

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2009 年 1 月 22 日 (22.01.2009)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2009/011305 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 213/81 (2006.01) A01P 3/00 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)

(74) 代理人: 田中 光雄, 外 (TANAKA, Mitsuo et al.); 〒
5400001 大阪府大阪市中央区城見 1 丁目 3 番 7 号
IMP ビル 青山特許事務所 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2008/062573

(22) 国際出願日: 2008 年 7 月 11 日 (11.07.2008)

(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2007-184033 2007 年 7 月 13 日 (13.07.2007) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化学株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁目 2 7 番 1 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): 小森 岳 (KOMORI, Takashi) [JP/JP]; 〒5610802 大阪府豊中市曽根東町 2-1-1-8-107 Osaka (JP). 久保田 真由美 (KUBOTA, Mayumi) [JP/JP]; 〒5610802 大阪府豊中市曽根東町 2-1-0-4-442 Osaka (JP). 松崎 雄一 (MATSUZAKI, Yuichi) [JP/JP]; 〒5600021 大阪府豊中市本町 8-7-20-318 Osaka (JP).

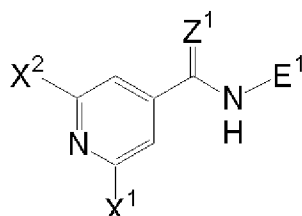
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN,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

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, 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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

(54) Title: AMIDE COMPOUND AND METHOD FOR CONTROLLING PLANT DISEASE USING THE SAME

(54) 発明の名称: アミド化合物とその植物病害防除方法



(1)

(57) Abstract: Disclosed is a plant disease control agent containing an amide compound represented by the formula (1) below which has an excellent plant disease controlling effect as an active ingredient. (In the formula, X¹, X², Z¹ and E¹ are as defined in the description.)

(57) 要約: 優れた植物病害防除効力を有する、式 (1): [式中、X¹、X²、Z¹ 及び E¹ 等は、明細書中に記載の定義を表す。] で示されるアミド化合物を有効成分として含有する植物病害防除剤を提供するものである。

WO 2009/011305 A1

明 細 書

アミド化合物とその植物病害防除方法

技術分野

[0001] 本発明は、アミド化合物とその植物病害防除方法に関する。

背景技術

[0002] 従来、多くの植物病害防除剤が開発され、実用に供されている。しかしながら、これらの植物病害防除剤は、必ずしも十分な防除効力を示さない場合がある。

発明の開示

発明が解決しようとする課題

[0003] 本発明は、優れた植物病害防除効力を有する化合物を提供することを課題とする。

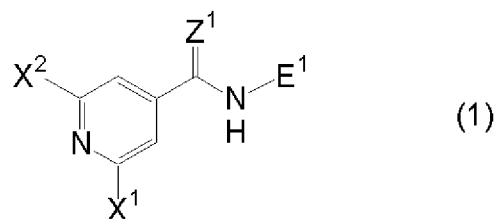
課題を解決するための手段

[0004] 本発明者らは、優れた植物病害防除効力を有する化合物を見出すべく検討の結果、下記式(1)で示されるアミド化合物が、優れた植物病害防除効力を有することを見出し、本発明に至った。

すなわち、本発明は、以下の[1]～[10]を提供するものである。

[1] 式(1):

[化1]



[式中、

X^1 はフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基を表し、

X^2 は水素原子、フッ素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、C1-C4ハロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ヒドロキシアルキル基、シアノ基、ホルミル基、 NR^3R^4 基、 CO_2R^5

基、 CONR^6R^7 基、又は、メチル基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいフェニル基を表し、

Z^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、

E^1 は A^1-Cy^1 で示される基又は $\text{A}^2-\text{CR}^8\text{R}^9\text{R}^{10}$ で示される基を表し、

A^1 は単結合、メチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、シクロプロピリデン、又は、C1-C3ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基及びC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンを表し、

A^2 はメチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C1-C3ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基及びC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンを表し、

Cy^1 は下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルケニル基、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよく、かつ環を形成するメチレンの1つがカルボニル基に置換されたC3-C6シクロアルキル基又は下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6ヒドロキシイミノシクロアルキル基を表し、

R^1 及び R^2 は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表し、

R^3 及び R^4 は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表し、

R^5 はC1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基又はC3-C4アルキニル基を表し、

R^6 は水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル

基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表し、

R^7 は水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基又はC2-C4ハロアルキル基を表し、

R^8 及び R^9 は独立してC1-C4アルキル基を表し、

R^{10} は水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基、カルボキシ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C2-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基、(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基、(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基、メルカプト基、カルバモイル基、C2-C6シアノアルキル基、C1-C3アルキルスルホニル基又は $NR^{11}R^{12}$ 基[式中、 R^{11} 及び R^{12} は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。]を表す。

群[a-1]:

ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシ基、シアノ基、カルボキシ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基、(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基、(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基、メルカプト基、カルバモイル基、ホルミル基、C2-C6シアノアルキル基、C1-C3アルキルスルホニル基、フェノキシ基又は $NR^{13}R^{14}$ 基[式中、 R^{13} 及び R^{14} は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。]]で示されるアミド化合物(以下、本発明化合物と記す場合もある。)

[2] A^1 が単結合、メチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンであり、

A^2 がメチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンであり、

R^{10} が水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C3アルキルチオ基又はC1-C6ヒドロキシアルキル基であり、

群[a-1]が、

ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基である

[1]記載のアミド化合物。

[3] A^1 が単結合、メチレン又は $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ であり、

A^2 がメチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 又は $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ であり、

R^{10} が水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C3アルキルチオ基又はC1-C6ヒドロキシアルキル基であり、

Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基、又は、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルケニル基である[1]又は[2]記載のアミド化合物。

[4] E^1 が $A^1-\text{Cy}^1$ で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンであり、

群[a-1]が、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基である[1]又は[2]記載のアミド化合物。

[5] E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-CH(CH_2CH_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレン基であり、 R^{10} が水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C3アルキルチオ基又はC1-C6ヒドロキシアルキル基である[1]又は[2]記載のアミド化合物。

[6] X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基であり、 R^1 が水素原子又はC1-C4アルキル基であり、 R^2 が水素原子又はC1-C4アルキル基であり、 Z^1 が酸素原子である[1]～[5]のいずれか一項記載のアミド化合物。

[7] X^1 がフッ素原子、メトキシ基又はアミノ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、メトキシ基、メチルチオ基又はアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子である[1]～[5]のいずれか一項記載のアミド化合物。

[8] [1]～[7]記載のアミド化合物を含有することを特徴とする植物病害防除組成物。

[9] [1]～[7]記載のアミド化合物の有効量を植物又は土壤に施用することを特徴とする植物病害の防除方法。

以下、[8]に記載の植物病害防除組成物を本発明防除組成物と記し、[9]に記載の植物病害の防除方法を本発明防除方法と記す場合がある。

発明の効果

[0005] 本発明により、植物病害を防除することができる。

発明を実施するための最良の形態

[0006] 本発明化合物は、上記式(1)で示されるアミド化合物である。

式(1)において、 X^1 はフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基を表す。

X^1 で示されるC1-C4アルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、1-メチルエトキシ基、1, 1-ジメチルエトキシ基、プロポキシ基、1-メチルプロポキシ基、2-メチルプロポキシ基、ブトキシ基等が挙げられる。

X^1 で示されるC3-C4アルケニルオキシ基としては、1-プロペニルオキシ基、2-プロペニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基等が挙げられる。

X^1 で示されるC3-C4アルキニルオキシ基としては、1-プロピニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基等が挙げられる。

[0007] R^1 及び R^2 は、独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。

R^1 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^1 で示されるC3-C4アルケニル基としては、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

R^1 で示されるC3-C4アルキニル基としては、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R^1 で示されるC2-C4ハロアルキル基としては、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

R^1 で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^1 で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカル

ボニル基等が挙げられる。

R^1 で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

[0008] R^2 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基及び1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^2 で示されるC3-C4アルケニル基としては、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

R^2 で示されるC3-C4アルキニル基としては、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R^2 で示されるC2-C4ハロアルキル基としては、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

R^2 で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^2 で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^2 で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

[0009] NR^1R^2 基としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、2-プロペニルアミノ基、2-プロピニルアミノ基、2-クロロエチルアミノ基、アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、1, 1-ジメチルエチルカルボニルアミノ基、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メタンスルホニルアミノ基、N-アセチル-N-メチルアミノ基、N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ基、メタンスルホニ

ルメチルアミノ基等が挙げられる。

[0010] 式(1)において、 X^2 は、水素原子、フッ素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、C1-C4ハロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ヒドロキシアルキル基、シアノ基、ホルミル基、 NR^3R^4 基、 CO_2R^5 基、 $CONR^6R^7$ 基、又は、メチル基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいフェニル基を表す。

X^2 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

X^2 で示されるC2-C4アルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

X^2 で示されるC2-C4アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

X^2 で示されるC1-C4ハロアルキル基としては、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

X^2 で示されるC1-C4アルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、1-メチルエトキシ基、1, 1-ジメチルエトキシ基、プロポキシ基、1-メチルプロポキシ基、2-メチルプロポキシ基、ブトキシ基等が挙げられる。

X^2 で示されるC1-C4アルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、1-メチルエチルチオ基、1, 1-ジメチルエチルチオ基、プロピルチオ基、1-メチルプロピルチオ基等が挙げられる。

X^2 で示されるC1-C4ヒドロキシアルキル基としては、ヒドロキシメチル基、1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基等が挙げられる。

X^2 で示される、メチル基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群より選ば

れる少なくとも1個の基で置換されていてもよいフェニル基としては、フェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-ニトロフェニル基等が挙げられる。

[0011] R^3 及び R^4 は、独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。

R^3 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^3 で示されるC3-C4アルケニル基としては、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

R^3 で示されるC3-C4アルキニル基としては、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R^3 で示されるC2-C4ハロアルキル基としては、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

R^3 で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^3 で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^3 で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

[0012] R^4 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^4 で示されるC3-C4アルケニル基としては、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

R^4 で示されるC3-C4アルキニル基としては、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R^4 で示されるC2-C4ハロアルキル基としては、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

R^4 で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^4 で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^4 で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

NR^3R^4 基としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、2-プロペニルアミノ基、2-プロピニルアミノ基、2-クロロエチルアミノ基、アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、1, 1-ジメチルエチルカルボニルアミノ基、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メタンスルホニルアミノ基、N-アセチル-N-メチルアミノ基、N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ基、メタンスルホニルメチルアミノ基等が挙げられる。

[0013] CO_2R^5 基の R^5 は、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基又はC3-C4アルキニル基を表す。

R^5 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^5 で示されるC3-C4アルケニル基としては、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

上記R⁵で示されるC3-C4アルキニル基としては、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

- [0014] CONR⁶R⁷基のR⁶は、水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。

R⁶で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R⁶で示されるC3-C4アルケニル基としては、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

R⁶で示されるC3-C4アルキニル基としては、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R⁶で示されるC2-C4ハロアルキル基としては、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

R⁶で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R⁶で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R⁶で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

- [0015] CONR⁶R⁷基のR⁷は、水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基又はC2-C4ハロアルキル基を表す。

R⁷で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R⁷で示されるC3-C4アルケニル基としては、1-プロペニル基、2-プロペニル基

、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

上記 R^7 で示されるC3-C4アルキニル基としては、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R^7 で示されるC2-C4ハロアルキル基としては、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

$CONR^6R^7$ 基としては、カルバモイル基、メチルカルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、エチルメチルカルバモイル基、(2-プロペニル)カルバモイル基、(2-プロピニル)カルバモイル基、2-クロロエチルカルバモイル基等が挙げられる。

[0016] 式(1)において、 Z^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 E^1 は A^1-Cy^1 で示される基又は $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基を表す。

[0017] A^1 は単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-CH(CH_2CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、シクロプロピリデン、又は、C1-C3ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基及びC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレン(以下、このメチレンを「置換メチレン a^1 」と言うことがある。)を表す。

置換メチレン a^1 におけるC1-C3ハロアルキル基としては、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

置換メチレン a^1 におけるC2-C4アルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

置換メチレン a^1 におけるC2-C4アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

置換メチレン a^1 におけるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

置換メチレン^{a1}としては、具体的には、2, 2, 2-トリフルオロエタン-1, 1-ジイル基、2, 2-ジフルオロエタン-1, 1-ジイル基、2-フルオロエタン-1, 1-ジイル基、3, 3, 3-トリフルオロプロパン-1, 1-ジイル基、2, 2, 2-トリクロロエタン-1, 1-ジイル基、2, 2-ジクロロエタンジイル基、2-クロロエタン-1, 1-ジイル基、2-プロペン-1, 1-ジイル基、2-ブテン-1, 1-ジイル基、3-メチル-2-ブテン-1, 1-ジイル基、2-プロピン-1, 1-ジイル基、2-ブチン-1, 1-ジイル基、3-ブチン-1, 1-ジイル基、シアノメチレン基、(メキシカルボニル)メチレン基、(エトキシカルボニル)メチレン基、(1-メチルエトキシカルボニル)メチル基等が挙げられる。

[0018] 上記Cy¹は下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルケニル基、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよく、かつ環を形成するメチレンの1つがカルボニル基に置換されたC3-C6シクロアルキル基(このシクロアルキル基を、以下、「置換シクロアルキル基」と称することがある)、又は、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6ヒドロキシイミノシクロアルキル基を表す。

上記群[a-1]:

ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、カルボキシル基、C2-C5アルコキシカルボニル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基、(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基、(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基、メルカプト基、カルバモイル基、ホルミル基、C2-C6シアノアルキル基、C1-C3アルキルスルホニル基、フェノキシ基又はNR¹³R¹⁴基。

[0019] 以下、「群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよい」という記載を、単に「群[a-1]の基で置換されていてもよい」と略記することがある。

本明細書において、特に断りのない限り、「で置換されていてよい」とは、1以上の水素原子が列挙した置換基に置換されていてよいことを意味する。

[0020] 群[a-1]におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。

群[a-1]におけるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC2-C4アルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC2-C4アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC1-C6アルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC3-C6アルケニルオキシ基としては、2-プロペニルオキシ基、1-メチル-2-プロペニルオキシ基、2-メチル-2-プロペニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、2-ヘキセニルオキシ基、5-ヘキセニルオキシ基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC1-C6ハロアルキル基としては、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、クロロフルオロメチル基、ブロモジフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC1-C6ハロアルコキシ基としては、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、フルオロ

メトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、5-クロロペンチルオキシ基、4-フルオロイソペンチルオキシ基、2, 2-ジクロロヘキシルオキシ基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC1-C3アルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、1-メチルエチルチオ基、プロピルチオ基等が挙げられる。

群[a-1]における、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基としては、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するメチレン、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するエチリデン、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するイソプロピリデン、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するプロピリデン等が挙げられる。

群[a-1]におけるC1-C6ヒドロキシアルキル基としては、ヒドロキシメチル基、1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシプロピル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC2-C4アルキルカルボニルオキシ基としては、アセトキシ基、エチルカルボニルオキシ基、1-メチルエチルカルボニルオキシ基、プロピルカルボニルオキシ基等が挙げられる。

群[a-1]における(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基としては、N-メチルアミノメチル基、N-エチルアミノメチル基、1-(N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-メチルアミノ)エチル基、1-(N-エチルアミノ)エチル基等が挙げられる。

群[a-1]における(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基としては、N, N-ジメチルアミノメチル基、1-(N, N-ジメチルアミノ)エチル基、2-(N, N-ジメチルアミノ)エチル基、N, N-ジエチルアミノメチル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC2-C6シアノアルキル基としては、シアノメチル基、1-シアノエチル基、2-シアノエチル基等が挙げられる。

群[a-1]におけるC1-C3アルキルスルホニル基としては、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基等が挙げられる。

[0021] R^{13} 及び R^{14} は、独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を

表す。

R^{13} で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^{13} で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^{13} で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{13} で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

[0022] R^{14} で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^{14} で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^{14} で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{14} で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

$NR^{13}R^{14}$ 基としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、1, 1-ジメチルエチルカルボニルアミノ基、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニルアミノ基、メタンスルホニルアミノ基、N-アセチル-N-メチルアミノ基、N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ基、メタンスルホニルメチルアミノ基等が挙げら

れる。

[0023] 群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基における、C3-C6シクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が挙げられる。

群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルケニル基における、C3-C6シクロアルケニル基としては、2-シクロプロペニル基、1-シクロブテニル基、2-シクロブテニル基、1-シクロペンテニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基が挙げられる。

置換シクロアルキル基としては、2-オキソシクロプロピル基、2-オキソシクロブチル基、3-オキソシクロブチル基、2-オキソシクロペンチル基、3-オキソシクロペンチル基、2-オキソシクロヘキシル基、3-オキソシクロヘキシル基、4-オキソシクロヘキシル基等が挙げられる。

群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6ヒドロキシイミノシクロアルキル基における、C3-C6ヒドロキシイミノシクロアルキル基としては、2-ヒドロキシイミノシクロプロピル基、2-ヒドロキシイミノシクロブチル基、3-ヒドロキシイミノシクロブチル基、2-ヒドロキシイミノシクロペンチル基、3-ヒドロキシイミノシクロペンチル基、2-ヒドロキシイミノシクロヘキシル基、3-ヒドロキシイミノシクロヘキシル基、4-ヒドロキシイミノシクロヘキシル基等が挙げられる。

[0024] A^1-Cy^1 で示される基としては、例えば、以下の基が挙げられる。

シクロプロピル基、2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル基；

シクロブチル基；

シクロペンチル基、2-メチルシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ブロモシクロペンチル基、2, 2-ジメチルシクロペンチル基、2-フルオロ-2-メチルシクロペンチル基、2-クロロ-2-メチルシクロペンチル基、2-ヒドロキシ-2-メチルシクロペンチル基、2, 2-ジフルオロシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基；

シクロヘキシル基、1-メチルシクロヘキシル基、2-メチルシクロヘキシル基、3-メ

チルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、2-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、2, 2-ジメチルシクロヘキシル基、2-フルオロ-2-メチルシクロヘキシル基、2-クロロ-2-メチルシクロヘキシル基、2-ヒドロキシ-2-メチルシクロヘキシル基、2, 2-ジフルオロシクロヘキシル基、2, 3-ジメチルシクロヘキシル基、2, 6-ジメチルシクロヘキシル基、2-エチルシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-ブロモシクロヘキシル基、2-ヨードシクロヘキシル基、2-ヒドロキシシクロヘキシル基、1-シアノシクロヘキシル基、2-シアノシクロヘキシル基、1-カルボキシシクロヘキシル基、1-(メトキシカルボニル)シクロヘキシル基、1-(エトキシカルボニル)シクロヘキシル基、2-(メトキシカルボニル)シクロヘキシル基、2-(エトキシカルボニル)シクロヘキシル基；

[0025] シクロプロピルメチル基、(1-メチルシクロプロピル)メチル基、(2-メチルシクロプロピル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロプロピル)メチル基、(2-ヒドロキシシクロプロピル)メチル基、(2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル)メチル基、(1-フルオロシクロプロピル)メチル基、(1-クロロシクロプロピル)メチル基、(1-シアノシクロプロピル)メチル基、(1-エトキシカルボニルシクロプロピル)メチル基、(1-メトキシカルボニルシクロプロピル)メチル基；

シクロブチルメチル基、(1-メチルシクロブチル)メチル基、(2-メチルシクロブチル)メチル基、(3-メチルシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(2-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(3-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-フルオロシクロブチル)メチル基、(1-クロロシクロブチル)メチル基、(1-シアノシクロブチル)メチル基、(1-エトキシカルボニルシクロブチル)メチル基、(1-メトキシカルボニルシクロブチル)メチル基；

シクロペンチルメチル基、(1-メチルシクロペンチル)メチル基、(2-メチルシクロペンチル)メチル基、(3-メチルシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(2-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(3-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-フルオロシクロペンチル)メチル基、(1-クロロシクロペンチル)メチル基、(1-シアノシクロペンチル)メチル基、(1-エトキシカルボニルシクロペンチル)メチル基、(1-メトキシカルボニルシクロペンチル)メチル基；

