(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
2014 年 10 月 2 日(02.10.2014)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2014/157596 A1

(51) 国際特許分類:
C07C 257/12 (2006.01) *A01P 3/00* (2006.01)
A01N 37/52 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2014/059054

(22) 国際出願日: 2014 年 3 月 20 日(20.03.2014)

(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 2013-061522 2013 年 3 月 25 日(25.03.2013) JP

(71) 出願人: 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: 玉島 博人(TAMASHIMA, Hiroto); 〒6658555 兵庫県宝塚市高司四丁目２番１号住友化学株式会社内 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).

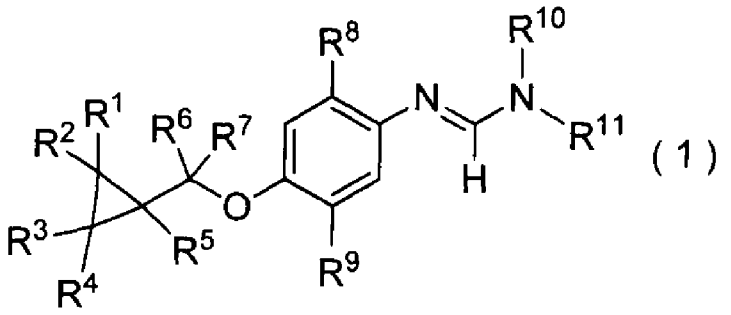
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, 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**: AMIDINE COMPOUND AND USE THEREOF

(54) 発明の名称 : アミジン化合物及びその用途



(1)

(57) **Abstract**: An amidine compound represented by formula (1) [wherein R^1, R^2, R^3, R^4 and R^5 are the same as or different from one another, and independently represent a C1-C5 alkyl group which may have at least one halogen atom or the like; R^6 and R^7 independently represent a hydrogen atom or the like; R^8 and R^9 are the same as or different from each other, and independently represent a C1-C3 alkyl group which may have at least one halogen atom or the like; and R^{10} and R^{11} are the same as or different from each other, and independently represent a C1-C6 alkyl group which may have at least one halogen atom or the like] has an excellent effect of controlling plant diseases.

(57) 要約: 式（１） 〔式中、 R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5は、同一または相異なり１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ５アルキル基等を表し、R^6およびR^7は水素原子等を表し、R^8およびR^9は同一または相異なり１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基等を表し、R^{10}およびR^{11}は同一または相異なり１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基等を表す。〕 で示されるアミジン化合物は、植物病害に対して優れた防除効力を有する。

WO 2014/157596 A1

明 細 書

発明の名称

アミジン化合物及びその用途

技術分野

［０００１］

本発明はアミジン化合物及びその用途に関する。

背景技術

［０００２］

植物病害防除剤の有効成分として多くの化合物が開発され、実用に供されている（WO2000/046184 A、WO2003/093224 A参照。）。

［０００３］

本発明は、植物病害に対して優れた防除効力を有する化合物を提供する。

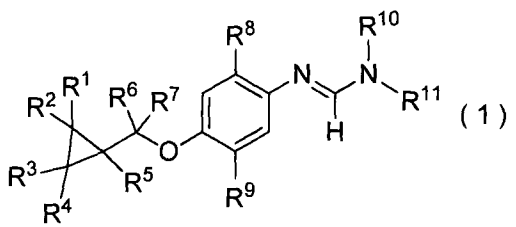
発明の開示

［０００４］

本発明者は、植物病害に対して優れた防除効力を有する化合物を見出すべく検討した結果、下記式（１）で示されるアミジン化合物が植物病害に対して優れた防除効力を有することを見出し、本発明に至った。

すなわち、本発明は以下の発明を含む。

〔１〕 式（１）



（１）

〔式中、

R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5は、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子、またはハロゲン原子を表し、

R^6およびR^7は、それぞれ独立して水素原子または１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基を表し、

R^8およびR^9は、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基、１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ２アルコキシ基またはハロゲン原子を表し、

R^{10}およびR^{11}は、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基または１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ２－Ｃ６アルケニル基を表す。〕

で示されるアミジン化合物（以下、本発明化合物（１）と記すことがある。）。

〔２〕　R^8およびR^9が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいメチル基であり、

R^{10}が、メチル基であり、

R^{11}が、Ｃ１－Ｃ３アルキル基またはＣ２－Ｃ３アルケニル基である〔１〕に記のアミジン化合物。

〔３〕　R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5が、それぞれ独立してＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子またはハロゲン原子であり、

R^8、R^9およびR^{10}がメチル基であり、

R^{11}がエチル基、プロピル基または２－プロペニル基である〔１〕に記載のアミジン化合物。

〔４〕　〔１〕～〔３〕のいずれか一項に記載のアミジン化合物を含有する植物病害防除剤（以下、本発明防除剤と記す。）。

〔５〕　〔１〕～〔３〕のいずれか一項に記載のアミジン化合物の有効量を植物又は土壌に処理することによる植物病害の防除方法。

〔６〕　植物病害を防除するための〔１〕～〔３〕のいずれか一項に記載のアミジン化合物の使用。

［０００５］

本発明化合物（１）を用いることにより、植物病害を防除することができる。

発明を実施するための形態

［０００６］

本発明における置換基を以下に説明する。

［０００７］

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

［０００８］

Ｃ１－Ｃ５アルキル基とは直鎖状もしくは分枝状の炭素数１～５のアルキル基を表し、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、ターシャリーブチル基、ペンチル基、２－メチルブチル基および３－メチルブチル基が挙げられる。

１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ５アルキル基とはＣ１－Ｃ５アルキル基およびＣ１－Ｃ５ハロアルキル基を表す。Ｃ１－Ｃ５ハロアルキル基とはＣ１－Ｃ５アルキル基が有する少なくとも１つの水素原子がハロゲン原子で置換された基を表し、例えば、モノフルオロメチル基、モノクロロメチル基、ジクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、クロロフルオロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、クロロジフルオロメチル基、２，２－ジフルオロエチル基、２－クロロ－２－フルオロエチル基、２－クロロ－２，２－ジフルオロエチル基、２，２－ジクロロ－２－フルオロエチル基、２－フルオロプロピル基、３－フルオロプロピル基、２，２－ジフルオロプロピル基、３，３，３－トリフルオロプロピル基、３－（フルオロメチル）－３－フルオロプロピル基、４－フルオロブチル基および５－フルオロペンチル基が挙げられる。水素原子と置換しうるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

［０００９］

Ｃ１－Ｃ３アルキル基とは、直鎖状もしくは分枝状のアルキル基を表し、メチル基、エチル基、プロピル基およびイソプロピル基が挙げられる。

１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基とはＣ１－Ｃ３アルキル基およびＣ１－Ｃ３ハロアルキル基を表す。Ｃ１－Ｃ３ハロアルキル基とはＣ１－Ｃ３アルキル基が有する少なくとも１つの水素原子がハロゲン原子で置換された基を表し、例えば、モノフルオロメチル基、モノクロロメチル基、ジクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、クロロフルオロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、クロロジフルオロメチル基、２，２－ジフルオロエチル基、２－クロロ－２－フルオロエチル基、２－クロロ－２，２－ジフルオロエチル基、２，２－ジクロロ－２－フルオロエチル基、２－フルオロプロピル基、３－フルオロプロピル基、２，２－ジフルオロプロピル基および３，３，３－トリフルオロプロピル基が挙げられる。水素原子と置換しうるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

［００１０］

Ｃ１－Ｃ６アルキル基とは直鎖状もしくは分枝状の炭素数１～６のアルキル基を表し、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、ターシャリーブチル基、ペンチル基、２－メチルブチル基、３－メチルブチル基およびヘキシル基が挙げられる。

１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基とはＣ１－Ｃ６アルキル基およびＣ１－Ｃ６ハロアルキル基を表す。Ｃ１－Ｃ６ハロアルキル基とは、Ｃ１－Ｃ６アルキル基が有する少なくとも１つの水素原子がハロゲン原子で置換された基を表し、例えば、モノフルオロメチル基、モノクロロメチル基、ジクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、クロロフルオロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、クロロジフルオロメチル基、２，２－ジフルオロエチル基、２－クロロ－２－フルオロ

エチル基、２－クロロ－２，２－ジフルオロエチル基、２，２－ジクロロ－２－フルオロエチル基、２－フルオロプロピル基、３－フルオロプロピル基、２，２－ジフルオロプロピル基、３，３，３－トリフルオロプロピル基、３－（フルオロメチル）－３－フルオロプロピル基、４－フルオロブチル基、５－フルオロペンチル基および２，２－ジフルオロヘキシル基が挙げられる。水素原子と置換しうるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

［００１１］

Ｃ２－Ｃ６アルケニル基とは、直鎖状もしくは分枝状のアルケニル基を表し、例えば、ビニル基、１－プロペニル基、イソプロペニル基、２－プロペニル基、１－ブテニル基、１－メチル－１－プロペニル基、２－ブテニル基、１－メチル－２－プロペニル基、３－ブテニル基、２－メチル－１－プロペニル基、２－メチル－２－プロペニル基、１，３－ブタジエニル基、１－ペンテニル基、１－エチル－２－プロペニル基、２－ペンテニル基、１－メチル－１－ブテニル基、３－ペンテニル基、１－メチル－２－ブテニル基、４－ペンテニル基、１－メチル－３－ブテニル基、３－メチル－１－ブテニル基、１，２－ジメチル－２－プロペニル基、１，１－ジメチル－２－プロペニル基、２－メチル－２－ブテニル基、３－メチル－２－ブテニル基、１，２－ジメチル－１－プロペニル基、２－メチル－３－ブテニル基、３－メチル－３－ブテニル基、１，３－ペンタジエニル基、１－ビニル－２－プロペニル基、１－ヘキセニル基および５－ヘキセニル基が挙げられる。

１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ２－Ｃ６アルケニル基とはＣ２－Ｃ６アルケニル基およびＣ２－Ｃ６ハロアルケニル基を表す。Ｃ２－Ｃ６ハロアルケニル基とは、Ｃ２－Ｃ６アルケニル基が有する少なくとも１の水素原子がハロゲン原子で置換された基を表し、例えば、２－クロロビニル基、２－ブロモビニル基、２－ヨードビニル基、３－クロロ－２－プロペニル基、３－ブロモ－２－プロペニル基、１－クロロメチルビニル基、２－ブロモ－１－メチルビニル基、１－トリフルオロメチルビニル基、３，３，３－トリクロロ－１－プロペニル基、３－ブロモ－３，３－ジフルオロ－１－プロペニル基、２，３，３，３－テトラクロロ－１－プロペニル基、１－トリフルオロメチル－２，２－ジフルオロビニル基、２－クロロ－２－プロペニル

基、３，３－ジフルオロ－２－プロペニル基、２，３，３－トリクロロ－２－プロペニル基、３，３－ジクロロ－２－プロペニル基、３，３－ジブロモ－２－プロペニル基、３－フルオロ－３－クロロ－２－プロペニル基、４－ブロモ－３－クロロ－３，４，４－トリフルオロ－１－ブテニル基、１－ブロモメチル－２－プロペニル基、３－クロロ－２－ブテニル基、４，４，４－トリフルオロ－２－ブテニル基、４－ブロモ－４，４－ジフルオロ－２－ブテニル基、３－ブロモ－３－ブテニル基、３，４，４－トリフルオロ－３－ブテニル基、３，４，４－トリブロモ－３－ブテニル基、３－ブロモ－２－メチル－２－プロペニル基、３，３－ジフルオロ－２－メチル－２－プロペニル基、３，３，３－トリフルオロ－２－メチル－１－プロペニル基、３－クロロ－４，４，４－トリフルオロ－２－ブテニル基、３，３，３－トリフルオロ－１－メチル－１－プロペニル基、３，４，４－トリフルオロ－１，３－ブタジエニル基、ペルフルオロ－１－ブテニル基、ペルフルオロ－３－ブテニル基、３，４－ジブロモ－１－ペンテニル基、４，４－ジフルオロ－３－メチル－３－ブテニル基、３，３，４，４，５，５，５－ヘプタフルオロ－１－ペンテニル基、５，５－ジフルオロ－４－ペンテニル基、４，５，５－トリフルオロ－４－ペンテニル基、３，４，４，４－テトラフルオロ－３－トリフルオロメチル－１－ブテニル基、４，４，４－トリフルオロ－３－メチル－２－ブテニル基、３，５，５－トリフルオロ－２，４－ペンタジエニル基、ペルフルオロ－１－ペンテニル基、ペルフルオロ－４－ペンテニル基、４，４，５，５，６，６，６－ヘプタフルオロ－２－ヘキセニル基、３，４，４，５，５，５－ヘキサフルオロ－３－トリフルオロメチル－１－ペンテニル基、４，５，５，５－テトラフルオロ－４－トリフルオロメチル－２－ペンテニル基、５－ブロモ－４，５，５－トリフルオロ－４－トリフルオロメチル－２－ペンテニル基、ペルフルオロ－１－ヘキセニル基およびペルフルオロ－５－ヘキセニル基が挙げられる。水素原子と置換しうるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

［００１２］

Ｃ２－Ｃ３アルケニル基とは、直鎖状もしくは分枝状のアルケニル基を表し、例えば、ビニル基、１－プロペニル基、およびイソプロペニル基が挙げられる。

［００１３］

１以上のハロゲン原子を有していてもよいメチル基とは、メチル基が有する少なくとも１の水素原子がハロゲン原子で置換された基を表し、例えば、モノフルオロメチル基、モノクロロメチル基、ジクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、クロロフルオロメチル基、およびジクロロフルオロメチル基が挙げられる。水素原子と置換しうるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

［００１４］

Ｃ１－Ｃ２アルコキシ基とは、メトキシ基またはエトキシ基を表す。１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ２アルコキシ基とは、メトキシ基またはエトキシ基が有する少なくとも１の水素原子がハロゲン原子で置換された基を表し、例えば、モノフルオロメトキシ基、モノクロロメトキシ基、モノブロモメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、２－フルオロエトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、２，２，２－トリクロロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、２，２－ジフルオロエトキシ基、２－クロロ－２－フルオロエトキシ基、２－クロロ－２，２－ジフルオロエトキシ基、２，２－ジクロロ－２－フルオロエトキシ基が挙げられる。水素原子と置換しうるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子が挙げられる。

［００１５］

本発明化合物（１）の態様としては、例えば式（１）における置換基が以下に示すものである化合物が挙げられる。

R^1 ～R^4がそれぞれ独立してＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子またはハロゲン原子である化合物；

R^1 ～R^4がそれぞれ独立してメチル基または水素原子である化合物；

R^5 がＣ１－Ｃ５アルキル基または水素原子である化合物；

R^5 がメチル基または水素原子である化合物；

［００１６］

R^6が水素原子であり、R^7がＣ１－Ｃ３アルキル基または水素原子である化合物；

R^6が水素原子であり、R^7がメチル基または水素原子である化合物；

R^8およびR^9が１以上のハロゲン原子を有していてもよいメチル基である化合物；

R^8およびR^9がメチル基である化合物；

R^8およびR^9がトリフルオロメチル基である化合物；

R^8およびR^9がメトキシ基である化合物；

R^8がメチル基であり、R^9がトリフルオロメチル基である化合物；

R^8がトリフルオロメチル基であり、R^9がメチル基である化合物；

R^{10}およびR^{11}がそれぞれ独立してＣ１－Ｃ６アルキル基またはＣ２－Ｃ６アルケニル基である化合物；

R^{10}およびR^{11}がそれぞれ独立してＣ１－Ｃ３アルキル基またはＣ２－Ｃ３アルケニル基である化合物；

R^{10}がメチル基であり、R^{11}がエチル基、プロピル基またはプロペニル基である化合物；

R^{10}がメチル基であり、R^{11}がエチル基またはプロピル基である化合物；

［００１７］

R^1～R^5がそれぞれ独立してＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子またはハロゲン原子であり、R^8およびR^9がそれぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいメチル基であり、R^{10}がメチル基であり、R^{11}がＣ１－Ｃ３アルキル基またはＣ２－Ｃ３アルケニル基である化合物；

［００１８］

R^1～R^5がそれぞれ独立してＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子またはハロゲン原子であり、R^8～R^{10}がメチル基であり、R^{11}がエチル基またはプロピル基である化合物；

R^1～R^4が水素原子であり、R^5がメチル基であり、R^6およびR^7が水素原子であり、R^8およびR^9がそれぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいメチル基であり、R^{10}がメチル基であり、R^{11}がエチル基またはプロピル基である化合物；

R^1～R^4が水素原子であり、R^5がメチル基であり、R^6およびR^7が水素原子であり、R^8およびR^9がメチル基であり、R^{10}がメチル基であり、R^{11}がエチル基またはプロピル基である化合物；

［００１９］

R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子またはハロゲン原子であり、R^6およびR^7が、それぞれ独立して水素原子またはＣ１－Ｃ３アルキル基であり、R^8およびR^9が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基であり、R^{10}およびR^{11}が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基または１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ２－Ｃ６アルケニル基である化合物；

［００２０］

R^1およびR^2が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子またはハロゲン原子であり、R^3、R^4、R^5およびR^6が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ５アルキル基または水素原子でありが、R^7が水素原子であり、R^8、R^9およびR^{10}が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基であり、R^{11}が、１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基または１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ２－Ｃ６アルケニル基である化合物；

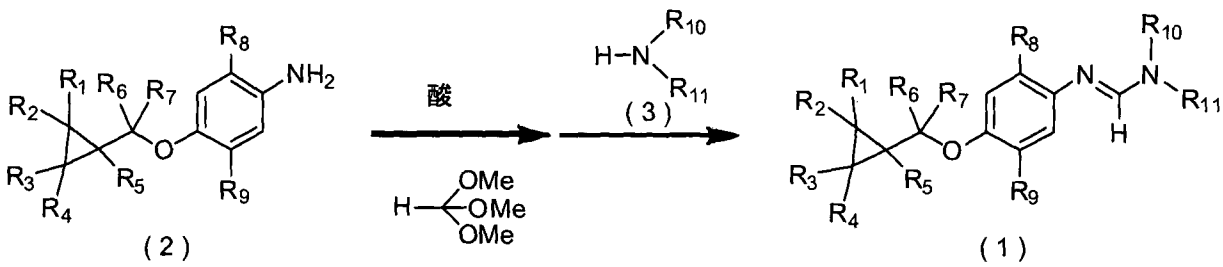
［００２１］

本発明化合物（１）は、例えば以下の製造法により製造することができる。

［００２２］

（製造法１）

本発明化合物（１）は、以下の式（２）で示される化合物（以下、化合物（２）と記すことがある。）とオルトぎ酸トリメチルとを酸の存在下で反応させた後、以下の式（３）で示される化合物（以下、化合物（３）と記すことがある。）と反応させることにより製造することができる。



〔式中、R^1～R^{11}は前記と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒中で行われる。

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、エチレングリコールジメチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル（以下、ＭＴＢＥと記す。）等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素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酸としては、パラトルエンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸ピリジニウム等が挙げられる。

該反応には化合物（２）１モルに対して、化合物（３）が通常１～１０モルの割合、酸が通常０．０１～１モルの割合で用いられ、オルトぎ酸トリメチルの量は通常、化合物（２）１グラムに対して、１～１００グラムの割合である。オルトぎ酸トリメチルは溶媒を兼ねて用いることもできる。

該反応の反応温度は通常－２０～１５０℃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（１）を単離することができる。単離された本発明化合物（１）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。

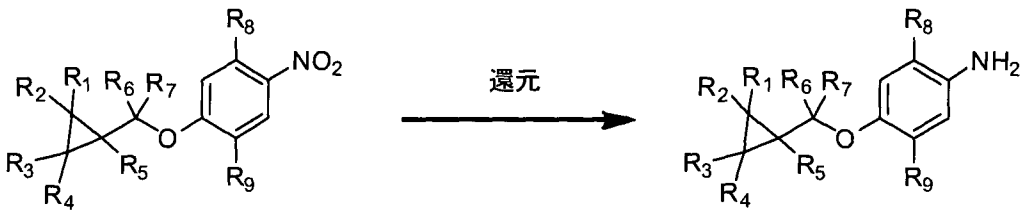
［００２３］

以下に中間体化合物の合成方法について詳細に記載する。

［００２４］

（参考製造法１）

化合物（２）は、以下の式（４）で示される化合物（以下、化合物（４）と記すことがある。）を還元することにより製造することができる。還元反応としては、酢酸水溶液もしくは塩酸水溶液中での鉄粉もしくは錫との反応および接触還元などが挙げられる。好ましい条件は、酢酸水溶液中、鉄粉との反応を含む。



