(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2010 年 11 月 25 日(25.11.2010)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2010/134635 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 277/20 (2006.01) *A01P 3/00* (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01) *C07D 277/56* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2010/058863

(22) 国際出願日: 2010 年 5 月 19 日(19.05.2010)

(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 2009-121871 2009 年 5 月 20 日(20.05.2009) 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２７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): 有本翔(**ARIMOTO, Sho**) [JP/JP]; 〒5600021 大阪府豊中市本町８－７－２０－３０４ Osaka (JP). 大平大輔(**OOHIRA, Daisuke**) [JP/JP]; 〒5610802 大阪府豊中市曽根東町２－１０－３－３１６ Osaka (JP). 久保田真由美(**KUBOTA, Mayumi**) [JP/JP]; 〒5610802 大阪府豊中市曽根東町２－１０－４－４４２ Osaka (JP). 倉橋真(**KURAHASHI, Makoto**) [JP/JP]; 〒6638201 兵庫県西宮市田代町１３－１６－２０１ Hyogo (JP).

(74) 代理人: 中山亨, 外(**NAKAYAMA, Tohru** et al.); 〒5418550 大阪府大阪市中央区北浜四丁目５番３３号住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, 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, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

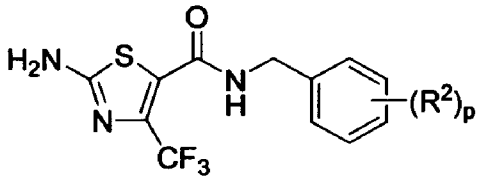
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), 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（条約第 21 条(3)）

(54) **Title**: AMIDE COMPOUND AND USE THEREOF FOR CONTROL OF PLANT DISEASES

(54) 発明の名称 : アミド化合物とその植物病害防除用途



（１）

(57) **Abstract**: An amide compound represented by formula (1) [wherein p represents an integer of 1 to 5, and R^2 is as defined in the description and represents a halogen atom, a cyano group, a nitro group, or the like] or a salt thereof, which has an excellent plant disease control effect.

(57) 要約: 式（１）〔式中、ｐは１から５の整数を表し、Ｒ^{2}はハロゲン、シアノ基、ニトロ基等の明細書中に記載の定義を表す。〕で示されるアミド化合物又はその塩は優れた植物病害防除効力を有する。

WO 2010/134635 A1

明細書

アミド化合物とその植物病害防除用途

技術分野

本発明は、アミド化合物及びその植物病害防除用途に関する。

背景技術

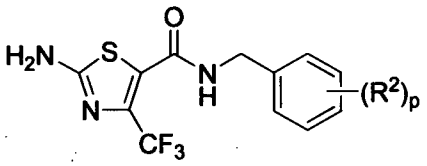
従来より、植物病害の防除のために多くの化合物が開発され、使用されてきた。

発明の開示

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。

本発明者等は、優れた植物病害防除効力を有する化合物を見出すべく鋭意検討した結果、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、本発明を完成した。すなわち、本発明は以下のものである。

［１］　式（１）



（１）

〔式中、

ｐは１から５の整数のいずれかを表し、

Ｒ^{2}は群Ｃより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ１～Ｃ５鎖式炭化水素基、群Ｄより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ３～Ｃ１０シクロアルキル基、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲン、シアノ基、ニトロ基、－Ｏ－Ｒ^{5}基、－Ｓ－Ｒ^{5}基、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ^{5}基、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＲ^{5}基、－ＯＣ（＝Ｏ）－Ｒ^{5}基、－ＮＲ^{5}Ｒ^{6}基、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＲ^{5}Ｒ^{6}基又は－ＮＲ^{5}－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ^{6}基を表すか、

或いは、ｐが２以上あり、かつ２つのＲ^{2}がベンゼン環の隣接する炭素に結合する

場合には、該２つのR^2が結合して、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ２～Ｃ５ポリメチレン基、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいプロペン－１，３－ジイル基、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよい１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基又はメチレンジオキシ基を表し、

R^5及びR^6は独立して、水素、群Ｃより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ１～Ｃ１０鎖式炭化水素基、群Ｄより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ３～Ｃ１０シクロアルキル基又は群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいフェニル基を表す。

但し、ｐが２から５の整数のいずれかである場合、R^2は相互に同一又は相異なる。

なお、群Ｃは群Ｄより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ３～Ｃ１０シクロアルキル基、ハロゲン、シアノ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルコキシ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルチオ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルフィニル基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルホニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルコキシ）カルボニル基及びハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニルオキシ基からなる群を表し、

群Ｄはハロゲン、シアノ基、ニトロ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ１０鎖式炭化水素基、群Ｄより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ３～Ｃ１０シクロアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルコキシ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルチオ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルフィニル基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルホニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルコキシ）カルボニル基及びハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニルオキシ基からなる群を表す。〕

で示されるアミド化合物（以下、本発明化合物と記す）又はその塩。

［２］　R^2がハロゲンである［１］記載のアミド化合物又はその塩。

［３］　R^2がフッ素又は塩素である［１］記載のアミド化合物又はその塩。

［４］　R^2がフッ素又は臭素である［１］記載のアミド化合物又はその塩。

［５］　ｐが３であり、R^2は相互に同一又は相異なり、ハロゲンである［１］記載のアミド化合物又はその塩。

［６］　ｐが３であり、R^2は相互に同一又は相異なり、フッ素又は塩素である［１］記載のアミド化合物又はその塩。

［７］　ｐが３であり、R^2は相互に同一又は相異なり、フッ素又は臭素である請求項１記載のアミド化合物又はその塩。

［８］　［１］～［７］いずれか１項記載のアミド化合物又はその塩と、不活性担体と、を含有する植物病害防除剤。

［９］　［１］～［７］いずれか１項記載のアミド化合物又はその塩の有効量を植物又は植物が生育する土壌に施用する工程を有する植物病害の防除方法。

［１０］　植物病害を防除するための［１］～［７］いずれか１項記載のアミド化合物又はその塩の使用。

発明を実施するための形態

本明細書の記載において用いられる種々の置換基について、例を挙げて以下に説明する。

「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素および沃素を意味する。

「群Ｃより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ１～Ｃ５鎖式炭化水素基」としては、例えばシクロプロピルメチル基、２－シクロプロピルエチル基、３－シクロプロピルプロピル基、４－シクロプロピルブチル基、５－シクロプロピルペンチル基、

メチル基、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、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ヨードメチル基、クロロジフルオロメチル基、

エチル基、２－フルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、パーフルオロエチル基、２－クロロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、２－ブロモエチル基、２－ヨードエチル基、

プロピル基、３－フルオロプロピル基、３，３，３－トリフルオロプロピル基、パーフルオロプロピル基、イソプロピル基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロピル基、パーフルオロイソプロピル基、３－クロロプロピル基、３，３，３－トリクロロプロピル基、３－ブロモプロピル基、３－ヨードプロピル基、

ブチル基、４－フルオロブチル基、４，４，４－トリフルオロブチル基、パーフルオロブチル基、４－クロロブチル基、４，４，４－トリクロロブチル基、４－ブロモブチル基、４－ヨードブチル基、ｓ－ブチル基、ｔ－ブチル基、

ペンチル基、５－フルオロペンチル基、５，５，５－トリフルオロペンチル基、パーフルオロペンチル基、５－クロロペンチル基、５，５，５－トリクロロペンチル基、５－ブロモペンチル基、５－ヨードペンチル基、

シアノメチル基、ジシアノメチル基、２－シアノエチル基、２，２－ジシアノエチル基、３－シアノプロピル基、３，３－ジシアノプロピル基、４－シアノブチル基、４，４－ジシアノブチル基、５－シアノペンチル基、５，５－ジシアノペンチル基、

メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基、イソプロポキシメチル基、ブトキシメチル基、イソブトキシメチル基、ｔ－ブトキシメチル基、２－メトキシエチル基、３－メトキシプロピル基、４－メトキシブチル基、５－メトキシペンチル基、２－エトキシエチル基、３－エトキシプロピル基、４－エトキシブチル基、５－エトキシペンチル基、２－プロポキシエチル基、３－プロポ

キシプロピル基、４－プロポキシブチル基、５－プロポキシペンチル基、２－ブトキシエチル基、３－ブトキシプロピル基、４－ブトキシブチル基、５－ブトキシペンチル基、

メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、プロピルチオメチル基、イソプロピルチオメチル基、ブチルチオメチル基、イソブチルチオメチル基、ｔ－ブチルチオメチル基、２－メチルチオエチル基、３－メチルチオプロピル基、４－メチルチオブチル基、５－メチルチオペンチル基、２－エチルチオエチル基、３－エチルチオプロピル基、４－エチルチオブチル基、５－エチルチオペンチル基、２－プロピルチオエチル基、３－プロピルチオプロピル基、４－プロピルチオブチル基、５－プロピルチオペンチル基、２－ブチルチオエチル基、３－ブチルチオプロピル基、４－ブチルチオブチル基、５－ブチルチオペンチル基、

メタンスルフィニルメチル基、エタンスルフィニルメチル基、プロパンスルフィニルメチル基、イソプロパンスルフィニルメチル基、ブタンスルフィニルメチル基、イソブタンスルフィニルメチル基、ｔ－ブタンスルフィニルメチル基、２－メタンスルフィニルエチル基、３－メタンスルフィニルプロピル基、４－メタンスルフィニルブチル基、５－メタンスルフィニルペンチル基、２－エタンスルフィニルエチル基、３－エタンスルフィニルプロピル基、４－エタンスルフィニルブチル基、５－エタンスルフィニルペンチル基、２－プロパンスルフィニルエチル基、３－プロパンスルフィニルプロピル基、４－プロパンスルフィニルブチル基、５－プロパンスルフィニルペンチル基、２－ブタンスルフィニルエチル基、３－ブタンスルフィニルプロピル基、４－ブタンスルフィニルブチル基、５－ブタンスルフィニルペンチル基、

メタンスルホニルメチル基、エタンスルホニルメチル基、プロパンスルホニルメチル基、イソプロパンスルホニルメチル基、ブタンスルホニルメチル基、イソブタンスルホニルメチル基、ｔ－ブタンスルホニルメチル基、２－メタンスルホニルエチル基、３－メタンスルホニルプロピル基、４－メタンスルホニルブチル基、５－メタンスルホニルペンチル基、２－エタンスルホニルエチル基、３－エタンスルホニルプロピル基、４－エタンスルホニルブチル基、５－エタンスルホニルペンチル基、２－プロパンスルホニルエチル基、３－プロパンスルホニルプロピル基、４－プロパンスルホニルブチル基、５－プロパンスルホニルペンチル基、

２－ブタンスルホニルエチル基、３－ブタンスルホニルプロピル基、４－ブタンスルホニルブチル基及び５－ブタンスルホニルペンチル基が挙げられる。

「群Ｄより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ３～Ｃ１０シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基、メチルシクロプロピル基、１，１－ジメチルシクロプロピル基、エチルシクロプロピル基、プロピルシクロプロピル基、ブチルシクロプロピル基、ペンチルシクロプロピル基、２－メチルシクロヘキシル基、２－エチルシクロヘキシル基、２－プロピルシクロヘキシル基、２－ブチルシクロヘキシル基、２－ペンチルシクロヘキシル基、３－メチルシクロヘキシル基、３－エチルシクロヘキシル基、３－プロピルシクロヘキシル基、３－ブチルシクロヘキシル基、３－ペンチルシクロヘキシル基、４－メチルシクロヘキシル基、４－エチルシクロヘキシル基、４－プロピルシクロヘキシル基、４－ブチルシクロヘキシル基、４－ペンチルシクロヘキシル基、フルオロシクロプロピル基、クロロシクロプロピル基、１，１－ジフルオロシクロプロピル基、１，１－ジクロロシクロプロピル基、２－フルオロシクロヘキシル基、３－フルオロシクロヘキシル基、４－フルオロシクロヘキシル基、２－クロロシクロヘキシル基、３－クロロシクロヘキシル基及び４－クロロシクロヘキシル基が挙げられる。

「群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいフェニル基」としては、例えばフェニル基、２－フルオロフェニル基、３－フルオロフェニル基、４－フルオロフェニル基、２－クロロフェニル基、３－クロロフェニル基、４－クロロフェニル基、２－ブロモフェニル基、３－ブロモフェニル基、４－ブロモフェニル基、２－ヨードフェニル基、３－ヨードフェニル基、４－ヨードフェニル基、２－シアノフェニル基、３－シアノフェニル基、４－シアノフェニル基、２－ニトロフェニル基、３－ニトロフェニル基、４－ニトロフェニル基、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－エチルフェニル基、３－エチルフェニル基、４－エチルフェニル基、２－プロピルフェニル基、３－プロピルフェニル基、４－プロピルフェニル基、２－イソプロピルフェニル

基、３－イソプロピルフェニル基、４－イソプロピルフェニル基、２－ブチルフェニル基、３－ブチルフェニル基、４－ブチルフェニル基、２－イソブチルフェニル基、３－イソブチルフェニル基、４－イソブチルフェニル基、２－ｔ－ブチルフェニル基、３－ｔ－ブチルフェニル基、４－ｔ－ブチルフェニル基、２－ペンチルフェニル基、３－ヘキシルフェニル基、４－ヘプチルフェニル基、２－オクチルフェニル基、３－ノニルフェニル基、４－デシルフェニル基、２－トリフルオロメチルフェニル基、３－トリフルオロメチルフェニル基、４－トリフルオロメチルフェニル基、２－（２，２，２－トリフルオロエチル）フェニル基、３－（３，３，３－トリフルオロプロピル）フェニル基、４－（４，４，４－トリフルオロブチル）フェニル基、２－（５，５，５－トリフルオロペンチル）フェニル基、３－（６，６，６－トリフルオロヘキシル）フェニル基、４－（７，７，７－トリフルオロヘプチル）フェニル基、２－（８，８，８－トリフルオロオクチル）フェニル基、３－（９，９，９－トリフルオロノニル）フェニル基、４－（１０，１０，１０－トリフルオロデシル）フェニル基、

２－シクロプロピルフェニル基、３－シクロプロピルフェニル基、４－シクロプロピルフェニル基、２－シクロブチルフェニル基、３－シクロペンチルフェニル基、４－シクロヘキシルフェニル基、２－シクロヘプチルフェニル基、３－シクロオクチルフェニル基、４－シクロノニルフェニル基、２－シクロデシルフェニル基、３－（メチルシクロプロピル）フェニル基、４－（１，１－ジメチルシクロプロピル）フェニル基、３－（フルオロシクロプロピル）フェニル基、４－（クロロシクロプロピル）フェニル基、２－（１，１－ジフルオロシクロプロピル）フェニル基、３－（１，１－ジクロロシクロプロピル）フェニル基、４－（２－フルオロシクロヘキシル）フェニル基、４－（２－クロロシクロヘキシル）フェニル基、

２－メトキシフェニル基、３－メトキシフェニル基、４－メトキシフェニル基、２－トリフルオロメトキシフェニル基、３－トリフルオロメトキシフェニル基、４－トリフルオロメトキシフェニル基、２－エトキシフェニル基、３－プロポキシフェニル基、４－ブトキシフェニル基、

２－メチルチオフェニル基、３－メチルチオフェニル基、４－メチルチオフェニル基、２－トリフルオロメチルチオフェニル基、３－トリフルオロメチルチオフ

ェニル基、４－トリフルオロメチルチオフェニル基、２－エチルチオフェニル基、３－プロピルチオフェニル基、４－ブチルチオフェニル基、
２－メタンスルフィニルフェニル基、３－メタンスルフィニルフェニル基、４－メタンスルフィニルフェニル基、２－メタンスルフィニルフェニル基、３－メタンスルフィニルフェニル基、４－メタンスルフィニルフェニル基、２－エチルスルフィニルフェニル基、３－プロピルスルフィニルフェニル基、４－ブチルスルフィニルフェニル基、
２－メタンスルホニルフェニル基、３－メタンスルホニルフェニル基、４－メタンスルホニルフェニル基、２－メタンスルホニルフェニル基、３－メタンスルホニルフェニル基、４－メタンスルホニルフェニル基、２－エチルスルホニルフェニル基、３－プロピルスルホニルフェニル基、４－ブチルスルホニルフェニル基、
２－アセチルフェニル基、３－アセチルフェニル基、４－アセチルフェニル基、
２－ジフルオロアセチルフェニル基、３－トリフルオロアセチルフェニル基、４－ジクロロアセチルフェニル基、２－トリクロロアセチルフェニル基、３－プロパノイルフェニル基、４－ブタノイルフェニル基、２－イソブタノイルフェニル基、３－ペンタノイルフェニル基、４－ピバロイルフェニル基、
２－（メトキシカルボニル）フェニル基、３－（メトキシカルボニル）フェニル基、４－（メトキシカルボニル）フェニル基、２－（トリフルオロメトキシカルボニル）フェニル基、３－（トリクロロメトキシカルボニル）フェニル基、４－（エトキシカルボニル）フェニル基、２－（プロポキシカルボニル）フェニル基、３－（イソプロポキシカルボニル）フェニル基、４－（ブトキシカルボニル）フェニル基、
２－アセトキシフェニル基、３－アセトキシフェニル基、４－アセトキシフェニル基、２－ジフルオロアセトキシフェニル基、３－トリフルオロアセトキシフェニル基、４－トリクロロアセトキシフェニル基、２－プロパノイルオキシフェニル基、３－ブタノイルオキシフェニル基、４－イソブタノイルオキシフェニル基、２－ペンタノイルオキシフェニル基及び３－ピバロイルオキシフェニル基が挙げられる。