シクロヘキシルメチル基、(1-メチルシクロヘキシル)メチル基、(2-メチルシクロヘキシル)メチル基、(3-メチルシクロヘキシル)メチル基、(4-メチルシクロヘキシル)メチル基、(2, 3-ジメチルシクロヘキシル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、(2-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、(3-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、(4-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、(1-フルオロシクロヘキシル)メチル基、(1-クロロシクロヘキシル)メチル基、(1-シアノシクロヘキシル)メチル基、(1-エトキシカルボニルシクロヘキシル)メチル基、(1-メトキシカルボニルシクロヘキシル)メチル基、(1-エチニルシクロヘキシル)メチル基、(2-フルオロシクロヘキシル)メチル基、(2-クロロシクロヘキシル)メチル基、(2-シアノシクロヘキシル)メチル基、(2-エトキシカルボニルシクロヘキシル)メチル基、(2-メトキシカルボニルシクロヘキシル)メチル基；

[0026] 1-(シクロプロピル)エチル基、1-(1-メチルシクロプロピル)エチル基、1-(2-メチルシクロプロピル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロプロピル)エチル基、1-(2-ヒドロキシシクロプロピル)エチル基、1-(2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル)エチル基、1-(1-フルオロシクロプロピル)エチル基、1-(1-クロロシクロプロピル)エチル基、1-(1-シアノシクロプロピル)エチル基、1-(1-エトキシカルボニルシクロプロピル)エチル基、1-(1-メトキシカルボニルシクロプロピル)エチル基；
1-(シクロブチル)エチル基、1-(1-メチルシクロブチル)エチル基、1-(2-メチルシクロブチル)エチル基、1-(3-メチルシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(2-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(3-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-フルオロシクロブチル)エチル基、1-(1-クロロシクロブチル)エチル基、1-(1-シアノシクロブチル)エチル基、1-(1-エトキシカルボニルシクロブチル)エチル基、1-(1-メトキシカルボニルシクロブチル)エチル基；

1-(シクロペンチル)エチル基、1-(1-メチルシクロペンチル)エチル基、1-(2-メチルシクロペンチル)エチル基、1-(3-メチルシクロペンチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基、1-(2-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基、1-(3-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基、1-(1-フルオロシクロペンチル)エチル基、

チル基、1-(1-クロロシクロペンチル)エチル基、1-(1-シアノシクロペンチル)エチル基、1-(1-エトキシカルボニルシクロペンチル)エチル基、1-(1-メトキシカルボニルシクロペンチル)エチル基；

1-(シクロヘキシル)エチル基、1-(1-メチルシクロヘキシル)エチル基、1-(2-メチルシクロヘキシル)エチル基、1-(3-メチルシクロヘキシル)エチル基、1-(4-メチルシクロヘキシル)エチル基、1-(2,3-ジメチルシクロヘキシル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基、1-(2-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基、1-(3-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基、1-(4-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基、1-(1-フルオロシクロヘキシル)エチル基、1-(1-クロロシクロヘキシル)エチル基、1-(1-シアノシクロヘキシル)エチル基、1-(1-エトキシカルボニルシクロヘキシル)エチル基、1-(1-メトキシカルボニルシクロヘキシル)エチル基、1-(1-エチニルシクロヘキシル)エチル基、1-(2-フルオロシクロヘキシル)エチル基、1-(2-クロロシクロヘキシル)エチル基、1-(2-シアノシクロヘキシル)エチル基、1-(2-エトキシカルボニルシクロヘキシル)エチル基、1-(2-メトキシカルボニルシクロヘキシル)エチル基；

[0027] 1-メチル-1-シクロプロピルエチル基、1-メチル-1-シクロブチルエチル基、1-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-メチル-1-(1-フルオロシクロブチル)エチル基、1-メチル-1-シクロペンチルエチル基、1-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基、1-メチル-1-(1-フルオロシクロペンチル)エチル基、1-メチル-1-シクロヘキシルエチル基、1-メチル-1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基、1-メチル-1-(1-フルオロシクロヘキシル)エチル基、

(1-ヒドロキシメチルシクロプロピル)メチル基、(1-ヒドロキシメチルシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシメチルシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)メチル基、(1-シクロヘキセニル)メチル基、(2-シクロヘキセニル)メチル基、(3-シクロヘキセニル)メチル基、(1-シクロペンテニル)メチル基、(2-シクロペンテニル)メチル基、(1-ジメチルアミノシクロプロピル)メチル基、(1-ジメチルアミノシクロブチル)メチル基、(1-ジメチルアミノシクロペンチル)メチル基、(1-ジメ

チルアミノシクロヘキシル)メチル基、
 (1-アセトキシシクロプロピル)メチル基、(1-アセトキシシクロブチル)メチル基、(1-アセトキシシクロペンチル)メチル基、(1-アセトキシシクロヘキシル)メチル基、
 (2-アセトキシシクロヘキシル)メチル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基、2-メトキシシクロプロピル基、2-メトキシシクロブチル基、2-メトキシシクロペンチル基、2-メトキシシクロヘキシル基、3-メトキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、(1-メトキシシクロヘキシル)メチル基、(2-メトキシシクロヘキシル)メチル基、2-アセトキシシクロブチル基、2-アセトキシシクロペンチル基、2-アセトキシシクロヘキシル基、2-メチルチオシクロブチル基、2-メチルチオシクロペンチル基、2-メチルチオシクロヘキシル基、2-(1, 1-ジメチルエトキシカルボニルアミノ)シクロブチル基、2-(1, 1-ジメチルエトキシカルボニルアミノ)シクロペンチル基、2-(1, 1-ジメチルエトキシカルボニルアミノ)シクロヘキシル基、2-アミノシクロブチル基、2-アミノシクロペンチル基、2-アミノシクロヘキシル基、2-アセチルアミノシクロブチル基、2-アセチルアミノシクロペンチル基、2-アセチルアミノシクロヘキシル基、2-ジメチルアミノシクロブチル基、2-ジメチルアミノシクロペンチル基、2-ジメチルアミノシクロヘキシル基、2-フェニルシクロブチル基、2-フェニルシクロペンチル基、2-フェニルシクロヘキシル基、2-ベンジルシクロブチル基、2-ベンジルシクロペンチル基、2-ベンジルシクロヘキシル基、2-トリフルオロメチルシクロブチル基、2-トリフルオロメチルシクロペンチル基、2-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、2-ヒドロキシメチルシクロブチル基、2-ヒドロキシメチルシクロペンチル基、2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル基、2-メチレンシクロヘキシル基、3-メチレンシクロヘキシル基、4-メチレンシクロヘキシル基、2-メチレンシクロペンチル基、3-メチレンシクロペンチル基、2-オキソシクロヘキシル基、3-オキソシクロヘキシル基、4-オキソシクロヘキシル基、2-オキソシクロペンチル基、3-オキソシクロペンチル基、2-ヒドロキシイミノシクロヘキシル基及び2-ヒドロキシイミノシクロペンチル基等。

[0028] A^2 は、メチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C1-C3ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基及

びC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレン(以下、このメチレンを「置換メチレン a^2 」と言うことがある。)を表す。

置換メチレン a^2 におけるC1-C3ハロアルキル基としては、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2-フルオロエチル基、3-フルオロプロピル基、1-クロロエチル基等が挙げられる。

置換メチレン a^2 におけるC2-C4アルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基及び3-ブテニル基等が挙げられる。

置換メチレン a^2 におけるC2-C4アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

置換メチレン a^2 におけるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

置換メチレン a^2 としては、具体的には、2, 2, 2-トリフルオロエタン-1, 1-ジイル基、2, 2-ジフルオロエタン-1, 1-ジイル基、2-フルオロエタン-1, 1-ジイル基、3, 3, 3-トリフルオロプロパン-1, 1-ジイル基、2, 2, 2-トリクロロエタン-1, 1-ジイル基、2, 2-ジクロロエタンジイル基、2-クロロエタン-1, 1-ジイル基、2-プロペン-1, 1-ジイル基、2-ブテン-1, 1-ジイル基、3-メチル-2-ブテン-1, 1-ジイル基、2-プロピン-1, 1-ジイル基、2-ブチン-1, 1-ジイル基、3-ブチン-1, 1-ジイル基、シアノメチレン基、(メトキシカルボニル)メチレン基、(エトキシカルボニル)メチレン基、(1-メチルエトキシカルボニル)メチル基等が挙げられる。

[0029] $A^2-CR^8R^9R^{10}$ の R^8 及び R^9 は、独立してC1-C4アルキル基を表す。

R^8 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^9 で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^{10} は水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基、カルボキシ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C2-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基、(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基、(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基、メルカプト基、カルバモイル基、C2-C6シアノアルキル基、C1-C3アルキルスルホニル基又は $NR^{11}R^{12}$ 基を表す。

[0030] R^{10} で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^{10} で示されるC2-C4アルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等が挙げられる。

R^{10} で示されるC2-C4アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、3-ブチニル基等が挙げられる。

R^{10} で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{10} で示されるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。

R^{10} で示されるC1-C6アルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基等が挙げられる。

R^{10} で示されるC3-C6アルケニルオキシ基としては、2-プロペニルオキシ基、1-メチル-2-プロペニルオキシ基、2-メチル-2-プロペニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、2-ヘキセニルオキシ基、5-ヘキセニルオキシ基等が挙げられる。

R^{10} で示されるC1-C6ハロアルキル基としては、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、クロロフルオロメチル基、ブロモジフ

ルオロメチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基等が挙げられる。

R¹⁰で示されるC2-C6ハロアルコキシ基としては、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、フルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、5-クロロペンチルオキシ基、4-フルオロイソペンチルオキシ基、2, 2-ジクロロヘキシルオキシ基等が挙げられる。

R¹⁰で示されるC1-C3アルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、1-メチルエチルチオ基、プロピルチオ基等が挙げられる。

R¹⁰で示されるC1-C6ヒドロキシアルキル基としては、ヒドロキシメチル基、1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシプロピル基等が挙げられる。

R¹⁰で示されるC2-C4アルキルカルボニルオキシ基としては、アセトキシ基、エチルカルボニルオキシ基、1-メチルエチルカルボニルオキシ基、プロピルカルボニルオキシ基等が挙げられる。

R¹⁰で示される(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基としては、N-メチルアミノメチル基、N-エチルアミノメチル基、1-(N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-メチルアミノ)エチル基、1-(N-エチルアミノ)エチル基等が挙げられる。

R¹⁰で示される(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基としては、N, N-ジメチルアミノメチル基、1-(N, N-ジメチルアミノ)エチル基、2-(N, N-ジメチルアミノ)エチル基、N, N-ジエチルアミノメチル基等が挙げられる。

R¹⁰で示されるC2-C6シアノアルキル基としては、シアノメチル基、1-シアノエチル基、2-シアノエチル基等が挙げられる。

R¹⁰で示されるC1-C3アルキルスルホニル基としては、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基等が挙げられる。

[0031] R¹¹及びR¹²は、独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。

R^{11} で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^{11} で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^{11} で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{11} で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

[0032] R^{12} で示されるC1-C4アルキル基としては、メチル基、エチル基、1-メチルエチル基、1, 1-ジメチルエチル基、プロピル基、1-メチルプロピル基等が挙げられる。

R^{12} で示されるC2-C5アルキルカルボニル基としては、アセチル基、エチルカルボニル基、1-メチルエチルカルボニル基、1, 1-ジメチルエチルカルボニル基等が挙げられる。

R^{12} で示されるC2-C5アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、1-メチルエトキシカルボニル基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{12} で示されるC1-C4アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、1-メチルエチルスルホニル基、1, 1-ジメチルエチルスルホニル基等が挙げられる。

$NR^{11}R^{12}$ 基としては、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、1, 1-ジメチルエチルカルボニルアミノ基、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、1, 1-ジメチルエトキシカルボニルアミノ基、メタンスルホニルアミノ基、N-アセチル-N-メチルアミノ基、N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ基、メタンスルホニルメチルアミノ基等が挙げられる。

[0033] $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基としては、例えば、2-メチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1, 2, 2-トリメチルプロピル基、1, 1, 2, 2-テトラメチルプロピル基、2-メチル-2-ヒドロキシプロピル基、1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシプロピル基、2-クロロ-1, 2-ジメチルプロピル基、2-クロロ-2-メチルプロピル基、1, 2-ジメチルブチル基、2, 2-ジメチル-3-ヒドロキシプロピル基、3-ヒドロキシ-1, 2, 2-トリメチルプロピル基等が挙げられる。

[0034] 式(1)で示されるアミド化合物の態様としては、例えば以下のものが挙げられる。

式(1)において、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がメキシ基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がアミノ基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 Z が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 Z が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0035] 式(1)において、 X^2 が水素原子、フッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物；

式(1)において、 X^2 が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^2 がフッ素原子であるアミド化合物；

[0036] 式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がメキシ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がアミノ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がメキシ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がアミノ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^3R^4 基(R^3 および R^4 は、上記定義と同じ。)であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

[0037] 式(1)において、 X^1 がフッ素原子、 $C1-C4$ アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 X^2 が水素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 が水素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であり、 X^2 が水素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 X^1 がメキシ基であり、 X^2 が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がアミノ基であり、 X^2 が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 X^2 が水素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 が水素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であり、 X^2 が水素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がメキシ基であり、 X^2 が水素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がアミノ基であり、 X^2 が水素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0038] 式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 X^2 がフッ素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 がフッ素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であり、 X^2 がフッ素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がメキシ基であり、 X^2 がフッ素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がアミノ基であり、 X^2 がフッ素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 X^2 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子であり、 X^2 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がメキシ基であり、 X^2 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子である

アミド化合物；

式(1)において、 X^1 がアミノ基であり、 X^2 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0039] 式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 (A^1 および Cy^1 は、上記定義と同じ。)で示される基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン又は $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 は上記定義と同じアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合であり、 Cy^1 は上記定義と同じアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 がメチレンであり、 Cy^1 は上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 は上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 は上記定義と同じであり、 Cy^1 が群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 は上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基及びC1-C6ヒドロキシアルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 は上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、ヒドロキシル基及びシアノ基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が、2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキ

シル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基、2-ヒドロキシシクロヘキシル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基又は2-ヒドロキシシクロヘキシル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であるアミド化合物；

[0040] 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロヘキシル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-クロロシクロヘキシル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロヘキシルメチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-シクロヘキシルエチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-シクロブチルエチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基であるアミド化合物；

[0041] 式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ (A^2 、 R^8 、 R^9 および R^{10} は、上記定義と同じ。)

で示される基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が上記定義と同じであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-メチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1, 2, 2-トリメチルプロピル基、2-メチル-2-ヒドロキシプロピル基又は1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシプロピル基であるアミド化合物；

[0042] 式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基(A^1 および Cy^1 は、上記定義と同じ。)であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン又は $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合であり、 Cy^1 が上記定義と同じである、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 がメチレンであり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 が群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基及びC1-C6ヒドロキシアルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、ヒドロキシル基及びシアノ基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0043] 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基、2-ヒドロキシシクロヘキシル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチ

ル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基又は2-ヒドロキシシクロヘキシル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0044] 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロヘキシル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-クロロシクロヘキシル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロヘキシルメチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-シクロヘキシルエチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がフッ

素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-シクロブチルエチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0045] 式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基(A^2 、 R^8 、 R^9 および R^{10} は、上記定義と同じ。)であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が上記定義と同じであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上

記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-メチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1, 2, 2-トリメチルプロピル基、2-メチル-2-ヒドロキシプロピル基又は1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシプロピル基であり、 X^1 がフッ素原子であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0046] 式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基(A^1 および Cy^1 は、上記定義と同じ。)であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン又は $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 がメチレンであり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン又は $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 が群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がメ

キシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基及びC1-C6ヒドロキシアルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、ヒドロキシル基及びシアノ基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

- [0047] 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基、2-ヒドロキシシクロヘキシル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；
- 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基又は2-ヒドロキシシクロヘキシル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；
- 式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)

ル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

[0048] 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロヘキシル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が2-クロロシクロヘキシル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 がシクロヘキシルメチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が1-シクロヘキシルエチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が1-シクロブチルエチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

[0049] 式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基(A^2 、 R^8 、 R^9 および R^{10} は、上記定義と同じ。)であり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物;

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が上記定義と同じであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-メチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1, 2, 2-トリメチルプロピル基、2-メチル-2-ヒドロキシプロピル基又は1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシプロピル基であり、 X^1 がメトキシ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0050] 式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基(A^1 および Cy^1 は、上記定義と同じ。)であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン又は $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 がメチレンであり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 が群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基及びC1-C6ヒドロキシアルキル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が上記定義と同じであり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、ヒドロキシル基及びシアノ基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0051] 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基、2-ヒドロキシシクロヘキシル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチ

ル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；
式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロペンチル基、2-フルオロシクロペンチル基、2-クロロシクロペンチル基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、2-メチルシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基又は2-ヒドロキシシクロヘキシル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；
式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロペンチル)メチル基、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基、1-シクロブチルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、1-シクロヘキシルエチル基、1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基、1-(1-ヒドロキシシクロペンチル)エチル基又は1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0052] 式(1)において、 E^1 が2-メチルシクロヘキシル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が2-クロロシクロヘキシル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロヘキシルメチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-シクロヘキシルエチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 がシクロブチルメチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-シクロブチルエチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が(1-ヒドロキシシクロブチル)メチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が1-(1-ヒドロキシシクロブチル)エチル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

[0053] 式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基(R^1 および R^2 は、上記定義と同じ。)であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はC1-C4アルコキシ基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はC1-C4アルコキシ基であり、 R^1 及び R^2 が独立して、水素原子、C1-C4アルキル基又はC2-C5アルキルカルボニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はC1-C4アルコキシ基であり、 R^1 及び R^2 が独立して、水素原子、C1-C4アルキル基又はC2-C5アルキルカルボニル基であり、 E^1 が A^1-Cy^1 (A^1 および Cy^1 は、上記定義と同じ。)であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はC1-C4アルコキシ基であり、 R^1 及び R^2 が独立して、水素原子、C1-C4アルキル基又はC2-C5アルキルカルボニル基であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はC1-C4アルコキシ基であり、 R^1 及び R^2 が独立して、水素原子、C1-C4アルキル基又はC2-C5アルキルカルボニル基であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 が群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はC1-C4アルコキシ基であり、 R^1 及び R^2 が独立して、水素原子、C1-C4アルキル基又はC2-C5アルキルカルボニル基であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 が群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はC1-C4アルコキシ基であり、 R^1 及び R^2 が独立して、水素原子、C1-C4アルキル基又はC2-C5アルキルカルボニル基であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

[0054] 式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 が群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 が群[a-1]の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

[0055] 式(1)において、 X^1 がフッ素原子又はC1-C4アルキル基であり、 X^2 が水素原子又はフッ素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子又はC1-C4アルキル基であり、 X^2 が水素原子又はフッ素原子であり、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ (A^2 、 R^8 、 R^9 および R^{10} は、上記定義と同じ。)で示される基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子又はC1-C4アルキル基であり、 X^2 が水素原子又はフッ素原子であり、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子又はC1-C4アルキル基であり、 X^2 が水素原子又はフッ素原子であり、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 および R^9 が上記定義と同じであり、 R^{10} が水素原子又はC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

[0056] 式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 および R^9 が上記定義と同じであり、 R^{10} が水素原子又はC1-C4アルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基 (A^2 、 R^8 、 R^9 および R^{10} は、上記定義と同じ。)であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミ

ド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 、 R^9 および R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が上記定義と同じであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 又は $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレンであり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基であり、 A^2 が $-C(CH_3)_2-$ であり、 R^8 がメチル基であり、 R^9 がメチル基であり、 R^{10} が上記定義と同じであり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；及び

式(1)において、 E^1 が2-メチルプロピル基、1, 2-ジメチルプロピル基、2, 2-ジメチルプロピル基、1, 2, 2-トリメチルプロピル基、2-メチル-2-ヒドロキシプロピル基又は1, 2-ジメチル-2-ヒドロキシプロピル基であり、 X^1 がアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物。

