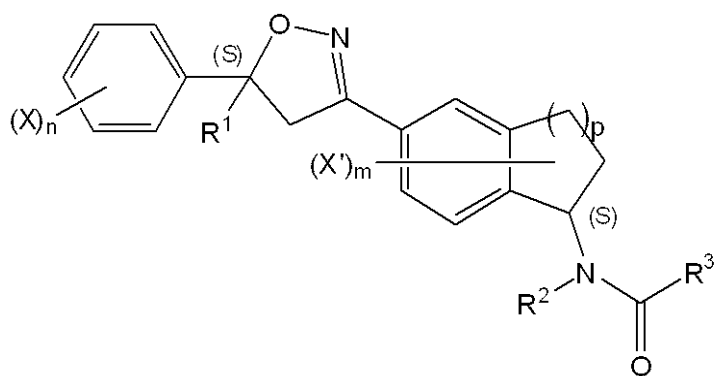
p は、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ 1 または 2 のいずれかの整数である。) で表されるイソオキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーからなるイソオキサゾリン化合物の結晶。

【請求項 2】

前記の式 (1) で表されるイソオキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーが、式 (1-1)

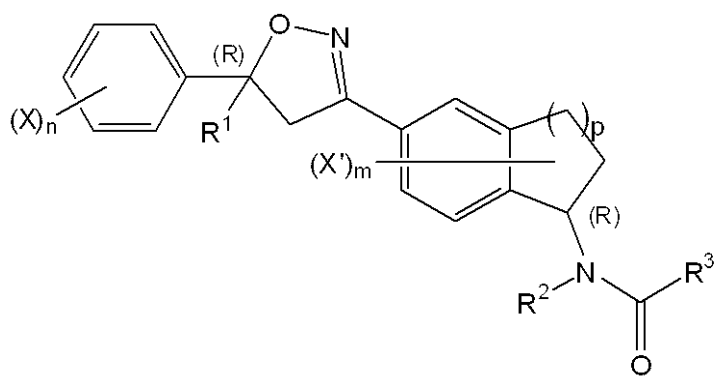
40

-1)



10

(式(I-1)中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、およびpは、前記式(1)におけるものと同じ意味を示す。)で表されるイソオキサゾリン化合物、および式(I-2)



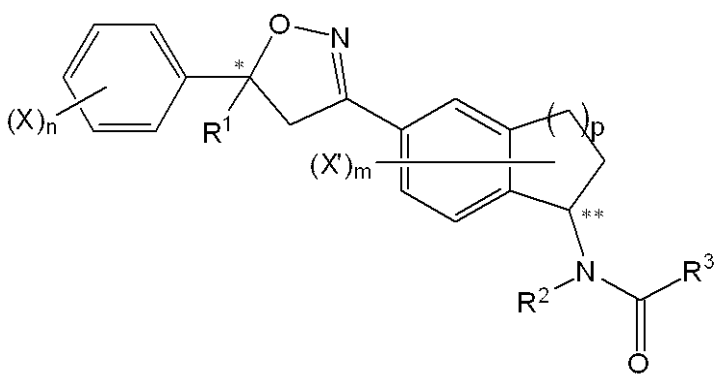
20

(式(I-2)中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、およびpは、前記式(1)におけるものと同じ意味を示す。)で表されるイソオキサゾリン化合物の2つの立体異性体の組み合わせであることを特徴とする請求項1に記載のイソオキサゾリン化合物の結晶。

【請求項3】

式(II)

30



40

(式(II)中、Xは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

nは、Xの置換数を示し且つ0~5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、X同士は互いに同一でも異なってもよい。

X'は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

mは、X'の置換数を示し且つ0~6のいずれかの整数である。mが2以上のとき、X'同士は互いに同一でも異なってもよい。

50

R¹は、C 1 ~ 6 ハロアルキル基を示す。

R²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。

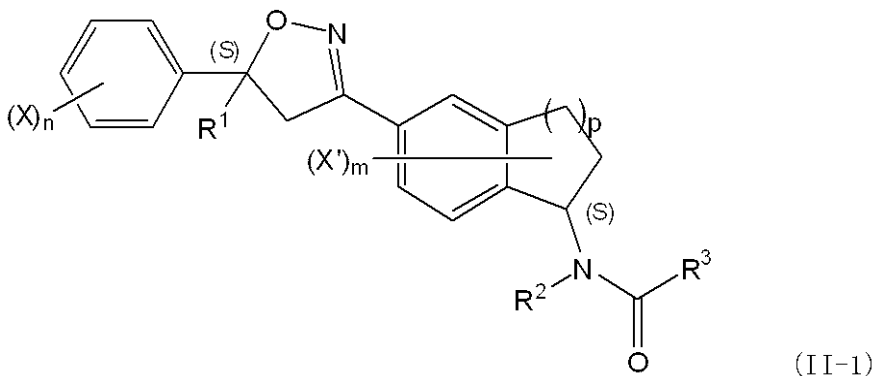
R³は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 6 ~ 10 アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

p は、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ 1 または 2 のいずれかの整数である。

* および**は、光学活性な炭素原子を示す。) で表される光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩。

【請求項 4】

前記の式 (II) で表される光学活性イソオキサゾリン化合物が、式 (II-1)



(式 (II-1) 中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、および p は、前記式 (II) におけるものと同じ意味を示す。) で表されることを特徴とする請求項 3 に記載のイソオキサゾリン化合物またはその塩。

【請求項 5】

請求項 1 もしくは請求項 2 に記載の結晶、または請求項 3 もしくは請求項 4 に記載の光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。

【請求項 6】

請求項 1 もしくは請求項 2 に記載の結晶、または請求項 3 もしくは請求項 4 に記載の光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する殺虫剤。

【請求項 7】

請求項 1 もしくは請求項 2 に記載の結晶、または請求項 3 もしくは請求項 4 に記載の光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する殺ダニ剤。

【請求項 8】

請求項 1 もしくは請求項 2 に記載の結晶、または請求項 3 もしくは請求項 4 に記載の光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する動物用外部寄生虫防除剤。

【請求項 9】

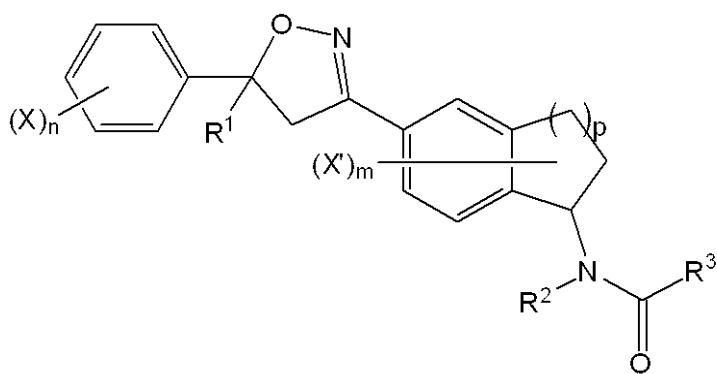
式 (I)

10

20

30

40



(I)

10

(式(I)中、Xは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

nは、Xの置換数を示し且つ0 ~ 5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、X同士は互いに同一でも異なってもよい。

X'は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

mは、X'の置換数を示し且つ0 ~ 6のいずれかの整数である。mが2以上のとき、X'同士は互いに同一でも異なってもよい。

20

R¹は、C 1 ~ 6 ハロアルキル基を示す。

R²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。

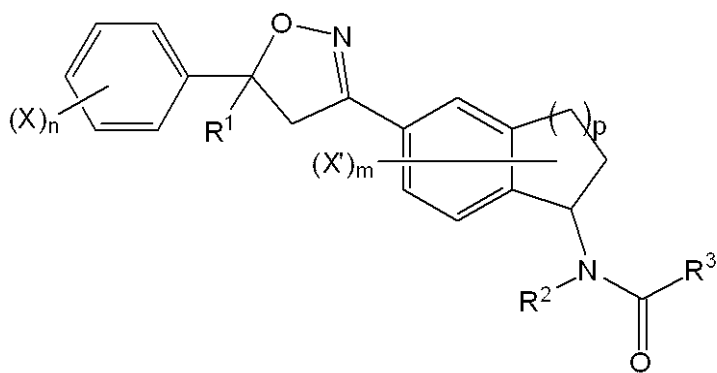
R³は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 6 ~ 10 アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

30

pは、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ1または2のいずれかの整数である。) で表されるイソオキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物を、エーテル系溶媒、エステル系溶媒、ハロゲン系溶媒、または炭化水素系溶媒のいずれか2種以上を混合した溶媒に溶解させて、その後晶析することにより、請求項1に記載の単一のジアステレオマーからなるイソオキサゾリン化合物の結晶を製造する方法。

【請求項10】

式(I)



(I)

40

(式(I)中、Xは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル

50

基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

n は、X の置換数を示し且つ 0 ~ 5 のいずれかの整数である。n が 2 以上のとき、X 同士は互いに同一でも異なってもよい。

X' は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

m は、X' の置換数を示し且つ 0 ~ 6 のいずれかの整数である。m が 2 以上のとき、X' 同士は互いに同一でも異なってもよい。

R¹ は、C 1 ~ 6 ハロアルキル基を示す。

R² は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。

R³ は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 6 ~ 10 アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

p は、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ 1 または 2 のいずれかの整数である。
) で表されるイソオキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物を、エーテル系溶媒、エステル系溶媒、ハロゲン系溶媒、または炭化水素系溶媒のいずれか 2 種以上を混合した溶媒に溶解させて、その後晶析することにより、請求項 2 に記載の式 (1-1) および式 (1-2) で表されるイソオキサゾリン化合物の 2 つの立体異性体の組み合わせからなるイソオキサゾリン化合物の結晶を製造する方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、イソオキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーからなる結晶、光学活性なイソオキサゾリン化合物、および有害生物防除剤に関する。

【背景技術】

【0002】

農園芸分野や畜産分野等において、多数の殺虫剤、殺ダニ剤などの有害生物防除剤が使用されているが、それらは、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じさせたり、あるいは人畜魚類などに対する毒性が強かったりする。そのため、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

【0003】

本発明に関連して特許文献 1 には、本発明化合物と同一の骨格を有する化合物が記載されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

【特許文献 1】W O 2 0 0 9 / 0 2 2 7 4 6

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

本発明は、工業的に有利に合成でき、効果が確実で、特に安全に使用できる有害生物防除剤の有効成分と成り得るとともに、安定な製剤化が可能な、イソオキサゾリン化合物の

10

20

30

40

50

単一のジアステレオマーからなる結晶、光学活性なイソオキサゾリン化合物またはその塩、およびこれらの化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤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】

【0006】

本発明者らは、上記課題を解決するために鋭意探索を行った。そして、本発明者らは、農作物の生育を助けるための薬剤の有効成分として特許文献1などで知られているイソオキサゾリン化合物またはその塩に着目し、検討を重ねた。その結果、特許文献1に記載のイソオキサゾリン化合物またはその塩を光学分割して得られる特定の光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩が、効力と安全性を両立しうることを見出した。また、安定な製剤化が可能な、単一のジアステレオマーからなるイソオキサゾリン化合物の結晶、およびその製造方法を見出した。本発明は、これらの知見に基づいて完成するに至ったものである。

10

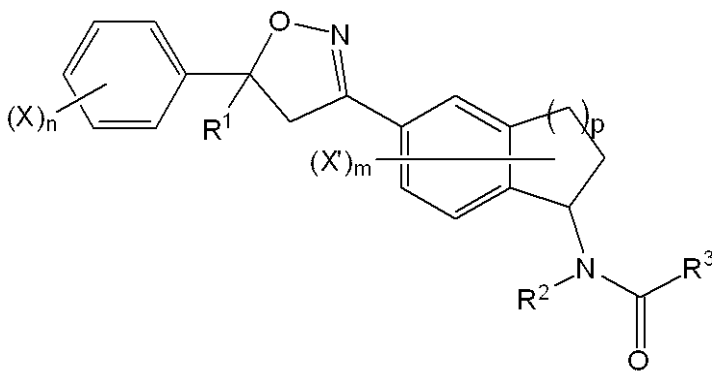
【0007】

すなわち、本発明は、以下のものを含む。

〔1〕式(1)で表されるイソオキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーからなる結晶。

【0008】

【化1】



20

(式(1)中、Xは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

30

nは、Xの置換数を示し且つ0~5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、X同士は互いに同一でも異なってもよい。

X'は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

mは、X'の置換数を示し且つ0~6のいずれかの整数である。mが2以上のとき、X'同士は互いに同一でも異なってもよい。

40

R¹は、C1~6ハロアルキル基を示す。

R²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC1~7アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシカルボニル基を示す。

R³は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC2~6アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC2~6アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC3~8シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC2~6アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC2~6アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC6~10アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

50

p は、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ 1 または 2 のいずれかの整数である。

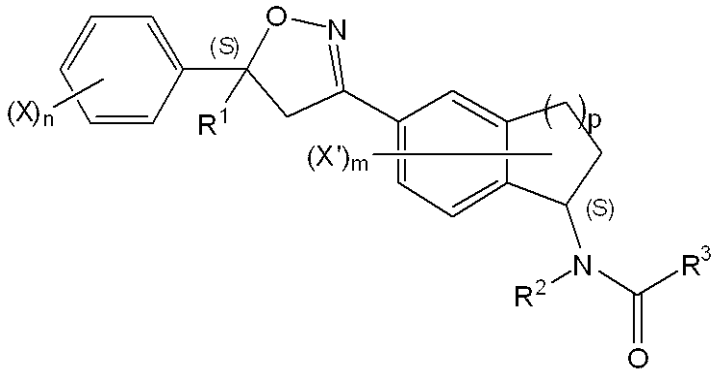
)

【0009】

〔2〕式(1-1)で表されるイソオキサゾリン化合物と式(1-2)で表されるイソオキサゾリン化合物との組み合わせからなる結晶。

【0010】

【化2】



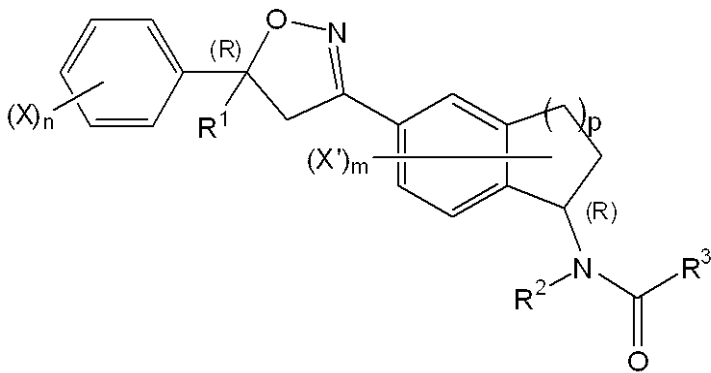
(I-1)

10

(式(1-1)中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、およびpは、前記式(1)におけるものと同じ意味を示す。)

【0011】

【化3】



(I-2)

30

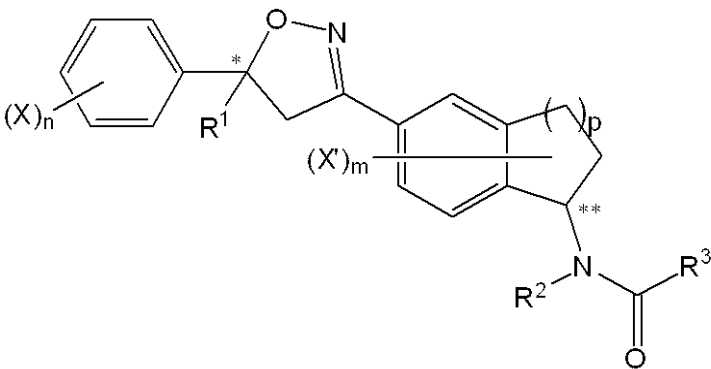
(式(1-2)中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、およびpは、前記式(1)におけるものと同じ意味を示す。)

