

(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  
2007年9月27日 (27.09.2007)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2007/108483 A1

(51) 国際特許分類:

*C07C 233/66* (2006.01)    *C07C 233/65* (2006.01)  
*A01N 37/18* (2006.01)    *C07C 233/73* (2006.01)  
*A01N 43/08* (2006.01)    *C07D 213/82* (2006.01)  
*A01N 43/10* (2006.01)    *C07D 231/14* (2006.01)  
*A01N 43/32* (2006.01)    *C07D 241/24* (2006.01)  
*A01N 43/40* (2006.01)    *C07D 277/20* (2006.01)  
*A01N 43/56* (2006.01)    *C07D 277/56* (2006.01)  
*A01N 43/60* (2006.01)    *C07D 307/56* (2006.01)  
*A01N 43/78* (2006.01)    *C07D 327/06* (2006.01)  
*A01N 47/02* (2006.01)    *C07D 333/38* (2006.01)  
*A01P 3/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2007/055726

(22) 国際出願日:

2007年3月20日 (20.03.2007)

(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2006-077752 2006年3月20日 (20.03.2006) JP  
 特願2006-294810  
 2006年10月30日 (30.10.2006) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 日本農薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 織田 雅次 (ODA, Masatsugu) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小

山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 松崎 義広 (MATSUZAKI, Yoshihiro) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 田中 浩二 (TANAKA, Koji) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 滝澤 英二 (TAKIZAWA, Eiji) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 長谷部 元宏 (HASEBE, Motohiro) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 黒木 信孝 (KUROKI, Nobutaka) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 諫訪 明之 (SUWA, Akiyuki) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 大島 賢治 (OSHIMA, Kenji) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP).

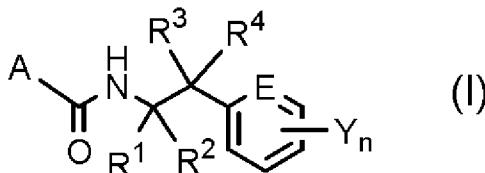
(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目1番1号 明治安田生命大阪御堂筋ビル Osaka (JP).

(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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,

[統葉有]

(54) Title: N-2-(HETERO)ARYLETHYLCARBOXAMIDE DERIVATIVE, AND PEST-CONTROLLING AGENT COMPRISING THE SAME

(54) 発明の名称: N-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体及びこれを含有する有害生物防除剤



(57) Abstract: Disclosed is an N-2-(hetero)arylethylcarboxamide derivative represented by the general formula (I) or a salt thereof: (I) wherein R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> independently represent a hydrogen atom or the like; R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> independently represent a hydrogen atom or the like; Y represents a halogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group which may be substituted by a halogen atom, or the like; n is an integer of 1 to 5; A represents a specific substituted cyclic group; and E represents C-H, C-Y (wherein Y is as defined above) or a nitrogen atom. Also disclosed is a pest-controlling agent comprising the derivative or the salt as an active ingredient. The derivative, the salt and the pest-controlling agent have superior properties to conventional ones, and are particularly useful as an excellent plant disease-controlling agent or nematocidal agent which can show a wide controlling spectrum at a low dose.

(57) 要約: 一般式 (I) [式中、R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> はそれぞれ独立に水素原子等を、R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> はそれぞれ独立に水素原子等を、Y はそれぞれ独立にハロゲン原子、ハロゲン原子により置換されていても良い (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基等を、n は 1 ~ 5 の整数を、A は特定の置換環式基を E は C-H ; C-Y (Y は上記に定義するとおりである。) 又は窒素原子を表す。] で表される N-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類、ならびにこれを有効成分として含有する有害生物防除剤は、従来技術に比べて優れた性能を有し、特に低薬量で広い防除スペクトラムを有する優れた植物病害防除剤又は殺線虫剤として有用である。

WO 2007/108483 A1



SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, ZA, ZM, ZW.

TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,  
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

- (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, LS, MW, MZ, NA, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,  
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,  
IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK,

添付公開書類:  
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

## 明細書

### N-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体及びこれを含有する有害生物防除剤

#### 技術分野

[0001] 本発明はN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類、及び該化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤、特に植物病害防除剤又は殺線虫剤並びにその使用方法に関する。

#### 背景技術

[0002] 従来、ある種のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体が殺菌活性を有することが知られている(例えば、特許文献1、2、3又は4参照。)。

特許文献1:特開平1-151546号公報

特許文献2:国際公開第04/016088号パンフレット

特許文献3:国際公開第04/074280号パンフレット

特許文献4:国際公開第06/016708号パンフレット

#### 発明の開示

##### 発明が解決しようとする課題

[0003] しかしながら、特許文献1に記載のフェネチルカルボキサミド誘導体は植物病害に対し実用レベルではほとんど活性を示さない。特許文献2、3及び4に記載のカルボキサミド誘導体は高い殺菌活性を示す場面もあるが、十分満足できる殺菌スペクトラムを有さない等の課題があった。この様に従来技術では植物病害防除剤として効力や防除スペクトラムの点で必ずしも十分ではなかった。近年、地球環境への負荷が注目されるようになり、植物病害防除剤においても低薬量で広い防除スペクトラムを有する化合物が求められていた。

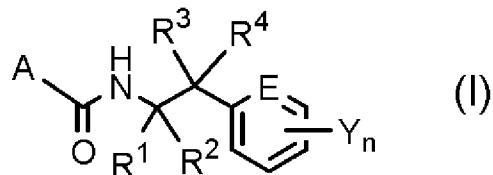
##### 課題を解決するための手段

[0004] 本発明者等は上記課題を解決すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式(I)で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体及びその塩類が植物病害防除剤として優れた防除効果と極めて広い殺菌スペクトラムを有するのみなら

ず、殺線虫活性をも併せ持つことを見いだし、本発明を完成させるに至った。即ち、本発明は、

[1]一般式(I)

[0005] [化1]



[0006] {式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>はそれぞれ独立に水素原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示す。また、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良い。

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示す。また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、Aが式(A3)で表される置換環式基を示す場合は、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>が一緒になって酸素原子を示しても良い。

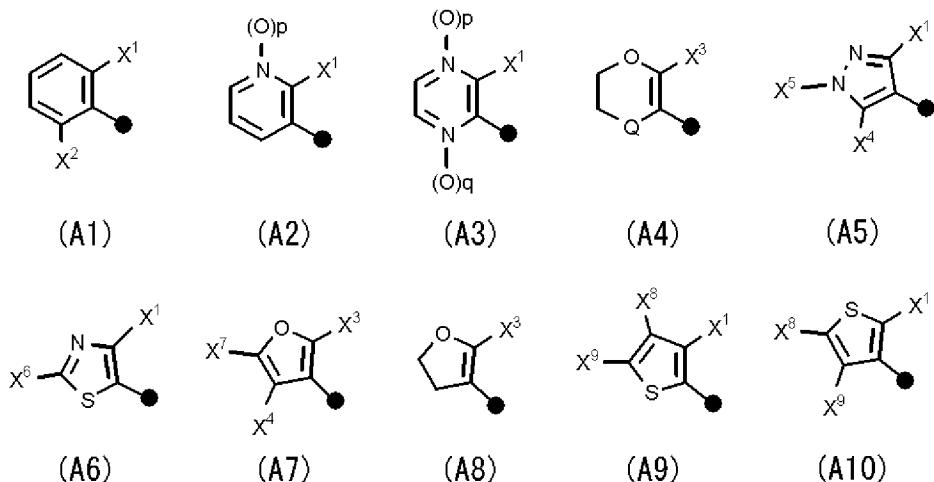
Yはそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ヒドロキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルキニル基;ハロゲン原子および(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選ばれる置換基により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルキニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基;(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル基;(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基;(C<sub>3</sub>—C<sub>30</sub>)トリアルキルシリル基;置換基群Zから選ばれる1以上の置換基で置換されていても良いフェニル基;置換基群Zから選ばれる1以上の置換基で置換されていても良いフェノキシ基;又は置換基群Zから選ばれる1以上の置換基で置換されていても良い複素環オキシ基を示し、nは1～5の整数を示す。

また、nが2～5の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルキ

レン基; ( $C_3 - C_5$ ) アルケニレン基; ( $C_2 - C_4$ ) アルキレンオキシ基; 又はハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_3$ ) アルキレンジオキシ基を示すことができる。置換基群Zは、水素原子; ハロゲン原子; シアノ基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_2 - C_6$ ) アルキニル基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_2 - C_6$ ) アルケニルオキシ基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_2 - C_6$ ) アルキニルオキシ基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルフィニル基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニル基; ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル基; ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシイミノ ( $C_1 - C_3$ ) アルキル基; 又はカルバモイル基を示す。

Aは、式(A1)乃至(A10)からなる群から選ばれる置換環式基を示す。

[0007] [化2]



[0008] (式中、X<sup>1</sup>はハロゲン原子; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_3$ ) アルキル基; ハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ基; 又はハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_3$ ) アルキルチオ基を示す。

X<sup>2</sup>は水素原子; 又はハロゲン原子を表す。

X<sup>3</sup>はハロゲン原子により置換されていても良い ( $C_1 - C_3$ ) アルキル基を示す。

X<sup>4</sup>、X<sup>7</sup>、X<sup>8</sup>及びX<sup>9</sup>はそれぞれ独立に、水素原子; ハロゲン原子; 又はハロゲン原子

により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す。

$X^5$ は水素原子;又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す。

$X^6$ は水素原子;アミノ基;モノ( $C_1-C_3$ )アルキルアミノ基;ジ( $C_1-C_3$ )アルキルアミノ基;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す。

$Q$ は酸素原子;硫黄原子;— $SO_2-$ 又は— $CH_2-$ を示す。

$p$ 及び $q$ はそれぞれ独立に0又は1を示す。)

$E$ はC—H;C—Y(Yは上記に定義するとおりである。);又は窒素原子を表す。

但し、(1)Eが窒素原子を示す場合、Aは式(A3)で表される置換環式基を示し、かつ(2)2, 6-ジクロロ-N-[2-{3-(トリフルオロメチル)フェニル}エチル]ベンズアミドを除く。}で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[2]EがC—H又はC—Y(Yは上記[1]に定義するとおりである。)を示す、上記[1]に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[0009] [3]Aが式(A1)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[4]Aが式(A1)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、また、 $R^1$ と $R^2$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ヒドロキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基;ハロゲン原子および( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選ばれる置換基により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_2-C_6$ )アルケニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されても良

い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良い複素環オキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルキレン基;( $C_3-C_5$ )アルケニレン基;( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^1$ がハロゲン原子;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルコキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキルチオ基を示し、

$X^2$ が水素原子;又はハロゲン原子を示す、

上記[1]乃至[3]のいずれかに記載のN—2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[0010] [5]Aが式(A2)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN—2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[6]Aが式(A2)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、また、 $R^1$ と $R^2$ は一緒になって

( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、 $Y$ がそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ヒドロキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基;ハロゲン原子および( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選ばれる置換基により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_2-C_6$ )アルケニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェノキシ基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良い複素環オキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルケレン基;( $C_3-C_5$ )アルケニレン基;( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、 $X^1$ がハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

pが0を示す、

上記[1]、[2]及び[5]のいずれかに記載のN—2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[0011] [7]Aが式(A3)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN—2-(

ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[8]Aが式(A3)で表される置換環式基を示し、

EがC—H; C—Y(Yは下記に定義するとおりである。)又は窒素原子を示し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子; 又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子; ハロゲン原子; 又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>が一緒になって酸素原子を示しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子; シアノ基; ヒドロキシ基; ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基; ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基; ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基; ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基; ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基; ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基; 同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基; 同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基; 又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良い複素環オキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケレン基; (C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基; (C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基; 又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、X<sup>1</sup>がハロゲン原子; 又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキ

ル基を示し、

p及びqが0を示す、

上記[1]又は[7]に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[9]EがC—H又はC—Y(Yは上記[8]に定義するとおりである。)を示す、上記[8]記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[0012] [10]Aが式(A4)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[11]Aが式(A4)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子；又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子；ハロゲン原子；又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基；ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基；ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基；ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基；ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基；同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基；又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケレン基；(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基；(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基；又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^3$ がハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、  
Qが硫黄原子を示す、

上記[1]、[2]及び[10]のいずれかに記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[0013] [12]Aが式(A5)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[13]Aが式(A5)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子；又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子；ハロゲン原子；又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基；同一又は異なっても

良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェニル基；又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェノキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルケレン基；( $C_3-C_5$ )アルケニレン基；( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基；又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、 $X^1$ がハロゲン原子；又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$X^4$ が水素原子;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示し、

$X^5$ が水素原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示す、

上記[1]、[2]及び[12]のいずれかに記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[0014] [14]Aが式(A6)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[15]Aが式(A6)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示し、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1 - C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3 - C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3 - C_5$ )アルケレン基;( $C_3 - C_5$ )アルケニレン基;( $C_2 - C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^1$ がハロゲン原子; 又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示し、

$X^6$ が水素原子; アミノ基; モノ( $C_1 - C_3$ )アルキルアミノ基; ジ( $C_1 - C_3$ )アルキルアミノ基; ハロゲン原子; 又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示す、

上記[1]、[2]及び[14]のいずれかに記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[0015] [16]Aが式(A7)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[17]Aが式(A7)で表される置換環式基を示し、

EがC-H又はC-Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子; 又は( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示し、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子; ハロゲン原子; 又は( $C_1 - C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3 - C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子; シアノ基; ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基; ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基; ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルチオ基; ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルスルフィニル基; ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルスルホニル基; 同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基; 又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示し、nが1~3の整数を示し、

また、nが2~3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3 - C_5$ )アルケン基; ( $C_3 - C_5$ )アルケニレン基; ( $C_2 - C_4$ )アルキレンオキシ基; 又はハロゲン原子

により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、  
 $X^3$ がハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、  
 $X^4$ 及び $X^7$ がそれぞれ独立して水素原子;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置  
 換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す、

上記[1]、[2]及び[16]のいずれかに記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカル  
 ボキサミド誘導体又はその塩類;

[0016] [18]Aが式(A8)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN—2  
 —(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類;

[19]Aが式(A8)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、  
 $R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を  
 示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、  
 Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良  
 い( $C_1-C_6$ )アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコ  
 キシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基;ハロゲ  
 ン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子  
 により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても  
 良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アル  
 キル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基か  
 ら選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しく  
 は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(  
 $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )ア  
 ルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を  
 示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルキ  
 レン基;( $C_3-C_5$ )アルケニレン基;( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子  
 により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^3$ がハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す、上記[1]、[2]及び[18]のいずれかに記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[0017] [20]Aが式(A9)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[21]Aが式(A9)で表される置換環式基を示し、

EがC-H又はC-Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子；又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子；ハロゲン原子；又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基；ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基；同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェニル基；又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェノキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルケレン基；( $C_3-C_5$ )アルケニレン基；( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基；又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^1$ がハロゲン原子；又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$X^8$ 及び $X^9$ がそれぞれ独立に水素原子；ハロゲン原子；又はハロゲン原子により置換

されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す、

上記[1]、[2]及び[20]のいずれかに記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[0018] [22]Aが式(A10)で表される置換環式基を示す、上記[1]又は[2]に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

[23]Aが式(A10)で表される置換環式基を示し、

EがC-H又はC-Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子；又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子；ハロゲン原子；又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基；同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基；又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルケレン基；( $C_3-C_5$ )アルケニレン基；( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基；又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^1$ がハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$X^8$ 及び $X^9$ がそれぞれ独立して水素原子；ハロゲン原子；又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す、

上記[1]、[2]及び[22]のいずれかに記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類；

- [0019] [24]上記[1]乃至[23]のいずれかに記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類を有効成分とする有害生物防除剤；  
[25]植物病害防除剤である上記[24]に記載の有害生物防除剤；  
[26]殺線虫剤である上記[24]に記載の有害生物防除剤；及び  
[27]上記[24]乃至[26]のいずれかに記載の有害生物防除剤の有効量を対象作物植物体又は当該植物の栽培に用いる土壤に処理することを特徴とする、有害生物の防除方法に関する。

