

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3887784号  
(P3887784)

(45) 発行日 平成19年2月28日(2007.2.28)

(24) 登録日 平成18年12月8日(2006.12.8)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 273/01 (2006.01)

C O 7 D 273/01

A O 1 N 43/88 (2006.01)

A O 1 N 43/88

C O 7 D 413/12 (2006.01)

C O 7 D 413/12

C O 7 D 417/14 (2006.01)

C O 7 D 417/14

請求項の数 16 (全 96 頁)

(21) 出願番号 特願平7-506205  
 (86) (22) 出願日 平成6年7月29日(1994.7.29)  
 (65) 公表番号 特表平10-507998  
 (43) 公表日 平成10年8月4日(1998.8.4)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP1994/002533  
 (87) 国際公開番号 W01995/004728  
 (87) 国際公開日 平成7年2月16日(1995.2.16)  
 審査請求日 平成13年3月30日(2001.3.30)  
 (31) 優先権主張番号 P4326908.7  
 (32) 優先日 平成5年8月11日(1993.8.11)  
 (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)  
 (31) 優先権主張番号 P4408005.0  
 (32) 優先日 平成6年3月10日(1994.3.10)  
 (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)

(73) 特許権者 302063961  
 バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ  
 ンゲゼルシャフト  
 ドイツ40789モンハイム・アルフレー  
 トーノベルーシュトラッセ50  
 (74) 代理人 100060782  
 弁理士 小田島 平吉  
 (72) 発明者 クリュガー, ベルントービーラント  
 ドイツ連邦共和国デー—51467ベルギ  
 ッシュグラートバツハ・アムフオレント5  
 2  
 (72) 発明者 アスマン, ルツツ  
 ドイツ連邦共和国デー—23701オイテ  
 イン・アイヒブラット2

最終頁に続く

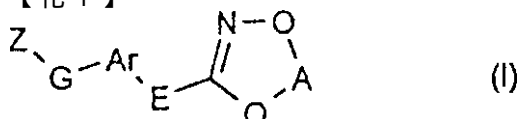
(54) 【発明の名称】 置換アザジオキサシクロアルケン及びその殺菌・殺カビ剤としての使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

1. 一般式(I)

【化1】



式中、Aは随時ハロゲンまたは各々炭素原子1～4個を有するアルキルもしくはハロゲノアルキルで置換されていてもよい炭素原子1～3個を有するアルカンジイルを表わし、Arは各々の場合に随時置換されていてもよいフェニレンまたはナフチレンを表わすか、或いは5または6環の員を有し、その少なくとも1個が酸素、硫黄または窒素を表わし、かつ適当ならば1個または2個の環員が更に窒素を表わすヘテロアリーレンを表わし、ここに可能である置換基はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、各々炭素原子1～6個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル、各々炭素原子2～6個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニル、アルケニルオキシまたはアルキニルオキシ、各々炭素原子1～6個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～13個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニル、各々炭素原子2～6個及

10

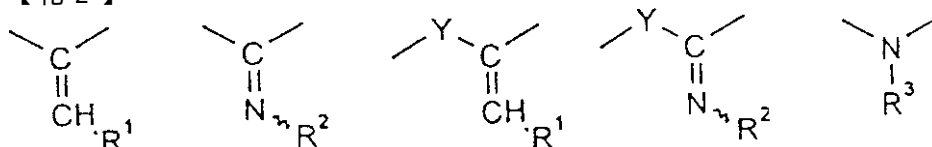
20



び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 13 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシ、各々個々のアルキル部分に炭素原子 1 ~ 6 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノアルキルまたはアルコキシイミノアルキル、或いは各々炭素原子 1 ~ 6 個を有し、かつ各々随時ハロゲン及び / または炭素原子 1 ~ 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル及び / または炭素原子 1 ~ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 9 個を有するハロゲノアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 または多置換されていてもよい各々の場合に 2 価のアルキレンまたはジオキシアルキレンから選ばれ、

E は基

【化 2】



の 1 つを表わし、

ここで Y は酸素、メチレン (CH<sub>2</sub>) またはアルキルイミノ (N - R) を表わし、

R は炭素原子 1 ~ 6 個を有するアルキルを表わし、

R<sup>1</sup> は水素、ハロゲン、シアノを表わすか、或いは各々アルキル基中に炭素原子 1 ~ 6 個を有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルコキシで置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノを表わし、

R<sup>2</sup> は水素、アミノ、シアノを表わすか、或いは各々アルキル基中に炭素原子 1 ~ 6 個を有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルコキシで置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノを表わし、そして

R<sup>3</sup> は水素、シアノを表わすか、各々炭素原子 6 個までを有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルコキシで置換されていてもよいアルキル、アルケニルまたはアルキニルを表わすか、或いはシクロアルキル部分に炭素原子 3 ~ 6 個及び適当ならばアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルを表わし、その際にこれらのシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキル基の各々は随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルキルまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよく、

G が単結合、酸素を表わすか、各々炭素原子 4 個までを有し、かつ各々随時ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルまたは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>-シクロアルキルで置換されていてもよいアルカンジイル、アルケンジイル、オキサアルケンジイル、アルキンジイルを表わすか、或いは基

-Q-CQ-、-CQ-Q-、-CH<sub>2</sub>-Q-、-Q-CH<sub>2</sub>-、-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>-Q-CQ-、-Q-CQ-CH<sub>2</sub>-、-Q-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-、-N=N-、-S(O)<sub>n</sub>-、-CH<sub>2</sub>-S(O)<sub>n</sub>-、-CQ-、-S(O)<sub>n</sub>-CH<sub>2</sub>-、

-C(R<sup>4</sup>)=N-O-、-C(R<sup>4</sup>)=N-O-CH<sub>2</sub>-、-N(R<sup>5</sup>)-、

-CQ-N(R<sup>5</sup>)-、-N(R<sup>5</sup>)-CQ-、-Q-CQ-N(R<sup>5</sup>)-、

-N=C(R<sup>4</sup>)-Q-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-N=C(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>5</sup>)-CQ-Q-、-CQ-N(R<sup>5</sup>)-

-CQ-Q-、-N(R<sup>5</sup>)-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-、-CQ-CH<sub>2</sub>-

または -N=N-C(R<sup>4</sup>)=N-O-

の 1 つを表わし、

ここで n は 0、1 または 2 の数を表わし、

Q は酸素または硫黄を表わし、

R<sup>4</sup> は水素、シアノを表わすか、各々アルキル基中に炭素原子 1 ~ 6 個を有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>-アルコキシで置換されていてもよいアルキル、ア

10

20

30

40

50



ルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノを表わすか、或いは随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよい炭素原子 3 ～ 6 個を有するシクロアルキルを表わし、そして

$R^5$  は水素、ヒドロキシル、シアノを表わすか、随時ハロゲン、シアノまたは $C_1 \sim C_4$ -アルコキシで置換されていてもよい炭素原子 1 ～ 6 個を有するアルキルを表わすか、或いは随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよい炭素原子 3 ～ 6 個を有するシクロアルキルを表わし、そして

Z は随時ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル（各々随時ハロゲンで置換されていてもよい）で置換されていてもよい炭素原子 1 ～ 8 個を有するアルキルを表わすか、各々炭素原子 8 個までを有し、かつ各々随時ハロゲンで置換されていてもよいアルケニルまたはアルキニルを表わすか、随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、フェニル（随時ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ -ハロゲノアルコキシで置換されていてもよい）、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよい炭素原子 3 ～ 6 個を有するシクロアルキルを表わすか、或いは各々の場合に随時置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたは 5 または 6 環の員を有し、その少なくとも 1 個が酸素、硫黄または窒素を表わし、かつ適当ならば 1 個または 2 個の環員が更に窒素を表わす（随時ベンゾ融合されていてもよい）複素環式基を表わし、

