

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年7月12日(2007.7.12)

【公表番号】特表2007-502312(P2007-502312A)

【公表日】平成19年2月8日(2007.2.8)

【年通号数】公開・登録公報2007-005

【出願番号】特願2006-529790(P2006-529790)

【国際特許分類】

**C 0 7 C 233/64 (2006.01)**

**C 0 7 C 251/50 (2006.01)**

**C 0 7 C 231/02 (2006.01)**

**C 0 7 C 231/12 (2006.01)**

**C 0 7 C 249/12 (2006.01)**

**C 0 7 C 63/70 (2006.01)**

**C 0 7 C 51/08 (2006.01)**

**C 0 7 C 51/60 (2006.01)**

**A 0 1 N 37/22 (2006.01)**

**A 0 1 P 3/00 (2006.01)**

**C 0 7 B 61/00 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 C 233/64 C S P

C 0 7 C 251/50

C 0 7 C 231/02

C 0 7 C 231/12

C 0 7 C 249/12

C 0 7 C 63/70

C 0 7 C 51/08

C 0 7 C 51/60

A 0 1 N 37/22 1 0 1

A 0 1 P 3/00

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成19年5月11日(2007.5.11)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

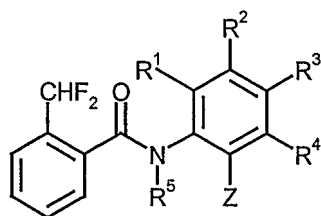
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(I)

〔式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は互いに独立して水素、弗素、塩素、メチル、イソプロピル又はメチルチオを表し、

$R^5$  は水素、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル；いずれの場合にも 1 から 9 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルホニル、ハロ -  $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル；ホルミル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - アルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - アルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル；いずれの場合にも 1 から 7 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する ( $C_1 - C_3$  - ハロアルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル；いずれの場合にも 1 から 6 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する ( $C_1 - C_3$  - アルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル、( $C_1 - C_3$  - アルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル；いずれの場合にも 1 から 13 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する ( $C_1 - C_3$  - ハロアルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル、( $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル； $-COR^6$ 、 $-CONR^7R^8$  又は  $-CH_2NR^9R^{10}$  を表し、

$R^6$  は水素、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_1 - C_8$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル；いずれの場合にも 1 から 9 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、ハロ -  $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル； $-COR^{11}$  を表し、

$R^7$  及び  $R^8$  は互いに独立して水素、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル；いずれの場合にも 1 から 9 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロアルキル、ハロ -  $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキルを表し、

$R^7$  及び  $R^8$  はまた、これらを結合している窒素原子と一緒にあって、場合によってハロゲン及び  $C_1 - C_4$  - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよく及び 5 から 8 個の環構成原子を有する飽和複素環を形成し (但し、前記複素環はさらに、酸素、硫黄及び  $NR^{12}$  からなる群から選択される 1 個又は 2 個の隣り合わない異種原子を含有していてもよい)、

$R^9$  及び  $R^{10}$  は互いに独立して水素、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル；いずれの場合にも 1 から 9 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロアルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキルを表し、

$R^9$  及び  $R^{10}$  はまた、これらを結合している窒素原子と一緒にあって、場合によりハロゲン及び  $C_1 - C_4$  - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよく及び 5 から 8 個の環構成原子を有する飽和複素環を形成し (但し、前記複素環はさらに、酸素、硫黄及び  $NR^{12}$  からなる群から選択される 1 個又は 2 個の隣り合わない異種原子を含有していてもよい)、

$R^{11}$  は水素、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_1 - C_8$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル；いずれの場合にも 1 から 9 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、ハロ -  $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキルを表し、

$R^{12}$  は水素又は  $C_1 - C_6$  - アルキルを表し、

Z は  $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$  又は  $Z^4$  を表し、この場合、

$Z^1$  は場合により同一又は異なる置換基でモノからペンタ置換されていてもよいフェニルを表し、

$Z^2$  は場合により同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよいビシクロアルキル又はシクロアルキルを表し、

$Z^3$  は非置換  $C_2 - C_{20}$  - アルキルを表すか又はハロゲン及び  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されている  $C_1 - C_{20}$  - アルキルを表し（但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び  $C_1 - C_4$  - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよい）、