【0012】

〔3〕式(II)で表される光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩。

【0013】

【化4】



(II)

40

(式(II)中、Xは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

50

n は、X の置換数を示し且つ 0 ~ 5 のいずれかの整数である。n が 2 以上のとき、X 同士は互いに同一でも異なってもよい。

X' は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

m は、X' の置換数を示し且つ 0 ~ 6 のいずれかの整数である。m が 2 以上のとき、X' 同士は互いに同一でも異なってもよい。

R¹ は、C 1 ~ 6 ハロアルキル基を示す。

R² は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。

R³ は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有する C 6 ~ 10 アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

p は、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ 1 または 2 のいずれかの整数である。

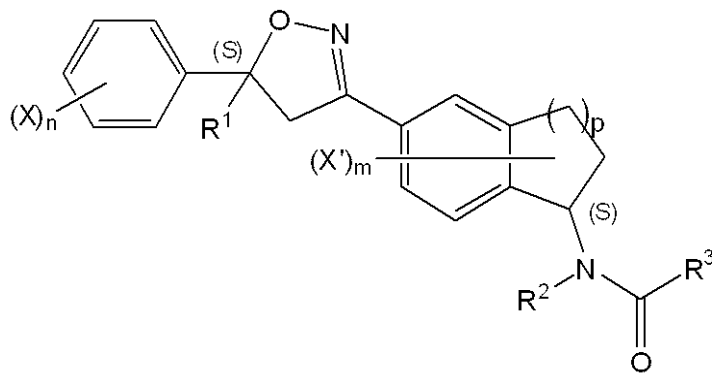
* および**は、光学活性な炭素原子を示す。)

【0014】

〔4〕式(II-1)で表される光学活性イソキサゾリン化合物またはその塩。

【0015】

【化5】



(II-1)

(式(II-1)中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、およびpは、前記式(II)におけるものと同じ意味を示す。)

【0016】

〔5〕〔1〕もしくは〔2〕に記載の結晶、または〔3〕もしくは〔4〕に記載の光学活性イソキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。

〔6〕〔1〕もしくは〔2〕に記載の結晶、または〔3〕もしくは〔4〕に記載の光学活性イソキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する殺虫剤。

〔7〕〔1〕もしくは〔2〕に記載の結晶、または〔3〕もしくは〔4〕に記載の光学活性イソキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する殺ダニ剤。

〔8〕〔1〕もしくは〔2〕に記載の結晶、または〔3〕もしくは〔4〕に記載の光学活性イソキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する動物用外部寄生虫防除剤。

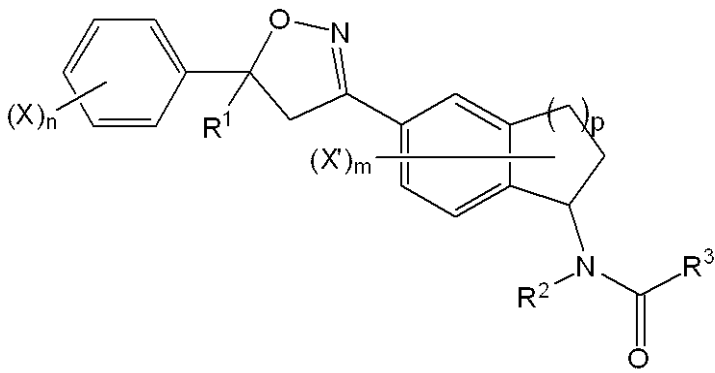
【0017】

〔9〕式(1)で表されるイソキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物を、エーテル系溶媒、エステル系溶媒、ハロゲン系溶媒、または炭化水素系溶媒のいずれか2種以上を混合した溶媒に溶解させて、その後晶析することを含む、〔1〕に記載の結晶を製造

する方法。

【0018】

【化6】



(I)

10

(式(I)中、Xは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

nは、Xの置換数を示し且つ0~5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、X同士は互いに同一でも異なってもよい。

X'は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

20

mは、X'の置換数を示し且つ0~6のいずれかの整数である。mが2以上のとき、X'同士は互いに同一でも異なってもよい。

R¹は、C1~6ハロアルキル基を示す。

R²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC1~7アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシカルボニル基を示す。

R³は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC2~6アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC2~6アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC3~8シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC2~6アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC2~6アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC6~10アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

30

pは、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ1または2のいずれかの整数である。

)

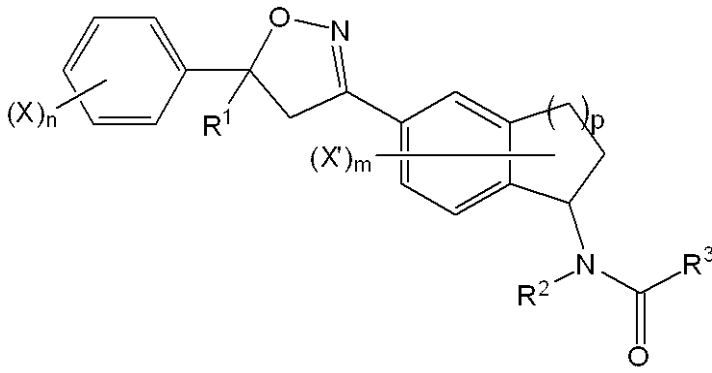
【0019】

〔10〕式(I)で表されるイソオキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物を、エーテル系溶媒、エステル系溶媒、ハロゲン系溶媒、または炭化水素系溶媒のいずれか2種以上を混合した溶媒に溶解させて、その後晶析することを含む、〔2〕に記載の結晶を製造する方法。

40

【0020】

【化 7】



10

(式(1)中、Xは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

nは、Xの置換数を示し且つ0 ~ 5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、X同士は互いに同一でも異なってもよい。

X'は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。

mは、X'の置換数を示し且つ0 ~ 6のいずれかの整数である。mが2以上のとき、X'同士は互いに同一でも異なってもよい。

20

R¹は、C 1 ~ 6 ハロアルキル基を示す。

R²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 7 アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコシカルボニル基を示す。

R³は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有するC 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有するC 6 ~ 10 アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

30

pは、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ1または2のいずれかの整数である。

)

【発明の効果】

【0021】

本発明によれば、工業的に有利に合成でき、効果が確実で、特に安全に使用できる有害生物防除剤の有効成分となり得る光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩が提供される。また、安定な製剤化が可能な、イソオキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーからなる結晶、およびその製造方法が提供される。

40

これらのイソオキサゾリン化合物またはその塩は、殺虫剤、殺ダニ剤、衛生害虫防除剤、動物用外部寄生虫防除剤などに有効である。

【図面の簡単な説明】

【0022】

【図1】製造実施例3(1)で使用したジアステレオマーの混合物のHPLCチャートを示す図である。

【図2】製造実施例3(1)で得られた結晶のHPLCチャートを示す図である。

【図3】製造実施例3(2)で使用したジアステレオマーの混合物のHPLCチャートを示す図である。

【図4】製造実施例3(2)で得られた結晶のHPLCチャートを示す図である。

50

【図5】製造実施例3(3)で使用したジアステレオマーの混合物のHPLCチャートを示す図である。

【図6】製造実施例3(3)で得られた結晶のHPLCチャートを示す図である。

【発明を実施するための形態】

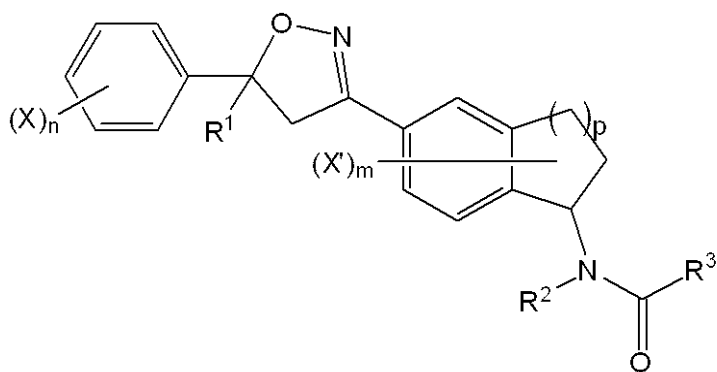
【0023】

〔イソキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーからなる結晶〕

本発明に係る式(1)で表されるイソキサゾリン化合物の単一のジアステレオマーからなる結晶は、比較的高い融点と、その融解の始点と終点の温度幅が狭く、物質として安定な特性を示し、製剤化時および製剤中での安定性に優れるという特長を有する。ここで「単一のジアステレオマー」は、複数存在する異性体のうちジアステレオマーの関係にあるいずれか一組の異性体の組合せである。

【0024】

【化8】



(I)

【0025】

一般にジアステレオマーの混合物は、アモルファス状であることが多く、融点が低い。またジアステレオマーの混合物が結晶として得られる場合であってもその結晶化の再現性に乏しい。さらに不純物を多く含むなど、実際の製剤化に向かないものである。一方、本発明に係る化合物は一般的なジアステレオマー混合物に比べて優れた特性を有する。

【0026】

以下に、式(1)において使用されている記号、用語などの意味を示す。

まず、「無置換の」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。「置換基を有する」との記載がなく母核となる基の名称のみで記載しているときは、別段の断りがない限り「無置換の」意味である。

一方、「置換基を有する」の用語は、母核となる基のいずれかの水素原子が、母核と同一または異なる構造の基で置換されていることを意味する。従って、「置換基」は、母核となる基に結合した他の基である。置換基は1つであってもよいし、2つ以上であってもよい。2つ以上の置換基は同一であってもよいし、異なるものであってもよい。

「C1~6」などの用語は、母核となる基の炭素原子数が1~6個などであることを表している。この炭素原子数には、置換基の中に在る炭素原子の数を含まない。例えば、置換基としてエトキシ基を有するブチル基は、C2アルコキシC4アルキル基に分類する。

【0027】

「置換基」は化学的に許容され、本発明の効果を有する限りにおいて特に制限されない。

「置換基」となり得る基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子；メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基などのC1~6アルキル基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘブチル基などのC3~8シクロアルキル基；ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2

10

20

30

40

50

- ペンテニル基、3 - ペンテニル基、4 - ペンテニル基、1 - メチル - 2 - ブテニル基、2 - メチル - 2 - ブテニル基、1 - ヘキセニル基、2 - ヘキセニル基、3 - ヘキセニル基、4 - ヘキセニル基、5 - ヘキセニル基などのC 2 ~ 6アルケニル基； 2 - シクロプロペニル基、2 - シクロペンテニル基、3 - シクロヘキセニル基、4 - シクロオクテニル基などのC 3 ~ 8シクロアルケニル基； エチニル基、1 - プロピニル基、2 - プロピニル基、1 - ブチニル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、1 - メチル - 2 - プロピニル基、2 - メチル - 3 - ブチニル基、1 - ペンチニル基、2 - ペンチニル基、3 - ペンチニル基、4 - ペンチニル基、1 - メチル - 2 - ブチニル基、2 - メチル - 3 - ペンチニル基、1 - ヘキシニル基、1, 1 - ジメチル - 2 - ブチニル基などのC 2 ~ 6アルキニル基；

【0028】

メトキシ基、エトキシ基、n - プロポキシ基、i - プロポキシ基、n - ブトキシ基、s - ブトキシ基、i - ブトキシ基、t - ブトキシ基などのC 1 ~ 6アルコキシ基； ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのC 2 ~ 6アルケニルオキシ基； エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのC 2 ~ 6アルキニルオキシ基； フェニル基、ナフチル基などのC 6 ~ 10アリール基； フェノキシ基、1 - ナフトキシ基などのC 6 ~ 10アリールオキシ基； ベンジル基、フェネチル基などのC 7 ~ 11アラルキル基； ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC 7 ~ 11アラルキルオキシ基； ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基、シクロヘキシルカルボニル基などのC 1 ~ 7アシル基； ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、シクロヘキシルカルボニルオキシ基などのC 1 ~ 7アシルオキシ基； メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n - プロポキシカルボニル基、i - プロポキシカルボニル基、n - ブトキシカルボニル基、t - ブトキシカルボニル基などのC 1 ~ 6アルコキシカルボニル基； カルボキシル基；

【0029】

水酸基； オキソ基； クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1, 2 - ジクロロ - n - プロピル基、1 - フルオロ - n - ブチル基、パーフルオロ - n - ペンチル基などのC 1 ~ 6ハロアルキル基； 2 - クロロ - 1 - プロペニル基、2 - フルオロ - 1 - ブテニル基などのC 2 ~ 6ハロアルケニル基； 4, 4 - ジクロロ - 1 - ブチニル基、4 - フルオロ - 1 - ペンチニル基、5 - プロモ - 2 - ペンチニル基などのC 2 ~ 6ハロアルキニル基； 2 - クロロ - n - プロポキシ基、2, 3 - ジクロロブトキシ基などのC 1 ~ 6ハロアルコキシ基； 2 - クロロプロペニルオキシ基、3 - プロモブテニルオキシ基などのC 2 ~ 6ハロアルケニルオキシ基； 4 - クロロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、2, 4 - ジクロロフェニル基などのC 6 ~ 10ハロアリール基； 4 - フルオロフェニルオキシ基、4 - クロロ - 1 - ナフトキシ基などのC 6 ~ 10ハロアリールオキシ基； クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4 - クロロベンゾイル基などのハロゲン置換C 1 ~ 7アシル基；

【0030】

シアノ基； イソシアノ基； ニトロ基； イソシアナト基； シアナト基； アミノ基； メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのC 1 ~ 6アルキルアミノ基； アニリノ基、ナフチルアミノ基などのC 6 ~ 10アリールアミノ基； ベンジルアミノ基、フェニルエチルアミノ基などのC 7 ~ 11アラルキルアミノ基； ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチリルアミノ基、i - プロピルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などのC 1 ~ 7アシルアミノ基； メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、n - プロポキシカルボニルアミノ基、i - プロポキシカルボニルアミノ基などのC 1 ~ 6アルコキシカルボニルアミノ基； アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、N - フェニル - N - メチルアミノカルボニル基などの無置換の若しくは置換基を有するアミノカルボニル基； イミノメチル基、(1 - イミノ)エチル基、(1 - イミノ) - n - プロピル基などのイミノ基で置換されたC 1 ~ 6アルキル基； ヒドロキシイミノメチル基、(1 - ヒドロキシイミノ)エチル基、(1 - ヒドロキシイミノ)プロピル基、メトキシイミノメチル基

10

20

30

40

50

、(1-メトキシイミノ)エチル基などのヒドロキシイミノ基またはアルコキシイミノ基で置換されたC1~6アルキル基；

【0031】

メルカプト基；メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、i-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、s-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基などのC1~6アルキルチオ基；ビニルチオ基、アリルチオ基などのC2~6アルケニルチオ基；エチニルチオ基、プロパルギルチオ基などのC2~6アルキニルチオ基；フェニルチオ基、ナフチルチオ基などのC6~10アリールチオ基；チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などのヘテロアリールチオ基；

【0032】

メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、t-ブチルスルフィニル基などのC1~6アルキルスルフィニル基；アリルスルフィニル基などのC2~6アルケニルスルフィニル基；プロパルギルスルフィニル基などのC2~6アルキニルスルフィニル基；フェニルスルフィニル基などのC6~10アリールスルフィニル基；チアゾリルスルフィニル基、ピリジルスルフィニル基などのヘテロアリールスルフィニル基；ベンジルスルフィニル基、フェネチルスルフィニル基などのC7~11アラルキルスルフィニル基；

メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基などのC1~6アルキルスルホニル基；アリルスルホニル基などのC2~6アルケニルスルホニル基；プロパルギルスルホニル基などのC2~6アルキニルスルホニル基；フェニルスルホニル基などのC6~10アリールスルホニル基；チアゾリルスルホニル基、ピリジルスルホニル基などのヘテロアリールスルホニル基；ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基などのC7~11アラルキルスルホニル基；