（４） （２）

〔式中、R^1～R^8およびR^9は前記と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒中で行われる。

該反応に用いられる溶媒としては、例えば水、水とテトラヒドロフランとの混合溶媒、水とエタノールの混合溶媒等が挙げられる。

該反応には化合物（４）１モルに対して、鉄粉が通常１～１０モルの割合で用いられる。酢酸の量は通常、化合物（４）１グラムに対して、１～１００グラムの割合である。酢酸は溶媒を兼ねて用いることもできる。

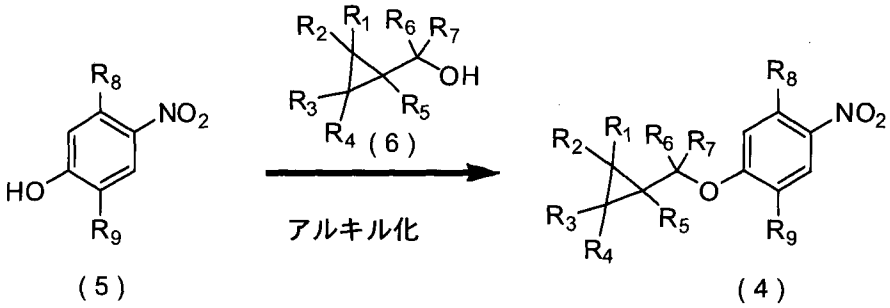
該反応の反応温度は通常－２０～１５０℃の範囲である。該反応の反応時間は通常０．１～２４時間の範囲である。

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、化合物（２）を単離することができる。単離された化合物（２）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。

［００２５］

（参考製造法２）

化合物（４）は、以下の式（５）で示される化合物（以下、化合物（５）と記すことがある。）と以下の式（６）で示される化合物（以下、化合物（６）と記すことがある。）とをトリフェニルホスフィンおよびアゾ化合物存在下で反応させることにより製造することができる。



(5) (4)

〔式中、R^1～R^9は前記と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒中で行われる。

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、エチレングリコールジメチルエーテル、ＭＴＢＥ等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素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アゾ化合物としては、例えば、アゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）、アゾジカルボン酸ジエチルが挙げられる。

該反応には化合物（５）１モルに対して、化合物（６）が通常１～１０モルの割合、トリフェニルホスフィンが通常１～１０モルの割合、アゾ化合物が通常１～１０モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常－２０～１５０℃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、化合物（４）を単離することができる。単離された化合物（４）は、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。

［００２６］

本発明防除剤は、本発明化合物（１）のみからなるものであってもよいが、通常は本発明化合物（１）を、固体担体、液体担体、ガス担体、界面活性剤等と混合し、必要により固着剤、分散剤、安定剤等の製剤用補助剤を添加して、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して用いる。これらの製剤には本発明化合物（１）が重量比で通常０．１～９９％、好ましくは０．２～９０％含有される。

［００２７］

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、フバサミクレー、ベントナイト、酸性白土）、タルク類、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、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、ｎ－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、イソブチルニトリル）、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。

［００２８］

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。

［００２９］

その他の製剤用補助剤としては、例えば固着剤や分散剤、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。

［００３０］

本発明防除剤を施用する方法としては、実質的に本発明防除剤が施用され得る形態であればその方法は特に限定されないが、例えば茎葉散布等の植物体への処理、土壌処理等の植物の栽培地への処理、種子消毒等の種子への処理等が挙げられる。

[００３１]

また、本発明防除剤を他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤と混合して、または混合せずに同時に用いることもできる。

かかる他の殺菌剤としては、例えば以下のものが挙げられる。

[００３２]

（１）アゾール殺菌剤

プロピコナゾール（ｐｒｏｐｉｃｏｎａｚｏｌｅ）、プロチオコナゾール（ｐｒｏｔｈｉｏｃｏｎａｚｏｌｅ）、トリアジメノール（ｔｒｉａｄｉｍｅｎｏｌ）、プロクロラズ（ｐｒｏｃｈｌｏｒａｚ）、ペンコナゾール（ｐｅｎｃｏｎａｚｏｌｅ）、テブコナゾール（ｔｅｂｕｃｏｎａｚｏｌｅ）、フルシラゾール（ｆｌｕｓｉｌａｚｏｌｅ）、ジニコナゾール（ｄｉｎｉｃｏｎａｚｏｌｅ）、ブロムコナゾール（ｂｒｏｍｕｃｏｎａｚｏｌｅ）、エポキシコナゾール（ｅｐｏｘｉｃｏｎａｚｏｌｅ）、ジフェノコナゾール（ｄｉｆｅｎｏｃｏｎａｚｏｌｅ）、シプロコナゾール（ｃｙｐｒｏｃｏｎａｚｏｌｅ）、メトコナゾール（ｍｅｔｃｏｎａｚｏｌｅ）、トリフルミゾール（ｔｒｉｆｌｕｍｉｚｏｌｅ）、テトラコナゾール（ｔｅｔｒａｃｏｎａｚｏｌｅ）、マイクロブタニル（ｍｙｃｌｏｂｕｔａｎｉｌ）、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）アミン殺菌剤

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

（3）ベンズイミダゾール殺菌剤

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

[００３３]

（4）ジカルボキシイミド殺菌剤

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

（5）アニリノピリミジン殺菌剤

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剤

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剤

クレソキシムメチル（ｋｒｅｓｏｘｉｍ－ｍｅｔｈｙｌ）、アゾキシストロビン（ａｚｏｘｙｓｔｒｏｂｉｎ）、トリフロキシストロビン（ｔｒｉｆｌｏｘｙｓｔｒｏｂｉｎ）、フルオキサストロビン（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）、オリサストロビン（ｏｒｙｓａｓｔｒｏｂｉｎ）、エネストロビン（ｅｎｅｓｔｒｏｂｉｎ）等；

（8）フェニルアマイド殺菌剤

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

（9）カルボン酸アミド殺菌剤

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

（１０）カルボキサミド殺菌剤

カルボキシン（ｃａｒｂｏｘｉｎ）、メプロニル（ｍｅｐｒｏｎｉｌ）、フルトラニル（ｆｌｕｔｏｌａｎｉｌ）、チフルザミド（ｔｈｉｆｌｕｚａｍｉｄｅ）、フラメトピル（ｆｕｒａｍｅｔｐｙｒ）、ボスカリド（ｂｏｓｃａｌｉｄ）、ペンチオピラド（ｐｅｎｔｈｉｏｐｙｒａｄ）、フルオピラム（ｆｌｕｏｐｙｒａｍ）、ビキサフェン（ｂｉｘａｆｅｎ）、ペンフルフェン（ｐｅｎｆｌｕｆｅｎ）、セダキサン（ｓｅｄａｘａｎｅ）、フルキサピロキサド（ｆｌｕｘａｐｙｒｏｘａｄ）、イソピラザム（ｉｓｏｐｙｒａｚａｍ）

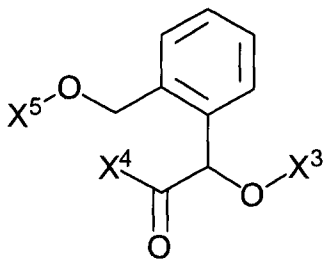
［００３４］

（１１）その他の殺菌剤

ジエトフェンカルブ（ｄｉｅｔｈｏｆｅｎｃａｒｂ）；チウラム（ｔｈｉｕｒａｍ）；フルアジナム（ｆｌｕａｚｉｎａｍ）；マンコゼブ（ｍａｎｃｏｚｅｂ）；クロロタロニル（ｃｈｌｏｒｏｔｈａｌｏｎｉｌ）；キャプタン（ｃａｐｔａｎ）；ジクロフルアニド（ｄｉｃｈｌｏｆｌｕａｎｉｄ）；フォルペット（ｆｏｌｐｅｔ）；キノキシフェン（ｑｕｉｎｏｘｙｆｅｎ）；フェンヘキサミド（ｆｅｎｈｅｘａｎｉｄ）；ファモキサドン（ｆａｎｏｘａｄｏｎ）；フェナミドン（ｆｅｎａｍｉｄｏｎ）；ゾキサミド（ｚｏｘａｍｉｄｅ）；エタボキサム（ｅｔｈａｂｏｘａｍ）；アミスルブロム（ａｍｉｓｕｌｂｒｏｍ）；シアゾファミド（ｃｙａｚｏｆａｍｉｄ）；メトラフェノン（ｍｅｔｒａｆｅｎｏｎｅ）；シフルフェナミド(ｃｙｆｌｕｆｅｎａｍｉｄ)；プロキナジド（ｐｒｏｑｕｉｎａｚｉｄ）；フルスルファミド（ｆｌｕｓｕｌｆａｍｉｄｅ）；フルオピコリド（ｆｌｕｏｐｉｃｏｌｉｄｅ）；フォセチル（ｆｏｓｅｔｙｌ）；シモキサニル（ｃｙｍｏｘａｎｉｌ）；ペンシクロン（ｐｅｎｃｙｃｕｒｏｎ）；トルクロホスメチル（ｔｏｌｃｌｏｆｏｓ-ｍｅｔｈｙｌ）；カル

プロパミド（ｃａｒｐｒｏｐａｍｉｄ）；ジクロシメット（ｄｉｃｌｏｃｙｍｅｔ）；フェノキサニル（ｆｅｎｏｘａｎｉｌ）；トリシクラゾール（ｔｒｉｃｙｃｌａｚｏｌｅ）；ピロキロン（ｐｙｒｏｑｕｉｌｏｎ）；プロベナゾール（ｐｒｏｂｅｎａｚｏｌｅ）；イソチアニル（ｉｓｏｔｉａｎｉｌ）；チアジニル（）；テブフロキン（ｔｅｂｕｆｌｏｑｕｉｎ）；ジクロメジン（ｄｉｃｌｏｍｅｚｉｎｅ）；カスガマイシン（ｋａｓｕｇａｍｙｃｉｎ）；フェリムゾン（ｆｅｒｉｍｚｏｎｅ）；フサライド（ｆｔｈａｌｉｄｅ）；バリダマイシン（ｖａｌｉｄａｍｙｃｉｎ）；ヒドロキシイソキサゾール（ｈｙｄｒｏｘｙｉｓｏｘａｚｏｌｅ）；イミノクタジン酢酸塩（ｉｍｉｎｏｃｔａｄｉｎｅ　ａｃｅｔａｔｅ）；イソプロチオラン（ｉｓｏｐｒｏｔｈｉｏｌａｎｅ）；オキソリニック酸（ｏｘｏｌｉｎｉｃ　ａｃｉｄ）；オキシテトラサイクリン（ｏｘｙｔｅｔｒａｃｙｃｌｉｎｅ）；ストレプトマイシン（ｓｔｒｅｐｔｏｍｙｃｉｎ）；塩基性塩化銅（ｃｏｐｐｅｒ　ｏｘｙｃｈｌｏｒｉｄｅ）；水酸化第二銅（ｃｏｐｐｅｒ　ｈｙｄｒｏｘｉｄｅ）；塩基性硫酸銅（ｃｏｐｐｅｒ　ｈｙｄｒｏｘｉｄｅ　ｓｕｌｆａｔｅ）；有機銅（ｏｒｇａｎｏｃｏｐｐｅｒ）；硫黄（ｓｕｌｆｕｒ）；アメトクトラジン（ａｍｅｔｏｃｔｒａｄｉｎ）；フェンピラザミン（ｆｅｎｐｙｒａｚａｍｉｎｅ）および

式（１２）



(12)

〔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。

［００３５］

かかる他の殺虫剤としては、例えば以下のものが挙げられる。

（１）有機リン化合物

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；

［００３６］

（２）カーバメート化合物

アラニカルブ（ａｌａｎｙｃａｒｂ）、ベンダイオカルブ（ｂｅｎｄｉｏｃａｒｂ）、ベンフラカルブ（ｂｅｎｆｕｒａｃａｒｂ）、ＢＰＭＣ、カルバリル（ｃａｒｂａｒｙｌ）、カルボフラン（ｃａｒｂｏｆｕｒａｎ）、カルボスルファン（ｃａｒｂｏｓｕｌｆａｎ）、クロエトカルブ（ｃｌｏｅｔｈｏｃａｒｂ）、エチオフェンカルブ（ｅｔｈｉｏｆｅｎｃａｒｂ）、フェノブカルブ（ｆｅｎｏｂｕｃａｒｂ）、フェノチオカルブ（ｆｅｎｏｔｈｉｏｃａｒｂ）、フェノキシカルブ（ｆｅｎｏｘｙｃａｒｂ）、フラチオカルブ（ｆｕｒａｔｈｉｏｃａｒｂ）、イソプロカルブ（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）、ｂｉｆｗｅｎｔｏｒｉｎ（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（ｆｌｕｍｅｔｈｒｉ

n）、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；

［００３７］

（４）ネライストキシン化合物

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（ｔｈｉａ

methoxam)、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（hexaflumuron）、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（pyraflupro le）等；

（8）Ｂｔトキシン殺虫剤

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

（9）ヒドラジン化合物

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）天然殺虫剤

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

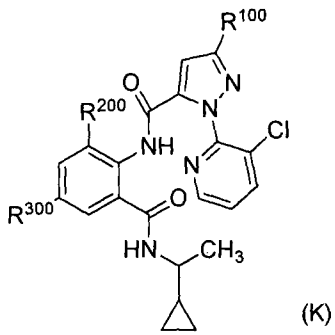
[0038]

（12）その他の殺虫剤

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）、シアントラニリプロール（ｃｙａｎｔｒａｎｉｌｉｐｒｏｌｅ）、

下記式（Ｋ）



(K)

〔式中、

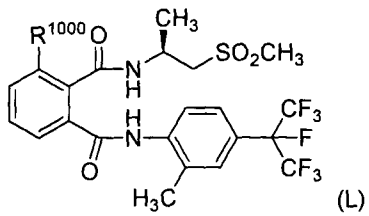
Ｒ１００は塩素、臭素又はトリフルオロメチル基を表し、

Ｒ２００は塩素、臭素又はメチル基を表し、

Ｒ３００は塩素、臭素又はシアノ基を表す。〕

で示される化合物、及び

下記式（Ｌ）



(L)

〔式中、

Ｒ１０００は塩素、臭素又はヨウ素を表す。〕

で示される化合物等。

［００３９］

かかる他の殺ダニ剤（殺ダニ活性成分）としては、例えばアセキノシル（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。

かかる他の殺線虫剤（殺線虫活性成分）としては、例えば、ＤＣＩＰ、フォスチアゼート（ｆｏｓｔｈｉａｚａｔｅ）、塩酸レバミゾール（ｌｅｖａｍｉｓｏｌ）、メチルイソチオシアネート（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。

［００４０］

本発明防除剤の施用量は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用方法、施用場所、対象病害、対象作物等によっても異なるが、本発明防除剤中の本発明化合物量で１０００m^2あたり、通常１～５００ｇ、好ましくは２～２００ｇである。乳剤、水和剤、懸濁剤等は通常水で希釈して施用されるが、その場合の希釈後の本発明化合物（１）濃度は、通常０．０００５～２重量％、好ましくは０．００５～１重量％であり、粉剤、粒剤等は通常希釈することなくそのまま施用される。種子への処理においては、種子１Ｋｇに対して本発明防除剤中の本発明化合物（１）量で、通常０.００１～

１００g、好ましくは０．０１～５０gの範囲で施用される。

［００４１］

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

［００４２］

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

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

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

［００４３］

上記「植物」には遺伝子組換え植物も含まれる。

[0044]

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）、黄化萎縮病（Sclerophthora macrospora）；コムギのうどんこ病（Erysiphe graminis）、赤かび病（Fusarium graminearum、F. avenaceum、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（Septoria tritici）、ふ枯病（Stagonospora nodorum）、黄斑病（Pyrenophora tritici－repentis）、；オオムギのうどんこ病（Erysiphe graminis）、赤かび病（Fusarium graminearum、F. avenaceum、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）；ムギ類のうどんこ病（Erysiphe graminis）、赤かび病（Fusarium graminearum, F. avenaceum, F. culmorum, Microdochium nivale）、さび病（Puccinia striiformis, P. graminis, P. recondita, P. hordei）、雪腐病（Typhula sp., Micronectriella n

ivalis）、裸黒穂病（Ustilago tritici, U. nuda）、なまぐさ黒穂病（Tilletia caries）、眼紋病（Pseudocercosporella herpotrichoides）、雲形病（Rhynchosporium secalis）、葉枯病（Septoria tritici）、ふ枯病（Leptosphaeria nodorum）、網斑病（Pyrenophora teres Drechsler）、立枯病（Gaeumannomyces graminis）、黄斑病（Pyrenophora tritici-repentis）；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）；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）；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 bidwelliii）、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（Mycosphaerell

a 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）、根こぶ病（Plasmodiophora parasitica）、べと病（Peronospora parasitica）；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）、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）、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 ｓｏｃｈｌｉｏｉｄｅｓ）；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）；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）；ダイコン黒斑病（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）；並びにバナナのシガトカ病（Ｍｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ ｆｉｊｉｅｎｓｉｓ、Ｍｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ ｍｕｓｉｃｏｌａ）。

実施例

［００４５］

次に本発明について製造例、製剤例、試験例等の実施例によりさらに具体的に説明するが、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、製造例を示す。

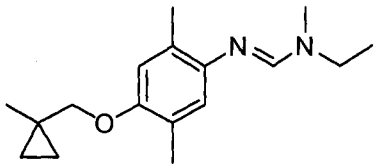
［００４６］

製造例１

２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．４７ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０４ｇおよびオルトぎ酸トリメチル５ｍＬの混合物を加熱還流下１時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン５ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にエチルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時

間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、N'－{2，5－ジメチル－4－[（1－メチルシクロプロピル）メトキシ]フェニル}－N－エチル－N－メチルホルムアミジン（本発明化合物（1－1））を0．15ｇ得た。

本発明化合物（1－1）



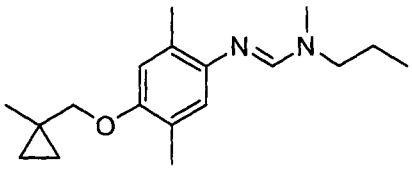
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.38 (1H, s), 6.58 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.68 (2H, s), 3.42-3.26 (2H, br m), 2.96 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.23 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz), 0.54 (2H, dd, J = 5.6, 4.4 Hz), 0.38 (2H, dd, J = 5.9, 4.2 Hz).

［0047］

製造例2

2，5－ジメチル－4－［（1－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン0．78ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物0．12ｇおよびオルトぎ酸トリメチル20ｍLの混合物を加熱還流下2時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣のうちの0．26ｇおよび1，4－ジオキサン10ｍLを室温で混合し、得られた混合物にメチルプロピルアミン0．5mLを室温で加えた。得られた混合物を80℃で1時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、N'－{2，5－ジメチル－4－[（1－メチルシクロプロピル）メトキシ]フェニル}－N－メチル－N－プロピルホルムアミジン（本発明化合物（1－2））を0．15ｇ得た。

本発明化合物（1－2）



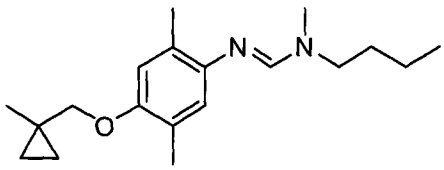
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.39 (1H, s), 6.58 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.68 (2H, s), 3.37-3.07 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.61 (2H, dd, J = 14.3, 7.2 Hz), 1.23 (3H, s), 0.91 (3H, t, J = 7.3 Hz), 0.54 (2H, t, J = 5.0 Hz), 0.38 (2H, t, J = 5.1 Hz).

［００４８］

製造例３

２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．７８ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．１２ｇおよびオルトぎ酸トリメチル２０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣のうちの０．２５ｇおよび１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にブチルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で１５分攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ－ブチル－Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－メチルホルムアミジン（本発明化合物（１－３））を０．１７ｇ得た。

本発明化合物（１－３）



^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.38 (1H, s), 6.58 (1H, s), 6.53 (1H, s), 3.68 (2H, s), 3.37-3.15 (2H, br m), 2.96 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.61-1.52 (2H, m), 1.39-1.26 (2H, m), 1.23 (3H, s), 0.95 (3H, t, J = 7.3 Hz), 0.54 (2H, t, J = 5.0 Hz), 0.38 (2H, t, J = 5.0 Hz).