### 発明の効果

- [0020] 本発明は、従来技術に比べて優れた性能を有する有害生物防除剤、特に低薬量で広い防除スペクトラムを有する植物病害防除剤又は殺線虫剤として有用な化合物を提供するものである。

### 発明を実施するための最良の形態

- [0021] 本発明のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体の一般式(I)の定義について以下に説明する。

[0022] 「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示す。

[0023] 「(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペニチル基、ネオペニチル基、ノルマルヘキシル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示す。

[0024] 「(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数1~3個のアルキル基を示す。

[0025] 「ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペニチル基、ネオペニチル基、ノルマルヘキシル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基；及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分

岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、例えばトリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、パーフルオロエチル基、パーフルオロイソプロピル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、1-ブロモエチル基、2, 3-ジブロモプロピル基等を示す。

- [0026] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数1～3個のアルキル基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～3個のアルキル基を示し、例えばトリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、パーフルオロエチル基、パーフルオロイソプロピル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、1-ブロモエチル基、2, 3-ジブロモプロピル基等を示す。
- [0027] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2-C_6$ )アルケニル基」とは、例えばビニル基、プロペニル基、ブテニル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニル基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニル基を示し、例えばフルオロビニル基、ジフルオロビニル基、パーフルオロビニル基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニル基、4, 4-ジフルオロー-3-ブテニル基等を示す。
- [0028] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2-C_6$ )アルキニル基」とは、例えばエチニル基、プロピニル基、ブチニル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数2～6個のアルキニル基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルキニル基を示し、例えばフルオロエチニル基、パーフルオロプロピニル基、4, 4, 4-トリフルオロー-2-ブチニル基等を示す。
- [0029] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基」とは、例えばメトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルコキシ基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアル

コキシ基を示し、例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、パーフルオロエトキシ基、パーフルオロイソプロポキシ基、クロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、1-ブロモエトキシ基、2, 3-ジブロモプロポキシ基等を示す。

- [0030] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルコキシ基」とは、例えばメトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～3個のアルコキシ基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～3個のアルコキシ基を示し、例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、パーフルオロエトキシ基、パーフルオロイソプロポキシ基、クロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、1-ブロモエトキシ基、2, 3-ジブロモプロポキシ基等を示す。
- [0031] 「ハロゲン原子および( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選ばれる置換基により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基」とは、例えばメトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルコキシ基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子及び/又は同一又は異なっても良い1以上の( $C_1-C_6$ )アルコキシ基により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルコキシ基を示し、例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、パーフルオロエトキシ基、パーフルオロイソプロポキシ基、クロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、1-ブロモエトキシ基、2, 3-ジブロモプロポキシ基、メキシメトキシ基、エトキシメトキシ基、プロポキシメトキシ基、メキシエトキシ基、エトキシエトキシ基等を示す。
- [0032] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2-C_6$ )アルケニルオキシ基」とは、例えばプロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基、ペンテニルオキシ基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニルオキシ基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニルオキシ基を示し、例えばフルオロビニルオキシ基、ジフルオロビニルオキシ基、パーフルオロビニルオキシ基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ基、4, 4

ージフルオロー-3-ブテニルオキシ基等を示す。

- [0033] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2-C_6$ )アルキニルオキシ基」とは、例えばプロピニルオキシ基、ブチニルオキシ基、ペンチニルオキシ基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルオキシ基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルオキシ基を示し、例えばフルオロエチニルオキシ基、パーフルオロプロピニルオキシ基、4, 4, 4-トリフルオロー-2-ブチニルオキシ基等を示す。
- [0034] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基」とは、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペニルチオ基、イソペニルチオ基、ノルマルヘキシリルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルチオ基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルチオ基を示し、例えばトリフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、パーフルオロエチルチオ基、パーフルオロイソプロピルチオ基、クロロメチルチオ基、ブロモメチルチオ基、1-ブロモエチルチオ基、2, 3-ジブロモプロピルチオ基等を示す。
- [0035] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキルチオ基」とは、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~3個のアルキルチオ基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~3個のアルキルチオ基を示し、例えばトリフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、パーフルオロエチルチオ基、パーフルオロイソプロピルチオ基、クロロメチルチオ基、ブロモメチルチオ基、1-ブロモエチルチオ基、2, 3-ジブロモプロピルチオ基等を示す。
- [0036] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基」とは、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ノルマルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペニルスルフィ

ニル基、イソペンチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキルスルフィニル基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキルスルフィニル基を示し、例えばトリフルオロメチルスルフィニル基、ジフルオロメチルスルフィニル基、ペーフルオロエチルスルフィニル基、ペーフルオロイソプロピルスルフィニル基、クロロメチルスルフィニル基、ブロモメチルスルフィニル基、1-ブロモエチルスルフィニル基、2, 3-ジブロモプロピルスルフィニル基等を示す。

[0037] 「ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基」とは、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリープチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペニチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキルスルホニル基;及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキルスルホニル基を示し、例えばトリフルオロメチルスルホニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、ペーフルオロエチルスルホニル基、ペーフルオロイソプロピルスルホニル基、クロロメチルスルホニル基、ブロモメチルスルホニル基、1-ブロモエチルスルホニル基、2, 3-ジブロモプロピルスルホニル基等を示す。

[0038] 「( $C_1-C_6$ )アルコキシカルボニル基」とは、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ノルマルプロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ノルマルブトキシカルボニル基、ターシャリーブトキシカルボニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルコキシカルボニル基を示す。

[0039] 「( $C_1-C_6$ )アルコキシイミノ( $C_1-C_3$ )アルキル基」とは、例えばメトキシイミノメチル基、エトキシイミノメチル基、ノルマルプロポキシイミノメチル基、イソプロポキシイミノエチル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルコキシイミノ( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す。

[0040] 「( $C_3-C_{30}$ )トリアルキルシリル基」とはトリメチルシリル基、トリエチルシリル基等の直

鎖又は分岐鎖状の総炭素原子数3～30個のアルキルシリル基を示す。

- [0041]  $R^1$ と $R^2$ 及び $R^3$ と $R^4$ が一緒になって形成される「 $(C_3-C_6)$ シクロアルカン」としては、シクロプロパン、シクロブタン、シクロヘキサン等が挙げられる。
- [0042] 「 $(C_3-C_5)$ アルキレン基」としては、トリメチレン基、テトラメチレン基、ペントメチレン基等が挙げられる。
- [0043] 「 $(C_3-C_5)$ アルケニレン基」としては、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH=CH-CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-CH_2-$ 等が挙げられる。
- [0044] 「 $(C_2-C_4)$ アルキレンオキシ基」としては、 $-CH_2-CH_2-O-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-O-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-O-$ 等が挙げられる。
- [0045] 「ハロゲン原子により置換されていても良い $(C_1-C_3)$ アルキレンジオキシ基」としては、 $-O-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_2-O-$ 等の炭素数1～3のアルキレンジオキシ基；及び同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された当該アルキレンジオキシ基を示し、例えば、 $-O-CF_2-O-$ 、 $-O-CF_2-CF_2-O-$ 、 $-O-CCl_2-O-$ 等を示す。
- [0046] 「モノ $(C_1-C_3)$ アルキルアミノ基」とは、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、ノルマルプロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数1～3個のアルキルアミノ基を示す。
- [0047] 「ジ $(C_1-C_3)$ アルキルアミノ基」とは、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジノルマルプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基、N—メチル-N—エチルアミノ基、N—メチル-N—イソプロピルアミノ基等の同一又は異なっていてもよい直鎖又は分鎖状の炭素原子数1～3個のアルキル基を2個有するアミノ基を示す。
- [0048] 「複素環オキシ基」とは、例えばフリルオキシ基、チエニルオキシ基、ピラゾリルオキシ基、イミダゾリルオキシ基、トリアゾリルオキシ基、チアゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、トリアジニルオキシ基、インドリルオキシ基、ベンゾチアゾリルオキシ基、キノリルオキシ基、キナゾリニルオキシ基、キノキサリニルオキシ基等の同一又は異なっても良く、酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員複素環オキシ基又はそれらの縮合

複素環オキシ基を示す。

[0049] 本発明の一般式(I)で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体は、公知化合物との偶然の一一致を回避するため、但し書により下記(1)及び(2)の条件が付される。

(1) Eが窒素原子を示す場合、Aは式(A3)で表される置換環式基を示す。

(2) 2, 6-ジクロロ-N-[2-{3-(トリフルオロメチル)フェニル}エチル]ベンズアミドを除く。

[0050] 本発明の一般式(I)で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

[0051] 本発明の一般式(I)で表される化合物において、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>として好ましくは、水素原子;メチル基;又はエチル基である。R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>のうち少なくとも一方は水素原子であることが更に好ましく、それに伴って生ずる光学活性体の一方のエナンチオマーは更に好ましい。

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立して水素原子;フッ素原子;又はR<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が一緒になつてシクロプロパンを形成することが好ましい。

Yとして好ましくはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子等のハロゲン原子;ヒドロキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)アルケニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)アルケニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオ基;置換基群Zから選ばれる置換基により置換されていても良いフェニル基;又は置換基群Zから選ばれる置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示すか、或いは隣り合う2つのYが一緒になって、ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基である。

Zとして好ましくはハロゲン原子;ハロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルキル基;又はハロ(C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>)アルコキシ基である。

nとして好ましくは2又は3である。

Aとして好ましくは式(A1)、(A2)、(A3)、(A4)、(A5)、(A6)、(A7)及び(A9)からなる群から選ばれる置換環式基であり、更に好ましくは式(A3)で表される置換環式基である。

X<sup>1</sup>として好ましくはハロゲン原子;トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基等のハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基;トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等のハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルコキシ基;又はトリフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基等のハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキルチオ基であり、更に好ましくはトリフルオロメチル基である。

X<sup>2</sup>として好ましくは水素原子、フッ素原子又は塩素原子であり、更に好ましくは水素原子である。

X<sup>3</sup>として好ましくはメチル基、トリフルオロメチル基又はジフルオロメチル基である。

X<sup>4</sup>、X<sup>7</sup>、X<sup>8</sup>及びX<sup>9</sup>として好ましくは水素原子である。

X<sup>5</sup>として好ましくはメチル基である。

X<sup>6</sup>として好ましくは水素原子、アミノ基、塩素原子又はメチル基である。

Qとして好ましくは硫黄原子である。

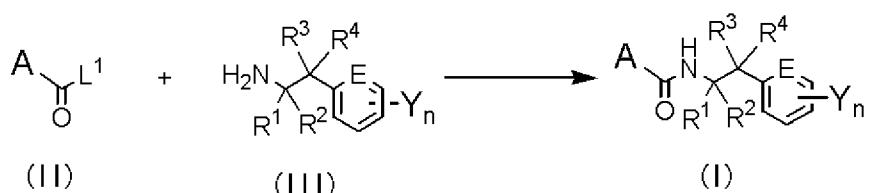
p及びqとして好ましくは0である。

Eとして好ましくはC—H又はC—Y(Yは上記に定義するとおりである。)である。

[0052] 本発明化合物は例えば下記の製造方法に従って製造されるがこれに限定されるものではない。

### 製造方法1

[0053] [化3]



[0054] (式中、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、E、Y及びnは前記に同じくし、L<sup>1</sup>は塩素原子、臭素原子、アルコキシ基等の脱離基を示す。)

一般式(II)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸誘導体と一般式(III)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体とを塩基の存在下、不活性溶媒中反応させることにより一般式(I)で表される本発明のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体を製造することができる。

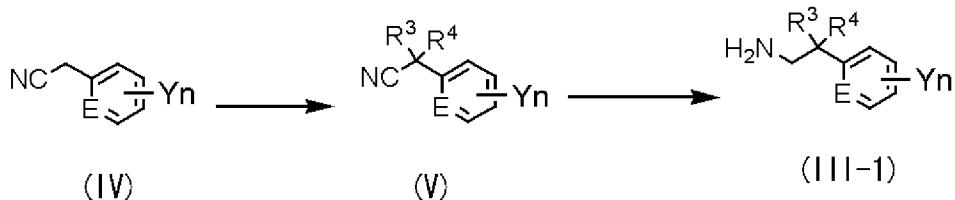
本反応における反応温度は通常-20°C~120°Cの範囲で、反応時間は通常0.2時間~24時間の範囲で行われる。一般式(III)で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体は一般式(II)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸誘導体に対して通常0.2~5倍モルの範囲で使用される。

[0055] 塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類;酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類;カリウム-t-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類;トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類;ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができる。塩基の量は一般式(II)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸誘導体に対して通常0.5~10倍モルの範囲で使用される。

[0056] 本反応は溶媒を使用しても使用しなくても良いが、使用できる溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類;ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類;ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類;塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類;アセトニトリル等のニトリル類;酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類;N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、水、酢酸等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

- [0057] 本反応に使用される一般式(II)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸誘導体は公知文献(例えば、国際公開第05/115994号パンフレット、国際公開第01/42223号パンフレット、国際公開第03/066609号パンフレット、国際公開第03/066610号パンフレット、国際公開第03/099803号パンフレット、国際公開第03/099804号パンフレット、国際公開第03/080628号パンフレット等)に記載の方法、又はこれらに準じた方法で製造することができる。
- [0058] 一般式(III)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体は例えば下記の中間体製造方法1乃至4に従って製造することができる。
- 中間体製造方法1( $R^1$ 及び $R^2$ が水素原子の場合)
- [0059] [化4]

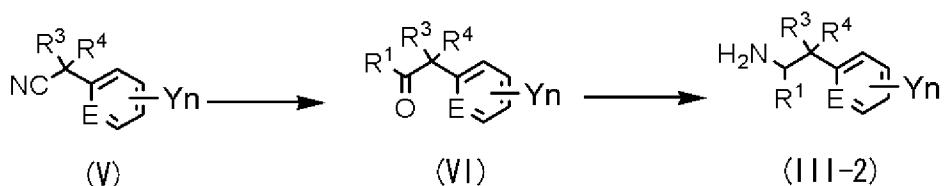


- [0060] (式中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、E、Y及びnは前記に同じ。)

本反応は公知文献(例えば、Tetrahedron, 2002, 58(11), p.2211.等)に記載の方法、又はこれに準じた方法で製造することができる。即ち、一般式(IV)で表されるアセトニトリル誘導体と相当するアルキル化剤とを塩基の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより一般式(V)で表される(ヘテロ)アリールアセトニトリル誘導体とし、該(ヘテロ)アリールアセトニトリル誘導体(V)を単離し、又は単離せずして不活性溶媒中でラネーニッケル等の触媒の存在下、接触水素添加するか或いは水素化リチウムアルミニウム等の還元剤を用いて還元することにより一般式(III-1)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体を製造することができる。

中間体製造方法2( $R^2$ が水素原子の場合)

- [0061] [化5]



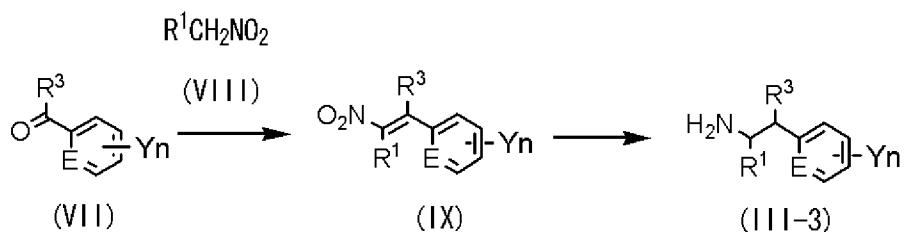
[0062] (式中、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、E、Y及びnは前記に同じ。)

本反応は公知文献(例えば、J. Med. Chem., 1986, 29, p.302、Angew. Chem., 1989, 28(2), p.218.等)に記載の方法、又はこれに準じた方法で製造することができる。