ここで他の可能である置換基は好ましくは酸素（2 個の対の水素原子に対する置換基として）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、各々炭素原子 1 ～ 6 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル、各々炭素原子 2 ～ 6 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニルまたはアルケニルオキシ、各々炭素原子 1 ～ 6 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ～ 13 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニル、各々炭素原子 2 ～ 6 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ～ 13 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシ、各々個々のアルキル部分に炭素原子 1 ～ 6 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノアルキルまたはアルコキシイミノアルキル、各々炭素原子 1 ～ 6 個を有し、かつ各々随時ハロゲン及び/または炭素原子 1 ～ 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル及び/または炭素原子 1 ～ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ～ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 または多置換されていてもよい各々の場合に 2 価のアルキレンまたはジオキシアルキレン、或いは炭素原子 3 ～ 6 個を有するシクロアルキル、各々 3 ～ 7 環の員を有し、各々の場合にその 1 ～ 3 個が同一もしくは相異なるヘテロ原子、殊に窒素、酸素及び/または硫黄である複素環式基または複素環式メチル、並びに各々随時フェニル部分においてハロゲン、シアノ、ニトロ、カルボキシル、カルバモイル及び/または炭素原子 1 ～ 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル及び/または炭素原子 1 ～ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ～ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキル及び/または炭素原子 1 ～ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ～ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルコキシ及び/または炭素原子 1 ～ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ～ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ及び/または炭素原子 1 ～ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ～ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニル及び/または炭素原子 5 個までを有するアルキルカルボニルまたはアルコキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 または多置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、ベンジル、ベンジロオ

10

20

30

40

50



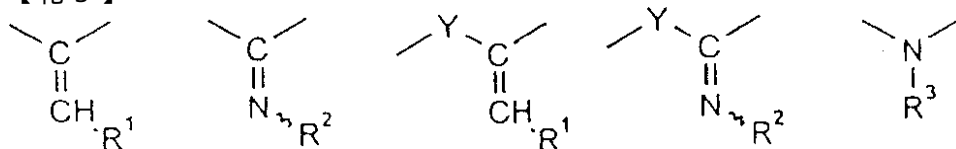
キシ、フェニルエチルまたはフェニルエチルオキシから選ばれる、  
のアザジオキサシクロアルケン。

【請求項 2】

A が各々随時フッ素、塩素、メチル、エチルまたはトリフルオロメチルで置換されていて  
もよいメチレンまたはジメチレン（エタン-1, 2-ジイル）を表わし、A<sub>r</sub> が各々の場合  
に随時置換されていてよいオルト-、メタ-もしくはパラ-フェニレンを表わすか、或い  
はフランジイル、チオフエンジイル、ピロールジイル、ピラゾールジイル、トリアゾール  
ジイル、オキサゾールジイル、イソキサゾールジイル、チアゾールジイル、イソチアゾール  
ジイル、オキサジアゾールジイル、チアジアゾールジイル、ピリジンジイル、ピリミジ  
ンジイル、ピリダジンジイル、ピラジンジイル、1, 3, 4-トリアジンジイルまたは 1  
10, 2, 3-トリアジンジイルを表わし、ここに可能な置換基は殊にフッ素、塩素、シアノ  
、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、メチルスル  
フィニルまたはメチルスルホニルから選ばれ、

E が基

【化 3】



の 1 つを表わし、

ここに Y が酸素、メチレン (CH<sub>2</sub>) またはアルキルイミノ (N-R) を表わし、

R がメチル、エチル、n-もしくは i-プロピルまたは n-、i-もしくは s-ブチルを表わ  
し、

R<sup>1</sup> が水素、フッ素、塩素、臭素、シアノを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素、シ  
アノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてよいメチル、エチル、プロピル、メト  
キシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノまたはジメチル  
アミノを表わし、R<sup>2</sup> が水素、アミノ、シアノを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素  
、シアノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてよいメチル、エチル、メトキシ、  
エトキシ、メチルアミノ、エチルアミノまたはジメチルアミノを表わし、そして

R<sup>3</sup> が水素、シアノを表わすか、各々随時フッ素、シアノ、メトキシまたはエトキシで置  
換されていてよいメチル、エチル、n-もしくは i-プロピルまたは n-、i-もしくは s-  
-ブチルを表わすか、アリルまたはプロパルギルを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩  
素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、n-もしくは i-プロピル、メトキシ-カル  
ボニルまたはエトキシ-カルボニルで置換されていてよいシクロプロピル、シクロブチ  
ル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シ  
クロペンチルメチルまたはシクロヘキシルメチルを表わし、

G が単結合、酸素を表わすか、各々随時フッ素、塩素、ヒドロキシル、メチル、エチル、  
n-もしくは i-プロピル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ  
ペンチルまたはシクロヘキシルで置換されていてよいメチレン、ジメチレン（エタン-  
1, 2-ジイル）、エテン-1, 2-ジイル、エチン-1, 2-ジイルを表わすか、或いは基  
-Q-CQ-、-CQ-Q-、-CH<sub>2</sub>-Q-、-Q-CH<sub>2</sub>-、-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-、  
-CH<sub>2</sub>-Q-CQ-、-Q-CQ-CH<sub>2</sub>-、-Q-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-、-N=N-、-S(O)<sub>n</sub>-、-CH  
2-S(O)<sub>n</sub>-、-CQ-、-S(O)<sub>n</sub>-CH<sub>2</sub>-、  
-C(R<sup>4</sup>)=N-O-、-C(R<sup>4</sup>)=N-O-CH<sub>2</sub>-、-N(R<sup>5</sup>)-、  
-CQ-N(R<sup>5</sup>)-、-N(R<sup>5</sup>)-CQ-、-Q-CQ-N(R<sup>5</sup>)-、  
-N=C(R<sup>4</sup>)-Q-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-N=C(R<sup>4</sup>)-、-N(R<sup>5</sup>)-CQ-Q-、-CQ-N(R<sup>5</sup>)  
-CQ-Q-、-N(R<sup>5</sup>)-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-、-CQ-CH<sub>2</sub>または -N=N-(R<sup>4</sup>)=N-O-  
の 1 つを表わし、

ここに n が 0、1 または 2 の数を表わし、

Q が酸素または硫黄を表わし、

10

20

30

40

50



R<sup>4</sup>が水素、シアノを表わすか、各々随時フッ素、塩素、シアノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてもよいメチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-もしくはs-ブチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表わし、そして

R<sup>5</sup>が水素、ヒドロキシル、シアノを表わすか、各々随時フッ素、塩素、シアノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてもよいメチル、エチル、n-もしくはi-プロピルまたはn-、i-、s-もしくはt-ブチルを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表わし、そして

Zが各々随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル（各々随時フッ素及び/または塩素で置換されていてもよい）で置換されていてもよいメチル、エチル、n-もしくはi-プロピルまたはn-、i-、s-もしくはt-ブチルを表わすか、各々随時フッ素、塩素または臭素で置換されていてもよいアリル、クロトニル、1-メチル-アリル、プロパルギルまたは1-メチル-プロパルギルを表わすか、各々随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、フェニル（随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよい）、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表わすか、或いは各々の場合に随時置換されていてもよいフェニル、ナフチル、フリル、テトラヒドロフリル、ベンゾフリル、テトラヒドロピラニル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリル、ジヒドロピロリル、テトラヒドロピロリル、ベンゾピロリル、ベンゾジヒドロピロリル、オキサゾリル、ベンゾキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニルまたは1, 3, 5-トリアジニルを表わし、ここに可能である置換基は各々の場合に好ましくは酸素（2個の対の水素原子に対する置換基として）、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-、i-、s-もしくはt-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-もしくはi-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、メチルアミノ、エチルアミノ、n-もしくはi-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチルまたはエトキシイミノエチル；或いは各々随時フッ素、塩素、メチル、エチルまたはn-もしくはi-プロピルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換で1または多置換されていてもよいトリメチレン（プロパン-1, 3-ジイル）、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、或いはシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、並びに各々随時フェニル部分においてフッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、カルボ

10

20

30

40

50



キシル、カルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、アセチル、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または多置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、ベンジルまたはベンジロキシから選ばれる、請求項1記載の式(I)の化合物。