「群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ２～Ｃ５ポリメチレ

ン基」としては、例えばエチレン基、１，３－プロピレン基、１，４－ブチレン基、１，５－ペンチレン基、フルオロエチレン基、クロロエチレン基、ブロモエチレン基、シアノエチレン基、ニトロエチレン基、１，２－プロピレン基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－プロピレン基、シクロプロピルエチレン基、メトキシエチレン基、トリフルオロメトキシエチレン基、メチルチオエチレン基、トリフルオロメチルチオエチレン基、メタンスルフィニルエチレン基、トリフルオロメタンスルフィニルエチレン基、メタンスルホニルエチレン基、トリフルオロメタンスルホニルエチレン基、アセチルエチレン基、トリフルオロアセチルエチレン基、メトキシカルボニルエチレン基、トリフルオロメトキシカルボニルエチレン基、アセトキシエチレン基及びトリフルオロアセトキシエチレン基が挙げられる。

「群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいプロペン－１，３－ジイル基」としては、例えばプロペン－１，３－ジイル基、２－フルオロプロペン－１，３－ジイル基、３－フルオロプロペン－１，３－ジイル基、３，３－ジフルオロプロペン－１，３－ジイル基、２－クロロプロペン－１，３－ジイル基、２－ブロモプロペン－１，３－ジイル基、２－シアノプロペン－１，３－ジイル基、２－ニトロプロペン－１，３－ジイル基、２－メチルプロペン－１，３－ジイル基、３－メチルプロペン－１，３－ジイル基、３，３－ジメチルプロペン－１，３－ジイル基、２－トリフルオロメチルプロペン－１，３－ジイル基、２－シクロプロピルプロペン－１，３－ジイル基、２－メトキシプロペン－１，３－ジイル基、２－トリフルオロメトキシプロペン－１，３－ジイル基、２－メチルチオプロペン－１，３－ジイル基、２－トリフルオロメチルチオプロペン－１，３－ジイル基、２－メタンスルフィニルプロペン－１，３－ジイル基、２－トリフルオロメタンスルフィニルプロペン－１，３－ジイル基、２－アセチルプロペン－１，３－ジイル基、２－トリフルオロアセチルプロペン－１，３－ジイル基、２－メトキシカルボニルプロペン－１，３－ジイル基、２－トリフルオロメトキシカルボニルプロペン－１，３－ジイル基、２－アセトキシプロペン－１，３－ジイル基及び２－トリフルオロアセトキシプロペン－１，３－ジイル基が挙げられる。

「群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよい１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基」としては、例えば１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－フルオロ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、２－フルオロ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－クロロ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、２－クロロ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－ブロモ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、２－ブロモ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－シアノ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－ニトロ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－メチル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、２－メチル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－トリフルオロメチル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－シクロプロピル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－メトキシ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－トリフルオロメトキシプ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－メチルチオ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－トリフルオロメチルチオ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－メタンスルフィニル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－トリフルオロメタンスルフィニル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－アセチル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－トリフルオロアセチル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－メトキシカルボニル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－トリフルオロメトキシカルボニル－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基、１－アセトキシ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基及び１－トリフルオロアセトキシ－１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基が挙げられる。

「Ｃ１～Ｃ４鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、エチニル基、プロピル基、イソプロピル基、アリル基、プロパルギル基、ブチル基、イソブチル基及びｔ－ブチル基が挙げられる。

「群Ｃより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ１～Ｃ１０鎖式炭化水素基」としては、例えばシクロプロピルメチル基、２－シクロプロピルエチル

基、３－シクロプロピルプロピル基、４－シクロプロピルブチル基、５－シクロプロピルペンチル基、

メチル基、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、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ヨードメチル基、クロロジフルオロメチル基、

エチル基、２－フルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、パーフルオロエチル基、２－クロロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、２－ブロモエチル基、２－ヨードエチル基、

プロピル基、３－フルオロプロピル基、３，３，３－トリフルオロプロピル基、パーフルオロプロピル基、イソプロピル基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロピル基、パーフルオロイソプロピル基、３－クロロプロピル基、３，３，３－トリクロロプロピル基、３－ブロモプロピル基、３－ヨードプロピル基、

ブチル基、４－フルオロブチル基、４，４，４－トリフルオロブチル基、パーフルオロブチル基、４－クロロブチル基、４，４，４－トリクロロブチル基、４－ブロモブチル基、４－ヨードブチル基、ｓ－ブチル基、ｔ－ブチル基、

ペンチル基、５－フルオロペンチル基、５，５，５－トリフルオロペンチル基、パーフルオロペンチル基、５－クロロペンチル基、５，５，５－トリクロロペンチル基、５－ブロモペンチル基、５－ヨードペンチル基、

ヘキシル基、６，６，６－トリフルオロヘキシル基、６－クロロヘキシル基、

ヘプチル基、７，７，７－トリフルオロヘプチル基、７－クロロヘプチル基、

オクチル基、８，８，８、－トリフルオロオクチル基、８－クロロオクチル基、

ノニル基、９，９，９－トリフルオロノニル基、９－クロロノニル基、

デシル基、１０，１０，１０－トリフルオロデシル基、１０－クロロデシル基、

シアノメチル基、ジシアノメチル基、２－シアノエチル基、２，２－ジシアノエチル基、３－シアノプロピル基、３，３－ジシアノプロピル基、４－シアノブチル基、４，４－ジシアノブチル基、５－シアノペンチル基、５，５－ジシアノペンチル基、

メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基、イソプロポキシメチル基、ブトキシメチル基、イソブトキシメチル基、ｔ－ブトキシメチル基、２

ーメトキシエチル基、３ーメトキシプロピル基、４ーメトキシブチル基、５ーメトキシペンチル基、２ーエトキシエチル基、３ーエトキシプロピル基、４ーエトキシブチル基、５ーエトキシペンチル基、２ープロポキシエチル基、３ープロポキシプロピル基、４ープロポキシブチル基、５ープロポキシペンチル基、２ーブトキシエチル基、３ーブトキシプロピル基、４ーブトキシブチル基、５ーブトキシペンチル基、

メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、プロピルチオメチル基、イソプロピルチオメチル基、ブチルチオメチル基、イソブチルチオメチル基、ｔーブチルチオメチル基、２ーメチルチオエチル基、３ーメチルチオプロピル基、４ーメチルチオブチル基、５ーメチルチオペンチル基、２ーエチルチオエチル基、３ーエチルチオプロピル基、４ーエチルチオブチル基、５ーエチルチオペンチル基、２ープロピルチオエチル基、３ープロピルチオプロピル基、４ープロピルチオブチル基、５ープロピルチオペンチル基、２ーブチルチオエチル基、３ーブチルチオプロピル基、４ーブチルチオブチル基、５ーブチルチオペンチル基、

メタンスルフィニルメチル基、エタンスルフィニルメチル基、プロパンスルフィニルメチル基、イソプロパンスルフィニルメチル基、ブタンスルフィニルメチル基、イソブタンスルフィニルメチル基、ｔーブタンスルフィニルメチル基、２ーメタンスルフィニルエチル基、３ーメタンスルフィニルプロピル基、４ーメタンスルフィニルブチル基、５ーメタンスルフィニルペンチル基、２ーエタンスルフィニルエチル基、３ーエタンスルフィニルプロピル基、４ーエタンスルフィニルブチル基、５ーエタンスルフィニルペンチル基、２ープロパンスルフィニルエチル基、３ープロパンスルフィニルプロピル基、４ープロパンスルフィニルブチル基、５ープロパンスルフィニルペンチル基、２ーブタンスルフィニルエチル基、３ーブタンスルフィニルプロピル基、４ーブタンスルフィニルブチル基、５ーブタンスルフィニルペンチル基、

メタンスルホニルメチル基、エタンスルホニルメチル基、プロパンスルホニルメチル基、イソプロパンスルホニルメチル基、ブタンスルホニルメチル基、イソブタンスルホニルメチル基、ｔーブタンスルホニルメチル基、２ーメタンスルホニルエチル基、３ーメタンスルホニルプロピル基、４ーメタンスルホニルブチル基、５ーメタンスルホニルペンチル基、２ーエタンスルホニルエチル基、３ーエタン

スルホニルプロピル基、４－エタンスルホニルブチル基、５－エタンスルホニルペンチル基、２－プロパンスルホニルエチル基、３－プロパンスルホニルプロピル基、４－プロパンスルホニルブチル基、５－プロパンスルホニルペンチル基、２－ブタンスルホニルエチル基、３－ブタンスルホニルプロピル基、４－ブタンスルホニルブチル基及び５－ブタンスルホニルペンチル基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルコキシ基」としては、メトキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、ジブロモメトキシ基、ヨードメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、エトキシ基、２－フルオロエトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、パーフルオロエトキシ基、２－クロロエトキシ基、２，２，２－トリクロロエトキシ基、２－ブロモエトキシ基、２－ヨードエトキシ基、
プロポキシ基、３－フルオロプロポキシ基、３，３，３－トリフルオロプロポキシ基、パーフルオロプロポキシ基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロポキシ基、パーフルオロイソプロポキシ基、３－クロロプロポキシ基、３，３，３－トリクロロプロポキシ基、３－ブロモプロポキシ基、３－ヨードプロポキシ基、
ブトキシ基、４－フルオロブトキシ基、４，４，４－トリフルオロブトキシ基、パーフルオロブトキシ基、４－クロロブトキシ基、４，４，４－トリクロロブトキシ基、４－ブロモブトキシ基及び４－ヨードブトキシ基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルチオ基」としては、メチルチオ基、フルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロメチルチオ基、ジクロロメチルチオ基、トリクロロメチルチオ基、ブロモメチルチオ基、ジブロモメチルチオ基、ヨードメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、
エチルチオ基、２－フルオロエチルチオ基、２，２，２－トリフルオロエチルチオ基、パーフルオロエチルチオ基、２－クロロエチルチオ基、２，２，２－トリクロロエチルチオ基、２－ブロモエチルチオ基、２－ヨードエチルチオ基、

プロピルチオ基、３－フルオロプロピルチオ基、３，３，３－トリフルオロプロピルチオ基、パーフルオロプロピルチオ基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロピルチオ基、パーフルオロイソプロピルチオ基、３－クロロプロピルチオ基、３，３，３－トリクロロプロピルチオ基、３－ブロモプロピルチオ基、３－ヨードプロピルチオ基、

ブチルチオ基、４－フルオロブチルチオ基、４，４，４－トリフルオロブチルチオ基、パーフルオロブチルチオ基、４－クロロブチルチオ基、４，４，４－トリクロロブチルチオ基、４－ブロモブチルチオ基及び４－ヨードブチルチオ基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルフィニル基」としては、メタンスルフィニル基、フルオロメタンスルフィニル基、ジフルオロメタンスルフィニル基、トリフルオロメタンスルフィニル基、クロロメタンスルフィニル基、ジクロロメタンスルフィニル基、トリクロロメタンスルフィニル基、ブロモメタンスルフィニル基、ジブロモメタンスルフィニル基、ヨードメタンスルフィニル基、クロロジフルオロメタンスルフィニル基、

エタンスルフィニル基、２－フルオロエタンスルフィニル基、２，２，２－トリフルオロエタンスルフィニル基、パーフルオロエタンスルフィニル基、２－クロロエタンスルフィニル基、２，２，２－トリクロロエタンスルフィニル基、２－ブロモエタンスルフィニル基、２－ヨードエタンスルフィニル基、

プロパンスルフィニル基、３－フルオロプロパンスルフィニル基、３，３，３－トリフルオロプロパンスルフィニル基、パーフルオロプロパンスルフィニル基、イソプロパンスルフィニル基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロパンスルフィニル基、パーフルオロイソプロパンスルフィニル基、３－クロロプロパンスルフィニル基、３，３，３－トリクロロプロパンスルフィニル基、３－ブロモプロパンスルフィニル基、３－ヨードプロパンスルフィニル基、

ブタンスルフィニル基、４－フルオロブタンスルフィニル基、４，４，４－トリフルオロブタンスルフィニル基、パーフルオロブタンスルフィニル基、４－クロロブタンスルフィニル基、４，４，４－トリクロロブタンスルフィニル基、４－ブロモブタンスルフィニル基及び４－ヨードブタンスルフィニル基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルホニル基」としては、メタンスルホニル基、フルオロメタンスルホニル基、ジフルオロメタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、クロロメタンスルホニル基、ジクロロメタンスルホニル基、トリクロロメタンスルホニル基、ブロモメタンスルホニル基、ジブロモメタンスルホニル基、ヨードメタンスルホニル基、クロロジフルオロメタンスルホニル基、

エタンスルホニル基、２－フルオロエタンスルホニル基、２，２，２－トリフルオロエタンスルホニル基、パーフルオロエタンスルホニル基、２－クロロエタンスルホニル基、２，２，２－トリクロロエタンスルホニル基、２－ブロモエタンスルホニル基、２－ヨードエタンスルホニル基、

プロパンスルホニル基、３－フルオロプロパンスルホニル基、３，３，３－トリフルオロプロパンスルホニル基、パーフルオロプロパンスルホニル基、イソプロパンスルホニル基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロパンスルホニル基、パーフルオロイソプロパンスルホニル基、３－クロロプロパンスルホニル基、３，３，３－トリクロロプロパンスルホニル基、３－ブロモプロパンスルホニル基、３－ヨードプロパンスルホニル基、

ブタンスルホニル基、４－フルオロブタンスルホニル基、４，４，４－トリフルオロブタンスルホニル基、パーフルオロブタンスルホニル基、４－クロロブタンスルホニル基、４，４，４－トリクロロブタンスルホニル基、４－ブロモブタンスルホニル基及び４－ヨードブタンスルホニル基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニル基」としては、アセチル基、フルオロアセチル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、クロロアセチル基、ジクロロアセチル基、トリクロロアセチル基、ブロモアセチル基、ジブロモアセチル基、ヨードアセチル基、クロロジフルオロアセチル基、

プロパノイル基、３－フルオロプロパノイル基、３，３，３－トリフルオロプロパノイル基、パーフルオロプロパノイル基、３－クロロプロパノイル基、３，３，３－トリクロロプロパノイル基、３－ブロモプロパノイル基、３－ヨードプロパ

ノイル基、
ブタノイル基、４－フルオロブタノイル基、４，４，４－トリフルオロブタノイル基、パーフルオロブタノイル基、３，３，３，３’，３’，３’－ヘキサフルオロイソブタノイル基、パーフルオロイソブタノイル基、４－クロロブタノイル基、４，４，４－トリクロロブタノイル基、４－ブロモブタノイル基、４－ヨードブタノイル基、イソブタノイル基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソブタノイル基、パーフルオロイソブタノイル基、
ペンタノイル基、５－フルオロペンタノイル基、５，５，５－トリフルオロペンタノイル基、パーフルオロペンタノイル基、５－クロロペンタノイル基、５，５，５－トリクロロペンタノイル基、５－ブロモペンタノイル基、５－ヨードペンタノイル基及びピバロイル基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４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、フルオロメトキシカルボニル基、ジフルオロメトキシカルボニル基、トリフルオロメトキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、ジクロロメトキシカルボニル基、トリクロロメトキシカルボニル基、ブロモメトキシカルボニル基、ジブロモメトキシカルボニル基、ヨードメトキシカルボニル基、クロロジフルオロメトキシカルボニル基、
エトキシカルボニル基、２－フルオロエトキシカルボニル基、２，２，２－トリフルオロエトキシカルボニル基、パーフルオロエトキシカルボニル基、２－クロロエトキシカルボニル基、２，２，２－トリクロロエトキシカルボニル基、２－ブロモエトキシカルボニル基、２－ヨードエトキシカルボニル基、
プロポキシカルボニル基、３－フルオロプロポキシカルボニル基、３，３，３－トリフルオロプロポキシカルボニル基、パーフルオロプロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロポキシカルボニル基、パーフルオロイソプロポキシカルボニル基、３－クロロプロポキシカルボニル基、３，３，３－トリクロロプロポキシカルボニル基、３－ブロモプロポキシカルボニル基、３－ヨードプロポキシカルボニル基、
ブトキシカルボニル基、４－フルオロブトキシカルボニル基、４，４，４－トリフルオロブトキシカルボニル基、パーフルオロブトキシカルボニル基、４－クロ