即ち、一般式(V)で表される(ヘテロ)アリールアセトニトリル誘導体にGrignard反応を行うことにより一般式(VI)で表されるケトン誘導体とし、該ケトン誘導体(VI)を単離し、又は単離せずにLeuckart-Wallach反応或いはそれに類した還元的アミノ化反応を行うか、ヒドロキシルアミンを反応させてヒドロキシム誘導体に導いた後ラネーニッケル等の触媒の存在下、接触水素添加することにより一般式(III-2)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体を製造することができる。

### 中間体製造方法3( $R^2$ 及び $R^4$ が水素原子の場合)

[0063] [化6]

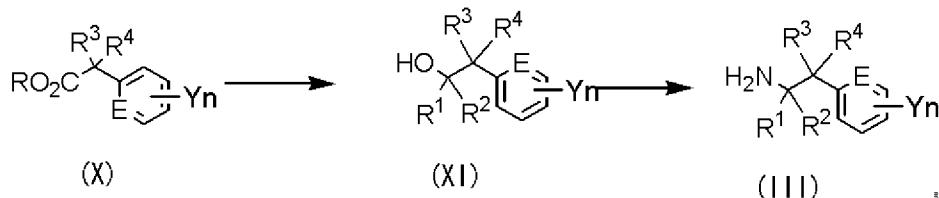


[0064] (式中、 $R^1$ 、 $R^3$ 、E、Y及びnは前記に同じ。)

本反応は公知文献(例えば、*Tetrahedron*, 1995, 51(18), p.5361.等)に記載の方法、又はこれに準じた方法で製造することができる。即ち、一般式(VII)で表されるケトン誘導体と一般式(VIII)で表されるニトロアルキル類とを反応させることにより一般式(IX)で表されるニトロアルケン誘導体とし、該ニトロアルケン誘導体(IX)を単離し、又は単離せずして亜鉛末等による金属還元、ラネーニッケル等の触媒を用いる接触水素添加、又は水素化リチウムアルミニウム等の還元剤を用いる還元方法により一般式(II-3)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体を製造ことができる。

中間体製造方法4

〔0065〕 〔化7〕

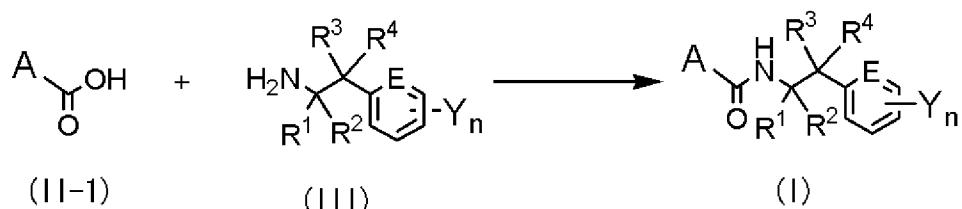


[0066] (式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、E、Y及びnは前記に同じ。)

本反応は公知文献(例えば、J. Am. Chem. Soc., 1950, 72, p.2786.等)に記載の方法、又はこれに準じた方法で製造することができる。即ち、一般式(X)で表される(ヘテロ)アリール酢酸エステル誘導体にGrignard反応或いはそれに類した反応を行うことにより一般式(XI)で表される(ヘテロ)アリールエチルアルコール誘導体とし、該(ヘテロ)アリールエチルアルコール誘導体(XI)を(ヘテロ)アリールエチルハライド誘導体に導いた後Gabriel反応を行うか、又は(ヘテロ)アリールエチルアジド誘導体に導いた後それを還元することにより一般式(III)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体を製造ことができる。

## 製造方法2

[0067] [化8]



[0068] (式中、A、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、E、Y及びnは前記に同じ。)

一般式(II-1)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸と一般式(III)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体とを縮合剤及び塩基の存在下、不活性溶媒中反応させることにより一般式(I)で表される本発明のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体を製造することができる。本反応における反応温度は通常-20°C~120°Cの範囲で、反応時間は通常0.2時間~24時間の範囲で行われる。一般式(III)で表される2-(ヘテロ)アリールエチルアミン誘導体は一般式(II-1)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸誘導体に対して通常0.2~5倍モルの範囲で使用される。

[0069] 本反応で使用する縮合剤としては、例えばシアノリン酸ジエチル(DEPC)、カルボ

ニルジイミダゾール(CDI)、1, 3-ジシクロヘキシリカルボジイミド(DCC)、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、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2-クロロ-1-メチルピリジニウム等を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸誘導体に対して通常0.5~3倍モルの範囲で使用すればよい。

[0070] 塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類;酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類;カリウム-t-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類;トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類;ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができる。塩基の量は一般式(II-1)で表される(ヘテロ)環式カルボン酸に対して通常0.5~10倍モルの範囲で使用される。

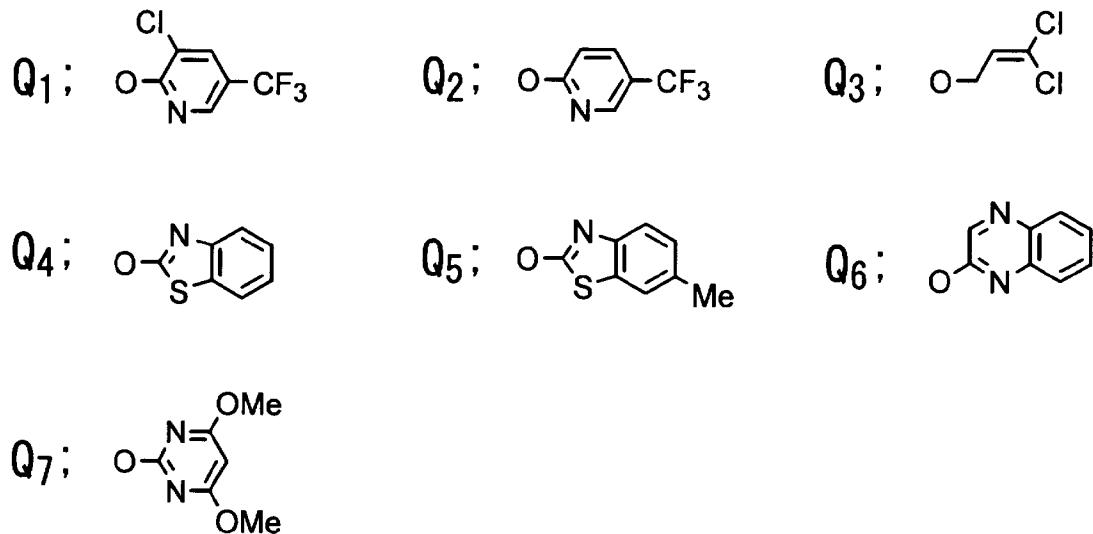
[0071] 本反応で使用できる溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類;ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類;塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類;クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類;アセトニトリル等のニトリル類;酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類;N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0072] かくして得られる本発明の一般式(I)で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体の代表例を第1表乃至第11表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。第1表乃至第11表において、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Ph」はフェニル基を、「i-」

はインを示し、「Q1～Q7」は下記構造を示す。

[0073] [化9]

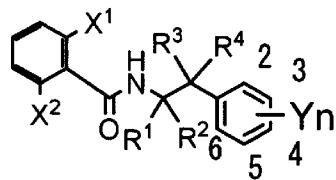


[0074] 尚、物性は融点(℃)又は屈折率 $n_D$ (測定温度℃)を示す。

また、第3表中化合物番号3-43-R及び3-43-Sは化合物番号3-43の光学活性体であり、その旋光度は3-43-Rが $[\alpha]_D^{25.0} = -48.18$ (C=1.00, CHCl<sub>3</sub>)であり、3-43-Sが $[\alpha]_D^{25.0} = +48.10$ (C=1.00, CHCl<sub>3</sub>)であった。更に、第1表乃至第11表中、物性欄に「Paste」と記載した化合物についてはその<sup>1</sup>HNMRスペクトルデータを第12表に示した。

[0075] [表1-1]

第1表



(I-1)

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
1-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl	104.9-105.7
1-2	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub>	63-65
1-3	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	4-Cl	116.6-117.6
1-4	CF <sub>3</sub>	H	H	H	Me	H	4-Cl	89
1-5	CF <sub>3</sub>	H	H	H	Me	Me	4-Cl	91-92
1-6	CF <sub>3</sub>	H	H	H	Et	H	4-Cl	Paste
1-7	CF <sub>3</sub>	H	H	H	Me	Et	4-Cl	Paste
1-8	CF <sub>3</sub>	H	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
1-9	CF <sub>3</sub>	H	H	H	i-Bu	H	4-Cl	Paste
1-10	I	H	H	H	Me	H	4-Cl	119
1-11	I	H	H	H	Me	Me	4-Cl	121-122
1-12	I	H	H	H	Et	H	4-Cl	103
1-13	I	H	H	H	Me	Et	4-Cl	Paste
1-14	I	H	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
1-15	I	H	H	H	i-Bu	H	4-Cl	86-91
1-16	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	104.2-105.2
1-17	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,3-Cl <sub>2</sub>	135-136
1-18	I	H	H	H	H	H	2,3-Cl <sub>2</sub>	145-146
1-19	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub>	148.4-149.4
1-20	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	95-96.8
1-21	I	H	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	107.2-109.2
1-22	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-F	81.5-82.8
1-23	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	97-98
1-24	I	H	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	121-122.7
1-25	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	89.8-90.9
1-26	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	112.9-113.7
1-27	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4-Me <sub>2</sub>	75.1-77.2
1-28	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,5-Me <sub>2</sub>	94-95
1-29	I	H	H	H	H	H	2,5-Me <sub>2</sub>	115-116
1-30	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-5-CF <sub>3</sub>	95.7-96.9
1-31	I	H	H	H	H	H	2-Cl-5-CF <sub>3</sub>	122-123

[0076] [表1-2]

第1表 (続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
1-32	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	142
1-33	I	H	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	161-162
1-34	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	108-112
1-35	I	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	101-103
1-36	F	F	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	99-101
1-37	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	107-110
1-38	I	H	Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	50-51
1-39	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	94-97
1-40	I	H	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	118
1-41	SCHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	103
1-42	I	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	125-126
1-43	Br	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	127-128
1-44	Cl	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	124-126
1-45	Me	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	136-138
1-46	F	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	78
1-47	F	F	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	75-76
1-48	OCF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	88-90
1-49	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	64-65
1-50	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	146-148
1-51	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	102-103
1-52	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-F-4-Cl	101-102
1-53	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Paste
1-54	I	H	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	98-100
1-55	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	94.4-95.8
1-56	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	Paste
1-57	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	135.7-137.2
1-58	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	137.8-138.8
1-59	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	Paste
1-60	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	109.6-111.5
1-61	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	130-131.6
1-62	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
1-63	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	144.5-145.5
1-64	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	121.5-124.5
1-65	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	140.7-142.3
1-66	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	169.2-171.6
1-67	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	

[0077] [表1-3]

第1表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
1-68	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	109.2-112.9
1-69	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	159.5-160.8
1-70	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
1-71	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	123.9-125.4
1-72	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
1-73	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
1-74	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
1-75	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
1-76	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	118.3-119.8
1-77	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
1-78	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
1-79	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	146.9-148.7
1-80	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	169.1-169.8
1-81	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	133
1-82	I	H	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	143
1-83	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	
1-84	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
1-85	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
1-86	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-F-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
1-87	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	121
1-88	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
1-89	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
1-90	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	3,4-F <sub>2</sub>	
1-91	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
1-92	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
1-93	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	
1-94	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	95.4-96.2
1-95	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	160.2-161.1
1-96	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	103.6-104.7
1-97	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	
1-98	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
1-99	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
1-100	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	98.7-99
1-101	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
1-102	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	74.1-76.3

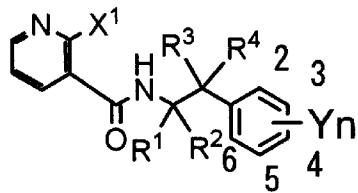
[0078] [表1-4]

第1表（続き）

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
1-103	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	125.4-128.4
1-104	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SOMe	128.9-129.6
1-105	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	135.4-137.1
1-106	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	143.0
1-107	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	2-Br-4-F	106.4
1-108	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	126.0
1-109	F	F	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	134.6-136.7

[0079] [表2-1]

第2表



化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
2-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	104.2-105.2
2-2	Cl	H	H	H	H	2-Cl	92.4-93.3
2-3	Cl	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub>	82-87
2-4	Cl	H	H	H	H	4-Cl	112.5-113.2
2-5	Cl	H	H	Me	H	4-Cl	Paste
2-6	Cl	H	H	Me	Me	4-Cl	Paste
2-7	Cl	H	H	Et	H	4-Cl	Paste
2-8	Cl	H	H	Me	Et	4-Cl	Paste
2-9	Cl	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
2-10	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub>	126.3-127.4
2-11	Cl	H	H	H	H	2,4-Me <sub>2</sub>	
2-12	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-F	108.3-109.4
2-13	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	99
2-14	Cl	H	H	H	H	4-Ph(4-OCH <sub>3</sub> )	184-185
2-15	Cl	H	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	99.7-101
2-16	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	98.1-99.2
2-17	Cl	H	H	Me	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
2-18	Cl	H	H	Et	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
2-19	Cl	H	H	Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	142-144
2-20	Cl	H	H	i-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	93-99
2-21	Cl	H	H	Bu	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	90-91
2-22	Cl	H	H	i-Bu	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
2-23	Cl	H	H	Me	Me	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
2-24	Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-25	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	88-109
2-26	Cl	Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	53-63
2-27	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	123.4-124
2-28	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	

[0080] [表2-2]

第2表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
2-29	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	
2-30	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
2-31	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	76-85
2-32	Cl	H	H	F	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-33	Cl	Me	H	F	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-34	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-35	CF <sub>3</sub>	Me	H	F	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-36	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
2-37	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	124
2-38	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	Paste
2-39	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	137.8-139.3
2-40	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	127-129
2-41	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
2-42	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
2-43	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
2-44	Cl	H	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
2-45	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
2-46	Cl	Me	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	107.6-111.9
2-47	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	
2-48	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	156.8-158.3
2-49	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	
2-50	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	
2-51	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	137.8-139.3
2-52	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	127-129.1
2-53	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	118.4-119.7
2-54	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
2-55	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
2-56	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
2-57	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
2-58	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	100.8-102.9
2-59	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
2-60	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
2-61	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
2-62	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	157.4-158.9

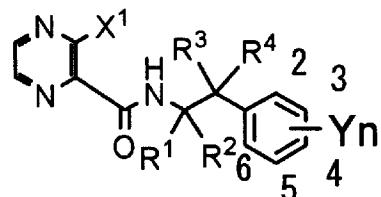
[0081] [表2-3]

第2表（続き）

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
2-63	Cl	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	104-109
2-64	Cl	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	138.4-138.5
2-65	Cl	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
2-66	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
2-67	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
2-68	Cl	Me	Me	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-69	Cl	Me	Me	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
2-70	Cl	Me	Me	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
2-71	Cl	Me	Me	H	H	3,4-F <sub>2</sub>	
2-72	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-73	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
2-74	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	
2-75	Cl	Et	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
2-76	Cl	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	116-117.6
2-77	Cl	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	127-129
2-78	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	131.8-132.8
2-79	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	128.4-129.5
2-80	Cl	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
2-81	Cl	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
2-82	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	104.5-105
2-83	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	140.8-141
2-84	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-F)	108.5-109.9
2-85	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-F)	Paste
2-86	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-OMe)	Paste
2-87	Cl	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	135.0
2-88	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	76.9-79.4
2-89	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SOMe	71.9-113.6
2-90	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	117.8-119.7
2-91	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	114.1-114.2
2-92	Cl	H	H	H	H	2-Br-4-F	Paste
2-93	Cl	Me	H	H	H	2-Br-4-F	123.4-127.1

[0082] [表3-1]