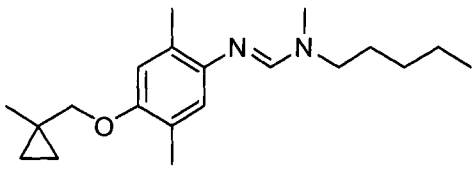
［００４９］

製造例４

２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．７８ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．１２ｇおよびオルトぎ酸トリメチル２０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸

水素ナトリウム水溶液を注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣のうちの０．２１ｇおよび１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にメチルペンチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で１時間撹拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－メチル－Ｎ－ペンチルホルムアミジン（本発明化合物（１－４））を０．１４ｇ得た。

本発明化合物（１－４）



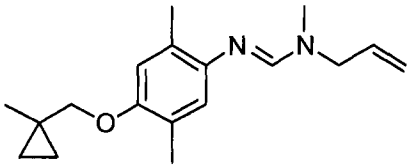
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.38 (1H, s), 6.58 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.68 (2H, s), 3.38-3.12 (2H, br m), 2.96 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.63-1.53 (2H, m), 1.40-1.25 (4H, m), 1.23 (3H, s), 0.91 (3H, t, J = 7.1 Hz), 0.54 (2H, t, J = 4.9 Hz), 0.38 (2H, t, J = 5.1 Hz).

［００５０］

製造例５

２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．７８ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．１２ｇおよびオルトぎ酸トリメチル２０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間撹拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注入し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた残渣のうちの０．２７ｇおよび１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にアリルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で１時間撹拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－プロペニル）ホルムアミジン（本発明化合物（１－５））を０．２０ｇ得た。

本発明化合物（１－５）



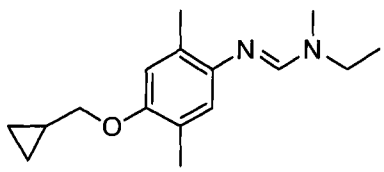
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.42 (1H, s), 6.59 (1H, s), 6.55 (1H, s), 5.84 (1H, ddd, J = 22.1, 5.5, 2.7 Hz), 5.25-5.17 (2H, m), 4.00-3.79 (2H, br m), 3.68 (2H, s), 2.95 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.20 (3H, s), 1.24 (3H, s), 0.54 (2H, t, J = 4.9 Hz), 0.39 (2H, t, J = 5.0 Hz).

［００５１］

製造例６

４－シクロプロピルメトキシー２，５－ジメチルフェニルアミン０．２３ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０２ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にエチルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－（４－シクロプロピルメトキシー２，５－ジメチルフェニル）－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルホルムアミジン（本発明化合物（１－６））を０．１０ｇ得た。

本発明化合物（１－６）



^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.38 (1H, s), 6.62 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.76 (2H, d, J = 6.8 Hz), 3.42-3.24 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.29-1.22 (1H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz), 0.62-0.55 (2H, m), 0.35-0.30 (2H, m).

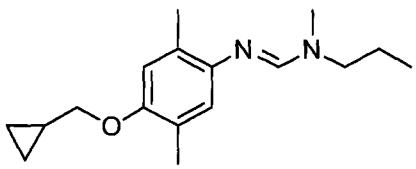
［００５２］

製造例７

４－シクロプロピルメトキシー２，５－ジメチルフェニルアミン０．２３ｇ、パラ

トルエンスルホン酸一水和物０．０２ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にメチルプロピルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－（４－シクロプロピルメトキシ－２，５－ジメチルフェニル）－Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルホルムアミジン（本発明化合物（１－７））を０．１６ｇ得た。

本発明化合物（１－７）



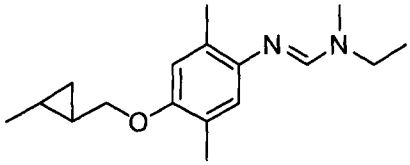
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.39 (1H, s), 6.63 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.76 (2H, d, J = 6.8 Hz), 3.34-3.10 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.67-1.56 (2H, m), 1.30-1.19 (1H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.4 Hz), 0.62-0.55 (2H, m), 0.35-0.30 (2H, m).

［００５３］

製造例８

２，５－ジメチル－４－［（２－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．２３ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０３ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にエチルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（２－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルホルムアミジン（本発明化合物（１－８））を０．１１ｇ得た。

本発明化合物（１－８）



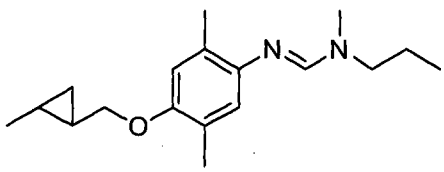
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.38 (1H, s), 6.62 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.76 (2H, dd, J = 6.6, 4.5 Hz), 3.42-3.27 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.07 (3H, d, J = 6.0 Hz), 0.99-0.90 (1H, m), 0.78-0.68 (1H, m), 0.52-0.44 (1H, m), 0.38-0.28 (1H, m).

［００５４］

製造例９

２，５－ジメチル－４－［（２－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．２５ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０３ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にメチルプロピルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（２－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルホルムアミジン（本発明化合物（１－９））を０．１３ｇ得た。

本発明化合物（１－９）



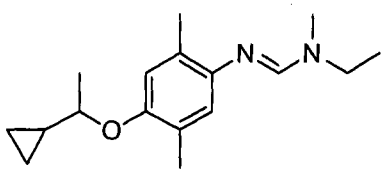
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.39 (1H, s), 6.62 (1H, s), 6.53 (1H, s), 3.76 (2H, dd, J = 6.8, 4.4 Hz), 3.29-3.15 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.67-1.56 (2H, m), 1.07 (3H, d, J = 5.8 Hz), 0.97-0.89 (1H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.4 Hz), 0.77-0.68 (1H, m), 0.51-0.44 (1H, m), 0.35-0.29 (1H, m).

［００５５］

製造例１０

４－（１－シクロプロピルエトキシ）－２，５－ジメチルフェニルアミン０．２３ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０３ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にエチルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－[４－（１－シクロプロピルエトキシ）－２，５－ジメチルフェニル]－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルホルムアミジン（本発明化合物（１－１０））を０．１２ｇ得た。

本発明化合物（１－１０）



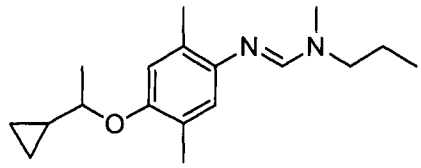
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.40 (1H, s), 6.65 (1H, s), 6.52 (1H, s), 3.68-3.60 (1H, m), 3.41-3.25 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.20 (3H, s), 2.17 (3H, s), 1.33 (3H, d, J = 6.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.13-1.02 (1H, m), 0.55-0.43 (2H, m), 0.37-0.30 (1H, m), 0.24-0.18 (1H, m).

［００５６］

製造例１１

４－（１－シクロプロピルエトキシ）－２，５－ジメチルフェニルアミン０．２５ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０２ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にメチルプロピルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－[４－（１－シクロプロピルエトキシ）－２，５－ジメチルフェニル]－Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルホルムアミジン（本発明化合物（１－１１））を０．１２ｇ得た。

本発明化合物（１－１１）



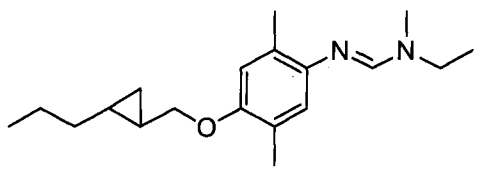
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.40 (1H, s), 6.65 (1H, s), 6.52 (1H, s), 3.68-3.60 (1H, m), 3.31-3.13 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.20 (3H, s), 2.17 (3H, s), 1.65-1.55 (2H, m), 1.33 (3H, d, J = 6.0 Hz), 1.13-1.02 (1H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.4 Hz), 0.54-0.43 (2H, m), 0.37-0.30 (1H, m), 0.25-0.18 (1H, m).

［００５７］

製造例１２

２，５－ジメチル－４－［（２－プロピルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．３３ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０３ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にエチルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（２－プロピルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルホルムアミジン（本発明化合物（１－１２））を０．１９ｇ得た。

本発明化合物（１－１２）



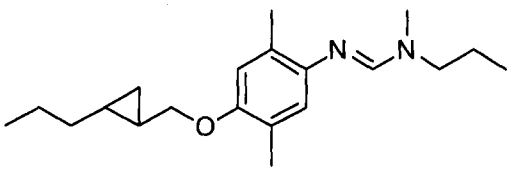
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.38 (1H, s), 6.60 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.76 (2H, ddd, J = 62.8, 9.9, 6.8 Hz), 3.42-3.25 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.49-1.38 (2H, m), 1.38-1.28 (1H, m), 1.20-1.11 (1H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.00-0.92 (1H, m), 0.93 (3H, t, J = 7.3 Hz), 0.75-0.66 (1H, m), 0.50-0.44 (1H, m), 0.39-0.33 (1H, m).

［００５８］

製造例１３

２，５－ジメチル－４－［（２－プロピルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．３２ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０３ｇおよびオルトぎ酸トリメチル１０ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン１０ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にメチルプロピルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（２－プロピルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルホルムアミジン（本発明化合物（１－１３））を０．２３ｇ得た。

本発明化合物（１－１３）



^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.39 (1H, s), 6.60 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.76 (2H, ddd, J = 62.9, 10.4, 7.1 Hz), 3.33-3.13 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.65-1.58 (2H, m), 1.48-1.27 (3H, m), 1.22-1.11 (1H, m), 1.01-0.92 (1H, m), 0.93 (3H, t, J = 7.3 Hz), 0.91 (3H, t, J = 7.3 Hz), 0.75-0.66 (1H, m), 0.50-0.44 (1H, m), 0.39-0.33 (1H, m).

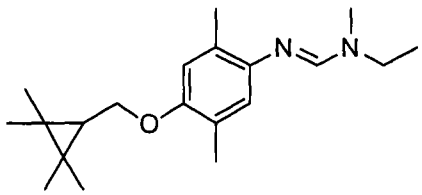
［００５９］

製造例１４

２，５－ジメチル－４－［（２，２，３，３－テトラメチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．１１ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０１ｇおよびオルトぎ酸トリメチル５ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン５ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にエチルメチルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（２，２，３，３－テトラメチルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルホルムアミジン（本発明化合物（１－１４））を

０．０７ｇ得た。

本発明化合物（１－１４）



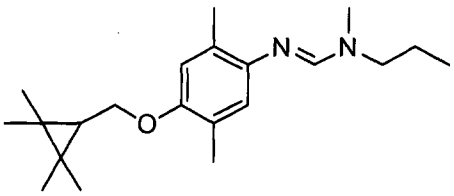
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.39 (1H, s), 6.65 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.93 (2H, d, J = 7.6 Hz), 3.41-3.27 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.12 (6H, s), 1.02 (6H, s), 0.70 (1H, t, J = 7.3 Hz).

［００６０］

製造例１５

２，５－ジメチル－４－［（２，２，３，３－テトラメチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミン０．０９ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０１ｇおよびオルトぎ酸トリメチル５ｍＬの混合物を加熱還流下２時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン５ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にメチルプロピルアミン０．５ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛２，５－ジメチル－４－［（２，２，３，３－テトラメチルシクロプロピル）メトキシ］フェニル｝－Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルホルムアミジン（本発明化合物（１－１５））を０．０７ｇ得た。

本発明化合物（１－１５）



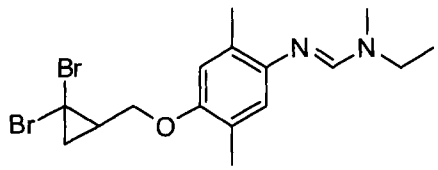
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.39 (1H, s), 6.65 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.93 (2H, d, J = 7.6 Hz), 3.31-3.15 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.65-1.59 (2H, m), 1.12 (6H, s), 1.02 (6H, s), 0.91 (3H, t, J = 7.3 Hz), 0.70 (1H, t, J = 7.4 Hz).

［００６１］

製造例１６

４－［（２，２－ジブロモシクロプロピル）メトキシ］－２，５－ジメチルフェニルアミン０．１９ｇ、パラトルエンスルホン酸一水和物０．０１ｇおよびオルトぎ酸トリメチル５ｍＬの混合物を加熱還流下１時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。得られた残渣および１，４－ジオキサン５ｍＬを室温で混合し、得られた混合物にエチルメチルアミン０．１ｍＬを室温で加えた。得られた混合物を８０℃で２時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。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、Ｎ’－｛４－［（２，２－ジブロモシクロプロピル）メトキシ］－２，５－ジメチルフェニル｝－Ｎ－エチル－Ｎ－メチルホルムアミジン（本発明化合物（１－１６））を０．１３ｇ得た。

本発明化合物（１－１６）



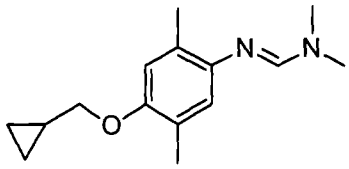
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.39 (1H, s), 6.67 (1H, s), 6.56 (1H, s), 4.06 (2H, dd, J = 6.6, 2.7 Hz), 3.44-3.24 (2H, br m), 2.97 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.16-2.04 (1H, m), 1.88 (1H, dd, J = 10.5, 7.6 Hz), 1.51 (1H, dd, J = 7.6, 7.6 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).

［００６２］

製造例１７

４－シクロプロピルメトキシ－２，５－ジメチルフェニルアミン０．２３ｇ、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミドジメチルアセタール１０ｍＬの混合物を加熱還流下１０時間攪拌した。放冷した反応混合物を減圧下濃縮した。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、Ｎ’－（４－シクロプロピルメトキシ－２，５－ジメチルフェニル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミジン（本発明化合物（１－１７））を０．１８ｇ得た。

本発明化合物（１－１７）



^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.38 (1H, s), 6.62 (1H, s), 6.54 (1H, s), 3.76 (2H, d, J = 6.6 Hz), 2.98 (6H, s), 2.22 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.26-1.24 (1H, m), 0.61-0.56 (2H, m), 0.34-0.31 (2H, m).

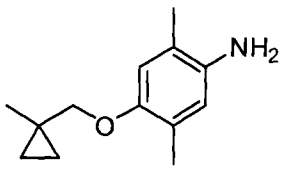
［００６３］

次に、本発明化合物の製造中間体の製造について参考製造例を示す。

［００６４］

参考製造例１

２，５－ジメチル－１－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］－４－ニトロベンゼン０．６１ｇ、鉄粉０．７８ｇ、酢酸２１ｍＬおよび水３ｍＬの混合物を８０℃で１時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を１規定水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にした後、酢酸エチルを加え、ろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－４－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミンを０．４７ｇ得た。



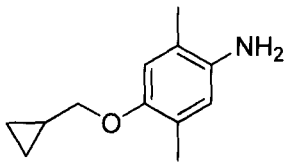
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 6.53 (1H, s), 6.50 (1H, s), 3.64 (2H, s), 3.30 (2H, br s), 2.17 (3H, s), 2.12 (3H, s), 1.23 (3H, s), 0.52 (2H, dd, J = 5.5, 4.5 Hz), 0.38 (2H, dd, J = 5.6, 4.4Hz).

［００６５］

参考製造例２

１－シクロプロピルメトキシ－２，５－ジメチル－４－ニトロベンゼン１．７３ｇ、鉄粉２．１８ｇ、酢酸３０ｍＬおよび水３０ｍＬの混合物を８０℃で１時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を１規定水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にした後、酢酸エチルを加え、ろ過した。ろ液を酢

酸エチルで抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、４－シクロプロピルメトキシ－２，５－ジメチルフェニルアミンを０．８４ｇ得た。

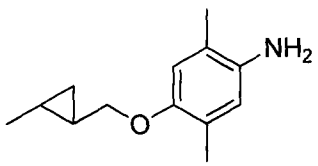


^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 6.58 (1H, s), 6.50 (1H, s), 3.72 (2H, d, J = 6.6 Hz), 3.30 (2H, br s), 2.17 (3H, s), 2.12 (3H, s), 1.29-1.18 (1H, m), 0.62-0.55 (2H, m), 0.34-0.29 (2H, m).

［００６６］

参考製造例３

２，５－ジメチル－１－［（２－メチルシクロプロピル）メトキシ］－４－ニトロベンゼン０．７０ｇ、鉄粉０．８３ｇ、酢酸１５ｍＬおよび水１５ｍＬの混合物を８０℃で１時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を１規定水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にした後、酢酸エチルを加え、ろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－４－［（２－メチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミンを０．４６ｇ得た。



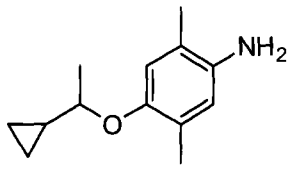
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 6.57 (1H, s), 6.50 (1H, s), 3.77-3.67 (2H, m), 3.31 (2H, br s), 2.17 (3H, s), 2.13 (3H, s), 1.08 (3H, d, J = 6.0 Hz), 0.98-0.88 (1H, m), 0.76-0.66 (1H, m), 0.50-0.43 (1H, m), 0.35-0.29 (1H, m).

［００６７］

参考製造例４

１－（１－シクロプロピルエトキシ）－２，５－ジメチル－４－ニトロベンゼン０．９７ｇ、鉄粉１．１５ｇ、酢酸１５ｍＬおよび水１５ｍＬの混合物を８０℃で１時

間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を１規定水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にした後、酢酸エチルを加え、ろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、４－（１－シクロプロピルエトキシ）－２，５－ジメチルフェニルアミンを０．５６ｇ得た。

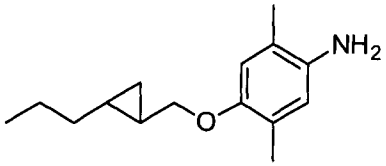


^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 6.60 (1H, s), 6.48 (1H, s), 3.58-3.50 (1H, m), 3.31 (2H, br s), 2.15 (3H, s), 2.11 (3H, s), 1.32 (3H, d, J = 6.2 Hz), 1.12-1.01 (1H, m), 0.55-0.43 (2H, m), 0.36-0.28 (1H, m), 0.24-0.16 (1H, m).

［００６８］

参考製造例５

２，５－ジメチル－４－ニトロ－１－［（２－プロピルシクロプロピル）メトキシ］ベンゼン１．５８ｇ、鉄粉１．６８ｇ、酢酸２０ｍＬおよび水２０ｍＬの混合物を８０℃で１時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を１規定水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にした後、酢酸エチルを加え、ろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－４－［（２－プロピルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミンを０．９０ｇ得た。



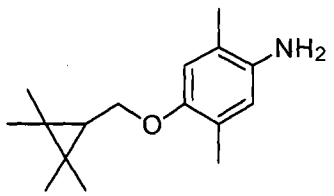
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 6.55 (1H, s), 6.50 (1H, s), 3.78 (1H, dd, J = 10.0, 6.5 Hz), 3.65 (1H, dd, J = 10.1, 7.1 Hz), 3.29 (2H, br s), 2.16 (3H, s), 2.12 (3H, s), 1.48-1.37 (2H, m), 1.36-1.25 (1H, m), 1.24-1.12 (1H, m), 1.00-0.88 (1H, m), 0.93 (3H, t, J = 7.3 Hz), 0.74-0.62 (1H, m), 0.49-

0.42 (1H, m), 0.39-0.32 (1H, m).

［００６９］

参考製造例６

２，５－ジメチル－４－ニトロ－１－［（２,２,３,３－テトラメチルシクロプロピル）メトキシ］ベンゼン０．３４ｇ、鉄粉０．３４ｇ、酢酸５ｍＬおよび水５ｍＬの混合物を８０℃で１時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を１規定水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にした後、酢酸エチルを加え、ろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－４－［（２，２，３，３－テトラメチルシクロプロピル）メトキシ］フェニルアミンを０．２４ｇ得た。

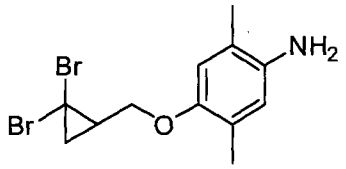


^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 6.60 (1H, s), 6.50 (1H, s), 3.89 (2H, d, J = 7.3 Hz), 3.30 (2H, br s), 2.16 (3H, s), 2.13 (3H, s), 1.12 (6H, s), 1.01 (6H, s), 0.69 (1H, d, J = 7.3 Hz).