ロブトキシカルボニル基、４，４，４－トリクロロブトキシカルボニル基、４－ブロモブトキシカルボニル基、４－ヨードブトキシカルボニル基及びｔ－ブトキシカルボニル基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニルオキシ基」としては、例えばアセトキシ基、フルオロアセトキシ基、ジフルオロアセトキシ基、トリフルオロアセトキシ基、クロロアセトキシ基、ジクロロアセトキシ基、トリクロロアセトキシ基、ブロモアセトキシ基、ジブロモアセトキシ基、ヨードアセトキシ基、クロロジフルオロアセトキシ基、
プロパノイルオキシ基、３－フルオロプロパノイルオキシ基、３，３，３－トリフルオロプロパノイルオキシ基、パーフルオロプロパノイルオキシ基、３－クロロプロパノイルオキシ基、３，３，３－トリクロロプロパノイルオキシ基、３－ブロモプロパノイルオキシ基、３－ヨードプロパノイルオキシ基、
ブタノイルオキシ基、４－フルオロブタノイルオキシ基、４，４，４－トリフルオロブタノイルオキシ基、パーフルオロブタノイルオキシ基、イソブタノイルオキシ基、３，３，３，３’，３’，３’－ヘキサフルオロイソブタノイルオキシ基、パーフルオロイソブタノイルオキシ基、４－クロロブタノイルオキシ基、４，４，４－トリクロロブタノイルオキシ基、４－ブロモブタノイルオキシ基、４－ヨードブタノイルオキシ基、ペンタノイルオキシ基、５－フルオロペンタノイルオキシ基、５，５，５－トリフルオロペンタノイルオキシ基、パーフルオロペンタノイルオキシ基、５－クロロペンタノイルオキシ基、５，５，５－トリクロロペンタノイルオキシ基、５－ブロモペンタノイルオキシ基、５－ヨードペンタノイルオキシ基及びピバロイルオキシ基が挙げられる。

「Ｃ１～Ｃ５アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ｔ－ブチル基及びペンチル基が挙げられる。

「ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ１０鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、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、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ヨードメチル基、クロロジフルオロメチル基、
エチル基、２－フルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、パーフルオロエチル基、２－クロロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、２－ブロモエチル基、２－ヨードエチル基、
プロピル基、３－フルオロプロピル基、３，３，３－トリフルオロプロピル基、パーフルオロプロピル基、イソプロピル基、２，２，２，２’，２’，２’－ヘキサフルオロイソプロピル基、パーフルオロイソプロピル基、３－クロロプロピル基、３，３，３－トリクロロプロピル基、３－ブロモプロピル基、３－ヨードプロピル基、
ブチル基、４－フルオロブチル基、４，４，４－トリフルオロブチル基、パーフルオロブチル基、４－クロロブチル基、４，４，４－トリクロロブチル基、４－ブロモブチル基、４－ヨードブチル基、ｓ－ブチル基、ｔ－ブチル基、
ペンチル基、５－フルオロペンチル基、５，５，５－トリフルオロペンチル基、パーフルオロペンチル基、５－クロロペンチル基、５，５，５－トリクロロペンチル基、５－ブロモペンチル基及び５－ヨードペンチル基が挙げられる。

本発明化合物の態様としては、例えば以下のアミド化合物が挙げられる。
式（１）において、R^2が群Ｃより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ１～Ｃ５鎖式炭化水素基、群Ｄより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ３～Ｃ１０シクロアルキル基、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲン又はシアノ基を表すか、
或いは、ｐが２以上あり、かつ２つのR^2がベンゼン環の隣接する炭素に結合する場合には、該２つのR^2が結合して、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ２～Ｃ５ポリメチレン基、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいプロペン－１，３－ジイル基、群Ｅより選ばれる１以上の基で置換されていてもよい１，３－ブタジエン－１，４－ジイル基又はメチレンジオキシ基であるアミド化合物；
式（１）において、R^2が群Ｃより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ１～Ｃ５鎖式炭化水素基又はハロゲンであるアミド化合物；

式（１）において、Ｒ^{2}がハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ５鎖式炭化水素基又はハロゲンであるアミド化合物；

式（１）において、Ｒ^{2}がハロゲンで置換されていてもよいメチル基又はハロゲンであるアミド化合物；

式（１）において、Ｒ^{2}がメチル基又はハロゲンであるアミド化合物；

式（１）において、Ｒ^{2}がハロゲンであるアミド化合物；

式（１）において、Ｒ^{2}がフッ素原であるアミド化合物；

式（１）において、Ｒ^{2}が塩素であるアミド化合物；

式（１）において、ｐが１であり、Ｒ^{2}がメチル基であるアミド化合物；

式（１）において、ｐが１であり、Ｒ^{2}がフッ素であるアミド化合物；

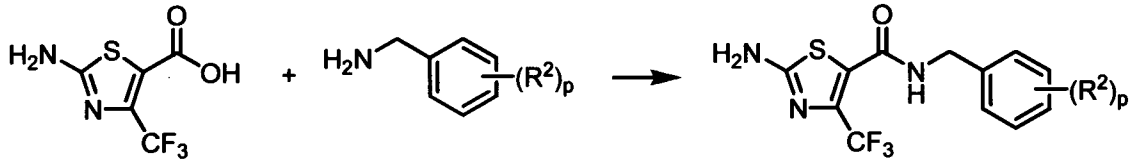
式（１）において、ｐが１であり、Ｒ^{2}が塩素であるアミド化合物；

及び、

式（１）において、ｐが２であり、２つのＲ^{2}がそれぞれフッ素と塩素であるアミド化合物。

（製造法１）

本発明化合物又はその塩は、化合物（３）又はその塩と化合物（２）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。



（２）　（３）　（１）

〔式中、Ｒ^{2}及びｐは前記と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

該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。

該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。）、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。）及び１，３－ジシクロヘキシルカルボジイミド等が挙げられる。

該反応には化合物（２）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０～２００℃の範囲である。該反応の反応時間は通常１～２４時間の範囲である。

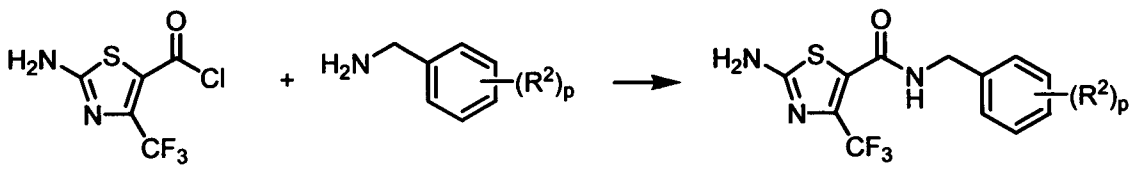
該反応において、ＢＯＰ試薬を使用する場合は、必要に応じて塩基の存在下で反応を行う。かかる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第３級アミン類及びピリジン、４－ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には化合物（２）１モルに対して、塩基が通常１～１０モルの割合で用いられる。

反応終了後は、反応混合物に水を加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物を単離することができる。単離された本発明化合物は、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。

（製造法２）

本発明化合物は、化合物（３）又はその塩と化合物（４）又はその塩とを、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。



（４）　（３）　（１）

〔式中、R^2及びｐは前記と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

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

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

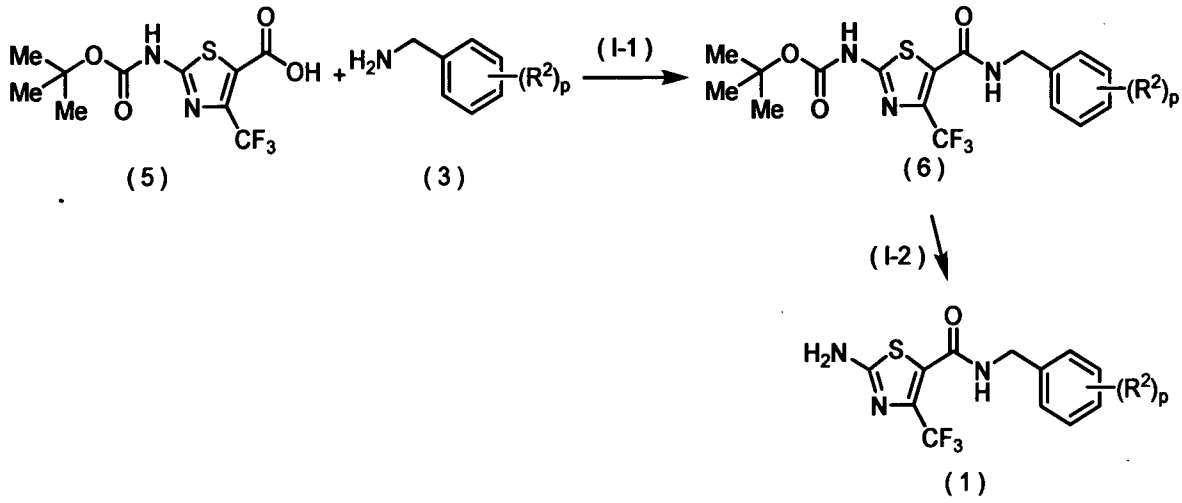
該反応には化合物（４）１モルに対して、化合物（３）が通常１～３モルの割合、塩基が通常１～１０モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常－２０～１４０℃の範囲である。該反応の反応時間は通常０．１～２４時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物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、本発明化合物を単離することができる。単離された本発明化合物は、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。

（製造法３）

本発明化合物は、例えば化合物（５）から下記のスキームに従って製造することができる。



〔式中、R^2及びｐは前記と同じ意味を表す。〕

工程（Ｉ－１）

化合物（６）は、化合物（５）と化合物（３）又はその塩とを、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。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

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

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

該反応には化合物（５）１モルに対して、化合物（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０～２００℃の範囲である。該反応の反応時間は通常１～２４時間の範囲である。

該反応において、ＢＯＰ試薬を使用する場合は、必要に応じて塩基の存在下で反応を行う。かかる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエ

チルアミン等の第３級アミン類及びピリジン、４－ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

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

反応終了後は、反応混合物に水を加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、化合物（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。

工程（Ｉ－２）

本発明化合物は、化合物（６）と酸とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

該反応に用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ＤＭＳＯ等のスルホキシド類、メタノール、エタノール、２－メチルエタノール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応に用いられる酸としては、例えば塩酸、硫酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、ｐ－トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸等の有機酸が挙げられる。

該反応には化合物（６）１モルに対して、酸は通常１モル～過剰量の割合で用いられる。

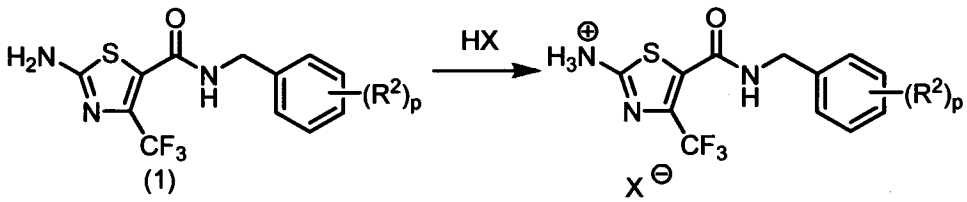
該反応の反応温度は、通常０～１５０℃の範囲である。該反応の反応時間は通常０．１～２４時間の範囲である。

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、本発明化合物を単離することができる。単離された本発明化合物は、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。

本発明化合物は、農学上許容される塩(agriculturally acceptable salt)を形

成できる。かかる本発明化合物の塩は、通常本発明化合物と酸との塩である。酸との塩としては例えば、塩酸塩、臭化水素塩、硫酸塩等の無機酸塩、メタンスルホン酸塩、ギ酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩等の有機酸塩が挙げられる。

本発明化合物と酸との塩は、本発明化合物を酸と反応させることにより製造することができる。



〔式中、R^2及びｐは前記と同じ意味を表し、ＨＸは酸を表す。〕

該反応は、溶媒の存在下又は溶媒の非存在下で行われる。

該反応に用いられる溶媒としては、例えばＴＨＦ、エチレングリコールジメチルエーテル、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、水及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応に用いられる酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸等の無機酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、ギ酸、ｐ－トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸等の有機酸が挙げられる。

該反応には本発明化合物１モルに対して、酸が通常１～１００モルの割合で用いられる。

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

反応終了後は、未反応の酸を除去して本発明化合物と酸との塩を単離することができる。

本発明の植物病害防除剤は、本発明化合物又はその塩と不活性担体（固体担体、液体担体又はガス担体）を含有する。本発明の植物病害防除剤は、さらに界面活性剤、その他の製剤用補助剤が混合され、水和剤、顆粒水和剤、フロアブル剤、粒剤、ドライフロアブル剤、乳剤、水性液剤、油剤、くん煙剤、エアゾール剤、

マイクロカプセル剤等に製剤化されている。これらの製剤には本発明化合物又はその塩が重量比で通常０．１～９９％、好ましくは０．２～９０％含有される。

固体担体としては、例えば、粘土類（例えば、カオリン、珪藻土、合成含水酸化珪素、ろう石クレー、ベントナイト、酸性白土、タルク）、その他の無機鉱物（例えば、セリサイト、石英粉末、硫黄粉末、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ）等の微粉末あるいは粒状物が挙げられる。液体担体としては、例えば、水、アルコール類（例えば、メタノール、エタノール）、ケトン類（例えば、アセトン、メチルエチルケトン）、芳香族炭化水素類（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン）、脂肪族炭化水素類（例えば、ヘキサン、シクロヘキサノン、灯油）、エステル類（例えば、酢酸エチル、酢酸ブチル）、ニトリル類（例えば、アセトニトリル、イソブチロニトリル）、エーテル類（例えば、ジオキサン、ジイソプロピルエーテル）、酸アミド類（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド）、ハロゲン化炭化水素類（例えば、ジクロロエタン、トリクロロエチレン、四塩化炭素）等が挙げられる。ガス状担体としては、例えばジメチルエーテル及び二酸化炭素が挙げられる。

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル類、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリオキシエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類、糖アルコール誘導体等が挙げられる。

その他の製剤用補助剤としては、例えば固着剤、分散剤、増粘剤、濡れ剤、増量剤や酸化防止剤、具体的にはカゼイン、ゼラチン、多糖類（例えば、デンプン、アラビヤガム、セルロース誘導体、アルギン酸）、リグニン誘導体、ベントナイト、糖類、合成水溶性高分子（例えば、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類）、ＰＡＰ（酸性りん酸イソプロピル）、ＢＨＴ（２，６－ジ－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メチルフェノール）、ＢＨＡ（２－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メトキシフェノールと３－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メトキシフェノールとの混合物）、植物油、鉱物油、脂肪酸又はそのエステル等が挙げられる。

本発明化合物又はその塩は、植物又は植物が生育する土壌に施用することによる植物病害の防除用途に用いられる。本発明化合物又はその塩を植物又は植物が生育する土壌に施用する方法としては、例えば植物に茎葉散布する方法、植物を栽培している土壌に施用する方法、及び植物種子に施用する方法が挙げられる。

本発明の植物病害防除方法には、通常本発明の植物病害防除剤が用いられる。

本発明の植物病害防除剤を植物に茎葉散布する方法又は植物を栽培している土壌に施用する方法に用いられる場合において、本発明の植物病害防除剤の施用量は、施用場所１，０００m^2あたり、本発明化合物又はその塩の量で通常１～５００ｇの割合、好ましくは２～２００ｇの割合である。本発明の植物病害防除剤が乳剤、水和剤、懸濁剤等に製剤化されている場合は、その製剤は本発明化合物又はその塩の濃度が通常０．０００５～２重量%、好ましくは０．００５～１重量%となるように水で希釈して施用される。本発明の植物病害防除剤が粉剤、粒剤等に製剤化されている場合は、その製剤は希釈することなくそのまま施用される。

本発明の植物病害防除剤を植物種子に施用する方法に用いられる場合において、本発明の植物病害防除剤の施用量は、種子１Ｋｇあたり、本発明化合物又はその塩の量で通常０．００１～１００ｇの割合、好ましくは０．０１～５０ｇの割合である。

本発明の植物病害防除剤は、他の殺菌剤、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と混合及び／又は併用できる。

かかる殺菌剤の有効成分としては、例えば以下のものが挙げられる。

（１）　アゾール殺菌活性化合物

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（ｆｌｕｑｕｉｎｃｏｎａｚｏｌｅ）、トリティコナゾール（ｔｒｉｔｉｃｏｎａｚｏｌｅ）、ビテルタノール（ｂｉｔｅｒｔａｎｏｌ）、イマザリル（ｉｍａｚａｌｉｌ）、フルトリアホール（ｆｌｕｔｒｉａｆｏｌ）、シメコナゾール（ｓｉｍｅｃｏｎａｚｏｌｅ）、イプコナゾール（ｉｐｃｏｎａｚｏｌｅ）等；