第3表



(I-3)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl	
3-2	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3-Cl	
3-3	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	4-Cl	
3-4	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub>	104-106
3-5	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	110.2-111.2
3-6	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-F	93.1-95.7
3-7	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	110.7-112.1
3-8	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-Me <sub>2</sub>	Paste
3-9	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	102-102.7
3-10	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	118-119
3-11	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	111-113
3-12	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	78-86
3-13	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3-14	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-OCHF <sub>2</sub> -4-Cl	
3-15	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	108-110
3-16	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	106.3-108.0
3-17	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF <sub>3</sub>	
3-18	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	149.2-150.0
3-19	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
3-20	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	
3-21	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3-22	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3-23	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,5-Me <sub>2</sub>	105.7-106.6
3-24	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3-25	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-5-CF <sub>3</sub>	131-133
3-26	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-F-5-CF <sub>3</sub>	
3-27	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub>	

[0083] [表3-2]

第3表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3-28	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,3-Cl <sub>2</sub>	
3-29	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub>	
3-30	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	114-115.2
3-31	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3,4-(OMe) <sub>2</sub>	
3-32	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	
3-33	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
3-34	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	
3-35	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3-36	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3,5-F <sub>2</sub>	
3-37	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub>	150-154
3-38	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3-39	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH <sub>2</sub> O-5	
3-40	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3-41	CF <sub>3</sub>	H	H	Et	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3-42	CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	91-95
3-43	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	163-164
3-43-R	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	184
3-43-S	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	183
3-44	CF <sub>3</sub>	Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
3-45	CF <sub>3</sub>	Me	H	F	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3-46	CF <sub>3</sub>	Me	H	F	F	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3-47	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF <sub>3</sub> )	
3-48	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	149-150
3-49	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	124-125
3-50	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	126-127
3-51	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-F-4-Cl	132-133
3-52	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Paste
3-53	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	68.3-71.9
3-54	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	128.8-129.9
3-55	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3-56	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3-57	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
3-58	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	127.9-130.4

[0084] [表3-3]

第3表（続き）

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3-59	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	103-105.9
3-60	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	177-178
3-61	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	109.2-110
3-62	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	134-135.6
3-63	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	159-162.4
3-64	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	137.4-140.7
3-65	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	177.2-178.3
3-66	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3-67	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	136.6-137.5
3-68	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
3-69	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3-70	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3-71	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3-72	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	127-128.7
3-73	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
3-74	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
3-75	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	125.1-127.9
3-76	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	195.6-196.5
3-77	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	129
3-78	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	164.2
3-79	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
3-80	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
3-81	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-F-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
3-82	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	82-85
3-83	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
3-84	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
3-85	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	3,4-F <sub>2</sub>	
3-86	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	125-128
3-87	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3-88	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	
3-89	CF <sub>3</sub>	Et	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	169-175
3-90	CF <sub>3</sub>	Et	H	H	H	2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3-91	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	110.3-112.9

[0085] [表3-4]

第3表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3-92	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	145-147
3-93	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	132.2-132.7
3-94	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	161.4-162.5
3-95	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
3-96	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	Paste
3-97	CF <sub>3</sub>	H	H	O		2,4-Cl <sub>2</sub>	
3-98	CF <sub>3</sub>	Me	H	O		2,4-Cl <sub>2</sub>	
3-99	CF <sub>3</sub>	Me	Me	O		2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
3-100	CF <sub>3</sub>	Me	Me	O		3,4-Cl <sub>2</sub>	133.9-135.2
3-101	CF <sub>3</sub>	Me	Me	O		2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3-102	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	123.3-125.5
3-103	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	175.9-176
3-104	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-F)	128.1-133.5
3-105	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-F)	113.7-117
3-106	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-OMe)	100.7-103
3-107	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Br <sub>2</sub>	
3-108	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-F	
3-109	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-CF <sub>3</sub>	
3-110	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-OCF <sub>3</sub>	
3-111	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-OCHF <sub>2</sub>	
3-112	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl-5-F	
3-113	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Br <sub>2</sub> -5-F	
3-114	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-SCF <sub>3</sub>	
3-115	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-SOCF <sub>3</sub>	
3-116	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
3-117	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	
3-118	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	154
3-119	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-SOMe	101.4-103.4
3-120	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	142.4
3-121	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Br-4-F	112.0
3-122	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Br-4-F	140.6-141.8
3-123	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	153.1-154.0
3-124	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH(Me) <sub>2</sub>	122.5

[0086] [表3-5]

第3表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3'-1	Cl	H	H	H	H	2-Cl	
3'-2	Cl	H	H	H	H	3-Cl	
3'-3	Cl	H	H	H	H	4-Cl	
3'-4	Cl	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub>	98-100
3'-5	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	99-100
3'-6	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-F	77-79
3'-7	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	96.5-97.4
3'-8	Cl	H	H	H	H	2,4-Me <sub>2</sub>	
3'-9	Cl	H	H	H	H	2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3'-10	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3'-11	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	107-108
3'-12	Cl	H	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
3'-13	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3'-14	Cl	H	H	H	H	2-OCHF <sub>2</sub> -4-Cl	
3'-15	Cl	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	70.4-71.3
3'-16	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	
3'-17	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF <sub>3</sub>	
3'-18	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	
3'-19	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
3'-20	Cl	H	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	
3'-21	Cl	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3'-22	Cl	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3'-23	Cl	H	H	H	H	2,5-Me <sub>2</sub>	
3'-24	Cl	H	H	H	H	2,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3'-25	Cl	H	H	H	H	2-Cl-5-CF <sub>3</sub>	104-105
3'-26	Cl	H	H	H	H	2-F-5-CF <sub>3</sub>	
3'-27	Cl	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub>	
3'-28	Cl	H	H	H	H	2,3-Cl <sub>2</sub>	
3'-29	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub>	
3'-30	Cl	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	100-102
3'-31	Cl	H	H	H	H	3,4-(OMe) <sub>2</sub>	83-85
3'-32	Cl	H	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	
3'-33	Cl	H	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
3'-34	Cl	H	H	H	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	

[0087] [表3-6]

第3表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3'-35	Cl	H	H	H	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3'-36	Cl	H	H	H	H	3,5-F <sub>2</sub>	
3'-37	Cl	H	H	H	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub>	
3'-38	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3'-39	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH <sub>2</sub> O-5	85-87
3'-40	Cl	H	H	Me	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-41	Cl	H	H	Me	Me	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
3'-42	Cl	H	H	Et	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
3'-43	Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
3'-44	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	168
3'-45	Cl	Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
3'-46	Cl	Me	H	F	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-47	Cl	Me	H	F	F	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-48	Cl	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF <sub>3</sub> )	
3'-49	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	132-133
3'-50	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	136-137
3'-51	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
3'-52	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Paste
3'-53	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	
3'-54	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3'-55	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3'-56	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3'-57	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
3'-58	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3'-59	Cl	H	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
3'-60	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3'-61	Cl	Me	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	149-150
3'-62	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	143.2-145.8
3'-63	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	
3'-64	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	
3'-65	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	183.7-184.6
3'-66	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3'-67	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	
3'-68	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	

[0088] [表3-7]

第3表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3'-69	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3'-70	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3'-71	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3'-72	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3'-73	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
3'-74	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
3'-75	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
3'-76	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3'-77	Cl	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-78	Cl	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	
3'-79	Cl	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
3'-80	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
3'-81	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
3'-82	Cl	Me	Me	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-83	Cl	Me	Me	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-84	Cl	Me	Me	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
3'-85	Cl	Me	Me	H	H	3,4-F <sub>2</sub>	
3'-86	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-87	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3'-88	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	
3'-89	Cl	Et	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3'-90	Cl	Et	H	H	H	2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3'-91	Cl	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
3'-92	Cl	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
3'-93	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	
3'-94	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	
3'-95	Cl	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
3'-96	Cl	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
3"-1	Me	H	H	H	H	2-Cl	
3"-2	Me	H	H	H	H	3-Cl	
3"-3	Me	H	H	H	H	4-Cl	
3"-4	Me	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub>	
3"-5	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	83-91
3"-6	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-F	

[0089] [表3-8]

第3表 (続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3"-7	Me	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	
3"-8	Me	H	H	H	H	2,4-Me <sub>2</sub>	Paste
3"-9	Me	H	H	H	H	2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3"-10	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3"-11	Me	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	
3"-12	Me	H	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
3"-13	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3"-14	Me	H	H	H	H	2-OCHF <sub>2</sub> -4-Cl	
3"-15	Me	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	
3"-16	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	
3"-17	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF <sub>3</sub>	
3"-18	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	
3"-19	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
3"-20	Me	H	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	
3"-21	Me	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3"-22	Me	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3"-23	Me	H	H	H	H	2,5-Me <sub>2</sub>	
3"-24	Me	H	H	H	H	2,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3"-25	Me	H	H	H	H	2-Cl-5-CF <sub>3</sub>	
3"-26	Me	H	H	H	H	2-F-5-CF <sub>3</sub>	
3"-27	Me	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub>	
3"-28	Me	H	H	H	H	2,3-Cl <sub>2</sub>	
3"-29	Me	H	H	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub>	
3"-30	Me	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	85.4-86.1
3"-31	Me	H	H	H	H	3,4-(OMe) <sub>2</sub>	
3"-32	Me	H	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	
3"-33	Me	H	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
3"-34	Me	H	H	H	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	
3"-35	Me	H	H	H	H	3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3"-36	Me	H	H	H	H	3,5-F <sub>2</sub>	
3"-37	Me	H	H	H	H	2,3,4-Cl <sub>3</sub>	
3"-38	Me	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3"-39	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH <sub>2</sub> O-5	
3"-40	Me	H	H	Me	Me	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste

[0090] [表3-9]

第3表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3"-41	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-42	Me	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
3"-43	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-44	Me	Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-45	Me	Me	H	F	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-46	Me	Me	H	F	F	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-47	Me	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF <sub>3</sub> )	123-124
3"-48	Me	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	122-123
3"-49	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	
3"-50	Me	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF <sub>3</sub> )	85-86
3"-51	Me	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
3"-52	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3"-53	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	
3"-54	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3"-55	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3"-56	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3"-57	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
3"-58	Me	H	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3"-59	Me	H	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
3"-60	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3"-61	Me	Me	H	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
3"-62	Me	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	
3"-63	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	
3"-64	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	
3"-65	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3"-66	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3"-67	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	
3"-68	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
3"-69	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3"-70	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3"-71	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3"-72	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3"-73	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF <sub>3</sub> )	
3"-74	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	

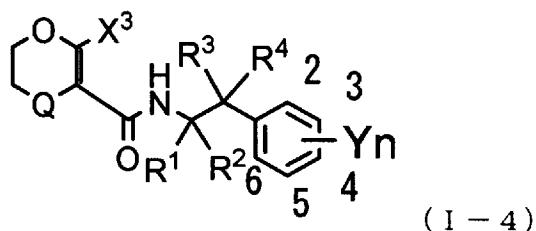
[0091] [表3-10]

第3表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
3"-75	Me	Me	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
3"-76	Me	Me	H	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub>	
3"-77	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-78	Me	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> O-4	
3"-79	Me	Me	H	H	H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	
3"-80	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
3"-81	Me	Me	H	H	H	2-F-4-OCF <sub>2</sub> O-5	
3"-82	Me	Me	Me	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-83	Me	Me	Me	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-84	Me	Me	Me	H	H	2,4-F <sub>2</sub>	
3"-85	Me	Me	Me	H	H	3,4-F <sub>2</sub>	
3"-86	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-87	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3"-88	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	
3"-89	Me	Et	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
3"-90	Me	Et	H	H	H	2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
3"-91	Me	H	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
3"-92	Me	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
3"-93	Me	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	
3"-94	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	
3"-95	Me	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
3"-96	Me	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	
3""-1	Br	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	125.2-126.1
3""-2	Br	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	176.7-178
3""-3	Br	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	
3""-4	Br	Me	H	H	H	2,4,5-F <sub>3</sub>	
3""-5	Br	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
3"""-1	I	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	160.9-161.8
3"""-2	I	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
3"""-3	I	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
3"""-4	I	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	

[0092] [表4]

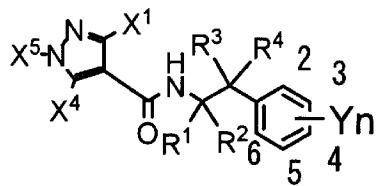
第4表



化合物番号	Q	X <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
4-1	S	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	139
4-2	S	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	104
4-3	S	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
4-4	S	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
4-5	S	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
4-6	S	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
4-7	S	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
4-8	S	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	

[0093] [表5]

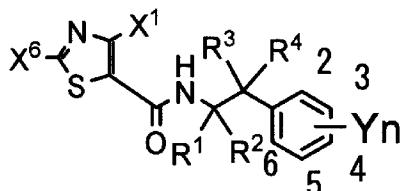
第5表



化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
5-1	Me	H	Me	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	131-135
5-2	Me	H	Me	H	H	H	H	3-CH=CH-CH=CH-4	103-106
5-3	Me	H	Me	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub>	Paste
5-4	Me	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	110-115
5-5	Me	H	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
5-6	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	102-103
5-7	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	83-120
5-8	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	129
5-9	Me	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	145-150
5-10	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
5-11	I	Me	Et	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	143-144
5-12	I	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	140-141
5-13	Br	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	129-130
5-14	Cl	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	112
5-15	I	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	120-154
5-16	Br	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	145-147
5-17	Cl	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	155-157
5-18	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	H	2-F-4-Cl	1.5062(26°C)
5-19	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	77
5-20	Me	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	169-170
5-21	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	163
5-22	Me	H	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	129-134
5-23	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	133-134
5-24	I	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	152-188
5-25	Br	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	163-166
5-26	Cl	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	141-142
5-27	CHF <sub>2</sub>	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
5-28	CHF <sub>2</sub>	H	Me	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
5-29	CHF <sub>2</sub>	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
5-30	CHF <sub>2</sub>	H	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	

[0094] [表6-1]

第6表



(I-6)

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>6</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
6-1	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	95-97
6-2	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	136
6-3	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Me <sub>2</sub>	Paste
6-4	Me	Me	H	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-5	Me	Me	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	Paste
6-6	Me	Me	H	H	H	H	3-CH=CH-CH=CH-4	97-99
6-7	Me	Me	H	H	H	H	2-i-Pr-4-Cl	Paste
6-8	Me	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
6-9	Me	Me	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub>	89-90
6-10	Me	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
6-11	Me	Me	H	H	H	H	2-F-4-CF <sub>3</sub>	115-116
6-12	Me	Me	H	H	Me	H	4-Cl	89
6-13	Me	Me	H	H	Me	Me	4-Cl	81
6-14	Me	Me	H	H	Et	H	4-Cl	Paste
6-15	Me	Me	H	H	Et	Me	4-Cl	Paste
6-16	Me	Me	H	H	Et	Et	4-Cl	Paste
6-17	Me	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-18	Me	Me	H	H	n-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-19	Me	Me	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-20	Me	Me	H	H	i-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-21	Me	Me	H	H	i-Bu	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-22	Me	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	154
6-23	Me	Me	Me	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-24	Me	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Paste
6-25	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	114-115
6-26	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	142-144
6-27	Me	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	143
6-28	CF <sub>3</sub>	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	142-143
6-29	CHF <sub>2</sub>	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	

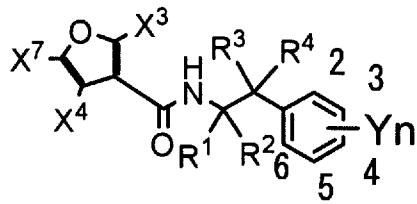
[0095] [表6-2]

第6表(続き)

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>6</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
6-30	CHF <sub>2</sub>	Me	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
6-31	CHF <sub>2</sub>	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
6-32	CHF <sub>2</sub>	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	

[0096] [表7]

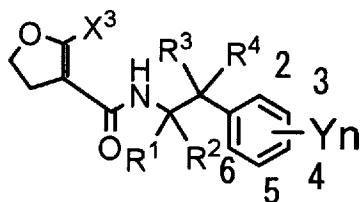
第7表



化合物番号	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>7</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
7-1	Me	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	106-107°C
7-2	Me	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
7-3	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
7-4	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
7-5	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
7-6	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
7-7	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
7-8	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	