［００７０］

参考製造例７

１－［（２，２－ジブロモシクロプロピル）メトキシ］－２，５－ジメチル－４－ニトロベンゼン０．３７ｇ、鉄粉０．２９ｇ、酢酸２０ｍＬおよび水５ｍＬの混合物を８０℃で１時間攪拌した。反応混合物を室温付近まで冷却した後、減圧下濃縮した。得られた残渣を１規定水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にした後、酢酸エチルを加え、ろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、４－［（２，２－ジブロモシクロプロピル）メトキシ］－２，５－ジメチルフェニルアミンを０．１９ｇ得た。

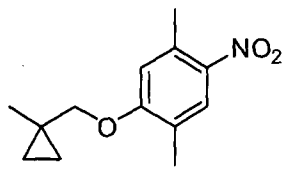


^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 6.62 (1H, s), 6.52 (1H, s), 4.06-3.97 (2H, m), 3.34 (2H, br s), 2.20 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.13-2.05 (1H, m), 1.90-1.84 (1H, m), 1.52-1.46 (1H, m).

［００７１］

参考製造例８

２，５－ジメチル－４－ニトロフェノール１．５９ｇ，（１－メチルシクロプロピル）メタノール０．８１ｇ，トリフェニルホスフィン２．９８ｇおよびトルエン５０ｍＬの混合物に０℃でアゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）２．９８ｇを加え、８０℃で４時間攪拌した。冷却後、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、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－１－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］－４－ニトロベンゼンを０．７７ｇ得た。



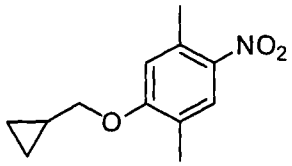
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.93 (1H, s), 6.58 (1H, s), 3.80 (2H, s), 2.60 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.25 (3H, s), 0.57 (2H, dd, J = 5.8, 4.6 Hz), 0.47 (2H, dd, J = 5.8, 4.6 Hz).

［００７２］

参考製造例９

２，５－ジメチル－４－ニトロフェノール１．７３ｇ，シクロプロピルメタノール０．７５ｇ，トリフェニルホスフィン３．２６ｇおよびトルエン１００ｍＬの混合物に０℃でアゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）３．１５ｇを加え、８０℃で４時間攪拌した。冷却後、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、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、１－シクロプロピルメトキ

シー２，５－ジメチル－４－ニトロベンゼンを１．９５ｇ得た。

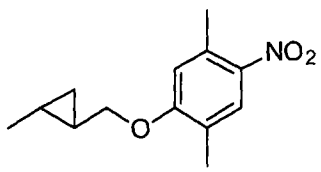


^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.93 (1H, s), 6.61 (1H, s), 3.89 (2H, d, J = 6.8 Hz), 2.61 (3 H, s), 2.24 (3H, s), 1.35-1.24 (1H, m), 0.70-0.63 (2H, m), 0.41-0.35 (2H, m).

［００７３］

参考製造例１０

２，５－ジメチル－４－ニトロフェノール１．４０ｇ，（２－メチルシクロプロピル）メタノール０．７２ｇ，トリフェニルホスフィン２．６４ｇおよびトルエン１００ｍＬの混合物に０℃でアゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）２．５５ｇを加え、８０℃で４時間攪拌した。冷却後、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、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－１－［（２－メチルシクロプロピル）メトキシ］－４－ニトロベンゼンを１．６４ｇ得た。



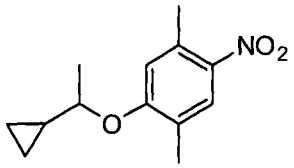
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.93 (1H, s), 6.60 (1H, s), 3.89 (2H, d, J = 6.8 Hz), 2.61 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.11 (3H, d, J = 6.0 Hz), 1.03-0.94 (1H, m), 0.84-0.74 (1H, m), 0.57-0.51 (1H, m), 0.44-0.38 (1H, m).

［００７４］

参考製造例１１

２，５－ジメチル－４－ニトロフェノール１．７０ｇ，（１－シクロプロピル）エタノール０．８８ｇ，トリフェニルホスフィン３．２０ｇおよびトルエン１００ｍＬの混合物に０℃でアゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）３．１０ｇを加え、８０℃で４時間攪拌した。冷却後、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、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、１－（１－シクロプロピルエトキシ）－２，５－ジメチル－４－ニトロベンゼンを１．０９ｇ得た。

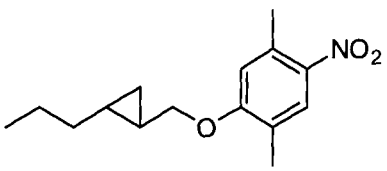


^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.93 (1H, s), 6.62 (1H, s), 4.06-3.97 (1H, m), 2.60 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.40 (3H, d, J = 6.0 Hz), 1.21-1.10 (1H, m), 0.62-0.52 (2H, m), 0.43-0.27 (2H, m).

［００７５］

参考製造例１２

２，５－ジメチル－４－ニトロフェノール２．１１ｇ，（２－プロピルシクロプロピル）メタノール１．４４ｇ，トリフェニルホスフィン３．９７ｇおよびトルエン１００ｍＬの混合物に０℃でアゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）３．８４ｇを加え、８０℃で４時間攪拌した。冷却後、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、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－４－ニトロ－１－［（２－プロピルシクロプロピル）メトキシ］ベンゼンを２．５２ｇ得た。



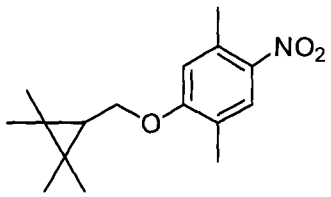
^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.93 (1H, s), 6.59 (1H, s), 4.01 (1H, dd, J = 9.9, 6.4 Hz), 3.76 (1H, dd, J = 9.9, 7.6 Hz), 2.61 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.49-1.35 (3H, m), 1.19-1.09 (1H, m), 1.06-0.97 (1H, m), 0.95 (3H, t, J = 7.2 Hz), 0.81-0.72 (1H, m), 0.56-0.49 (1H, m), 0.48-0.41 (1H, m).

［００７６］

参考製造例１３

２，５－ジメチル－４－ニトロフェノール１．０８ｇ，（２，２，３，３－テトラメチルシクロプロピル）メタノール０．８３ｇ，トリフェニルホスフィン２．０４ｇ

およびトルエン１００ｍＬの混合物に０℃でアゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）１．９７ｇを加え、９０℃で４時間攪拌した。冷却後、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、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、２，５－ジメチル－４－ニトロ－１－［（２，２，３，３－テトラメチルシクロプロピル）メトキシ］ベンゼンを０．１５ｇ得た。

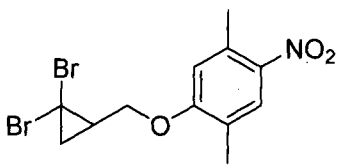


^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.93 (1H, s), 6.64 (1H, s), 4.07 (2H, d, J = 7.6 Hz), 2.62 (3H, s), 2.22 (3H, s), 1.15 (6H, s), 1.06 (6H, s), 0.74 (1H, t, J = 7.6 Hz).

［００７７］

参考製造例１４

２，５－ジメチル－４－ニトロフェノール０．４７ｇ，（２，２－ジブロモシクロプロピル）メタノール（参考文献（Ｒ．Ｈｕｗｙｌｅｒ，Ａ．Ａｌ－Ｄｕｌａｙｙｍｉ，Ｍ．Ｎｅｕｅｎｓｃｈｗａｎｄｅｒ，Ｈｅｌｖ．Ｃｈｉｍ．Ａｃｔａ １９９９，８２，２３３６）に従い製造）０．６４ｇ，トリフェニルホスフィン０．８７ｇおよびトルエン３０ｍＬの混合物に０℃でアゾジカルボン酸ビス（２－メトキシエチル）０．８５ｇを加え、８０℃で５時間攪拌した。冷却後、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、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。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、１－［（２，２－ジブロモ－シクロプロピル）メトキシ］－２，５－ジメチル－４－ニトロベンゼンを０．３８ｇ得た。



^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 7.94 (1H, s), 6.65 (1H, s), 4.24 (1H, dd, J = 10.5, 5.6 Hz), 4.12 (1H, dd, J = 10.4, 7.9 Hz), 2.62 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.21-2.11 (1H, m), 1.99-1.93 (1H, m), 1.61-1.55

(1H, m).

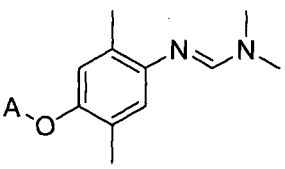
[0078]

上記方法に準じて化合物AA－001～AA－528、AB－001～AB－528、AC－001～AC－528、AD－001～AD－528、AE－001～AE－528、AF－001～AF－528、AG－001～AG－528、AH－001～AH－528、AI－001～AI－528、AJ－001～AJ－528、AK－001～AK－528、AL－001～AL－528、AM－001～AM－528、AN－001～AN－528、AO－001～AO－528、AP－001～AP－528、AQ－001～AQ－528、AR－001～AR－528、AS－001～AS－528、AT－001～AT－528、AU－001～AU－528、AV－001～AV－528、AW－001～AW－528、AX－001～AX－528、AY－001～AY－528、AZ－001～AZ－528、AAA－001～AAA－528、AAB－001～AAB－528、AAC－001～AAC－528、AAD－001～AAD－528、AAE－001～AAE－528、AAF－001～AAF－528、AAG－001～AAG－528、AAH－001～AAH－528、AAI－001～AAI－528、AAJ－001～AAJ－528、AAK－001～AAK－528、AAL－001～AAL－528、AAM－001～AAM－528、AAN－001～AAN－528、AAO－001～AAO－528、AAP－001～AAP－528、AAQ－001～AAQ－528、AAR－001～AAR－528、AAS－001～AAS－528、AAT－001～AAT－528、AAU－001～AAU－528、AAV－001～AAV－528、AAW－001～AAW－528、AAX－001～AAX－528、AAY－001～AAY－528、AAZ－001～AAZ－528、ABA－001～ABA－528、ABB－001～ABB－528、ABC－001～ABC－528、ABD－001～ABD－528、ABE－001～ABE－528、ABF－001～ABF－528、ABG－001～ABG－528、ABH－001～ABH－528、ABI－001～ABI－528、ABJ－001～ABJ－528、ABK－001～ABK－528、ABL－001～ABL－528、ABM－

００１～ＡＢＭ－５２８、ＡＢＮ－００１～ＡＢＮ－５２８、ＡＢＯ－００１～ＡＢＯ－５２８、ＡＢＰ－００１～ＡＢＰ－５２８、ＡＢＱ－００１～ＡＢＱ－５２８、ＡＢＲ－００１～ＡＢＲ－５２８、ＡＢＳ－００１～ＡＢＳ－５２８、ＡＢＴ－００１～ＡＢＴ－５２８、ＡＢＵ－００１～ＡＢＵ－５２８、ＡＢＶ－００１～ＡＢＶ－５２８、ＡＢＷ－００１～ＡＢＷ－５２８、ＡＢＸ－００１～ＡＢＸ－５２８、ＡＢＹ－００１～ＡＢＹ－５２８、ＡＢＺ－００１～ＡＢＺ－５２８、ＡＣＡ－００１～ＡＣＡ－５２８、ＡＣＢ－００１～ＡＣＢ－５２８、ＡＣＣ－００１～ＡＣＣ－５２８、ＡＣＤ－００１～ＡＣＤ－５２８、ＡＣＥ－００１～ＡＣＥ－５２８、ＡＣＦ－００１～ＡＣＦ－５２８、ＡＣＧ－００１～ＡＣＧ－５２８、ＡＣＨ－００１～ＡＣＨ－５２８、ＡＣＩ－００１～ＡＣＩ－５２８、ＡＣＪ－００１～ＡＣＪ－５２８、ＡＣＫ－００１～ＡＣＫ－５２８、ＡＣＬ－００１～ＡＣＬ－５２８、ＡＣＭ－００１～ＡＣＭ－５２８、ＡＣＮ－００１～ＡＣＮ－５２８、ＡＣＯ－００１～ＡＣＯ－５２８、ＡＣＰ－００１～ＡＣＰ－５２８、ＡＣＱ－００１～ＡＣＱ－５２８、ＡＣＲ－００１～ＡＣＲ－５２８、ＡＣＳ－００１～ＡＣＳ－５２８、ＡＣＴ－００１～ＡＣＴ－５２８、ＡＣＵ－００１～ＡＣＵ－５２８、ＡＣＶ－００１～ＡＣＶ－５２８、ＡＣＷ－００１～ＡＣＷ－５２８、ＡＣＸ－００１～ＡＣＸ－５２８、ＡＣＹ－００１～ＡＣＹ－５２８、ＡＣＺ－００１～ＡＣＺ－５２８、ＡＤＡ－００１～ＡＤＡ－５２８、ＡＤＢ－００１～ＡＤＢ－５２８、ＡＤＣ－００１～ＡＤＣ－５２８、ＡＤＤ－００１～ＡＤＤ－５２８、ＡＤＥ－００１～ＡＤＥ－５２８、ＡＤＦ－００１～ＡＤＦ－５２８、ＡＤＧ－００１～ＡＤＧ－５２８、ＡＤＨ－００１～ＡＤＨ－５２８を得ることができる。

［００７９］

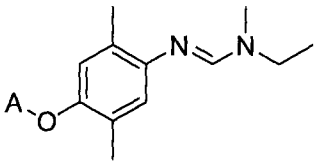
化合物ＡＡ－００１～ＡＡ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

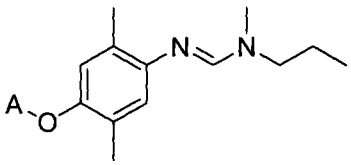
で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢ－００１～ＡＢ－５２８は



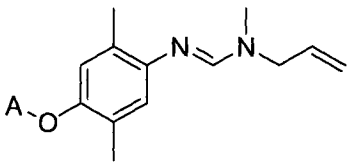
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣ－００１～ＡＣ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

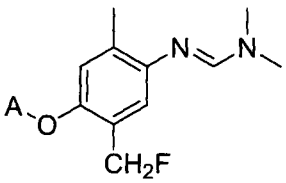
化合物ＡＤ－００１～ＡＤ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

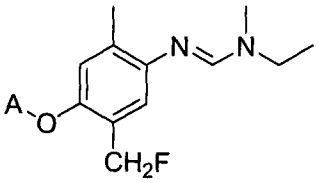
［００８０］

化合物ＡＥ－００１～ＡＥ－５２８は



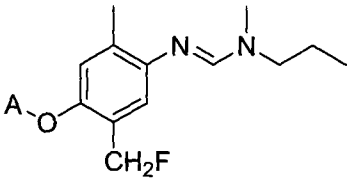
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＦ－００１～ＡＦ－５２８は



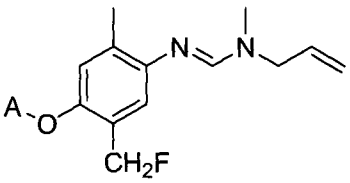
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＧ－００１～ＡＧ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

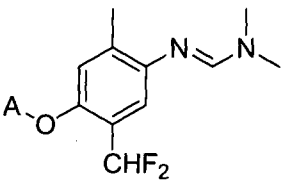
化合物ＡＨ－００１～ＡＨ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

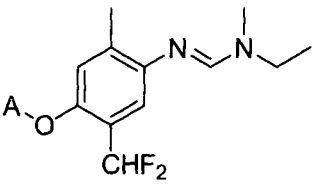
［００８１］

化合物ＡＩ－００１～ＡＩ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

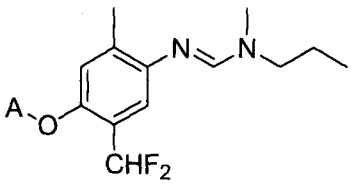
化合物ＡＪ－００１～ＡＪ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物であり、

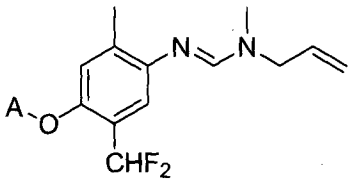
化合物ＡＫ－００１～ＡＫ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＬ－００１～ＡＬ－５２８は

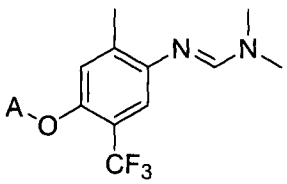


〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物である。

［００８２］

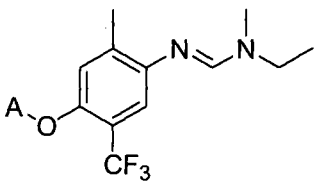
化合物ＡＭ－００１～ＡＭ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物であり、

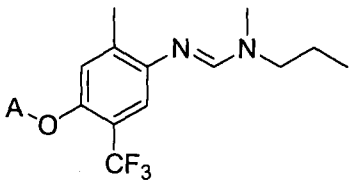
化合物ＡＮ－００１～ＡＮ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

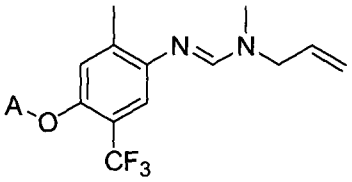
で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＯ－００１～ＡＯ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

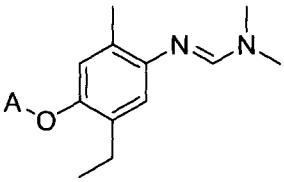
化合物ＡＰ－００１～ＡＰ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

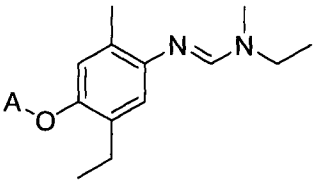
［００８３］

化合物ＡＱ－００１～ＡＱ－５２８は



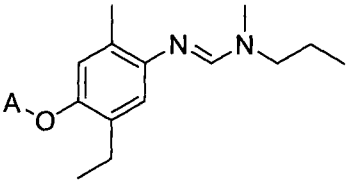
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＲ－００１～ＡＲ－５２８は



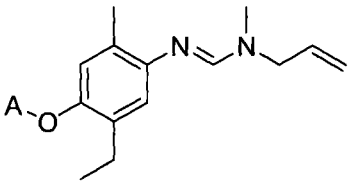
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＳ－００１～ＡＳ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

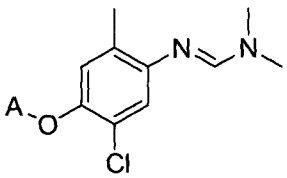
化合物ＡＴ－００１～ＡＴ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

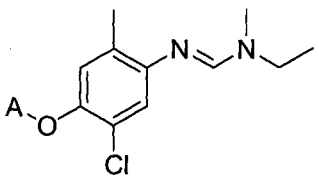
［００８４］

化合物ＡＵ－００１～ＡＵ－５２８は



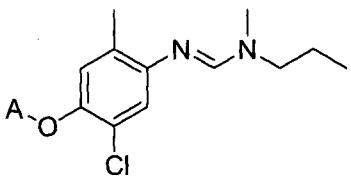
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＶ－００１～ＡＶ－５２８は



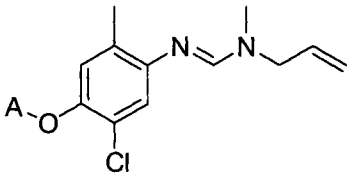
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＷ－００１～ＡＷ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

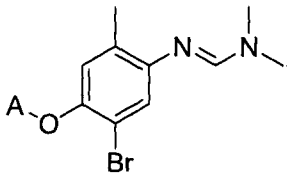
化合物ＡＸ－００１～ＡＸ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

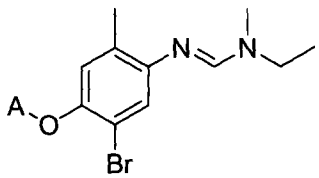
［００８５］

化合物ＡＹ－００１～ＡＹ－５２８は



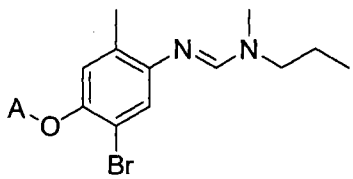
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＺ－００１～ＡＺ－５２８は



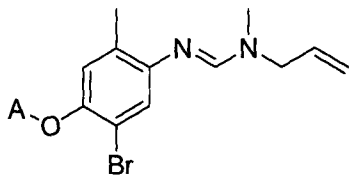
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＡ－００１～ＡＡＡ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

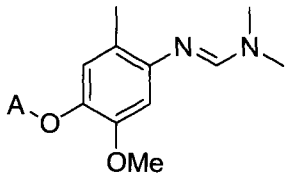
化合物ＡＡＢ－００１～ＡＡＢ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