【0033】

ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などの5員ヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダニジル基、トリアジニル基などの6員ヘテロアリール基；アジリジニル基、エポキシ基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基などの飽和ヘテロシクリル基；トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、t-ブチルジメチルシリル基などのトリC1~6アルキル置換シリル基；トリフェニルシリル基；などを挙げるができる。

【0034】

また、これらの「置換基」は、当該基の中のいずれかの水素原子がさらに別の「置換基」で置換されたものであってもよい。

【0035】

(X)

式(1)中のXは、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。nは、Xの置換数を示し且つ0~5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、X同士は互いに同一でも異なってもよい。

【0036】

Xにおける「C1~6アルキル基」は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。アルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、i-プロピル基、i-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、i-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、2,2-ジメチルプロピル基、i-ヘキシル基などを挙げるができる。

【0037】

Xにおける「置換基を有するC1~6アルキル基」としては、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、2-シクロオクチルエチル基などのC3~8シクロアルキルC1~6アルキル基；

10

20

30

40

50

フルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジプロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリプロモメチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、4 - フルオロブチル基、4 - クロロブチル基、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル基、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - トリフルオロメチルエチル基、パーフルオロヘキシル基、パークロロヘキシル基、2, 4, 6 - トリクロロヘキシル基などのC 1 ~ 6ハロアルキル基；

【0038】

ヒドロキシメチル基、2 - ヒドロキシエチル基などのヒドロキシC 1 ~ 6アルキル基；
 メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メトキシ - n - プロピル基、n - プロポキシメチル基、i - プロポキシエチル基、s - ブトキシメチル基、t - ブトキシエチル基などのC 1 ~ 6アルコキシC 1 ~ 6アルキル基；
 メトキシメトキシメチル基、1 - メトキシエトキシメチル基、2 - メトキシエトキシメチル基、2 - (1 - メトキシエトキシ)エチル基、2 - (2 - メトキシエトキシ)エチル基などのC 1 ~ 6アルコキシC 1 ~ 6アルコキシC 1 ~ 6アルキル基；
 ジメトキシメチル基、ジエトキシメチル基、2, 2 - ジメトキシエチル基、1, 2 - ジメトキシエチル基、3, 3 - ジメトキシn - プロピル基、2, 2 - ジエトキシエチル基などのジC 1 ~ 6アルコキシC 1 ~ 6アルキル基；
 ホルミルオキシメチル基、アセトキシメチル基、2 - アセトキシエチル基、プロピオニルオキシメチル基、プロピオニルオキシエチル基などのC 1 ~ 7アシルオキシC 1 ~ 6アルキル基；
 イミノメチル基、(1 - イミノ)エチル基、(1 - イミノ)プロピル基などのイミノ基で置換されたC 1 ~ 6アルキル基；
 ヒドロキシイミノメチル基、(1 - ヒドロキシイミノ)エチル基、(1 - ヒドロキシイミノ) - n - プロピル基、メトキシイミノメチル基、(1 - メトキシイミノ)エチル基などのヒドロキシイミノ基またはアルコキシイミノ基で置換されたC 1 ~ 6アルキル基；
 無置換の若しくは置換基を有するベンジル基、無置換の若しくは置換基を有するフェネチル基などの無置換の若しくは置換基を有するC 7 ~ 11アラルキル基；
 などを挙げるができる。

10

20

【0039】

Xにおける「C 1 ~ 6アルコキシ基」としては、メトキシ基、エトキシ基、i - プロポキシ基、n - ブトキシ基、i - ブトキシ基、s - ブトキシ基、t - ブトキシ基、n - ペンチルオキシ基、i - ペンチルオキシ基、n - ヘキシルオキシ基などを挙げるができる。

30

Xにおける「置換基を有するC 1 ~ 6アルコキシ基」としては、フルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、プロモメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、ジプロモメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、トリプロモメトキシ基、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ基、2, 2, 2 - トリクロロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、4 - フルオロブトキシ基、3, 3, 3 - トリフルオロプロポキシ基、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - トリフルオロメチルエトキシ基、パーフルオロヘキシルオキシ基などのC 1 ~ 6ハロアルコキシ基；
 メトキシメトキシ基、1 - メトキシエトキシ基、2 - メトキシエトキシ基、エトキシメトキシ基、1 - エトキシエトキシ基、2 - エトキシエトキシ基、1 - メトキシ - n - プロポキシ基、2 - メトキシ - n - プロポキシ基、3 - メトキシ - n - プロポキシ基などのC 1 ~ 6アルコキシC 1 ~ 6アルコキシ基；
 シクロプロピルメトキシ基、シクロブチルメトキシ基、シクロペンチルメトキシ基、シクロヘキシルメトキシ基、2 - メチルシクロプロピルメトキシ基、2, 3 - ジメチルシクロプロピルメトキシ基、2 - シクロプロピルエトキシ基などのC 3 ~ 8シクロアルキルC 1 ~ 6アルコキシ基；
 ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC 7 ~ 11アラルキルオキシ基；
 などを挙げるができる。

40

【0040】

これらのうち、Xは、ハロゲン原子、またはC 1 ~ 6ハロアルキル基であることが好ましい。

【0041】

50

(X')

式(1)中のX'は、ハロゲン原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、水酸基、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシ基、ニトロ基、またはシアノ基を示す。mは、X'の置換数を示し且つ0~6のいずれかの整数である。mが2以上のとき、X'同士は互いに同一でも異なってもよい。

【0042】

X'における「C1~6アルキル基」、および「C1~6アルコキシ基」としては、前記Xにおいて挙げたそれらと同じものを挙げるができる。

【0043】

(R¹)

式(1)中のR¹は、C1~6ハロアルキル基を示す。

【0044】

R¹における「C1~6ハロアルキル基」としては、フルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジプロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリプロモメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、2,2,2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、3,3,3-トリフルオロプロピル基、2,2,2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル基、パーフルオロヘキシル基、パークロロヘキシル基、2,4,6-トリクロロヘキシル基などを挙げるができる。

これらのうち、R¹は、トリフルオロメチル基であることが好ましい。

【0045】

(R²)

式(1)中のR²は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルキル基、無置換のもしくは置換基を有するC1~7アシル基、または無置換のもしくは置換基を有するC1~6アルコキシカルボニル基を示す。

【0046】

R²における「C1~6アルキル基」としては、前記Xにおいて挙げたそれと同じものを挙げるができる。

【0047】

R²における「C1~7アシル基」としては、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基などを挙げるができる。

R²における「置換基を有するC1~7アシル基」としては、クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのハロゲン置換C1~7アシル基を挙げるができる。

【0048】

R²における「C1~6アルコキシカルボニル基」としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基などを挙げるができる。

R²における「置換基を有するC1~6アルコキシカルボニル基」としては、シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、2-メチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2,3-ジメチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-クロロシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-シクロプロピルエトキシカルボニル基などのC3~8シクロアルキルC1~6アルコキシカルボニル基；フルオロメトキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、プロモメトキシカルボニル基、ジフルオロメトキシカルボニル基、ジクロロメトキシカルボニル基、ジプロモメトキシカルボニル基、トリフルオロメトキシカルボニル基、トリクロロメトキシカルボニル基、トリプロモメトキシカルボニル基、2,2,2-トリフルオロエトキシカルボニル基、2,2,2-トリクロロエトキシカルボニル基、ペンタフルオロエトキシカルボニル基、4-フルオロブトキシカルボニル基、3,3,3-トリフルオロプロポキシカルボニル基、2,2,2-トリ

10

20

30

40

50

フルオロ - 1 - トリフルオロメチルエトキシカルボニル基、パーフルオロヘキシルオキシカルボニル基などの C 1 ~ 6 ハロアルコキシカルボニル基；などを挙げることができる。

【 0 0 4 9 】

(R³)

式 (1) 中の R³は、水素原子、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニル基、無置換のもしくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換のもしくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、無置換のもしくは置換基を有する C 6 ~ 1 0 アリール基、または無置換のもしくは置換基を有するヘテロ環基を示す。

10

【 0 0 5 0 】

R³における「 C 1 ~ 6 アルキル基」、および「 C 1 ~ 6 アルコキシ基」としては、前記 X において挙げたそれらと同じものを挙げることができる。

【 0 0 5 1 】

R³における「 C 2 ~ 6 アルケニル基」としては、ビニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、1 - ブテニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基、1 - メチル - 2 - プロペニル基、2 - メチル - 2 - プロペニル基、1 - ペンテニル基、2 - ペンテニル基、3 - ペンテニル基、4 - ペンテニル基、1 - メチル - 2 - ブテニル基、2 - メチル - 2 - ブテニル基、1 - ヘキセニル基、2 - ヘキセニル基、3 - ヘキセニル基、4 - ヘキセニル基、5 - ヘキセニル基などを挙げることができる。

20

R³における「置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル基」としては、2 - クロロ - 1 - プロペニル基、2 - フルオロ - 1 - ブテニル基などの C 2 ~ 6 ハロアルケニル基；などを挙げることができる。

【 0 0 5 2 】

R³における「 C 2 ~ 6 アルキニル基」としては、エチニル基、1 - プロピニル基、2 - プロピニル基、1 - ブチニル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基、1 - メチル - 2 - プロピニル基、2 - メチル - 3 - ブチニル基、1 - ペンチニル基、2 - ペンチニル基、3 - ペンチニル基、4 - ペンチニル基、1 - メチル - 2 - ブチニル基、2 - メチル - 3 - ペンチニル基、1 - ヘキシニル基、1, 1 - ジメチル - 2 - ブチニル基などを挙げることができる。

30

R³における「置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニル基」としては、4, 4 - ジクロロ - 1 - ブチニル基、4 - フルオロ - 1 - ペンチニル基、5 - プロモ - 2 - ペンチニル基などの C 2 ~ 6 ハロアルキニル基；などを挙げることができる。

【 0 0 5 3 】

R³における「 C 3 ~ 8 シクロアルキル基」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、シクロヘプチル基などを挙げることができる。

R³における「置換基を有するシクロアルキル基」としては、クロロシクロヘキシル基、プロモシクロヘキシル基、2 - メチルシクロプロピル基、2, 3 - ジメチルシクロプロピル基などを挙げることができる。

40

【 0 0 5 4 】

R³における「 C 2 ~ 6 アルケニルオキシ基」としては、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 - ブテニルオキシ基、2 - ブテニルオキシ基、3 - ブテニルオキシ基、1 - メチル - 2 - プロペニルオキシ基、2 - メチル - 2 - プロペニルオキシ基、1 - ペンテニルオキシ基、2 - ペンテニルオキシ基、1 - メチル - 2 - ブテニルオキシ基、2 - メチル - 2 - ブテニルオキシ基、1 - ヘキセニルオキシ基、2 - ヘキセニルオキシ基などを挙げることができる。

R³における「置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシ基」としては、2 - クロロ - 1 - プロペニルオキシ基、2 - フルオロ - 1 - ブテニルオキシ基などの C 2 ~ 6 ハロアル

50

ケニルオキシ基； などを挙げるができる。

【0055】

R³における「C2～6アルキニルオキシ基」としては、エチニルオキシ基、1-プロピニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、1-ブチニルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基、1-メチル-2-プロピニルオキシ基、2-メチル-3-ブチニルオキシ基、1-ペンチニルオキシ基、2-ペンチニルオキシ基、1-メチル-2-ブチニルオキシ基、2-メチル-3-ペンチニルオキシ基、1-ヘキシニルオキシ基などを挙げるができる。

R³における「置換基を有するC2～6アルキニルオキシ基」としては、4,4-ジクロロ-1-ブチニルオキシ基、4-フルオロ-1-ペンチニルオキシ基、5-プロモ-2-ペンチニルオキシ基などのC2～6ハロアルキニルオキシ基； などを挙げるができる。

10

【0056】

R³における「C6～10アリール基」は、単環であってもよいし、多環であってもよい。多環アリール基は、少なくとも一つの環が芳香環であれば、残りの環が飽和脂環、不飽和脂環または芳香環のいずれであってもよい。C6～10アリール基としては、フェニル基、ナフチル基、アズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げるができる。

【0057】

R³における「ヘテロ環基」は、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子が環を構成する原子として含むものである。ヘテロ環基は、単環であってもよいし、多環であってもよい。

20

ヘテロ環基としては、5員ヘテロアリール基、6員ヘテロアリール基、縮合ヘテロアリール基、飽和ヘテロ環基、部分不飽和ヘテロ環基などを挙げるができる。

【0058】

5員ヘテロアリール基としては、ピロール-1-イル基、ピロール-2-イル基、ピロール-3-イル基などのピロリル基； フラン-2-イル基、フラン-3-イル基などのフリル基； チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基などのチエニル基； イミダゾール-1-イル基、イミダゾール-2-イル基、イミダゾール-4-イル基、イミダゾール-5-イル基などのイミダゾリル基； ピラゾール-1-イル基、ピラゾール-3-イル基、ピラゾール-4-イル基、ピラゾール-5-イル基などのピラゾリル基； オキサゾール-2-イル基、オキサゾール-4-イル基、オキサゾール-5-イル基などのオキサゾリル基； イソオキサゾール-3-イル基、イソオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾール-5-イル基などのイソオキサゾリル基； チアゾール-2-イル基、チアゾール-4-イル基、チアゾール-5-イル基などのチアゾリル基； イソチアゾール-3-イル基、イソチアゾール-4-イル基、イソチアゾール-5-イル基などのイソチアゾリル基； 1,2,3-トリアゾール-1-イル基、1,2,3-トリアゾール-4-イル基、1,2,3-トリアゾール-5-イル基、1,2,4-トリアゾール-1-イル基、1,2,4-トリアゾール-3-イル基、1,2,4-トリアゾール-5-イル基などのトリアゾリル基； 1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル基、1,3,4-オキサジアゾール-2-イル基などのオキサジアゾリル基； 1,2,4-チアジアゾール-3-イル基、1,2,4-チアジアゾール-5-イル基、1,3,4-チアジアゾール-2-イル基などのチアジアゾリル基； テトラゾール-1-イル基、テトラゾール-2-イル基などのテトラゾリル基； などを挙げるができる。

30

40

【0059】

6員ヘテロアリール基としては、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基などのピリジル基； ピラジン-2-イル基、ピラジン-3-イル基などのピラジニル基； プリミジン-2-イル基、プリミジン-4-イル基、プリミジン-5-イル基などのプリミジニル基； ピリダジン-3-イル基、ピリダジン-4-イル

50

基などのピリダジニル基；トリアジニル基；などを挙げることができる。

【0060】

その他のヘテロ環基としては、アジリジン-1-イル基、アジリジン-2-イル基、エポキシ基；ピロリジン-1-イル基、ピロリジン-2-イル基、ピロリジン-3-イル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、テトラヒドロフラン-3-イル基；ピペリジン-1-イル基、ピペリジン-2-イル基、ピペリジン-3-イル基、ピペリジン-4-イル基、ピペラジン-1-イル基、ピペラジン-2-イル基、モルホリン-2-イル基、モルホリン-3-イル基、モルホリン-4-イル基；1,3-ベンゾジオキサソール-4-イル基、1,3-ベンゾジオキサソール-5-イル基、1,4-ベンゾジオキサソール-5-イル基、1,4-ベンゾジオキサソール-6-イル基、3,4-ジヒドロ-2H-1,5-ベンゾジオキサセピン-6-イル基、3,4-ジヒドロ-2H-1,5-ベンゾジオキサセピン-7-イル基、2,3-ジヒドロベンゾフラン-4-イル基、2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル基、2,3-ジヒドロベンゾフラン-6-イル基、2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル基；などを挙げることができる。