[0097] [表8]

第8表

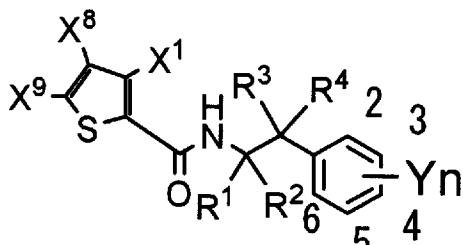


(I-8)

化合物番号	X <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
8-1	Me	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
8-2	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
8-3	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
8-4	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
8-5	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
8-6	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
8-7	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
8-8	CF <sub>3</sub>	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	

[0098] [表9]

第9表

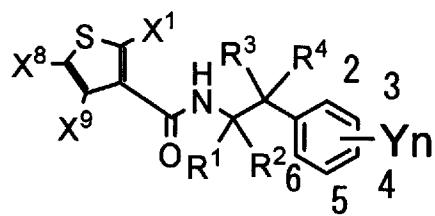


(I-9)

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
9-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	67-70°C
9-2	I	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	81-87°C
9-3	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
9-4	Me	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
9-5	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	
9-6	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	
9-7	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -5-F	
9-8	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F <sub>2</sub>	

[0099] [表10]

第10表

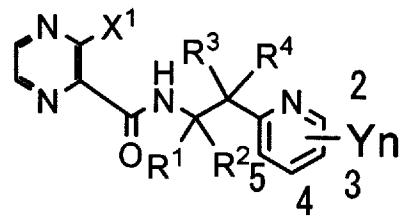


(I-10)

化合物番号	X <sup>1</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
10-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
10-2	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
10-3	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	

[0100] [表11]

第11表



(I-11)

化合物番号	X <sup>1</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Yn	物性
11-1	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3-CF <sub>3</sub> -5-Cl	130-131°C
11-2	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3-Cl-5-F	
11-3	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	

[0101] [表12-1]

第12表

化合物番号	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
1-6	7.65(dd, 1H), 7.51(m, 2H), 7.32(dd, 1H), 7.30(d, 2H), 7.14(d, 2H), 5.58(br, 1H), 3.92(m, 1H), 3.38(m, 1H), 2.80(m, 1H), 1.79(m, 1H), 1.60(m, 1H), 0.83(t, 3H)
1-7	7.65(d, 1H), 7.51(m, 2H), 7.25–7.36(m, 5H), 5.40(br, 1H), 3.77(dd, 1H), 3.59(dd, 1H), 1.80(m, 1H), 1.66(m, 1H), 1.37(s, 3H), 0.74(t, 3H)
1-8	7.65(dd, 1H), 7.51(m, 2H), 7.26–7.37(m, 5H), 5.31(br, 1H), 3.74(d, 2H), 1.75(m, 4H), 0.79(t, 6H)
1-9	7.65(dd, 1H), 7.51(m, 2H), 7.32(dd, 1H), 7.29(d, 2H), 7.15(d, 2H), 5.56(br, 1H), 3.87(m, 1H), 3.33(m, 1H), 2.98(m, 1H), 1.53(m, 2H), 1.40(m, 1H), 0.87(t, 6H)
1-13	7.81(dd, 1H), 7.27–7.34(m, 5H), 7.22(dd, 1H), 7.05(dt, 1H), 5.43(br, 1H), 3.76(dd, 1H), 3.61(dd, 1H), 1.83(m, 1H), 1.68(m, 1H), 1.41(s, 3H), 0.75(t, 3H)
1-14	7.81(dd, 1H), 7.30–7.35(m, 5H), 7.22(dd, 1H), 7.06(dt, 1H), 5.34(br, 1H), 3.75(d, 2H), 1.78(m, 4H), 0.81(t, 6H)
1-53	7.70(d, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53(t, 1H), 7.46(d, 1H), 7.40(s, 1H), 7.39(d, 1H), 7.30(d, 1H), 5.86(br, 1H), 3.71(dd, 2H), 3.00(t, 2H), 2.44(s, 3H)
1-56	7.70(d, 1H), 7.51–7.60(m, 2H), 7.47(d, 1H), 7.30(d, 1H), 7.19(d, 1H), 7.01(dd, 1H), 6.49(t, 1H), 5.84(br, 1H), 3.72(q, 2H), 3.07(t, 2H)
1-59	7.69(d, 1H), 7.47–7.60(m, 3H), 7.36(t, 2H), 7.24(d, 1H), 7.15(t, 1H), 7.00–7.03(m, 3H), 6.88(dd, 1H), 5.85(br, 1H), 3.73(q, 2H), 3.05(t, 2H)
2-5	8.41(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.31(m, 3H), 7.20(d, 1H), 6.39(br, 1H), 3.79(m, 1H), 3.50(m, 1H), 3.11(m, 1H), 1.35(d, 3H)
2-6	8.41(dd, 1H), 8.01(dd, 1H), 7.27–7.36(m, 5H), 6.23(br, 1H), 3.69(d, 2H), 1.43(s, 6H)
2-7	8.40(dd, 1H), 7.99(dd, 1H), 7.26–7.33(m, 3H), 7.17(d, 1H), 6.32(br, 1H), 3.91(m, 1H), 3.45(m, 1H), 2.83(m, 1H), 1.80(m, 1H), 1.62(m, 1H), 0.85(t, 3H)

[0102] [表12-2]

第12表(続き)

化合物番号	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
2-8	8.41(dd, 1H), 8.03(dd, 1H), 7.27–7.34(m, 4H), 6.18(br, 1H), 3.79(dd, 2H), 3.62(dd, 2H), 1.85(m, 1H), 1.68(m, 1H), 1.41(s, 3H), 0.75(t, 3H)
2-9	8.41(dd, 1H), 8.05(dd, 1H), 7.29–7.35(m, 4H), 6.13(br, 1H), 3.77(d, 2H), 1.79(m, 4H), 0.80(t, 6H)
2-17	8.42(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.39(dd, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.27(m, 2H), 6.43(br, 1H), 3.77(m, 1H), 3.65(m, 2H), 1.34(d, 3H)
2-18	8.41(dd, 1H), 7.99(dd, 1H), 7.40(d, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.25(m, 2H), 6.36(br, 1H), 3.86(m, 1H), 3.60(m, 1H), 3.51(m, 1H), 3.84(m, 1H), 1.67(m, 1H), 0.88(t, 3H)
2-22	8.42(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.39(dd, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.27(m, 2H), 6.36(br, 1H), 3.83(m, 1H), 3.68(m, 1H), 3.51(m, 1H), 1.64(m, 1H), 1.57(m, 1H), 1.44(m, 1H), 0.90(dd, 6H)
2-23	8.36(dd, 1H), 7.98(dd, 1H), 7.37(m, 2H), 7.28(dd, 2H), 7.22(dd, 2H), 6.26(br, 1H), 4.06(d, 2H), 1.57(s, 6H)
2-38	8.46(dd, 1H), 8.08(dd, 1H), 7.34(dd, 1H), 7.30(d, 1H), 7.20(d, 1H), 7.02(dd, 1H), 6.55(br, 1H), 6.49(t, 1H), 3.77(q, 2H), 3.10(t, 2H)
2-85	8.45(dd, 1H), 8.00(dd, 1H), 7.33(dd, 1H), 7.30(t, 1H), 7.29(d, 1H), 7.05(d, 1H), 6.90(dd, 1H), 6.83(m, 1H), 6.78(dd, 1H), 6.69–6.72(m, 1H), 6.36(d, 1H), 4.50–4.61(m, 1H), 3.07(dd, 1H), 2.99(dd, 1H), 1.35(d, 3H)
2-86	8.44(dd, 1H), 7.99(dd, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.24(t, 2H), 7.03(d, 1H), 6.88(dd, 1H), 6.75(d, 1H), 6.58(d, 1H), 6.57(s, 1H), 6.35(d, 1H), 4.48–4.59(m, 1H), 3.79(s, 3H), 3.06(dd, 1H), 2.97(dd, 1H), 1.34(d, 3H)
2-92	8.46(dd, 1H), 8.09(dd, 1H), 7.27–7.36(m, 3H), 7.00(ddd, 1H), 6.56(br, 1H) 3.76(q, 2H), 3.10(t, 2H)
3-8	8.8(d, 1H), 8.7(d, 1H), 7.45(br, 1H), 6.9–7.1(m, 3H), 3.7(q, 2H), 2.9(t, 2H), 2.33(s, 3H), 2.30(s, 3H)
3-44	8.80(d, 1H), 8.72(d, 1H), 7.37(d, 1H), 7.32(d, 1H), 7.20(dd, 1H), 4.10(m, 1H), 1.28(m, 1H), 1.24(d, 3H), 1.02(m, 1H), 0.90(m, 1H)

[0103] [表12-3]

第12表 (続き)

化合物番号	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
3-52	8.82(d, 1H), 8.71(d, 1H), 7.50(br, 1H), 7.40(s, 1H), 7.38(d, 1H), 7.30(d, 1H), 3.75(dd, 2H), 3.02(t, 2H), 2.44(s, 3H)
3'-41	8.49(d, 1H), 8.39(d, 1H), 7.42(d, 1H), 7.34(d, 1H), 7.24(br, 1H), 7.21(dd, 1H), 4.02(d, 2H), 1.54(s, 6H)
3'-42	8.50(d, 1H), 8.42(d, 1H), 7.47(br, 1H), 7.39(d, 1H), 7.22-7.28(m, 2H), 3.80(m, 1H), 3.58(m, 1H), 3.49(m, 1H), 1.83(m, 1H), 1.68(m, 1H), 0.87(t, 3H)
3'-43	8.52(d, 1H), 8.45(d, 1H), 7.61(br, 1H), 7.38(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.16(dd, 1H), 3.65(d, 2H), 1.11(dd, 2H), 0.91(dd, 2H)
3'-45	8.53(d, 1H), 8.47(d, 1H), 7.56(br, 1H), 7.37(d, 1H), 7.32(d, 1H), 7.19(dd, 1H), 4.11(m, 1H), 1.28(m, 1H), 1.23(d, 3H), 0.92(m, 1H), 0.87(m, 1H)
3'-52	8.54(d, 1H), 8.46(d, 1H), 7.73(br, 1H), 7.40(s, 1H), 7.38(d, 1H), 7.30(d, 1H), 3.71(dd, 2H), 3.01(t, 2H), 2.45(s, 3H)
3"-8	8.6(d, 1H), 8.3(d, 1H), 8.0(br, 1H), 7.1(d, 1H), 7.0(d, 1H), 6.97(dd, 1H), 3.6(q, 2H), 3.0(s, 3H), 2.9(t, 2H), 2.34(s, 3H)
3"-40	8.55(d, 1H), 8.27(d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.42(d, 1H), 7.34(d, 1H), 7.20(dd, 1H), 3.99(d, 2H), 2.96(s, 3H), 1.54(s, 6H)
3"-42	8.58(d, 1H), 8.33(d, 1H), 7.97(br, 1H), 7.38(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.16(dd, 1H), 3.63(d, 2H), 2.94(s, 3H), 1.09(dd, 2H), 0.89(dd, 2H)
5-3	7.62(s, 1H), 7.4-7.5(m, 4H), 5.55(br, 1H), 3.82(s, 3H), 3.7(q, 2H), 2.98(t, 2H), 2.35(s, 3H)
5-5	7.57(s, 1H), 7.39(d, 1H), 7.20-7.29(m, 2H), 5.60(br, 1H), 3.78(s, 3H), 3.78(m, 1H), 3.45(m, 2H), 2.29(s, 3H), 1.79(m, 2H), 1.63(m, 1H), 0.85(t, 3H)
6-3	6.9-7.0(m, 3H), 5.7 (br, 1H), 3.6(q, 2H), 2.9(t, 2H), 2.7(s, 3H), 2.6(s, 3H), 2.32(s, 3H), 2.30(s, 3H)

[0104] [表12-4]

第12表(続き)

化合物番号	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
6-4	7.39(d, 1H), 7.32(d, 1H), 7.07(dd, 1H), 5.65(br, 1H), 3.63(q, 2H), 2.88(t, 2H), 2.66(s, 3H), 2.60(s, 3H)
6-5	7.18(d, 1H), 7.13(dd, 1H), 7.07(d, 1H), 5.96(br, 1H), 3.59(q, 2H), 2.89(t, 2H), 2.67(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.34(s, 3H)
6-7	7.06(d, 1H), 6.88(dd, 1H), 6.87(d, 1H), 5.8(br, 1H), 4.55(m, 1H), 3.60(q, 2H), 2.86(t, 2H), 2.65(s, 3H), 2.57(s, 3H), 1.59(s, 6H)
6-14	7.32(d, 2H), 7.14(d, 2H), 5.48(br, 1H), 3.86(m, 1H), 3.30(m, 1H), 2.77(m, 1H), 2.63(s, 3H), 2.47(s, 1H), 1.77(m, 1H), 1.60(m, 1H), 0.84(t, 3H)
6-15	7.35(d, 2H), 7.27(d, 2H), 5.30(br, 1H), 3.69(dd, 1H), 3.49(dd, 1H), 2.62(s, 3H), 2.44(s, 3H), 1.82(m, 1H), 1.64(m, 1H), 1.34(s, 3H), 0.74(t, 3H)
6-16	7.35(d, 2H), 7.29(d, 2H), 5.22(br, 1H), 3.64(d, 2H), 2.62(s, 3H), 2.42(s, 3H), 1.74(q, 4H), 0.79(t, 6H)
6-17	7.41(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.21(d, 1H), 5.54(br, 1H), 3.77(m, 1H), 3.47(m, 2H), 2.64(s, 3H), 2.50(s, 3H), 1.79(m, 1H), 1.65(m, 1H), 0.86(t, 3H)
6-18	7.40(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.22(d, 1H), 5.52(br, 1H), 3.76(m, 1H), 3.54(m, 1H), 3.45(m, 1H), 2.64(s, 3H), 2.50(s, 3H), 1.65(m, 2H), 1.25(m, 2H), 0.88(t, 3H)
6-19	7.39(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.20(dd, 1H), 5.76(br, 1H), 3.57(d, 2H), 2.65(s, 3H), 2.56(s, 3H), 1.07(dd, 2H), 0.90(dd, 2H),
6-20	7.42(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.21(d, 1H), 5.39(br, 1H), 3.96(m, 1H), 3.48(m, 1H), 3.27(m, 1H), 2.62(s, 3H), 2.44(s, 3H), 1.94(m, 1H), 1.11(d, 3H), 0.79(d, 3H)
6-21	7.40(d, 1H), 7.27(dd, 1H), 7.22(d, 1H), 5.53(br, 1H), 3.74(m, 1H), 3.62(m, 1H), 3.40(m, 1H), 2.64(s, 3H), 2.51(s, 3H), 1.61(m, 1H), 1.51(m, 1H), 1.41(m, 1H), 0.88(dd, 6H)
6-23	7.40(d, 1H), 7.30(d, 1H), 7.22(dd, 1H), 5.69(br, 1H), 4.00(m, 1H), 2.67(s, 3H), 2.61(s, 3H), 1.24(m, 1H), 1.19(d, 3H), 0.88-0.99(m, 3H)
6-24	7.41(d, 1H), 7.22(dd, 1H), 7.18(d, 1H), 5.78(br, 1H), 3.66(q, 2H), 3.04(t, 2H), 2.56(s, 3H)

[0105] 本発明の一般式(I)で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する有害生物防除剤は、特に水稻、果樹、野菜、その他作物及び花卉の植物病害防除や、線虫などの土壌有害生物防除に適している。