$Z^4$  は  $C_2 - C_{20}$  - アルケニル又は  $C_2 - C_{20}$  - アルキニルを表し、これらはそれぞれ場合によりハロゲン及び  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよい（但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び  $C_1 - C_4$  - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよい）、

又は、

$R^1$ 、 $R^2$  及び  $R^3$  は互いに独立して水素又は弗素を表し、および

$Z$  及び  $R^4$  はこれらを結合している炭素原子と一緒になって場合により置換されていてもよい5又は6員炭素環又は複素環を形成する）

で示されるジフロオロメチルベンズアニリド。

#### 【請求項2】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  が互いに独立して水素、弗素、塩素、又はメチルを表し、

$R^5$  が水素； $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル；いずれの場合にも1から9個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルホニル、ハロ -  $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキル；ホルミル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - アルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - アルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル；いずれの場合にも1から7個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する( $C_1 - C_3$  - ハロアルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル；いずれの場合にも1から6個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する( $C_1 - C_3$  - アルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル、( $C_1 - C_3$  - アルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル；いずれの場合にも1から13個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する( $C_1 - C_3$  - ハロアルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル、( $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル；-COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>又は-CH<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>を表し、

$R^6$  が水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル；いずれの場合にも1から9個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、ハロ -  $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキル；-COR<sup>11</sup>を表し、

$R^7$  及び  $R^8$  が互いに独立して水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル；いずれの場合にも1から9個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、ハロ -  $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキルを表し、

$R^9$  及び  $R^{10}$  が互いに独立して水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル；いずれの場合にも1から9個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキルを表し、

$R^{11}$  が水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル；いずれの場合にも1から9個の弗素、塩素及び/又は臭素原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ハ

ロアルコキシ、ハロ -  $C_1 - C_3$  - アルコキシ -  $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキルを表し、

$R^{1,2}$  は水素又は  $C_1 - C_4$  - アルキルを表し、

$Z$  が  $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$  又は  $Z^4$  を表し、この場合、

$Z^1$  が場合により同一又は異なる置換基でモノからペンタ置換されていてもよいフェニルを表し、ここで置換基はリスト  $W^1$  から選択され、

$W^1$  が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル；

いずれの場合にもそれぞれ 1 から 8 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルキル、ヒドロキシアルキル、オキソアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、ジアルコキシアルキル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル又はアルキルスルホニル；

いずれの場合にもそれぞれ 2 から 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルケニル又はアルケニルオキシ；

いずれの場合にもそれぞれ 1 から 6 個の炭素原子と 1 から 13 個の同一又は異なるハロゲン原子を有する直鎖又は分岐ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル又はハロアルキルスルホニル；

いずれの場合にもそれぞれ 2 から 6 個の炭素原子と 1 から 11 個の同一又は異なるハロゲン原子を有する直鎖又は分岐ハロアルケニル又はハロアルケニルオキシ；

いずれの場合にもそれぞれの炭化水素鎖に 1 から 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アリールアルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニルオキシ、それぞれの炭化水素鎖に 2 から 6 個の炭素原子を有するアルケニルカルボニル又はアルキニルカルボニル；

いずれの場合にも 3 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキル又はシクロアルキルオキシ；

いずれの場合にも二重に結合される 3 個又は 4 個の炭素原子を有するアルキレン、2 個又は 3 個の炭素原子を有するオキシアルキレン、又は 1 個もしくは 2 個の炭素原子を有するジオキシアルキレン（但し、それぞれの基は、場合により弗素、塩素、オキソ、メチル、トリフルオロメチル及びエチルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノからテトラ置換されていてもよい）；

又は、基 -  $C(Q^1) = N - Q^2$ （式中、

$Q^1$  は水素、ヒドロキシルを表すか又は 1 から 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 から 4 個の炭素原子と 1 から 9 個の同一又は異なるハロゲン原子を有するハロアルキル、又は 1 から 6 個の炭素原子を有するシクロアルキルを表し、及び

$Q^2$  はヒドロキシル、アミノ、メチルアミノ、フェニル、ベンジルを表すか、又はいずれの場合にも場合によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ又はフェニル基で置換されていてもよい、1 から 4 個の炭素原子を有するアルキル又はアルコキシを表すか、又はいずれの場合にも 2 から 4 個の炭素原子を有するアルケニルオキシ又はアルキニルオキシを表す）、