10

【0061】

これらのうち、 R^3 は、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシC1~6アルキル基、またはC1~6アルコキシC1~6アルコキシC1~6アルキル基であることが好ましい。

【0062】

(p)

pは、括弧内のメチレン基の繰返し数を示し且つ1または2のいずれかの整数である。pは1であることが好ましい。

pを含む環の部分は、pが1の場合はシクロペンタン環に成り、pが2の場合はシクロヘキサン環に成る。

20

式(1)においては、インダン環を有することが好ましい。

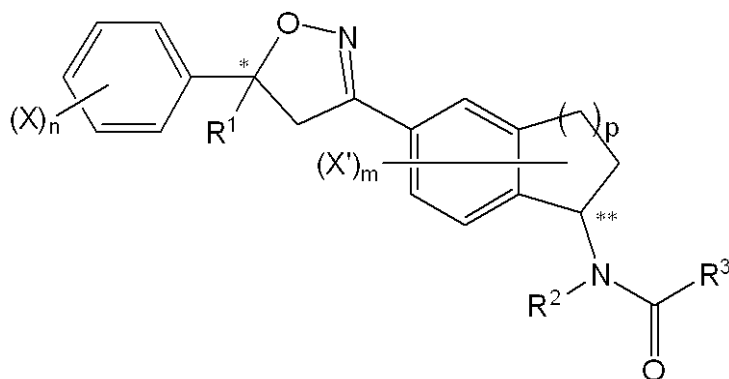
【0063】

式(1)で表されるイソオキサゾリン化合物は、下記の式(1)中のイソオキサゾリン上の*を付した炭素および飽和環上の**を付した炭素が、不斉炭素となる。(ここで、式(1)中、X、n、X'、m、 R^1 、 R^2 、 R^3 、およびpは、前記式(1)におけるものと同じ意味を示す。)

30

【0064】

【化9】



(1)

40

【0065】

そのため、式(1)で表されるイソオキサゾリン化合物は、最低でも4種の立体異性体が存在する。そのうちで、単一のジアステレオマーについては、比較的高い融点およびその融解の始点と終点の温度幅が狭い結晶となる。

【0066】

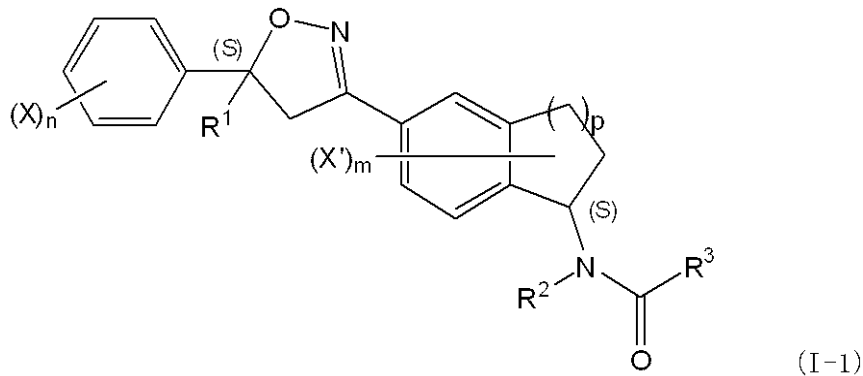
本発明においては、単一のジアステレオマーが、特に以下に示す式(1-1)で表されるイソオキサゾリン化合物(以下、(S,S)体ということがある。)と式(1-2)で表されるイソオキサゾリン化合物(以下、(R,R)体ということがある。)との組み合わせで

50

あることが好ましい。(ここで式中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、およびpは、前記式(1)におけるものと同じ意味を示す。)

【0067】

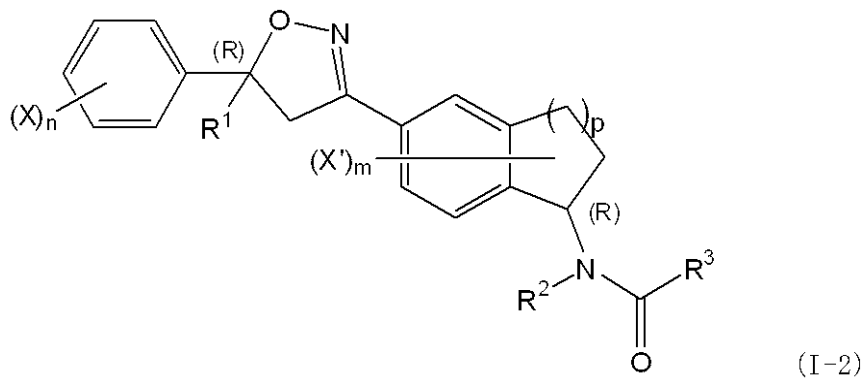
【化10】



10

【0068】

【化11】



20

【0069】

式(1)で表されるイソオキサゾリン化合物としては、WO2009/022746号パンフレットに記載されているイソオキサゾリン化合物が該当する。式(1)で表されるイソオキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物は、WO2009/022746号パンフレットに記載されている製造方法によって製造することができる。

30

そして、得られたイソオキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物を、エーテル系溶媒、エステル系溶媒、ハロゲン系溶媒、または炭化水素系溶媒のいずれか2種以上を混合した溶媒に溶解させて、その後晶析することにより、単一のジアステレオマーからなるイソオキサゾリン化合物の結晶を製造することができる。

【0070】

製造に用いることができるエーテル系溶媒としては、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、メチルt-ブチルエーテル、ジメトキシエタンなどが挙げられる。エステル系溶媒としては、酢酸エチル、酢酸n-プロピル、酢酸t-ブチルエステルなどが挙げられる。ハロゲン系溶媒としては、塩化メチレン、クロロホルム、1,1,1-トリクロロエタンなどが挙げられる。炭化水素系溶媒としては、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、ベンゼン、トルエンなどが挙げられる。

40

本発明においては、エステル系溶媒と炭化水素系溶媒の混合溶媒であることが好ましい。この場合、溶媒の比率は、イソオキサゾリン化合物に基づいて適宜選択することができるが、エステル系溶媒：炭化水素系溶媒 = 1 : 1 ~ 1 : 10程度であることが好ましい。

【0071】

式(1)で表されるイソオキサゾリン化合物の具体例としては、以下の化合物を挙げることができる。そして、これらの(S,S)体と対応する(R,R)体との組み合わせが本発明の単一のジアステレオマーからなるイソオキサゾリン化合物の結晶を構成する。

50

N - (5 - (5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N-(5-(5-(3,5-Dichloro-phenyl)-5-(trifluoromethyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、

3 - メトキシ - N - (5 - (5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : 3-methoxy-N-(5-(5-(3,5-Dichloro-phenyl)-5-(trifluoromethyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、

N - (5 - (5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N-(5-(5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、

3 - メトキシ - N - (5 - (5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド (英表記 : 3-methoxy-N-(5-(5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide]

【 0 0 7 2 】

(S , S) 体と対応する (R , R) 体との組み合わせは、比較的高い融点およびその融解の始点と終点の温度幅が狭い結晶を形成するとともに、含まれる (S , S) 体が、4種の立体異性体の中で最も活性が高いため、この結晶は有害生物防除剤の主成分として有効である。

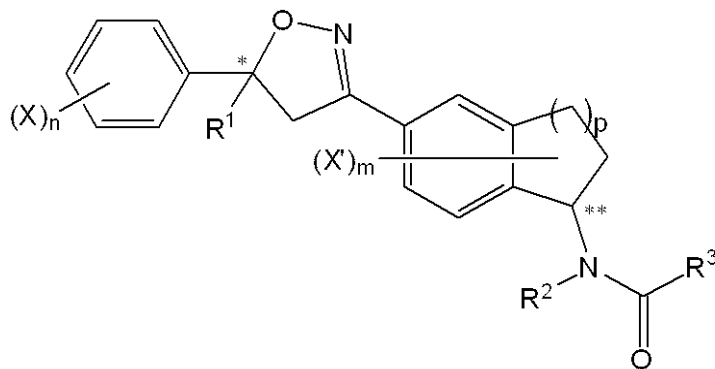
【 0 0 7 3 】

[光学活性イソキサゾリン化合物]

本発明の光学活性イソキサゾリン化合物は、式 (II) で表される化合物である。

【 0 0 7 4 】

【 化 1 2 】



【 0 0 7 5 】

式 (II) 中、X、n、X'、m、R¹、R²、R³、および p は、前記式 (I) におけるものと同じ意味を示す。

【 0 0 7 6 】

(* 、 **)

* および ** は、付された炭素原子が、光学活性であることを示し、その炭素原子についての特定の異性体の存在率が 50% より大きいことを意味する。好ましくは、当該 1 つの特定の異性体の存在率は、90% 以上、より好ましくは 95% 以上、さらにより好ましくは 98% 以上である。

【 0 0 7 7 】

光学活性イソキサゾリン化合物としては、先に述べた (S , S) 体、(R , R) 体以外に、これらと異なるジアステレオマーである (S , R) 体、(R , S) 体を挙げること

ができる。

【0078】

式(11)で表される光学活性イソキサゾリン化合物としては、WO2009/022746号パンフレットに記載されているイソキサゾリン化合物の光学活性体が該当する。式(11)で表される光学活性イソキサゾリン化合物は、WO2009/022746号パンフレットに記載されている製造方法によってイソキサゾリン化合物を得、それを公知の光学分割法で分割することによって得ることができ、また公知の不斉合成方法で合成することによって得ることができる。

【0079】

光学活性イソキサゾリン化合物の具体例としては、以下の化合物を挙げることができる。

N - ((R) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - (ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N - ((R) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) prop anamide] 、

N - ((R) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - (ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N - ((R) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) prop anamide] 、

N - ((S) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - (ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N - ((S) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) prop anamide] 、 および

N - ((S) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - (ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N - ((S) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) prop anamide]

【0080】

3 - メトキシ - N - ((R) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : 3 - methoxy - N - ((R) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) propanamide] 、

3 - メトキシ - N - ((R) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : 3 - methoxy - N - ((R) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) propanamide] 、

3 - メトキシ - N - ((S) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : 3 - methoxy - N - ((S) - 5 - ((R) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) propanamide] 、 および

3 - メトキシ - N - ((S) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : 3 - methoxy - N - ((S) - 5 - ((S) - 5 - (3 , 5 - Dichloro - phenyl) - 5 - (trifluoromethyl) - 4 , 5 - dihydroisoxazol - 3 - yl) - 2 , 3 - dihydro - 1H - inden - 1 - yl) propanamide]

10

20

30

40

50

)-5-(3,5-Dichloro-phenyl)-5-(trifluoromethyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide]

【 0 0 8 1 】

N - ((R) - 5 - ((S) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N-((R)-5-((S)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、

N - ((R) - 5 - ((R) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N-((R)-5-((R)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、

N - ((S) - 5 - ((R) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N-((S)-5-((R)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、 および

N - ((S) - 5 - ((S) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド [英表記 : N-((S)-5-((S)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide]

【 0 0 8 2 】

3 - メトキシ - N - ((R) - 5 - ((S) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド (英表記 : 3-methoxy-N-((R)-5-((S)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、

3 - メトキシ - N - ((R) - 5 - ((R) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド (英表記 : 3-methoxy-N-((R)-5-((R)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、

3 - メトキシ - N - ((S) - 5 - ((R) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド (英表記 : 3-methoxy-N-((S)-5-((R)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide] 、 および

3 - メトキシ - N - ((S) - 5 - ((S) - 5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミド (英表記 : 3-methoxy-N-((S)-5-((S)-5-(trifluoromethyl)-5-(3-(trifluoromethyl)phenyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)propanamide]

【 0 0 8 3 】

さらに、式 (II) で表される化合物の塩としては、塩酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩などの無機酸の塩；酢酸塩、乳酸塩、プロピオン酸塩、安息香酸塩などの有機酸の塩；を挙げることができる。

【 0 0 8 4 】

[有害生物防除剤]

10

20

30

40

50

本発明の有害生物防除剤は、本発明の光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩を有効成分として含有する。

防除対象としては、特に農作物、果樹、花卉、または樹木に付く害虫およびダニ類などの有害生物が挙げられる。

すなわち、本発明の有害生物防除剤は、上記の農作物などを保護対象とした殺虫剤、殺ダニ剤として有効である。

対象となる害虫、ダニ類の例を以下に示す。

(1) 鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ(*Agrotis ypsilon*)、タマナギンウワバ(*Autographa nigrisigna*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)、モモシクイガ(*Carposina sasakii*)、ナシヒメシクイ(*Grapholitha molesta*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、チャノホソガ(*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoniella*)、マイマイガ(*Lymantria dispar*)、チャドクガ(*Euproctis pseudoconsersa*)、ニカメイガ(*C. hilo suppressalis*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、ヨーロピアンコーンボラー(*Ostrinia nubilalis*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、スジマダラメイガ(*Cadra cautella*)、ヘリオティス属種(*Heliothis* spp.)、ヘリオベルバ属種(*Helioverpa*)、アグロティス属種(*Agrotis* spp.)、イガ(*Tinea translucens*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)など；

10

20

【0085】

(2) 半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、ニセダイコンアブラムシ(*Lipaphis erysimi*)、ムギクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum padi*)、ホソヘリカメムシ(*Riptortus clavatus*)、アオクサカメムシ(*A. crosternum hilare*)、ヤノネカイガラムシ(*Unaspis yanonensis*)、クワコナカイガラムシ(*Pseudococcus comstocki*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、シルバーリーフコナジラミ(*Bemisia argentifolii*)、ナシキジラミ(*Psylla pyricola*)、ナシグンバイ(*Stephanitis nashi*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、ヒメトビウンカ(*Laodelphax stratella*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)など；

30

【0086】

(3) 甲虫目害虫、例えば、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、ウリハムシ(*Aulacophora indica*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、コクゾウムシ(*Sitophilus oryzae*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、ヒメコガネ(*Anomala rufocuprea*)、ジアプロティカ属種(*Diabrotica* spp.)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus*)、ゴマダラカミキリ(*Anoplophora malasiaca*)、アグリオティス属(*Agriotes* spp.)、ニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintioctomaculata*)、コクヌスト(*Tenebroides mauritanicus*)、ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)など、；

40

【0087】

(4) 双翅目害虫、例えば、ウリミバエ(*Bactrocera cucurbitae*)、ミカンコミバエ(*B. actrocera dorsalis*)、タネバエ(*Delia platura*)、イネハモグリバエ(*Hydrellia griseola*)、キイロシヨウジョウバエ(*Drosophila melanogaster*)など；

(5) アザミウマ目害虫、例えば、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*)など；

(6) 膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、キイロスズメバチ(*Vespa simillima*)、カブラハバチ(*Athalia rosae*)など；

(7) 直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)など；

【0088】

50

(8) ゴキブリ目 (Blattodea) 害虫、例えば、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、コワモンゴキブリ (*Periplaneta australasiae*) など；

(9) シロアリ目害虫、例えば、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*) など、

(10) 植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ネグサレセンチュウ類、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) など；

10

【 0 0 8 9 】

対象となるダニ類 (Acarı) の例を以下に示す。

(1) 無気門目 (Astigmata) のコナダニ類 (Acaridida) ；

(a) コナダニ科 (Acaridae) のダニ、例えばリゾギルホス属種 (*Rhizoglyphus* spp.) の、ネダニ (*Rhizoglyphus echinopus*)、ロビンダニ (*Rhizoglyphus robini*)；ケナガコナダニ属種 (*Tyrophagus* spp.) の、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、オンシツケナガコナダニ (*Tyrophagus neiswanderi*)、オオケナガコナダニ (*Tyrophagus perniciosus*)、ハウレンソウケナガコナダニ (*Tyrophagus similis*)；その他、アシプトコナダニ (*Acarus siro*)、ムギコナダニ (*Aleuroglyphus ovatus*)、ニセケナガコナダニ (*Mycetoglyphus fungivorus*)；