本発明の植物病害防除剤の使用対象は糸状菌類病害、細菌類病害、ウイルス病害であり、例えば、不完全菌類による病害(例えば、ボトリチス(Botrytis)属病害、ヘルミントスボリウム(Helminthosporium)属病害、フザリウム(Fusarium)属病害、セプトリア(Septoria)属病害、サルコスボラ(Cercospora)属病害、シュードサルコスボレラ(Pseudocercosporaella)属病害、リンコスボリウム(Rhynchosporium)属病害、ピリキュラリア(Pyricularia)属病害、アルタナリア(Alternaria)属病害等)、担子菌類(例えばヘミレリア(Hemilelia)属病害、リゾクトニア(Rhizoctonia)属病害

、ウスティラゴ(*Ustilago*)属病害、ティフラ(*Typhula*)属病害、プッキニア(*Puccinia*)属病害等)、子のう菌類による病害(例えば、ベンチュリア(*Venturia*)属病害、ポドスフェラ(*Podosphaera*)属病害、レプトスファエリア(*Leptosphaeria*)属病害、ブルメリア(*Blumeria*)属病害、エリシphe(*Erysiphe*)属病害、ミクロドキュウム(*Microdochium*)属病害、スクレロチニア(*Sclerotinia*)属病害、ゲウマノマイセス(*Gaeumanomyces*)属病害、モニリニア(*Monilinia*)属病害、ウンシヌラ(*Unsinula*)属病害等)、その他の菌類(例えば、アスコクイタ(*Ascochyta*)属病害、フォマ(*Phoma*)属病害、ピシウム(*Pythium*)属病害、コルテイシウム(*Corticium*)属病害、ピレノフォラ(*Pyrenophora*)属病害等)、細菌類による病害である、例えば、シュードモナス(*Pseudomonas*)属病害、ザントモナス(*Xanthomonas*)属病害、エルウィニア(*Erwinia*)属病害等、あるいは、ウイルス類(例えば、タバコモザイクウイルス等)による病害等の防除に適している。

- [0106] 具体的病害としては、例えば、イネいもち病(*Pyricularia oryzae*)、イネ紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、イネごま葉枯病(*Cochiobolus miyabeanus*)、イネ苗立ち枯れ病(*Rhizopus chinensis*, *Pythium graminicola*, *Fusarium graminecola*, *Fusarium roseum*, *Mucor* sp., *Phoma* sp., *Trichoderma* sp.)、イネ馬鹿苗病(*Gibberella fujikuroi*)、オオムギ及びコムギ等のうどんこ病(*B lumeria graminis*)、又はキュウリ等のうどんこ病(*Sphaerotheca fuliginea*)、ナス等のうどんこ病(*Erysiphe cichoracearum*)及び他の宿主植物のうどんこ病、オオムギ及びコムギ等の眼紋病(*Pseudocercosporella herpotrichoides*)、コムギ等の黒穂病(*Urocystis tritici*)、オオムギ及びコムギ等の雪腐病(*Microdochium nivalis*, *Pythium iwayamai*, *Typhla ishikariensis*, *Typhla incarnata*, *Sclerotinia borealis*)、オオムギ及びコムギ等の赤かび病(*Fusarium graminearum*, *Fusarium avenaceum*, *Fusarium culmorum*, *Microdochium nivalis*)、オオムギ及びコムギ等のさび病(*Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia graminis*)、オオムギ及びコムギ等の立枯病(*Gaeumannomyces graminis*)、エンバクの冠さび病(*Puccinia coronata*)、及び他の植物のさび病、キュウリ、イチゴ等の灰色かび病(*Botrytis cinerea*)、トマト、キャベツ

等の菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、ジャガイモ、トマト等の疫病(*Phytophtora infestans*)及び他の植物の疫病、キュウリベと病(*Pseudoperonospora cubensis*)、ブドウベと病(*Plasmopara viticola*)等の種々の植物のべと病、リンゴ黒星病(*Venturia inaequalis*)、リンゴ斑点落葉病(*Alternaria mali*)、ナシ黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、カンキツ黒点病(*Diaporthe citri*)、カンキツそうか病(*Elsinoe fawcetti*)、テンサイ褐斑病(*Cercospora beticola*)、ラッカセイ褐斑病(*Cercospora arachidicola*)、ラッカセイ黒瀆病(*Cercospora personata*)、コムギ葉枯れ病(*Septoria tritici*)、コムギふ枯れ病(*Leptosphaeria nodorum*)、オオムギ網斑病(*Pyrenophora teres*)、オオムギ斑葉病(*Pyrenophora graminea*)、オオムギ雲形病(*Rhynchosporium secalis*)、コムギ裸黒穂病(*Ustilago nuda*)、コムギなまぐさ黒穂病(*Tilletia caries*)、シバの葉腐病(*Rhizoctonia solani*)、シバのダラースポット病(*Sclerotinia homoeocarpa*)、*Psuedomonas*属による、例えばキュウリ斑点細菌病(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)、トマト青枯病(*Pseudomonas solanacearum*)及びイネ糊枯細菌病(*Pseudomonas glumae*)、*Xanthomonas*属による、例えばキャベツ黒腐病(*Xanthomonas campestris*)、イネ白葉枯病(*Xanthomonas oryzae*)及びカンキツかいよう病(*Xanthomonas citri*)、*Erwinia*属による、例えばキャベツ軟腐病(*Erwinia carotovora*)等の細菌病、タバコモザイク病(*Tobacco mosaic virus*)等のウイルス病等が挙げられる。

[0107] また、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ(*Globodera rostchiensis*)、ネコブセンチュウ(*Meloidogyne sp.*)、サツマイモネコブセンチュウ(*Meloidogyne incognita*)、ミカンネセンチュウ(*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ(*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ(*Aphelenchoides ritzemabosi*)等の線虫類の防除に適している。

[0108] 本発明の有害生物防除剤を使用できる植物は特に限定されるものではないが、例えば、穀類(例えば、イネ、オオムギ、コムギ、ライムギ、オートムギ、トウモロコシ、高粱等)、豆類(大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、落花生等)、果樹・果実類(リンゴ、柑橘類、梨、ブドウ、桃、梅、桜桃、クルミ、アーモンド、バナナ、イチゴ等)、野菜類(キャ

ベツ、トマト、ほうれん草、ブロッコリー、レタス、タマネギ、ネギ、ピーマン等)、根菜類(ニンジン、馬鈴薯、サツマイモ、大根、蓮根、かぶ等)、加工用作物類(綿、麻、コウゾ、ミツマタ、菜種、ビート、ホップ、サトウキビ、テンサイ、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等)、瓜類(カボチャ、キュウリ、スイカ、メロン等)、牧草類(オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等)、芝類(高麗芝、ベントグラス等)、香料等用作物類(ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、しょうが等)、花卉類(キク、バラ、蘭等)等の植物が挙げられる。

[0109] また、近年、遺伝子組み換え作物(除草剤耐性作物、殺虫性タンパク産生遺伝子を組み込んだ害虫耐性作物、病害に対する抵抗性誘導物質産生遺伝子を組み込んだ病害耐性作物、食味向上作物、保存性向上作物、収量向上作物等)、昆虫性フェロモン(ハマキガ類、ヨトウガ類の交信攪乱剤等)、天敵昆虫等を用いたIPM(総合的害虫管理)技術が進歩しており、本発明の有害生物防除剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることができる。

[0110] 本発明化合物を有害生物防除剤の有効成分として用いる場合、他の成分を加えずそのまま用いても良いが、通常は農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I)で表されるN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用される。

[0111] 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えば、ダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、纖維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類(例えば、タルク、ピロフィライト等)、シリカ類{例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン(含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。)}、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻

土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、磷安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

- [0112] 液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうこととなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば、水、アルコール類(例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等)、ケトン類(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサン等)、エーテル類(例えば、エチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等)、脂肪族炭化水素類(例えば、ケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えば、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば、酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えば、ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えば、アセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げができる。

- [0113] 他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないこともできる。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えば、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を挙げができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えば、カゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

- [0114] 固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えば、ワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えば、シリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

防腐剤としては、1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン、パラクロロメタキシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等も添加することができる。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT(ジブチルヒドロキシトルエン)等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることもできる。

- [0115] 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、有害生物防除剤100重量部中、0. 01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、乳剤、水和剤、粉剤又は粒剤とする場合は0. 01～50重量%が適當である。

本発明の有害生物防除剤は各種有害生物を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で使用すれば良い。本発明の有害生物防除剤の使用量は種々の因子、例えば、目的、対象有害生物、作物の生育状況、有害生物の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0. 001g～10kg、好ましくは0. 01g～1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

- [0116] 本発明の方法に用いる有害生物防除剤は、各種有害生物を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で有害生物防除に有効な量を当該有害生物の発生が予測される対象植物の種子又は播種するための栽培担体等に通常の方法を適用して使用すれば良く、稲育苗箱施用、種子粉衣等の施用方法、種子消毒法、植穴処理、株元処理、作条処理、土壤混和等の施用方法で使用す

ることができ、果樹、穀類、野菜等の畑作において発生する病害に対しては粉衣や浸漬等の種子処理、苗根の浸漬処理、播種時等の作条、育苗用の栽培容器や植え穴、株元等の育苗担体等への灌注、表面散布、混和処理等の後灌水等して植物に吸収させて使用することにより実施できる。水耕栽培における水耕液に処理しても良い。

- [0117] 種子処理の方法としては、通常の方法に従って、例えば、液状製剤を希釀又は希釀せず、または固体状製剤を希釀して液体状態にて種子を浸漬して薬剤を浸透させる方法、固形製剤又は液状製剤を種子と混和、粉衣処理等して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の高い担体と混和して種子に単層又は多層にコーティングする方法、植え付けと同時に種子の近辺に散布する方法等をあげることができる。

当該種子処理を行う「種子」とは、広義には本発明における「繁殖用植物体」と同義であり、いわゆる種子の他、球根、塊茎、種いも、鱗茎、あるいは挿し木栽培用の茎等の栄養繁殖用の植物体を含むものである。

本発明の方法を実施する場合の「土壤」又は「栽培担体」とは、植物を栽培するための支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、例えば、いわゆる各種土壤、育苗マット、水等を含むものであり、砂、バーミキュライト、綿、紙、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、バーク、軽石等を含むこともできる。

- [0118] 土壤への施用方法としては、例えば、液体又は固体製剤を水に希釀又は希釀せずして植物体の設置場所近辺又は育苗のための苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の設置場所近辺又は苗床に散布する方法、播種前又は移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壤全体と混和する方法、播種前又は植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布する方法などが挙げられる。

- [0119] 水稲の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば、播種時施用、緑化期施用、移植時施用など施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤型で施用すれば良い。

培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。

単に、培土と各種製剤を交互に層状にして施用しても良い。播種時の施用の時期は播種の前、同時、播種後いずれでも良く、覆土後に施用しても良い。

[0120] 畑作物、例えば麦等においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等への処理が好ましい。畠へ直接播種する植物においては、種子への直接の処理の他、栽培中の植物に近接する栽培担体等への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釀又は希釀しない薬剤を液状にて灌注処理を行うこと等ができる。

移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接の処理の他、育苗用の苗床への液状とした薬剤の灌注処理又は粒剤の散布処理ができる。又、定植時に粒剤を植え穴に処理したり、移植場所近辺の栽培担体に混和することもできる。

[0121] 本発明の有害生物防除剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することもできる。

かかる目的で使用する他の殺菌剤は、例えば、硫黄、石灰硫黄合剤、塩基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオファネート、チオファネートメチル、ベノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクリン、フラメトピル、チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロパミド、ジクロフルアニド、フルスルファミド、クロロタロニル、クレソキシム・メチル、フェノキサニル、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオレイミド、プロシミドン、ビンクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、ビテルタノール、トリフルミゾール、イプコナゾール、フルコナゾール、プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、ミクロブタニル、テトラコナゾール、ヘキサコナゾール、テブコナゾール、チアジニル、イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエート、シプロコナゾール、インプロチオラン、フェナリモル、ピリメタ

ニル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジン、アゾキシストロビン、チアジアジン、キャプタン、プロベナゾール、アシベンゾラルSメチル、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネート、オキソリニック酸、ジチアノン、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシン、プラストサイシン、ストレプトマイシン等を挙げることができ、

- [0122] 同様の目的で使用する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例えば、エチオン、トリクロルホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロルボス、メビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカルバム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレッド、メチルパラチオン、フェニトロチオン、シアノホス、プロパホス、フェンチオン、プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、ジメチルビンホス、クロルフェビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス・メチル、ピリダafenチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、ホスマット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カズサホス、メスルフェンホス、DPS (NK-0795)、
- [0123] ホスホカルブ、フェナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、レスメトリン、ペルメトリン、テフルトリン、ビフェントリン、フェンプロパトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、シハロトリン、ラムダシハロトリン、デルタメトリン、アクリナトリン、フェンバレート、エスフェンバレート、シクロプロトリン、エトフェンプロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフェン、フルシリネート、フルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカルブ、プロポキスル、フェノキシカルブ、フェノブカルブ、エチオフェンカルブ、フェノチオカルブ、ビフェナゼート、BPMC(2-セコンダリーブチルフェニル-N-メチルカーバメート)、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジフルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズ

ロン、酸化フェンブタスズ、水酸化トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メトプレン、ハイドロプレン、ビナパクリル、アミトラズ、ジコホル、ケルセン、クロルベンジレート、フェニソブロモレート、テトラジホン、ベンスルタップ、ベンゾメート、テブフェノジド、メキシフェノジド、ピリダリル、メタフルミジン、フルベンジアミド、クロマフェノジド、プロパルギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナピル、フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピラム、アセタミプリド、チアクロプリド、イミダクロプリド、チアメトキサム、クロチアニジン、ジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドラメチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、TPIC(トリプロピルイソシアヌレート)、ピメトロジン、クロフェンテジン、ブロフェジン、チオシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチン複合体、ミルベメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピノサッド、BT(バチルス・チューリングンシス)、アザディラクチン、ロテノン、ヒドロキシプロピルデンプン、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、バストリア、モナクロスポリウム・フィマトパガム等を挙げることができ、

- [0124] 同様に除草剤としては、例えば、グリホサート、スルホセート、グルホシネート、ビアラホス、ブタミホス、エスプロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニュロン、ダイムロン、イソウロン、ベンスルフロンメチル、シクロスルファムロン、シノスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、テニルクロール、アラクロール、プレチラクロール、クロメプロップ、エトベンザニド、メフェナセット、ペンディメタリン、ビフェノックス、アシフルオフェン、ラクトフェン、シハロホップブチル、アイオキシニル、プロモブチド、アロキシジム、セトキシジム、ナプロパミド、インダノファン、ピラゾレート、ベンゾフェナップ、ピラフルフェンエチル、イマザピル、スルフェントラゾン、カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサジアゾン、パラコート、ジクワット、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメトリン、トリアジフラム、ベンフレセート、フルチアセットメチル、キザロホップ・エチル、ベンタゾン、過酸化カルシウム等を挙げができる。

## 実施例

[0125] 次に実施例を挙げて具体的に説明するが発明の要旨を超えない限りそれらに限定されるものではない。

実施例1. N-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル]-2-トリフルオロメチルベンズアミド(化合物No. 1-32)の製造  
1-1)

2,4-ジクロロベンズアルデヒド(1.45g, 8.3mmol)、酢酸アンモニウム(0.64g, 8.3mmol)及びニトロエタン(6g, 80mmol)の混合物を、6時間加熱還流した。室温にまで冷却し酢酸エチルを加え、水と飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。エタノールにて再結晶し、2,4-ジクロロ-1-(2-ニトロ-1-プロペニル)ベンゼン(黄色針状結晶、収量;1.0g、収率;52%)を得た。

[0126] 1-2)

水素化リチウムアルミニウム(0.33g, 8.9mmol)のテトラヒドロフラン懸濁液(20ml)に、2,4-ジクロロ-1-(2-ニトロ-1-プロペニル)ベンゼン(1.0g, 4.3mmol)のテトラヒドロフラン溶液(5ml)を室温で滴下した。ゆるやかに還流が始まり、その後1時間加熱還流した。室温まで冷却した後、冰浴で冷やしながら水を2ml加えた。さらに1N水酸化ナトリウム水溶液を5ml加え、不溶物をセライトろ過により除いた。ろ液に水を加え、メチルt-ブチルエーテルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮して粗製の[2-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル]アミン(収量;0.8g、収率;91%)を得た。