[0057] 本発明化合物としては、更に、以下のものが挙げられる。

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基であり、 R^1 及

び R^2 が、それぞれ水素原子、メチル基又はメキシカルボニル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^2 が水素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 Z^1 が酸素原子であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基又は $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基を表し、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 及び R^9 が、それぞれメチル基であり、 R^{10} が水素原子又はメチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基であり、 R^1 及び R^2 が、それぞれ水素原子、メチル基又はメキシカルボニル基であり、 X^2 が水素原子であり、 Z^1 が酸素原子であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基又は $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基を表し、 A^1 が単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であり、 A^2 が $-CH(CH_3)-$ であり、 R^8 及び R^9 が、それぞれメチル基であり、 R^{10} が水素原子又はメチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^2 が水素原子、フッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^3R^4 基であり、 R^3 及び R^4 が、それぞれ水素原子又はメチル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^3R^4 基であり、 R^1 及び R^2 が、それぞれ水素原子、メチル基又はメキシカルボニル基であり、 R^3 及び R^4 が、それぞれ水素原子又はメチル基であり、 Z^1 が酸素原子であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基を表し、 A^1 が単結合、メチレン又は $-CH(CH_3)-$ であり、 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

[0058] 式(1)において、 X^1 がフッ素原子、アミノ基又はメキシ基であるアミド化合物；

式(1)において、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基を表し、 A^1 が単結合、メチレン又は $-C$

$\text{H}(\text{CH}_3)_-$ であり、 Cy^1 が塩素原子、メチル基又はヒドロキシル基で置換されていて
もよいC5-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^1 がフッ素原子又はメキシ基であり、 X^2 が水素原子であり、 Z^1 が
酸素原子であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示される基を表し、 A^1 が単結合、メチレン又は $-\text{C}$
 $\text{H}(\text{CH}_3)_-$ であり、 Cy^1 が塩素原子、メチル基又はヒドロキシル基で置換されていて
もよいC5-C6シクロアルキル基であるアミド化合物；

式(1)において、 X^2 が水素原子、フッ素原子又はアミノ基であるアミド化合物；及び
式(1)において、 X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 が水素原子、フ
ッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子であり、 E^1 が A^1-Cy^1 で示さ
れる基を表し、 A^1 が単結合、メチレン又は $-\text{CH}(\text{CH}_3)_-$ であり、 Cy^1 がハロゲン原
子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の
基で置換されていてよいC3-C6シクロアルキル基であるアミド化合物。

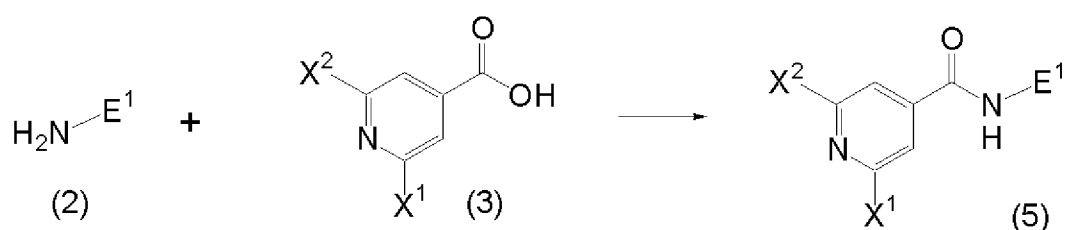
[0059] 本明細書中においては、化合物の構造式が便宜上一定の異性体を表すことがある
が、本発明には化合物の構造上生じる全ての活性な幾何異性体、光学異性体、立
体異性体、互変異性体等の異性体および異性体混合物を含み、便宜上の式の記載
に限定されるものではなく、いずれか一方の異性体でも混合物でもよい。従って、分
子内に不斉炭素原子を有し光学活性体およびラセミ体が存在することがあり得るが、
本発明においては特に限定されず、何れの場合も含まれる。

[0060] 本発明化合物は、例えば以下の(製造法1)～(製造法6)により製造することができる。

[0061] (製造法1)

式(1)で示されるアミド化合物のうち、 Z^1 が酸素原子である化合物(5)は、化合物(2)又はその塩(例えば、塩酸塩)と化合物(3)とを、脱水縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。

[化2]



[式中、 E^1 、 X^1 及び X^2 は上記と同じ定義を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン(以下、THFと記す場合がある。)、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル(以下、MTBEと記す場合がある。)等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸ブチル、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド(以下、DMFと記す場合がある。)等の酸アミド類、ジメチルスルホキシド(以下、DMSOと記す場合がある)等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる脱水縮合剤としては、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩(以下、WSCと記す。)、及び1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、(ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ)トリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(以下、BOP試薬と記す。)等のホスホニウム塩等が挙げられる。

化合物(2)又はその塩1モルに対して、化合物(3)が通常1~3モルの割合、脱水縮合剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

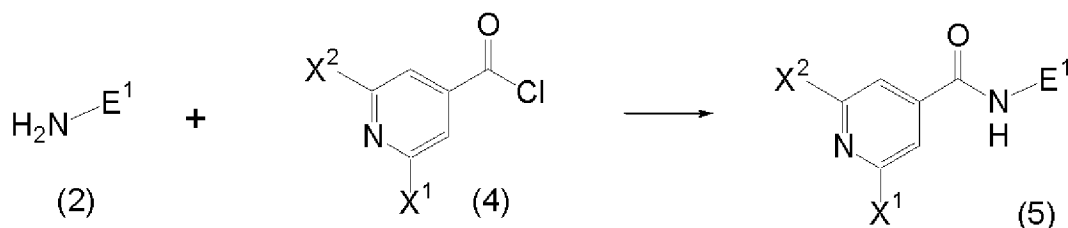
該反応の反応温度は、通常0~140°Cの範囲であり、反応時間は通常1~24時間の範囲である。

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

[0062] (製造法2)

式(1)で示されるアミド化合物のうち、 Z^1 が酸素原子である化合物(5)は、化合物(2)又はその塩(例えば、塩酸塩)と化合物(4)またはその塩酸塩とを、塩基の存在下、反応させることにより製造することができる。

[化3]



〔式中、 E^1 、 X^1 及び X^2 は上記と同じ定義を表す。〕

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

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

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

化合物(2)又はその塩1モルに対して、化合物(4)が通常1～3モルの割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

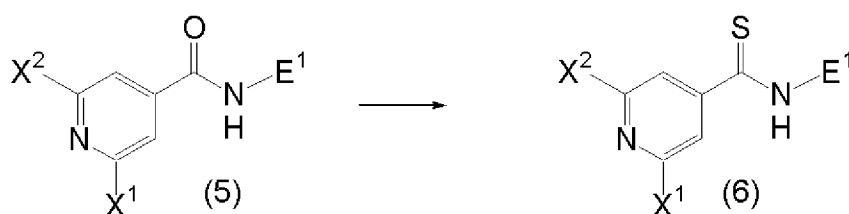
該反応の反応温度は通常 $-20\sim 100^\circ\text{C}$ の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

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

[0063] (製造法3)

式(1)で示されるアミド化合物のうち、 Z^1 が硫黄原子である化合物(6)は、式(1)で示されるアミド化合物のうち Z^1 が酸素原子である化合物(5)と、2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3-ジチア-2,4-ジフォスフェタン-2,4-ジスルフィド(以下、ローソン試薬と記す。)又は五硫化リン等の硫黄化剤とを反応させることにより製造することができる。

[化4]



[式中、 E^1 、 X^1 及び X^2 は上記と同じ定義を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、MTBE等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル、ブチロニトリル等の有機ニトリル類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類及びこれらの混合物が挙げられる。

化合物(5)1モルに対して、硫黄化剤が通常1～2モルの割合で用いられる。

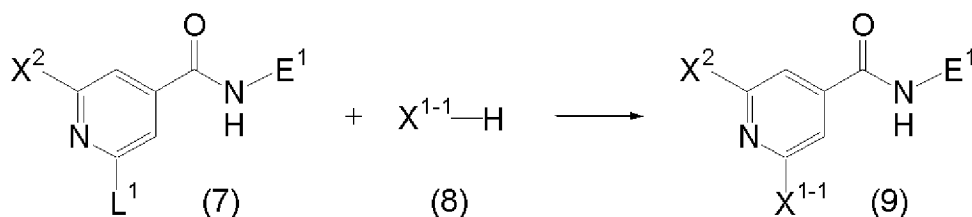
該反応の反応温度は通常25～150℃の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

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

[0064] (製造法4)

式(1)で示されるアミド化合物のうち、 X^1 がC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基であり、 Z^1 が酸素原子である化合物(9)は、化合物(7)と化合物(8)とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

[化5]



[式中、 E^1 及び X^2 は上記と同じ定義を表し、 L^1 はフッ素原子又は塩素原子を表し、 X

$^{1-1}$ はC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基を表し、 R^1 及び R^2 は上記と同じ定義を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

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

反応に用いられる塩基としては、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びカリウム1, 1-ジメチルエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類等が挙げられる。

化合物(7)1モルに対して、化合物(8)が通常1モル～過剰量の割合、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

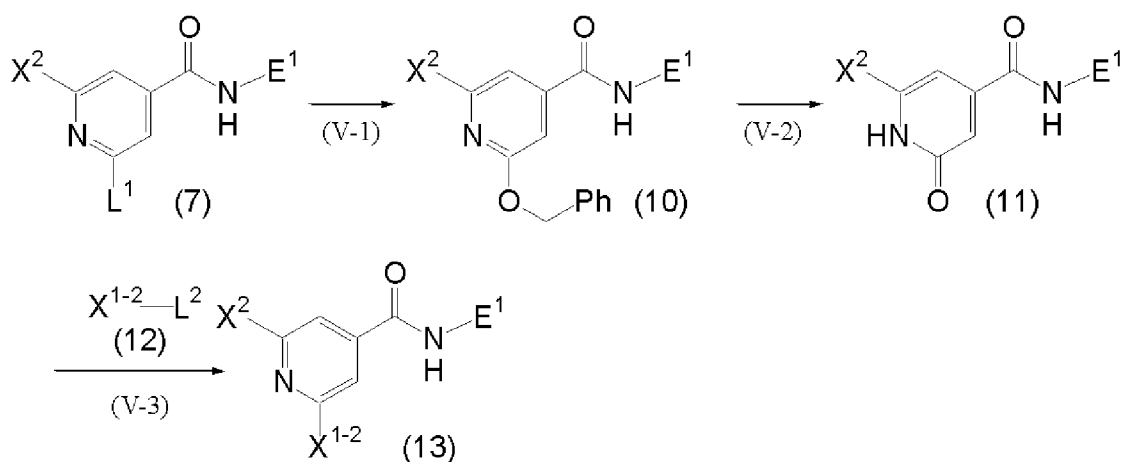
反応終了後は、反応混合物を有機溶剤で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(9)を単離することができる。単離された化合物(9)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

X^{1-1} が NR^1R^2 基である場合には、化合物(8)を溶媒として使用することもできる。

[0065] (製造法5)

式(1)で示されるアミド化合物のうち、式(13)で示される化合物は、下記のスキームに示される方法にて製造することができる。

[化6]



[式中、 E^1 、 L^1 及び X^2 は上記と同じ定義を表し、 L^2 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はメタンスルホニルオキシ基を表し、 X^{1-2} はC1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基又はC3-C4アルキニルオキシ基を表し、Phはフェニル基を表す。]

工程(V-1)

製造法4記載の方法に準じて、化合物(10)は、化合物(7)とベンジルアルコールとを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

[0066] 工程(V-2)

化合物(11)は、化合物(10)をパラジウム炭素存在下、水素と反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸エチル等のエステル類、THF、MTBE等のエーテル類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

化合物(10)1モルに対して、パラジウム炭素が通常0.01~0.1モルの割合、水素が通常1~2モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常0~50℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

該反応で使用する水素の圧力は、通常、常圧~10気圧の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を濾過し、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(11)を単離することができる。単離された化合物(11)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

また、化合物(11)は、化合物(7)と水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物とを反応させることにより、化合物(10)を経由することなく製造することもできる。

[0067] 工程(V-3)

化合物(13)は、化合物(11)と化合物(12)とを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば、トルエン、ヘキサン等の炭化水素類、アセトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、DMF等の酸アミド類及びDMSO等のスルホキシド類が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩類、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等が挙げられる。

化合物(11)1モルに対して、化合物(12)が通常1～3モルの割合、塩基が通常1～3モルの割合で用いられる。

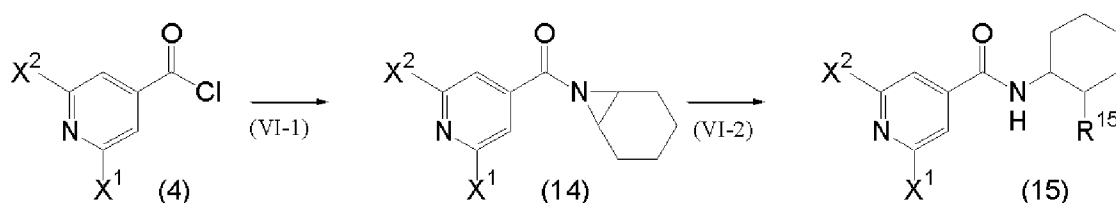
該反応の反応温度は通常0～140℃の範囲であり、反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

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

[0068] (製造法6)

式(1)で示されるアミド化合物のうち、式(15)で示される化合物は、下記のスキームに示される方法にて製造することができる。

[化7]



[式中、 X^1 及び X^2 は上記と同じ定義を表し、 R^{15} はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、シアノ基、C1－C3アルキルチオ基、C1－C6アルコキシ基又はフェノキシ基を表す。]

工程(VI-1)

製造法2記載の方法に準じて、化合物(14)は、化合物(4)と7-アザビシクロ[4.1.0]ヘプタンとを、塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

[0069] 工程(VI-2)

化合物(15)は、化合物(14)と下記に挙げられる試薬とを反応させることにより製造することができる。

該反応に用いられる試薬としては、以下の試薬が挙げられる。

- R^{15} がフッ素原子である場合、フッ化カリウム、フッ化リチウム等のアルカリ金属フッ化物、フッ化カルシウム等のアルカリ土類金属フッ化物、テトラブチルアンモニウムフロリド等の4級アンモニウムフロリド類及びフッ化水素等のフッ素化剤。

- R^{15} が塩素原子である場合、塩化ナトリウム、塩化リチウム等のアルカリ金属塩化物、塩化マグネシウム等のアルカリ土類金属塩化物、塩化アルミニウム、塩化亜鉛(II)等の金属塩化物、テトラブチルアンモニウムクロリド等の4級アンモニウムクロリド、トリメチルシリルクロリド等の有機ケイ素塩化物、塩化チオニル等の硫黄化合物、オキシ塩化リン、三塩化リン、五塩化リン等のリン化合物及び塩化水素等の塩素化剤。

- R^{15} が臭素原子である場合、臭化ナトリウム等のアルカリ金属臭化物、臭化マグネシウム等のアルカリ土類金属臭化物、臭化亜鉛(II)等の金属臭化物、テトラブチルアンモニウムブロミド等の4級アンモニウムブロミド、トリメチルシリルブロミド等の有機ケイ素臭化物、三臭化リン等のリン化合物及び臭化水素等の臭素化剤。

- R^{15} がヨウ素原子である場合、ヨウ化カリウム等のアルカリ金属ヨウ化物、ヨウ化マグネシウム等のアルカリ土類金属ヨウ化物、ヨウ化亜鉛(II)等の金属ヨウ化物、テトラブ

チルアンモニウムヨージド等の4級アンモニウムヨージド、トリメチルシリルヨージド等の有機ケイ素化合物及びヨウ化水素等のヨウ素化剤。

・ R^{15} がシアノ基である場合、シアン化カリウム、シアン化ナトリウム等の青酸塩及びトリメチルシリルシアニド等の有機ケイ素化合物等のシアノ化剤。

・ R^{15} がC1－C3アルキルチオ基である場合、C1－C3アルキルメルカプタン。

・ R^{15} がC1－C6アルコキシ基である場合、C1－C6アルコール。

・ R^{15} がフェノキシ基である場合には、フェノール。

[0070] 該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、MTBE等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、酢酸ブチル、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF等の酸アミド類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

化合物(14)1モルに対して、上記の試薬が通常1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常－20～150℃の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

該反応は、必要に応じて添加剤の存在下で行うこともできる。かかる添加剤としては、例えばトリブチルフォスフィン等のリン化合物が挙げられる。

上記のC1－C3アルキルメルカプタン、C1－C6アルコール及びフェノールは、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等と反応させることによりアルカリ金属塩に調製した後、該反応に用いることもできる。

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

化合物(15)のうち、 R^{15} が塩素原子であるアミド化合物は、化合物(4)と7-アザビシクロ[4.1.0]ヘプタンとを反応させた後、そのまま、上述の塩素化剤と反応することにより合成することもできる。

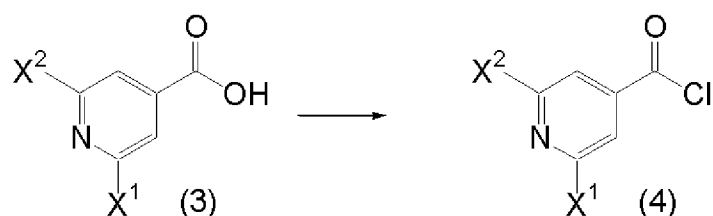
[0071] 本発明化合物の合成に用いる中間体化合物の一部は、市販されているか、公知の

文献等に開示のある化合物である。また、中間体化合物は、例えば下記の方法により製造することができる。

[0072] (中間体製造法1)

化合物(4)またはその塩酸塩は、化合物(3)と塩化チオニルとを反応させることにより製造することができる。

[化8]



[式中、 X^1 及び X^2 は上記と同じ定義を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、DMF等の酸アミド類及びこれらの混合物が挙げられる。

化合物(3)1モルに対して、塩化チオニルが通常1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常20～150℃の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物(4)を単離することができる。単離された化合物(4)は、再結晶等によりさらに精製することもできる。

[0073] 本発明化合物は、植物病害を防除する効果を示す。

本発明化合物が優れた効力を有する植物病害としては、糸状菌類病害、細菌類病害、ウイルス病害が挙げられる。糸状菌類病害の原因となる糸状菌類として、具体的にはエリシフェ属菌、例えばコムギうどんこ病菌(*Erysiphe graminis*);ウンシヌラ属菌、例えばブドウうどんこ病菌(*Uncinula necator*);ポドスファエラ属菌、例えばリソグうどんこ病菌(*Podosphaera leucotricha*);スファエロテカ属菌、例えばキュウ

リうどんこ病菌 (*Sphaerotheca cucurbitae*); オイディオプシス属菌、例えばトマトうどんこ病菌 (*Oidiopsis sicula*); マグナポリセ属菌、例えばイネいもち病菌 (*Magnaporthe oryzae*); コクリオボルス属菌、例えばイネごま葉枯病菌 (*Cochliobolus miyabeanus*); ミコスファレラ属菌、例えばコムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*); パイレノフォーラ属菌、例えばオオムギ網斑病菌 (*Pyrenophora teres*); スタゴノスポラ属菌、例えばコムギふ枯れ病菌 (*Stagonospora nodorum*); リンコスポリウム属菌、例えばオオムギ雲形病菌 (*Rhynchosporium secalis*); シュードサーコスボレラ属菌、例えばコムギ眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*); ゴーマノマイセス属菌、例えばコムギ立枯病菌 (*Gaeumannomyces graminis*); フザリウム属菌、例えばコムギ赤かび病菌 (*Fusarium* sp.); ミクロドキウム属菌、例えばコムギ紅色雪腐病菌 (*Microdochium nivale*); ベンチュリア属菌、例えばリンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*); エルシノエ属菌、たとえばブドウ黒痘病菌 (*Elsinoe ampelina*); ボトリティス属菌、例えばキュウリ灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*); モニリニア属菌、例えばモモ灰星病菌 (*Monilinia fructicola*); フォーマ属菌、例えばナタネ根朽病菌 (*Phoma lingam*); クラドスポリウム属菌、例えばトマト葉かび病菌 (*Cladosporium fulvum*); サーコスボラ属菌、例えばラッカセイ褐斑病菌 (*Cercospora beticola*); サーコスポリディウム属菌、例えばカッラセイ黒渋病菌 (*Cercosporidium personatum*); コレトリカム属菌、例えばイチゴ炭そ病菌 (*Colletotrichum fragariae*); スクレロティニア属菌、例えばキュウリ菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*); アルタナーリア属菌、例えばリンゴ斑点落葉病菌 (*Alternaria mali*); バーティシリウム属菌、例えばナス半身萎凋病菌 (*Verticillium dahliae*); リゾクトニア属菌、例えばイネ紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*); パクシニア属菌、例えばコムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*); ファコプソラ属菌、例えばダイズさび病菌 (*Phakopsora pachyrhizi*); テイレティア属菌、例えばコムギなまぐさ黒穂病菌 (*Tilletia caries*); ウスティラゴ属菌、例えばオオムギ裸黒穂病菌 (*Ustilago nuda*); スクレロティウム属菌、例えばラッカセイ白絹病菌 (*Sclerotium rolfsii*); ファイトフトラ属菌、例えばジャガイモ疫病病菌 (*Phytophthora infestans*); シュードペロノスポーラ属菌、例えばキュウリべと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*); ペロノ