20

【 0 0 9 0 】

(2) 前気門目 (Prostigmata) のケダニ類 (Actinedida) ；

(a) ハダニ科 (Tetranychidae) のダニ、例えばブリオピア属種 (*Bryobia* spp.) の、クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*)、ニセクローバーハダニ (*Bryobia rubrioculus*)；例えばエオテトラニクス属種 (*Eotetranychus* spp.) の、アンズハダニ (*Eotetranychus boreus*)、ミチノクハダニ (*Eotetranychus geniculatus*)、クリハダニ (*Eotetranychus pruni*)、クルミハダニ (*Eotetranychus uncatus*)、シイノキハダニ (*Eotetranychus shii*)、スギナミハダニ (*Eotetranychus suginamensis*)、エノキハダニ (*Eotetranychus celtis*)、スミスハダニ (*Eotetranychus smithi*)、コウノシロハダニ (*Eotetranychus asiaticus*)、ミヤケハダニ (*Eotetranychus kankitus*)；例えばオリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.) の、マンゴーハダニ (*Oligonychus mangiferus*)、アボガドハダニ (*Oligonychus perseae*)、エゾスギハダニ (*Oligonychus pustulosus*)、カラマツハダニ (*Oligonychus karamatus*)、スギノハダニ (*Oligonychus hondoensis*)、チビコブハダニ (*Oligonychus ilicis*)、トドマツハダニ (*Oligonychus ununguis*)、イネハダニ (*Oligonychus shinkajii*)、サトウキビハダニ (*Oligonychus orthius*)；例えばパノニクス属種 (*Panonychus* spp.) の、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、クワオオハダニ (*Panonychus mori*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)；例えばテトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.) の、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*)、ミズナラハダニ (*Tetranychus quercivorus*)、アシノウハダニ (*Tetranychus ludeni*)、サガミハダニ (*Tetranychus phaselus*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)；例えばアポニクス属 (*Aponychus* spp.) の、イトマキハダニ (*Aponychus corpuzae*)、タイリクハダニ (*Aponychus firmianae*)；例えばミドリハダニ属 (*Sasanychus* spp.) の、ミドリハダニ (*Sasanychus akitanus*)、ヒメミドリハダニ (*Sasanychus pusillus*)；例えばシゾテトラニクス属 (*Shizotetranychus* spp.) の、タケスゴモリハダニ (*Shizotetranychus celarius*)、ススキスゴモリハダニ (*Shizotetranychus miscanthi*)、ケナガスゴモリハダニ (*Shizotetranychus longus*)、ヤナギハダニ (*Shizotetranychus schizopus*)、ヒメササハダニ (*Shizotetranychus recki*)；その他、ナミケナガハダニ (*Tuckerella pavoniformis*)、カタバミハダニ (*Tetranychina harti*)、ケウスハダニ (*Yezonychus sapporensis*)；

30

40

【 0 0 9 1 】

50

(b) ヒメハダニ科 (Tenuipalpidae) のダニ、例えばブレビバルプス属種 (Brevipalpus spp.) の、ブドウヒメハダニ (Brevipalpus lewisi)、サボテンヒメハダニ (Brevipalpus russulus)、チャノヒメハダニ (Brevipalpus obovatus)、ミナミヒメハダニ (Brevipalpus phoenicis) ; 例えばテニバルプス属種 (Tenuipalpus spp.) の、ランヒメハダニ (Tenuipalpus pacificus)、カキヒメハダニ (Tenuipalpus zhizhilashviliae) ; その他、パイナップルヒメハダニ (Dolichotetranychus floridanus) ;

(c) フシダニ科 (Eriophyidae) のダニ、例えばアセリア属種 (Aceria spp.) の、カキサビダニ (Aceria diospyri)、イチジクモンサビダニ (Aceria ficus)、クリフシダニ (Aceria japonica)、クコフシダニ (Aceria kuko)、カーネーションサビダニ (Aceria paradianthi)、クコハモグリダニ (Aceria tiyingi)、チューリップサビダニ (Aceria tulipae)、シバハマキフシダニ (Aceria zoysiea) ; 例えばエリオフィエス属種 (Eriophyes spp.) の、ニセナシサビダニ (Eriophyes chibaensis)、ウメフシダニ (Eriophyes emarginatae) ; 例えばアクロプス属種 (Aculops spp.) の、トマトサビダニ (Aculops lycopersici)、ミカンサビダニ (Aculops pelekassi) ; 例えばアクルス属種 (Aculus spp.) の、モモサビダニ (Aculus fockeui)、リンゴサビダニ (Aculus schlechtendali) ; その他、ブドウハモグリダニ (Colomerus vitis)、ブドウサビダニ (Calepitrimerus vitis)、リュウキュウミカンサビダニ (Phyllocotruta citri)、マキサビダニ (Paracalacarus podocarpi)、チャノサビダニ (Calacarus carinatus)、チャノナガサビダニ (Acaphylla thaeavagrans)、キンモクサビダニ (Paraphytoptus kikus)、ナシサビダニ (Epitrimerus pyri) ;

(d) ホコリダニ科 (Transemidae) のダニ、例えばタルソネムス属種 (Tarsonemus spp.) の、スジプトホコリダニ (Tarsonemus bilobatus)、アシボソホコリダニ (Tarsonemus waitei) ; その他、シクラメンホコリダニ (Phytonemus pallidus)、チャノホコリダニ (Polyphagotarsonemus latus) ;

(e) ハシリダニ科 (Penthaleidae) のダニ、例えばペンタレウス属種 (Penthaleus spp.) の、ハクサイダニ (Penthaleus erythrocephalus)、ムギダニ (Penthaleus major) ;

【 0 0 9 2 】

本発明の有害生物防除剤は、さらに、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫、寄生虫などの有害生物の防除にも使用できる。特に人獣に害をなす外部寄生虫に対する防除効果に優れる。防除の対象となる外部寄生虫としては、宿主動物の背、脇下、下腹部、内股部などに寄生して動物から血液やフケなどの栄養源を得て生息するもの、および宿主動物の背、臀部などに飛来して動物から血液やフケなどの栄養源を得て生息するものを包含する。外部寄生虫としては、ダニ類、シラミ類、ノミ類などが挙げられる。

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

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

【 0 0 9 3 】

対象となるダニ類 (Acari) としては以下の害虫が挙げられる。

(1) 中気門目 (Mesostigmata) のダニ類 (mite)

(a) ワクモ科 (Dermanyssidae) のダニ、例えばワクモ属種 (Dermanyssus spp.) の、ワクモ (Dermanyssus gallinae) ;

(b) オオサシダニ科 (Macronyssidae) のダニ、例えばイエダニ属種 (Ornithonyssus spp.) の、トリサシダニ (Ornithonyssus sylviarum)、ネッタイトリサシダニ (Ornithonyssus bursa)、イエダニ (Ornithonyssus bacoti) ;

(c) トゲダニ科 (Laelapidae) のダニ、例えばトゲダニ属種 (Laelaps spp.) の、ネズミトゲダニ (Laelaps echidninus)、ホクマントゲダニ (Laelaps jettmari) ; ミツバチ

トゲダニ (*Tropilaelaps clarae*)

(d) ヘギダニ科 (*Varroidae*) のダニ、例えばヘギダニ属種 (*Varroa* spp.) の、ミツバチヘギイタダニ (*Varroa destructor*)、パロアジャコブソニ (*Varroa jacobsoni*)、パロアアンデルウッドイ (*Varroa underwoodi*) ;

【 0 0 9 4 】

(2) 後気門目 (*Metastigmata*) のマダニ類 (tick)

(a) ヒメダニ科 (*Argasidae*) のダニ、例えばナガヒメダニ属種 (*Argas* spp.) の、ナガヒメダニ (*Argas persicus*)、アルガス・リフレクサス (*Argas reflexus*) ; 例えばヒメダニ属種 (*Ornithodoros* spp.) の、オルニトドラス・モウバータ (*Ornithodoros moubata*) ;

10

(b) マダニ科 (*Ixodidae*) のダニ、例えばチマダニ属種 (*Haemaphysalis* spp.) の、ヘマフィサリス・コンシナ (*Haemaphysalis concinna*)、ヘマフィサリス・パンクタータ (*Haemaphysalis punctata*)、ヘマフィサリス・シニアパリナ (*Haemaphysalis cinnabarinata*)、ヘマフィサリス・オトフィラ (*Haemaphysalis otophila*)、ヘマフィサリス・レアチ (*Haemaphysalis leachi*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、マゲシマチマダニ (*Haemaphysalis mageshimaensis*)、イエンチマダニ (*Haemaphysalis yeni*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、クロウサギチマダニ (*Haemaphysalis pentalagi*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ダグラスチマダニ (*Haemaphysalis douglasi*) ; 例えばキララマダニ属種 (*Amblyomma* spp.) の、アンブリオマ・アメリカナム (*Amblyomma americanum*)、アンブリオマ・バリエガタム (*Amblyomma variegatum*)、アンブリオマ・マキュラタム (*Amblyomma maculatum*)、アンブリオマ・ヘブラエウム (*Amblyomma hebraeum*)、アンブリオマ・カジェネン (*Amblyomma cajennense*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*) ; 例えばマダニ属種 (*Ixodes* spp.) の、マダニ (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ヘキサゴナス (*Ixodes hexagonus*)、イクソデス・キャニスガ (*Ixodes canisuga*)、イクソデス・ピロサス (*Ixodes pilosus*)、イクソデス・ルビキュンダス (*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカブラリス (*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクラス (*Ixodes holocyclus*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツェマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*) ; 例えばウシマダニ亜属種 (*Boophilus* spp.) の、オウシマダニ (*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*)、リピセファラス (ブーフイラス) ・デコロラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus*)、リピセファラス (ブーフイラス) ・アニュラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) annulatus*)、リピセファラス (ブーフイラス) ・カルセラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) calceratus*)、 ; 例えばコイタマダニ属種 (*Rhipicephalus* spp.) の、リピセファラス・エベルトシ (*Rhipicephalus evertsi*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファラス・ブルサ (*Rhipicephalus bursa*)、リピセファラス・アッペンディキュラタス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファラス・キャペンシス (*Rhipicephalus capensis*)、リピセファラス・ツラニカス (*Rhipicephalus turanicus*)、リピセファラス・ザンベジエンシス (*Rhipicephalus zambeziensis*) ; 例えばカクマダニ属種 (*Dermacentor* spp.) の、デルマセントール・マルギナタス (*Dermacentor marginatus*)、デルマセントール・レティキュラタス (*Dermacentor reticulatus*)、デルマセントール・ピクタス (*Dermacentor pictus*)、デルマセントール・アルビピクタス (*Dermacentor albipictus*)、デルマセントール・アンデルソニ (*Dermacentor andersoni*)、デルマセントール・バリアピリス (*Dermacentor variabilis*) ;

20

30

40

【 0 0 9 5 】

(3) 無気門目 (*Astigmata*) のコナダニ類 (*Acaridida*)

(a) キュウセンヒゼンダニ科 (*Psoroptidae*) のダニ、例えばキュウセンヒゼンダニ属種 (*Psoroptidae* spp.) の、ヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*)、ウサギキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウマキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes equi*) ;

50

ui) ; 例えばシヨクヒヒゼンダニ属種 (Chorioptes spp.) の、シヨクヒヒゼンダニ (Chorioptes bovis) ; オトデクテス属種 (Otodectes spp.) の、ミミヒゼンダニ (Otodectes cynotis) ;

(b) ヒゼンダニ科 (Sarcoptidae) のダニ、例えばヒゼンダニ属種 (Sarcoptes spp.) の、センコウヒゼンダニ (Sarcoptes scabiei)、イヌセンコウヒゼンダニ (Sarcoptes canis)、ウシセンコウヒゼンダニ (Sarcoptes bovis)、ヒツジセンコウヒゼンダニ (Sarcoptes ovis)、サルコプテス・ルピカブラエ (Sarcoptes rupicaprae)、ウマセンコウヒゼンダニ (Sarcoptes equi)、ブタセンコウヒゼンダニ (Sarcoptes suis) ; 例えば、ノトエドス属種 (Notoedres spp.)、ネコシヨウセンコウヒゼンダニ (Notoedres cati) ;

(c) トリヒゼンダニ科 (Knemidokoptidae) のダニ、例えばトリアシヒゼンダニ属種 (Knemidokoptes spp.) のトリアシヒゼンダニ (Knemidokoptes mutans) ;

10

【 0 0 9 6 】

(4) 前気門目 (Prostigmata) のケダニ類 (Actinedida)

(a) ニキビダニ科 (Demodixidae) のダニ、例えばニキビダニ属種 (Demodex spp.) の、イヌニキビダニ (Demodex canis)、ウシニキビダニ (Demodex bovis)、ヒツジニキビダニ (Demodex ovis)、ヤギニキビダニ (Demodex caprae)、ウマニキビダニ (Demodex equi)、デモデックス・カバリ (Demodex caballi)、ブタニキビダニ (Demodex suis)、ネコニキビダニ (Demodex cati) ;

(b) ツツガムシ科 (Trombiculidae) のダニ、例えばツツガムシ属種 (Trombicula spp.) の、トロンビキュラ・アルフレズゲシ (Trombicula alfreddugesi)、トロンビキュラ・アカムシ (Trombicula akamushi) ;

20

【 0 0 9 7 】

シラミ類 (Phthiraptera) としては以下の害虫が挙げられる。

(1) シラミ亜目 (Anoplura) のシラミ類 (louse)

(a) ケモノジラミ科 (Haematopinidae) のシラミ、例えばブタジラミ属種 (Haematopinus spp.) の、ウマジラミ (Haematopinus asini)、ウシジラミ (Haematopinus eurysternus)、ブタジラミ (Haematopinus suis) ;

(b) ケモノホソジラミ科 (Linognathidae) のシラミ、例えばリノグナツス属種 (Linognathus spp.) の、イヌジラミ (Linognathus setosus)、ウシホソジラミ (Linognathus vituli)、リノグナサス・オピラス (Linognathus ovillus)、リノグナサス・オピフォルミス (Linognathus oviformis)、リノグナサス・ペダリス (Linognathus pedalis)、ヤギホソジラミ (Linognathus stenopsis) ; 例えばソレノポテス属種 (Solenopotes spp.) の、ケブカウシジラミ (Solenopotes capillatus) ;

30

【 0 0 9 8 】

(2) タンカクハジラミ亜目 (Amblycera) のハジラミ類 (biting louse)

(a) タンカクハジラミ科 (Menoponidae) のハジラミ、例えばメナカンツス属種 (Menacanthus spp.) のニワトリオオハジラミ (Menacanthus stramineus)、ニワトリツノハジラミ (Menacanthus cornutus)、ウスイロニワトリハジラミ (Menacanthus pallidulus) ; 例えばメノポン属種 (Menopon spp.) の、ニワトリハジラミ (Menopon gallinae) ;

40

【 0 0 9 9 】

(3) チョウカクハジラミ亜目 (Ischnocera) のハジラミ類 (biting louse)

(a) チョウカクハジラミ科 (Philopteridae) のハジラミ、例えばコランビコーラ属種 (Columbicola spp.) の、ハトナガハジラミ (Columbicola columbae) ; 例えばクルクロトガステル属種 (Cuclotogaster spp.) の、ハバピロナガハジラミ (Cuclotogaster heterographus) ; 例えばゴニオデス属種 (Goniodes spp.) の、カクアゴハジラミ (Goniodes dissimilis)、マルハジラミ (Goniodes gigas)、ヒメニワトリハジラミ (Goniodes gallinae) ; 例えばリペウルス属種 (Lipeurus spp.) の、ニワトリナガハジラミ (Lipeurus caponis) ;

(b) ケモノハジラミ科 (Trichodectidae) のハジラミ、例えばボビコーラ属種 (Bovicola spp.) の、ウシハジラミ (Bovicola bovis)、ヒツジハジラミ (Bovicola ovis)、ボ