物性;<sup>1</sup>H-NMR[CDCl<sub>3</sub>/TMS, δ 値(ppm)]7.38(d, 1H), 7.18(d, 1H), 7.17(s, 1H), 3.24(m, 1H), 2.80(dd, 1H), 2.65(dd, 1H), 1.23(d, 3H)

[0127] 1-3)

粗製の[2-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル]アミン(約0.8g, 3.9mmol)及びトリエチルアミン(0.6g, 5.9mmol)のテトラヒドロフラン溶液(20ml)に2-トリフルオロメチルベンズイルクロライド(0.8g, 3.8mmol)を室温でゆっくり滴下した。室温で0.5時間攪拌後、水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を0.5N塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、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より精製し、アセトン/n-ヘキサン混合溶

媒で再結晶することにより、目的物(白色固体、収量;0.4g、収率;27%)を得た。

物性;融点 142°C

- [0128] 実施例2. N-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル]-2-トリフルオロメチルピラジン-3-カルボキサミド(化合物No.3-43)の製造

2-トリフルオロメチルピラジン-3-カルボン酸(0.25g, 1.3mmol)、[2-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メチルエチル]アミン(0.27g, 1.3mmol)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.19g, 1.6mmol)のクロロホルム(10ml)溶液に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(0.3g, 1.6mmol)を加え、室温にて12時間攪拌した。水及びクロロホルムを加え分液し、有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製して目的物(収量;0.31g、収率;63%)を得た。

物性;融点 163-164°C

- [0129] 実施例3. N-{1-[1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロピル]エチル}-2-クロロピラジン-3-カルボキサミド(化合物No.3'-45)の製造

3-1)

1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロパンカルボニトリル(5.0g, 23.6mmol)のテトラヒドロフラン溶液(20ml)に、臭化メチルマグネシウム(0.96mol/1テトラヒドロフラン溶液;30ml)を室温で加えた。1.5時間加熱還流後、室温まで冷却し、氷浴で冷やしながら0.5M塩酸を加えた。酢酸エチルで抽出した有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮して粗製の1-[1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロピル]エタノン(茶色オイル、収量;3.4g、収率;63%)を得た。

- [0130] 3-2)

1-[1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロピル]エタノン(3.4g, 14.8mmol)、ヒドロキシルアミン塩酸塩(2.8g)、トリエチルアミン(3.8g)及びエタノール(30ml)の混合物を8時間加熱還流した。室温まで冷却し、エタノールを留去し、酢酸エチルを加えた。水と飽和食塩水で洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、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より精製して、1-[1-(2,4-ジク

ロロフェニル)シクロプロピル]エタノンオキシム(白色固体、収量;3.4g、収率;94%)を得た。

[0131] 3-3)

1-[1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロピル]エタノンオキシム(2.6g, 10.7 mmol)、ラネーニッケル(2.0g)及びエタノール(30ml)の混合物を、水素加圧下、室温で30時間攪拌した。セライトろ過でラネーニッケルを除き、ろ液を濃縮した。残渣に酢酸エチルを加え、水と飽和食塩水で洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮して、粗製の1-[1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロピル]エチルアミン(茶色オイル)を得た。

物性;  $^1\text{H-NMR}$ [ $\text{CDCl}_3$ /TMS,  $\delta$  値(ppm)]7.37(d, 1H), 7.29(d, 1H), 7.18(dd, 1H), 2.87(q, 1H), 1.05(d, 3H), 0.96(br, 2H), 0.80(d, 2H)

これをメチルt-ブチルエーテル(20ml)に溶解し、4N塩酸の酢酸エチル溶液を滴下した。白色沈殿物をろ過して、メチルt-ブチルエーテルで洗浄、風乾して、1-[1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロピル]エチルアミン塩酸塩(白色固体、収量;2.0g)を得た。

物性;  $^1\text{H-NMR}$ [ $\text{CDCl}_3$ /TMS,  $\delta$  値(ppm)]8.35(br, 3H), 7.45(d, 1H), 7.39(d, 1H), 7.19(dd, 1H), 3.36(br, 1H), 1.37(d, 3H), 1.25-1.39(m, 2H), 1.03(m, 1H), 0.96(m, 1H)

[0132] 3-4)

2-クロロピラジン-3-カルボン酸(0.15g, 1.0mmol)、1-[1-(2,4-ジクロロフェニル)シクロプロピル]エチルアミン塩酸塩(0.25g, 0.94mmol)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.29g, 2.4mmol)のクロロホルム(10ml)溶液に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(0.22g, 1.2mmol)を加え、室温にて12時間攪拌した。水及びクロロホルムを加え分液し、有機層を水及び飽和食塩水で順次洗浄し無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:1)で精製して表題化合物(収量;0.24g、収率;69%)を得た。

物性;  $^1\text{H-NMR}$ [ $\text{CDCl}_3$ /TMS,  $\delta$  値(ppm)]:8.53(d, 1H), 8.47(d, 1H), 7.55(br, 1H)

, 7.37 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 4.11 (m, 1H), 1.28 (m, 1H), 1.23 (d, 3H), 1.01 (m, 1H), 0.90 (m, 2H)

[0133] 以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

[0134] 製剤例1

本発明化合物	10部
キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

[0135] 製剤例2

本発明化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。	

[0136] 製剤例3

本発明化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部
以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。	

[0137] 製剤例4

本発明化合物	20部
カオリンと合成高分散珪酸	75部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5部
以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。	

[0138] 次に、本発明化合物が有害生物防除剤、特に植物病害防除剤又は殺線虫剤として有用であることを試験例で示す。なお、本発明化合物は第1表～第11表に記載の化合物番号で示す。また、比較対照化合物として下記の4化合物を用いて同様の評価を行った。

比較化合物A;2, 6-ジクロロ-N-[2-{3-(トリフルオロメチル)フェニル}エチル]ベンズアミド(特開平1-151546号公報に記載の化合物番号12の化合物)

比較化合物B;N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-2-トリフルオロメチルベンズアミド(国際公開第04/016088号パンフレットに記載の化合物番号A-20の化合物)

比較化合物C;N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-2-クロロピリジン-3-カルボキサミド(国際公開第04/074280号パンフレットに記載の化合物番号R-1の化合物)

比較化合物D;N-[3',4'-ジクロロ-(1, 1-ジメチル)フェナシル]-3-メチル-2-チオフェンカルボキサミド(国際公開第06/016708号パンフレットに記載の化合物番号1-20の化合物)

[0139] 試験例1 リンゴ黒星病防除効果試験

ポットで育成したリンゴ苗木(品種:王林)に本発明化合物を製剤例1にしたがって調製した乳剤を水で所定量に希釀して茎葉散布した。散布翌日にPSA培地で培養して得られたリンゴ黒星病菌(*Venturia inaequalis*)の胞子懸濁液を噴霧接種し、20°C多湿条件下で保持した。接種14日後に式1に従って防除率を求め、下記の基準に従って防除効果を判定した。

[0140] [数1]

$$\text{防除率 (\%)} = \frac{(\text{無処理区の病斑面積率} - \text{処理区の病斑面積率}) \times 100}{\text{無処理区の病斑面積率}} \quad (1)$$

[0141] 判定基準

0 : 防除率9%以下

- 1 : 防除価10~19%
- 2 : 防除価20~29%
- 3 : 防除価30~39%
- 4 : 防除価40~49%
- 5 : 防除価50~59%
- 6 : 防除価60~69%
- 7 : 防除価70~79%
- 8 : 防除価80~89%
- 9 : 防除価90~99%
- 10: 防除価100%

[0142] 上記の試験の結果、本発明化合物は有効成分濃度50ppm、散布薬液量50mLにおいて優れた防除効果を示し、特に化合物No. 1-16、1-17、1-20、1-21、1-22、1-23、1-28、1-29、1-30、1-34、1-37、1-51、1-65、2-1、2-53、2-58、3-4、3-5、3-6、3-7、3-8、3-10、3-11、3-23、3-30、3-37、3-43、3-43-S、3-50、3-51、3-53、3-54、3-58、3-59、3-60、3-61、3-62、3-64、3-65、3-67、3-75、3-76、3-77、3-82、3-86、3-92、3-94、3-96、3-100、3-102、3-103、3-106、3'-5、3'-6、3'-7、3'-11、3'-30、3'-44、3'-61、3'-62、3''-5、3''-8、4-1、5-4、5-5、5-7、5-15、5-20、5-21、5-26、6-1、6-2、6-3、6-5、6-9、6-22、6-24、6-26、9-1及び9-2は判定基準10の高い活性を示した。比較化合物Aは4倍の高濃度200ppmを処理した場合でも判定基準0で効果を示さなかった。

[0143] 試験例2 キュウリ灰色かび病防除効果試験

直径9cmのポットで育苗した1葉期のキュウリ(品種:四葉)に本発明化合物を製剤例1にしたがって調製した乳剤を水で所定量に希釀して茎葉散布した。散布翌日にPSA培地で培養して得られたキュウリ灰色かび病菌(*Botrytis cinerea*)の胞子懸濁液を直径6mmのペーパーディスクに含浸させてキュウリ子葉に置床接種し、20°C多湿条件下で保持した。接種7日後に式2に従って防除価を求め、試験例1の判

定基準に従って防除効果を判定した。

[0144] [数2]

$$\text{防除率 (\%)} = \frac{(\text{無処理区の病斑直径} - \text{処理区の病斑直径}) \times 100}{\text{無処理区の病斑直径}} \quad (2)$$

[0145] 上記の試験の結果、本発明化合物は有効成分濃度50ppm、散布薬液量50mLにおいて優れた防除効果を示し、特に化合物No. 1-20、2-1、2-20、2-25、3-4、3-5、3-6、3-7、3-8、3-9、3-10、3-11、3-25、3-30、3-42、3-43、3-43-S、3-51、3-53、3-61、3-62、3-64、3-75、3-77、3-86、3-89、3-92、3-93、3-94、3-96、3-100、3-102、3-103、3-104、3-105、3-106、3'-5、3'-6、3'-7、3'-11、3'-30、3'-42、3'-43、3'-44、3''-5、3''-8、3''-42、4-2、5-21、6-1、6-3、6-19、6-22、7-1及び9-2は判定基準10の高い活性を示した。比較化合物A、比較化合物B及び比較化合物Dは判定基準0で効果を示さなかった。比較化合物Aは4倍の高濃度200ppmを処理した場合でも判定基準0で効果を示さなかった。

[0146] 試験例3 オオムギうどんこ病防除効果試験

直径6cmのポットで育苗した1葉期のオオムギ(品種:関東6号)に本発明化合物を製剤例1にしたがって調製した乳剤を水で所定量に希釀して茎葉散布した。散布翌日にオオムギうどんこ病菌(*Blumeria graminis hordei*)に罹病したオオムギ葉から得られた胞子を振りかけて接種し、温室内で保持した。接種7日後に試験例1の判定基準に従って防除効果を判定した。

[0147] 上記の試験の結果、本発明化合物は有効成分濃度50ppm、散布薬液量50mLにおいて優れた防除効果を示し、特に化合物No. 1-16、1-25、1-27、1-29、1-30、1-32、1-33、1-34、1-35、1-37、1-39、1-51、1-61、1-63、1-79、2-18、2-25、2-26、2-58、3-4、3-5、3-7、3-9、3-10、3-11、3-25、3-37、3-42、3-43、3-43-S、3-44、3-50、3-51、3-53、3-58、3-60、3-61、3-62、3-64、3-75、3-77、3-86、3-92、3-9

3、3-94、3-96、3-100、3-102、3-103、3-104、3'-5、3'-7、3'-11、3'-42、3'-43、3'-45、3'-61、3'-65、3''-42、5-4、5-6、5-7、5-15、5-20、5-21、5-23、6-1、6-4、6-11、6-12、6-13、6-14、6-15、6-18、6-20、6-22、6-23、6-26及び9-1は判定基準10の高い活性を示した。比較化合物A、比較化合物B、比較化合物C及び比較化合物Dは判定基準0で効果を示さなかった。

[0148] 試験例4 サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 防除効果試験

ポットで栽培したメロンの実生苗に本発明化合物を製剤例1にしたがって調製した乳剤を500ppmに希釈した薬液を株元に灌注処理し、薬剤処理1日後にサツマイモネコブセンチュウの水懸濁液(線虫約500匹/ml)を処理区及び無処理区に接種(土壌灌注)し、ポットを25°Cの温室に置いた。接種8日後に根部を水洗して根瘤数を調査し、下記判定基準に従って効果を判定した。

判定基準

A: 根瘤なし。

B: 根瘤はあるが、無処理区より明らかにその数が少ない。

C: 無処理区と同等以上の根瘤数あり。

[0149] 上記の試験の結果、本発明化合物は有効成分濃度500ppm、株元灌注処理において防除効果を示し、化合物No. 1-16、1-34、3'-43、3'-44、3''-48が判定基準B以上の高い活性を示した。

産業上の利用可能性

[0150] 本発明の化合物は、地球環境への負荷が少なく、低薬量で広い防除スペクトラムを有し、優れた防除効果を示す有害生物防除剤として有用である。

本出願は、日本で出願された特願2006-077752及び特願2006-294810を基礎としており、その内容は本明細書にすべて包含されるものである。

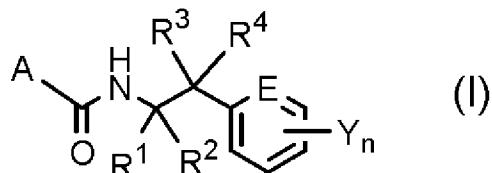
本発明がその好ましい態様を参照して提示又は記載される一方、本明細書中において、添付の請求の範囲で包含される発明の範囲を逸脱することなく、形態や詳細

の様々な変更をなし得ることは当業者に理解されるであろう。本明細書中に示され又は参照されたすべての特許、特許公報及びその他の刊行物は、参照によりその全体が取り込まれる。

## 請求の範囲

[1] 一般式(I)

[化1]



{式中、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>はそれぞれ独立に水素原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示す。また、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良い。

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>はそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示す。また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、Aが式(A3)で表される置換環式基を示す場合は、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>が一緒になって酸素原子を示しても良い。

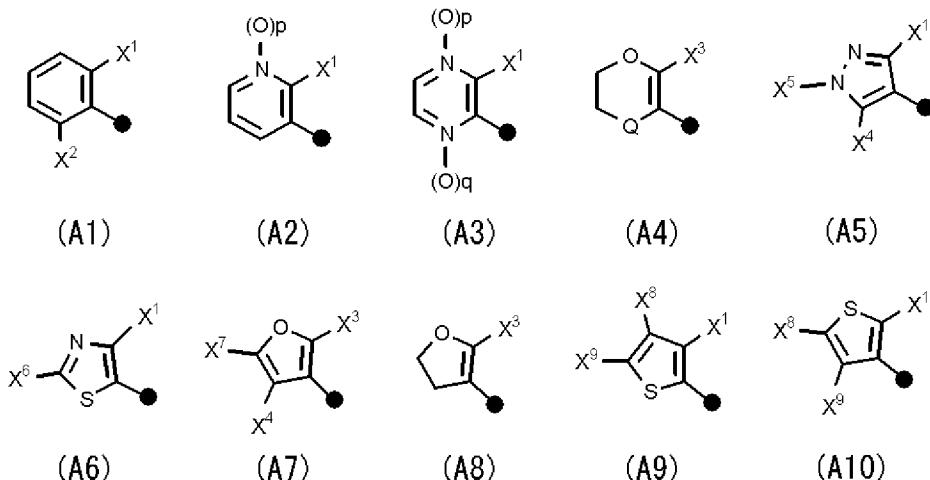
Yはそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ヒドロキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルキニル基;ハロゲン原子および(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選ばれる置換基により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルキニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基;(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル基;(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシイミノ(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基;(C<sub>3</sub>—C<sub>30</sub>)トリアルキルシリル基;置換基群Zから選ばれる1以上の置換基で置換されていても良いフェニル基;置換基群Zから選ばれる1以上の置換基で置換されていても良いフェノキシ基;又は置換基群Zから選ばれる1以上の置換基で置換されていても良い複素環オキシ基を示し、nは1~5の整数を示す。