【請求項3】

Aがジメチレン(エタン-1,2-ジイル)を表わし、

A<sub>r</sub>がオルト-フェニレン、ピリジン-2,3-ジイルまたはチオフエン-2,3-ジイルを表わし、

Eが基

【化4】



の1つを表わし、

ここにR<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が各々の場合にメトキシを表わし、

Gが酸素、メチレン或いは基

-CH<sub>2</sub>-O-、-O-CH<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>n</sub>-、-CH<sub>2</sub>-S(O)<sub>n</sub>-、  
-S(O)<sub>n</sub>-CH<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)=N-O-、-O-N=C(R<sup>4</sup>)-、  
-C(R<sup>4</sup>)=N-O-CH<sub>2</sub>-、-N(R<sup>5</sup>)-または-CH<sub>2</sub>-O-N=C(R<sup>4</sup>)-

の1つを表わし、

ここにnが0、1または2の数を表わし、

R<sup>4</sup>が水素、メチルまたはエチルを表わし、そして

R<sup>5</sup>が水素、メチルまたはエチルを表わし、そして

Zが各々の場合に随時置換されていてもよいフェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニルまたは1,3,5-トリアジニルを表わし、ここに可能な置換基は好ましくはフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチルまたはエトキシイミノエチル、或いは各々随時フッ素、塩素、メチルまたはエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または多置換されていてもよいメチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、並びに各々随時フェニル部分においてフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または多置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、ベンジルまたはベンジロキシから選ばれる請求項1記載の式(I)の化合物。

【請求項4】

少なくとも1つの請求項1記載の式(I)の化合物を含有することを特徴とする、殺菌・殺カビ組成物。

【請求項5】

請求項1記載の式(I)の化合物を菌・カビ及び/またはその環境上に作用させることを

10

20

30

40

50

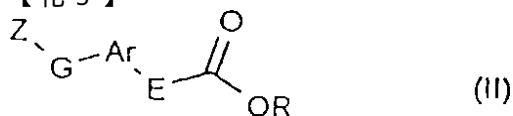


特徴とする、望ましくない菌・カビの防除方法。

【請求項 6】

請求項 1 記載の一般式 (I) のアザジオキサシクロアルケンの製造方法であって、一般式 (II)

【化 5】



式中、Ar、E、G 及び Z は請求項 1 に記載の意味を有し、

そして

R はアルキルを表わす、

のカルボン酸誘導体を第 1 工程で適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下でヒドロキシアルミンまたはそのハロゲン化水素酸塩と反応させ、そして第 1 工程の生成物をその場で、即ち中間体を単離せずに第 2 工程で適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下で一般式 (III)



式中、A は請求項 1 に記載の意味を有し、そして

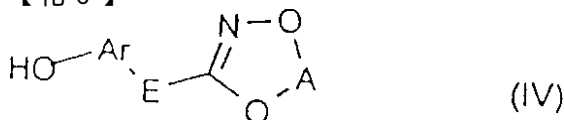
X はハロゲン、アルキルスルホニルオキシまたはアリールスルホニルオキシを表わす、の 2 置換されたアルカンと反応させることを特徴とする、上記方法。

【請求項 7】

G が酸素または基-CH<sub>2</sub>-O-を表わし、そして A、Ar、E 及び Z が請求項 1 に記載の意味を有する、請求項 1 記載の一般式 (I) のアザジオキサシクロアルケンの製造方法であって、

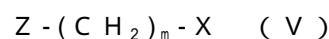
一般式 (IV)

【化 6】



式中、A、Ar 及び E は上記の意味を有する、

のヒドロキシアリール化合物を適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下で一般式 (V)



式中、Z は上記の意味を有し、

X は請求項 6 に記載の意味を有し、そして、

m は 0 または 1 の数を表わす、

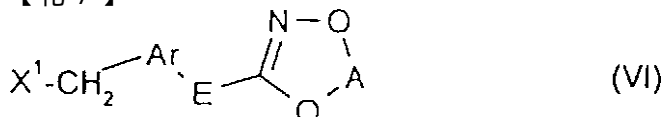
の化合物と反応させ、そして続いて適当ならば置換反応を常法により基 Z に対して行うことを特徴とする、上記方法。

【請求項 8】

G が基-Q-CH<sub>2</sub>-を表わし、そして A、Ar、E、Q 及び Z が請求項 1 に記載の意味を有する、請求項 1 記載の一般式 (I) のアザジオキサシクロアルケンの製造方法であって、

一般式 (VI)

【化 7】



式中、A、Ar 及び E は上記の意味を有し、そして

X<sup>1</sup> はハロゲンを表わす、

のハロゲノメチル化合物を適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下で一般式 (VII)

10

20

30

40

50



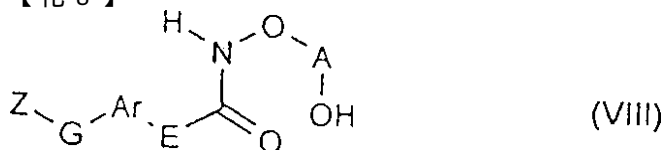
Z-Q-H (VII)

式中、Q及びZは上記の意味を有する、  
の化合物と反応させることを特徴とする、上記方法。

【請求項9】

請求項1記載の一般式(I)のアザジオキサシクロアルケンの製造方法であって、  
一般式(VIII)

【化8】



10

式中、A、Ar、E、G及びZは請求項1に記載の意味を有する、  
のヒドロキシアルコキシアミドを適当ならば希釈剤の存在下で脱水剤を用いて脱水環化反  
応させることを特徴とする、上記方法。

【請求項10】

請求項1記載の式(I)の化合物の殺菌・殺カビ剤としての使用方法。

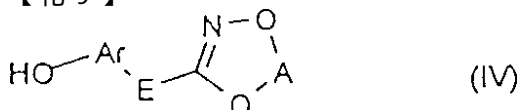
【請求項11】

請求項1記載の式(I)の化合物を増量剤及び/または表面活性物質と混合することを特  
徴とする、殺菌・殺カビ組成物の製造方法。

【請求項12】

一般式(IV)

【化9】



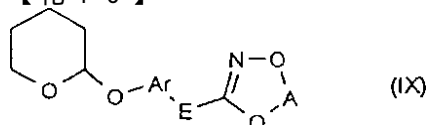
20

式中、A、Ar及びEは請求項1に記載の意味を有する、  
の化合物。

【請求項13】

一般式(IX)

【化10】



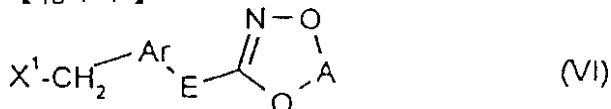
30

式中、A、Ar及びEは請求項1に記載の意味を有する、  
の化合物。

【請求項14】

一般式(VI)

【化11】



40

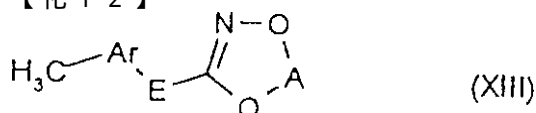
式中、A、Ar及びEは請求項1に記載の意味を有し、そして  
X<sup>1</sup>はハロゲンを表わす、  
の化合物。

【請求項15】

一般式(XIII)



## 【化 1 2】

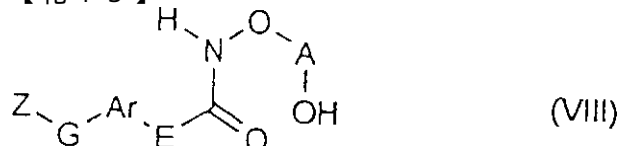


式中、A、Ar 及び E は請求項 1 に記載の意味を有する、  
の化合物。

## 【請求項 1 6】

一般式 (VIII)

## 【化 1 3】



式中、A、Ar、E、G 及び Z は請求項 1 に記載の意味を有する、  
の化合物。

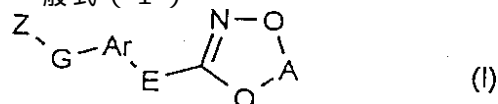
## 【発明の詳細な説明】

本発明は新規な置換されたアザジオキサシクロアルケン、その製造方法、及びその殺菌・  
殺力ビ剤 (fungicides) としての使用に関する。

ある置換された 5, 6 - ジヒドロ - 1, 4, 2 - ジオキサジンが殺菌・殺力ビ特性 (fungicidal properties) を有することは開示されている (特許出願第 0 1 2 2 1 3 7 1 号、Chem. Abstracts 1 1 2 : 9 8 5 6 6 t 引用 ; 特許出願第 0 2 0 0 1 4 8 4、Chem. Abstracts 1 1 3 : 6 2 8 1 y 引用参照)。