50

ピコラ・リンバータ (*Bovicola limbata*)、ヤギハジラミ (*Bovicola caprae*)、ウマハジラミ (*Bovicola equi*) ; 例えばケモノハジラミ属種 (*Trichodectes* spp.) の、イヌハジラミ (*Trichodectes canis*) ; 例えばフェリコラ属種 (*Felicola* spp.) の、ネコハジラミ (*Felicola subrostrata*) ;

【 0 1 0 0 】

ノミ類 (*Siphonaptera*) としては以下の害虫が挙げられる。

(a) スナノミ科 (*Tungidae*) のノミ、例えばスナノミ属種 (*Tunga* spp.) の、スナノミ (*Tunga penetrans*) ;

(b) ヒトノミ科 (*Pulicidae*) のノミ、例えばイヌノミ属種 (*Ctenocephalides* spp.) の、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) ; 10
例えばアルカエオプシラ属種 (*Archaeopsylla* spp.) の、ハリネズミノミ (*Archaeopsylla erinacei*) ; 例えばネズミノミ属種 (*Xenopsylla* spp.) の、東洋ネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) ; 例えばヒトノミ属種 (*Pulex* spp.) の、ヒトノミ (*Pulex irritans*) ; 例えばエチドノファガ属種 (*Echidnophaga* spp.) の、ニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea*) ;

(c) ナガノミ科 (*Ceratophyllidae*) のノミ、例えばナガノミ属種 (*Ceratophyllus* spp.) の、トリノミ (*Ceratophyllus gallinae*)、ヤマトネズミノミ (*Ceratophyllus anisus*) ; 10
例えばノソプスルラス属種 (*Nosopsyllus* spp.) の、ヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*)、

(d) ホソノミ科 (*Leptopsyllidae*) のノミ、例えばホソノミ属種 (*Leptopsylla* spp.) の、メクラネズミノミ (*Leptopsylla segnis*) ; 20

【 0 1 0 1 】

その他にも、対象となる外部寄生虫としては、カメムシ目の害虫が挙げられる。

【 0 1 0 2 】

カメムシ目 (*Hemiptera*) の害虫としては以下の害虫が挙げられる。

(a) トコジラミ科 (*Cimicidae*) の昆虫、例えばシメックス属種 (*Cimex* spp.) の、トコジラミ (*Cimex lectularius*) ;

(b) サシガメ科 (*Reduviidae*) の昆虫、さらにはオオサシガメ亜科 (*Triatominae*) の、10
例えばパンストロンギラス属種 (*Panstrongylus* spp.) ; 例えばロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.) の、ベネズエラサシガメ (*Rhodnius prolixus*) ; 30
例えばサシガメ属種 (*Triatoma* spp.) の、サシガメ (*Triatoma infestans*) ;

【 0 1 0 3 】

その他にも、刺咬性昆虫 (咀嚼性ハエ、吸血成虫ハエ、移動性双翅類の幼虫、寄生バエのウジ) であるハエ目 (*Diptera*) 害虫にも有効である。

【 0 1 0 4 】

ハエ類 (*Diptera*) の害虫としては以下の害虫が挙げられる。

(1) 長角亜目 (*Nematocera*)

(a) カ科 (*Culicidae*) のカ、例えばイエカ属種 (*Culex* spp.) の、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、キュレックス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、チカイエカ (*Culex pipiens molestus*)、ネッタイエカ (*Culex pipiens fatigans*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus summorosus*) ; 40
例えばアルミゲレス属種 (*Armigeres* spp.) の、オオクロヤブカ (*Armigeres subalbatu*) ; 50
例えばハマダラカ属種 (*Anopheles* spp.) の、ガンビアハマダラカ (*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・マキュリペニス (*Anopheles maculipennis*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、オオツルハマダラカ (*Anopheles lesteri*) ; 40
例えばヤブカ属種 (*Aedes* spp.) の、ネッタيشマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、イーデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、トウゴウヤブカ (*Aedes togoi*)、キンイロヤブカ (*Aedes vexans nipponii*) ;

(b) ブユ科 (*Simuliidae*) のブユ、例えばブユ属種 (*Simulium* spp.) の、シムリウム・レプタンス (*Simulium reptans*)、ツメトゲブユ (*Simulium ornatum*)、ヒメアシマダラ 50

ブユ (*Simulium venustum*)、ウマブユ (*Simulium salopiense*) ; 例えばプロシムリウム属種 (*Prosimulium* spp.) の、キアシオオブユ (*Prosimulium yezoense*) ;

(c) ヌカカ科 (*Ceratopogonidae*) のヌカカ、例えばクリコイデス属種 (*Culiodes* spp.) の、ニワトリヌカカ (*Culicoides arakawae*)、ウスシロフヌカカ (*Culicoides pictimargo*)、キブネヌカカ (*Culicoides kibunensis*)、セマダラヌカカ (*Culicoides homotomus*)、ウシヌカカ (*Culicoides oxystoma*)、ニッポンヌカカ (*Culicoides nipponensis*)、ホシヌカカ (*Culicoides punctatus*)、ミヤマヌカカ (*Culicoides maculatus*)、マツザワヌカカ (*Culicoides matsuzawai*)

【 0 1 0 5 】

(2) 短角亜目

(a) アブ科 (*Tabanidae*) のアブ、例えばアブ属種 (*Tabanus* spp.) の、タバヌス・プロミウス (*Tabanus bromius*)、タバヌス・スポドプテルス (*Tabanus spodopterus*)、タバヌス・アトラタス (*Tabanus atratus*)、タバヌス・スデチカス (*Tabanus sudeticus*)、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、アカウシアブ (*Tabanus chrysurus*)、シロフアブ (*Tabanus trigeminus*)、キスジアブ (*Tabanus fulvemedioides*)、イヨシロオビアブ (*Tabanus iyoensis*) ; 例えばメクラアブ属種 (*Chrysops* spp.) の、クリソプス・カエキュチエンス (*Chrysops caecutiens*)、クリソプス・レリクタス (*Chrysops relictus*)、キンメアブ (*Chrysops suavis*)、クロキンメアブ (*Chrysops japonicus*) ;

(b) イエバエ科 (*Muscidae*) のハエ、例えばイエバエ属種 (*Muscina* spp.) の、イエバエ (*Musca domestica*)、クロイエバエ (*Musca bezzii*)、ノイエバエ (*Musca hervei*)、ウスイロイエバエ (*Musca conducens*)、オオイエバエ (*Musca stabulans*)、 ; 例えばノサシバエ属種 (*Stomoxys* spp.) の、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、 ; 例えばノサシバエ属種 (*Haematobia* spp.) の、ノサシバエ (*Haematobia irritans*)、ヘマトビア・イリタンス・エクシグア (*Haematobia irritans exigua*)、ヘマトビア・スティミュランス (*Haematobia stimulans*) ; ヒメイエバエ属種 (*Fannia* spp.) の、ヒメイエバエ (*Fannia canisularis*) ;

(c) ツエツエバエ科 (*Glossinidae*) のシェシェバエ属種 (*Glossina* spp.) ;

(d) シラミバエ科 (*Hippoboscidae*) のハエ、例えばメロファガス属種 (*Melophagus* spp.) の、シラミバエ (*Melophagus ovinus*) ;

(e) クロバエ科 (*Calliphoridae*) のハエ、例えばクロバエ属種 (*Calliphora*) の、オオクロバエ (*Calliphora lata*) ; 例えばキンバエ属種 (*Lucilia* spp.) の、ヒツジキンバエ (*Lucilia (Phaenicia) cuprina*) ヒロズキンバエ (*Lucilia (Phaenicia) sericata*)、ミドリキンバエ (*Lucilia illustris*) ; 例えばオビキンバエ属 (*Chrysomya* spp.) の、ラセンウジバエ (*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・クロロピガ (*Chrysomya chloropyga*)、クリソミア・ベジアナ (*Chrysomya bezziana*) ;

(f) ヒツジバエ科 (*Oestridae*) のハエ、例えばカワモグリバエ亜科 (*Cuterebrinae*) のウサギヒフバエ属種 (*Cuterebra* spp.) ; 例えばウシバエ亜科 (*Hypodermatinae*) の、さらにはウシバエ属種 (*Hypoderma* spp.) の、ウシバエ (*Hypoderma bovis*)、キスジウシバエ (*Hypoderma lineatum*) ; 例えばウマバエ亜科 (*Gasterophilinae*) の、さらにはウマバエ属種 (*Gasterophilus* spp.) の、ウマバエ (*Gasterophilus intestinalis*)、アトアカウマバエ (*Gasterophilus haemorrhoidalis*)、ガステロフィラス・イネルミス (*Gasterophilus inermis*)、ムネアカウマバエ (*Gasterophilus nasalis*)、ガステロフィラス・ニグリコルニス (*Gasterophilus nigricornis*)、アカウマバエ (*Gasterophilus pecorum*) ; 例えばヒツジバエ亜科 (*Oestrinae*) の、さらにはヒツジバエ属種 (*Oestrus* spp.) の、ヒツジバエ (*Oestrus ovis*) ;

【 0 1 0 6 】

本発明の有害生物防除剤は、殺菌剤、他の殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、植物調節剤などの他の有効成分と混用または併用してもよい。本発明の有害生物防除剤と混合して使用できる殺菌剤、他の殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、植物生長調節剤の代表例を以下に示す。

10

20

30

40

50

【 0 1 0 7 】

殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤：

(1) 有機 (チオ) ホスフェート系：アセフェート、アザメチホス、アジンホス・メチル、アジンホス・エチル、プロモホス・エチル、プロムフェンピンホス、BRP、クロルピリホス、クロルピリホス・メチル、クロルピリホス・エチル、クロルフェンピンホス、カズサホス、カルボフェノチオン、クロルエトキシホス、クロルメホス、クマホス、シアノフェンホス、シアノホス、CYAP、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、ジメトン-S-メチル、ジメチルピンホス、ジメトン-S-メチルスルホン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロフェンチオン、ジオキサベンゾホス、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、EPN、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、フェンスルホチオン、フルピラゾホス、ホノホス、ホルモチオン、ホスメチラン、ヘプテノホス、イサゾホス、ヨードフェンホス、イソフェンホス、イソキサチオン、イプロベンホス、マラチオン、メピンホス、メタミドホス、メチダチオン、モノクロトホス、メカルバム、メタクリホス、ナレッド、オメトエート、オキシジメトン・メチル、パラオクソン、パラチオン、パラチオン・メチル、フェントエート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス・メチル、ピリミホス・エチル、プロフェノホス、プロチオホス、ホスチアゼート、ホスホカルブ、プロバホス、プロペタムホス、プロトエート、ピリダフェンチオン、ピラクロホス、キナルホス、サリチオン、スルプロホス、スルホテップ、テトラクロルピンホス、テルブホス、トリアゾホス、トリクロルホン、テブピリムホス、テメホス、チオメトン、バミドチオン、；

10

20

【 0 1 0 8 】

(2) カルバメート系：アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、フェノキシカルブ、フェノチオカルブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ、トリアザメート、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、MIPC、MPMC、MTMC、ピリダフェンチオン、フラチオカルブ、XMC、アルドキシカルブ、アリキシカルブ、アミノカルブ、ベンダイオカルブ、ブフェンカルブ、ブタカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、クロエトカルブ、ジメチラン、ホルメタネート、イソプロカルブ、メタム・ナトリウム、メトルカルブ、プロメカルブ、チオフアノックス、トリメタカルブ、キシリルカルブ；

30

(3) ピレトロイド系：アレトリン、ピフェントリン、シフルトリン、ベータ・シフルトリン、シハロトリン、ラムダ・シハロトリン、シフェノトリン、シペルメトリン、アルファ・シペルメトリン、ベータ・シペルメトリン、ゼータ・シペルメトリン、デルタメトリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、イミプロトリン、ペルメトリン、プラレトリン、ピレトリン、ピレトリンI、ピレトリンII、レスメトリン、シラフルオフエン、フルバリネート、テフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、プロフルトリン、ジメフルトリン、アクリナトリン、シクロプロトリン、ハルフェンプロックス、フルシトリネート、ピオアレスリン、ピオエタノメトリン、ピオペルメトリン、ピオレスメトリン、トランスペルメトリン、エンペントリン、フェンフルトリン、フェンピリトリン、フルプロシトリネート、フルフェンプロックス、フルメトリン、メトフルトリン、フェノトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、テラレトリン；

40

【 0 1 0 9 】

(4) 成長調節物質：

(a) キチン合成阻害剤：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ピストリフルロン、ノピフルムロン、ブプロフェジン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロフェンテジン、フルアズロン、ペンフルロン；

(b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド、クロマフェノジド、アザジラクチン；

50

(c) 幼若ホルモン様物質：ピリプロキシフェン、メトプレン、ジオフェノラン、エポフェノナン、ハイドロプレン、キノプレン、トリプレン；

(d) 脂質生合成阻害剤：スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、フロニカミド；

【0110】

(5) ニコチン受容体アゴニスト/アンタゴニスト化合物：アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、チアメトキサム、ニチアジン、ニコチン、ベンスルタップ、カルタップ；

(6) GABAアンタゴニスト化合物：

(a) アセトプロール、エチプロール、フィプロニル、バニリプロール、ピラフルプロール、ピリプロール；

(b) 有機塩素系；カンフェクロル、クロルデン、エンドスルファン、HCH、 γ -HCH、ヘプタクロル、メトキシクロル

(7) 大環状ラクトン殺虫剤：アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、ミルベメクチン、レピメクチン、スピノサド、イベルメクチン、セラメクチン、ドラメクチン、エピノメクチン、モキシデクチン、

(8) METI I化合物：フェナザキン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、フルフェネリム、ヒドラメチルノン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ジコホル；

(9) METI IIおよびIII化合物：アセキノシル、フルアクリピリム、ロテノン；

(10) 脱共役剤化合物：クロルフェナピル、ピナバクリル、ジノプトン、ジノカップ、DNOC；

【0111】

(11) 酸化的リン酸化阻害剤化合物：シヘキサチン、ジアフェンチウロン、フェンブタチン・オキシド、プロパルギット、アゾシクロチン；

(12) 脱皮かく乱化合物：シロマジン；

(13) 混合機能オキシダーゼ阻害剤化合物：ピペロニルブトキシド；

(14) ナトリウムチャンネル遮断剤化合物：インドキサカルブ、メタフルミゾン；

(15) 微生物農薬：BT剤、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原系状菌剤、線虫病原系状菌剤；バチルス属種、白きょう病菌、黒きょう病菌、ペキロマイセス属種、チューリングエンシン、パーティシリウム属種；

(16) ラトロフィリン受容体作用薬：デブシペプチド、環状デブシペプチド、24員環状デブシペプチド、エモデブシド；

(17) オクトパミン性作用薬：アミトラズ；

(18) リアノジン誘導体作用薬：フルベンジアミド、クロラントラニリプロール、シアントラリニプロール

(19) マグネシウム刺激性ATPアーゼの阻害薬：チオシクラム、チオスルタップ、ネライストキシン；

(20) 摂食阻害薬：ピメトロジン；

(21) ダニ成長阻害薬：クロフェンテジン、エトキサゾール；

(22) その他のもの：ベクロチアズ、ピフェナゼート、ピリダリル、硫黄、シエノピラフェン、シフルメトフェン、アミドフルメット、テトラジホン、クロルジメホルム、1,3-ジクロロプロペン、DCIP、フェニソプロモレート、ベンゾメート、メタアルデヒド、スピネトラム、ピリフルキナゾン、ベンゾキシメート、プロモプロピレート、キノメチオネート、クロルベンジレート、クロルピクリン、クロチアゾベン、ジシクラニル、フェノキサクリム、フェントリファニル、フルベンジミン、フルフェンジン、ゴシップルア、ジャポニルア、メトキサジアゾン、石油、オレイン酸カリウム、スルフルラミド、テトラスル、トリアラセン；