また、nが2~5の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケレン基;(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基;(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子

により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができる。置換基群Zは、水素原子；ハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2 - C_6$ )アルケニル基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2 - C_6$ )アルキニル基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2 - C_6$ )アルコキシ基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2 - C_6$ )アルケニルオキシ基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_2 - C_6$ )アルキニルオキシ基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルチオ基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルスルフィニル基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルホニル基；( $C_1 - C_6$ )アルコキシカルボニル基；( $C_1 - C_6$ )アルコキシイミノ( $C_1 - C_3$ )アルキル基；又はカルバモイル基を示す。

Aは、式(A1)乃至(A10)からなる群から選ばれる置換環式基を示す。

### [化2]



(式中、 $X^1$ はハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基；ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルコキシ基；又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキルチオ基を示す。

$X^2$ は水素原子；又はハロゲン原子を表す。

$X^3$ はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示す。

$X^4$ 、 $X^7$ 、 $X^8$ 及び $X^9$ はそれぞれ独立に、水素原子；ハロゲン原子；又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示す。

$X^5$ は水素原子;又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す。

$X^6$ は水素原子;アミノ基;モノ( $C_1-C_3$ )アルキルアミノ基;ジ( $C_1-C_3$ )アルキルアミノ基;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す。

Qは酸素原子;硫黄原子;—SO<sub>2</sub>—又は—CH<sub>2</sub>—を示す。

p及びqはそれぞれ独立に0又は1を示す。)

EはC—H; C—Y(Yは上記に定義するとおりである。); 又は窒素原子を表す。

但し、(1)Eが窒素原子を示す場合、Aは式(A3)で表される置換環式基を示し、かつ(2)2, 6-ジクロロ-N-[2-{3-(トリフルオロメチル)フェニル}エチル]ベンズアミドを除く。}で表されるN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

- [2] EがC—H又はC—Y(Yは請求項1に定義するとおりである。)を示す、請求項1に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[3] Aが式(A1)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[4] Aが式(A1)で表される置換環式基を示し、  
EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、  
R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、  
R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、  
Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ヒドロキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子および(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選ばれる置換基により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>

$-C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良い複素環オキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルキレン基;( $C_3-C_5$ )アルケニレン基;( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、 $X^1$ がハロゲン原子;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルコキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキルチオ基を示し、 $X^2$ が水素原子;又はハロゲン原子を示す、

請求項1乃至3のいずれか1項に記載のN—2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[5] Aが式(A2)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[6] Aが式(A2)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、また、 $R^1$ と $R^2$ は一緒になって

( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を

示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ヒドロキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子および(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選ばれる置換基により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基;ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェノキシ基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(ii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良い複素環オキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケレン基;(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基;(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、X<sup>1</sup>がハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

pが0を示す、

請求項1、2及び5のいずれか1項に記載のN—2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[7] Aが式(A3)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[8] Aが式(A3)で表される置換環式基を示し、

EがC—H; C—Y(Yは下記に定義するとおりである。)又は窒素原子を示し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子; 又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子; ハロゲン原子; 又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>が一緒になって酸素原子を示しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子; シアノ基; ヒドロキシ基; ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基; ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基; ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>)アルケニルオキシ基; ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基; ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基; ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基; 同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェニル基; 同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェノキシ基; 又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良い複素環オキシ基を示し、nが1~3の整数を示し、

また、nが2~3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケレン基; (C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基; (C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基; 又はハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、

X<sup>1</sup>がハロゲン原子; 又はハロゲン原子により置換されても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

p及びqが0を示す、

請求項1又は7に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[9] EがC-H又はC-Y(Yは請求項8に定義するとおりである。)を示す、請求項8記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[10] Aが式(A4)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[11] Aが式(A4)で表される置換環式基を示し、

EがC-H又はC-Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子;又は(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示し、nが1~3の整数を示し、

また、nが2~3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)アルケレン基;(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)アルケニレン基;(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、X<sup>3</sup>がハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

Qが硫黄原子を示す、

請求項1、2及び10のいずれか1項に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[12] Aが式(A5)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[13] Aが式(A5)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良

い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコ

キシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲ

ン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子

により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基;同一又は異なっても

良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アル

キル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基か

ら選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しく

は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(

C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)ア

ルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を

示し、nが1~3の整数を示し、

また、nが2~3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルキ

レン基;(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基;(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子

により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、

X<sup>1</sup>がハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキ

ル基を示し、

X<sup>4</sup>が水素原子;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—

$C_3$ )アルキル基を示し、

$X^5$ が水素原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す、

請求項1、2及び12のいずれか1項に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[14] Aが式(A6)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[15] Aが式(A6)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良

い( $C_1-C_6$ )アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基;ハロゲ

ン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子

により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても

良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アル

キル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基か

ら選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しく

は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(

$C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )ア

ルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を

示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルキ

レン基;( $C_3-C_5$ )アルケニレン基;( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子

により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^1$ がハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキ

ル基を示し、

$X^6$ が水素原子;アミノ基;モノ( $C_1-C_3$ )アルキルアミノ基;ジ( $C_1-C_3$ )アルキルアミノ基;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキル基を示す、

請求項1、2及び14のいずれか1項に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[16] Aが式(A7)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[17] Aが式(A7)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

$R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1-C_3$ )アルキル基を示し、

$R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1-C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3-C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコ

キシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルチオ基;ハロゲ

ン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子

により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても

良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アル

キル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )アルコキシ基か

ら選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しく

は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(

$C_1-C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い( $C_1-C_6$ )ア

ルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を

示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3-C_5$ )アルキ

レン基;( $C_3-C_5$ )アルケニレン基;( $C_2-C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子

により置換されていても良い( $C_1-C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、

$X^3$ がハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示し、 $X^4$ 及び $X^7$ がそれぞれ独立して水素原子;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示す、請求項1、2及び16のいずれか1項に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[18] Aが式(A8)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[19] Aが式(A8)で表される置換環式基を示し、EがC-H又はC-Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、 $R^1$ 及び $R^2$ がそれぞれ独立に水素原子;又は( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示し、 $R^3$ 及び $R^4$ がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は( $C_1 - C_6$ )アルキル基を示し、また、 $R^3$ と $R^4$ は一緒になって( $C_3 - C_6$ )シクロアルカンを形成しても良く、Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェニル基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_6$ )アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されても良いフェノキシ基を示し、nが1~3の整数を示し、

また、nが2~3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって( $C_3 - C_5$ )アルケレン基;( $C_3 - C_5$ )アルケニレン基;( $C_2 - C_4$ )アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_3$ )アルキレンジオキシ基を示すことができ、 $X^3$ がハロゲン原子により置換されても良い( $C_1 - C_3$ )アルキル基を示す、

請求項1、2及び18のいずれか1項に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[20] Aが式(A9)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[21] Aが式(A9)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示し、nが1～3の整数を示し、

また、nが2～3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケレン基;(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基;(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、

X<sup>1</sup>がハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

X<sup>8</sup>及びX<sup>9</sup>がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示す、

請求項1、2及び20のいずれか1項に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[22] Aが式(A10)で表される置換環式基を示す、請求項1又は2に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類。

[23] Aが式(A10)で表される置換環式基を示し、

EがC—H又はC—Y(Yは下記に定義するとおりである。)を示し、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>がそれぞれ独立に水素原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>がそれぞれ独立に水素原子;ハロゲン原子;又は(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基を示し、また、R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>)シクロアルカンを形成しても良く、

Yがそれぞれ独立にハロゲン原子;シアノ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルチオ基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルフィニル基;ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキルスルホニル基;同一又は異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェニル基;又は同一若しくは異なっても良く、(i)ハロゲン原子、(ii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルキル基及び(iii)ハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基により置換されていても良いフェノキシ基を示し、nが1~3の整数を示し、

また、nが2~3の整数である場合に隣り合う2つのYが一緒になって(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケレン基;(C<sub>3</sub>—C<sub>5</sub>)アルケニレン基;(C<sub>2</sub>—C<sub>4</sub>)アルキレンオキシ基;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキレンジオキシ基を示すことができ、

X<sup>1</sup>がハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示し、

X<sup>8</sup>及びX<sup>9</sup>がそれぞれ独立して水素原子;ハロゲン原子;又はハロゲン原子により置換されていても良い(C<sub>1</sub>—C<sub>3</sub>)アルキル基を示す、

請求項1、2及び22のいずれか1項に記載のN—2—(ヘテロ)アリールエチルカルボ

キサミド誘導体又はその塩類。

- [24] 請求項1乃至23のいずれか1項に記載のN-2-(ヘテロ)アリールエチルカルボキサミド誘導体又はその塩類を有効成分とする有害生物防除剤。
- [25] 植物病害防除剤である請求項24に記載の有害生物防除剤。
- [26] 犀線虫剤である請求項24に記載の有害生物防除剤。
- [27] 請求項24乃至26のいずれか1項に記載の有害生物防除剤の有効量を対象作物植物体又は当該植物の栽培に用いる土壤に処理することを特徴とする、有害生物の防除方法。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/055726

**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)

C07C233/66, A01N37/18, A01N43/08, A01N43/10, A01N43/32, A01N43/40,  
A01N43/56, A01N43/60, A01N43/78, A01N47/02, A01P3/00, C07C233/65,  
C07C233/73, C07D213/82, C07D231/14, C07D241/24, C07D277/20, C07D277/56,

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	1996-2007
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2007	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2007

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
Caplus (STN), REGISTRY (STN)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2006/16708 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD), 16 February, 2006 (16.02.06), Pages 2 to 15, 53 to 69 & JP 2007-23007 A & EP 1776011 A1	1-27
X	WO 2005/85238 A1 (Bayer Cropscience S.A.), 15 September, 2005 (15.09.05), Pages 1 to 15, 35 to 40 & EP 1574511 A1 & EP 1720865 A1	1-27
X	WO 2005/58833 A1 (Bayer Cropscience S.A.), 30 June, 2005 (30.06.05), Pages 1 to 15, 36 to 55 & EP 1548007 A1 & EP 1694649 A1	1-27

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  
02 May, 2007 (02.05.07)

Date of mailing of the international search report  
22 May, 2007 (22.05.07)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP2007/055726

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2005/58828 A1 (Bayer Cropscience S.A.), 30 June, 2005 (30.06.05), Pages 1 to 6, 26 to 39 & EP 1694648 A1	1-27
X	WO 2005/14545 A2 (Bayer Cropscience S.A.), 17 February, 2005 (17.02.05), Pages 1 to 6, 27 to 37 & EP 1500651 A1 & JP 2006-528613 A & US 2006/246102 A1	1-27
X	WO 2004/74280 A1 (Bayer Cropscience S.A.), 02 September, 2004 (02.09.04), Pages 1 to 44 & EP 1449841 A1 & JP 2006-517948 A & US 2006/052366 A1	1-27
X	JP 2005-179234 A (Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd.), 07 July, 2005 (07.07.05), Pages 3 to 4, 14 to 19, 24 to 28 (Family: none)	1-27
X	JP 2005-535714 A (Bayer Cropscience S.A.), 24 November, 2005 (24.11.05), Pages 6 to 8, 10 to 26 & EP 1389614 A1 & US 2005/234110 A1	1-27
X	JP 2001-342183 A (Ube Industries, Ltd.), 11 December, 2001 (11.12.01), Pages 2 to 6 (Family: none)	1-27
X	JP 1-151546 A (Eli Lilly and Co.), 14 June, 1989 (14.06.89), Pages 3 to 4, 26 to 27 & EP 314422 A2 & US 4957533 A	1-27

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP2007/055726

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
(International Patent Classification (IPC))

*C07C233/66(2006.01)i, A01N37/18(2006.01)i, A01N43/08(2006.01)i,  
A01N43/10(2006.01)i, A01N43/32(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i,  
A01N43/56(2006.01)i, A01N43/60(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i,  
A01N47/02(2006.01)i, A01P3/00(2006.01)i, C07C233/65(2006.01)i,  
C07C233/73(2006.01)i, C07D213/82(2006.01)i, C07D231/14(2006.01)i,  
C07D241/24(2006.01)i, C07D277/20(2006.01)i, C07D277/56(2006.01)i,  
C07D307/56(2006.01)i, C07D327/06(2006.01)i, C07D333/38(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))

C07D307/56, C07D327/06, C07D333/38

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. C07C233/66, A01N37/18, A01N43/08, A01N43/10, A01N43/32, A01N43/40, A01N43/56, A01N43/60, A01N43/78, A01N47/02, A01P3/00, C07C233/65, C07C233/73, C07D213/82, C07D231/14, C07D241/24, C07D277/20, C07D277/56, C07D307/56, C07D327/06, C07D333/38

## 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	1971-2007年
日本国実用新案登録公報	1996-2007年
日本国登録実用新案公報	1994-2007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(STN), 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 請求の範囲の番号
X	WO 2006/16708 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD) 2006. 02. 16 p. 2-15, 53-69 & JP 2007-23007 A & EP 1776011 A1	1-27
X	WO 2005/85238 A1 (Bayer Cropscience S. A.) 2005. 09. 15 p. 1-15, 35-40 & EP 1574511 A1 & EP 1720865 A1	1-27
X	WO 2005/58833 A1 (Bayer Cropscience S. A.) 2005. 06. 30 p. 1-15, 36-55 & EP 1548007 A1 & EP 1694649 A1	1-27

 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  02.05.2007	国際調査報告の発送日  22.05.2007
国際調査機関の名称及びあて先  日本国特許庁 (ISA/JP) 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）  前田 憲彦 電話番号 03-3581-1101 内線 3443 4H 8318

C(続き) . 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 請求の範囲の番号
X	WO 2005/58828 A1(Bayer Cropscience S.A.) 2005.06.30 p. 1-6, 26-39 & EP 1694648 A1	1-27
X	WO 2005/14545 A2(Bayer Cropscience S.A.) 2005.02.17 p. 1-6, 27-37 & EP 1500651 A1 & JP 2006-528613 A & US 2006/246102 A1	1-27
X	WO 2004/74280 A1(Bayer Cropscience S.A.) 2004.09.02 p. 1-44 & EP 1449841 A1 & JP 2006-517948 A & US 2006/052366 A1	1-27
X	JP 2005-179234 A(石原産業株式会社) 2005.07.07 第3-4, 14-19, 24-28 頁 (ファミリーなし)	1-27
X	JP 2005-535714 A(バイエル・クロツプサイエンス・エス・アーユ) 2005.11.24 第6-8, 10-26 頁 & EP 1389614 A1 & US 2005/234110 A1	1-27
X	JP 2001-342183 A(宇部興産株式会社) 2001.12.11 第2-6 頁 (ファミリーなし)	1-27
X	JP 1-151546 A(イーライ・リリー・アンド・カンパニー) 1989.06.14 第3-4, 26-27 頁 & EP 314422 A2 & US 4957533 A	1-27

## 発明の属する分野の分類

C07C233/66(2006.01)i, A01N37/18(2006.01)i, A01N43/08(2006.01)i, A01N43/10(2006.01)i,  
A01N43/32(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01N43/56(2006.01)i, A01N43/60(2006.01)i,  
A01N43/78(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01P3/00(2006.01)i, C07C233/65(2006.01)i,  
C07C233/73(2006.01)i, C07D213/82(2006.01)i, C07D231/14(2006.01)i,  
C07D241/24(2006.01)i, C07D277/20(2006.01)i, C07D277/56(2006.01)i,  
C07D307/56(2006.01)i, C07D327/06(2006.01)i, C07D333/38(2006.01)i