スポーラ属菌、例えばハクサイベと病菌(*Peronospora parasitica*); プラズモパラ属菌、例えばブドウベと病菌(*Plasmopara viticola*); ブレミア属菌、例えばレタスベと病菌(*Bremia lactucae*); スクレロフトーラ属菌、例えばイネ黄化萎縮病菌(*Sclerophthora macrospora*); ピシウム属菌、例えばキュウリ苗立枯病菌(*Pythium ultimum*); プラズモディオフォーラ属菌、例えばナタネ根こぶ病菌(*Plasmodiophora brassicae*); アファノマイセス属菌、例えばテンサイ黒根病菌(*Aphanomyces cochlioides*); シエラビオプシス属菌、例えばワタのBlack Root Rot病菌(*Thielaviopsis basicola*); ディプロディア属菌、例えばトウモロコシ茎腐病菌(*Diplodia maydis*); アスペルギルス属菌(*Aspergillus* sp.); ペニシリウム属菌(*Penicillium* sp.); トリコデルマ属菌(*Trichoderma* sp.); リゾプス属菌(*Rhizopus* sp.)などが挙げられる。

[0074] 細菌類病害の原因となる細菌として、バークホルデリア属菌、例えばイネ苗立枯細菌病菌(*Burkholderia plantarii*); シュードモナス属菌、例えばキュウリ斑点細菌病菌(*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*); ラルストニア属細菌、例えばナス青枯病菌(*Ralstonia solanacearum*); ザンソモナス属細菌、例えばカンキツかいよう病菌(*Xanthomonas citri*); エルウィニア属細菌、例えばハクサイ軟腐病菌(*Erwinia carotovora*)等が挙げられる。

[0075] ウイルス病の原因となるウィルスとしては、タバコモザイクウイルス(*Tobacco mosaic virus*)、キュウリモザイクウイルス(*Cucumber mosaic virus*)等が挙げられる。また、ウイルス病を媒介することによりウイルス病の原因となる糸状菌としてポリミキサ属菌(*Polymyxa* sp.)、オルピディウム属菌(*Olpidium* sp.)等が挙げられる。本発明化合物は、これら以外の糸状菌類、細菌類、ウイルスにも殺菌スペクトルを示す。

[0076] 本発明化合物を含有する植物病害防除組成物もまた、本発明の1つである。

本発明防除組成物は、本発明化合物と、固体担体及び液体担体等の不活性な担体と、必要に応じて界面活性剤その他の製剤用補助剤とを混合することにより製剤化することができる。本発明防除組成物は、乳剤、水和剤、顆粒水和剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等に製剤化することができる。

本発明防除組成物は、本発明化合物を通常0.1～90重量%含有する。

[0077] 製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば、カオリンクレイ、アッタパルジヤイトクレイ、ベントナイト、モンモリロナイト、酸性白土、パイロフィライト、タルク、珪藻土、方解石等の鉱物；トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻粉等の天然有機物；尿素等の合成有機物；炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム等の塩類；合成含水酸化珪素等の合成無機物；等からなる微粉末、又は、これらの鉱物、天然有機物、合成有機物、塩類、合成無機物等からなる粒状物が挙げられる。

[0078] 液体担体としては、例えばキシレン、アルキルベンゼン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類；2-プロパノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、セロソルブ等のアルコール類；アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類；ダイズ油、綿実油等の植物油；石油系脂肪族炭化水素類；エステル類；ジメチルスルホキシド；アセトニトリル；水が挙げられる。

[0079] 界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド重縮合物等の陰イオン界面活性剤、及び、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アルキルポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤が挙げられる。

[0080] その他の製剤用補助剤としては、例えばポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン等の水溶性高分子；アラビアガム、アルギン酸及びその塩、CMC（カルボキシメチルセルロース）、ゼンサンガム等の多糖類；アルミニウムマグネシウムシリケート、アルミナゾル等の無機物；防腐剤；着色剤；PAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT（ジブチルヒドロキシトルエン）等の安定化剤が挙げられる。

[0081] 本発明化合物は、茎葉処理等の植物の処理に用いることにより当該植物を植物病害から保護することもできるし、土壌処理に用いることにより当該土壌に生育する植物を植物病害から保護することもできる。

本発明化合物の有効量を植物又は土壌へ施用することを特徴とする植物病害の防除方法もまた、本発明の1つである。

上述の処理及び施用において、本発明化合物として本発明防除組成物を用いることができる。

- [0082] 本発明防除剤の施用量は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用方法、施用場所、対象病害、対象作物等によっても異なるが、本発明防除剤中の本発明化合物量で10アールあたり、通常1～500g、好ましくは2～200gである。

本発明防除剤は、乳剤、水和剤、懸濁剤等の液剤である場合、通常水で希釈して施用されるが、希釈後の本発明化合物濃度で、通常0.0005～2重量%、好ましくは0.005～1重量%で施用することができる。

本発明防除剤は、粉剤、粒剤等の固形剤である場合、通常希釈することなくそのまま施用される。

種子への処理においては、本発明防除剤は、種子1kgに対して本発明化合物量で、通常0.001～100g、好ましくは0.01～50gの範囲で施用される。

- [0083] 本発明の植物病害防除方法は、通常、病害の発生が予測される植物、若しくはその植物が生育する土壤に、本発明化合物の有効量を施用すること、及び／又は病害の発生が確認された植物若しくはその植物が生育する土壤に、本発明化合物の有効量を施用することにより行われる。

- [0084] 本発明化合物は、畑、水田、芝生、果樹園等の農耕地における植物病害の防除剤として使用することができ、具体的には、以下に挙げられる「作物」等を栽培する農耕地等において、当該農耕地の病害を防除することができる。

- [0085] 農作物;トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等、
野菜;ナス科野菜(ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等)、ウリ科野菜(キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等)、アブラナ科野菜(ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等)、キク科野菜(ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等)、ユリ科野菜(ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス)、セリ科野菜(ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等)、アカザ科野菜(ホウレンソウ、フダンソウ等)、シソ科野菜(シソ、ミント、バジル等)、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等、

花卉、

観葉植物、

果樹；仁果類(リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等)、核果類(モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等)、カンキツ類(ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等)、堅果類(クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等)、液果類(ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等)、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ等、

果樹以外の樹；チャ、クワ、花木、街路樹(トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチョウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ)等。

[0086] 上記「作物」としては、イソキサフルトール等のHPPD阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のALS阻害剤、EPSP合成酵素阻害剤、グルタミン合成酵素阻害剤、プロモキシニル、ジカンバ等の除草剤に対する耐性が、古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により付与された作物も含まれる。

[0087] 古典的な育種法により耐性が付与された「作物」の例として、イマゼタピル等のイミダゾリノン系除草剤耐性のClearfield(登録商標)、カノーラ、チフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系ALS阻害型除草剤耐性のSTSダイズ等がある。

また、遺伝子組換え技術により耐性が付与された「作物」の例として、グリホサートやグルホシネート耐性のトウモロコシ、ダイズ、ワタ、ナタネ品種があり、RoundupReady(登録商標)、RoundupReady2(登録商標)及びLibertyLink(登録商標)等の商品名ですでに販売されている。

[0088] 上記「作物」としては、遺伝子組換え技術を用いて選択的毒素等を合成する事が可能となった遺伝子組換え植物も含まれる。

この様な遺伝子組換え植物で発現される選択的毒素として、例えば、バチルス・セレウスやバチルス・ポピリエ由来の殺虫性タンパク質；Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9C等の δ -エンドトキシニンタンパク質、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等のバチルス・チューリンゲンシス由来

の殺虫タンパク質;等のバチルス属由来の殺虫性タンパク質が挙げられる。上記選択的毒素としては、更に、線虫由来の殺虫タンパク質;さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素;糸状菌類毒素;植物レクチン;アグルチニン;トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤;リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サボリン、ブリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク質(RIP);3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素;エクダイソン阻害剤;HMG-COAリダクターゼ;ナトリウムチャネル、カルシウムチャネル阻害剤等のイオンチャネル阻害剤;幼若ホルモンエステラーゼ;利尿ホルモン受容体;スチルベンシンターゼ;ビベンジルシンターゼ;キチナーゼ;グルカナナーゼ等が挙げられる。

[0089] またこの様な遺伝子組換え作物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C等の δ -エンドトキシンタンパク質、VIP1、VIP2、VIP3、VIP3A等の殺虫タンパク質のハイブリッド毒素、一部を欠損した毒素、修飾された毒素も含まれる。

ハイブリッド毒素は、例えば、組換え技術を用いて、これらタンパク質の異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出すことができる。一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したCry1Abが知られている。修飾された毒素としては、天然型の毒素のアミノ酸の1つ又は複数が置換されている。

これら毒素の例及びこれら毒素を合成する事ができる組換え植物は、EP-A-0374 753、WO93/07278、WO95/34656、EP-A-0427529、EP-A-451878、WO03/052073に記載されている。

これらの遺伝子組換え植物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫への耐性を該植物へ付与する。

[0090] また、1つ若しくは複数の殺虫性の害虫抵抗性遺伝子を含み、1つ又は複数の毒素を発現する遺伝子組換え植物は既に知られており、いくつかの植物は市販されている。

これら遺伝子組換え植物の例として、YieldGard(登録商標)(Cry1Ab毒素を発現

するトウモロコシ品種)、YieldGard Rootworm(登録商標)(Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種)、YieldGard Plus(登録商標)(Cry1AbとCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種)、Herculex I(登録商標)(Cry1Fa2毒素とグルホシネートへの耐性を付与する為にホスフィノトリシン N-アサチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現するトウモロコシ品種)、NuCOTN33B(Cry1Ac毒素を発現するワタ品種)、Bollgard I(登録商標)(Cry1Ac毒素を発現するワタ品種)、Bollgard II(登録商標)(Cry1AcとCry2Ab毒素とを発現するワタ品種)、VIPCOT(登録商標)(VIP毒素を発現するワタ品種)、NewLeaf(登録商標)(Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種)、NatureGard(登録商標)、Agrisure(登録商標)GT Advantage(GA21 グリホサート耐性形質)、Agrisure(登録商標)CB Advantage(Bt11コーンボーラー(CB)形質)、Protecta(登録商標)等が挙げられる。

[0091] 上記「作物」としては、遺伝子組換え技術を用いて、選択的な作用を有する抗病原性物質を産生する能力を付与された遺伝子組換え植物も含まれる。

こうした遺伝子組換え植物で発現される抗病原性物質の例として、PRタンパク質(PRPs)等が知られている。このような抗病原性物質とそれを産生する遺伝子組換え植物は、EP-A-0392225、WO95/33818、EP-A-0353191等に記載されている。

上記抗病原性物質の例として、更に、ナトリウムチャネル阻害剤、カルシウムチャネル阻害剤(ウイルスが産生するKP1、KP4、KP6毒素等が知られている。)等のイオンチャネル阻害剤;スチルベンシンターゼ;ピベンジルシンターゼ;キチナーゼ;グルカナーゼ;ペプチド抗生物質;ヘテロ環を有する抗生物質、植物病害抵抗性に関与するタンパク因子(WO03/000906に記載されている。)等の微生物が産生する抗病原性物質等が挙げられる。

また、上記植物には、古典的育種技術または遺伝子組換え技術を用い、先に述べたような除草剤耐性、害虫抵抗性、病害耐性等に関わる形質を2種以上付与された系統、および同類または異なる性質を有する遺伝子組換え植物同士を掛け合わせるにより親系統が有する2種以上の性質が付与された系統も含まれる。

[0092] 本発明化合物は、殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節

剤、肥料または土壌改良剤等のその他の有効成分と混合して用いることもできるし、本発明化合物とその他の有効成分とを混合せずに同時に用いることもできる。また、本発明防除組成物は、その他の有効成分と混合して用いることもできるし、本発明防除組成物とその他の有効成分とを混合せずに同時に用いることもできる。

[0093] かかる他の殺菌剤としては、例えば

(1)アゾール系殺菌剤

プロピコナゾール(propiconazole)、プロチオコナゾール(prothioconazole)、トリアジメノール(triadimenol)、プロクロラズ(prochloraz)、ペンコナゾール(penconazole)、テブコナゾール(tebuconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、ジニコナゾール(diniconazole)、ブロムコナゾール(bromuconazole)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、シプロコナゾール(cyproconazole)、メトコナゾール(metconazole)、トリフルミゾール(triflumizole)、テトラコナゾール(tetraconazole)、マイクロブタニル(microbutanil)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、フルキンコナゾール(flouquinconazole)、トリティコナゾール(triticonazole)、ビテルタノール(bitertanol)、イマザリル(imazalil)、フルトリアホル(flutriafol)、シメコナゾール(simeconazole)、イプコナゾール(ipconazole)等；

[0094] (2)アミン系殺菌剤

フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、トリデモルフ(tridemorph)、フェンプロピジン(fenpropidin)、スピロキサミン(spiroxamine)等；

[0095] (3)ベンズイミダゾール系殺菌剤

カルベンダジム(carbendazim)、ベノミル(benomyl)、チアベンダゾール(thiabendazole)、チオファネートメチル(thiophanate—Methyl)等；

[0096] (4)ジカルボキシイミド系殺菌剤

プロシミドン(procymidone)、イプロジオン(iprodione)、ビンクロゾリン(vinclozolin)等；

[0097] (5)アニリノピリミジン系殺菌剤

シプロジニル(cyprodinil)、ピリメタニル(pyrimethanil)、メパニピリム(mepanipy

rim)等;

[0098] (6)フェニルピロール系殺菌剤

フェンピクロニル(fenpiclonil)、フルジオキシニル(fludioxonil)等;

[0099] (7)ストロビルリン系殺菌剤

クレソキシムメチル(kresoxim-methyl)、アゾキシストロビン(azoxystrobin)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)、フルオキサストロビン(fluxastrobin)、ピコキシストロビン(picoxystrobin)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin)、ピリベンカルブ(pyribencarb)、メトミノストロビン(metominostrobin)、オリザストロビン(oryzastrobin)、エネストロビン(enestrobin)等;

[0100] (8)フェニルアמיד系殺菌剤

メタラキシル(metalaxyl)、メタラキシルMまたはメフェノキサム(metalaxyl-M or mefenoxam)、ベナラキシル(benalaxyl)、ベナラキシルMまたはキララキシル(benalaxyl-M or kiralaxyl)等;

[0101] (9)カルボン酸アミド系殺菌剤

ジメトモルフ(dimethomorph)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、ベンチアバリカルブイソプロピル(benthiavalicarb-isopropyl)、マンジプロパミド(mandipropamid)、バリフェナル(valiphenal)等;

[0102] (10)カルボキサミド系殺菌剤

カルボキシン(carboxin)、メプロニル(mepronil)、フルトラニル(flutolanil)、チフルザミド(thifluzamide)、フラメトピル(furametpyr)、ボスカリド(boscalid)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、フルオピラム(fluopyram)、ビキサフェン(bixafen)等;

[0103] (11)その他の殺菌剤または植物病害防除剤

ジエトフェンカルブ;チウラム;フルアジナム;マンコゼブ;クロロタロニル;キャプタン;ジクロフルアニド;フォルペット;キノキシフェン;フェンヘキサミド;ファモキサドン;フェナミドン;ゾキサミド;エタボキサム;アミスルブロム;シアゾファミド;メトラフェノン;シフルフェナミド;プロキナジド;フルスルファミド;フルオピコリド;フォセチル;シモキサニル;ペンシクロン;トルクロホスメチル;カルプロパミド;ジクロシメット;フェノキサニル;トリシクラゾール;ピロキロン;プロベナゾール;イソチアニル;チアジニル;テブフロキン;ジク

ロメジン;カスガマイシン;フェリムゾン;フサライド;バリダマイシン;ヒドロキシイソキサゾール;イミノクタジン酢酸塩;イソプロチオラン;オキシソリニック酸;オキシテトラサイクリン;ストレプトマイシン;塩基性塩化銅;水酸化第二銅;塩基性硫酸銅;有機銅;硫黄等;が挙げられる。

[0104] かかる他の殺虫剤としては、例えば

(1) 有機リン系化合物

アセフェート(acephate)、リン化アルミニウム(Aluminium phosphide)、ブタチオホス(butathiofos)、キャドサホス(cadusafos)、クロルエトキシホス(chlorethoxy fos)、クロルフエンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル(chlorpyrifos-methyl)、シアノホス(cyanophos:CYAP)、ダイアジノン(diazinon)、DCIP(dichlorodiisopropyl ether)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion:ECP)、ジクロロボス(dichlorvos:DDVP)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジスルホトン(disulfoton)、EPN、エチオン(ethion)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrifos)、フェンチオン(fenthion:MPP)、フェニトロチオン(fenitrothion:MEP)、ホスチアゼート(fossthiate)、ホルモチオン(formothion)、リン化水素(Hydrogen phosphide)、イソフェンホス(isofenphos)、イソキサチオン(isoxathion)、マラチオン(malathion)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メチダチオン(methidathion:DMTP)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレド(naled:BRP)、オキシデプロホス(oxydeprofos:ESP)、パラチオン(parathion)、ホサロン(phosalone)、ホスメット(phosmet:PMP)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、キナルホス(quinalphos)、フェントエート(phenthoate:PAP)、プロフェノホス(profenofos)、プロパホス(propaphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclorfos)、サリチオン(salithion)、スルプロホス(sulprofos)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テムホス(temephos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テルブホス(terbufos)、チオメトン(thiometon)、トリクロルホン(trichlorophon:DEP)、バミドチオン(vamidothion)、フォレート(phorate)、カズサホス(cadusafos)等;

[0105] (2)カーバメート系化合物

アラニカルブ(alanycarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、BPMC、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、クロエトカルブ(cloethocarb)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocab:MIPC)、メトルカルブ(metolcarb)、メソミル(methomyl)、メチオカルブ(methiocarb)、NAC、オキサミル(oxamyl)、ピリミカーブ(pirimicarb)、プロポキスル(propoxur:PHC)、XMC、チオジカルブ(thiodicarb)、キシリルカルブ(xylylc arb)、アルジカルブ(aldicarb)等;

[0106] (3)合成ピレスロイド系化合物

アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、ベンフルスリン(benfluthrin)、ベーターシフルトリン(beta-cyfluthrin)、ビフェントリン(bifenthrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルメスリン(flumethrin)、フルバリネート(fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、イミプロトリン(imiprothrin)、ペルメトリン(permethrin)、プラレトリン(prallethrin)、ピレトリン(pyrethrin)、レスメトリン(resmethrin)、シグマーシペルメトリン(sigma-cypermethrin)、シラフルオフェン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、フェノトリン(phenothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、アルファーシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、ゼーターシペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ラムダーシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、フラメトリン(furamethrin)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メキシメチル)ベンジル (EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレ

ート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-メチルベンジル (EZ)-(1RS, 3RS;1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-プロポ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4-(メキシメチル)ベンジル (1RS, 3RS;1RS, 3SR)-2, 2-ジメチル-3-(2-メチル-1-プロペニル)シクロプロパンカルボキシレート等;