【0112】

殺菌剤：

10

20

30

40

50

(1) ベンゾイミダゾール系：ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファネート メチル等；

(2) ジカルボキシイミド系：クロゾリネート、イブロジオン、プロシミドン、ピンクロゾリン等；

(3) DMI - 殺菌剤系：イマザリル、オキシポコナゾール、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール、トリホリン、ピリフェノックス、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、ビテルタノール、プロムコナゾール、シブロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、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、イブコナゾール、メトコナゾール、マイクロブタニル、ペンコナゾール、プロビコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、エタコナゾール、ファーコナゾールシス等；

【0113】

(4) フェニルアミド系：ベナラキシル、フララキシル、メタラキシル、メタラキシル-M、オキサジキシル、オフラセ等；

(5) アミン系：アルジモルフ、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミン等；

(6) ホスホロチオレート系：EDDP、イプロベンホス、ピラゾホス等；

(7) ジチオラン系：イソプロチオラン等；

(8) カルボキサミド：ベノダニル、ボスカリド、カルボキシニン、フェンフラン、フルトラニル、フラメトピル、メプロニル、オキシカルボキシニン、ペンチオピラド、チフルザミド等；

(9) ヒドロキシ-(2-アミノ)ピリミジン系：ブピリメート、ジメチリモル、エチリモル等；

【0114】

(10) AP殺菌剤 (アニリノピリミジン)系：シブロジニル、メバニピリム、ピリメタニル等；

(11) N-フェニルカーバメート系：ジエトフェンカルブ等；

(12) QoI-殺菌剤 (Qo阻害剤)系：アゾキシストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、クレソキシム-メチル、トリフロキシストロピン、ジモキシストロピン、メトミノストロピン、オリザストロピン、ファモキサドン、フルオキサストロピン、フェンアミドン、メトミノフェン等；

(13) PP殺菌剤 (フェニルピロール)系：フェンピコニル、フルジオキシソニル等；

(14) キノリン系：キノキシフェン等；

【0115】

(15) AH殺菌剤 (芳香族炭化水素)系：ピフェニル、クロロネブ、ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクトフォス-メチル等；

(16) MBI-R系：フサライド、ピロキロン、トリシクラゾール等；

(17) MBI-D系：カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル等；

(18) SBI剤：フェンヘキサミド、ピリブチカルブ、ターピナフィン等；

(19) フェニルウレア：ペンシクロン等；

(20) QiI-殺菌剤 (Qi阻害剤)：シアゾファミド等；

(21) ベンズアミド系：ゾキサミド等；

(22) エノピランウロン系：プラストサイジン、ミルディオマイシン等；

(23) ヘキサピラノシル系：カスガマイシン等；

(24) グルコピラノシル系：ストレプトマイシン、バリダマイシン等；

(25) シアノアセトアミド系：シモキサニル等；

(26) カーバメート系：ヨードカルブ、プロパモカルブ、プロチオカルブ、ポリカーバメート等；

(27) 脱共役剤：ピナバクリル、ジノカップ、フェリムゾン、フルアジナム等；

10

20

30

40

50

(28) 有機スズ化合物：酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ等；

【0116】

(29) リン酸エステル：亜リン酸、トルクロホスメチル、ホセチル等；

(30) フタルアミド酸系：テクロフタラム等；

(31) ベンゾトリアジン系：トリアゾキシド等；

(32) ベンゼンスルフォナミド系：フルスルファミド等；

(33) ピリダジノン：ジクロメジン等；

(34) CAA 殺菌剤（カルボン酸アミド）系：ジメトモルフ、フルモルフ、ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、マンジプロパミド等；

10

(35) テトラサイクリン：オキシテトラサイクリン等；

(36) チオカーバメート系：メタスルホカルブ等；

(37) その他の化合物：エトリジアゾール、ポリオキシシン、オキシリニック酸、ヒドロキシイソキサゾール、オクチノリン、シルチオフアム、ジフルメトリム、アシベンゾラルSメチル、プロベナゾール、チアジニル、エタボキサム、シフルフェナミド、プロキナジド、メトラフェノン、フルオピコリド、水酸化第二銅、有機銅、硫黄、ファーバム、マンゼブ、マンネブ、メチラム、プロピネブ、チウラム、ジネブ、ジラム、キャプタン、カプタホール、フォルペット、クロロタロニル、ジクロフルアニド、トリルフルアニド、ドジン、グアザチン、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンドデシルベンゼンスルホン酸塩、アニラジン、ジチアノン、クロロピクリン、ダゾメット、メタムナトリウム塩、キノメチオネート、シプロフラム、シルチオフアム、アグロバクテリウム、フルオルイミド)等；

20

【0117】

植物生長調節剤：

アブシジン酸、インドール酪酸、ウニコナゾール、エチクロゼート、エテホン、クロキシホナック、クロルメコート、クロレラ抽出液、過酸化カルシウム、シアナミド、ジクロルプロップ、ジベレリン、ダミノジッド、デシルアルコール、トリネキサバックエチル、メピコートクロリド、パクロブトラゾール、パラフィンワックス、ピペロニルプトキシド、ピラフルフェンエチル、フルルプリミドール、プロヒドロジャスモン、プロヘキサジオンカルシウム塩、ベンジルアミノプリン、ペンディメタリン、ホルクロルフェニユロン、マレイン酸ヒドラジドカリウム、1-ナフチルアセトアミド、4-CPA、MCPB、コリン、硫酸オキシキノリン、エチクロゼート、ブトルアリン、1-メチルシクロプロペン、アビグリシン塩酸塩；

30

【0118】

本発明の有害生物防除剤は、有効成分のみを含有するものであってもよいが、固体担体、液体担体、ガス状担体などの担体を含有していてもよい。また、本発明の有害生物防除剤は、有効成分を多孔セラミック板や不織布などの基材に含浸させたものであってもよい。さらに、必要に応じて界面活性剤、その他の補助剤を添加したものであってもよい。

【0119】

本発明の有害生物防除剤は、一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、フロアブル、マイクロカプセル、エアゾール、煙霧剤、加熱蒸散剤、燻煙剤、殺ダニ剤の場合はベイト剤などの形態に製剤化することができる。

40

【0120】

固体の剤型への製剤化において使用される添加剤および担体としては、大豆粉、小麦粉などの植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレーなどの鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝などの有機および無機化合物などを挙げるができる。

【0121】

液体の剤型への製剤化において使用される溶剤としては、ケロシン、キシレンおよび石油系の芳香族炭化水素、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジ

50

メチルスルホキシド、アルコール、アセトン、トリクロロエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水などなどを挙げることができる。

【0122】

噴射剤に製剤化する際に使用されるガス状担体としては、ブタンガス、LPG、ジメチルエーテル、炭酸ガスなどが挙げられる。

【0123】

毒餌の基材としては、穀物粉、植物油、糖、結晶セルロースなどの餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸などの酸化防止剤、デヒドロ酢酸などの保存料、トウガラシ末などの子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料などの害虫誘引性香料などが挙げられる。

10

【0124】

製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要に応じ界面活性剤を添加することができる。添加することができる界面活性剤は特に制限されない。例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテルなどの非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、高級アルコールの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸共重合体などを挙げることができる。

20

【0125】

製剤中における有効成分の含有量は、通常、製剤全体に対して、好ましくは0.01~90重量%、より好ましくは0.05~85重量%である。

【0126】

このようにして得られた水和剤、乳剤、フロアブル剤、水溶剤、顆粒水和剤は水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液にして、また粉剤・粒剤はそのままで、植物あるいは土壤に散布することができる。

また、防疫用殺ダニ剤として使用する場合には、油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌、防ダニシートなどの形態で供給された製剤をそのまま使用することができる。

30

【0127】

また、本発明の有害生物防除剤を、ウシ、ブタなどの家畜類、イヌ、ネコなどのペット類の動物に寄生するダニ類の防除用殺ダニ剤とする場合には、宿主動物1kgに対して、有効成分が、0.01~1000mgの割合となる量で使用することができる。

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

40

【実施例】

【0128】

[製造実施例1]

WO2009/022746号パンフレットに記載されている化合物番号1-28のイソキサゾリン化合物(3-メトキシ-N-(5-(5-(トリフルオロメチル)-5-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)プロパナミド)を当該文献記載の製造方法で合成した。この場合、4種の立体異性体の混合物が得られた。

【0129】

50

その後、キラルHPLCを用いる公知の方法で光学分割した。得られた光学活性イソオキサゾリン化合物（光学活性化合物A～D）の分析試験結果、および各光学活性化合物の $[\alpha]_D$ 値を以下に示す。

評価システム ポンプ : LC-2-AD (島津製作所(株)社製)
 検出機 : SPD-20A (島津製作所(株)社製)
 オートサンプラー : SIL-20A (島津製作所(株)社製)

分析条件 カラム : CHIRALPAK IA
 サイズ : 0.46cm I.D. × 25cmL
 移動相 : ノルマルヘキサン / エタノール = 90 / 10 (v/v)
 流速 : 1.0mL / min.
 温度 : 40
 波長 : 263nm

光学活性化合物 A : tR=13.956 : $[\alpha]_D^{22.4} -96.60^\circ$ (c=1.00, CHCl₃)
 光学活性化合物 B : tR=15.604 : $[\alpha]_D^{23.6} -45.00^\circ$ (c=0.22, CHCl₃)
 光学活性化合物 C : tR=24.622 : $[\alpha]_D^{24.0} +97.52^\circ$ (c=1.05, CHCl₃)
 光学活性化合物 D : tR=30.565 : $[\alpha]_D^{22.8} +41.60^\circ$ (c=0.24, CHCl₃)

10

20

【0130】

[製造実施例2]

以下の製造方法によって、光学活性イソオキサゾリン化合物Aを製造した。
 (工程1)(R)-5-プロモ-インダン-1-オール(以下、化合物[(R)-2]と記載することがある。)の合成

三方コックおよびバブラーをセットした200mlガラス製2頸フラスコに、フッ素樹脂コーティング攪拌子、5-プロモ-インダン-1-オン40g(190mmol)、N,N-ジメチルホルムアミド47mlおよびギ酸-トリエチルアミン(5:2共沸混合物)94mlを入れ、フラスコ内部をアルゴン置換しながら超音波脱気した。

アルゴンを流しながら、触媒としてのRuCl[(R,R)-Tsdpen][p-cymene]1.23g(1.93mol, 1mol%)を加え、次いで脱気した。その後、三方コックをバブラーに繋ぎ40にて65時間攪拌した。反応液をHPLCで分析したところ、95.5%conv.、95%eeであった。

30

放冷後、水100mlを加え、n-ヘキサン/酢酸エチルの1/1混合液1.4Lで抽出し、次いで有機層を水500mlで3回洗浄した。エチレンジアミン20mlを加えて攪拌した。その後、水500ml、10%塩酸300ml、水500ml、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液300ml、および飽和食塩水500mlによって順次洗浄した。次いで、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。

桐山コートにセライトおよび重金属除去用ジアミンシリカ200gを充填し、そこへ上記で得られた有機層を注ぎ込み、吸引ろ過した。溶媒を留去し、得られた残渣を熱酢酸エチルに溶解させた。これにn-ヘキサンを加えて再結晶させた。化合物[(R)-2]32.95g(155mmol, 81%)が白色針状結晶として得られた。これをキラルHPLCで分析したところ、>99%eeであった。

40

【0131】

なお、キラルHPLCの分析条件は以下のとおりである。

測定温度20、カラムとしてDAICEL CHIRALPACK AD-3(25cm × 4.6mm)、溶離液としてヘキサン:エタノール=90:10混合液を用い、1ml/分、UV(220nm)検出器を用いた。

S体のリテンションタイムは8.0分、R体のリテンションタイムは9.9分であった。

【0132】

50

得られた化合物、すなわち、(R)-5-プロモ-インダン-1-オールの $[\alpha]_D$ 値は、 $[\alpha]_D^{33} -13.2^\circ$ (c 0.53, CH_2Cl_2)であった。

【0133】

なお、触媒を $\text{RuCl}[(\text{S,S})\text{-Tsdpen}][\text{p-cymene}]$ に替えた以外は製造実施例2と同じ手法を用いることで、(S)-5-プロモ-インダン-1-オールを合成することができる。

この場合、得られた(S)-5-プロモ-インダン-1-オールの $[\alpha]_D$ 値は、 $[\alpha]_D^{33} +12.6^\circ$ (c 0.53, CH_2Cl_2)であった。

【0134】

(工程2) (S)-5-プロモ-インダン-1-イルアミン(以下、化合物[(S)-3]と記載することがある。)の合成

(工程1)で得られた化合物[(R)-2] 8.52 g (40 mmol)のトルエン溶液30 mlに、-5~0の温度範囲にて、 $(\text{PhO})_2\text{P}(\text{O})\text{N}_3$ 13.2 g (48 mmol)のトルエン溶液30 mlおよびジアザピシクロウンデセン7.31 g (48 mmol)のトルエン溶液30 mlを加え、同温度範囲にて1時間攪拌した。その後、室温まで温めた。

0に冷やして水を加えた。それを室温にて10分間攪拌した。その後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、次いで無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。桐山ロートにセライトおよび重金属除去用ジアミンシリカを充填し、そこへ有機層を注ぎ、吸引ろ過した。溶媒を留去し、アジド体の粗生成物を得た。

桐山ロートにシリカゲルを充填し、そこへ前記アジド体粗生成物を入れ、n-ヘキサン/酢酸エチルの97/3混合液を用いて溶出した。溶出液を留去した。 $^1\text{H-NMR}$ の分析で、ほぼ純粋なアジド体9.57 g (quant.)が薄黄色油状物質として得られた。

得られたアジド体をメタノール100 mlに溶解し、これに室温にて $\text{SnCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ 19 g (84 mmol)を加え6時間攪拌した。その後、溶媒を留去した。これに2 M水酸化ナトリウム水溶液190 mlを加えて2時間攪拌した。

反応液をセライトでろ過し、ジクロロメタンで3回抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。その後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を留去したところ化合物[(S)-3] 6.97 g (82%、2工程)が薄赤色油状物質として得られた。

【0135】

(工程3) (S)-N-(5-プロモ-インダン-1-イル)-3-メトキシ-プロピオンアミド(以下、化合物[(S)-4]と記載することがある。)の合成

【0136】

先に得られた化合物[(S)-3] 6.97 g (32.9 mmol)および3-メトキシ-プロピオン酸4.3 g (36.4 mmol)のジクロロメタン溶液60 mlに、0にて、塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド9.5 g (50 mmol)およびN,N-ジメチル-4-アミノピリジン2.0 g (16.4 mmol)を加え、室温にて3時間攪拌した。これに水を加えて、ジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和食塩水、10%塩酸および飽和食塩水を用いて順次洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、次いで溶媒を留去した。化合物[(S)-4] 9.18 g (98.4% ee)の粗生成物を得られた。当該粗生成物をn-ヘキサン/酢酸エチルから再結晶したところ、化合物[(S)-4] 6.68 g (化合物[(R)-2]からの収率56%、99.6% ee)が白色針状結晶として得られた。

鏡像異性体過剰率の分析におけるHPLC条件は以下のとおりである。

測定温度30、カラムとしてDAICEL CHIRALPACK AD-3 (25 cm x 4.6 mm)、溶離液としてヘキサン:エタノール=90:10混合液を用い、1.0 ml/分、UV (220 nm)検出器を用いた。