（２）　アミン殺菌活性化合物

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；

（３）　ベンズイミダゾール殺菌活性化合物

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；

（４）　ジカルボキシイミド殺菌活性化合物

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

（５）　アニリノピリミジン殺菌活性化合物

シプロディニル（ｃｙｐｒｏｄｉｎｉｌ）、ピリメタニル（ｐｙｒｉｍｅｔｈａｎｉｌ）、メパニピリム（ｍｅｐａｎｉｐｙｒｉｍ）等；

（６）　フェニルピロール殺菌活性化合物

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

（７）　ストロビルリン殺菌活性化合物

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（ｆｌｕｏｘａｓｔｒｏｂｉｎ)、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；

（８）　フェニルアマイド殺菌活性化合物

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；

（９）　カルボン酸アミド殺菌活性化合物

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）

（１０）　カルボン酸アミド殺菌活性化合物

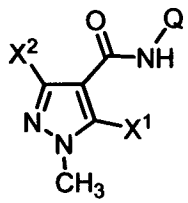
カルボキシン（ｃａｒｂｏｘｉｎ)、メプロニル（ｍｅｐｒｏｎｉｌ)、フルトラニル（ｆｌｕｔｏｌａｎｉｌ)、チフルザミド（ｔｈｉｆｌｕｚａｍｉｄｅ)、フラメトピル（ｆｕｒａｍｅｔｐｙｒ)、ボスカリド（ｂｏｓｃａｌｉｄ)、ペンチオピラド（ｐｅｎｔｈｉｏｐｙｒａｄ)、フルオピラン（ｆｌｕｏｐｙｒａｍ)、

ビキサフェン（ｂｉｘａｆｅｎ）、

（１１）　その他の殺菌活性化合物

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；

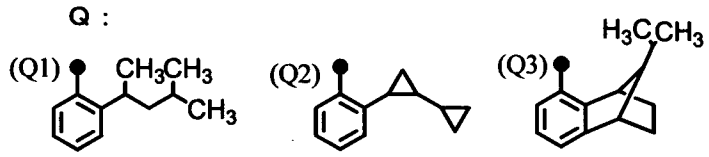
式（８）



（８）

〔式中、X^1は水素、またはハロゲンを表し、X^2はメチル基、ジフルオロメチル基、又はトリフルオロメチル基を表し、Ｑは下記のいずれかの基

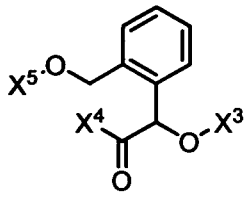
Ｑ：



を表す。〕

で示されるピラゾールカルボキサミド化合物；

式（９）

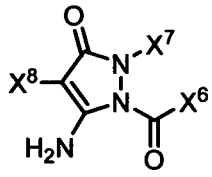


(9)

〔式中、X^3はメチル基、ジフルオロメチル基、またはエチル基を表し、X^4はメトキシ基、またはメチルアミノ基を表し、X^5はフェニル基、２－メチルフェニル基、または２，５－ジメチルフェニル基を表す。〕

で示されるα－アルコキシフェニル酢酸化合物；

式（１０）



(10)

〔式中、X^6はメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、２－プロペニルオキシ基、２－プロピニルオキシ基、３－ブテニルオキシ基、３－ブチニルオキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、または２－プロペニルチオ基を表し、X^7は１－メチルエチル基、または１－メチルプロピル基を表し、X^8は２－メチルフェニル基、または２，６－ジクロロフェニル基を表す。〕

で示されるピラゾリノン化合物。

かかる殺虫剤の有効成分としては、例えば以下のものが挙げられる。

（１）　有機リン殺虫活性化合物

アセフェート（ａｃｅｐｈａｔｅ）、りん化アルミニウム（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（ｃｈｌｏｒｅｔｈｏｘｙｆｏｓ）、クロルフェンビンホス（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

ルボス（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（ｅｔｒｉｍｆｏｓ)、フェンチオン（ｆｅｎｔｈｉｏｎ:ＭＰＰ)、フエニトロチオン(ｆｅｎｉｔｒｏｔｈｉｏｎ:ＭＥＰ)、ホスチアゼート（ｆｏｓｔｈｉａｚａｔｅ)、ホルモチオン（ｆｏｒｍｏｔｈｉｏｎ)、りん化水素（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)、ナレッド（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)、テメホス（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（ｔｒｉｃｈｌｏｒｐｈｏｎ：ＤＥＰ)、バミドチオン（ｖａｍｉｄｏｔｈｉｏｎ)、フォレート（ｐｈｏｒａｔｅ)、カズサホス（ｃａｄｕｓａｆｏｓ）等；

（２）　カーバメート殺虫活性化合物

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

エンカルブ（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（ｉｓｏｐｒｏｃａｒｂ：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（ｘｙｌｙｌｃａｒｂ）、アルジカルブ（ａｌｄｉｃａｒｂ）等；

（３）　合成ピレスロイド殺虫活性化合物

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（ｐｙｒｅｔｈｒｉｎｓ）、レスメトリン（ｒｅｓｍｅｔｈｒｉｎ）、シグマーサイパーメスリン（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

ファシペルメトリン（ａｌｐｈａ-ｃｙｐｅｒｍｅｔｈｒｉｎ）、ゼータシペルメトリン（ｚｅｔａ-ｃｙｐｅｒｍｅｔｈｒｉｎ）、ラムダシハロトリン（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－（メトキシメチル）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－（メトキシメチル）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；

（４）　ネライストキシン殺虫活性化合物

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；

（５）　ネオニコチノイド殺虫活性化合物

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；

（６）　ベンゾイル尿素殺虫活性化合物

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（ｆｌｕａｚｕｒｏｎ）、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（ｈｅｘａｆｌｕｍｕｒｏ

n)、ルフェヌロン（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；

（７）　フェニルピラゾール殺虫活性化合物

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；

（８）　Ｂｔトキシン

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；

（９）　ヒドラジン殺虫活性化合物

クロマフェノジド（ｃｈｒｏｍａｆｅｎｏｚｉｄｅ)、ハロフェノジド（ｈａｌｏｆｅｎｏｚｉｄｅ)、メトキシフェノジド(ｍｅｔｈｏｘｙｆｅｎｏｚｉｄｅ)、テブフェノジド（ｔｅｂｕｆｅｎｏｚｉｄｅ）等；

（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；

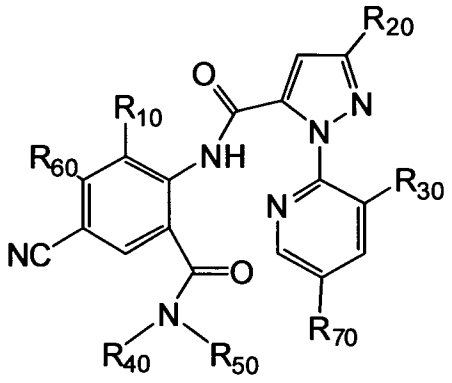
（１１）　その他の殺虫有効成分

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

アベルメクチン（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（flupyrazofos）、ハイドロプレン（hydroprene）、メトプレン（methoprene）、インドキサカルブ（indoxacarb）、メトキサジアゾン（metoxadiazone）、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（pyriproxyfen）、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）、亜ひ酸（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）、スピロテトラマット（spirotetramat）、ピリフルキナゾン（pyrifluquinazone）、スピネトラム（spinetoram）、クロラントラニリプロール（chlorantraniliprole）、

式（11）



(11)

[式中、

R_{10}は、Me、Cl、BrまたはF、

R_{20}は、F、Cl、Br、C1－C4ハロアルキル、またはC1－C4ハロアルコキシ、

R_{30}は、F、ClまたはBr、

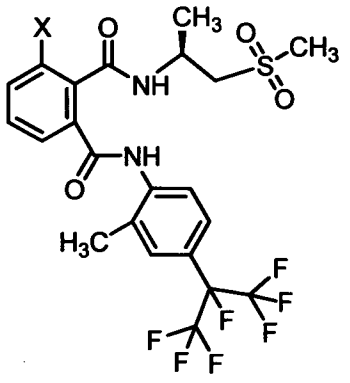
R_{40}は、H、1以上のハロゲン；CN；SMe；S（O）Me；S（0）$_2$MeおよびOMeで置換されていてもよいC1－C4アルキル、C3－C4アルケニル、C3－C4アルキニル、または、C3－C5シクロアルキルアルキル、

R_{50}は、HまたはMe、

R_{60}は、H、FまたはCl、

R_{70}は、H、FまたはClを表す。]で示される化合物、

式（12）



(12)

[式中、Xは、Cl、BrまたはIを表す。]

で示される化合物。

かかる殺ダニ剤の有効成分としては、例えばアセキノシル（ａｃｅｑｕｉｎｏｃｙｌ）、アミトラズ（ａｍｉｔｒａｚ）、ベンゾキシメート（ｂｅｎｚｏｘｉｍａｔｅ）、ビフェナゼート（ｂｉｆｅｎａａｔｅ）、フェニソブロモレート（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：ｄｉｃｏｆｏｌ）、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（ｆｌｕａｃｒｙｐｙｒｉｍ）、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）、スピロテトラマット（ｓｐｉｒｏｔｅｔｒａｍａｔ）、アミドフルメット（ａｍｉｄｏｆｌｕｍｅｔ）、シエノピラフェン（ｃｙｅｎｏｐｙｒａｆｅｎ）等が挙げられる。

かかる殺線虫剤の有効成分としては、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（ｍｅｔｈｙｉｓｏｔｈｉｏｃｙａｎａｔｅ）、酒石酸モランテル（ｍｏｒａｎｔｅｌ ｔａｒｔａｒａｔｅ）、イミシアホス（ｉｍｉｃｙａｆｏｓ）等が挙げられる。

かかる植物生長調節剤の有効成分としては、例えば、エテホン（ｅｔｈｅｐｈｏｎ）、クロルメコート（ｃｈｌｏｒｍｅｑｕａｔ－ｃｈｌｏｒｉｄｅ）、メピコート（ｍｅｐｉｑｕａｔ－ｃｈｌｏｒｉｄｅ）、等が挙げられる。

本発明の植物病害防除剤は、例えば畑、水田、芝生、果樹園等の農耕地で使用することができる。本発明の植物病害防除剤を使用できる「作物」としては、例えば以下のものが挙げられる。

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、ヤトロファ等、

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。

「作物」には、遺伝子組換作物も含まれる。

本発明化合物又はその塩が効力を有する植物病害としては、例えば糸状菌による植物病害が挙げられ、具体的には以下の植物病害が挙げられる。

イネのいもち病(Magnaporthe grisea)、ごま葉枯病(Cochliobolus miyabeanus)、紋枯病 (Rhizoctonia solani)、馬鹿苗病 (Gibberella fujikuroi)；

コムギの病害:うどんこ病(Erysiphe graminis)、赤かび病(Fusarium graminearum、F. avenacerum、F. culmorum、Microdochium nivale)、さび病(Puccinia striiformis、P. graminis、P. recondita)、紅色雪腐病 (Micronectriella nivale)、雪腐小粒菌核病 (Typhula sp.)、裸黒穂病 (Ustilago tritici)、なまぐさ黒穂病 (Tilletia caries)、眼紋病 (Pseudocercosporella herpotrichoides)、葉枯病 (Mycosphaerella graminicola)、ふ枯病 (Stagonospora nodorum)、黄斑病 (Pyrenophora tritici-repentis)；

オオムギの病害：うどんこ病 (Erysiphe graminis)、赤かび病 (Fusarium graminearum、F. avenacerum、F. culmorum、Microdochium nivale)、さび病 (Puccinia striiformis、P. graminis、P. hordei)、裸黒穂病 (Ustilago nuda)、雲形病 (Rhynchosporium secalis)、網斑病 (Pyrenophora teres)、斑点病 (Cochliobolus sativus)、斑葉病 (Pyrenophora graminea)、リゾクトニア属菌による苗立枯れ病 (Rhizoctonia solani)；

カンキツ類の黒点病 (Diaporthe citri)、そうか病 (Elsinoe fawcetti)、果実腐敗病 (Penicillium digitatum, P. italicum)、フィトフトラ病 (Phytophthora parasitica, Phytophthora citrophthora)；

リンゴのモニリア病 (Monilinia mali)、腐らん病 (Valsa ceratosperma)、うどんこ病 (Podosphaera leucotricha)、斑点落葉病 (Alternaria alternata apple pathotype)、黒星病 (Venturia inaequalis)、炭そ病 (Glomerella cingulata)、疫病 (Phytophtora cactorum)；

ナシの黒星病 (Venturia nashicola, V. pirina)、黒斑病 (Alternaria alternata Japanese pear pathotype)、赤星病 (Gymnosporangium haraeanum)；

モモの灰星病 (Monilinia fructicola)、黒星病 (Cladosporium carpophilum)、フォモプシス腐敗病 (Phomopsis sp.)；

ブドウの黒とう病 (Elsinoe ampelina)、晩腐病 (Glomerella cingulata)、うどんこ病 (Uncinula necator)、さび病 (Phakopsora ampelopsidis)、ブラックロット病 (Guignardia bidwellii)、べと病 (Plasmopara viticola) ;

カキの炭そ病 (Gloeosporium kaki)、落葉病 (Cercospora kaki, Mycosphaerella nawae) ;

ウリ類の炭そ病 (Colletotrichum lagenarium)、うどんこ病 (Sphaerotheca fuliginea)、つる枯病 (Mycosphaerella melonis)、つる割病 (Fusarium oxysporum)、べと病 (Pseudoperonospora cubensis)、疫病 (Phytophthora sp.)、苗立枯病 (Pythium sp.) ;

トマトの輪紋病 (Alternaria solani)、葉かび病 (Cladosporium fulvum)、疫病 (Phytophthora infestans) ;

ナスの褐紋病 (Phomopsis vexans)、うどんこ病 (Erysiphe cichoracearum) ;

アブラナ科野菜の黒斑病 (Alternaria japonica)、白斑病 (Cercosporella brassicae) ;

ネギのさび病 (Puccinia allii)、ダイズの紫斑病 (Cercospora kikuchii)、黒とう病 (Elsinoe glycines)、黒点病 (Diaporthe phaseolorum var. sojae)、さび病 (Phakopsora pachyrhizi)、茎疫病 (Phytophthora sojae) ;

インゲンの炭そ病 (Colletotrichum lindemthianum)

ラッカセイの黒渋病 (Cercospora personata)、褐斑病 (Cercospora arachidicola)、白絹病 (Sclerotium rolfsii) ;

エンドウのうどんこ病 (Erysiphe pisi) ;

ジャガイモの夏疫病 (Alternaria solani)、疫病 (Phytophthora infestans)、緋色腐敗病 (Phytophthora erythroseptica)、半身萎凋病 (Verticillium albo-atrum, V. dahliae, V. nigrescens) ;

イチゴのうどんこ病 (Sphaerotheca humuli) ;

チャの網もち病 (Exobasidium reticulatum) ; 白星病 (Elsinoe leucospila)、輪斑病 (Pestalotiopsis sp.)、炭そ病 (Colletotrichum theae-sinensis)

タバコの赤星病 (Alternaria longipes)、うどんこ病 (Erysiphe cichoracearum)、炭そ病 (Colletotrichum tabacum)、べと病 (Peronospora tabacina)、疫病 (Phytophthora nicotianae) ;

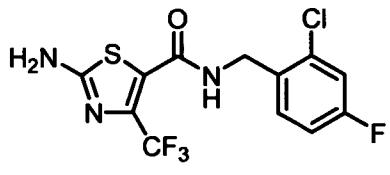
テンサイの褐斑病（Cercospora beticola）、葉腐病（Thanatephorus cucumeris）、根腐病（Thanatephorus cucumeris）、黒根病（Aphanomyces cochlioides）；
バラの黒星病（Diplocarpon rosae）、うどんこ病（Sphaerotheca pannosa）；
キクの褐斑病（Septoria chrysanthemi－indici）、白さび病（Puccinia horiana）；
ヒマワリのべと病（Plasmopara halstedii）；
タマネギの白斑葉枯病(Botrytis cinerea, B. byssoidea, B. squamosa)、灰色腐敗病（Botrytis alli）、小菌核性腐敗病（Botrytis squamosa）；
種々の作物の灰色かび病(Botrytis cinerea)、菌核病(Sclerotinia sclerotiorum)、ピシウム属菌による苗立枯病（Pythium aphanidermatum、P. debarianum, P. graminicola, P. irregulare, P. ultimum）；ダイコンの黒すす病（Alternaria brassicicola）；
シバのダラースポット病（Sclerotinia homeocarpa）、シバのブラウンパッチ病およびラージパッチ病（Rhizoctonia solani）；
バナナのシガトカ病（Mycosphaerella fijiensis、Mycosphaerella musicola、Pseudocercospora musae）；並びに
ポリミクサ属（Polymixa spp.）またはオルピディウム属（Olpidium spp.）等によって媒介される各種植物のウイルス病。