[0107] (4) ネライストキシシン系化合物

カルタップ(cartap)、ベンスルタップ(bensultap)、チオシクラム(thiocyclam)、モノスルタップ(monosultap)、ビスルタップ(bisultap)等;

[0108] (5) ネオニコチノイド系化合物

イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、アセタミプリド(acetamiprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チアクロプリド(thiacloprid)、ジノテフラン(dinotefuran)、クロチアニジン(clothianidin)等;

[0109] (6) ベンゾイル尿素系化合物

クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ビストリフルロン(bistrifluron)、ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルアズロン(flua-zuron)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフエヌロン(lufenuron)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、トリフルムロン(triflumuron)、トリアズロン等;

[0110] (7) フェニルピラゾール系化合物

アセトプロール(acetoprole)、エチプロール(ethiprole)、フィプロニル(fipronil)、バニリプロール(vaniliprole)、ピリプロール(pyriprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)等;

[0111] (8) Btトキシシン系殺虫剤

バチルス・チューリンゲンシス菌由来の生芽胞および産生結晶毒素、並びにそれらの混合物;

[0112] (9) ヒドラジン系化合物

クロマフェノジド(chromafenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、メキシフェ

メゾド(methoxyfenozide)、テブフェノゾド(tebufenozide)等;

[0113] (10)有機塩素系化合物

アルドリン(aldrin)、ディルドリン(dieldrin)、ジエノクロル(dienochlor)、エンドスルファン(endosulfan)、メトキシクロル(methoxychlor)等;

[0114] (11)天然系殺虫剤

マシン油(machine oil)、硫酸ニコチン(nicotine-sulfate);

[0115] (12)その他の殺虫剤

アベルメクチンB(avermectin-B)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、ブプロフェジン(buprofezin)、クロルフェナピル(chlorphenapyr)、シロマジン(cyromazine)、D-D(1, 3-Dichloropropene)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、フェナザキン(fenazaquin)、フルピラゾホス(flupyrzofos)、ハイドロブレン(hydroprene)、メトブレン(methoprene)、インドキサカルブ(indoxacarb)、メトキサジアゾン(metoxadiazon)、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリプロキシフェン(pyriproxifen)、スピノサッド(spinosad)、スルフラミド(sulfluramid)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、トリアゼメイト(triazamate)、フルベンジアミド(flubendiamide)、レピメクチン(lepimectin)、ヒ酸(Arsenic acid)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、石灰窒素(Calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(Calcium polysulfide)、クロルデン(chlordane)、DDT、DSP、フルフェネリウム(flufenerim)、フロニカミド(flonicamid)、フルリムフェン(flurimfen)、ホルメタネート(formetanate)、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、臭化メチル(Methyl bromide)、ニディノテフラン(nidinotefuran)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、プロトリフェンビュート(protrifenbute)、スピロメシフェン(spiromesifen)、硫黄(Sulfur)、メタフルミゾン(metaflumizone)、スピロテトラマト(spirotetramat)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazone)、スピネトラム(spinetoram)、クロラントラニプロール(chlorantraniliprole)

で示される化合物等が挙げられる。

[0116] かかる他の殺ダニ剤(殺ダニ活性成分)としては、例えばアセキノシル(acequinoc

yl)、アミトラズ(amitraz)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ビフェナゼート(bifenazate)、フェニソブプロモレート(bromopropylate)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロルベンジレート(chlorobenzilate)、CPCBS(chlorfenson)、クロフェンテジン(clofentezine)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、ケルセン(ジコホル:dicofo l)、エトキサゾール(etoxazole)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フルアクリピリム(flucacrypyrim)、フルプロキシフェン(fluproxyfen)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、プロパルギット(propargite:BPPS)、ポリナクチン複合体(polynactins)、ピリダベン(pyridaben)、ピリミジフェン(Pyrimidifen)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、テトラジホン(tetradifon)、スピロディクロフェン(spirodiclofen)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スピロテトラマト(spirotetramat)、アミドフルメット(amido flumet)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)等が挙げられる。

[0117] かかる他の殺線虫剤(殺線虫活性成分)としては、例えば、DCIP、フォスチアゼート(fosthiazate)、塩酸レバミゾール(levamisol)、メチルイソチオシアネート(methylisothiocyanate)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、イミシアホス(imicyafos)等が挙げられる。

[0118] かかる薬害軽減剤(薬害軽減活性成分)としては、例えば、1, 8-ナフタリックアンヒドライド(1, 8-naphthalic anhydride)、チョメトリニル(cyometrinil)、オキサベトリニル(oxabetrinil)、フルキシフェニン(fluxofenim)、フルラゾール(flurazole)、ベノキサコール(benoxacor)、ジクロルミド(dichlormid)、フリラゾール(furilazole)、フェンクロリム(fenclorim)、ダイムロン(daimuron)、クミルロン(cumyluron)、ジメピペレート(dimepiperate)、クロキントセツトメキシル(cloquintocet-mexyl)、フェンクロラゾールエチル(fenchlorazole-ethyl)、メフェンピルジエチル(mefenpyr-diethyl)、イソキサジフェンエチル(isoxadifen-ethyl)等が挙げられる。

[0119] かかる植物生長調節剤(植物生長調節活性成分)としては、例えば、エテホン(ethephon)、クロルメコートクロリド(chlormequat-chloride)、メピコートクロリド(mepiquat-chloride)、等が挙げられる。

[0120] 本発明農業用組成物を、何らかの方法により除草剤耐性を付与された作物に処理

し、同時にまたは異なる時期にある種の除草剤を処理することにより、効果的かつ省力的に、高い「作物生育改善効果」を得ることもできる。ここで、「作物生育改善効果」とは、作物の虫害、病害、雑草害の防除などにより、結果的に作物収穫量の増加をもたらすこと等を意味する。

具体的には、イミダゾリノン系除草剤耐性を付与された作物、例えばClearfield(登録商標)カノーラに、本発明農業用組成物とイマザピル等のイミダゾリノン系除草剤を、同時又は異なる時期に処理し、Clearfieldカノーラの生育を改善することが出来る。また、グリホサート耐性が付与された作物、例えばRoundupReady(登録商標)ワタやRoundupReady2ダイズ(登録商標)に、本発明農業用組成物とグリホサートを、同時又は異なる時期に処理し、RoundupReadyトウモロコシやRoundupReady2ダイズの生育を改善することが出来る。また、グルホシネート耐性が付与された作物、例えばLibertyLink(登録商標)トウモロコシに、本発明農業用組成物とグルホシネートを、同時または異なる時期に処理することにより、LibertyLinkワタの生育を改善することが出来る。

実施例

[0121] 以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

まず、本発明化合物の製造例を示す。

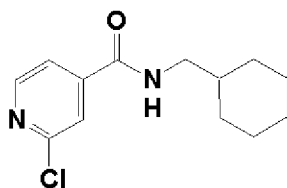
[0122] 製造例1

2-クロロイソニコチン酸3.0gと塩化チオニル3.6gとN,N-ジメチルホルムアミド[DMF]3滴とをトルエン30mlに加え、2時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮して、2-クロロイソニコチン酸塩化物3.5gを得た。

2-クロロイソニコチン酸塩化物3.5gとシクロヘキシルメチルアミン2.4gとトリエチルアミン2.5gとをテトラヒドロフラン[THF]20mlに加え、室温で30分間攪拌した。反応混合物に酢酸エチルを加え、セライト(登録商標)を通して濾過した。得られた濾液を減圧下で濃縮し、残渣をtert-ブチルメチルエーテル[MTBE]とヘキサンとの混合溶媒で洗浄し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド4.2gを得た。

N-(シクロヘキシルメチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド

[化9]

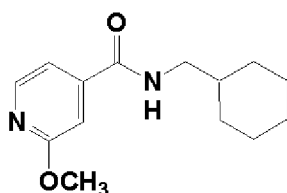


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.93–1.32 (5H, m), 1.53–1.80 (6H, m), 3.31 (2H, dd, $J=6.5, 6.4$ Hz), 6.25 (1H, br s), 7.52 (1H, dd, $J=5.1, 1.5$ Hz), 7.63–7.64 (1H, m), 8.50 (1H, d, $J=5.1$ Hz).

[0123] N-(シクロヘキシルメチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド0.42gとナトリウムメトキシドの28%メタノール溶液1.0gとを1,4-ジオキサン10mlに加え、80°Cで4時間加熱攪拌した。室温付近まで放冷した反応混合物を水にあげ、酢酸エチルで抽出し、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-メトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物1と記す。)0.10gを得た。

本発明化合物1

[化10]



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.94–1.31 (5H, m), 1.52–1.80 (6H, m), 3.29 (2H, dd, $J=6.2, 6.3$ Hz), 3.97 (3H, s), 6.15 (1H, br s), 7.02–7.03 (1H, m), 7.16 (1H, dd, $J=5.3, 1.3$ Hz), 8.25 (1H, d, $J=5.3$ Hz).

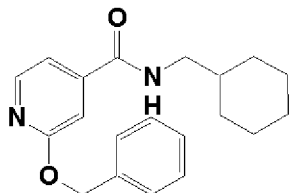
[0124] 製造例2

N-(シクロヘキシルメチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド3.6gとベンジルアルコール3.4gとをDMF30mlに加えた溶液に、60%水素化ナトリウム(油性)1.25gを加え、2時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物を水にあげ、10%クエン酸水溶液を加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾

乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をMTBE及びヘキサンで順次洗浄し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-ベンジルオキシイソニコチン酸アミド1.6gを得た。

N-(シクロヘキシルメチル)-2-ベンジルオキシイソニコチン酸アミド

[化11]

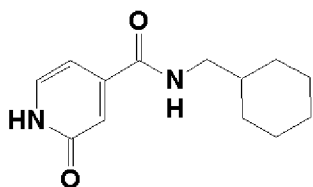


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93–1.31 (5H, m), 1.51–1.79 (6H, m), 3.28 (2H, dd, $J=6.6, 6.2\text{Hz}$), 5.41 (2H, s), 6.16 (1H, br s), 7.08 (1H, dd, $J=1.6, 0.7\text{Hz}$), 7.19 (1H, dd, $J=5.3, 1.6\text{Hz}$), 7.29–7.47 (5H, m), 8.25 (1H, dd, $J=5.3, 0.7\text{Hz}$).

[0125] N-(シクロヘキシルメチル)-2-ベンジルオキシイソニコチン酸アミド1.6gとパラジウム炭素50mgとをメタノール30mlに加え、水素雰囲気下で常圧で反応させた。反応混合物をセライト(登録商標)を通して濾過した後、濾液を減圧下で濃縮した。残渣をMTBE及びヘキサンで順次洗浄し、N-(シクロヘキシルメチル)-1,2-ジヒドロ-2-オキシイソニコチン酸アミド1.3gを得た。

N-(シクロヘキシルメチル)-1,2-ジヒドロ-2-オキシイソニコチン酸アミド

[化12]



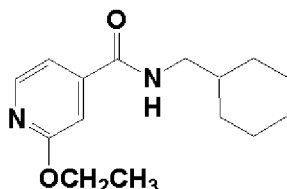
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.85–1.33 (5H, m), 1.49–1.80 (6H, m), 3.28 (2H, dd, $J=6.4, 6.3\text{Hz}$), 6.14–6.19 (1H, m), 6.63 (1H, dd, $J=6.8, 1.2\text{Hz}$), 6.81–6.82 (1H, m), 7.41 (1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 12.41 (1H, br s).

[0126] N-(シクロヘキシルメチル)-1,2-ジヒドロ-2-オキシイソニコチン酸アミドとヨウ化エチルと炭酸セシウムとをDMFに加え、室温で攪拌する。反応液に水を加え、酢

酸エチルで抽出し、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮する。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-エトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物2と記す。)を得る。

本発明化合物2

[化13]

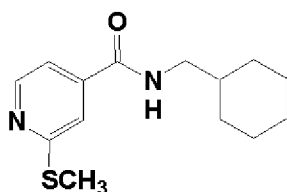


[0127] 製造例3

N-(シクロヘキシルメチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド3. 3gをナトリウムチオメチドの15%水溶液30mlに加え、3時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-メチルチオイソニコチン酸アミド2. 6gを得た。

N-(シクロヘキシルメチル)-2-メチルチオイソニコチン酸アミド

[化14]

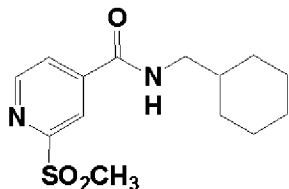


$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \quad \delta : 0.92-1.22(5\text{H}, \text{m}), 1.51-1.79(6\text{H}, \text{m}), 2.58(3\text{H}, \text{s}), 3.28(2\text{H}, \text{dd}, J=6.4, 6.3\text{Hz}), 6.37(1\text{H}, \text{br s}), 7.23(1\text{H}, \text{dd}, J=5.2, 1.5\text{Hz}), 7.48(1\text{H}, \text{dd}, J=1.5, 0.7\text{Hz}), 8.50(1\text{H}, \text{dd}, J=5.2, 0.7\text{Hz}).$

[0128] N-(シクロヘキシルメチル)-2-メチルチオイソニコチン酸アミド2. 3gと3-クロロ過安息香酸(純度65%)4. 0gとをクロロホルム20mlに加え、室温で8時間攪拌した。反応混合物に水及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、

減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-メチルスルホニルイソニコチン酸アミド1.5gを得た。

N-(シクロヘキシルメチル)-2-メチルスルホニルイソニコチン酸アミド
[化15]

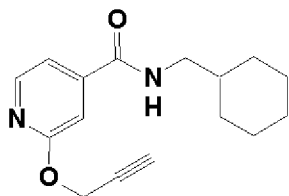


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.95–1.32 (5H, m), 1.56–1.81 (6H, m), 3.27 (3H, s), 3.34 (2H, dd, $J=6.4, 6.3\text{Hz}$), 6.47 (1H, br s), 7.99 (1H, dd, $J=5.0, 1.7\text{Hz}$), 8.28 (1H, dd, $J=1.7, 0.7\text{Hz}$), 8.85 (1H, dd, $J=5.0, 0.7\text{Hz}$).

[0129] N-(シクロヘキシルメチル)-2-メチルスルホニルイソニコチン酸アミド0.30gとプロパルギルアルコール0.13gと60%水素化ナトリウム(油性)80mgとをDMF3mlに加え、室温で4時間攪拌した。反応混合物に10%クエン酸水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-(2-プロピニルオキシ)イソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物3と記す。)0.24gを得た。

本発明化合物3

[化16]



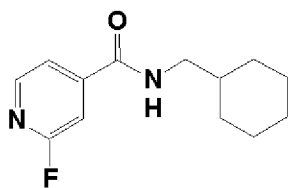
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.93–1.32 (5H, m), 1.51–1.79 (6H, m), 2.48 (1H, t, $J=2.4\text{Hz}$), 3.29 (2H, dd, $J=6.5, 6.4\text{Hz}$), 5.01 (2H, d, $J=2.4\text{Hz}$), 6.21 (1H, br s), 7.07–7.09 (1H, m), 7.23 (1H, dd, $J=5.3, 1.4\text{Hz}$), 8.26 (1H, d, $J=5.3\text{Hz}$).

[0130] 製造例4

2-フルオロイソニコチン酸0.25gとDMF1滴とを塩化チオニル3mlに加え、1時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応液を常圧下で濃縮し、残渣にTHF5mlとシクロヘキシルメチルアミン0.30gとトリエチルアミン1.0gとを加えた。室温で2時間攪拌した後、反応混合物を濃縮して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物4と記す。)0.29gを得た。

本発明化合物4

[化17]



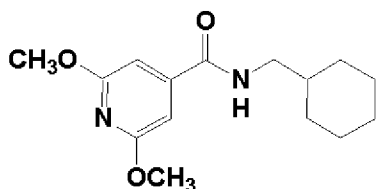
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.92–1.30 (5H, m), 1.53–1.80 (6H, m), 3.30 (2H, dd, $J=6.4, 6.3\text{Hz}$), 6.62 (1H, br s), 7.28–7.29 (1H, m), 7.50 (1H, ddd, $J=5.3, 1.7, 1.6\text{Hz}$), 8.31 (1H, d, $J=5.3\text{Hz}$).

[0131] 製造例5

2,6-ジメトキシイソニコチン酸2.5gと塩化チオニル2.5gとDMF1滴とを、トルエン50mlに加え、3時間加熱還流した。反応液を減圧下で濃縮し、2,6-ジメトキシイソニコチン酸塩化物を得た。次いで、2,6-ジメトキシイソニコチン酸塩化物とシクロヘキシルメチルアミン2.0gとトリエチルアミン2.0gとを、THF30mlに加え、室温で4時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2,6-ジメトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物5と記す。)1.7gを得た。

本発明化合物5

[化18]



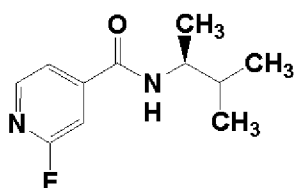
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.92–1.30(5H, m), 1.50–1.78(6H, m), 3.26(2H, dd, $J=6.5, 6.4\text{Hz}$), 3.93(6H, s), 6.26(1H, br s), 6.59(2H, s).

[0132] 製造例6

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに(1S)–1, 2–ジメチルプロピルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N–((1S)–1, 2–ジメチルプロピル)–2–フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物6と記す。)を得た。

本発明化合物6

[化19]



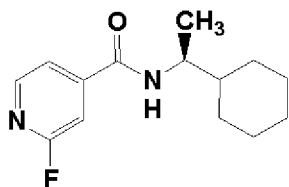
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.96(3H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 0.98(3H, d, $J=3.6\text{Hz}$), 1.20(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.77–1.89(1H, m), 4.02–4.15(1H, m), 5.94–6.04(1H, m), 7.25–7.26(1H, m), 7.47(1H, ddd, $J=5.3, 1.5, 1.5\text{Hz}$), 8.33(1H, d, $J=5.3\text{Hz}$).

[0133] 製造例7

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに(1S)–1–シクロヘキシルエチルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N–((1S)–1–シクロヘキシルエチル)–2–フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物7と記す。)を得た。

本発明化合物7

[化20]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.97–1.31(8H, m), 1.39–1.50(1H, m), 1.64–1.83(5H, m), 4.01–4.11(1H, m), 6.03(1H, d, $J=7.7\text{Hz}$), 7.25–7.26(1H, m), 7.47(1H, ddd, $J=5.1, 1.6, 1.5\text{Hz}$), 8.32(1H, d, $J=5.$

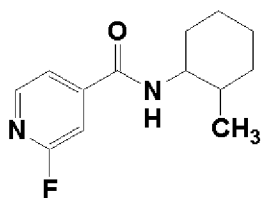
1Hz).

[0134] 製造例8

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに2-メチルシクロヘキシルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物8と記す。)を得た。

本発明化合物8

[化21]



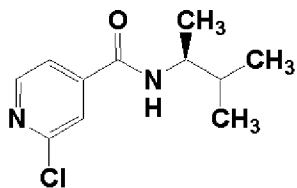
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \quad \delta : 0.93-0.99(3.0\text{H}, \text{m}), 1.08-1.84(8.0\text{H}, \text{m}), 1.93-2.08(1.0\text{H}, \text{m}), 3.64-3.74(0.7\text{H}, \text{m}), 4.22-4.29(0.3\text{H}, \text{m}), 6.07-6.28(1.0\text{H}, \text{m}), 7.24-7.28(1.0\text{H}, \text{m}), 7.45-7.51(1.0\text{H}, \text{m}), 8.30-8.34(1.0\text{H}, \text{m}).$

[0135] 製造例9

(1S)-1,2-ジメチルプロピルアミン0.22gとトリエチルアミン0.30gとをTHF5mlに加え、氷冷下にて2-クロロイソニコチン酸塩化物0.44gとTHF3mlの混合液を加えて30分間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮して、N-((1S)-1,2-ジメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド0.53gを得た。

N-((1S)-1,2-ジメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド

[化22]



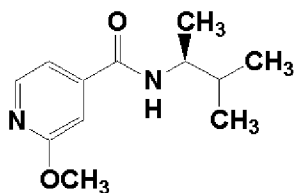
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \quad \delta : 0.97(3\text{H}, \text{d}, J=6.8\text{Hz}), 0.98(3\text{H}, \text{d}, J=6.8\text{Hz}), 1.20(3\text{H}, \text{d}, J=6.8\text{Hz}), 1.78-1.88(1\text{H}, \text{m}), 4.02-4.12(1\text{H}, \text{m}), 5$

. 94 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 51 (1H, dd, J=5. 1, 1. 7Hz), 7. 62 (1H, dd, J=1. 4, 0. 7Hz), 8. 50 (1H, dd, J=5. 1, 0. 7Hz).