しかしながら、これらの化合物には特殊な重要性が得られていない。

一般式 (I)



式中、A は随時置換されていてもよいアルカンジイル (アルキレン) を表わし、  
Ar は各々の場合に随時置換されていてもよいアリーレンまたはヘテロアリーレンを表わし、

E は 2 - 位に基 R<sup>1</sup> を有する 1 - アルケン - 1, 1 - ジイル基、2 - 位に基 R<sup>2</sup> を有する 2 - アザ - 1 - アルケン - 1, 1 - ジイル基、または 1 - 位に基 R<sup>1</sup> を有する 3 - オキサ - もしくは 3 - チア - 1 - プロペン - 2, 3 - ジイル基を表わすか、3 - 位に基 R 及び 1 - 位に基 R<sup>1</sup> を有する 3 - アザ - 1 - プロペン - 2, 3 - ジイル基を表わすか、1 - 位に基 R<sup>2</sup> を有する 1 - アザ - 1 - プロペン - 2, 3 - ジイル基を表わすか、1 - 位に基 R<sup>2</sup> を有する 3 - オキサ - もしくは 3 - チア - 1 - アザ - プロペン - 2, 3 - ジイル基を表わすか、3 - 位に基 R 及び 1 - 位に基 R<sup>2</sup> を有する 1, 3 - ジアザ - 1 - プロペン - 2, 3 - ジイル基を表わすか、或いは随時置換されていてもよいイミノ基 (「アザメチレン」、N - R<sup>3</sup>) を表わし、ここに

R はアルキルを表わし、

R<sup>1</sup> は水素、ハロゲン、シアノまたは各々の場合に随時置換されていてもよいアルキル、  
アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノもしくはジアルキルアミノを表わし、

R<sup>2</sup> は水素、アミノ、シアノまたは各々の場合に随時置換されていてもよいアルキル、  
アルコキシ、アルキルアミノもしくはジアルキルアミノを表わし、そして

R<sup>3</sup> は水素、シアノまたは各々の場合に随時置換されていてもよいアルキル、アルケニル、  
アルキニル、シクロアルキルもしくはシクロアルキルアルキルを表わし、

G は単結合、酸素を表わすか、各々随時ハロゲン、ヒドロキシル、アルキル、ハロゲノアルキルまたはシクロアルキルで置換されていてもよいアルカンジイル、アルケンジイル、  
オキサアルケンジイル、アルキンジイルを表わすか、或いは基

-Q-CQ-, -CQ-Q-, -CH<sub>2</sub>-Q-, -Q-CH<sub>2</sub>-、



-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-Q-CQ-, -Q-CQ-CH<sub>2</sub>-,  
 -Q-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-, -N=N-, -S(O)<sub>n</sub>-, -CH<sub>2</sub>-S(O)<sub>n</sub>-, -CQ-, -S(O)<sub>n</sub>-CH<sub>2</sub>-,  
 -C(R<sup>4</sup>)=N-O-,  
 -C(R<sup>4</sup>)=N-O-CH<sub>2</sub>-, -N(R<sup>5</sup>)-, -CQ-N(R<sup>5</sup>)-,  
 -N(R<sup>5</sup>)-CQ-, -Q-CQ-N(R<sup>5</sup>)-, -N=C(R<sup>4</sup>)-Q-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-O-N=C(R<sup>4</sup>)-,  
 -N(R<sup>5</sup>)-CQ-Q-,  
 -CQ-N(R<sup>5</sup>)-CQ-Q-, -N(R<sup>5</sup>)-CQ-Q-CH<sub>2</sub>-,  
 -CQ-CH<sub>2</sub>-または-N=N-C(R<sup>4</sup>)=N-O-

の1つを表わし、ここに

nは0、1または2の数を表わし、

10

Qは酸素または硫黄を表わし、

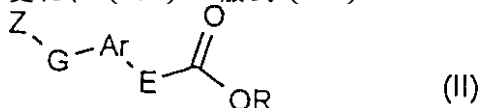
R<sup>4</sup>は水素、シアノを表わすか、或いは各々随時置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノまたシリロアルキルを表わし、そして

R<sup>5</sup>は水素、ヒドロキシル、シアノを表わすか、或いは各々随時置換されていてもよいアルキル、アルコキシまたはシクロアルキルを表わし、そして

Zは各々の場合に随時置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリールまたは複素環式基を表わす、の新規な置換されたアザジオキサシクロアルケンが見い出された。

更に、(a)一般式(II)

20



式中、Ar、E、G及びZは上記の意味を有し、そして

Rはアルキルを表わす、

のカルボン酸誘導体を第1工程で適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下でヒドロキシルアミンまたはそのハロゲン化水素酸塩と反応させ、そして第1工程の生成物をその場で、即ち中間体を単離せずに第2工程で適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下で一般式(III)

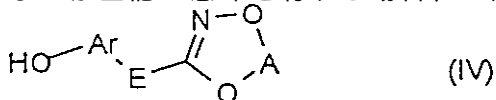
X-A-X (III)

30

式中、Aは上記の意味を有し、そして

Xはハロゲン、アルキルスルホニルオキシまたはアリールスルホニルオキシを表わす、の2置換されたアルカンと反応させるか、

(b)式(I)において、Gが酸素または基-CH<sub>2</sub>-O-を表わし、そしてA、Ar、E及びZが上記の意味を有する場合、一般式(IV)



式中、A、Ar及びEは上記の意味を有する、

のヒドロキシアリール化合物を適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下で一般式(V)

40

Z-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-X (V)

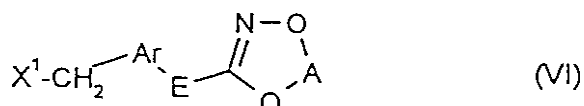
式中、X及びZは上記の意味を有し、そして

mは0または1の数を表わす、

の化合物と反応させ、そして続いて適当ならば置換反応を常法により基Zに対して行うか、

(c)式(I)において、Gが基-Q-CH<sub>2</sub>-を表わし、そしてA、Ar、E及びZが上記の意味を有する場合、一般式(VI)





式中、A、Ar及びEは上記の意味を有し、そして

X<sup>1</sup>はハロゲンを表わす、

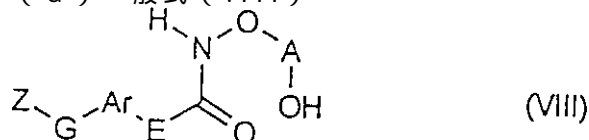
のハロゲノメチル化合物を適当ならば酸受容体の存在下及び適当ならば希釈剤の存在下で一般式(VII)

Z-Q-H (VII)

式中、Q及びZは上記の意味を有する、

の化合物と反応させるか、または

(d)一般式(VIII)



式中、A、Ar、E、G及びZは上記の意味を有する、

のヒドロキシアルコキシアミドを適当ならば希釈剤の存在下で脱水剤を用いて脱水環化反応させる場合に一般式(I)の新規な置換されたアザジオキサシクロアルケンが得られることが見い出された。

最終的に、一般式(I)の新規な置換されたアザジオキサシクロアルカンが極めて強い殺菌・殺力ビ活性を有することが見い出された。

適当ならば、本発明による化合物は種々の可能な異性体形の混合物の状態、殊にE-及びZ-異性体の状態で存在し得る。本発明の請求の範囲のものはE-及びZ-異性体並びにまたこれらの異性体のいずれかの混合物である。