【実施例】

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。

製造例１

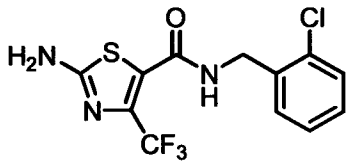


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．２１ｇ、

ＤＭＦ２ｍｌ、トリエチルアミン０．４２ｇ及び２－クロロ－４－フルオロベンジルアミン０．３２ｇの混合物にＢＯＰ試薬０．５３ｇを加え、室温で終夜撹拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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２－アミノ－Ｎ－（２－クロロ－４－フルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１）と記す。）０．３１ｇを得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6) δ [ppm] :4.40(2H, d, J=5.6Hz), 7.22-7.27(1H, m), 7.34-7.38(1H, m), 7.44-7.47(1H, m), 7.78(2H, brs), 8.90(1H, t, J=5.6Hz)

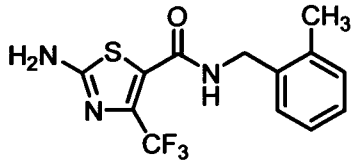
製造例２



窒素雰囲気下にて、ＢＯＰ試薬０．４９ｇ、２－クロロベンジルアミン０．１３ｇ、ＤＭＦ１ｍＬ、トリエチルアミン０．１５ｇの混合物に、窒素雰囲気下かつ氷冷下にて２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．２１ｇを加え、室温で８時間攪拌した。室温にて終夜放置し、反応混合物を飽和重曹水に注加した。その混合物を酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－クロロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２）と記す。）を０．１５ｇ得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6) δ [ppm] :4.43(2H, d, J=5.6Hz), 7.28-7.37(3H, m), 7.45(1H, d, J=7.8Hz,), 7.77(2H, brs,), 8.90(1H, t, J=5.6Hz)

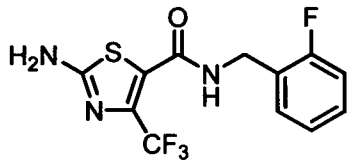
製造例３



ＢＯＰ試薬０．７３ｇ、２－メチルベンジルアミン０．２０ｇ、ＤＭＦ１．５ｍＬ、トリエチルアミン０．１７ｇの混合物に、氷冷下にて２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．３２ｇを加え、室温で２．５時間攪拌した。室温にて終夜放置し、反応混合物を飽和重曹水に注加した。その混合物を酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３）と記す。）を０．４１ｇ得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6) δ [ppm] :2.28(3H, s), 4.34(2H, d, J=5.6Hz), 7.14-7.21(4H, m), 7.73(2H, brs), 8.81(1H, t, J=5.6Hz)

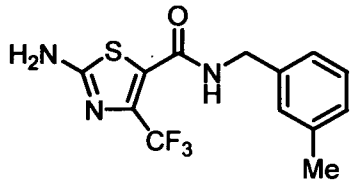
製造例４



ＢＯＰ試薬０．７３ｇ、２－フルオロベンジルアミン０．２１ｇ、ＤＭＦ１．５ｍＬ、トリエチルアミン０．１７ｇの混合物に、氷冷下にて２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．３２ｇを加え、室温で５時間攪拌した。室温にて終夜放置し、反応混合物を飽和重曹水に注加した。その混合物を酢酸エチルで抽出し、水、飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－フルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４）と記す。）を０．３８ｇ得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6) δ [ppm] :4.40(2H, d, J=5.6Hz), 7.16-7.20(2H, m), 7.30-7.34(2H, m), 7.76(2H, brs), 8.89(1H, t, J=5.6Hz)

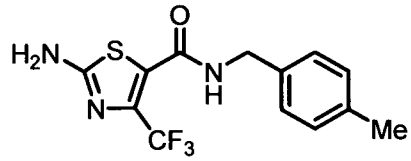
製造例５



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、３－メチルベンジルアミン０．２４ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（３－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５）と記す。）を０．４９ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：２．２９（３Ｈ，ｓ），４．３３（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．０１－７．１０（３Ｈ，ｍ），７．１７－７．２５（１Ｈ，ｍ），７．７３（２Ｈ，ｂｒｓ），８．８７（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

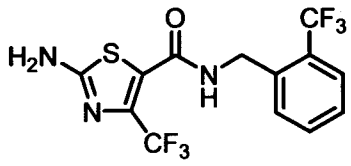
製造例６



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－メチルベンジルアミン０．２４ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（６）と記す。）を０．５１ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： 2．28 （3H， s），4．31 （2H， d， J ＝ 6．0 Hz），7．08－7．19 （6H， m），8．87 （1H， t， J ＝ 6．0 Hz）．

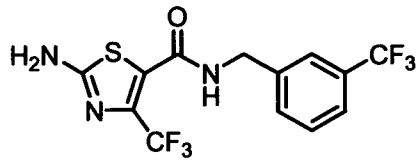
製造例7



2－アミノ－4－トリフルオロメチルチアゾール－5－カルボン酸0．42g、DMF 2mL、トリエチルアミン0．21g、BOP試薬0．93gの混合物に、2－トリフルオロメチルベンジルアミン0．39gを加え、室温で6時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、2－アミノ－4－トリフルオロメチル－N－（2－トリフルオロメチルベンジル）－チアゾール－5－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（7）と記す。）を0．55g得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： 4．55 （2H， d， J ＝ 5．6 Hz），7．45－7．55 （2H， m），7．64－7．77 （2H， m），7．80 （2H， brs），8．96 （1H， t， J ＝ 5．6 Hz）．

製造例8

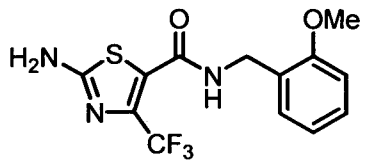


2－アミノ－4－トリフルオロメチルチアゾール－5－カルボン酸0．42g、DMF 2mL、トリエチルアミン0．21g、BOP試薬0．93gの混合物に、3－トリフルオロメチルベンジルアミン0．39gを加え、室温で6時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出し

た。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－４－トリフルオロメチル－Ｎ－（３－トリフルオロメチルベンジル）－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（８）と記す。）を０．４２ｇ得た。

^{1}H－NMR（DMSO－d_6）δ：４．４６（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝６．０Ｈｚ），７．５３－７．６５（４Ｈ，ｍ），７．７７（２Ｈ，ｂｒｓ），９．００（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝６．０Ｈｚ）．

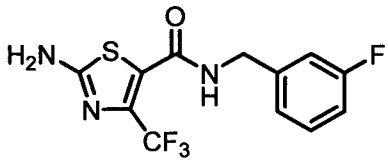
製造例９



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２－メトキシベンジルアミン０．３０ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－メトキシベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（９）と記す。）を０．３４ｇ得た。

^{1}H－NMR（DMSO－d_6）δ：３．８０（３Ｈ，ｓ），４．３３（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），６．８８－６．９５（１Ｈ，ｍ），６．９８（１Ｈ，ｄ，Ｊ＝８．２Ｈｚ），７．１５（１Ｈ，ｄ，Ｊ＝７．５Ｈｚ），７．２１－７．２９（１Ｈ，ｍ），７．７３（２Ｈ，ｂｒｓ），８．７０（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

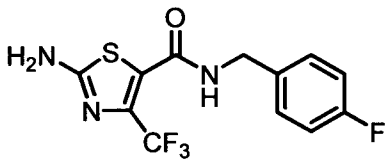
製造例１０



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、３－フルオロベンジルアミン０．２８ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（３－フルオロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１０）と記す。）を０．４０ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３８（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．０１－７．１５（３Ｈ，ｍ），７．３３－７．４３（１Ｈ，ｍ），７．７６（２Ｈ，ｂｒｓ），８．９３（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

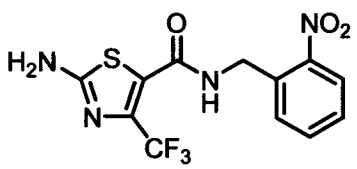
製造例１１



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－フルオロベンジルアミン０．２８ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－フルオロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１１）と記す。）を０．４７ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： ４．３４ （２H， d， J ＝ ６．０ Hz）， ７．１０－７．２２ （２H， m）， ７．２４－７．３６ （２H， m）， ７．７５ （２H， ｂｒｓ）， ８．９０ （１H， t， J ＝ ６．０ Hz）．

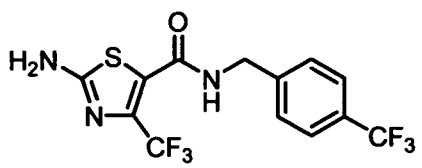
製造例１２



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．４４ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２－ニトロベンジルアミン塩酸塩０．４２ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－ニトロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１２）と記す。）を０．５１ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： ４．６６ （２H， d， J ＝ ５．６ Hz）， ７．４７－７．５９ （２H， m）， ７．７１－７．７８ （１H， m）， ７．８０ （２H， ｂｒｓ）， ８．０１－８．１０ （１H， m）， ８．９２ （１H， t， J ＝ ５．６ Hz）．

製造例１３

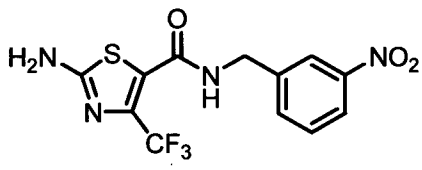


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－トリフルオロメチルベンジルアミン０．３９ｇを加え、室温で６時間攪拌し

た。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－４－トリフルオロメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルベンジル）－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１３）と記す。）を０．４９ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．４５（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．４９（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝８．０Ｈｚ），７．７１（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝８．２Ｈｚ），７．７８（２Ｈ，ｂｒｓ），８．９８（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

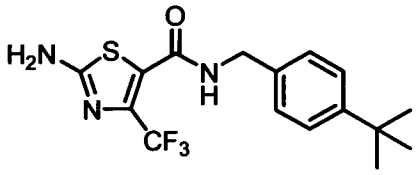
製造例１４



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．４４ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、３－ニトロベンジルアミン塩酸塩０．４２ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（３－ニトロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１４）と記す。）を０．５３ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．５０（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．６１－７．６８（１Ｈ，ｍ），７．６９－７．８６（３Ｈ，ｍ），８．０６－８．１７（２Ｈ，ｍ），９．０４（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

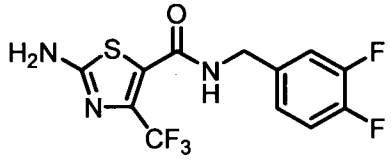
製造例１５



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－ｔｅｒｔ－ブチルベンジルアミン０．３６ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－ｔｅｒｔ－ブチルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１５）と記す。）を０．１８ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：１．２７（９Ｈ，ｓ），４．３２（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．１４－７．２４（２Ｈ，ｍ），７．３２－７．４０（２Ｈ，ｍ），７．７３（２Ｈ，ｂｒｓ），８．８４（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

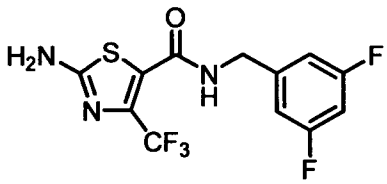
製造例１６



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、３，４－ジフルオロベンジルアミン０．３２ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（３，４－ジフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１６）と記す。）を０．５３ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： ４．３５ （２H， d， J ＝ ５．８ Hz）， ７．０７－７．１５ （１H， m）， ７．２５－７．３４ （１H， m）， ７．３５－７．４６ （１H， m）， ７．７７ （２H， brs）， ８．９３ （１H， t， J ＝ ５．８ Hz）．

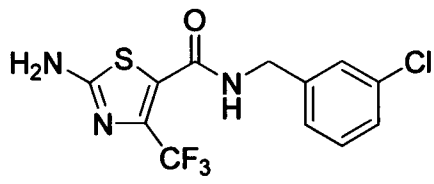
製造例１７



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、DMF２mL、トリエチルアミン０．２１ｇ、BOP試薬０．９３ｇの混合物に、３，５－ジフルオロベンジルアミン０．３２ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－N－（３，５－ジフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１７）と記す。）を０．４９ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： ４．３９ （２H， d， J ＝ ６．０ Hz）， ６．９１－７．０３ （２H， m）， ７．０６－７．１７ （１H， m）， ７．７９ （２H， brs）， ８．９６ （１H， t， J ＝ ６．０ Hz）．

製造例１８

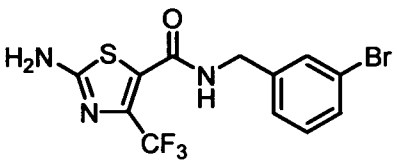


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、DMF２mL、トリエチルアミン０．２１ｇ、BOP試薬０．９３ｇの混合物に、３－クロロベンジルアミン０．３１ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合

物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（３－クロロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１８）と記す。）を０．５０ｇ得た。

^{1}H－NMR（DMSO－d_6）δ：４．３７（２H，ｄ，Ｊ＝６．０ Ｈｚ），７．２１－７．２８（１H，ｍ），７．２８－７．３４（２H，ｍ），７．３４－７．４２（１H，ｍ），７．７７（２H，ｂｒｓ），８．９４（１H，ｔ，Ｊ＝６．０ Ｈｚ）．

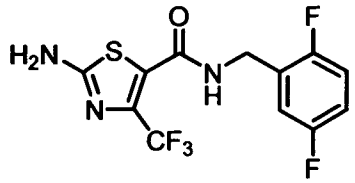
製造例１９



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．４４ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、３－ブロモベンジルアミン塩酸塩０．４９ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（３－ブロモベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（１９）と記す。）を０．５８ｇ得た。

^{1}H－NMR（DMSO－d_6）δ：４．３６（２H，ｄ，Ｊ＝６．０ Ｈｚ），７．２２－７．３７（２H，ｍ），７．３９－７．５３（２H，ｍ），７．７７（２H，ｂｒｓ），８．９４（１H，ｔ，Ｊ＝６．０ Ｈｚ）．

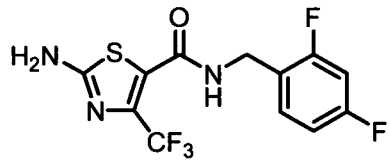
製造例２０



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２，５－ジフルオロベンジルアミン０．３２ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２，５－ジフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２０）と記す。）を０．５０ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３９（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．０６－７．１３（１Ｈ，ｍ），７．１３－７．２１（１Ｈ，ｍ），７．２２－７．３０（１Ｈ，ｍ），７．７８（２Ｈ，ｂｒｓ），８．９３（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

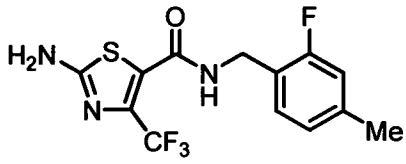
製造例２１



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２，４－ジフルオロベンジルアミン０．３２ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２，４－ジフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２１）と記す。）を０．４６ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： ４．３６ （２H， d， J ＝ ５．８ Hz）， ７．０３－７．１４ （１H， m）， ７．１７－７．２９ （１H， m）， ７．３１－７．４２ （１H， m）， ７．７６ （２H， brs）， ８．８９ （１H， t， J ＝ ５．８ Hz）．

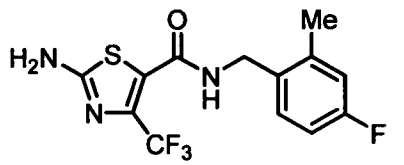
製造例２２



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、DMF２mL、トリエチルアミン０．２１ｇ、BOP試薬０．９３ｇの混合物に、２－フルオロ－４－メチルベンジルアミン０．３１ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－N－（２－フルオロ－４－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２２）と記す。）を０．４３ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： ２．２９ （３H， s）， ４．３５ （２H， d， J ＝ ５．８ Hz）， ６．８９－７．０７ （２H， m）， ７．１３－７．２８ （１H， m）， ７．７４ （２H， brs）， ８．８４ （１H， t， J ＝ ５．８ Hz）．

製造例２３

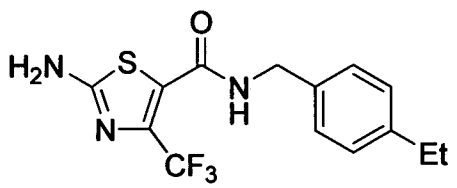


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、DMF２mL、トリエチルアミン０．２１ｇ、BOP試薬０．９３ｇの混合物に、４－フルオロ－２－メチルベンジルアミン０．３１ｇを加え、室温で６時間攪拌