S体のリテンションタイムは16.3分、R体のリテンションタイムは25.5分であった。

【0137】

(工程4) (S)-N-5-アセチル-インダン-1-イル)-3-メトキシ-プロピオンアミド(以下、化合物[(S)-5]ということがある。)の合成

三方コックおよびアルゴン風船をセットした200mlガラス製2頸フラスコに、フッ素樹脂コーティング攪拌子、前記の化合物[(S)-4] 6.68g (22.4mmol)、n-ブチルビニルエーテル5.6g (553.9mmol)、炭酸カリウム3.72g (26.9mmol)、N,N-ジメチルホルムアミド75mlおよび水19mlを入れ、フラスコ内部をアルゴン置換しながら超音波脱気した。

これに、アルゴンを流しながら1,3-ビス(ジフェニル-フォスフィノ)プロパン923mg (2.24mmol)およびPd(OAc)₂251mg (1.12mmol)を加え、さらに脱気操作を行った。その後、三方コックをアルゴン風船に繋ぎ、80にて5時間攪拌した。

0にて水20mlを加え、溶液のpHが2になるまで濃塩酸を滴下した。その後、室温にて2時間攪拌した。n-ヘキサン/酢酸エチルの1/1混合液で抽出した。それを飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーを用いてn-ヘキサン:酢酸エチルの5:1混合液による溶出、次いで酢酸エチルによる溶出を行い精製した。化合物[(S)-5]4.8g (82%)が白色結晶として得られた。

【0138】

(工程5) (S)-3-メトキシ-N-(5-(4,4,4-トリフルオロ-3-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)プロ-2-エノイル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)プロパンアミド(以下、化合物[(S)-6]と記載することがある。)の合成

2,2,2-トリフルオロ-1-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-エタノン1.82g (7.5mmol)、前記の化合物[(S)-5]1.3g (5mmol)、炭酸カリウム1.38g (10mmol)およびテトラブチルアンモニウムプロマイドをトルエン溶媒10mlにて22時間還流下で攪拌して反応させた。反応終了後、水を加え、次いで酢酸エチルで抽出した。その後、乾燥させ、濃縮し、カラムクロマトグラフィーを用いてn-ヘキサン:酢酸エチルの1:1混合液にて精製した。化合物[(S)-6]2.3g (63%)が得られた。

【0139】

(工程6) 3-メトキシ-N-(5-(5-(トリフルオロメチル)-5-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)プロパンアミド(以下、化合物[(S)-7]と記載することがある。)の合成

前記の化合物[(S)-6]48.5mg (0.1mmol)、50%ヒドロキシルアミン水溶液20mg (0.3mmol)およびN-3,5-トリフルオロメチルベンジルキニジニウムプロマイド(6.3mg、10mol%)のクロロホルム溶液2mlを0にて冷やし、攪拌しながら、50%水酸化カリウム水溶液0.5mlを滴下した。滴下終了後、0にて15時間攪拌を行った。その後、水を加え、トルエン溶媒にて抽出した。その後、乾燥させ、濃縮して、n-ヘキサン:酢酸エチルの1:1混合液を用いてカラム精製した。化合物[(S)-7](86%)が得られた。なお、得られた化合物の光学純度は81.3% eeであった。

鏡像異性体過剰率の分析のHPLC条件を以下に示す。

測定温度20、カラムとしてDAICEL CHIRALPAK AD-H(25cm×4.6mm)、溶離液としてヘキサン:エタノールの90:10混合液を用い、1.0ml/分、UV(254nm)検出器を用いた。

主生成物のリテンションタイムは16.4分、副生成物のリテンションタイムは21.9分であった。

この反応にて得られる主生成物は、光学活性化合物Aであり、絶対配置は(イソキサゾリン、インダン)=(*R,S)のものである。副生成物は、光学活性化合物Bであり、絶対配置は(イソキサゾリン、インダン)=(*S,S)のものである。なお、イソキサゾリン部分の絶対配置は推定である。

10

20

30

40

50

【0140】

上記手法と同様の手法にて他の光学活性化合物を製造することができる。

【0141】

[製造実施例3]

(1) 3 - メトキシ - N - (5 - (5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミドの結晶の製造

WO2009/022746号パンフレットに記載の方法に従って、図1のHPLCチャートが観測されるイソキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物(1)を合成した。

10gのジアステレオマーの混合物(1)を、酢酸エチル30mLとヘキサン60mLの混合溶媒に溶かし、晶析を行った。析出した結晶をろ過し、得られた結晶を更に酢酸エチル - ヘキサンの混合溶媒で再結晶化を行い、単一のジアステレオマーからなる結晶を得た(1.85g、37%)。得られた結晶の融点は、129~130であった。得られた結晶のHPLCチャート(図2参照)から、該結晶は、2番目のリテンションタイムを示す(S,S)体と、4番目のリテンションタイムを示す(R,R)体からなることが分かった。

【0142】

(2) N - (5 - (5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) プロパナミドの結晶の製造

WO2009/022746号パンフレットに記載の方法に従って、図3のHPLCチャートが観測されるイソキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物(2)を合成した。

4gのジアステレオマーの混合物(2)を、酢酸エチル20mLとヘキサン20mLの混合溶媒に溶かし、晶析を行った。析出した結晶をろ過し、得られた結晶を更に酢酸エチル - ヘキサンの混合溶媒で再結晶化を行い、単一のジアステレオマーからなる結晶を得た(681mg、34%)。得られた結晶の融点は、170~171であった。得られた結晶のHPLCチャート(図4参照)から、該結晶は、2番目のリテンションタイムを示す(S,S)体と、4番目のリテンションタイムを示す(R,R)体からなることが分かった。

【0143】

(3) シクロプロパンカルボン酸(5 - (5 - (トリフルオロメチル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) アミドの結晶の製造

WO2009/022746号パンフレットに記載の方法に従って、図5のHPLCチャートが観測されるイソキサゾリン化合物のジアステレオマーの混合物(3)を合成した。

430mgのジアステレオマーの混合物(3)を、酢酸エチル4mLとヘキサン12mLの混合溶媒に溶かし、晶析を行った。析出した結晶をろ過し、得られた結晶を更に酢酸エチル - ヘキサンの混合溶媒で再結晶化を行い、単一のジアステレオマーからなる結晶を得た(70mg、33%)。得られた結晶の融点は、208~209であった。得られた結晶のHPLCチャート(図6参照)から、該結晶は、2番目のリテンションタイムを示す(S,S)体と、4番目のリテンションタイムを示す(R,R)体からなることが分かった。

【0144】

[製剤実施例]

本発明の有害生物防除剤の製剤実施例を若干示すが、添加物および添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。以下に農園芸用の製剤実施例を示す。

10

20

30

40

50

【 0 1 4 5 】

製剤実施例 1 (水和剤)

有効成分	40部
珪藻土	53部
高級アルコール硫酸エステル	4部
アルキルナフタレンスルホン酸塩	3部

以上を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分40%の水和剤を得た。

【 0 1 4 6 】

製剤実施例 2 (乳剤)

有効成分	30部	10
キシレン	33部	
ジメチルホルムアミド	30部	
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	7部	

以上を混合溶解して、有効成分30%の乳剤を得た。

【 0 1 4 7 】

以下に防疫用・動物用の製剤実施例を示す。

【 0 1 4 8 】

製剤実施例 3 (顆粒)

有効成分	5部	
カオリン	94部	20
ホワイトカーボン	1部	

有効成分を有機溶媒中で溶解させ、担体上へ噴霧した後、溶媒を減圧下蒸発させる。この種の顆粒は動物の餌と混合できる。

【 0 1 4 9 】

製剤実施例 4 (注入剤)

有効成分	0.1~1部
ラッカセイ油	バランス

調製後は、滅菌フィルターによりろ過滅菌する。

【 0 1 5 0 】

製剤実施例 5 (ポアオン剤)

有効成分	5部	30
ミリスチン酸エステル	10部	
イソプロパノール	バランス	

【 0 1 5 1 】

製剤実施例 6 (スポットオン剤)

有効成分	10~15部
パルミチン酸エステル	10部
イソプロパノール	バランス

【 0 1 5 2 】

製剤実施例 7 (スプレーオン剤)

有効成分	1部	40
プロピレングリコール	10部	
イソプロパノール	バランス	

【 0 1 5 3 】

以上のようにして得られた本発明の有害生物防除剤の試験例を以下に示す。

[試験例 1]

アワヨトウに対する効力確認試験

製剤実施例 2 に示された処方に従って乳剤を得た。それを光学活性化合物濃度が 0.49 ppm になるように水で希釈した。その希釈液中にトウモロコシ葉を 30 秒間浸漬した。トウモロコシ葉を風乾し、次いでろ紙を敷いたプラスチック製容器に入れた。それにア

ワヨトウ 2 齢幼虫 5 頭を接種した。プラスチック製容器に蓋をして、温度 25、湿度 65% の恒温室内に置いた。6 日経過後に、アワヨトウの生死を調べ、殺虫率を求めた。試験は 2 反復で行った。その結果、光学活性化合物 B ((S, S) 体) を用いた乳剤を浸漬させたトウモロコシ葉において 100% の殺虫率を示した。

【0154】

[試験例 2]

コナガに対する効力確認試験

製剤実施例 2 に示された処方に従って乳剤を得た。それを光学活性化合物濃度が 0.49 ppm になるように水で希釈した。その希釈液中にキャベツ葉片を 30 秒間浸漬した。キャベツ葉片を風乾し、次いでろ紙を敷いたプラスチック製容器に入れた。それにコナガ 2 齢幼虫 5 頭を接種した。プラスチック製容器に蓋をして、温度 25、湿度 65% の恒温室内に置いた。3 日経過後に、コナガの生死を調べ、殺虫率を求めた。試験は 2 反復で行った。その結果、光学活性化合物 B を用いた乳剤を浸漬させたキャベツ葉片において 100% の殺虫率を示した。

10

【産業上の利用可能性】

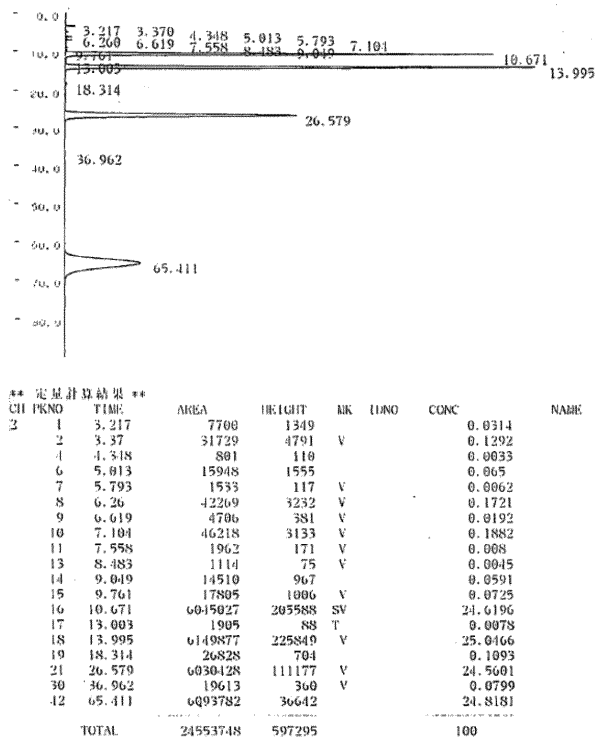
【0155】

本発明によれば、工業的に有利に合成でき、効果が確実で、特に安全に使用できる有害生物防除剤の有効成分となりうる光学活性イソオキサゾリン化合物またはその塩が提供される。また、安定な製剤化が可能な、単一のジアステレオマーからなるイソオキサゾリン化合物の結晶、およびその製造方法が提供される。

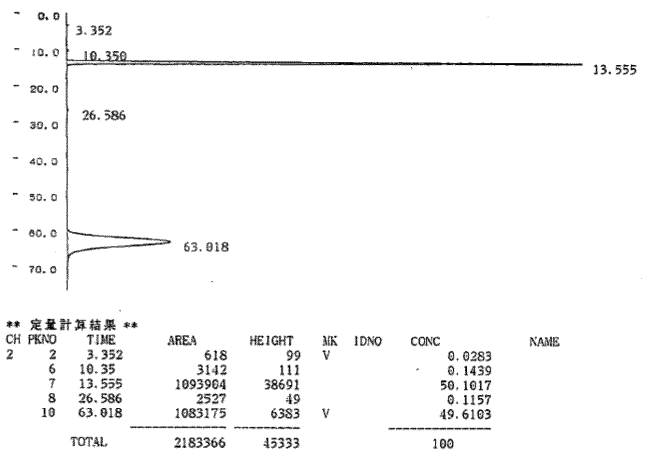
20

これらのイソオキサゾリン化合物またはその塩は、殺虫剤、殺ダニ剤、衛生害虫防除剤、動物用外部寄生虫防除剤などに有効であり、本発明は産業上極めて有用である。

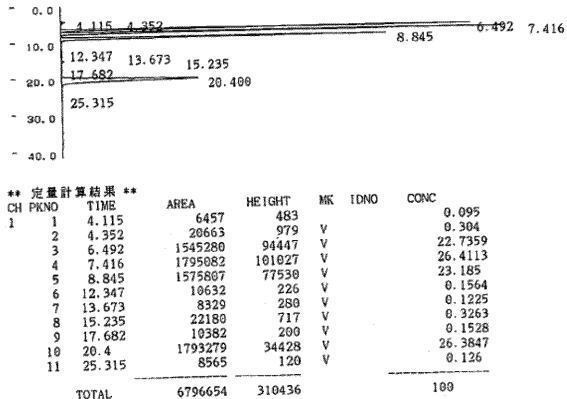
【図 1】



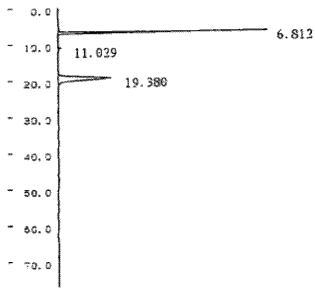
【図 2】



【図 3】



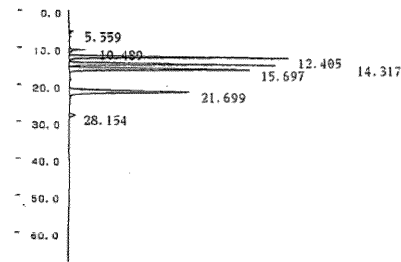
【 図 4 】



** 定量計算結果 **

CH	PKNO	TIME	AREA	HEIGHT	MK	IDNO	CONC	NAME
1	1	6.812	424919	25265			50.0191	
	3	11.029	10057	495			1.1815	
	4	19.38	414558	6616			48.7994	
TOTAL			849514	32315			100	

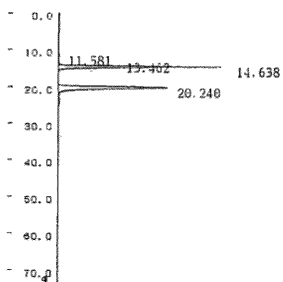
【 図 5 】



** 定量計算結果 **

CH	PKNO	TIME	AREA	HEIGHT	MK	IDNO	CONC	NAME
1	1	5.559	5687	233			0.4143	
	3	10.489	21662	923			1.5781	
	4	12.405	336528	13223	V		24.5159	
	5	14.317	331794	12510	V		24.171	
	6	15.697	335145	11027	V		24.4152	
	8	21.699	326863	7394			23.8118	
	9	28.154	15012	353			1.0936	

【 図 6 】



** 定量計算結果 **

CH	PKNO	TIME	AREA	HEIGHT	MK	IDNO	CONC	NAME
1	4	11.581	12854	435			0.2646	
	5	13.462	5998	255			0.1235	
	6	14.638	2416519	81194			49.7446	
	7	20.24	2422480	54061			49.8673	
TOTAL			4857850	135946			100	

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I テーマコード(参考)
A 0 1 P 7/04 (2006.01) A 0 1 P 7/04

Fターム(参考) 4H011 AC01 AC04 BA01 BB10 DA02 DA13 DA15 DA16 DA21 DC01
DC05

【要約の続き】

【選択図】なし