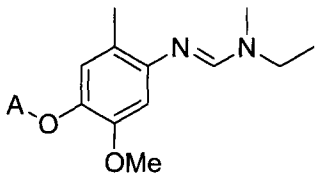
［００８６］

化合物ＡＡＣ－００１～ＡＡＣ－５２８は



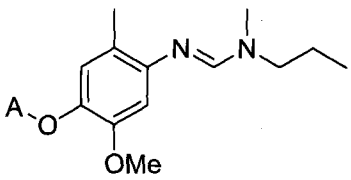
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＤ－００１～ＡＡＤ－５２８は



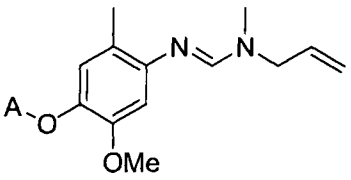
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＥ－００１～ＡＡＥ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

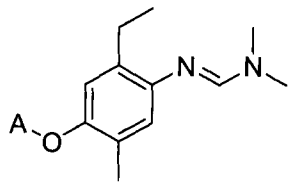
化合物ＡＡＦ－００１～ＡＡＦ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

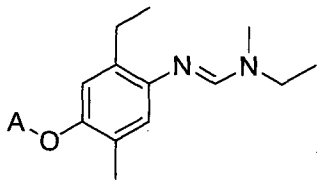
［００８７］

化合物ＡＡＧ－００１～ＡＡＧ－５２８は



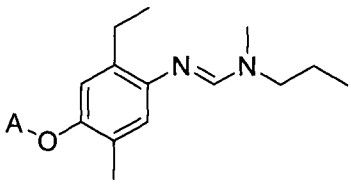
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＨ－００１～ＡＡＨ－５２８は



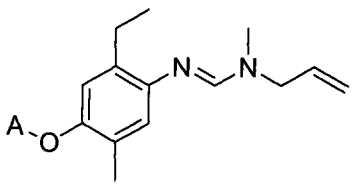
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＩ－００１～ＡＡＩ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

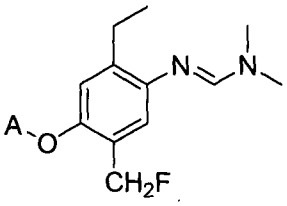
化合物ＡＡＪ－００１～ＡＡＪ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

［００８８］

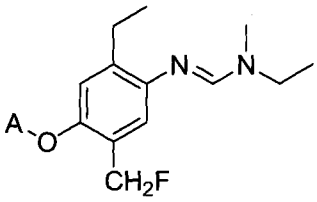
化合物ＡＡＫ－００１～ＡＡＫ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物であり、

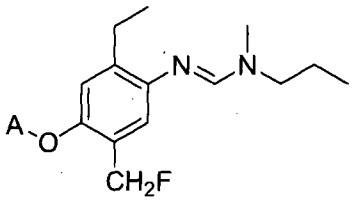
化合物ＡＡＬ－００１～ＡＡＬ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物であり、

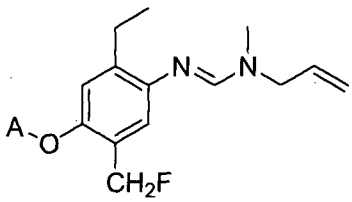
化合物ＡＡＭ－００１～ＡＡＭ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＮ－００１～ＡＡＮ－５２８は

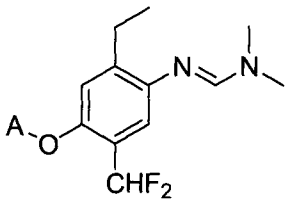


〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕

で示されるアミジン化合物である。

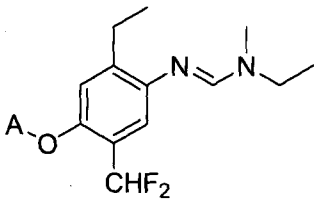
［００８９］

化合物ＡＡＯ－００１～ＡＡＯ－５２８は



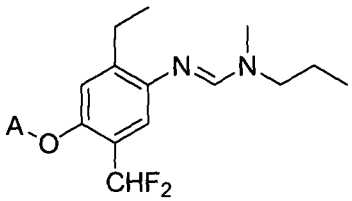
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＰ－００１～ＡＡＰ－５２８は



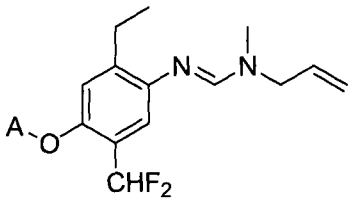
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＱ－００１～ＡＡＱ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

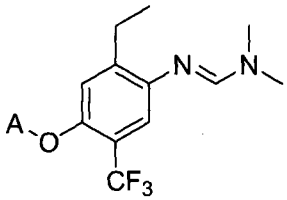
化合物ＡＡＲ－００１～ＡＡＲ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

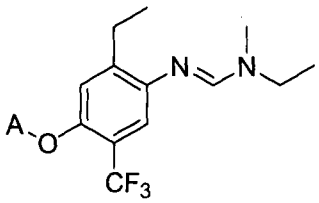
［００９０］

化合物ＡＡＳ００１～ＡＡＳ－５２８は



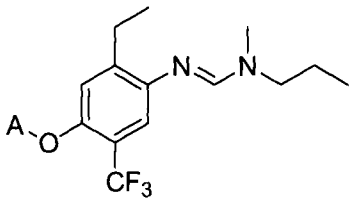
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＴ－００１～ＡＡＴ－５２８は



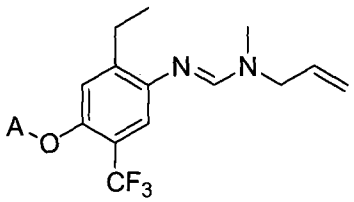
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＵ－００１～ＡＡＵ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

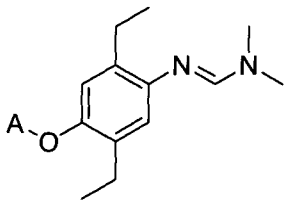
化合物ＡＡＶ－００１～ＡＡＶ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

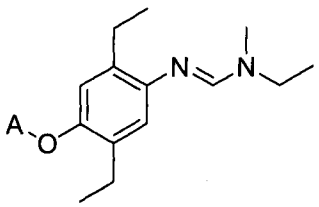
［００９１］

化合物ＡＡＷ－００１～ＡＡＷ－５２８は



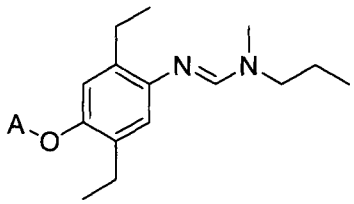
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＸ－００１～ＡＡＸ－５２８は



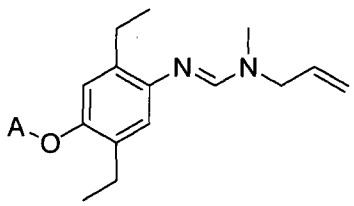
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＡＹ－００１～ＡＡＹ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

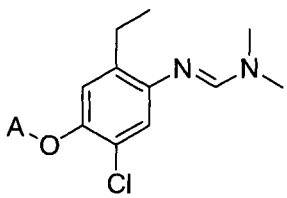
化合物ＡＡＺ－００１～ＡＡＺ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

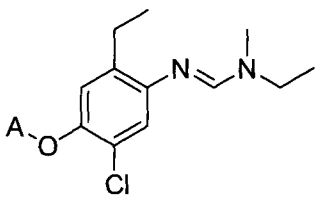
［００９２］

化合物ＡＢＡ－００１～ＡＢＡ－５２８は



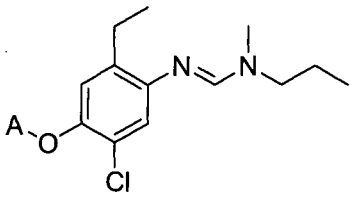
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＢ－００１～ＡＢＢ－５２８は



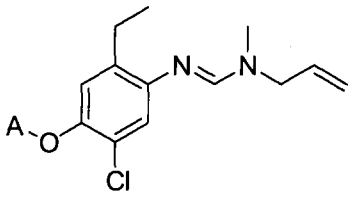
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＣ－００１～ＡＢＣ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

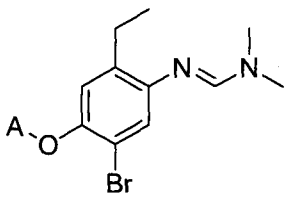
化合物ＡＢＤ－００１～ＡＢＤ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

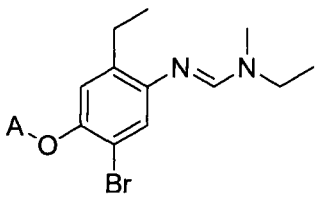
［００９３］

化合物ＡＢＥ－００１～ＡＢＥ－５２８は



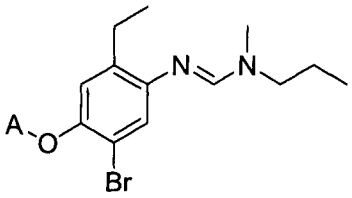
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＦ－００１～ＡＢＦ－５２８は



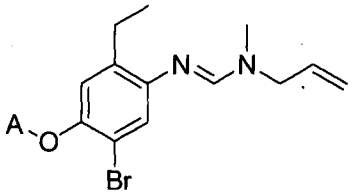
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＧ－００１～ＡＢＧ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

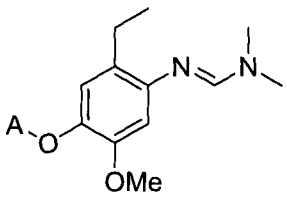
化合物ＡＢＨ－００１～ＡＢＨ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

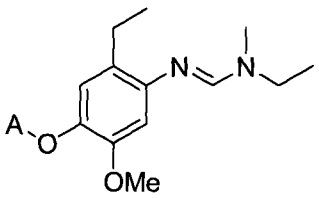
［００９４］

化合物ＡＢＩ－００１～ＡＢＩ－５２８は



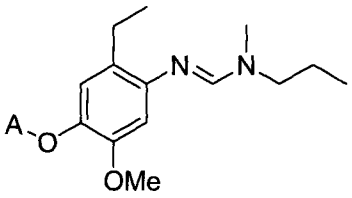
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＪ－００１～ＡＢＪ－５２８は



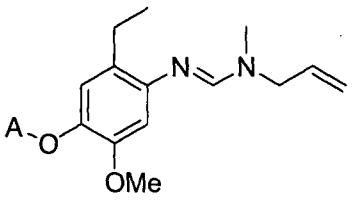
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＫ－００１～ＡＢＫ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

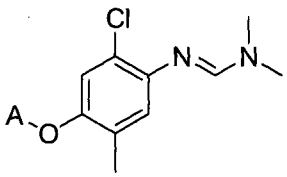
化合物ＡＢＬ－００１～ＡＢＬ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

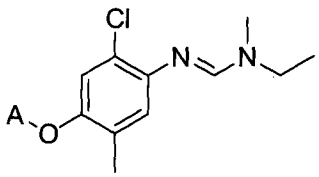
［００９５］

化合物ＡＢＭ－００１～ＡＢＭ－５２８は



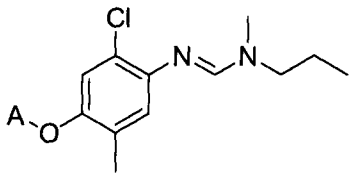
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＮ－００１～ＡＢＮ－５２８は



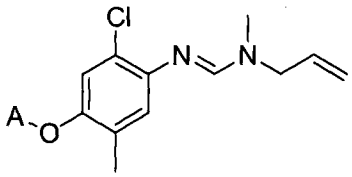
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＯ－００１～ＡＢＯ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

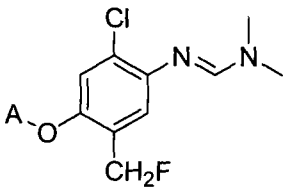
化合物ＡＢＰ－００１～ＡＢＰ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

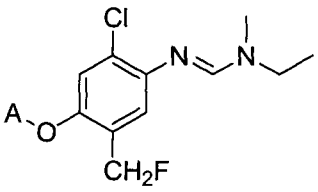
［００９６］

化合物ＡＢＱ－００１～ＡＢＱ－５２８は



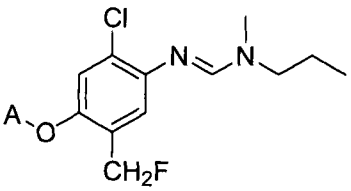
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＲ－００１～ＡＢＲ－５２８は



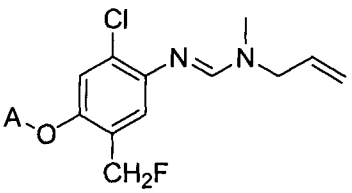
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＳ－００１～ＡＢＳ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

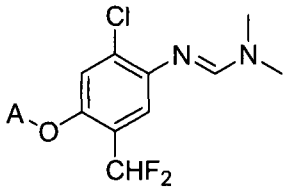
化合物ＡＢＴ－００１～ＡＢＴ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

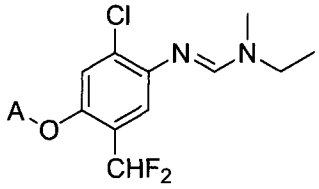
［００９７］

化合物ＡＢＵ－００１～ＡＢＵ－５２８は



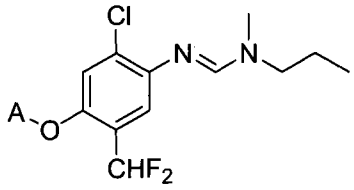
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＶ－００１～ＡＢＶ－５２８は



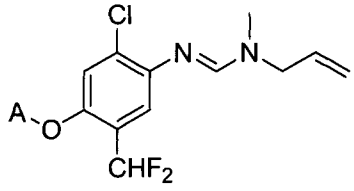
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＷ－００１～ＡＢＷ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

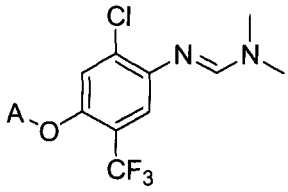
化合物ＡＢＸ－００１～ＡＢＸ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

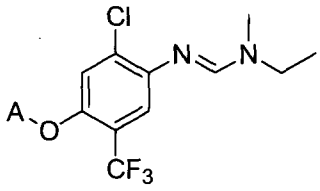
［００９８］

化合物ＡＢＹ－００１～ＡＢＹ－５２８は



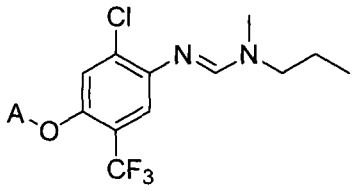
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＢＺ－００１～ＡＢＺ－５２８は



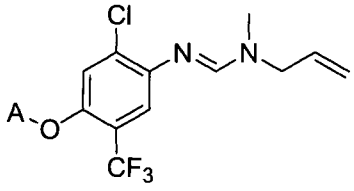
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＡ－００１～ＡＣＡ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

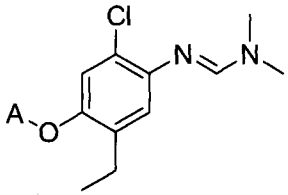
化合物ＡＣＢ－００１～ＡＣＢ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

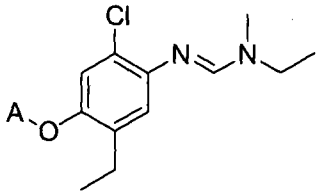
［００９９］

化合物ＡＣＣ－００１～ＡＣＣ－５２８は



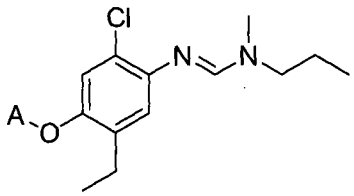
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＤ－００１～ＡＣＤ－５２８は



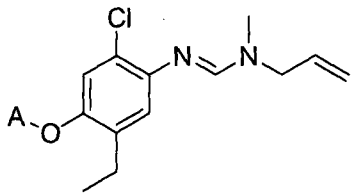
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＥ－００１～ＡＣＥ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

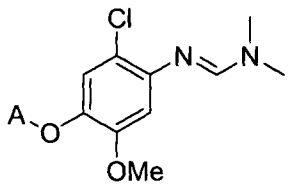
化合物ＡＣＦ－００１～ＡＣＦ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

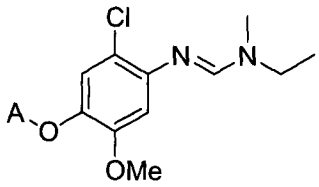
［０１００］

化合物ＡＣＧ－００１～ＡＣＧ－５２８は



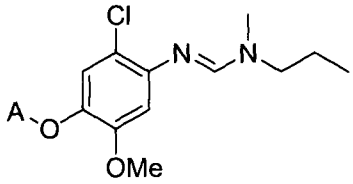
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＨ－００１～ＡＣＨ－５２８は



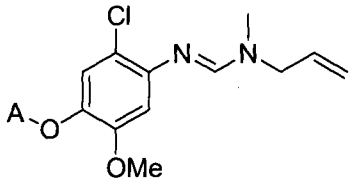
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＩ－００１～ＡＣＩ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

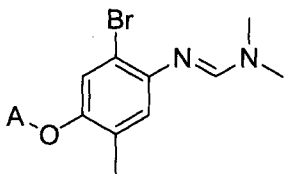
化合物ＡＣＪ－００１～ＡＣＪ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

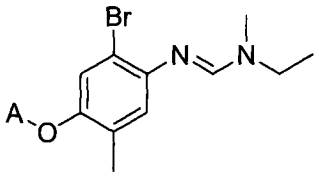
［０１０１］

化合物ＡＣＫ－００１～ＡＣＫ－５２８は



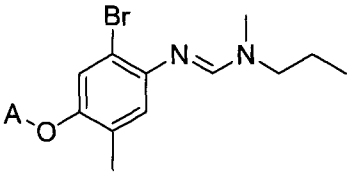
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＬ－００１～ＡＣＬ－５２８は



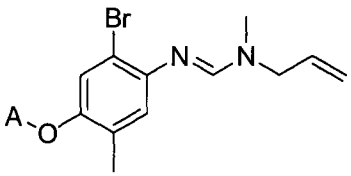
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＭ－００１～ＡＣＭ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

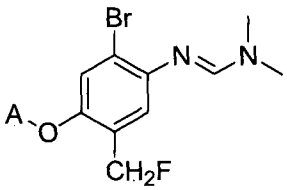
化合物ＡＣＮ－００１～ＡＣＮ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

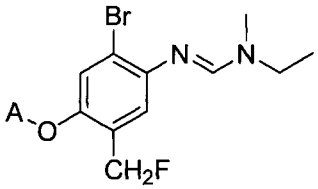
［０１０２］

化合物ＡＣＯ－００１～ＡＣＯ－５２８は



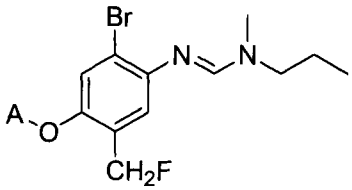
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＰ－００１～ＡＣＰ－５２８は



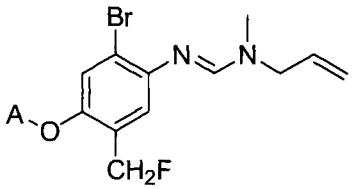
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＱ－００１～ＡＣＱ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

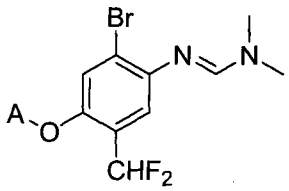
化合物ＡＣＲ－００１～ＡＣＲ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

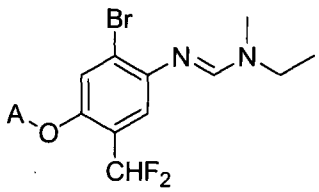
［０１０３］

化合物ＡＣＳ－００１～ＡＣＳ－５２８は



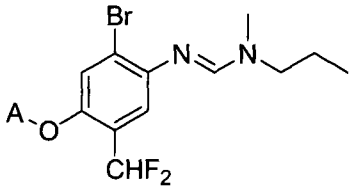
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＴ－００１～ＡＣＴ－５２８は



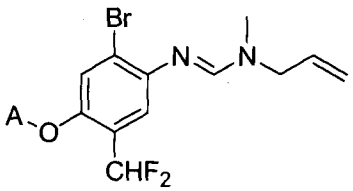
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＵ－００１～ＡＣＵ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