した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－フルオロ－２－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２３）と記す。）を０．４２ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：２．２９（３Ｈ，ｓ），４．３１（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），６．９４－７．１０（２Ｈ，ｍ），７．１６－７．２９（１Ｈ，ｍ），７．７３（２Ｈ，ｂｒｓ），８．８１（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

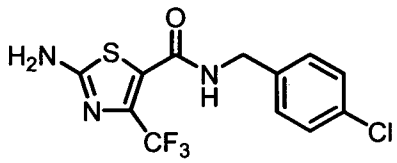
製造例２４



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－エチルベンジルアミン０．３０ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－エチルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２４）と記す。）を０．４２ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：１．１６（３Ｈ，ｔ，Ｊ＝７．５Ｈｚ），２．５７（２Ｈ，ｑ，Ｊ＝７．５Ｈｚ），４．３２（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．１２－７．２３（４Ｈ，ｍ），７．７３（２Ｈ，ｂｒｓ），８．８６（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

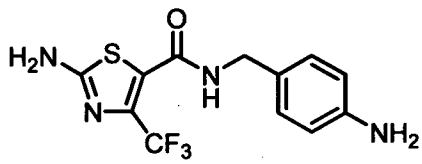
製造例２５



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－クロロベンジルアミン０．３１ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－クロロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２５）と記す。）を０．４９ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３５（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝６．０Ｈｚ），７．２５－７．３５（２Ｈ，ｍ），７．３６－７．４５（２Ｈ，ｍ），７．７６（２Ｈ，ｂｒｓ），８．９１（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝６．０Ｈｚ）．

製造例２６

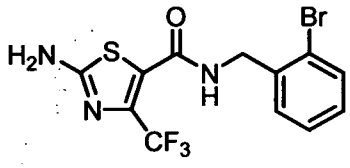


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－アミノベンジルアミン０．２７ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－アミノベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２６）と記す。）を

０．４７ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．１７（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），４．９７（２Ｈ，ｂｒｓ），６．３７－６．７３（２Ｈ，ｍ），６．８１－７．２４（２Ｈ，ｍ），７．６９（２Ｈ，ｂｒｓ），８．７０（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

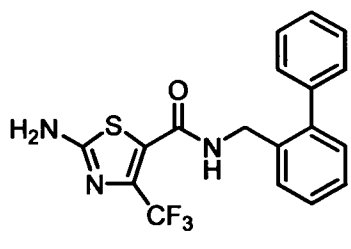
製造例２７



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．４４ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２－ブロモベンジルアミン塩酸塩０．４９ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－ブロモベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２７）と記す。）を０．５４ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．４０（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．１６－７．２７（１Ｈ，ｍ），７．２７－７．３５（１Ｈ，ｍ），７．３５－７．４５（１Ｈ，ｍ），７．５５－７．６８（１Ｈ，ｍ），７．７８（２Ｈ，ｂｒｓ），８．９１（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

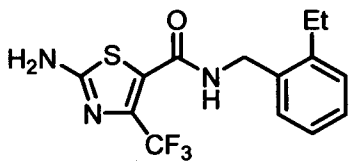
製造例２８



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２－フェニルベンジルアミン０．４０ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－フェニルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２８）と記す。）を０．５２ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３０（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．１７－７．２９（１Ｈ，ｍ），７．２９－７．４３（６Ｈ，ｍ），７．４３－７．５１（２Ｈ，ｍ），７．７２（２Ｈ，ｂｒｓ），８．８２（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ）．

製造例２９

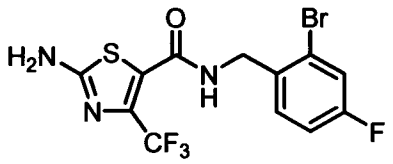


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２－エチルベンジルアミン０．３０ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－４－トリフルオロメチル－Ｎ－（２－エチルベンジル）－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（２９）と記す。）を０．３７ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：１．１７（３Ｈ，ｔ，Ｊ＝７．５Ｈｚ），２．６４（２Ｈ，ｑ，Ｊ＝７．５Ｈｚ），４．３９（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．１６－７．２２（４Ｈ，ｍ），

7．73 （2H, brs), 8．82 （1H, t, J = 5．6 Hz).

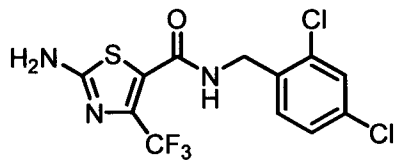
製造例３０



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２－ブロモ－４－フルオロベンジルアミン０．４５ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－ブロモ－４－フルオロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３０）と記す。）を０．５９ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： 4．38 （2H, d, J = 5．6 Hz), 7．26－7．41 （2H, m), 7．57－7．64 （1H, m), 7．79 （2H, brs), 8．81 （1H, t, J = 5．6 Hz).

製造例３１

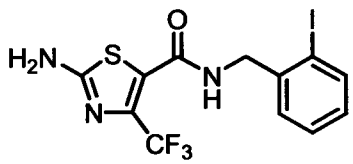


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２，４－ジクロロベンジルアミン０．３９ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた

残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２，４－ジクロロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３１）と記す。）を０．６２ｇ得た。

^{1}H－NMR（DMSO－d_6）δ：４．４１（２H，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．２９－７．３８（１H，ｍ），７．４２－７．５０（１H，ｍ），７．５９－７．６６（１H，ｍ），７．７９（２H，ｂｒｓ），８．９１（１H，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

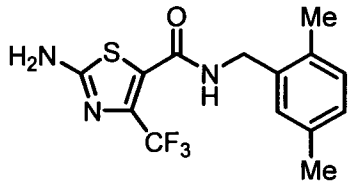
製造例３２



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２－ヨードベンジルアミン塩酸塩０．５９ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２－ヨードベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３２）と記す。）を０．６２ｇ得た。

^{1}H－NMR（DMSO－d_6）δ：４．３２（２H，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），６．９９－７．０９（１H，ｍ），７．２１－７．３０（１H，ｍ），７．３６－７．４７（１H，ｍ），７．７８（２H，ｂｒｓ），７．８４－７．９２（１H，ｍ），８．９０（１H，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

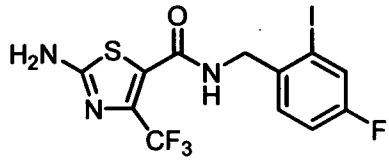
製造例３３



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、２，５－ジメチルベンジルアミン０．３０ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（２，５－ジメチルベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３３）と記す。）を０．５３ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：２．２２（３Ｈ，ｓ），２．２４（３Ｈ，ｓ），４．３０（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），６．９６－７．０６（３Ｈ，ｍ），７．７２（２Ｈ，ｂｒｓ），８．７８（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

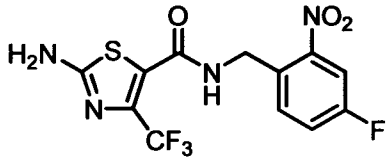
製造例３４



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－フルオロ－２－ヨードベンジルアミン塩酸塩０．６３ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－フルオロ－２－ヨードベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３４）と記す。）を０．７４ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： 4．31 （2H， d， J ＝ 5．6 Hz）， 7．15－7．40 （2H， m）， 7．67－7．91 （3H， m）， 8．88 （1H， t， J ＝ 5．6 Hz）．

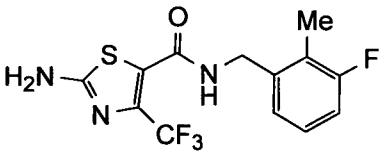
製造例３５



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ２ｍＬ、トリエチルアミン０．２１ｇ、ＢＯＰ試薬０．９３ｇの混合物に、４－フルオロ－２－ニトロベンジルアミン塩酸塩０．３５ｇを加え、室温で６時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、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で精製した。得られた固体をクロロホルムで洗浄し、２－アミノ－Ｎ－（４－フルオロ－２－ニトロベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３５）と記す。）を０．４５ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： 4．62 （2H， d， J ＝ 5．6 Hz）， 7．54－7．61 （1H， m）， 7．63－7．72 （1H， m）， 7．80 （2H， brs）， 7．94－8．02 （1H， m）， 8．91 （1H， t， J ＝ 5．6 Hz）．

製造例３６

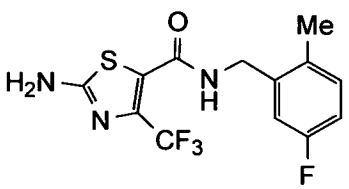


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および３－フルオロ－２－メチルベンジルアミン０．２８ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重

曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（３－フルオロ－２－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３６）と記す。）を０．４０ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：２．１８（３Ｈ，ｄ，Ｊ＝２．０Ｈｚ），４．３７（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．０３－７．０９（２Ｈ，ｍ），７．２０（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ＝１３．９，７．８Ｈｚ），７．７５（２Ｈ，ｓ），８．８６（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

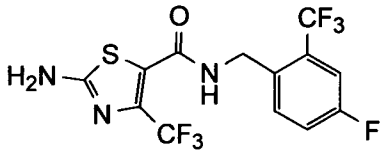
製造例３７



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および５－フルオロ－２－メチルベンジルアミン０．２８ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（５－フルオロ－２－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３７）と記す。）を０．３８ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：２．２５（３Ｈ，ｓ），４．３３（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．９Ｈｚ），６．９４－７．０２（２Ｈ，ｍ），７．１８－７．２３（１Ｈ，ｍ），７．７７（２Ｈ，ｓ），８．８９（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．９Ｈｚ）．

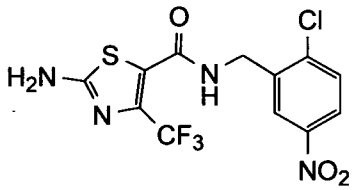
製造例３８



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および４－フルオロ－２－トリフルオロメチルベンジルアミン０．３９ｇを混合し、その混合物を室温で３時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（４－フルオロ－２－トリフルオロメチルベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３８）と記す。）を０．４９ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．５１（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．４Ｈｚ），７．５０－７．６５（３Ｈ，ｍ），７．８０（２Ｈ，ｓ），８．９７（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．４Ｈｚ）．

製造例３９

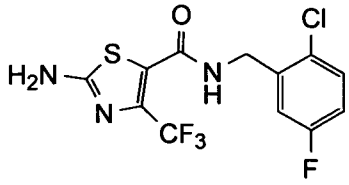


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．４９ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および２－クロロ－５－ニトロベンジルアミン塩酸塩０．４５ｇを混合し、その混合物を室温で３時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、２－アミノ－Ｎ－（２－クロロ－５－ニトロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（３９）と記す。）を０．４０ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．５２（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．

9 Hz), 7.79 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.84 (2H, s), 8.15−8.20 (2H, m), 9.11 (1H, t, J = 5.9 Hz).

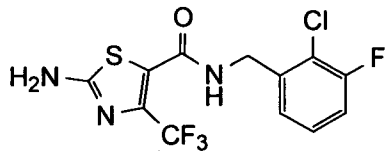
製造例40



2−アミノ−4−トリフルオロメチルチアゾール−5−カルボン酸0.42g、DMF3mL、トリエチルアミン0.24g、BOP試薬1.06g、および2−クロロ−5−フルオロベンジルアミン0.32gを混合し、その混合物を室温で1時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、2−アミノ−4−トリフルオロメチル−N−（2−クロロ−5−フルオロベンジル）チアゾール−5−カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（40）と記す。）を0.43g得た。

^{1}H−NMR (DMSO−d_6) δ: 4.41 (2H, d, J = 5.6 Hz), 7.10 (1H, dd, J = 9.6, 3.0 Hz), 7.17−7.22 (1H, m), 7.52 (1H, dd, J = 8.8, 5.1 Hz), 7.80 (2H, s), 8.95 (1H, t, J = 5.6 Hz).

製造例41

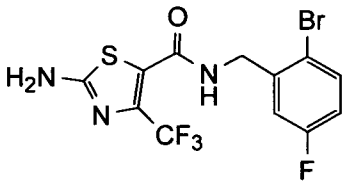


2−アミノ−4−トリフルオロメチルチアゾール−5−カルボン酸0.42g、DMF3mL、トリエチルアミン0.24g、BOP試薬1.06g、および2−クロロ−3−フルオロベンジルアミン0.32gを混合し、その混合物を室温

で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（２－クロロ－３－フルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４１）と記す。）を０．１４ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．４６（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．９Ｈｚ），７．１７（１Ｈ，ｄ，Ｊ＝７．１Ｈｚ），７．３１－７．４３（２Ｈ，ｍ），７．７９（２Ｈ，ｓ），８．９５（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．９Ｈｚ）．

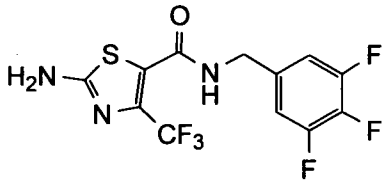
製造例４２



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．４９ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および２－ブロモ－５－フルオロベンジルアミン塩酸塩０．４８ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（２－ブロモ－５－フルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４２）と記す。）を０．４５ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３８（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．０６－７．１６（２Ｈ，ｍ），７．６７（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ＝８．８，５．４Ｈｚ），７．７９（２Ｈ，ｓ），８．９５（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

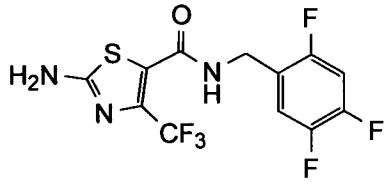
製造例４３



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および３，４，５－トリフルオロベンジルアミン０．３２ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（３，４，５－トリフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４３）と記す。）を０．３４ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３５（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝６．１Ｈｚ），７．１７－７．２２（２Ｈ，ｍ），７．８０（２Ｈ，ｓ），８．９５（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝６．１Ｈｚ）．

製造例４４

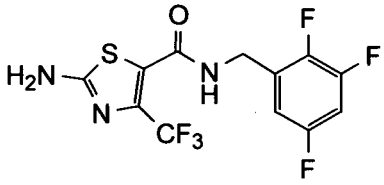


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および２，４，５－トリフルオロベンジルアミン０．３２ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、２－アミノ－Ｎ－（２，４，５－トリフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４４）と記す。）を０．４５ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３５（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．

6 Hz), 7.32－7.39 (1H, m), 7.52－7.59 (1H, m), 7.78 (2H, s), 8.92 (1H, t, J = 5.6 Hz).

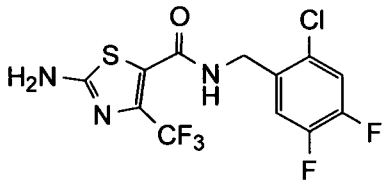
製造例45



2－アミノ－4－トリフルオロメチルチアゾール－5－カルボン酸0.42g、DMF 3mL、トリエチルアミン0.24g、BOP試薬1.06g、および2，3，5－トリフルオロベンジルアミン0.32gを混合し、その混合物を室温で1時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、2－アミノ－N－（2，3，5－トリフルオロベンジル）－4－トリフルオロメチルチアゾール－5－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（45）と記す。）を0.34g得た。

^{1}H－NMR (DMSO－d_6) δ: 4.43 (2H, d, J = 5.9 Hz), 6.95－7.00 (1H, m), 7.42－7.50 (1H, m), 7.80 (2H, s), 8.97 (1H, t, J = 5.9 Hz).