[0136] N-((1S)-1, 2-ジメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド0. 32gと28%ナトリウムメキシド0. 68gとをメタノール3mlに加え、16時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮して、残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下で濃縮して、N-((1S)-1, 2-ジメチルプロピル)-2-メキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物9と記す。)0. 22gを得た。

本発明化合物9

[化23]



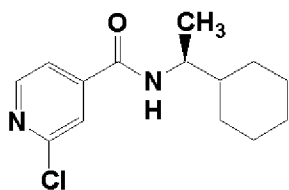
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0. 96 (3H, d, J=6. 8Hz), 0. 96 (3H, d, J=6. 8Hz), 1. 18 (3H, d, J=6. 8Hz), 1. 76-1. 86 (1H, m), 3. 97 (3H, s), 4. 01-4. 11 (1H, m), 5. 91 (1H, d, J=6. 8Hz), 7. 02 (1H, dd, J=1. 5, 0. 7Hz), 7. 15 (1H, dd, J=5. 4, 1. 5Hz), 8. 25 (1H, dd, J=5. 4, 0. 7Hz).

[0137] 製造例10

(1S)-1, 2-ジメチルプロピルアミンの代わりに(1S)-1-シクロヘキシルエチルアミンを用いて製造例9記載の方法に準じた操作を行い、N-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド、次いで、N-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2-メキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物10と記す。)を得た。

N-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド

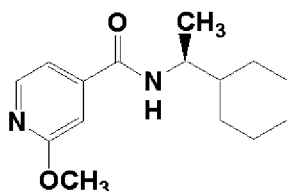
[化24]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.20–1.80(11H, m), 1.21(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 4.00–4.12(1H, m), 5.83–5.97(1H, m), 7.51(1H, dd, $J=5.1, 1.5\text{Hz}$), 7.61–7.62(1H, m), 8.50(1H, dd, $J=5.1, 0.5\text{Hz}$).

本発明化合物10

[化25]



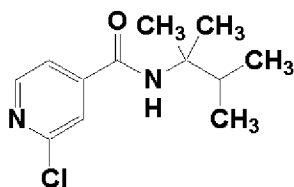
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.01–1.75(11H, m), 1.19(3H, d, $J=7.0\text{Hz}$), 3.97(3H, s), 4.05(1H, d, $J=8.9\text{Hz}$), 5.90(1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.01–7.02(1H, m), 7.16(1H, dd, $J=5.3, 1.4\text{Hz}$), 8.25(1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0138] 製造例11

(1S)-1,2-ジメチルプロピルアミンの代わりに1,1,2-トリメチルプロピルアミンを用いて製造例9記載の方法に準じた操作を行い、N-(1,1,2-トリメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド、次いで、N-(1,1,2-トリメチルプロピル)-2-メトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物11と記す。)を得た。

N-(1,1,2-トリメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド

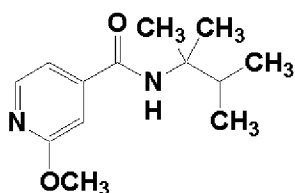
[化26]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.95(6H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.40(6H, s), 2.37–2.44(1H, m), 5.83(1H, br s), 7.46(1H, dd, $J=5.1, 1.5\text{Hz}$), 7.57(1H, dd, $J=1.5, 0.7\text{Hz}$), 8.48(1H, d, $J=4.9\text{Hz}$).

本発明化合物11

[化27]



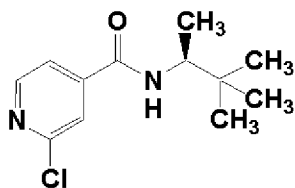
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94 (6H, d, $J=7.0\text{Hz}$), 1.39 (6H, s), 2.34–2.44 (1H, m), 3.96 (3H, s), 5.82 (1H, br s), 6.97 (1H, dd, $J=1.4, 0.7\text{Hz}$), 7.12 (1H, dd, $J=5.3, 1.4\text{Hz}$), 8.23 (1H, dd, $J=5.3, 0.7\text{Hz}$).

[0139] 製造例12

(1S)-1,2-ジメチルプロピルアミンの代わりに(1S)-1,2,2-トリメチルプロピルアミンを用いて製造例9記載の方法に準じた操作を行い、N-((1S)-1,2,2-トリメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド、次いで、N-((1S)-1,2,2-トリメチルプロピル)-2-メトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物12と記す。)を得た。

N-((1S)-1,2,2-トリメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド

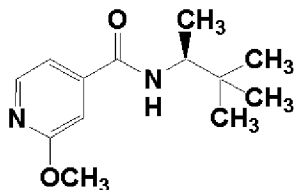
[化28]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.98 (9H, s), 1.18 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 4.05–4.13 (1H, m), 5.92 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.50 (1H, dd, $J=5.1, 1.5\text{Hz}$), 7.60–7.61 (1H, m), 8.51 (1H, d, $J=4.9\text{Hz}$).

本発明化合物12

[化29]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.96 (9H, s), 1.16 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 3.97 (3H, s), 4.03–4.12 (1H, m), 5.89 (1H, br s), 7.00–7.01 (1H, m), 7.15

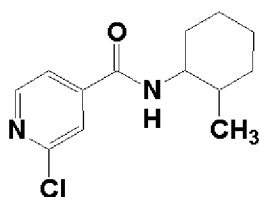
(1H, dd, J=5.4, 1.5Hz), 8.26(1H, dd, J=5.4, 0.7Hz).

[0140] 製造例13

(1S)-1,2-ジメチルプロピルアミンの代わりに2-メチルシクロヘキシルアミンを用いて製造例9記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-クロロイソニコチン酸アミド、次いで、N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-メトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物13と記す。)を得た。

N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-クロロイソニコチン酸アミド

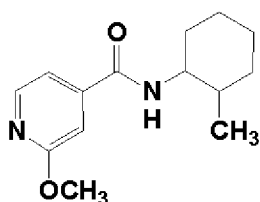
[化30]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94(0.9H, d, J=6.8Hz), 0.98(2.1H, d, J=6.3Hz), 1.08-2.07(9.0H, m), 3.63-3.73(0.7H, m), 4.22-4.28(0.3H, m), 5.99-6.21(1.0H, m), 7.50-7.54(1.0H, m), 7.61-7.64(1.0H, m), 8.47-8.50(1.0H, m).

本発明化合物13

[化31]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.93(0.9H, d, J=6.8Hz), 0.97(2.1H, d, J=6.6Hz), 1.13-2.04(9.0H, m), 3.63-3.73(0.7H, m), 3.96-3.98(3.0H, m), 4.21-4.28(0.3H, m), 5.84(0.7H, d, J=8.0Hz), 6.09(0.3H, d, J=7.6Hz), 7.02-7.03(1.0H, m), 7.15-7.17(1.0H, m), 8.24-8.27(1.0H, m).

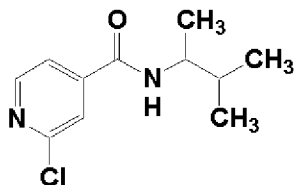
[0141] 製造例14

(1S)-1,2-ジメチルプロピルアミンの代わりに1,2-ジメチルプロピルアミンを

用いて製造例9記載の方法に準じた操作を行い、N-(1,2-ジメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド、次いで、N-(1,2-ジメチルプロピル)-2-メトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物14と記す。)を得た。

N-(1,2-ジメチルプロピル)-2-クロロイソニコチン酸アミド

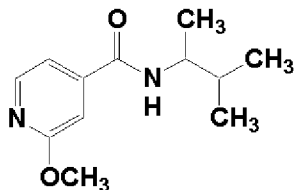
[化32]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.96(3H, d, $J=3.7\text{Hz}$), 0.98(3H, d, $J=3.7\text{Hz}$), 1.20(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.76–1.89(1H, m), 4.02–4.11(1H, m), 5.90–6.01(1H, m), 7.51(1H, dd, $J=5.1, 1.5\text{Hz}$), 7.62(1H, dd, $J=1.5, 0.7\text{Hz}$), 8.50(1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

本発明化合物14

[化33]



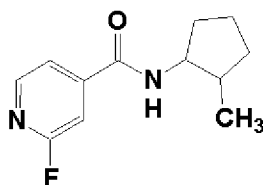
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.95(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 0.96(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.18(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.76–1.86(1H, m), 3.97(3H, s), 4.03–4.10(1H, m), 5.93(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.02(1H, dd, $J=1.5, 0.7\text{Hz}$), 7.15(1H, dd, $J=5.4, 1.5\text{Hz}$), 8.25(1H, dd, $J=5.1, 0.7\text{Hz}$).

[0142] 製造例15

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに2-メチルシクロペンチルアミン塩酸塩を用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-メチルシクロペンチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物15と記す。)を得た。

本発明化合物15

[化34]



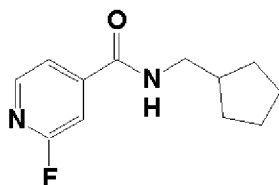
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.95 (0.9H, d, $J=7.0\text{Hz}$), 1.09 (2.1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.29–2.28 (7.0H, m), 3.93–4.01 (0.7H, m), 4.41–4.48 (0.3H, m), 6.02–6.06 (1.0H, br m), 7.25–7.27 (1.0H, m), 7.45–7.49 (1.0H, m), 8.32–8.34 (1.0H, m).

[0143] 製造例16

シクロヘキシルメチルアミンの代わりにシクロペンチルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(シクロペンチルメチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物16と記す。)を得た。

本発明化合物16

[化35]



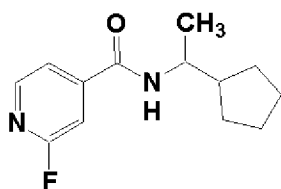
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.22–1.32 (3H, m), 1.55–1.86 (5H, m), 2.12–2.21 (1H, m), 3.41 (2H, dd, $J=7.2, 5.8\text{Hz}$), 6.25 (1H, br s), 7.26–7.27 (1H, m), 7.47–7.49 (1H, m), 8.33 (1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0144] 製造例17

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに1-シクロペンチルエチルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(1-シクロペンチルエチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物17と記す。)を得た。

本発明化合物17

[化36]



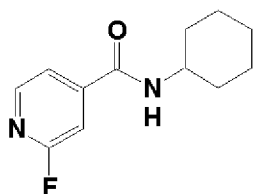
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.25 (3H, d, $J=6.5\text{Hz}$), 1.27–1.38 (2H, m), 1.55–1.85 (6H, m), 1.88–1.97 (1H, m), 4.03–4.12 (1H, m), 5.92–5.95 (1H, m), 7.24–7.25 (1H, m), 7.45–7.47 (1H, m), 8.33 (1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0145] 製造例18

シクロヘキシルメチルアミンの代わりにシクロヘキシルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(シクロヘキシル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物18と記す。)を得た。

本発明化合物18

[化37]



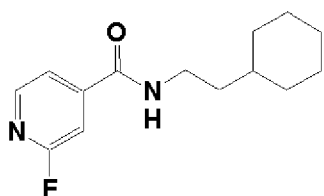
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.20–1.30 (3H, m), 1.37–1.49 (2H, m), 1.66–1.81 (3H, m), 2.02–2.06 (2H, m), 3.93–4.02 (1H, m), 5.95–5.97 (1H, m), 7.25–7.26 (1H, m), 7.45–7.47 (1H, m), 8.33 (1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0146] 製造例19

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに2-シクロヘキシルエチルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-シクロヘキシルエチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物19と記す。)を得た。

本発明化合物19

[化38]



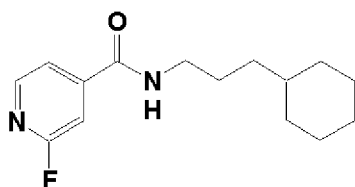
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.89–1.01 (2H, m), 1.09–1.40 (4H, m), 1.49–1.54 (2H, m), 1.62–1.77 (5H, m), 3.45–3.51 (2H, m), 6.38 (1H, br s), 7.27–7.28 (1H, m), 7.48 (1H, ddd, $J=5.3, 1.7, 1.6\text{Hz}$), 8.32 (1H, ddd, $J=5.3, 0.8, 0.7\text{Hz}$).

[0147] 製造例20

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに3-シクロヘキシルプロピルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(3-シクロヘキシルプロピル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物20と記す。)を得た。

本発明化合物20

[化39]



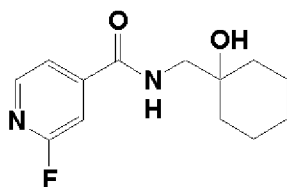
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.83–0.95 (2H, m), 1.08–1.29 (6H, m), 1.59–1.74 (7H, m), 3.41–3.47 (2H, m), 6.25 (1H, br s), 7.26–7.27 (1H, m), 7.47 (1H, ddd, $J=5.1, 1.7, 1.6\text{Hz}$), 8.33 (1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0148] 製造例21

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチルアミン塩酸塩を用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル-2-メトキシイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物21と記す。)を得た。

本発明化合物21

[化40]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.31–1.60(10H, m), 2.32(1H, s), 3.49(2H, d, $J=5.9\text{Hz}$), 6.87–6.89(1H, m), 7.31–7.31(1H, m), 7.51–7.53(1H, m), 8.31(1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

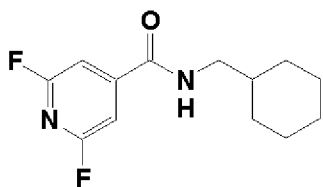
[0149] 製造例22

2, 6-ジフルオロイソニコチン酸1.0gと塩化チオニル1.3mlとDMF1滴とをトルエン5mlに加え、4時間加熱還流した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮して、2, 6-ジフルオロイソニコチン酸塩化物トルエン溶液6mlを得た。

上記の操作で得た2, 6-ジフルオロイソニコチン酸塩化物トルエン溶液1mlとシクロヘキシルメチルアミン0.16gとトリエチルアミン0.2mlとを酢酸エチル3mlに加え、室温で3時間攪拌した。その後、反応混合物を減圧下で濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2, 6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物22と記す。)0.22gを得た。

本発明化合物22

[化41]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.95–1.03(2H, m), 1.15–1.30(3H, m), 1.54–1.77(6H, m), 3.30(2H, dd, $J=6.8, 6.0\text{Hz}$), 6.44–6.46(1H, m), 7.16(2H, s).

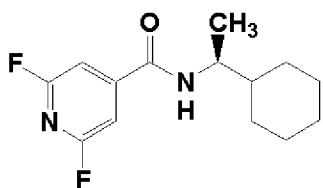
[0150] 製造例23

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに(1S)-1-シクロヘキシルエチルアミンを用いて製造例22記載の方法に準じた操作を行い、N-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2, 6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物23と記す。)を

得た。

本発明化合物23

[化42]



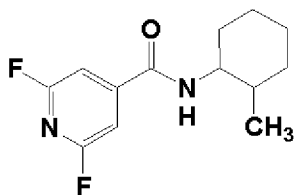
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.01–1.27 (8H, m), 1.40–1.46 (1H, m), 1.67–1.80 (5H, m), 4.01–4.10 (1H, m), 5.90–5.92 (1H, m), 7.13 (2H, s).

[0151] 製造例24

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに2-メチルシクロヘキシルアミンを用いて製造例22記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-メチルシクロヘキシル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物24と記す。)を得た。

本発明化合物24

[化43]



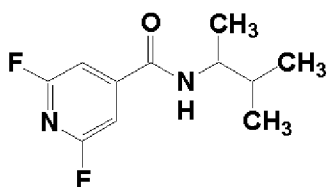
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.93–0.99 (3.0H, m), 1.02–2.05 (9.0H, m), 3.63–3.72 (0.7H, m), 4.21–4.27 (0.3H, m), 6.24–6.27 (1.0H, m), 7.13 (0.6H, s), 7.17 (1.4H, s).

[0152] 製造例25

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに1,2-ジメチルプロピルアミンを用いて製造例22記載の方法に準じた操作を行い、N-(1,2-ジメチルプロピル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物25と記す。)を得た。

本発明化合物25

[化44]



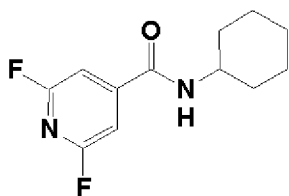
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.96 (3H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 0.98 (3H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 1.20 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.78–1.87 (1H, m), 4.01–4.09 (1H, m), 6.10 (1H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 7.14 (2H, s).

[0153] 製造例26

シクロヘキシルメチルアミンの代わりにシクロヘキシルアミンを用いて製造例22記載の方法に準じた操作を行い、N-(シクロヘキシル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物26と記す。)を得た。

本発明化合物26

[化45]



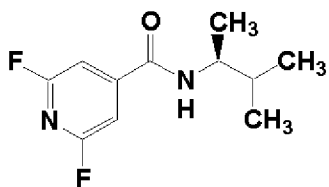
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.14–1.46 (5H, m), 1.66–1.80 (3H, m), 1.99–2.05 (2H, m), 3.89–3.99 (1H, m), 6.31–6.33 (1H, m), 7.15 (2H, s).

[0154] 製造例27

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに(1S)-1,2-ジメチルプロピルアミンを用いて製造例22記載の方法に準じた操作を行い、N-((1S)-1,2-ジメチルプロピル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物27と記す。)を得た。

本発明化合物27

[化46]



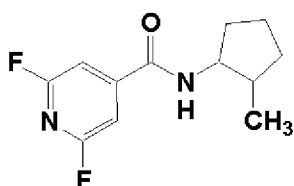
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.96 (3H, d, $J=3.2\text{Hz}$), 0.98 (3H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 1.20 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.78–1.87 (1H, m), 4.01–4.08 (1H, m), 6.08 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.14 (2H, s).

[0155] 製造例28

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに2-メチルシクロペンチルアミン塩酸塩を用いて製造例22記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-メチルシクロペンチル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物28と記す。)を得た。

本発明化合物28

[化47]



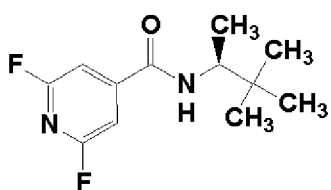
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.95 (1.2H, d, $J=7.0\text{Hz}$), 1.08 (1.8H, d, $J=6.5\text{Hz}$), 1.24–1.96 (6.0H, m), 2.04–2.30 (1.0H, m), 3.91–4.00 (0.6H, m), 4.39–4.46 (0.4H, m), 6.16–6.26 (1.0H, m), 7.14 (0.8H, s), 7.16 (1.2H, s).

[0156] 製造例29

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに(1S)-1,2,2-トリメチルプロピルアミンを用いて製造例22記載の方法に準じた操作を行い、N-((1S)-1,2,2-トリメチルプロピル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物29と記す。)を得た。

本発明化合物29

[化48]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.97 (9H, s), 1.18 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 4.04–4.

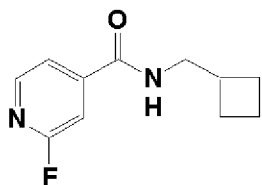
13(1H, m), 6.02(1H, d, J=8.2Hz), 7.12(2H, s).

[0157] 製造例30

シクロヘキシルメチルアミンの代わりにシクロブチルメチルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(シクロブチルメチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物30と記す。)を得た。

本発明化合物30

[化49]



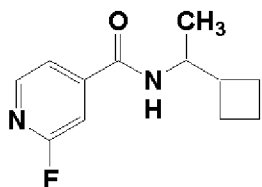
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.69–1.79(2H, m), 1.88–2.00(2H, m), 2.06–2.14(2H, m), 2.53–2.64(1H, m), 3.48(2H, dd, J=7.2, 6.0Hz), 6.60(1H, br s), 7.27–7.29(1H, m), 7.48–7.50(1H, m), 8.30(1H, dd, J=5.2, 0.6Hz).