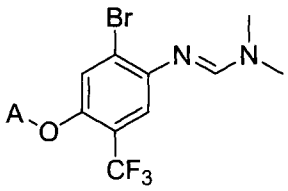
化合物ＡＣＶ－００１～ＡＣＶ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

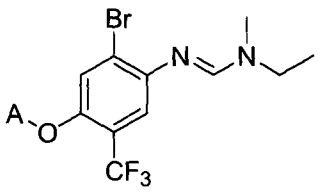
［０１０４］

化合物ＡＣＷ－００１～ＡＣＷ－５２８は



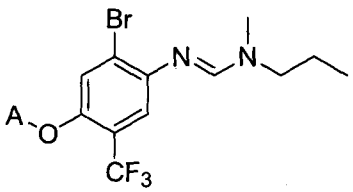
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＸ－００１～ＡＣＸ－５２８は



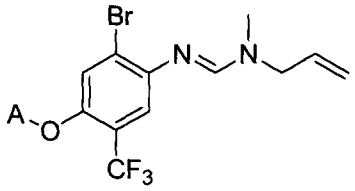
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＣＹ－００１～ＡＣＹ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

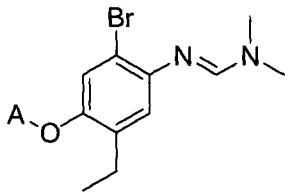
化合物ＡＣＺ－００１～ＡＣＺ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

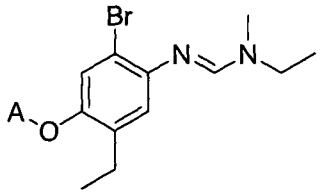
［０１０５］

化合物ＡＤＡ－００１～ＡＤＡ－５２８は



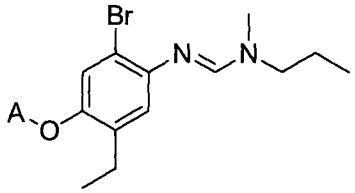
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＤＢ－００１～ＡＤＢ－５２８は



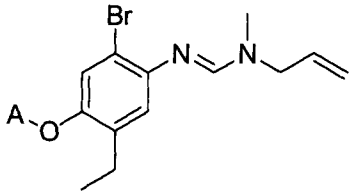
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＤＣ－００１～ＡＤＣ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

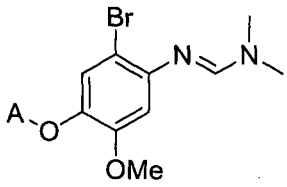
化合物ＡＤＤ－００１～ＡＤＤ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

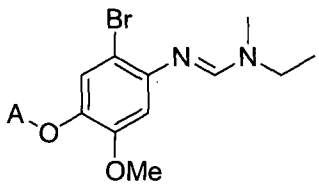
［０１０６］

化合物ＡＤＥ－００１～ＡＤＥ－５２８は



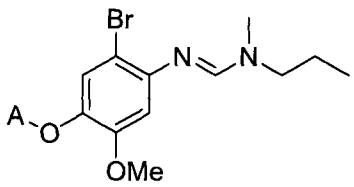
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＤＦ－００１～ＡＤＦ－５２８は



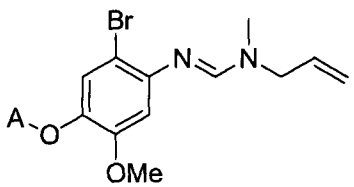
〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＤＧ－００１～ＡＤＧ－５２８は



〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物であり、

化合物ＡＤＨ－００１～ＡＤＨ－５２８は

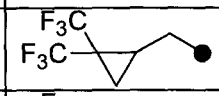
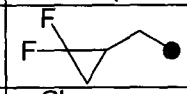
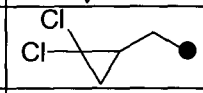
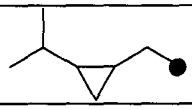
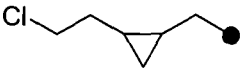
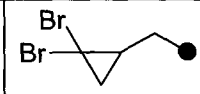
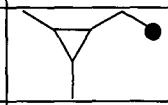
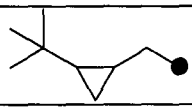
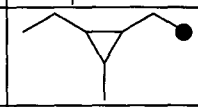
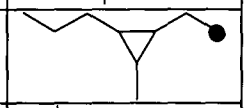
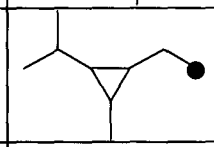
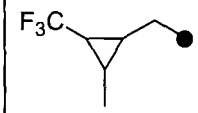
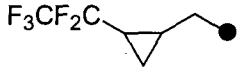
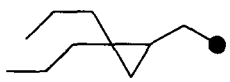
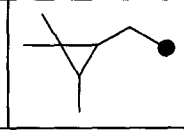


〔式中、Ａは、表１～表１８に示す置換番号１～５２８に各々対応する置換基〕で示されるアミジン化合物である。

ただし、表１～表１８における●は、結合部位を表す。

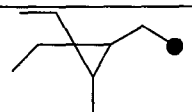
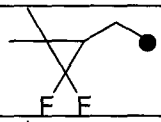
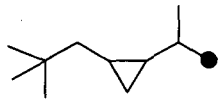
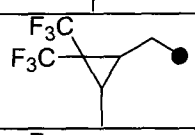
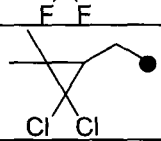
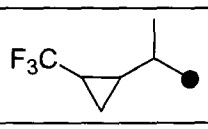
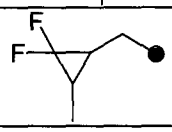
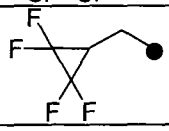
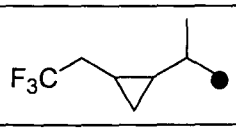
[0107]

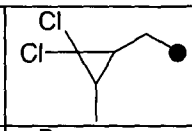
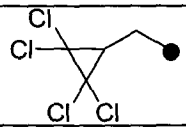
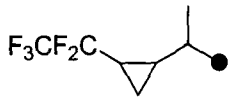
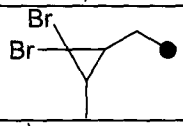
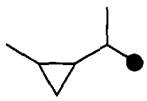
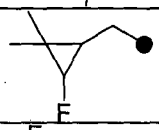
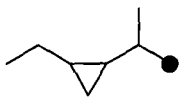
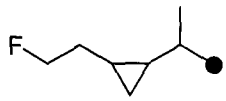
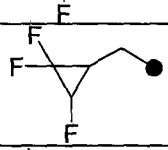
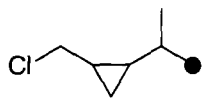
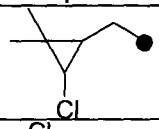
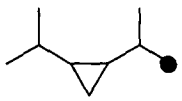
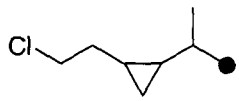
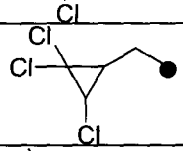
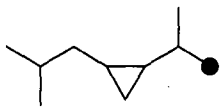
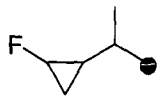
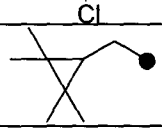
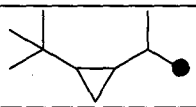
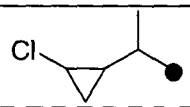
[表1]

置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
1		11		21	
2		12		22	
3		13		23	
4		14		24	
5		15		25	
6		16		26	
7		17		27	
8		18		28	
9		19		29	
10		20		30	

[0108]

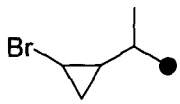
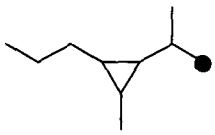
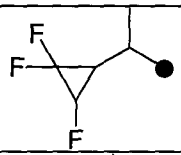
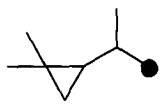
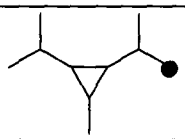
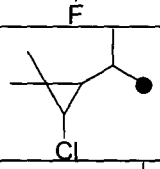
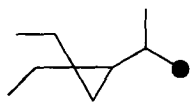
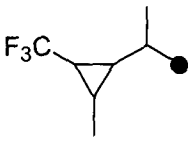
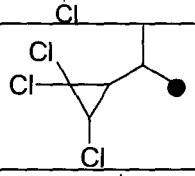
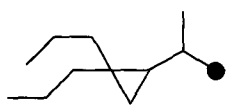
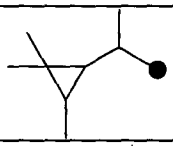
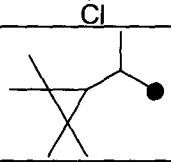
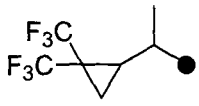
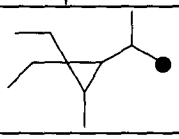
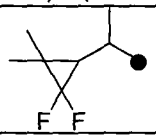
[表2]

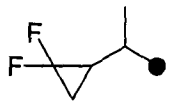
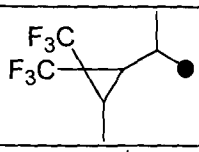
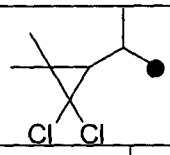
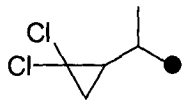
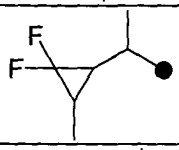
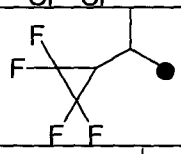
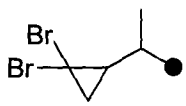
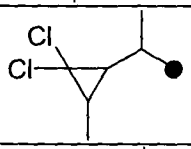
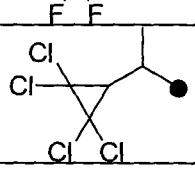
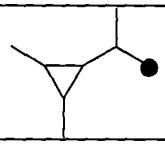
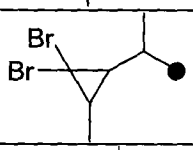
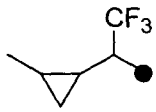
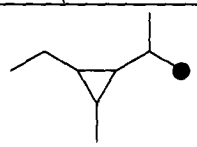
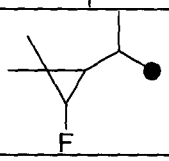
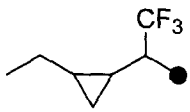
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
31		41		51	
32		42		52	
33		43		53	

3 4		4 4		5 4	
3 5		4 5		5 5	
3 6		4 6		5 6	
3 7		4 7		5 7	
3 8		4 8		5 8	
3 9		4 9		5 9	
4 0		5 0		6 0	

[0109]

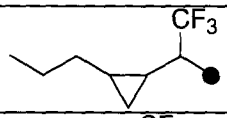
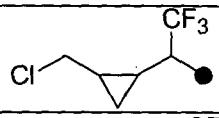
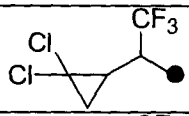
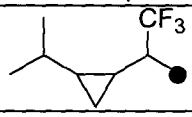
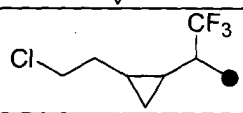
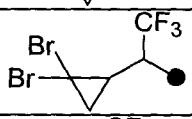
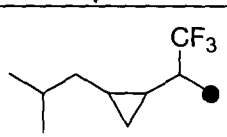
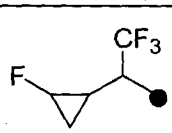
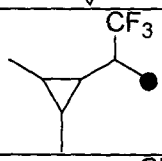
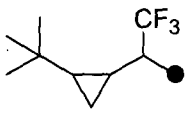
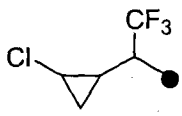
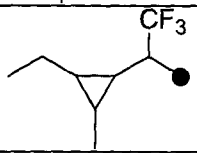
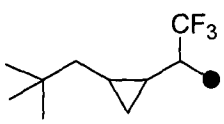
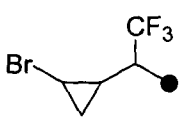
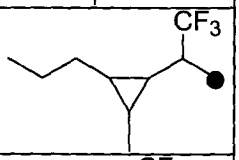
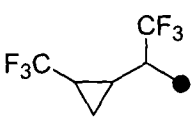
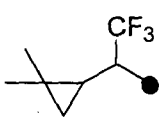
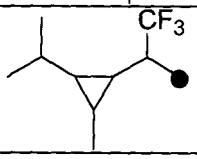
[表3]

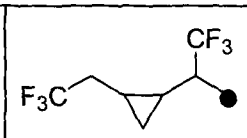
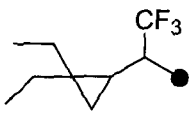
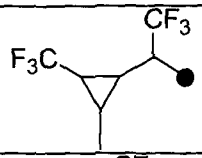
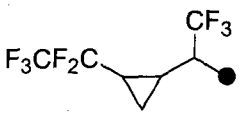
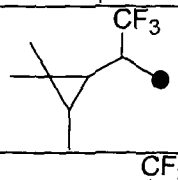
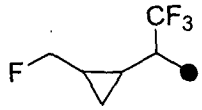
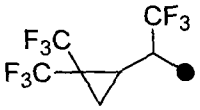
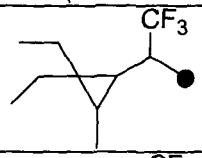
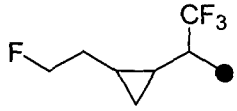
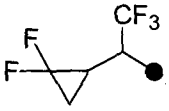
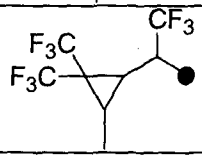
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
6 1		7 1		8 1	
6 2		7 2		8 2	
6 3		7 3		8 3	
6 4		7 4		8 4	
6 5		7 5		8 5	

66		76		86	
67		77		87	
68		78		88	
69		79		89	
70		80		90	

[0110]

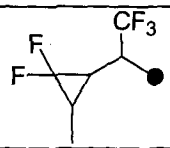
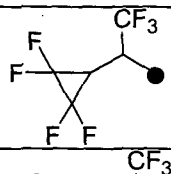
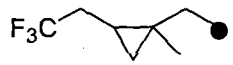
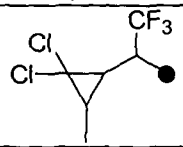
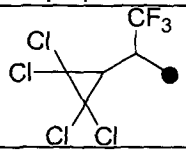
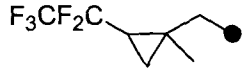
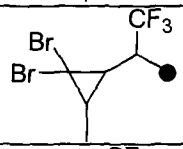
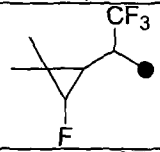
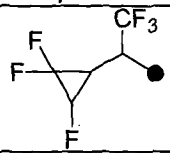
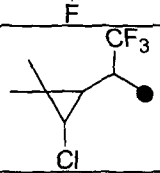
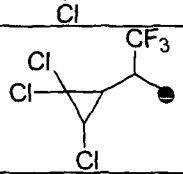
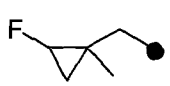
[表4]

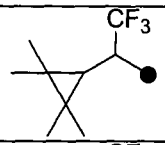
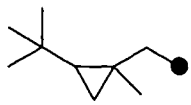
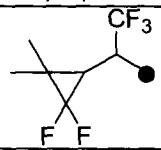
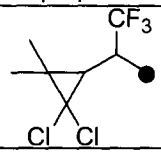
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
91		101		111	
92		102		112	
93		103		113	
94		104		114	
95		105		115	
96		106		116	

97		107		117	
98		108		118	
99		109		119	
100		110		120	

[0111]

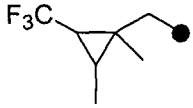
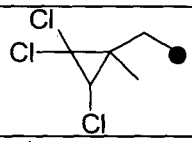
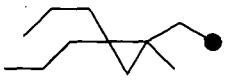
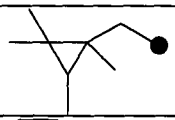
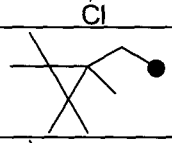
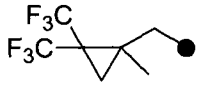
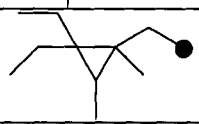
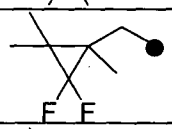
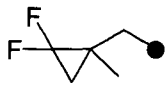
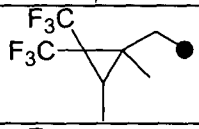
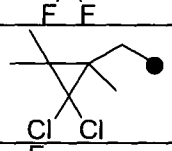
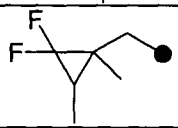
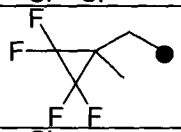
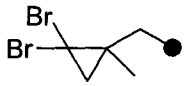
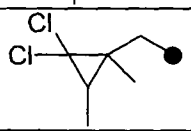
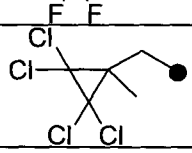
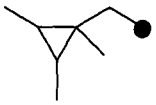
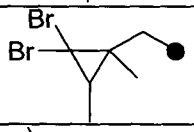
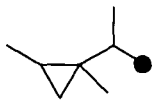
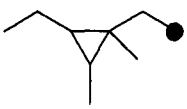
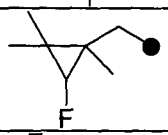
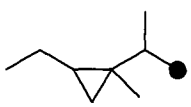
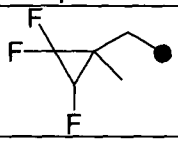
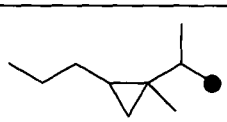
[表5]

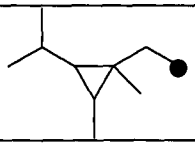
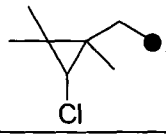
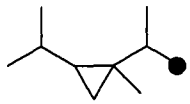
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
121		131		141	
122		132		142	
123		133		143	
124		134		144	
125		135		145	
126		136		146	
127		137		147	

128		138		148	
129		139		149	
130		140		150	

[0112]

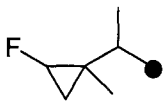
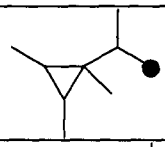
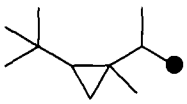
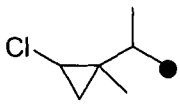
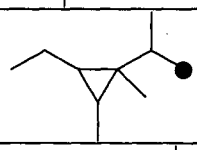
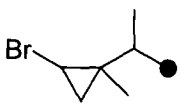
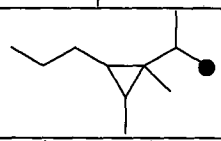
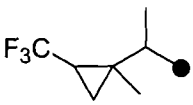
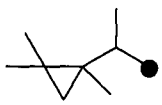
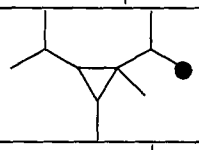
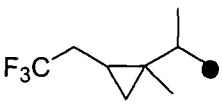
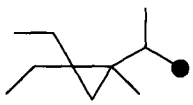
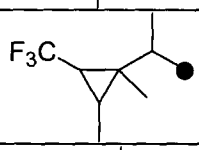
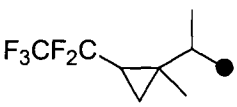
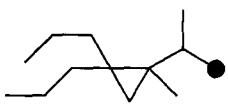
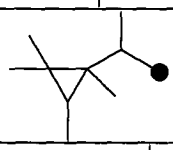
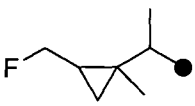
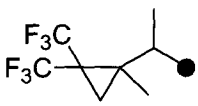
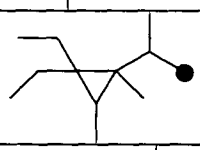
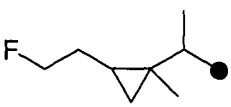
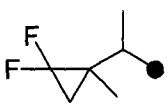
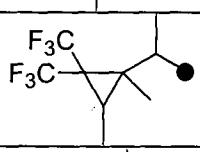
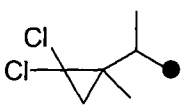
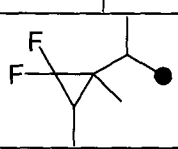
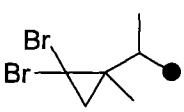
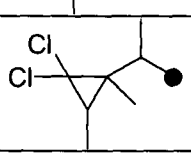
[表6]