製造例46

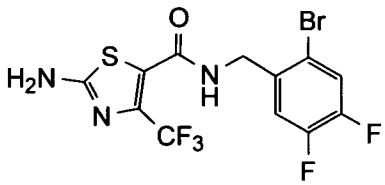


2－アミノ－4－トリフルオロメチルチアゾール－5－カルボン酸0.42g、DMF 3mL、トリエチルアミン0.49g、BOP試薬1.06g、および2－クロロ－4，5－ジフルオロベンジルアミン塩酸塩0.43gを混合し、その混合物を室温で1時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出

した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（２－クロロ－４，５－ジフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４６）と記す。）を０．５２ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３８（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．３４（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ＝１１．５，８．５Ｈｚ），７．７６（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ＝１０．４，７．４Ｈｚ），７．８０（２Ｈ，ｓ），８．９４（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

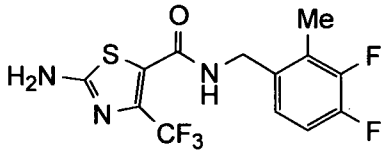
製造例４７



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．７１ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジルアミン塩酸塩０．５２ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４７）と記す。）を０．５２ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３５（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．３２（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ＝１１．６，８．４Ｈｚ），７．７９（２Ｈ，ｓ），７．８８（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ＝１０．２，７．６Ｈｚ），８．９４（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

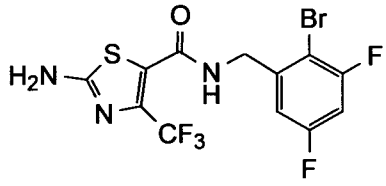
製造例４８



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および３，４－ジフルオロ－２－メチルベンジルアミン０．３１ｇを混合し、その混合物を室温で２時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（３，４－ジフルオロ－２－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４８）と記す。）を０．２１ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：２．２４（３Ｈ，ｓ），４．３４（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．０４－７．０８（１Ｈ，ｍ），７．２０－７．２７（１Ｈ，ｍ），７．７５（２Ｈ，ｓ），８．８５（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

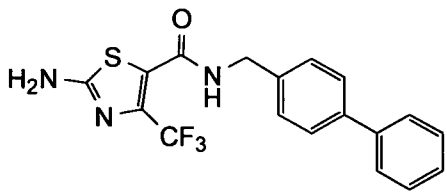
製造例４９



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．４９ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルアミン塩酸塩０．５２ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（４９）と記す。）を０．４９ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： 4．43 （2H， d， J ＝ 5．6 Hz）， 6．99 （1H， d， J ＝ 9．5 Hz）， 7．40－7．46 （1H， m）， 7．81 （2H， s）， 8．98 （1H， t， J ＝ 5．6 Hz）．

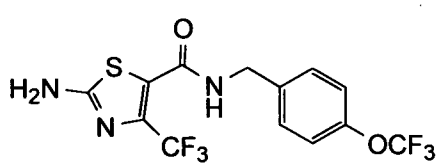
製造例５０



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．５１ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および４－フェニルベンジルアミン０．３７ｇを混合し、その混合物を室温で２時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（４－フェニルベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５０）と記す。）を０．２０ｇ得た。

^{1}H－NMR （DMSO－d_6） δ： 4．41 （2H， d， J ＝ 6．1 Hz）， 7．34－7．38 （3H， m）， 7．43－7．48 （2H， m）， 7．62－7．67 （4H， m）， 7．75 （2H， s）， 8．93 （1H， t， J ＝ 6．1 Hz）．

製造例５１

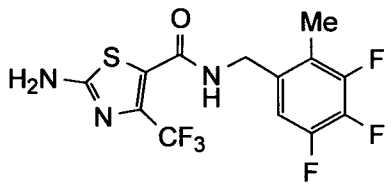


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および４－トリフルオロメトキシベンジルアミン０．３８ｇを混合し、その混合物を室温

で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（４－トリフルオロメトキシベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５１）と記す。）を０．５７ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．３８（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．９Ｈｚ），７．３４（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝８．３Ｈｚ），７．３９（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝８．３Ｈｚ），７．７７（２Ｈ，ｓ），８．９３（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．９Ｈｚ）．

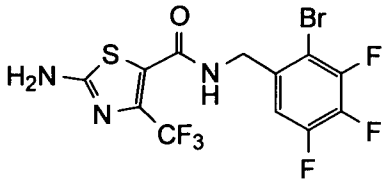
製造例５２



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および３，４，５－トリフルオロ－２－メチルベンジルアミン０．３５ｇを混合し、その混合物を室温で７時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（３，４，５－トリフルオロ－２－メチルベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５２）と記す。）を０．４８ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：２．２０（３Ｈ，ｓ），４．３４（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．０５－７．１１（１Ｈ，ｍ），７．７８（２Ｈ，ｓ），８．８９（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

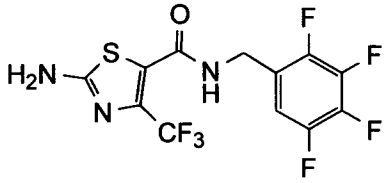
製造例５３



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．４９ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロベンジルアミン塩酸塩０．５５ｇを混合し、その混合物を室温で２時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５３）と記す。）を０．６３ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．４０（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ），７．２１－７．２７（１Ｈ，ｍ），７．８２（２Ｈ，ｓ），８．９６（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．６Ｈｚ）．

製造例５４

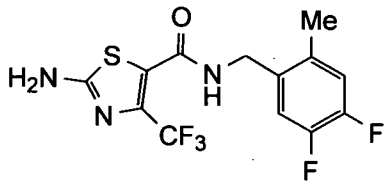


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．４９ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および２，３，４，５－テトラフルオロベンジルアミン塩酸塩０．４３ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、２－アミノ－Ｎ－（２，３，４，５－テトラフルオロベンジル）－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５４）と記す。）を０．４９ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．４１（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．

6 Hz), 7.22－7.29 (1H, m), 7.80 (2H, s), 8.94 (1H, t, J = 5.6 Hz).

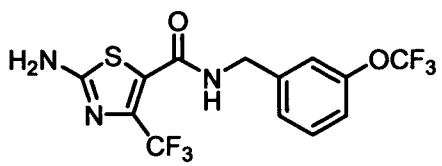
製造例５５



２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ３ｍＬ、トリエチルアミン０．２４ｇ、ＢＯＰ試薬１．０６ｇ、および４，５－ジフルオロ－２－メチルベンジルアミン０．３１ｇを混合し、その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－４－トリフルオロメチル－Ｎ－（４，５－ジフルオロ－２－メチルベンジル）チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５５）と記す。）を０．４２ｇ得た。

^{1}H－NMR (DMSO－d_6) δ： 2.25 (3H, s), 4.29 (2H, d, J = 5.6 Hz), 7.16 (1H, dd, J = 11.8, 8.4 Hz), 7.27 (1H, dd, J = 11.6, 8.4 Hz), 7.76 (2H, s), 8.86 (1H, t, J = 5.5 Hz).

製造例５６

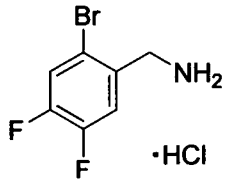


２－アミノ－４－トリフルオロメチルチアゾール－５－カルボン酸０．４２ｇ、ＤＭＦ１０ｍＬ、トリエチルアミン０．２０ｇ、ＢＯＰ試薬０．８８ｇの混合物に、３－トリフルオロメトキシベンジルアミン０．３８ｇを加え、室温で３時間攪拌した。反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗

浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、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、２－アミノ－Ｎ－（３－トリフルオロメトキシベンジル）－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸アミド（以下、本発明化合物（５６）と記す。）を０．２８ｇ得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．４０（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．８Ｈｚ），７．２２－７．３０（３Ｈ，ｍ），７．４６（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝７．７Ｈｚ），７．７６（２Ｈ，ｓ），８．９８（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．９Ｈｚ）．

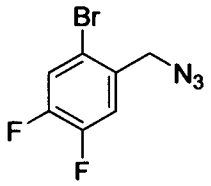
参考製造例１



２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジルアジド３．３５ｇのＴＨＦ溶液（４０ｍＬ）に、氷冷下にてトリフェニルホスフィン３．９１ｇを加えた。その混合物を室温で６時間攪拌した。反応混合物を終夜室温で放置し、ここにアンモニア水（２８％）を１５ｍＬ加えた。その混合物を室温で３時間攪拌した後、４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液４６．４ｍＬを加えた。その混合物を室温で１時間攪拌した後、１Ｎ塩酸を８７．５ｍＬ加えた。反応混合物を静置し、ＴＨＦ層を分取した。水層はｔ－ブチルエチルエーテルで抽出し、ＴＨＦ層とあわせた。水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で濃縮して、残渣にＴＨＦ５ｍＬを加えた。氷冷下にて濃塩酸１．５ｍＬを加え、トルエンを加えて水を共沸させた。残渣をＴＨＦで洗浄し、得られた結晶を乾燥して、２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジルアミン塩酸塩１．９４ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．１０（２Ｈ，ｓ），７．８２（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝１１．７Ｈｚ，Ｊ$_2$＝８．３Ｈｚ），７．９３（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝１０．１Ｈｚ，Ｊ$_2$＝７．７Ｈｚ），８．５５（３Ｈ，ｂｒｓ）

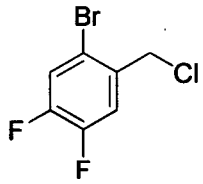
参考製造例２



２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジルクロリド３．２８ｇのＤＭＳＯ溶液（３０ｍＬ）にアジ化ナトリウム１．０８ｇを加えた。その混合物を室温で１．５時間攪拌した。反応混合物を終夜室温で放置し、反応混合物を水５０ｍＬに注加した。ｔ－ブチルメチルエーテルで抽出し、水、飽和食塩水の順に洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で濃縮して、２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジルアジド３．３５ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）δ：４．４５（２Ｈ，ｓ），７．２８（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝１０．０Ｈｚ，Ｊ$_2$＝７．６Ｈｚ），７．４４（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝９．５Ｈｚ，Ｊ$_2$＝７．３Ｈｚ）

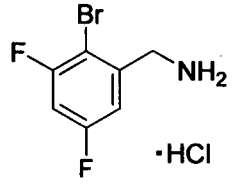
参考製造例３



２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジルアルコール４．０２ｇのトルエン溶液（１５ｍＬ）に塩化チオニル１．４５ｍＬとＤＭＦ２滴を加えた。その混合物を８０℃にて１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に付して、２－ブロモ－４，５－ジフルオロベンジルクロリド３．２８ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）δ：４．６２（２Ｈ，ｓ），７．３６（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝１０．５Ｈｚ，Ｊ$_2$＝８．１Ｈｚ），７．４３（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝９．５Ｈｚ，Ｊ$_2$＝７．４Ｈｚ）

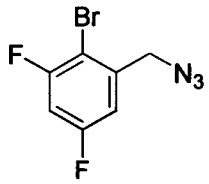
参考製造例４



２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルアジド６．９０ｇのＴＨＦ溶液（１００ｍＬ）に、氷冷下にてトリフェニルホスフィン７．９１ｇを加えた。その混合物を室温で９時間攪拌した。反応混合物を終夜室温で放置し、アンモニア水（２８％）を３０ｍＬ加えた。室温で３時間攪拌した後、４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液９４ｍＬを加えた。室温で１時間攪拌した後、１Ｎ塩酸を１７７ｍＬ加えた。反応混合物を静置し、ＴＨＦ層を分取した。水層はｔ－ブチルエチルエーテルで抽出し、ＴＨＦ層とあわせた。水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で濃縮して、残渣にＴＨＦ１０ｍＬを加えた。氷冷下にて濃塩酸３ｍＬを加え、生じた結晶を濾過により集めた。得られた結晶をＴＨＦで洗浄した後、乾燥して、２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルアミン塩酸塩２．８９ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．１７（２Ｈ，ｓ），７．４８－７．５３（２Ｈ，ｍ），８．７１（３Ｈ，ｂｒｓ）

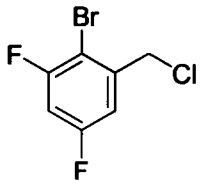
参考製造例５



２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルクロリド７．００ｇのＤＭＳＯ溶液（５５ｍＬ）にアジ化ナトリウム２．１８ｇを加えた。その混合物を室温で２．５時間攪拌した。反応混合物を終夜室温で放置し、反応混合物を水２００ｍＬに注加した。ｔ－ブチルメチルエーテルで抽出し、水、飽和食塩水の順に洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で濃縮して、２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルアジド６．９０ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）δ：４．５２（２Ｈ，ｓ），６．８７－６．９２（１Ｈ，ｍ），７．０２－７．０５（１Ｈ，ｍ）

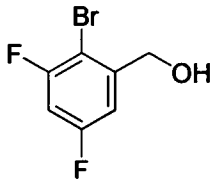
参考製造例６



２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルアルコール６．１２ｇのトルエン溶液（２００ｍＬ）に塩化チオニル２．４０ｍＬとＤＭＦ４滴を加えた。その混合物を８０℃にて１時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルクロリド７．００ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）δ：４．６８（２Ｈ，ｓ），６．８７－７．１８（２Ｈ，ｍ）

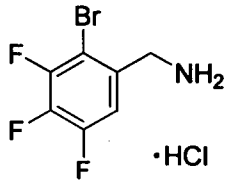
参考製造例７



２－ブロモ－３，５－ジフルオロ安息香酸１９．５１ｇのＴＨＦ溶液（３００ｍＬ）に１，１’－カルボニルジイミダゾール２０．０１ｇを加え、３時間４０分加熱還流した。反応混合物を室温まで放冷し、水素化ホウ素ナトリウム５．０７ｇの水溶液（１６０ｍＬ）に４時間かけて滴下した。水素化ホウ素ナトリウム２．５ｇを追加し、３時間攪拌した後、室温で一晩放置した。反応混合物を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトに付して、２－ブロモ－３，５－ジフルオロベンジルアルコール７．４１４ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）δ：２．０１（１Ｈ，ｂｒｓ），４．７６（２Ｈ，ｓ），６．８４（１Ｈ，ｄｄｄ，J_1 ＝ ８．３ Ｈｚ，J_2 ＝ ８．３ Ｈｚ，J_3 ＝ ２．９ Ｈｚ），７．１３－７．１６（１Ｈ，ｍ）

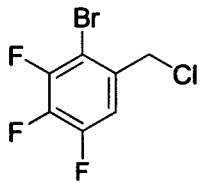
参考製造例８



２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロベンジルクロリド６．５４ｇのＤＭＳＯ溶液（５５ｍＬ）にアジ化ナトリウム２．１８ｇを加えた。その混合物を室温で３０分間攪拌した。反応混合物を室温で一晩放置した後、反応混合物を水８０ｍＬに注加した。ｔ－ブチルメチルエーテルで抽出した後、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。残渣にＴＨＦ１００ｍＬを加え、氷冷下にてトリフェニルホスフィン７．２７ｇを加え、室温で１．５時間攪拌した。室温で３日間放置した後、アンモニア水（２８％）２８ｍＬを加え、３時間攪拌した。４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液９４ｍＬを加え、１時間攪拌した。１Ｎ塩酸を１５０ｍＬ加えた後、反応混合物を静置し、ＴＨＦ層を分取した。水層はｔ－ブチルエチルエーテルで抽出し、ＴＨＦ層とあわせた。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で濃縮して、残渣にＴＨＦ５ｍＬを加えた。氷冷下にて濃塩酸５ｍＬを加え、トルエンを加えて水を共沸させた。残渣をクロロホルムで洗浄し、得られた結晶を乾燥して、２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロベンジルアミン塩酸塩３．３６ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．１５（２Ｈ，ｓ），７．７５－７．８０（１Ｈ，ｍ），８．６９（３Ｈ，ｂｒｓ）

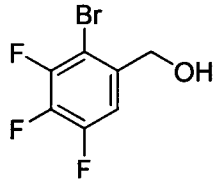
参考製造例９



２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロベンジルアルコール１６．６５ｇのトルエン溶液（２００ｍＬ）に塩化チオニル７．５６ｍＬとＤＭＦ４滴を加えた。その混合物を１１０℃にて３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に付して、２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロベンジルクロリド６．５３７ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）δ：４．６４（２Ｈ，ｓ），７．２１－７．２６（１Ｈ，ｍ）

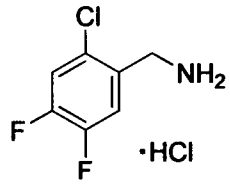
参考製造例１０



２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロ安息香酸１６．９１ｇのトルエン溶液（２００ｍＬ）に塩化チオニル７．２６ｍＬとＤＭＦ４滴を加えた。その混合物を１１０℃で６時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をＴＨＦ１５０ｍＬに溶解させた。このＴＨＦ溶液を氷冷した水素化ホウ素ナトリウム４．０９ｇのエタノール溶液（３００ｍＬ）に１．５時間かけて滴下し、その後室温で１時間攪拌した。反応混合物を室温で一晩放置した後、減圧下で濃縮した。残渣に水と酢酸エチルを加え、酢酸エチル層を分取した。水層は酢酸エチルで抽出し、先の酢酸エチル層と合わせた。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトに付して、２－ブロモ－３，４，５－トリフルオロベンジルアルコール６．６０３ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（$CDCl_3$）δ：２．０８（１Ｈ，ｔ，Ｊ＝５．９Ｈｚ），４．７２（２Ｈ，ｄ，Ｊ＝５．９Ｈｚ），７．２４－７．２９（１Ｈ，ｍ）

参考製造例１１

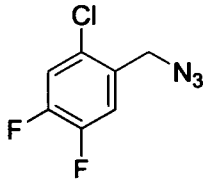


２－クロロ－４，５－ジフルオロ－ベンジルアジド２．６３ｇのＴＨＦ溶液（５０ｍＬ）に、氷冷下にてトリフェニルホスフィン３．７２ｇを加えた。その混合物を室温で７．５時間攪拌した。反応混合物を１日間室温で放置し、アンモニア水（２８％）を１４ｍＬ加えた。室温で３．５時間攪拌した後、４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液４５ｍＬを加えた。室温で２時間攪拌した後、１Ｎ塩酸を８５ｍＬ加えた。反応混合物を静置し、ＴＨＦ層を分取した。水層はｔ－ブチルエチルエーテルで抽出し、ＴＨＦ層とあわせた。水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で濃縮して、残渣にＴＨＦ５ｍＬを加えた。氷冷下にて濃塩酸１．５ｍＬを加え、生じた結晶を濾過により集めた。得られた結晶をＴ