[0158] 製造例31

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに1-シクロブチルエチルアミン塩酸塩を用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(1-シクロブチルエチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物31と記す。)を得た。

本発明化合物31

[化50]



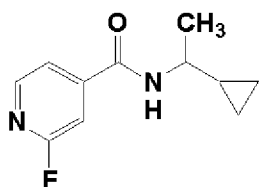
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.14(3H, d, J=6.8Hz), 1.71–1.93(4H, m), 1.95–2.09(2H, m), 2.31–2.41(1H, m), 4.10–4.19(1H, m), 6.44(1H, d, J=8.0Hz), 7.27–7.28(1H, m), 7.48–7.51(1H, m), 8.28(1H, d, J=5.1Hz).

[0159] 製造例32

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに1-シクロプロピルエチルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(1-シクロプロピルエチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物32と記す。)を得た。

本発明化合物32

[化51]



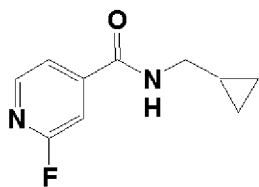
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.25–0.31 (1H, m), 0.36–0.60 (3H, m), 0.88–0.97 (1H, m), 1.31 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 3.50–3.59 (1H, m), 6.88 (1H, d, $J=7.0\text{Hz}$), 7.30–7.31 (1H, m), 7.52–7.54 (1H, m), 8.28 (1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0160] 製造例33

シクロヘキシルメチルアミンの代わりにシクロプロピルメチルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(シクロプロピルメチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物33と記す。)を得た。

本発明化合物33

[化52]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.26–0.30 (2H, m), 0.55–0.59 (2H, m), 1.01–1.13 (1H, m), 3.32 (2H, dd, $J=7.2, 5.6\text{Hz}$), 6.78 (1H, br s), 7.31–7.32 (1H, m), 7.52–7.54 (1H, m), 8.31 (1H, d, $J=5.3\text{Hz}$).

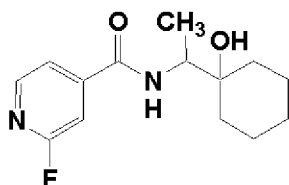
[0161] 製造例34

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチルア

ミン塩酸塩を用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(1-(1-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物34と記す。)を得た。

本発明化合物34

[化53]



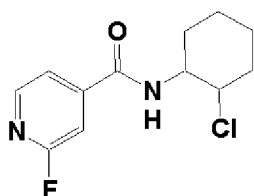
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.20–1.67(12H, m), 2.43–2.50(2H, m), 4.14–4.22(1H, m), 6.91(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 7.29–7.33(1H, m), 7.53(1H, ddd, $J=5.3, 1.7, 1.5\text{Hz}$), 8.30(1H, d, $J=5.3\text{Hz}$).

[0162] 製造例35

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに2-クロロシクロヘキシルアミン塩酸塩を用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-クロロシクロヘキシル)-2-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物35と記す。)を得た。

本発明化合物35

[化54]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.18–1.50(3H, m), 1.74–1.87(3H, m), 2.28–2.35(2H, m), 3.89(1H, td, $J=10.7, 4.2\text{Hz}$), 4.00–4.09(1H, m), 6.39(1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 7.30–7.31(1H, m), 7.51–7.53(1H, m), 8.34(1H, d, $J=5.3\text{Hz}$).

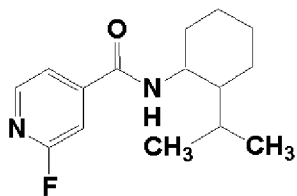
[0163] 製造例36

シクロヘキシルメチルアミンの代わりに2-(1-メチルエチル)シクロヘキシルアミンを用いて製造例4記載の方法に準じた操作を行い、各々、下記のスペクトルを示すN

－(2－(1－メチルエチル)シクロヘキシル)－2－フルオロイソニコチン酸アミドの2種の異性体(以下、各々を本発明化合物36及び37と記す。)を得た。

本発明化合物36

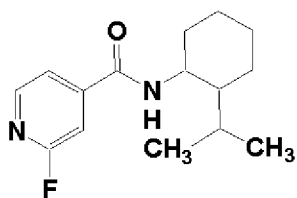
[化55]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.85(3H, d, $J=7.0\text{Hz}$), 0.93(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 1.08–2.11(10H, m), 3.97(1H, ddd, $J=20.4, 10.7, 4.0\text{Hz}$), 5.84(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.25–7.27(1H, m), 7.45–7.49(1H, m), 8.32–8.35(1H, m).

本発明化合物37

[化56]



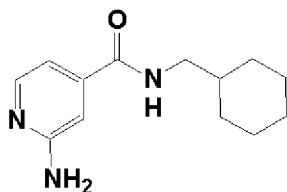
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.76–2.10(16H, m), 4.53–4.59(1H, m), 6.22(1H, d, $J=7.7\text{Hz}$), 7.23–7.25(1H, m), 7.44–7.48(1H, m), 8.34(1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0164] 製造例37

N－(シクロヘキシルメチル)－2－フルオロイソニコチン酸アミド0.23gと28%アンモニア水1mlとを、1,4－ジオキサン1mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名: Discover、CEM社製)にて $18\text{kgf}/\text{cm}^2$ 、 150°C の条件に50分間付した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N－(シクロヘキシルメチル)－2－アミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物38と記す。)0.22gを得た。

本発明化合物38

[化57]



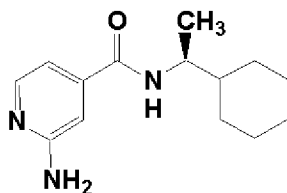
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.94–1.04 (2H, m), 1.12–1.31 (3H, m), 1.52–1.78 (6H, m), 3.28 (2H, dd, $J=6.5, 6.3\text{Hz}$), 4.59 (2H, s), 6.12–6.13 (1H, m), 6.83 (1H, dd, $J=5.3, 1.4\text{Hz}$), 6.86–6.87 (1H, m), 8.15 (1H, dd, $J=5.3, 0.7\text{Hz}$).

[0165] 製造例38

N-(シクロヘキシルメチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミドの代わりにN-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミドを用いて製造例37記載の方法に準じた操作を行い、N-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2-アミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物39と記す。)を得た。

本発明化合物39

[化58]



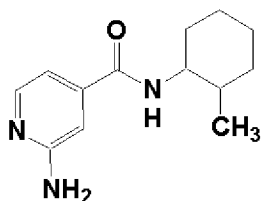
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.98–1.26 (8H, m), 1.38–1.45 (1H, m), 1.66–1.80 (5H, m), 4.00–4.07 (1H, m), 4.62 (2H, s), 5.89 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 6.83 (1H, dd, $J=5.2, 1.3\text{Hz}$), 6.86–6.86 (1H, m), 8.14 (1H, d, $J=5.1\text{Hz}$).

[0166] 製造例39

N-(シクロヘキシルメチル)-2-フルオロイソニコチン酸アミドの代わりにN-(2-メチルシクロヘキシル)-2-フルオロイソニコチン酸アミドを用いて製造例37記載の方法に準じた操作を行い、N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-アミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物40と記す。)を得た。

本発明化合物40

[化59]



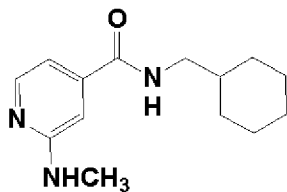
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \quad \delta : 0.93 (0.9\text{H}, \text{d}, J=7.0\text{Hz}), 0.97 (2.1\text{H}, \text{d}, J=6.5\text{Hz}), 1.09-2.06 (9.0\text{H}, \text{m}), 3.63-3.73 (0.7\text{H}, \text{m}), 4.21-4.27 (0.3\text{H}, \text{m}), 4.59-4.61 (2.0\text{H}, \text{m}), 5.82 (0.7\text{H}, \text{d}, J=8.2\text{Hz}), 6.08 (0.3\text{H}, \text{d}, J=7.2\text{Hz}), 6.82-6.87 (2.0\text{H}, \text{m}), 8.14-8.16 (1.0\text{H}, \text{m}).$

[0167] 製造例40

N-(シクロヘキシルメチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド0.30gを40%メチルアミン水溶液4mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名:Discover、CEM社製)にて $18\text{kgf}/\text{cm}^2$ 、 150°C の条件に10分間付した。室温付近まで放冷した反応混合物を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-メチルアミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物41と記す。)0.29gを得た。

本発明化合物41

[化60]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \quad \delta : 0.93-1.32 (5\text{H}, \text{m}), 1.52-1.81 (6\text{H}, \text{m}), 2.96 (3\text{H}, \text{d}, J=5.3\text{Hz}), 3.29 (2\text{H}, \text{dd}, J=6.4, 6.3\text{Hz}), 4.67-4.75 (1\text{H}, \text{br m}), 6.17 (1\text{H}, \text{br s}), 6.73 (1\text{H}, \text{dd}, J=5.2, 1.4\text{Hz}), 6.78 (1\text{H}, \text{s}), 8.15 (1\text{H}, \text{d}, J=5.2\text{Hz}).$

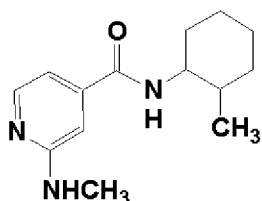
[0168] 製造例41

N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-クロロイソニコチン酸アミド0.40gを40%メ

チルアミン水溶液4mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名:Discover、CEM社製)にて18kgf/cm²、150℃の条件に10分間付した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-メチルアミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物42と記す。)0.42gを得た。

本発明化合物42

[化61]



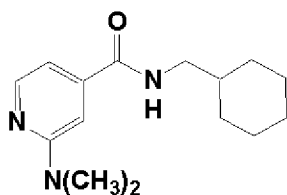
¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.93(0.9H, d, J=7.0Hz), 0.98(2.1H, d, J=6.5Hz), 1.09-2.06(9.0H, m), 2.95-2.98(3.0H, m), 3.63-3.73(0.7H, m), 4.21-4.28(0.3H, m), 4.70-4.77(1.0H, m), 5.83-5.90(0.7H, m), 6.08-6.16(0.3H, m), 6.72-6.78(2.0H, m), 8.14-8.18(1.0H, m).

[0169] 製造例42

N-(シクロヘキシルメチル)-2-クロロイソニコチン酸アミド0.30gを50%ジメチルアミン水溶液4mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名:Discover、CEM社製)にて18kgf/cm²、150℃の条件に10分間付した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-ジメチルアミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物43と記す。)0.35gを得た。

本発明化合物43

[化62]



¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.93-1.31(5H, m), 1.51-1.80(6H, m), 3.10

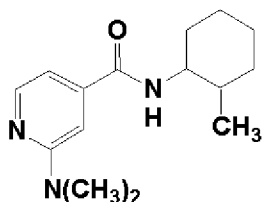
−3. 14(6H, m), 3. 29(2H, dd, J=6. 4, 6. 3Hz), 6. 20(1H, br s), 6. 67(1H, d, J=5. 3Hz), 6. 93(1H, s), 8. 21(1H, dd, J=5. 3, 0. 7Hz).

[0170] 製造例43

N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-クロロイソニコチン酸アミド0. 40gを50%ジメチルアミン水溶液4mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名:Discover、CEM社製)にて18kgf/cm²、150℃の条件に10分間付した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-ジメチルアミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物44と記す。)0. 47gを得た。

本発明化合物44

[化63]



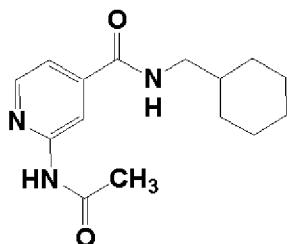
¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0. 93(0. 9H, d, J=7. 0Hz), 0. 98(2. 1H, d, J=6. 5Hz), 1. 09-2. 08(9. 0H, m), 3. 12-3. 13(6. 0H, m), 3. 63-3. 74(0. 7H, m), 4. 22-4. 28(0. 3H, m), 5. 87(0. 7H, d, J=8. 2Hz), 6. 12(0. 3H, d, J=7. 7Hz), 6. 65-6. 67(1. 0H, m), 6. 91-6. 94(1. 0H, m), 8. 20-8. 24(1. 0H, m).

[0171] 製造例44

テトラヒドロフラン1ml、N-(シクロヘキシルメチル)-2-アミノイソニコチン酸アミド0. 14g及びピリジン0. 28gの混合物に、アセチルクロライド0. 5gを氷冷下で滴下し、該混合物を室温で12時間攪拌した。その後、反応混合物を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-(メチルカルボニルアミノ)イソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物45と記す。)0. 14gを得た。

本発明化合物45

[化64]



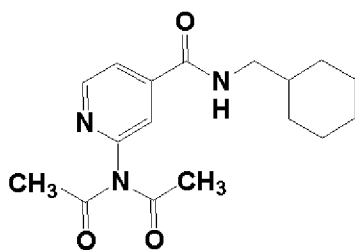
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94–1.03 (2H, m), 1.11–1.31 (3H, m), 1.54–1.79 (6H, m), 2.24 (3H, s), 3.30 (2H, dd, $J=6.5, 6.5\text{Hz}$), 6.36 (1H, s), 7.51 (1H, dd, $J=5.1, 1.4\text{Hz}$), 8.28 (1H, br s), 8.37 (1H, d, $J=5.3\text{Hz}$), 8.43 (1H, s).

[0172] 製造例45

テトラヒドロフラン1ml、N-(シクロヘキシルメチル)-2-アミノイソニコチン酸アミド0.19g及びトリエチルアミン0.22mlの混合物に、アセチルクロライド0.08gを氷冷下で滴下し、該混合物を室温で10分間攪拌した。その後、反応混合物に酢酸エチルを加え、セライト(登録商標)を通して濾過した。濾液を減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-(ジ(メチルカルボニル)アミノ)イソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物46と記す。)0.11gを得た。

本発明化合物46

[化65]



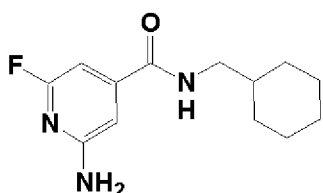
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.94–1.04 (2H, m), 1.10–1.31 (3H, m), 1.52–1.63 (1H, m), 1.68–1.79 (5H, m), 2.30 (6H, s), 3.28 (2H, dd, $J=6.7, 6.2\text{Hz}$), 6.44 (1H, br s), 7.54–7.54 (1H, m), 7.63 (1H, dd, $J=4.9, 1.5\text{Hz}$), 8.66–8.67 (1H, m).

[0173] 製造例46

N-(シクロヘキシルメチル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド0.14gと28%アンモニア水1mlとを、1,4-ジオキサン1mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名:Discover、CEM社製)にて18kgf/cm²、120℃の条件に5分間付した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-アミノ-6-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物47と記す。)0.10gを得た。

本発明化合物47

[化66]



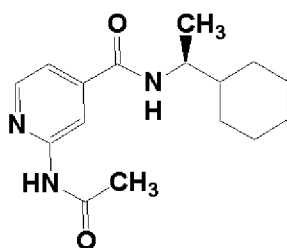
¹H-NMR(CDCl₃) δ:0.95-1.04(2H, m), 1.16-1.30(3H, m), 1.52-1.60(1H, m), 1.67-1.77(5H, m), 3.28(2H, dd, J=6.5, 6.3Hz), 4.67(2H, s), 6.05(1H, br s), 6.41-6.42(1H, m), 6.68-6.68(1H, m).

[0174] 製造例47

N-(2-メチルシクロヘキシル)-2-アミノイソニコチン酸アミドの代わりにN-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2-アミノイソニコチン酸アミドを用いて製造例44記載の方法に準じた操作を行い、N-(1-シクロヘキシルエチル)-2-(メチルカルボニルアミノ)イソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物48と記す。)を得た。

本発明化合物48

[化67]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.72–1.79(14H, m), 2.25(3H, s), 4.01–4.09(1H, m), 6.23(1H, br s), 7.52–7.54(1H, m), 8.04–8.06(1H, m), 8.28(1H, d, $J=5.1\text{Hz}$), 8.50(1H, s).

[0175] 製造例48

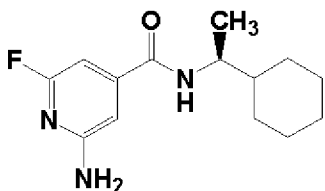
N-(シクロヘキシルメチル)-1,2-ジヒドロ-2-オキシイソニコチン酸アミドとヨウ化メチルと炭酸セシウムとをDMFに加え、室温で攪拌する。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮する。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-(シクロヘキシルメチル)-2-メトキシイソニコチン酸アミド(本発明化合物1)を得る。

[0176] 製造例49

N-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド0.28gと28%アンモニア水1mlとを、1,4-ジオキサン1mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名:Discover、CEM社製)にて $18\text{kgf}/\text{cm}^2$ 、 120°C の条件に7分間付した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮し、析出した固体を濾集し、水及びヘキサンで順次洗浄し、乾燥してN-((1S)-1-シクロヘキシルエチル)-2-アミノ-6-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物49と記す。)0.16gを得た。

本発明化合物49

[化68]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.99–1.29(8H, m), 1.37–1.46(1H, m), 1.63–1.79(5H, m), 3.98–4.07(1H, m), 4.70(2H, br s), 5.84(1H, d, $J=7.7\text{Hz}$), 6.41(1H, dd, $J=1.7, 1.0\text{Hz}$), 6.67(1H, dd, $J=1.6, 1.1\text{Hz}$).

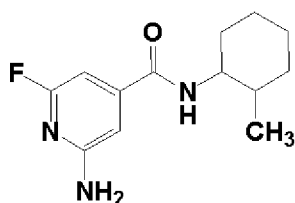
[0177] 製造例50

N-(2-メチルシクロヘキシル)-2,6-ジフルオロイソニコチン酸アミド0.23gと

28%アンモニア水1mlとを、1, 4-ジオキサン1mlに加え、マイクロウェーブ反応装置(製品名:Discover、CEM社製)にて18kgf/cm²、120℃の条件に7分間付した。室温付近まで放冷した反応混合物を減圧下で濃縮し、析出した固体を濾集し、水及びヘキサンで順次洗浄し、乾燥してN-(2-メチルシクロヘキシル)-2-アミノ-6-フルオロイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物50と記す。)0.15gを得た。

本発明化合物50

[化69]



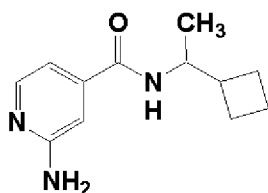
¹H-NMR(CDCl₃) δ: 0.93(1.2H, d, J=6.8Hz), 0.97(1.8H, d, J=6.3Hz), 1.12-1.79(8.0H, m), 1.94-2.06(1.0H, m), 3.65-3.70(0.6H, m), 4.20-4.24(0.4H, m), 4.68(2.0H, br s), 5.75(0.6H, d, J=5.1Hz), 6.01(0.4H, d, J=6.8Hz), 6.41(1.0H, br s), 6.67-6.68(1.0H, m).

[0178] 製造例51

2-アミノイソニコチン酸0.30g、1-シクロブチルエチルアミン塩酸塩0.30g、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール0.38g、トリエチルアミン0.30g及びWSC0.54gとをDMF4mlに加え、室温で1日攪拌した。反応液に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付してN-(1-シクロブチルエチル)-2-アミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物51と記す。)0.22gを得た。

本発明化合物51

[化70]



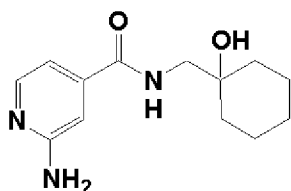
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.13 (3H, d, $J=6.5\text{Hz}$), 1.73–2.09 (6H, m), 2.28–2.39 (1H, m), 4.10–4.19 (1H, m), 4.58 (2H, s), 5.72–5.81 (1H, m), 6.81 (1H, dd, $J=5.2, 1.4\text{Hz}$), 6.85–6.86 (1H, m), 8.14 (1H, dd, $J=5.2, 0.6\text{Hz}$).