及びフェニル、フェノキシ、フェニルチオ、ベンゾイル、ベンゾイルエテニル、シンナモイル、複素環、又はいずれの場合にもそれぞれのアルキル部分に 1 から 3 個の炭素原子を有するフェニルアルキル、フェニルアルキルオキシ、フェニルアルキルチオ又は複素環アルキル（但し、これらの基のそれぞれは、場合により環部分がハロゲン及び/又は 1 から 4 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルキル又はアルコキシでモノからトリ置換されていてもよい）を表し、

$Z^2$  がいずれの場合にも 3 から 10 個の炭素原子を有するシクロアルキル又はピシクロアルキルを表し（但し、これらの基のそれぞれは、場合により同一又は異なる  $C_1 - C_4$  - アルキルでモノからテトラ置換されていてもよい）、

$Z^3$  が非置換  $C_2 - C_{20}$  - アルキルを表すか、又は弗素、塩素、臭素、ヨウ素及び

C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されているC<sub>1</sub> - C<sub>20</sub> - アルキルを表し（但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合により弗素、塩素、臭素、ヨウ素、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル及びC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノからテトラ置換されていてもよい）、

Z<sup>4</sup> がC<sub>2</sub> - C<sub>20</sub> - アルケニル又はC<sub>2</sub> - C<sub>20</sub> - アルキニルを表し、このそれぞれが場合により弗素、塩素、臭素、ヨウ素及びC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよく（但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合により弗素、塩素、臭素、ヨウ素、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル及びC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノからテトラ置換されていてもよい）、

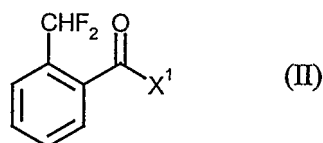
Z 及び R<sup>4</sup> がこれらを結合している炭素原子と一緒にあって、場合により同一又は異なる置換基でモノ置換からテトラ置換されていてもよい5員又は6員炭素環又は複素環を形成していてもよいものである、

請求項1に記載の式(I)で示されるジフルオロメチルベンズアニリド。

【請求項3】

a) 式(II)

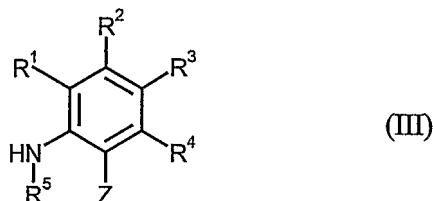
【化2】



(式中、X<sup>1</sup> は塩素又はヒドロキシルを表す)

で示されるジフルオロメチルベンゾイル誘導体を、式(III)

【化3】



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> 及び Z は請求項1で定義した通りである)

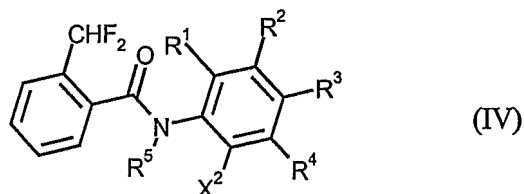
で示されるアニリン誘導体と、

適切ならば触媒の存在下で、適切ならば縮合剤の存在下で、

適切ならば酸結合剤の存在下で及び適切ならば希釈剤の存在下で反応させるか、又は

b) 式(IV)

【化4】



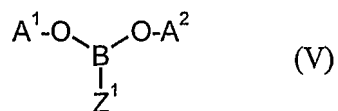
(式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 及び R<sup>5</sup> は請求項1で定義した通りであり、

X<sup>2</sup> は塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメチルスルホネートを表す)

で示されるハロジフルオロメチルベンズアニリドを、式(V)

## 【化 5】



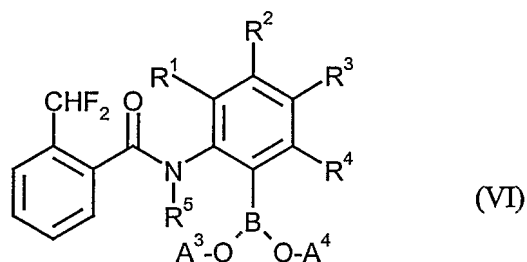
(式中、

 $Z^1$  は請求項 1 で定義した通りであり、 $A^1$  及び  $A^2$  はそれぞれ水素を表すか又は一緒になってテトラメチルエチレンを表す)で示されるボロン酸誘導体と、