ＨＦで洗浄した後、乾燥して、２－クロロ－４，５－ジフルオローベンジルアミン塩酸塩１．４１ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ：４．１０（２Ｈ，ｓ），７．７９（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝１０．４Ｈｚ，Ｊ$_1$＝７．４Ｈｚ），７．８８（１Ｈ，ｄｄ，Ｊ$_1$＝１１．５Ｈｚ，Ｊ$_1$＝８．５Ｈｚ），８．７２（３Ｈ，ｂｒｓ）

参考製造例１２



２－クロロ－４，５－ジフルオローベンジルブロミド３．１５ｇのＤＭＳＯ溶液（２５ｍＬ）にアジ化ナトリウム１．０３ｇを加えた。その混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を終夜室温で放置し、反応混合物を水１００ｍＬに注加した。ｔ－ブチルメチルエーテルで抽出し、水、飽和食塩水の順に洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で濃縮して、２－クロロ－４，５－ジフルオローベンジルアジド２．６３ｇを得た。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_3$）δ：４．４６（２Ｈ，ｓ），７．２５－７．２９（２Ｈ，ｍ）

次に製剤例を示す。なお、部とは重量部を示す。

製剤例１

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種５０部、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部をよく粉砕混合することにより、各々の水和剤を得る。

製剤例２

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種２０部とソルビタントリオレエート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、

湿式粉砕法で微粉砕した後、この中に、キサンタンガム０．０５部及びアルミニウムマグネシウムシリケート０．１部を含む水溶液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。

製剤例３

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種２部、カオリンクレー８８部及びタルク１０部をよく粉砕混合することにより、各々の粉剤を得る。

製剤例４

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種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。

製剤例５

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種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部をよく粉砕混合した後、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。

製剤例６

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種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部を混合し、湿式粉砕法で微粉砕することにより、各々のフロアブル製剤を得る。

製剤例７

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種４０部、プロピレングリコールを５部（ナカライテスク製）、Soprophor FLK を５部（ローディア日華製）、アンチフォームＣエマルションを０．２部（ダウコーニング社製）、プロキセルGXL を０．３部（アーチケミカル製）、及びイオン交換水を４９．５部の割合で混合し、

原体スラリーを調製する。該スラリー１００部に１５０部のガラスビーズ（Φ=1mm）を投入し、冷却水で冷却しながら、２時間粉砕する。粉砕後、ガラスビーズをろ過により除き、各々のフロアブル製剤を得る。

製剤例８

本発明化合物（１）～（５６）のいずれか１種５０部、NNカオリンクレーを３８．５部（竹原化学工業製）、Morwet D４２５を１０部、Morwer EFW を１．５部（アクゾノーベル社製）の割合で混合し、該混合物をジェットミルで粉砕し、各々の粉剤を得る。

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。

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、本発明化合物を処理した植物の病斑の面積と、無処理の植物の病斑の面積を比較することにより評価した。

試験例１

プラスチックポットに土壌を詰め、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（５）、（８）、（９）、（１５）、（１６）、（１７）、（１８）、（１９）、（２２）、（２３）、（２４）、（２５）及び（５１）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（Magnaporthe oryzae）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（５）、（８）、（９）、（１５）、（１６）、（１７）、（１８）、（１９）、（２２）、（２３）、（２４）、（２５）及び（５１）を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。

試験例２

プラスチックポットに土壌を詰め、コムギ（品種；シロガネ）を播種し、温室内で９日間生育させた後、コムギ赤さび病菌（Puccinia redondita f. sp. tritici）

の胞子をふりかけ接種した。接種後２３℃、暗黒多湿下に１日置いた後、風乾させコムギ赤さび病感染苗とした。本発明化合物（２９）、（４１）及び（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、さらに照明下に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（２９）、（４１）及び（４８）を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。

試験例３

プラスチックポットに土壌を詰め、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（１５）、（２１）、（２２）及び（４６）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（Septoria tritici）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（１５）、（２１）、（２２）及び（４６）を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。

試験例４

プラスチックポットに土壌を詰め、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。上記ポットにキュウリベと病菌（Pseudoperonospola cubensis）遊走子嚢の水懸濁液を噴霧接種し、２３℃、多湿下に１日置いた後、風乾し、キュウリベと病感染苗とした。本発明化合物（６）、（８）、（１０）、（１１）、（１２）、（１４）、（１６）、（１７）、（１８）、（１９）、（２２）、（２３）、（２５）、（３０）、（３５）、（３６）、（３７）、（３８）、（４０）、（４２）、（４５）、（４６）、（４７）、（４８）、（４９）、（５２）、（５３）及び（５５）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。散布後植物を風乾し、２３℃の温室内で５日置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（６）、（８）、

（１０）、（１１）、（１２）、（１４）、（１６）、（１７）、（１８）、（１９）、（２２）、（２３）、（２５）、（３０）、（３５）、（３６）、（３７）、（３８）、（４０）、（４２）、（４５）、（４６）、（４７）、（４８）、（４９）、（５２）、（５３）及び（５５）を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。

試験例５

プラスチックポットに土壌を詰め、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（４４）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。散布後植物を風乾し、キュウリ灰色かび病菌（Botrytis cinerea）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日置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（４４）を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。

試験例６

プラスチックポットに土壌を詰め、インゲン（品種；長鶉菜豆）を播種し、温室内で８日間生育させた。本発明化合物（１１）、（１５）、（５２）、（５４）及び（５５）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、上記インゲン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、菌核病菌（Sclerotinia sclerotiorum）の菌糸含有ＰＤＡ培地をインゲン葉面上に置いた。接種後２３℃、多湿下に５日置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１１）、（１５）、（５２）、（５４）及び（５５）を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。

試験例７

プラスチックポットに土壌を詰め、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。上記ポットにキュウリベと病菌（Pseudoperonospola

cubensis）遊走子嚢の水懸濁液を噴霧接種し、２３℃、多湿下に１日置いた後、風乾し、キュウリベと病感染苗とした。本発明化合物（１）、（２）、（３）及び（４）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。散布後植物を風乾し、２３℃の温室内で５日置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１）、（２）、（３）及び（４）を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。

試験例８

プラスチックポットに土壌を詰め、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）、（２）、（３）、（４）、（５）、（６）、（７）、（８）、（９）、（１０）、（１１）、（１２）、（１３）、（１４）、（１６）、（１７）、（１８）、（１９）、（２０）、（２３）、（２５）、（２７）、（２９）、（３０）、（３１）、（３２）、（３４）、（３５）、（３６）、（３７）、（３８）、（３９）、（４０）、（４１）、（４２）、（４５）、（４６）、（４７）、（４８）、（４９）、（５２）、（５３）及び（５５）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（Phytophthora infestans）胞子の水懸濁液を噴霧接種した。接種後はじめは２３℃、多湿下に１日置き、続いて２０℃の人工気象室内で４日間栽培した後、病斑面積を調査した。

本発明化合物（１）、（２）、（３）、（４）、（５）、（６）、（７）、（８）、（９）、（１０）、（１１）、（１２）、（１３）、（１４）、（１６）、（１７）、（１８）、（１９）、（２０）、（２３）、（２５）、（２７）、（２９）、（３０）、（３１）、（３２）、（３４）、（３５）、（３６）、（３７）、（３８）、（３９）、（４０）、（４１）、（４２）、（４５）、（４６）、（４７）、（４８）、（４９）、（５２）、（５３）及び（５５）を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。

試験例９

プラスチック製スポンジ片にトマト（品種：パティオ）を播種し、プラスチックカップ中で約２０日間水耕栽培した。本発明化合物（１）、（２）、（３）、（４）、

（５）、（６）、（７）、（１０）、（１４）、（１６）、（１７）、（１９）、（２２）、（２３）、（２５）、（２７）、（２９）、（３０）、（３６）、（３７）、（３８）、（４０）、（４１）、（４２）、（４５）、（４６）、（４７）、（４８）、（４９）、（５２）及び（５３）の各々を製剤例６に準じてフロアブル製剤とした後、重量換算で１植物あたり１ｍｇを上記トマト水耕栽培苗のカップ中に投入した。さらに７日間水耕栽培後、トマト疫病菌（Phytophthora infestans）胞子の水懸濁液を噴霧接種した。接種後はじめは２３℃、多湿下に１日置き、続いて２０℃の人工気象室内で４日間栽培した後、病斑面積を調査した。

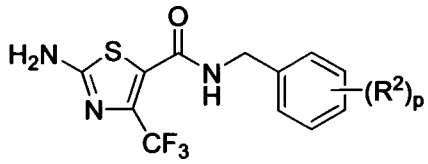
本発明化合物（１）、（２）、（３）、（４）、（５）、（６）、（７）、（１０）、（１４）、（１６）、（１７）、（１９）、（２２）、（２３）、（２５）、（２７）、（２９）、（３０）、（３６）、（３７）、（３８）、（４０）、（４１）、（４２）、（４５）、（４６）、（４７）、（４８）、（４９）、（５２）及び（５３）を処理した植物における病斑面積は、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

産業上の利用可能性

本発明化合物又はその塩は優れた植物病害防除効力を有することから、植物病害防除用途に有用である。

請求の範囲

1． 式（1）



（1）

〔式中、

pは1から5の整数のいずれかを表し、

R^2は群Cより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいC1～C5鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいC3～C10シクロアルキル基、群Eより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲン、シアノ基、ニトロ基、－O－R^5基、－S－R^5基、－C（＝O）－R^5基、－C（＝O）－OR^5基、－OC（＝O）－R^5基、－NR^5R^6基、－C（＝O）－NR^5R^6基又は－NR^5－C（＝O）－R^6基を表すか、

或いは、pが2以上あり、かつ2つのR^2がベンゼン環の隣接する炭素に結合する場合には、該2つのR^2が結合して、群Eより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいC2～C5ポリメチレン基、群Eより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいプロペン－1，3－ジイル基、群Eより選ばれる1以上の基で置換されていてもよい1，3－ブタジエン－1，4－ジイル基又はメチレンジオキシ基を表し、

R^5及びR^6は独立して、水素、群Cより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいC1～C10鎖式炭化水素基、群Dより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいC3～C10シクロアルキル基又は群Eより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいフェニル基を表す。

但し、pが2から5の整数のいずれかである場合、R^2は相互に同一又は相異なる。

なお、群Cは群Dより選ばれる1以上の基で置換されていてもよいC3～C10シクロアルキル基、ハロゲン、シアノ基、ハロゲンで置換されていてもよいC1～C4アルコキシ基、ハロゲンで置換されていてもよいC1～C4アルキルチオ基、ハロゲンで置換されていてもよいC1～C4アルキルスルフィニル基、ハ

ロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルホニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルコキシ）カルボニル基及びハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニルオキシ基からなる群を表し、

群ＤはＣ１～Ｃ５アルキル基及びハロゲンからなる群を表し、

群Ｅはハロゲン、シアノ基、ニトロ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ１０鎖式炭化水素基、群Ｄより選ばれる１以上の基で置換されていてもよいＣ３～Ｃ１０シクロアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルコキシ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルチオ基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルフィニル基、ハロゲンで置換されていてもよいＣ１～Ｃ４アルキルスルホニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニル基、ハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルコキシ）カルボニル基及びハロゲンで置換されていてもよい（Ｃ１～Ｃ４アルキル）カルボニルオキシ基からなる群を表す。］

で示されるアミド化合物又はその塩。

２．　R^2がハロゲンである請求項１記載のアミド化合物又はその塩。

３．　R^2がフッ素又は塩素である請求項１記載のアミド化合物又はその塩。

４．　R^2がフッ素又は臭素である請求項１記載のアミド化合物又はその塩。

５．　ｐが３であり、R^2は相互に同一又は相異なり、ハロゲンである請求項１記載のアミド化合物又はその塩。

６．　ｐが３であり、R^2は相互に同一又は相異なり、フッ素又は塩素である請求項１記載のアミド化合物又はその塩。

７．　ｐが３であり、R^2は相互に同一又は相異なり、フッ素又は臭素である請求項１記載のアミド化合物又はその塩。

８．　請求項１記載のアミド化合物又はその塩と、不活性担体と、を含有する植物病害防除剤。

９．　請求項１記載のアミド化合物又はその塩の有効量を植物又は植物が生育する土壌に施用する工程を有する植物病害の防除方法。

１０．　植物病害を防除するための請求項１記載のアミド化合物又はその塩の使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2010/058863

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
C07D277/20(2006.01)i, *A01N43/78*(2006.01)i, *A01P3/00*(2006.01)i, *C07D277/56*(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)
C07D277/20, A01N43/78, A01P3/00, C07D277/56

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2010
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2010	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2010

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.
Y	GB 1211889 A (UNIROYAL INC.), 21 March 1968 (21.03.1968), entire text; particularly, claims; pages 1, 2; example H & JP 46-33595 B & JP 46-24373 B & US 3505055 A & US 3547917 A & US 3709992 A & US 3725427 A & ZA 6706681 A & FR 1546183 A & NL 6716445 A & NL 6716446 A & AU 6729633 A & BE 707400 A & GB 1211890 A & SU 253685 A & SU 270632 A & SU 306626 A & NL 7702263 A & DE 1795863 A & DE 1695968 A	1-10

☒ 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	Date of mailing of the international search report
07 July, 2010 (07.07.10)	20 July, 2010 (20.07.10)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2010/058863

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2007/087906 A1 (BAYER CROPSCIENCE S.A.), 09 August 2007 (09.08.2007), entire text; claims; page 7, line 23 to page 8, line 2 & JP 2009-525290 A & EP 1981866 A1 & AU 2006337483 A1 & KR 2008090438 A & CN 101360730 A & CA 2632870 A1 & MX 2008009510 A1 & ZA 200805608 A	1-10
Y	JP 7-89946 A (Lucky Ltd.), 04 April 1995 (04.04.1995), entire text; claims; examples & EP 639574 A1 & US 5514643 A	1-10
A	JP 4-128275 A (Mitsubishi Kasei Corp.), 28 April 1992 (28.04.1992), entire text (Family: none)	1-10
A	JP 2001-342183 A (Ube Industries, Ltd.), 11 December 2001 (11.12.2001), entire text (Family: none)	1-10
P,A	WO 2010/012794 A1 (BAYER CROPSCIENCE S.A.), 04 February 2010 (04.02.2010), entire text (Family: none)	1-10

国際調査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ２０１０／０５８８６３

Ａ．　発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07D277/20(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i, A01P3/00(2006.01)i, C07D277/56(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（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07D277/20, A01N43/78, A01P3/00, C07D277/56

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	１９２２－１９９６年
日本国公開実用新案公報	１９７１－２０１０年
日本国実用新案登録公報	１９９６－２０１０年
日本国登録実用新案公報	１９９４－２０１０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	関連する請求項の番号
Y	GB 1211889 A (UNIROYAL INC.) 1968.03.21, 全文、特に、Claims, 第1, 2頁, EXAMPLE H & JP 46-33595 B & JP 46-24373 B & US 3505055 A & US 3547917 A & US 3709992 A & US 3725427 A & ZA 6706681 A & FR 1546183 A & NL 6716445 A & NL 6716446 A & AU 6729633 A & BE 707400 A & GB 1211890 A & SU 253685 A & SU 270632 A & SU 306626 A & NL 7702263 A & DE 1795863 A & DE 1695968 A	１－１０

☑　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 ０７．０７．２０１０	国際調査報告の発送日 ２０．０７．２０１０
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁（ＩＳＡ／ＪＰ） 郵便番号１００－８９１５ 東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	特許庁審査官（権限のある職員）　４Ｐ　２９３９ 新留　素子 電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４９２

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	関連する請求項の番号
Ｙ	WO 2007/087906 A1 (BAYER CROPSCIENCE SA) 2007.08.09, 全文、Claims, 第７頁第23行～第８頁第２行 & JP 2009-525290 A & EP 1981866 A1 & AU 2006337483 A1 & KR 2008090438 A & CN 101360730 A & CA 2632870 A1 & MX 2008009510 A1 & ZA 200805608 A	１－１０
Ｙ	JP 7-89946 A (株式会社ラッキー) 1995.04.04, 全文、特許請求の範囲、実施例 & EP 639574 A1 & US 5514643 A	１－１０
Ａ	JP 4-128275 A (三菱化成株式会社) 1992.04.28, 全文 (ファミリーなし)	１－１０
Ａ	JP 2001-342183 A (宇部興産株式会社) 2001.12.11, 全文 (ファミリーなし)	１－１０
Ｐ，Ａ	WO 2010/012794 A1 (BAYER CROPSCIENCE SA) 2010.02.04, 全文 (ファミリーなし)	１－１０