本発明は好ましくはAが随時ハロゲンまたは各々炭素原子1~4個を有するアルキルもしくはハロゲノアルキルで置換されていてもよい炭素原子1~3個を有するアルカンジイルを表わし、Arが各々の場合に随時置換されていてもよいフェニレンまたはナフチレンを表わすか、或いは5または6環の員を有し、その少なくとも1個が酸素、硫黄または窒素を表わし、かつ適当ならば1個または2個の環員が更に窒素を表わすヘテロアリーレンを表わし、ここに可能である置換基はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、各々炭素原子1~6個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル、各々炭素原子2~6個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニル、アルケニルオキシまたはアルキニルオキシ、各々炭素原子1~6個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1~13個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニル、各々炭素原子2~6個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1~13個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシ、各々個々のアルキル部分に炭素原子1~6個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノアルキルまたはアルコキシイミノアルキル、或いは各々炭素原子1~6個を有し、かつ各々随時ハロゲン及び/または炭素原子1~4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル及び/または炭素原子1~4個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1~9個を有するハロゲンアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または多置換されていてもよい各々の場合に2価のアルキレンまたはジオキシアルキレンから選ばれ、Eが基

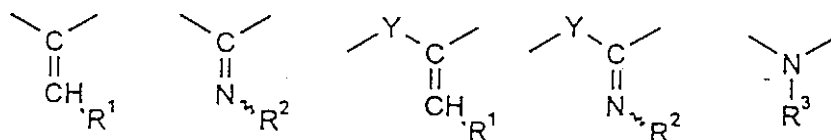
10

20

30

40





の1つを表わし、ここにYが酸素、硫黄、メチレン( $\text{CH}_2$ )またはアルキルイミノ( $\text{N}-\text{R}$ )を表わし、Rが炭素原子1～6個を有するアルキルを表わし、 $\text{R}^1$ が水素、ハロゲン、シアノを表わすか、或いは各々アルキル基中に炭素原子1～6個を有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシで置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノを表わし、 $\text{R}^2$ が水素、アミノ、シアノを表わすか、或いは各々アルキル基中に炭素原子1～6個を有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシで置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノを表わし、そして $\text{R}^3$ が水素、シアノを表わすか、各々炭素原子6個までを有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシで置換されていてもよいアルキル、アルケニルまたはアルキニルを表わすか、或いはシクロアルキル部分に炭素原子3～6個及び適当ならばアルキル部分に炭素原子1～4個を有するシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルを表わし、その際にこれらのシクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルの各々は随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよく、Gが単結合、酸素を表わすか、各々炭素原子4個までを有し、かつ各々随時ハロゲン、ヒドロキシル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -ハロゲノアルキルまたは $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ -シクロアルキルで置換されていてもよいアルカンジイル、アルケンジイル、オキサアルケンジイル、アルキルジイルを表わすか、或いは基

-Q-CQ-、-CQ-Q-、- $\text{CH}_2$ -Q-、-Q- $\text{CH}_2$ -、-CQ-Q- $\text{CH}_2$ -、  
 - $\text{CH}_2$ -Q-CQ-、-Q-CQ- $\text{CH}_2$ -、-Q-CQ-Q- $\text{CH}_2$ -、-N=N-、-S(O) $_n$ -、- $\text{CH}_2$ -S(O) $_n$ -、-CQ-、-S(O) $_n$ - $\text{CH}_2$ -、  
 -C( $\text{R}^4$ )=N-O-、-C( $\text{R}^4$ )=N-O- $\text{CH}_2$ -、-N( $\text{R}^5$ )-、  
 -CQ-N( $\text{R}^5$ )-、-N( $\text{R}^5$ )-CQ-、-Q-CQ-N( $\text{R}^5$ )-、  
 -N=C( $\text{R}^4$ )-Q- $\text{CH}_2$ -、- $\text{CH}_2$ -O-N=C( $\text{R}^4$ )-、-N( $\text{R}^5$ )-CQ-Q-、-CQ-N( $\text{R}^5$ )-CQ-Q-、-N( $\text{R}^5$ )-CQ-Q- $\text{CH}_2$ -、-CQ- $\text{CH}_2$ -  
 または-N=N-C( $\text{R}^4$ )=N-O-

の1つを表わし、ここにnが0、1または2の数を表わし、Qが酸素または硫黄を表わし、 $\text{R}^4$ が水素、シアノを表わすか、各々アルキル基中に炭素原子1～6個を有し、かつ各々随時ハロゲン、シアノまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシで置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノを表わすか、或いは随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよい炭素原子3～6個を有するシクロアルキルを表わし、そして $\text{R}^5$ が水素、ヒドロキシル、シアノを表わすか、随時ハロゲン、シアノまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシで置換されていてもよい炭素原子1～6個を有するアルキルを表わすか、或いは随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよい炭素原子3～6個を有するシクロアルキルを表わし、そしてZが随時ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキルチオ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキルスルフィニルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキルスルホニル(各々随時ハロゲンで置換されていてもよい)で置換されていてもよい炭素原子1～8個を有するアルキルを表わすか、各々炭素原子8個までを有し、かつ各々随時ハロゲンで置換されていてもよいアルケニルまたはアルキニルを表わすか、随時ハロゲン、シアノ、カルボキシル、フェニル(随時ハロゲン、シアノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -ハロゲノアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -ハロゲノアルコキシで置換されていてもよい)、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -アルコキシ-カルボニルで置換されていてもよい炭素原子3～6個を有するシクロアルキルを表わすか、或いは各々の場合に随時置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたは5または6環の員を有し、その少なく

10

20

30

40

50



とも 1 個が酸素、硫黄または窒素を表わし、かつ適当ならば 1 個または 2 個の環員が更に窒素を表わす（随時ベンゾ融合されていてもよい）複素環式基を表わし、ここに他の可能である置換は好ましくは酸素（2 個の対の水素原子に対する置換基として）、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、各々炭素原子 1 ~ 6 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル、各々炭素原子 2 ~ 6 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニルまたはアルケニルオキシ、各々炭素原子 1 ~ 6 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 13 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ、ハロゲノアルキルチオ、ハロゲノアルキルスルフィニルまたはハロゲノアルキルスルホニル、各々炭素原子 2 ~ 6 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 13 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルケニルまたはハロゲノアルケニルオキシ、各々個々のアルキル部分に炭素原子 1 ~ 6 個を有する各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノアルキルまたはアルコキシイミノアルキル、各々炭素原子 1 ~ 6 個を有し、かつ各々随時ハロゲン及び / または炭素原子 1 ~ 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル及び / または炭素原子 1 ~ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 または多置換されていてもよい各々の場合に 2 価のアルキレンまたはジオキシアルキレン、或いは炭素原子 3 ~ 6 個を有するシクロアルキル、各々 3 ~ 7 環の員を有し、各々の場合にその 1 ~ 3 個が同一もしくは相異なるヘテロ原子、殊に窒素、酸素及び / または硫黄である複素環式基または複素環式メチル、並びに各々随時フェニル部分においてハロゲン、シアノ、ニトロ、カルボキシル、カルバモイル及び / または炭素原子 1 ~ 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル及び / または炭素原子 1 ~ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキル及び / または炭素原子 1 ~ 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ及び / または炭素原子 1 ~ 4 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 9 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルコキシ及び / または各々炭素原子 5 個までを有するアルキルカルボニルまたはアルコキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 または多置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、フェニルエチルまたはフェニルエチルオキシから選ばれる式 (I) の化合物に関する。

定義中の飽和もしくは不飽和炭化水素鎖例えばアルキル、アルカンジイル、アルケニルまたはアルキニル、またはヘテロ原子と一緒にあった例えばアルコキシ、アルキルチオまたはアルキルアミノは各々の場合に直鎖状もしくは分枝鎖状である。

ハロゲンは一般にフッ素、塩素、臭素またはヨウ素、好ましくはフッ素、塩素または臭素、殊にフッ素または塩素を表わす。

殊に本発明は A が各々随時フッ素、塩素、メチル、エチルまたはトリフルオロメチルで置換されていてもよいメチレンまたはジメチレン（エタン-1, 2-ジイル）を表わし、Ar が各々の場合に随時置換されていてもよいオルト-、メタ-もしくはパラ-フェニレンを表わすか、或いはフランジイル、チオフエンジイル、ピロールジイル、ピラゾールジイル、トリアゾールジイル、オキサゾールジイル、イソキサゾールジイル、チアゾールジイル、イソチアゾールジイル、オキサジアゾールジイル、チアジアゾールジイル、ピリジンジイル、ピリミジンジイル、ピリダジンジイル、ピラジンジイル、1, 3, 4-トリアジンジイルまたは 1, 2, 3-トリアジンジイルを表わし、ここに可能な置換基は殊にフッ素、塩素、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、メチルスルフィニルまたはメチルスルホニルから選ばれ、E が基