置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
151		161		171	
152		162		172	
153		163		173	
154		164		174	
155		165		175	
156		166		176	
157		167		177	
158		168		178	
159		169		179	

160		170		180	

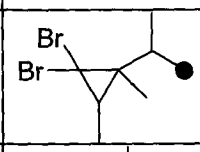
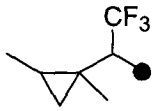
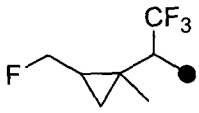
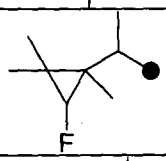
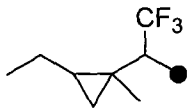
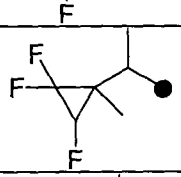
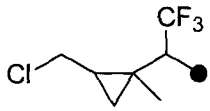
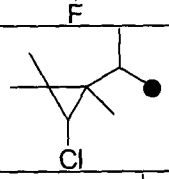
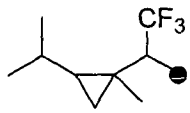
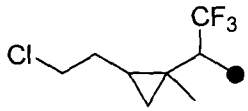
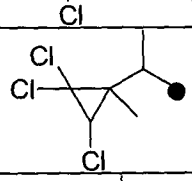
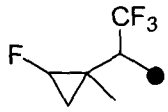
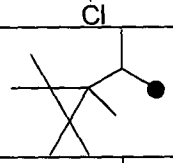
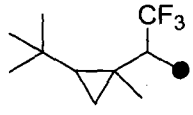
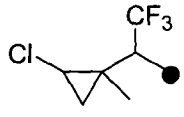
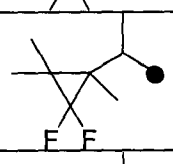
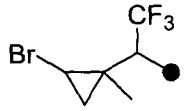
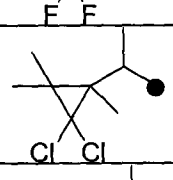
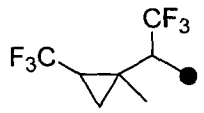
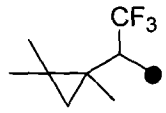
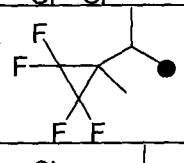
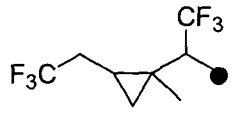
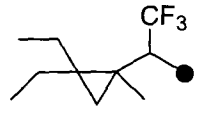
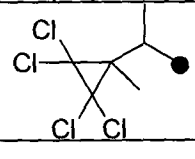
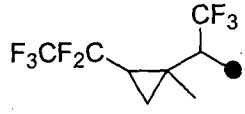
[0113]

[表7]

置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
181		191		201	
182		192		202	
183		193		203	
184		194		204	
185		195		205	
186		196		206	
187		197		207	
188		198		208	
189		199		209	
190		200		210	

[0114]

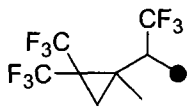
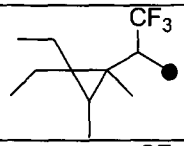
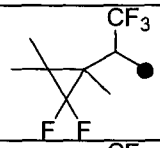
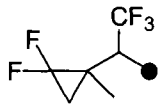
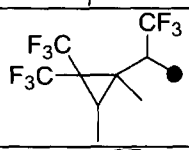
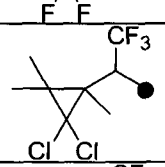
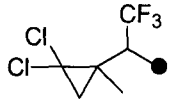
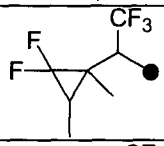
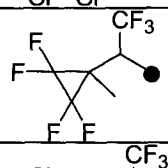
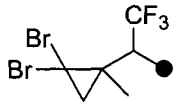
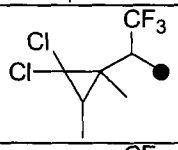
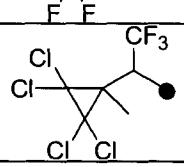
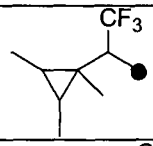
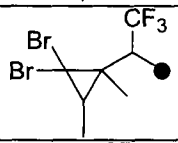
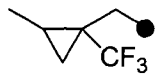
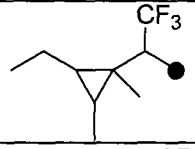
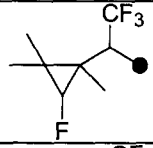
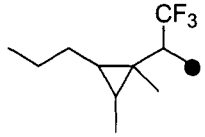
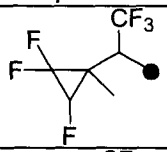
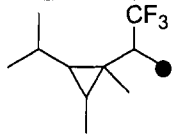
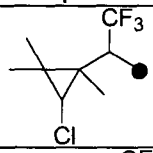
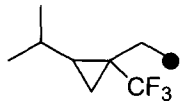
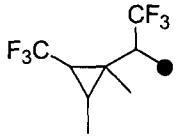
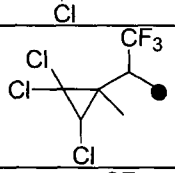
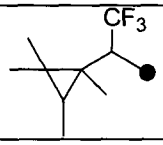
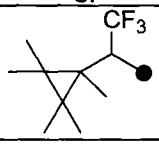
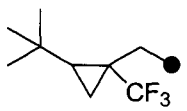
[表８]

置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
２１１		２２１		２３１	
２１２		２２２		２３２	
２１３		２２３		２３３	
２１４		２２４		２３４	
２１５		２２５		２３５	
２１６		２２６		２３６	
２１７		２２７		２３７	
２１８		２２８		２３８	
２１９		２２９		２３９	
２２０		２３０		２４０	

[０１１５]

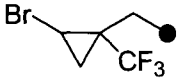
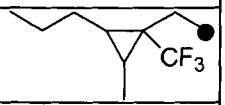
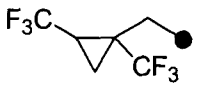
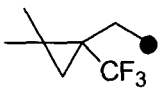
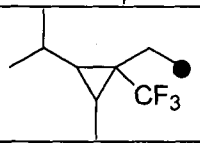
[表９]

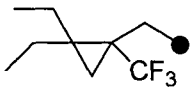
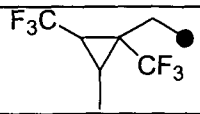
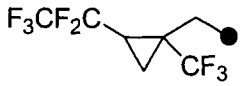
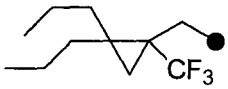
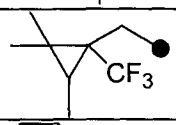
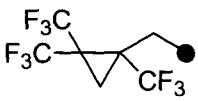
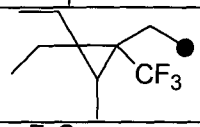
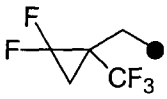
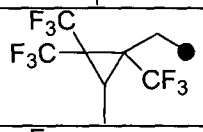
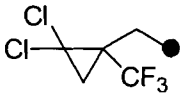
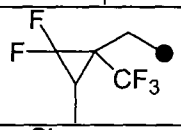
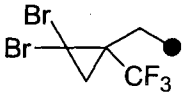
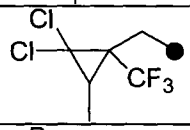
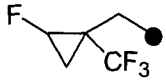
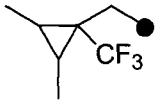
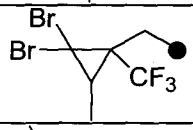
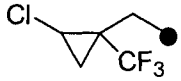
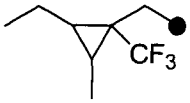
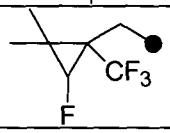
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A

241		251		261	
242		252		262	
243		253		263	
244		254		264	
245		255		265	
246		256		266	
247		257		267	
248		258		268	
249		259		269	
250		260		270	

[0116]

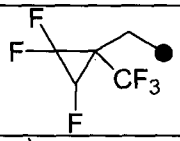
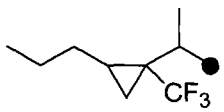
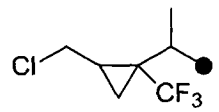
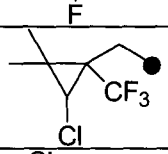
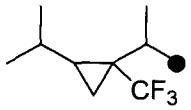
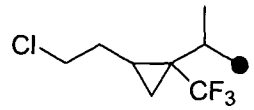
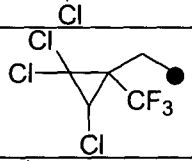
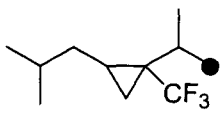
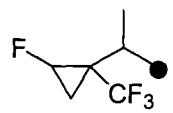
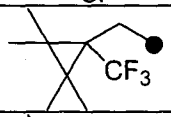
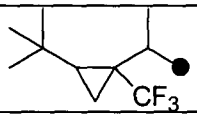
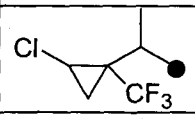
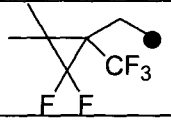
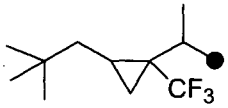
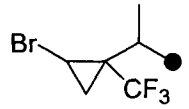
[表10]

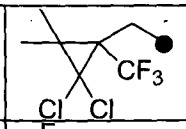
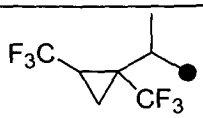
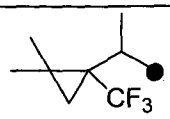
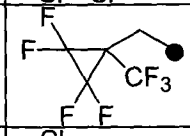
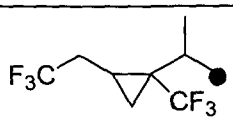
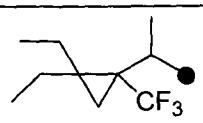
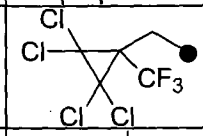
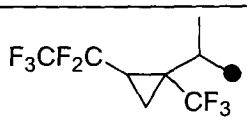
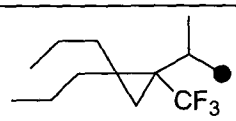
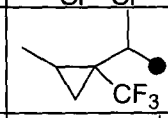
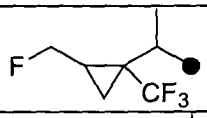
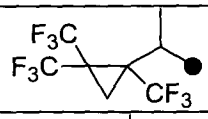
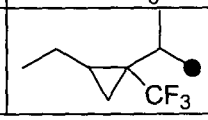
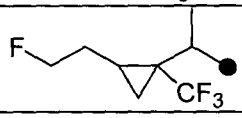
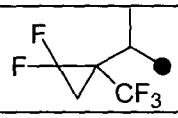
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
271		281		291	
272		282		292	

273		283		293	
274		284		294	
275		285		295	
276		286		296	
277		287		297	
278		288		298	
279		289		299	
280		290		300	

[0117]

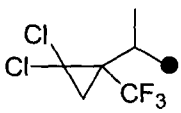
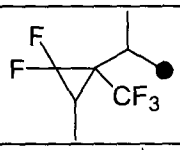
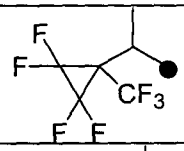
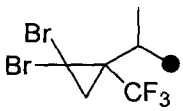
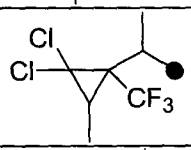
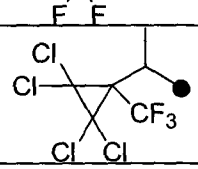
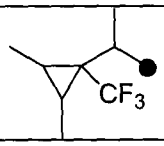
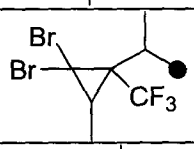
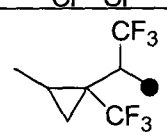
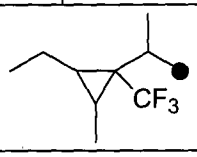
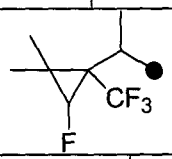
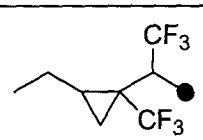
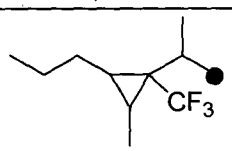
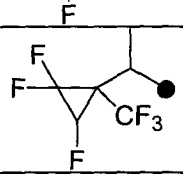
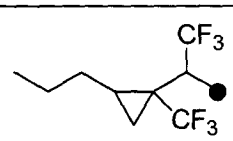
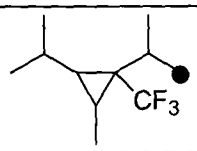
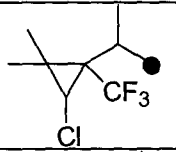
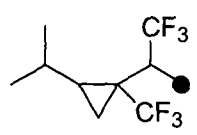
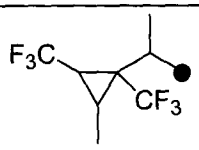
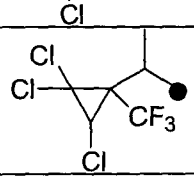
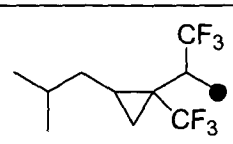
[表11]

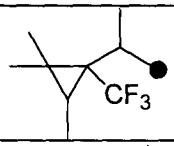
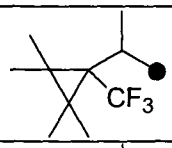
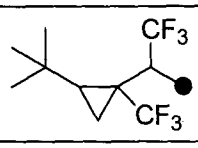
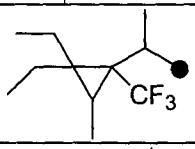
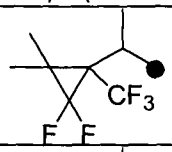
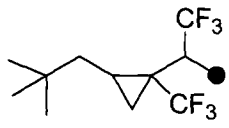
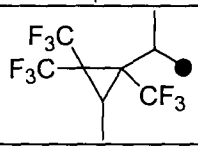
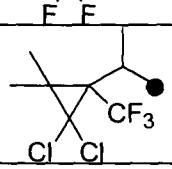
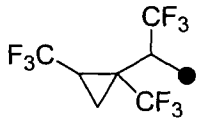
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
301		311		321	
302		312		322	
303		313		323	
304		314		324	
305		315		325	

306		316		326	
307		317		327	
308		318		328	
309		319		329	
310		320		330	

[0118]

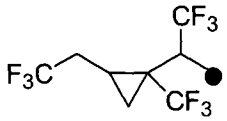
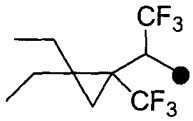
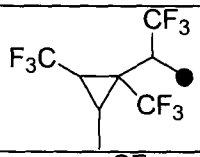
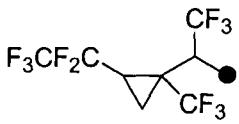
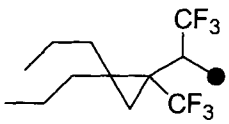
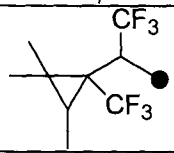
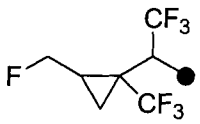
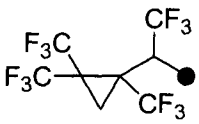
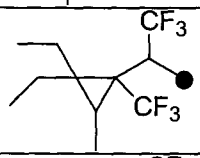
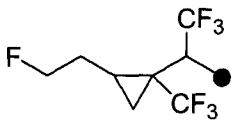
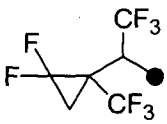
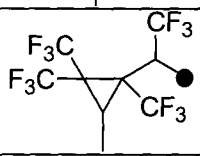
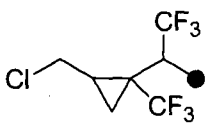
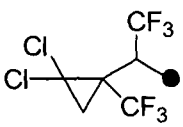
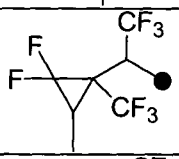
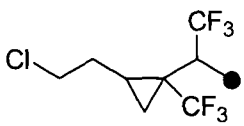
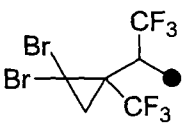
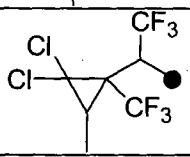
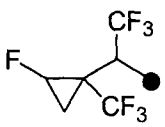
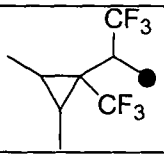
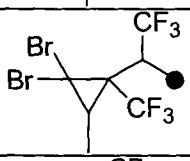
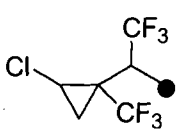
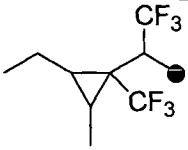
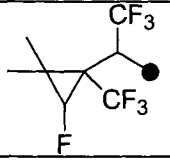
[表12]

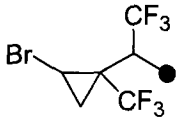
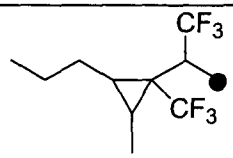
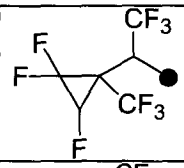
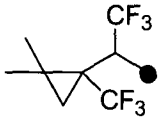
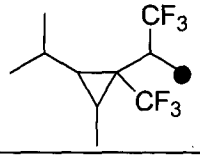
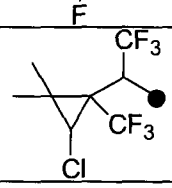
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
331		341		351	
332		342		352	
333		343		353	
334		344		354	
335		345		355	
336		346		356	
337		347		357	

338		348		358	
339		349		359	
340		350		360	

[0119]

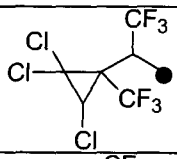
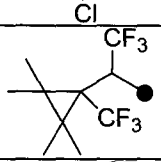
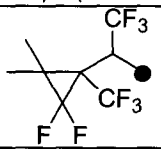
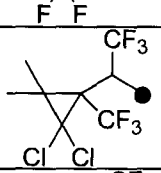
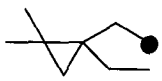
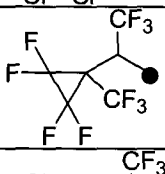
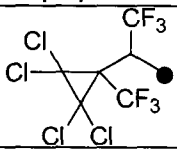
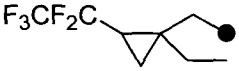
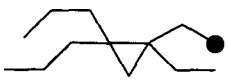
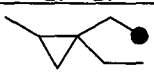
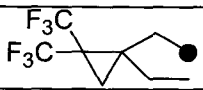
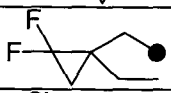
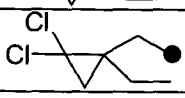
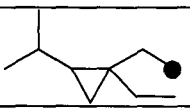
[表13]

置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
361		371		381	
362		372		382	
363		373		383	
364		374		384	
365		375		385	
366		376		386	
367		377		387	
368		378		388	

369		379		389	
370		380		390	

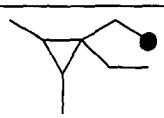
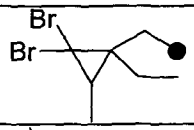
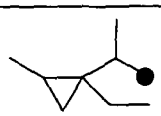
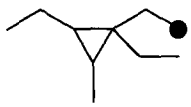
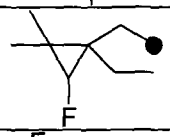
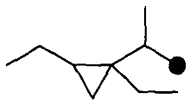
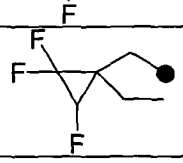
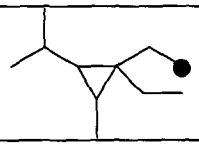
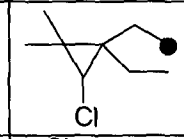
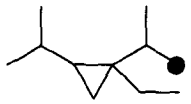
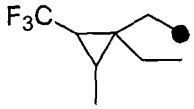
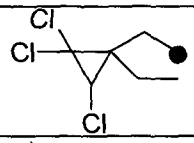
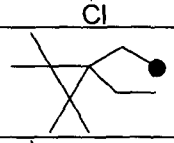
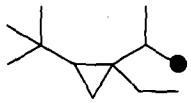
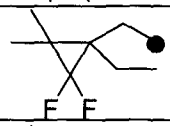
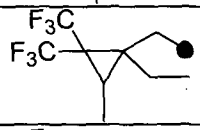
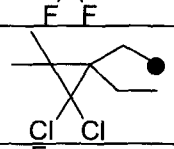
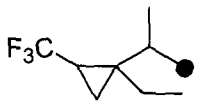
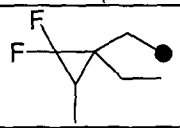
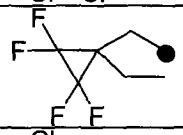
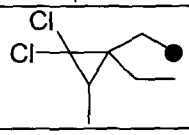
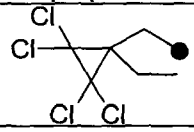
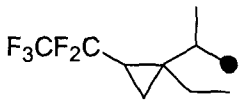
[0120]