触媒の存在下で、適切ならば酸結合剤の存在下で及び適切ならば希釈剤の存在下で反応させるか、又は

c) 式 (VI)

## 【化 6】



(式中、

 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は請求項 1 で定義した通りであり、 $A^3$  及び  $A^4$  はそれぞれ水素を表すか又は一緒になってテトラメチルエチレンを表す)で示されるジフルオロメチルベンズアミドボロン酸誘導体を、式 (VII)

(式中、

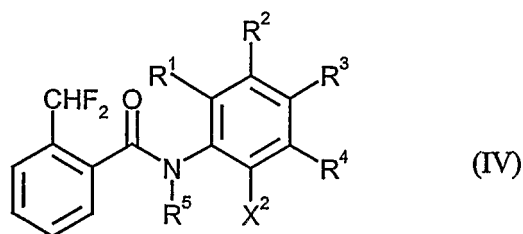
 $Z^1$  は請求項 1 で定義した通りであり、 $X^3$  は塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメチルスルホネートを表す)

で示されるフェニル誘導体と、

触媒の存在下で、適切ならば酸結合剤の存在下で及び適切ならば希釈剤の存在下で反応させるか、又は

d) 式 (IV)

## 【化 7】



(式中、

 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は請求項 1 で定義した通りであり、 $X^2$  は塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメチルスルホネートを表す)で示されるハロジフルオロメチルベンズアニリドを、式 (VII)

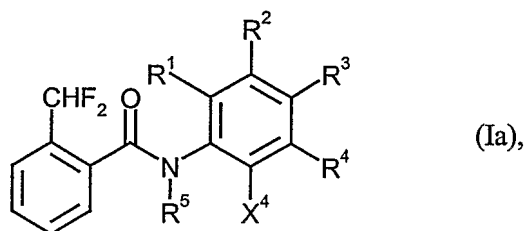
(式中、

 $Z^1$  は請求項 1 で定義した通りであり、 $X^3$  は塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメチルスルホネートを表す)

で示されるフェニル誘導体と、

パラジウム又はニッケル触媒の存在下及び 4, 4', 4'', 4''', 5, 5', 5'', 5''' - オクタメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキソボランの存在下で、適切ならば酸結合剤の存在下で及び適切ならば希釈剤の存在下で反応させるか、又は  
e) 式 (Ia)

【化 8】



〔式中、

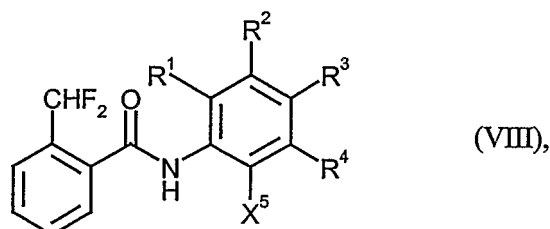
$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は請求項 1 で定義した通りであり、

$X^4$  は  $C_2 - C_{20}$  - アルケニル又は  $C_2 - C_{20}$  - アルキニルを表し、このそれぞれは場合によりハロゲン及び  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよい（但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び / 又は  $C_1 - C_4$  - アルキルで置換されていてもよい）〕

で示されるジフルオロメチルベンズアニリドを、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば触媒の存在下で水素化するか、又は

f) 式 (VII)

【化 9】



〔式中、

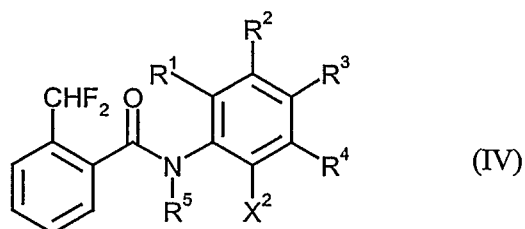
$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は請求項 1 で定義した通りであり、

$X^5$  は場合によりハロゲン及び  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でさらにモノ置換又は多置換されていてもよい  $C_2 - C_{20}$  - ヒドロキシアルキルを表す（但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び / 又は  $C_1 - C_4$  - アルキルで置換されていてもよい）〕