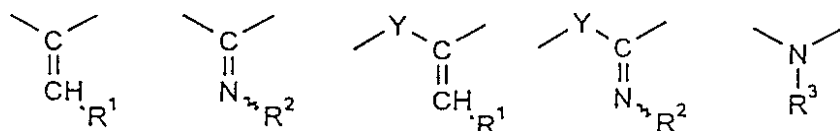
10

20

30

40





の1つを表わし、ここにYが酸素、硫黄、メチレン( $\text{CH}_2$ )またはアルキルイミノ( $\text{N-R}$ )を表わし、Rがメチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピルまたは $n$ -、 $i$ -もしくは $s$ -ブチルを表わし、 $\text{R}^1$ が水素、フッ素、塩素、臭素、シアノを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素、シアノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてもよいメチル、エチル、プロピル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノまたはジメチルアミノを表わし、 $\text{R}^2$ が水素、アミノ、シアノを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素、シアノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてもよいメチル、エチル、メトキシ、エトキシ、メチルアミノ、エチルアミノまたはジメチルアミノを表わし、そして $\text{R}^3$ が水素、シアノを表わすか、各々随時フッ素、シアノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてもよいメチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピルまたは $n$ -、 $i$ -もしくは $s$ -ブチルを表わすか、アリルまたはプロパルギルを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチルまたはシクロヘキシルメチルを表わし、Gが単結合、酸素を表わすか、各々随時フッ素、塩素、ヒドロキシル、メチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルで置換されていてもよいメチレン、ジメチレン(エタン-1,2-ジイル)、エテン-1,2-ジイル、エチン-1,2-ジイルを表わすか、或いは基

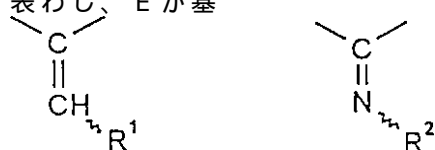
-Q-CQ-, -CQ-Q-, - $\text{CH}_2$ -Q-, -Q- $\text{CH}_2$ -, -CQ-Q- $\text{CH}_2$ -,  
 - $\text{CH}_2$ -Q-CQ-, -Q-CQ- $\text{CH}_2$ -, -Q-CQ-Q- $\text{CH}_2$ -, -N=N-, -S(O) $_n$ -, - $\text{CH}_2$ -S(O) $_n$ -, -CQ-, -S(O) $_n$ - $\text{CH}_2$ -,  
 -C( $\text{R}^4$ )=N-O-, -C( $\text{R}^4$ )=N-O- $\text{CH}_2$ -, -N( $\text{R}^5$ )-,  
 -CQ-N( $\text{R}^5$ )-, -N( $\text{R}^5$ )-CQ-, -Q-CQ-N( $\text{R}^5$ )-,  
 -N=C( $\text{R}^4$ )-Q- $\text{CH}_2$ -, - $\text{CH}_2$ -O-N=C( $\text{R}^4$ )-, -N( $\text{R}^5$ )-CQ-Q-, -CQ-N( $\text{R}^5$ )  
 -CQ-Q-または-N( $\text{R}^5$ )-CQ-Q- $\text{CH}_2$ -

の1つを表わし、ここに $n$ が0、1または2の数を表わし、Qが酸素または硫黄を表わし、 $\text{R}^4$ が水素、シアノを表わすか、各々随時フッ素、塩素、シアノ、メトキシまたはエトキシで置換されていてもよいメチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピル、 $n$ -、 $i$ -もしくは $s$ -ブチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノを表わすか、或いは各々随時フッ素、塩素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピル、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表わし、そして $\text{R}^5$ が水素、ヒドロキシル、シアノを表わすか、各々随時フッ素、塩素、シアノ、カルボキシル、メチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表わし、そしてZが各々随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル(各々随時フッ素及び/または塩素で置換されていてもよい)で置換されていてもよいメチル、エチル、 $n$ -もしくは $i$ -プロピルまたは $n$ -、 $i$ -、 $s$ -もしくは $t$ -ブチルを表わすか、各々随時フッ素、塩素または臭素で置換されていてもよいアリル、クロトニル、1-メチル-アリル、プロパルギルまたは1-メチル-プロパルギルを表わすか、



各々随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、カルボキシル、フェニル（随時フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシで置換されていてもよい）、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、メトキシ-カルボニルまたはエトキシ-カルボニルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表わすか、或いは各々の場合に随時置換されていてもよいフェニル、ナフチル、フリル、テトラヒドロフリル、ベンゾフリル、テトラヒドロピラニル、チエニル、ベンゾチエニル、ピロリル、ジヒドロピロリル、テトラヒドロピロリル、ベンゾピロリル、ベンゾジヒドロピロリル、オキサゾリル、ベンゾキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニルまたは1, 3, 5-トリアジニルを表わし、ここに可能である置換基は各々の場合に好ましくは酸素（2個の対の水素原子に対する置換基として）、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホルミル、カルボキシル、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、メチルアミノ、エチルアミノ、*n*-もしくは*i*-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、アセチル、プロピオニル、アセチルオキシ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチルまたはエトキシイミノエチル；或いは各々随時フッ素、塩素、メチル、エチルまたは*n*-もしくは*i*-プロピルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換で1または多置換されていてもよいトリメチレン（プロパン-1, 3-ジイル）、メチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、或いはシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、並びに各々随時フェニル部分においてフッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、カルボキシル、カルバモイル、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、アセチル、メトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または多置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、ベンジルまたはベンジロキシから選ばれる式（I）の化合物に関する。

殊に好適な本発明による化合物の群はAがジメチレン（エタン-1, 2-ジイル）を表わし、Arがオルト-フェニレン、ピリジン-2, 3-ジイルまたはチオフエン-2, 3-ジイル表わし、Eが基



の1つを表わし、ここにR<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が各々の場合にメトキシを表わし、Gが酸素、メチレン或いは基

-CH<sub>2</sub>-O-、-O-CH<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>n</sub>-、-CH<sub>2</sub>-S(O)<sub>n</sub>-、  
-S(O)<sub>n</sub>-CH<sub>2</sub>-、-C(R<sup>4</sup>)=N-O-、-O-N=C(R<sup>4</sup>)-、  
-C(R<sup>4</sup>)=N-O-CH<sub>2</sub>-、-N(R<sup>5</sup>)-または-CH<sub>2</sub>-O-N=C(R<sup>4</sup>)-

の1つを表わし、ここにnが0、1または2の数を表わし、R<sup>4</sup>が水素、メチルまたはエチルを表わし、そしてR<sup>5</sup>が水素、メチルまたはエチルを表わし、そしてZが各々の場合

10

20

30

40

50

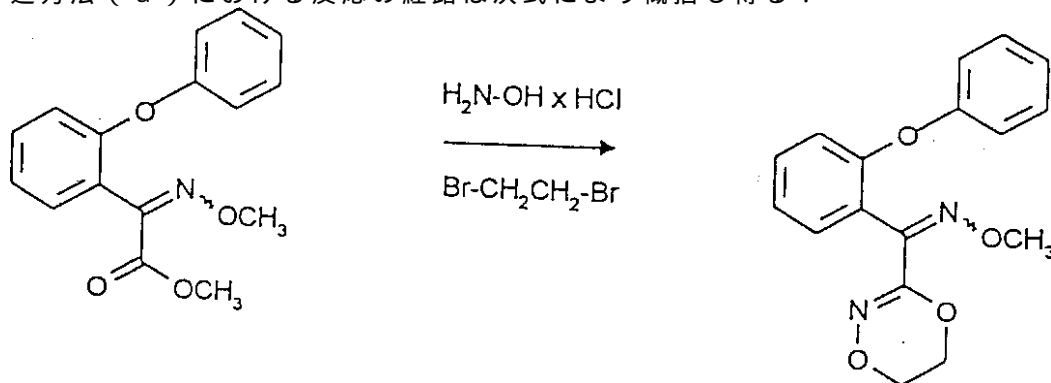


に随時置換されていてもよいフェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニルまたは1, 3, 5-トリアジニルを表わし、ここに可能な置換基は好ましくはフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-もしくは*i*-プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチルまたはエトキシイミノエチル、或いは各々