[表14]

置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
391		401		411	
392		402		412	
393		403		413	
394		404		414	
395		405		415	
396		406		416	
397		407		417	
398		408		418	
399		409		419	
400		410		420	

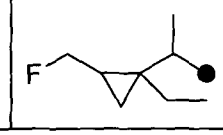
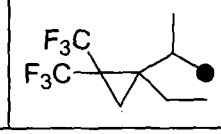
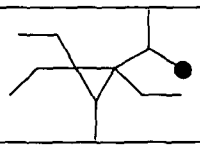
[0121]

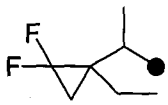
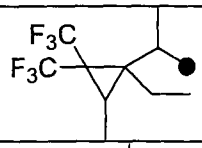
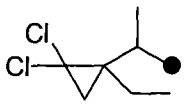
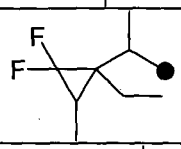
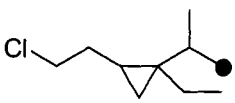
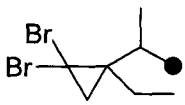
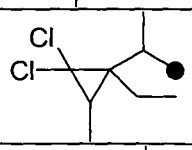
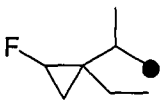
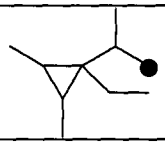
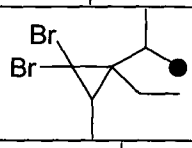
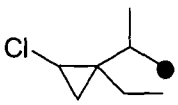
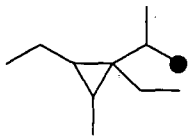
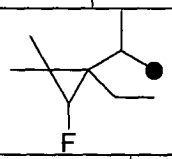
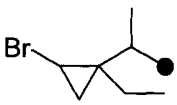
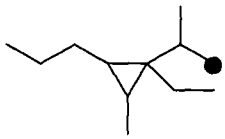
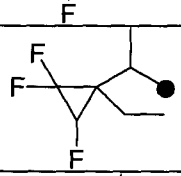
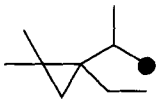
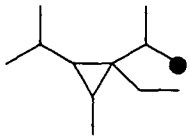
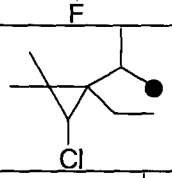
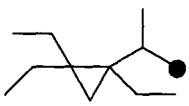
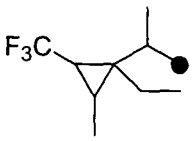
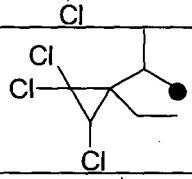
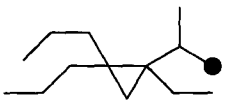
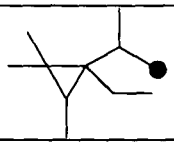
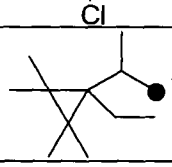
[表１５]

置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
４２１		４３１		４４１	
４２２		４３２		４４２	
４２３		４３３		４４３	
４２４		４３４		４４４	
４２５		４３５		４４５	
４２６		４３６		４４６	
４２７		４３７		４４７	
４２８		４３８		４４８	
４２９		４３９		４４９	
４３０		４４０		４５０	

[０１２２]

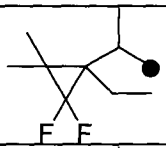
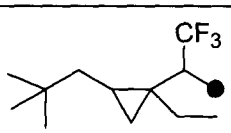
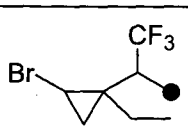
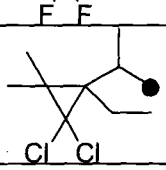
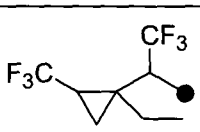
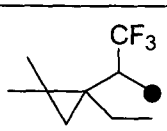
[表１６]

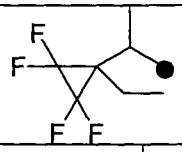
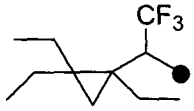
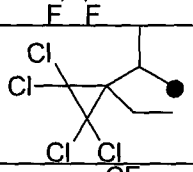
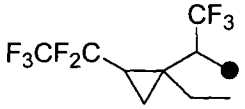
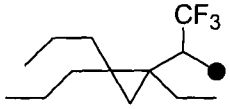
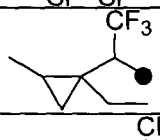
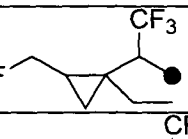
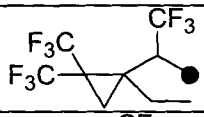
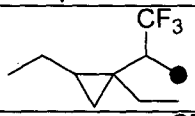
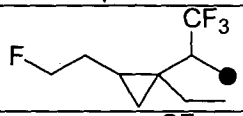
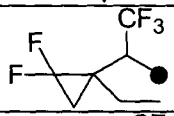
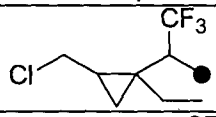
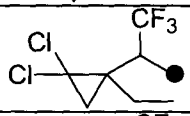
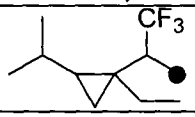
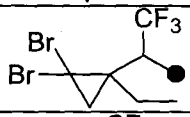
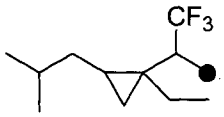
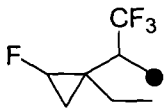
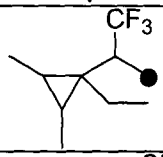
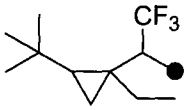
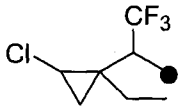
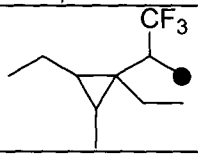
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
４５１		４６１		４７１	

452		462		472	
453		463		473	
454		464		474	
455		465		475	
456		466		476	
457		467		477	
458		468		478	
459		469		479	
460		470		480	

[0123]

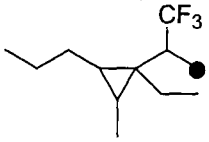
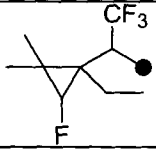
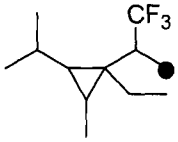
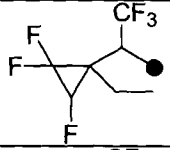
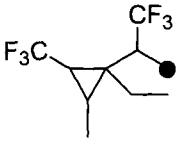
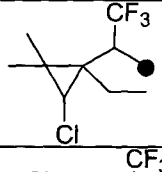
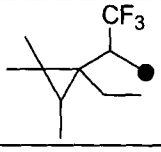
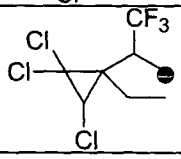
[表17]

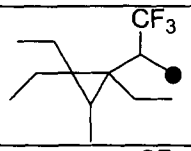
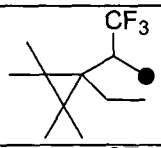
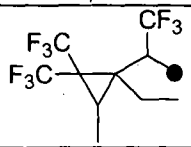
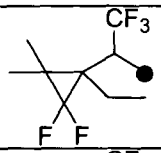
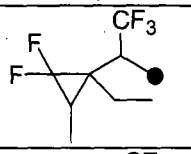
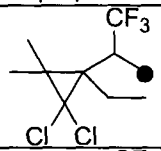
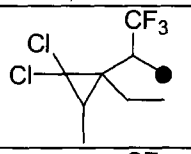
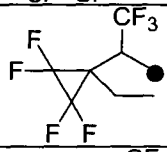
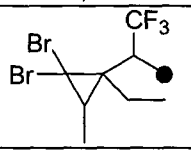
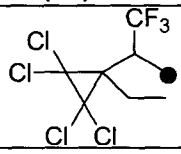
置換基番号	A	置換基番号	A	置換基番号	A
481		491		501	
482		492		502	

483		493		503	
484		494		504	
485		495		505	
486		496		506	
487		497		507	
488		498		508	
489		499		509	
490		500		510	

[0124]

[表18]

置換基番号	A	置換基番号	A
511		520	
512		521	
513		522	
514		523	

515		524	
516		525	
517		526	
518		527	
519		528	

[0125]

次に製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

[0126]

製剤例1

本発明化合物（1－1）～（1－16）のいずれか1化合物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、製剤を得る。

[0127]

製剤例2

本発明化合物（1－1）～（1－16）のいずれか1化合物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、製剤を得る。

[0128]

製剤例3

本発明化合物（1－1）～（1－16）のいずれか1化合物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、製剤を得る。

［０１２９］

製剤例４

本発明化合物（１－１）～（１－１６）のいずれか１化合物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、製剤を得る。

［０１３０］

製剤例５

本発明化合物（１－１）～（１－１６）のいずれか１化合物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、製剤を得る。

［０１３１］

製剤例６

本発明化合物（１－１）～（１－１６）のいずれか１化合物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、製剤を得る。

［０１３２］

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とを比較することにより評価した。

［０１３３］

試験例１；

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにイネ（品種；日本晴）を播種し、温室内で２０日間生育させた。その後、本発明化合物（１－１）および（１－１６）をそれぞれ製剤例２に準じて製剤とし、水で希釈して所定濃度（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、前記散布処理をしたイネと、イネいもち病菌（Ｍａｇｎａｐｏｒｔｈｅ　ｇｒｉｓｅａ）に罹病したイネ苗（品種；日本晴）とを接触させながら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（１－１）および（１－１６）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１３４］

試験例２

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにコムギ（品種；シロガネ）を播種し、温室内で９日間生育させた。その後、該コムギにコムギのさび病菌（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａ）の胞子をふりかけ接種した。該コムギを２３℃、暗黒多湿下に１日間置いた後、風乾した。本発明化合物（１－１）および（１－１６）をそれぞれ製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度(２００ppm)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７日間置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１－１）および（１－１６）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１３５］

試験例３

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにコムギ（品種；シロガネ）を播種し、温室内で９日間生育させた。本発明化合物（１－２），（１－３），および（１－６）～（１－１６）をそれぞれ製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度(２００ｐｐｍ)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、１８℃、照明下で５日間栽培した後、コムギのさび病菌（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａ）の胞子をふりかけ接種した。接種後植物を２３℃、暗黒多湿下に１日間置いた後、１８℃、照明下で８日間栽培し、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１－２），（１－３）および（１－６）～（１－１６）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１３６］

試験例４

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにキュウリ（品種；相模半白）を播種し、温室内で１２日間生育させた。本発明化合物１，２および１６をそれぞれ製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度（２００ｐｐｍ）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、キュウリうどんこ病菌（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａ）胞子をふりかけ接種した。植物を昼間２４℃、夜間２０℃の温室で11日間栽培した後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１－１），（１－２）および（１－１６）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１３７］

試験例５

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにコムギ（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（１－８），（１－１１），（１－１２），（１－１４）および（１－１５）をそれぞれ製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度（２００ｐｐｍ）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、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。接種後植物を１８℃多湿下に３日間置き、次に照明下に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（１－８），（１－１１），（１－１２），（１－１４）および（１－１５）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１３８］

試験例６

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにオオムギ（品種；ニシノホシ）を播種し、温室で7日間生育させた。本発明化合物（１－１２），（１－１４）および（１－１６）をそれぞれ製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度（２００ｐｐｍ）にし、上記オオ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、２日後にオオムギ網斑病菌（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ　ｔｅｒｅｓ）胞子の水懸濁液を噴霧接種した。接種後植物を昼間２３℃、夜間２０℃の温室内で多湿下に３日間置き、次に温室内で７日間栽培した後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１－１２），（１－１４）および（１－１６）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１３９］

試験例７

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにオオムギ（品種；ミカモゴールデン）を播種し、温室で7日間生育させた。本発明化合物（１－８），（１－１２），および（１－１４）～（１－１６）をそれぞれ製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度（２００ｐｐｍ）にし、上記オオ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、２日後にオオムギ雲形病菌（Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ　ｓｅｃａｌｉｓ）胞子の水懸濁液を噴霧接種した。接種後植物を昼間２３℃、夜間２０℃の温室内で多湿下に３日間置き、次に温室内で７日間栽培した後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物本発明化合物（１－８），（１－１２）および（１－１４）～（１－１６）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１４０］

試験例８

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにダイズ（品種；黒千石）を播種し、温室内で１３日間生育させた。本発明化合物（１－１）～（１－３），および（１－５）～（１－１５）をそれぞれ製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度（２００ｐｐｍ）にし、上記ダイズ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、２日後にダイズさび病菌（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉ）胞子の水懸濁液を噴霧接種した。接種後植物を昼間２３℃、夜間２０℃の温室内で多湿下に３日間置き、次に温室内で１４日間栽培した後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１－１）～（１－３），および（１－５）～（１－１５）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％

以下であった。

［０１４１］

試験例９

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにダイズ（品種；黒千石）を播種し、温室内で１３日間生育させた。その後、上記ダイズにダイズさび病菌（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉ）胞子の水懸濁液を噴霧接種した。上記ダイズを２３℃、多湿下に１日間置いた後、風乾した。本発明化合物（１－１）～（１－１５）を製剤例２に準じた製剤とした後、水で希釈して所定濃度(２００ｐｐｍ)にし、上記ダイズ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１４日間置いた後、病斑面積を調査した。その結果、本発明化合物（１－１）～（１－１５）を処理した植物における病斑面積はいずれも、無処理の植物における病斑面積の３０％以下であった。

［０１４２］

比較試験例

プラスチックポットに土壌を詰め、そこにイネ（品種；日本晴）を播種し、温室内で２０日間生育させた。その後、本発明化合物（１－１７）および国際特許公報WO２０００/４６１８４に記載の化合物２６７（Ｎ’－（４－シクロヘキシルメトキシ－２，５－ジメチルフェニル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミジン）をそれぞれ製剤例２に準じて製剤とし、水で希釈して所定濃度（２００ｐｐｍ）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、前記散布処理をしたイネと、イネいもち病菌（Ｍａｇｎａｐｏｒｔｈｅ　ｇｒｉｓｅａ）に罹病したイネ苗（品種；日本晴）とを接触させながら６日間置いた後、病斑面積を調査した。その結果、表Aに示す通り、同じ条件下において、本発明化合物（１－１７）は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１０％以下であり、一方WO２０００/４６１８４に記載の化合物２６７は無処理の植物における病斑面積の５０％以下であった。

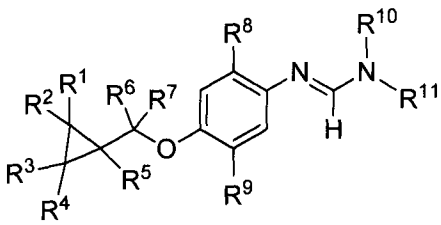
［表１９］

化合物	濃度(ppm)	病斑面積(%)
本発明化合物（１－17）	200	1－10
WO2000/46184 化合物267	200	31－50

上記結果は国際特許公報WO２０００/４６１８４に記載の化合物のうち構造上最も近い化合物と比べて、本発明化合物の方が優れた生物活性を示すものである。

請 求 の 範 囲

1. 式（1）


（1）

〔式中、

R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5は、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子、またはハロゲン原子を表し、

R^6およびR^7は、それぞれ独立して水素原子または１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基を表し、

R^8およびR^9は、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基、１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ２アルコキシ基またはハロゲン原子を表し、

R^{10}およびR^{11}は、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基または１以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ２－Ｃ６アルケニル基を表す。〕

で示されるアミジン化合物。

2. R^8およびR^9が、それぞれ独立して１以上のハロゲン原子を有していてもよいメチル基であり、

R^{10}が、メチル基であり、

R^{11}が、Ｃ１－Ｃ３アルキル基またはＣ２－Ｃ３アルケニル基である請求の範囲１に記のアミジン化合物。

3. R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5が、それぞれ独立してＣ１－Ｃ５アルキル基、水素原子またはハロゲン原子であり、

R^8、R^9およびR^{10}がメチル基であり、

R^{11}がエチル基、プロピル基または２－プロペニル基である請求の範囲１に記載のアミジン化合物。

４．　請求の範囲１～３のいずれか一項に記載のアミジン化合物を含有する植物病害防除剤。

５．　請求の範囲１～３のいずれか一項に記載のアミジン化合物の有効量を植物又は土壌に処理することを含む植物病害の防除方法。

６．　植物病害を防除するための請求の範囲１～３のいずれか一項に記載のアミジン化合物の使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/059054

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
C07C257/12(2006.01)i, *A01N37/52*(2006.01)i, *A01P3/00*(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07C257/12, A01N37/52, A01P3/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched
Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2014
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2014 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2014

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2002-536354 A (Aventis Cropscience GmbH), 29 October 2002 (29.10.2002), claims; paragraphs [0005], [0024], [0033] to [0037]; examples; compound 267 & JP 2011-57678 A & US 6893650 B1 & WO 2000/046184 A1	1-6
A	JP 54-117431 A (Schering AG.), 12 September 1979 (12.09.1979), claims; page 4, lower right column, line 2 to page 5, lower left column, line 6; examples & GB 2013669 A & DE 2804739 A & FR 2416220 A	1-6

☒ 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
16 June, 2014 (16.06.14)	24 June, 2014 (24.06.14)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/059054

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 58-4757 A (Stauffer Chemical Co.), 11 January 1983 (11.01.1983), claims; page 3, lower right column, 1st line from the bottom to page 4, upper right column, line 13; examples & JP 54-9246 A & US 4149874 A & US 4230483 A & US 4356026 A & EP 324 A1	1-6
A	JP 2005-524706 A (E.I. Du Pont de Nemours & Co.), 18 August 2005 (18.08.2005), claims & US 2005/0182025 A1 & WO 2003/093224 A1	1-6

国際調査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ２０１４／０５９０５４

Ａ．　発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07C257/12(2006.01)i, A01N37/52(2006.01)i, A01P3/00(2006.01)i

Ｂ．　調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07C257/12, A01N37/52, A01P3/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	１９２２－１９９６年
日本国公開実用新案公報	１９７１－２０１４年
日本国実用新案登録公報	１９９６－２０１４年
日本国登録実用新案公報	１９９４－２０１４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/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
X	JP 2002-536354 A（アベンティス・クロップサイエンス・ゲー・エム・ベー・ハー）2002.10.29, 請求の範囲、段落【０００５】、【００２４】、【００３３】－【００３７】、実施例、化合物２６７ & JP 2011-57678 A & US 6893650 B1 & WO 2000/046184 A1	１－６
A	JP 54-117431 A（シエーリング・アクチエンゲゼルシヤフト）1979.09.12, 請求の範囲、第４頁右下欄２行～第５頁左下欄第６行、実施例 & GB 2013669 A & DE 2804739 A & FR 2416220 A	１－６

☑　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	国際調査報告の発送日
１６．０６．２０１４	２４．０６．２０１４

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）　４Ｈ　４１６０
岩井　好子
電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４４３

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
Ａ	JP 58-4757 A（ストウフアー・ケミカル・カンパニー）1983.01.11, 請求の範囲、第３頁右下欄下１行～第４頁右上欄第１３行、実施例 & JP 54-9246 A & US 4149874 A & US 4230483 A & US 4356026 A & EP 324 A1	１－６
Ａ	JP 2005-524706 A（イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・アンド・カンパニー）2005.08.18, 請求の範囲 & US 2005/0182025 A1 & WO 2003/093224 A1	１－６