[0179] 製造例52

2-アミノイソニコチン酸0.30g、(1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチルアミン塩酸塩0.43g、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール0.38g、トリエチルアミン0.30g及びWSC0.54gとをDMF4mlに加え、室温で1日攪拌した。反応液に水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付してN-((1-ヒドロキシシクロヘキシル)メチル)-2-アミノイソニコチン酸アミド(以下、本発明化合物52と記す。)0.40gを得た。

本発明化合物52

[化71]



$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.48–1.62 (10H, m), 2.22 (1H, br s), 3.47 (2H, d, $J=5.8\text{Hz}$), 4.63 (2H, br s), 6.60 (1H, br s), 6.86–6.87 (2H, m), 8.11–8.13 (1H, m).

[0180] 次に製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

[0181] 製剤例1

本発明化合物1～52の何れか50部を、リグニンスルホン酸カルシウム3部、ラウリル硫酸マグネシウム2部及び合成含水酸化珪素45部をよく粉碎混合することにより、各

々の水和剤を得る。

[0182] 製剤例2

本発明化合物1～52の何れか20部とソルビタントリオレート1.5部とを、ポリビニルアルコール2部を含む水溶液28.5部と混合し、湿式粉碎法で微粉碎する。得られた微粉末中に、キサントガム0.05部及びアルミニウムマグネシウムシリケート0.1部を含む水溶液40部を加え、さらにプロピレングリコール10部を加えて攪拌混合し、各々のフロアブル製剤を得る。

[0183] 製剤例3

本発明化合物1～52の何れか2部、カオリンクレー88部及びタルク10部をよく粉碎混合することにより、各々の粉剤を得る。

[0184] 製剤例4

本発明化合物1～52の何れか5部、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル14部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム6部及びキシレン75部をよく混合することにより、各々の乳剤を得る。

[0185] 製剤例5

本発明化合物1～52の何れか2部、合成含水酸化珪素1部、リグニンスルホン酸カルシウム2部、ベントナイト30部及びカオリンクレー65部をよく粉碎混合する。得られた混合物に水を加えてよく練り合せ、造粒乾燥することにより、各々の粒剤を得る。

[0186] 製剤例6

本発明化合物1～52の何れか10部;ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩50部を含むホワイトカーボン35部;及び水55部を混合する。得られた混合物に湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

[0187] 次に、本発明化合物が植物病害の防除に有用であることを試験例で示す。

下記試験例において、茎葉散布は、得られた液を1種ずつ、それぞれ別々の植物に散布することにより行った。

なお防除効果は、調査時の供試植物上の病斑の面積を目視観察し、本発明化合物で処理した植物の病斑の面積と、この植物と同様に病原菌を接種し上記処理をしなかった植物の病斑の面積を比較することにより評価した。

[0188] 試験例1

コムギうどんこ病予防効果試験 (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ(品種;シロガネ)を播種し、温室内で10日間生育させた。

その後、本発明化合物1、3～8及び12～37の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記コムギの葉面に充分付着するように茎葉散布した。

上記茎葉散布後、植物を風乾し、病原菌の胞子をふりかけ接種した。接種後、23℃の温室に7日間置いた後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物8、16、17、18、21、22、24、26、28、31及び35の何れかで処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0189] 試験例2

コムギふ枯れ病予防効果試験 (*Stagonospora nodorum*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ(品種;シロガネ)を播種し、温室内で10日間生育させた。

その後、本発明化合物1及び3～37の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記コムギの葉面に充分付着するように茎葉散布した。

上記茎葉散布後、植物を風乾し、コムギふ枯れ病菌胞子の水懸濁液を噴霧接種した。

接種後はじめは18℃、暗黒多湿下に4日間置き、さらに照明下に4日間置いた後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物4、17～31の何れかで処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0190] 試験例3

コムギ赤かび病予防効果試験 (*Fusarium culmorum*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ(品種;シロガネ)を播種し、温室内で10

日間生育させた。

その後、本発明化合物1、3～8及び12～37の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記コムギの葉面に充分付着するように茎葉散布した。

上記茎葉散布後、植物を風乾し、コムギ赤かび病菌胞子の水懸濁液を噴霧接種した。

接種後はじめは23℃、暗黒多湿下に4日間置き、さらに照明下に3日間置いた後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物15、16、17及び22の何れかで処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0191] 試験例4

キュウリ灰色かび病予防効果試験 (*Botrytis cinerea*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ(品種;相模半白)を播種し、温室内で12日間生育させた。

本発明化合物1、3～48の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記キュウリ葉面に充分付着するように茎葉散布した。

上記茎葉散布後、植物を風乾し、キュウリ灰色かび病菌の胞子含有PDA培地をキュウリ葉面上に置いた。接種後12℃、多湿下に4日間置いた後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物1、18、22、26及び35の何れかで処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0192] 試験例5

キュウリ菌核病予防効果試験 (*Sclerotinia sclerotiorum*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ(品種;相模半白)を播種し、温室内で12日間生育させた。

本発明化合物3～48の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記キュウリ葉面に充分付着するように茎葉散布した。

上記茎葉散布後、植物を風乾し、菌核病菌の菌糸含有PDA培地をキュウリ葉面上に置いた。接種後18℃、多湿下に4日間置いた後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物3、4、24、26及び35の何れかで処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0193] 試験例6

ダイコン黒斑病予防効果試験(*Alternaria brassicicola*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、ダイコン(品種;早生40日)を播種し、温室内で5日間生育させた。

本発明化合物1、3～48の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記ダイコン葉面に充分付着するように茎葉散布した。

上記茎葉散布後、植物を風乾し、ダイコン黒斑病菌胞子の水懸濁液を噴霧接種した。接種後はじめは24℃、多湿下に1日間置き、さらに温室内で3日間置いた後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物4又は35で処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0194] 試験例7

ブドウべと病治療効果試験(*Plasmopara viticola*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、ブドウ(品種;ベリーAの実生)を播種し、温室内で40日間生育させた。上記ポットにブドウべと病菌遊走子嚢の水懸濁液を噴霧接種し、23℃、多湿下に1日間置いた後、風乾し、ブドウべと病感染苗とした。

本発明化合物15～48の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記ブドウ苗の葉面に充分付着するように茎葉散布した。

上記茎葉散布後、植物を風乾し、23℃の温室内で5日間置き、さらに23℃多湿下に1日間置いた後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物15、16、18、21、22、24、26、28、31、34及び35の何れかで処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0195] 試験例8

トマト疫病予防効果試験 (*Phytophthora infestans*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、トマト(品種:パティオ)を播種し、温室内で20日間生育させた。

本発明化合物1、3～52の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記トマト苗の葉面に充分付着するように茎葉散布した。葉面上の該希釈液が乾く程度に風乾した後、トマト疫病菌胞子の水懸濁液を噴霧接種した。

上記茎葉接種後、はじめは23℃、多湿下に1日間置き、さらに温室内で4日間栽培した後、病斑面積を調査した。

その結果、本発明化合物1、4、7、8、10、13、15、23、32、34、38、39、41、43、45、46、49及び52の何れかで処理した植物における病斑面積は、上記茎葉散布をしなかった植物における病斑面積の30%以下であった。

[0196] 試験例9

イネいもち病予防効果試験 (*Magnaporthe grisea*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、イネ(品種;日本晴)を播種し、温室内で20日間生育させた。その後、本発明化合物1、3～52の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記イネの葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後、植物を風乾し、昼間24℃、夜間20℃多湿下で、いもち病菌に罹病したイネ苗(品種;日本晴)と接触させながら6日間置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物51で処理した植物における病斑面積は、無処理の植物における病斑面積の30%以下であった。

[0197] 試験例10

コムギ葉枯病予防効果試験 (*Septoria tritici*)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ(品種;アポジー)を播種し、温室内で10日間生育させた。本発明化合物49~52の各々を製剤例6に準じてフロアブル製剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、上記コムギの葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾し、3日後または4日後にコムギ葉枯病菌胞子の水懸濁液を噴霧接種した。接種後はじめは18℃多湿下に3日置き、さらに照明下に14日から18日間置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物50で処理した植物における病斑面積は、無処理の植物における病斑面積の30%以下であった。

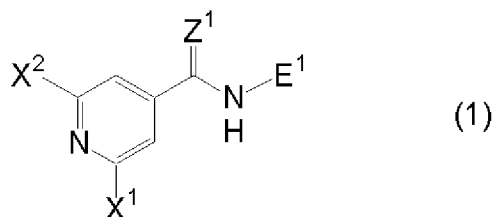
産業上の利用可能性

[0198] 本発明により、植物病害を防除することができる。

請求の範囲

[1] 式(1):

[化1]



〔式中、

X^1 はフッ素原子、C1-C4アルコキシ基、C3-C4アルケニルオキシ基、C3-C4アルキニルオキシ基又は NR^1R^2 基を表し、

X^2 は水素原子、フッ素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、C1-C4ハロアルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ヒドロキシアルキル基、シアノ基、ホルミル基、 NR^3R^4 基、 CO_2R^5 基、 $CONR^6R^7$ 基、又は、メチル基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいフェニル基を表し、

Z^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、

E^1 は A^1-Cy^1 で示される基又は $A^2-CR^8R^9R^{10}$ で示される基を表し、

A^1 は単結合、メチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-CH(CH_2CH_3)-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、シクロプロピリデン、又は、C1-C3ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基及びC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンを表し、

A^2 はメチレン、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-CH(CH_2CH_3)-$ 、又は、C1-C3ハロアルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基及びC2-C5アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンを表し、

Cy^1 は下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルケニル基、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で

置換されていてもよく、かつ環を形成するメチレンの1つがカルボニル基に置換されたC3-C6シクロアルキル基、又は、下記群[a-1]より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6ヒドロキシイミノシクロアルキル基を表し、

R¹及びR²は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表し、

R³及びR⁴は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表し、

R⁵はC1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基又はC3-C4アルキニル基を表し、

R⁶は水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基、C2-C4ハロアルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表し、

R⁷は水素原子、C1-C4アルキル基、C3-C4アルケニル基、C3-C4アルキニル基又はC2-C4ハロアルキル基を表し、

R⁸及びR⁹は独立してC1-C4アルキル基を表し、

R¹⁰は水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、シアノ基、カルボキシ基、C2-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C2-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基、(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基、(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基、メルカプト基、カルバモイル基、C2-C6シアノアルキル基、C1-C3アルキルスルホニル基又はNR¹¹R¹²基[式中、R¹¹及びR¹²は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。]を表す。

群[a-1]:

ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、カルボキシル基、C2-C5アルコキシカルボニル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基、(C1-C3アルキルアミノ)C1-C6アルキル基、(ジ(C1-C3アルキル)アミノ)C1-C6アルキル基、メルカプト基、カルバモイル基、ホルミル基、C2-C6シアノアルキル基、C1-C3アルキルスルホニル基、フェノキシ基又は $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 基〔式中、 R^{13} 及び R^{14} は独立して水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C5アルキルカルボニル基、C2-C5アルコキシカルボニル基又はC1-C4アルキルスルホニル基を表す。〕]

で示されるアミド化合物。

- [2] A^1 が単結合、メチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンであり、

A^2 がメチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンであり、

R^{10} が水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C3アルキルチオ基又はC1-C6ヒドロキシアルキル基であり、

群[a-1]が、

ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基である

請求項1記載のアミド化合物。

- [3] A^1 が単結合、メチレン又は $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ であり、
 A^2 がメチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 又は $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ であり、
 R^{10} が水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C3アルキルチオ基又はC1-C6ヒドロキシアルキル基であり、
 Cy^1 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルキル基、又は、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基及びヒドロキシル基より選ばれる少なくとも1個の基で置換されていてもよいC3-C6シクロアルケニル基である請求項1又は2記載のアミド化合物。
- [4] E^1 が $A^1-\text{Cy}^1$ で示される基であり、 A^1 が単結合、メチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレンであり、
群[a-1]が、ハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ヒドロキシル基、シアノ基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C3アルキルチオ基、環を形成する炭素原子との2重結合を形成するC1-C3アルキリデン基、C1-C6ヒドロキシアルキル基、C2-C4アルキルカルボニルオキシ基である請求項1又は2記載のアミド化合物。
- [5] E^1 が $A^2-\text{CR}^8\text{R}^9\text{R}^{10}$ で示される基であり、 A^2 がメチレン、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$ 、又は、C2-C4アルケニル基及びC2-C4アルキニル基からなる群より選ばれる少なくとも1個の基で置換されたメチレン基であり、 R^{10} が水素原子、C1-C4アルキル基、C2-C4アルケニル基、C2-C4アルキニル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、C1-C6アルコキシ基、C3-C6アルケニルオキシ基、C1-C3アルキルチオ基又はC1-C6ヒドロキシアルキル基である請求項1又は2記載のアミド化合物。
- [6] X^1 がフッ素原子、C1-C4アルコキシ基又は NR^1R^2 基であり、 R^1 が水素原子又はC1-C4アルキル基であり、 R^2 が水素原子又はC1-C4アルキル基であり、 Z^1 が酸素原子である請求項1～5のいずれか一項記載のアミド化合物。

- [7] X^1 がフッ素原子、メキシ基又はアミノ基であり、 X^2 が水素原子、フッ素原子、メキシ基、メチルチオ基又はアミノ基であり、 Z^1 が酸素原子である請求項1～5のいずれか一項記載のアミド化合物。
- [8] 請求項1～7のいずれか一項記載のアミド化合物を含有することを特徴とする植物病害防除組成物。
- [9] 請求項1～7のいずれか一項記載のアミド化合物の有効量を植物又は土壤に施用することを特徴とする植物病害の防除方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/062573

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D213/81(2006.01) i, A01N43/40(2006.01) i, A01P3/00(2006.01) i

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)

C07D213/81, A01N43/40, A01P3/00

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	1996-2008
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2008	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2008

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 2006/084246 A2 (SENOYX, INC.), 10 August, 2006 (10.08.06), Full text; particularly, Compound No.E65 & JP 2008-530020 A & JP 2007-517493 A & JP 2007-512227 A & US 2007/0104709 A1 & EP 1848289 A2 & WO 2005/041684 A2 & WO 2005/015158 A2 & KR 10-2007-0104456 A & CN 101052725 A	1-4, 6, 7
X	JP 2004-538277 A (Bayer CropScience S.A.), 24 December, 2004 (24.12.04), Full text; particularly, Claims; example 21 & US 2004/0152698 A1 & US 2006/0205732 A1 & EP 1275301 A1 & WO 2003/006454 A2	1-9

☒ 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
18 August, 2008 (18.08.08)

Date of mailing of the international search report
26 August, 2008 (26.08.08)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/062573

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 4-112872 A (Nippon Kayaku Co., Ltd.), 14 April, 1992 (14.04.92), Full text; particularly, Claims; Compound No.1 (Family: none)	1-9
Y	JP 62-265265 A (Nippon Kayaku Co., Ltd.), 18 November, 1987 (18.11.87), Full text; particularly, Claims; Compounds No.6, 9, 10 & US 4804762 A & EP 246507 A1 & CN 87104160 A	1-9
Y	JP 63-275566 A (Nippon Kayaku Co., Ltd.), 14 November, 1988 (14.11.88), Full text; particularly, Claims; Compound No.13 (Family: none)	1-9
Y	JP 59-227845 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 21 December, 1984 (21.12.84), Full text; particularly, Claims; Compound No.34 & US 4709052 A & US 5075488 A & EP 128006 A2 & DE 3485073 A & AU 2885684 A & CA 1261839 A	1-9
Y	JP 2-229161 A (Nippon Kayaku Co., Ltd.), 11 September, 1990 (11.09.90), Full text; particularly, Claims; Compound No.4 (Family: none)	1-9
Y	WO 2004/024692 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG.), 25 March, 2004 (25.03.04), Full text; particularly, Claims; examples 4, 15 to 18, 24, 33, 35 to 40 & DE 10239481 A	1-9
Y	JP 63-130582 A (Nippon Kayaku Co., Ltd.), 02 June, 1988 (02.06.88), Full text; particularly, Claims; examples & US 4804762 A & EP 246507 A1 & CN 87104160 A	1-9
Y	JP 1-283271 A (CIBA-Geigy AG.), 14 November, 1989 (14.11.89), Full text; particularly, Claims; examples & US 5049569 A & EP 334812 A2 & AU 3170189 A & ZA 8902215 A	1-9
A	JP 2007-145816 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 14 June, 2007 (14.06.07), Full text; particularly, Claims; examples & WO 2007/049729 A2	1-9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/062573

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2007-145817 A (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 14 June, 2007 (14.06.07), Full text; particularly, Claims; examples & WO 2007/049728 A1	1-9

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. C07D213/81 (2006.01)i, A01N43/40 (2006.01)i, A01P3/00 (2006.01)i

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 (I P C))

Int.Cl. C07D213/81, A01N43/40, A01P3/00

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	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 0 8 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 0 8 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 0 8 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 2006/084246 A2 (SENO MYX, INC.) 2006.08.10, 全文、特に、化合物番号 E 6 5 参照 & JP 2008-530020 A & JP 2007-517493 A & JP 2007-512227 A & US 2007/0104709 A1 & EP 1848289 A2 & WO 2005/041684 A2 & WO 2005/015158 A2 & KR 10-2007-0104456 A & CN 101052725 A	1-4, 6, 7

☒ 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

1 8 . 0 8 . 2 0 0 8

国際調査報告の発送日

2 6 . 0 8 . 2 0 0 8

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (I S A / J P)

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

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)

榎本 佳予子

4 P

9 6 3 8

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2

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	JP 2004-538277 A (バイエル・クロツプサイエンス・エス・アー) 2004. 12. 24, 全文、特に、特許請求の範囲、実施例 2 1 参照 & US 2004/0152698 A1 & US 2006/0205732 A1 & EP 1275301 A1 & WO 2003/006454 A2	1-9
Y	JP 4-112872 A (日本化薬株式会社) 1992. 04. 14, 全文、特に、特許請求の範囲、化合物N o. 1 参照 (ファミリーなし)	1-9
Y	JP 62-265265 A (日本化薬株式会社) 1987. 11. 18, 全文、特に、特許請求の範囲、化合物N o. 6、9、1 0 参照 & US 4804762 A & EP 246507 A1 & CN 87104160 A	1-9
Y	JP 63-275566 A (日本化薬株式会社) 1988. 11. 14, 全文、特に、特許請求の範囲、化合物N o. 1 3 参照 (ファミリーなし)	1-9
Y	JP 59-227845 A (住友化学工業株式会社) 1984. 12. 21, 全文、特に、特許請求の範囲、化合物番号 3 4 参照 & US 4709052 A & US 5075488 A & EP 128006 A2 & DE 3485073 A & AU 2885684 A & CA 1261839 A	1-9
Y	JP 2-229161 A (日本化薬株式会社) 1990. 09. 11, 全文、特に、特許請求の範囲、化合物N o. 4 参照 (ファミリーなし)	1-9
Y	WO 2004/024692 A1 (BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT) 2004. 03. 25, 全文、特に、特許請求の範囲、実施例 4、1 5 ~ 1 8、2 4、3 3、 3 5 ~ 4 0 参照 & DE 10239481 A	1-9
Y	JP 63-130582 A (日本化薬株式会社) 1988. 06. 02, 全文、特に、特許請求の範囲、実施例参照 & US 4804762 A & EP 246507 A1 & CN 87104160 A	1-9
Y	JP 1-283271 A (チバーガイギー アクチエンゲゼルシャフト) 1989. 11. 14, 全文、特に、特許請求の範囲、実施例参照 & US 5049569 A & EP 334812 A2 & AU 3170189 A & ZA 8902215 A	1-9

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
A	JP 2007-145816 A (住友化学株式会社) 2007.06.14, 全文、特に、特許請求の範囲、実施例参照 & WO 2007/049729 A2	1-9
A	JP 2007-145817 A (住友化学株式会社) 2007.06.14, 全文、特に、特許請求の範囲、実施例参照 & WO 2007/049728 A1	1-9