で示されるヒドロキシアルキルジフルオロメチルベンズアニリドを、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸の存在下で脱水するか、又は

g) 式 (IV)

【化 10】



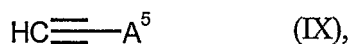
〔式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は請求項 1 で定義した通りであり、

$X^2$  は塩素、臭素、ヨウ素又はトリフルオロメチルスルホネートを表す）

で示されるハロゲン - ジフルオロメチルベンズアニリドを、式 (IX)

【化 1 1】

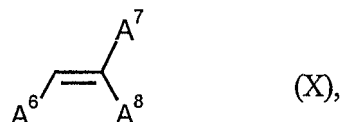


〔式中、

$\text{A}^5$  は場合によりハロゲン及び  $\text{C}_3 - \text{C}_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよい  $\text{C}_2 - \text{C}_{18}$  - アルキルを表す (但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び / 又は  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキルで置換されていてもよい) ]

で示されるアルキン、又は式 (X)

【化 1 2】



〔式中、

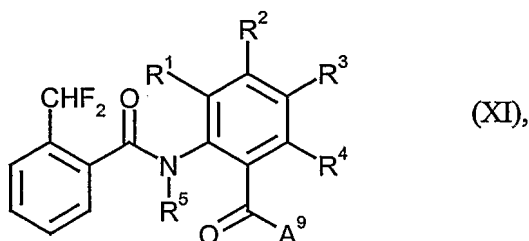
$\text{A}^6$ 、 $\text{A}^7$  及び  $\text{A}^8$  は互いに独立してそれぞれ水素を表すか又はハロゲン及び  $\text{C}_3 - \text{C}_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよいアルキルを表す (但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び / 又は  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキルで置換されていてもよく及び分子の開鎖の炭素原子の総数は 20 個を越えないものとする) ]

で示されるアルケンと、

適切ならば希釈剤の存在下で、適切ならば酸結合剤の存在下で及び 1 種又はそれ以上の触媒の存在下で反応させるか、又は

h) 式 (XI)

【化 1 3】



〔式中、

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  及び  $\text{R}^5$  は請求項 1 で定義した通りであり、

$\text{A}^9$  は水素を表すか又は場合によりハロゲン及び  $\text{C}_3 - \text{C}_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよい  $\text{C}_1 - \text{C}_{18}$  - アルキルを表す (但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び / 又は  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキルで置換されていてもよい) ]

で示されるケトン、式 (XII)



〔式中、

$\text{A}^{10}$  は場合によりハロゲン及び  $\text{C}_3 - \text{C}_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でモノ置換又は多置換されていてもよい  $\text{C}_1 - \text{C}_{18}$  - アルキルを表し (但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び / 又は  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキルで置換されていてもよい) 、

$\text{P} \text{X}$  は基 -  $\text{P}^+ (\text{C}_6\text{H}_5)_3 \text{Cl}^-$ 、 $-\text{P}^+ (\text{C}_6\text{H}_5)_3 \text{Br}^-$ 、 $-\text{P}^+ (\text{C}_6\text{H}_5)_3 \text{I}^-$ 、 $-\text{P} (= \text{O}) (\text{OCH}_3)_3$  又は  $-\text{P} (= \text{O}) (\text{OC}_2\text{H}_5)_3$  を表す]

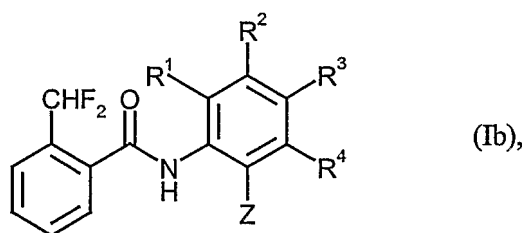
で示されるリン化合物と、



適切ならば希釈剤の存在下で反応させるか、又は

i) 式 (I b)

【化 1 4】



(式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は請求項 1 で定義した通りである)

で示されるジフルオロメチルベンズアニリドを、式 (X I I I)