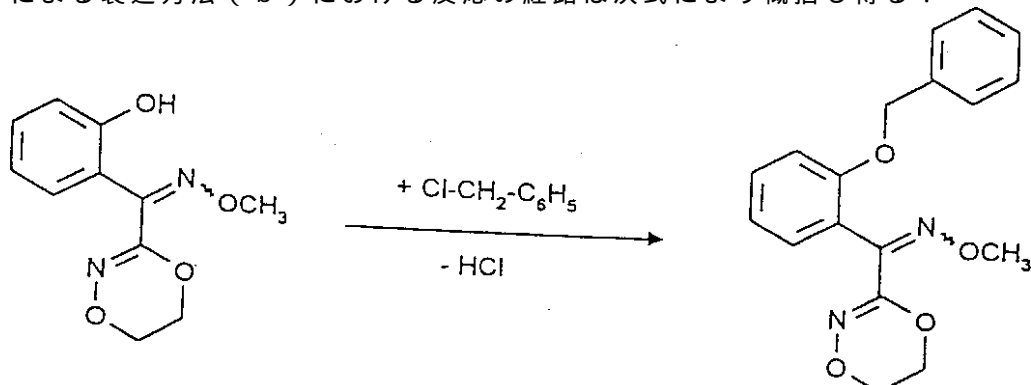
随時フッ素、塩素、メチルまたはエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または多置換されていてもよいメチレンジオキシまたはエチレンジオキシ、並びに各々随時フェニル部分においてフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、*n*-もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-もしくは*t*-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、*n*-もしくは*i*-プロポキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または多置換されていてもよいフェニル、フェノキシ、ベンジルまたはベンジロキシから選ばれる式(I)の化合物である。

上記の一般的な基の定義、または好適な範囲が示されている場合の基の定義は式(I)の最終生成物及び同様に各々の場合にその製造に必要とされる出発物質または中間体に適用される。

これらの基の定義は相互に必要なに応じて結合されることができ、即ち示された好適な化合物の範囲間の組合せも可能である。  
例えば、出発物質として -メトキシイミノ- - (2-フェノキシ-フェニル) 酢酸メチル、ヒドロキシルアミン塩酸塩及び1, 2-ジブromo-エタンを用いる場合、本発明による製造方法(a)における反応の経路は次式により概括し得る：



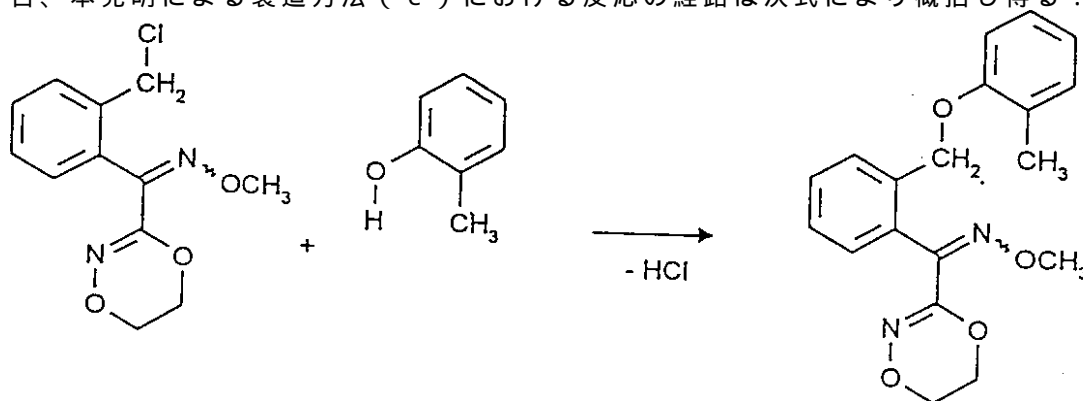
例えば、出発物質として3-[ -メトキシイミノ- - (2-ヒドロキシ-フェニル) -メチル] -5, 6-ジヒドロ-1, 4, 2-ジオキサジン及び塩化ベンジルを用いる場合、本発明による製造方法(b)における反応の経路は次式により概括し得る：



例えば、出発物質として3-[ -メトキシイミノ- - (2-クロロメチル-フェニル) -メチル] -5, 6-ジヒドロ-1, 4, 2-ジオキサジン及び2-メチルフェノールを用いる場

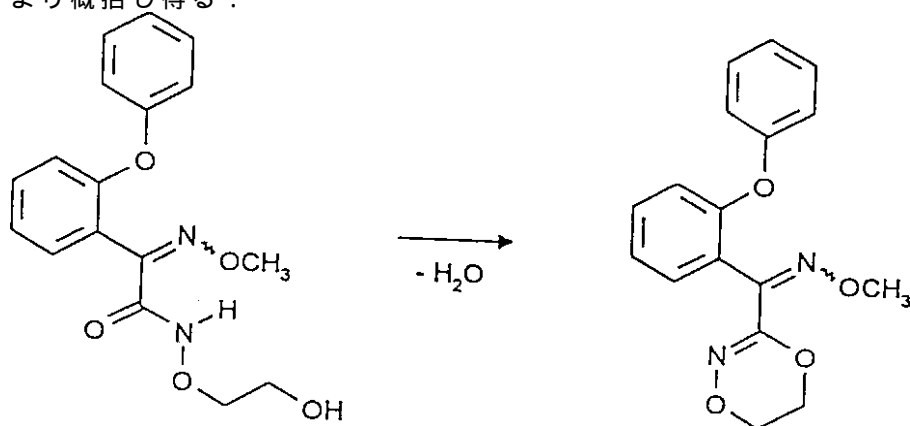


合、本発明による製造方法(c)における反応の経路は次式により概括し得る：



10

例えば、出発物質としてN-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-N-メトキシイミノ-(2-フェノキシ-フェニル)-アセトアミドを用いる場合、本発明による製造方法(d)は次式により概括し得る：



20

式(II)は本発明による方法(a)を行う際に出発物質として必要とされるカルボン酸誘導体の一般的定義を与える。この式(II)において、Ar、E、G及びZは好ましくは、または殊に、Ar、E、G及びZに対して好適か、または殊に好適なものとして本発明による式(I)の化合物の記載に関連して既に挙げられた意味を有し；Rは好ましくは炭素原子1～4個を有するアルキル、殊にメチルまたはエチルを表わす。

30

式(II)の出発物質は公知であり、そして/またはそれ自体公知である方法により製造し得る(ヨーロッパ特許出願公開第178,826号、同第242,081号、同第382,375号、同第493,711号参照)。

式(III)は本発明による方法(a)において出発物質として更に用いられる2置換されたアルカンの一般的定義を与える。式(III)において、Aは好ましくは、または殊に、Aに対して好適か、または殊に好適なものとして本発明による式(I)の化合物の記載に関連して既に与えられた意味を有し；Xは好ましくは塩素、臭素、メチルスルホニルオキシ、フェニルスルホニルオキシまたはトリルスルホニルオキシを表わす。

式(III)の出発物質は有機合成に対して公知の化学薬品である。

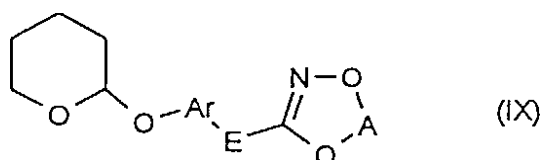
40

式(IV)は一般式(I)の化合物の製造に対する本発明による方法(b)において出発物質として用いられるヒドロキシアリール化合物の一般的定義を与える。式(IV)において、A、Ar及びEは好ましくは、または殊に、A、Ar及びEに対して好適か、または殊に好適なものとして式(I)の化合物の記載に関連して既に上に与えられた意味を有する。

式(IV)の出発物質は従来文献からは未知であり；これらのものは新規物質として本出願の一部のものである。

式(IV)の新規なヒドロキシアリール化合物は一般式(IX)