〔式中、

$R^5 - 1$  は  $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル；いずれの場合にも 1 から 9 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルホニル、ハロ -  $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - ハロシクロアルキル；ホルミル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - アルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - アルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル；いずれの場合にも 1 から 7 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する ( $C_1 - C_3$  - ハロアルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル、( $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - アルキル；いずれの場合にも 1 から 6 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する ( $C_1 - C_3$  - アルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル、( $C_1 - C_3$  - アルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル；いずれの場合にも 1 から 13 個の弗素、塩素及び / 又は臭素原子を有する ( $C_1 - C_3$  - ハロアルキル)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル、( $C_1 - C_3$  - ハロアルコキシ)カルボニル -  $C_1 - C_3$  - ハロアルキル； $-COR^6$ 、 $-CONR^7R^8$  又は  $-CH_2NR^9R^{10}$  を表し、

$R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  は請求項 1 で定義した通りであり、

$X^6$  は塩素、臭素又はヨウ素を表す〕

で示されるハロゲン化物と、

塩基の存在下で及び希釈剤の存在下で反応させる

ことを特徴とする、請求項 1 に記載の式 (I) で示されるジフルオロメチルベンズアニリドの製造方法。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の式 (I) で示されるジフルオロメチルベンズアニリドの少なくとも 1 種と、増量剤及び / 又は界面活性剤とを含有してなることを特徴とする、望ましくない微生物の防除用組成物。

【請求項 5】

望ましくない微生物を防除するための請求項 1 に記載の式 (I) で示されるジフルオロメチルベンズアニリドの使用。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の式 (I) で示されるジフルオロメチルベンズアニリドを微生物及び / 又はこの生息環境に施用することを特徴とする、望ましくない微生物の防除方法。

【請求項 7】

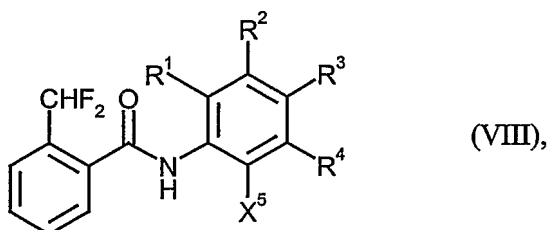
請求項 1 に記載の式 (I) で示されるジフルオロメチルベンズアニリドを増量剤及び / 又は界面活性剤と混合することを特徴とする、望ましくない微生物の防除用組成物の製造

方法。

【請求項 8】

式 (VII) の

【化 15】



〔式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は請求項 1 で定義した通りであり、

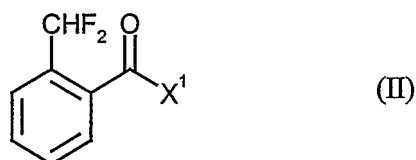
$X^5$  は場合によりハロゲン及び  $C_3 - C_6$  - シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基でさらにモノ置換又は多置換されていてもよい  $C_2 - C_{20}$  - ヒドロキシアルキルを表す (但し、この部分のシクロアルキル部分は、場合によりハロゲン及び / 又は  $C_1 - C_4$  - アルキルで置換されていてもよい) 〕

で示されるヒドロキシアルキルジフルオロメチルベンズアニリド。

【請求項 9】

式 (II) の

【化 16】



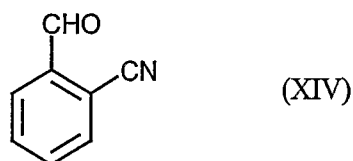
〔式中、 $X^1$  は塩素又はヒドロキシルを表す〕

で示されるジフルオロメチルベンゾイル誘導体。

【請求項 10】

式 (XIV) の

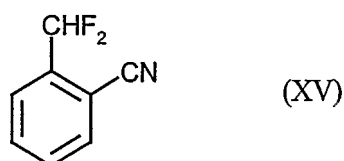
【化 17】



で示される 2 - ホルミルベンゾニトリルを、第一工程で、希釈剤の存在下で (ジエチルアミノ) 硫黄トリフルオリドを用いて弗素化し、

得られた式 (XV) の

【化 18】



で示される 2 - ジフルオロメチルベンゾニトリルを、第二工程で、塩基と反応させ、

場合によっては、この酸を、第三工程で、希釈剤の存在下で塩素化剤と反応させて、対応する酸塩化物を得ることを特徴とする、請求項 9 に記載の式 (II) で示されるジフルオロメチルベンゾイル誘導体の製造法。