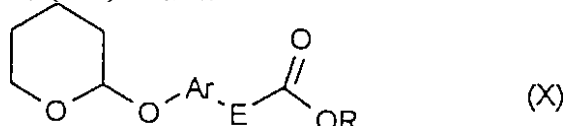




式中、A、Ar 及び E は上記の意味を有する、  
 のテトラヒドロピラニルオキシ化合物を適当ならば希釈剤例えば水、メタノール、エタノールまたは酢酸エチルの存在下にて 0 乃至 100 間の温度で酸例えば塩酸、硫酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、または酸性イオン交換体と反応させる場合に得られる（製造実施例参照）。

式 (IX) のテトラヒドロピラニルオキシ化合物は従来文献からは未知であり；これらのものは新規物質として本出願の一部のものである。

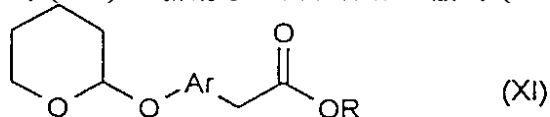
式 (IX) の新規なテトラヒドロピラニルオキシ化合物は一般式 (X)



式中、Ar、E 及び R は上記の意味を有する、  
 のエステルを適当ならば酸受容体例えば水酸化カリウムの存在下及び適当ならば希釈剤例えばメタノール及び水の存在下にてヒドロキシルアミンまたは適当ならばその塩酸塩と反応させ、そして生じる中間体を更にその場で適当ならば酸受容体例えば炭酸カリウムの存在下にて 0 乃至 100 間の温度で上の一般式 (III) のジハロゲノアルカンと反応させる場合に得られる [本発明による方法 (a) の記載及び製造実施例参照]。

式 (X) のエステルは従来文献からは未知であり；これらのものは新規物質として本出願の一部のものである。

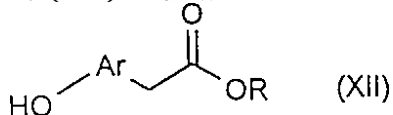
式 (X) の新規なエステルは一般式 (XI)



式中、Ar 及び R は上記の意味を有する、  
 のテトラヒドロピラニルオキシ-フェニル酢酸エステルを常法により誘導体化する場合に得られる（製造実施例参照）。

式 (XI) のテトラヒドロピラニルオキシ-フェニル酢酸エステルは従来文献からは未知であり；これらのものは新規物質として本出願の一部のものである。

式 (XI) の新規なテトラヒドロピラニルオキシ-フェニル酢酸エステルは一般式 (XII)



式中、Ar 及び R は上記の意味を有する、  
 のヒドロキシフェニル酢酸エステルを適当ならば触媒例えば p-トルエンスルホン酸の存在下及び適当ならば希釈剤例えばテトラヒドロフランの存在下にて 0 乃至 100 間の温度でジヒドロピランと反応させる場合に得られる（製造実施例参照）。

式 (XII) の出発物質は合成に対して公知の化学薬品である。

式 (V) は一般式 (I) の化合物の製造に対する本発明による方法 (b) において出発物質として更に用いられる化合物の一般的定義を与える。式 (V) において、Z は好ましくは、または殊に、Z に対して好適か、または殊に好適なものとして式 (I) の化合物の記載に関連して既に挙げられた意味を有し；X は好ましくは塩素、臭素、メチルスルホニルオキシ、フェニルスルホニルオキシまたはトリルスルホニルオキシを表わす。

式 (V) の出発物質は合成に公知の化学薬品である。

式 (VI) は一般式 (I) の化合物の製造に対する本発明による方法 (c) において出発物質として用いるハロゲノメチル化合物の一般的定義を与える。式 (VI) において、A、A

10

20

30

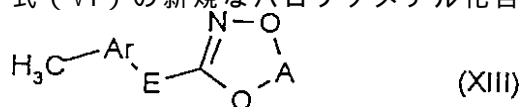
40

50



r 及び E は好ましくは、または殊に、A、Ar 及び E に対して好適か、または殊に好適なものとして式 (I) の化合物の記載に関連して上に既に挙げられた意味を有し；X<sup>1</sup> は好ましくはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素、殊に塩素または臭素を表わす。式 (VI) の出発物質は従来文献から未知であり；これらのものは新規物質として本出願の一部のものである。

式 (VI) の新規なハロゲンメチル化合物は一般式 (XIII)

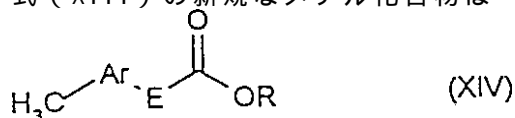


式中、A、Ar 及び E は上記の意味を有する、

のメチル化合物を 0 乃至 150 間の温度で適当ならば触媒例えばアゾイソブチロニトリルの存在下及び適当ならば希釈剤例えばテトラクロロメタンの存在下にてハロゲン化剤例えば N-ブromo-または N-クロロ-スクシンイミドと反応させる場合に得られる（製造実施例参照）。

先駆体として必要とされる式 (XIII) のメチル化合物は従来文献からは未知であり；これらのものは新規物質として本出願の一部のものである。

式 (XIII) の新規なメチル化合物は一般式 (XIV)



式中、A、E 及び R は上記の意味を有する、

のエステルを適当ならば酸受容体例えば水酸化カリウムの存在下及び適当ならば希釈剤例えばメタノールの存在下でヒドロキシルアミンまたはヒドロキシルアミン塩酸塩と反応させ、次に生成物を本発明による方法 (a) と同様に 0 乃至 150 間の温度で適当ならば酸受容体例えば炭酸カリウムの存在下にて上の一般式 (III) の 2 置換されたアルカンと反応させる場合に得られる（製造実施例参照）。

式 (XIV) の先駆体は公知であり、そして / またはそれ自体公知である方法により製造し得る（ヨーロッパ特許出願公開第 386,561 号、同第 498,188 号、製造実施例参照）。

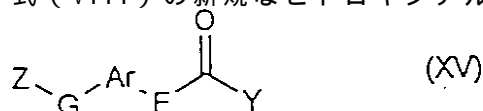
式 (VII) は一般式 (I) の化合物の製造に対する本発明による方法 (c) において出発物質として更に用いられる化合物の一般的定義を与える。式 (VII) において、Q 及び Z は好ましくは、または殊に、Q 及び Z に対して好適か、または殊に好適なものとして式 (I) の化合物の記載に関連して既に上に与えられた意味を有する。

式 (VII) の出発物質は有機合成に対して公知の化学薬品である。

式 (VIII) は一般式 (I) の化合物の製造に対する本発明による方法 (d) において出発物質として用いられるヒドロキシアлкоキシアミドの一般的定義を与える。式 (VIII) において、A、Ar、E、G 及び Z は好ましくは、または殊に、A、Ar、E、G 及び Z に対して好適か、または殊に好適なものとして式 (I) の化合物の記載に関連して既に上に与えられた意味を有する。

式 (XIII) の出発物質は従来文献からは未知であり；これらのものは新規物質として本出願の一部のものである。

式 (VIII) の新規なヒドロキシアлкоキシアミドは一般式 (XV)



式中、Ar、E、G 及び Z は上記の意味を有し、そして

Y はハロゲン、ヒドロキシルまたはアルコキシを表わす、

のカルボン酸誘導体を 0 乃至 150 間の温度で、適当ならば酸受容体例えばトリエチルアミン、ピリジンまたは 4-ジメチルアミノ-ピリジンの存在下及び適当ならば希釈剤例えば塩化メチレン、トルエンまたはテトラヒドロフランの存在下にて一般式 (XVI)

10

20

30

40

50



$\text{H}_2\text{N}-\text{O}-\text{A}-\text{OH}$  (XVI)

式中、Aは上記の意味を有する、

のヒドロキシルアミンと反応させる場合に得られる(製造実施例参照)。

先駆体として必要とされる式(XV)のカルボン酸誘導体は公知であり、そして/またはそれ自体公知である方法により製造し得る(ヨーロッパ特許出願公開第178,826号、同第242,081号、同第382,375号、同第493,711号参照)。

また先駆体として更に必要とされる式(XVI)のヒドロキシルアミンは公知であり、そして/またはそれ自体公知である方法により製造し得る(J. Chem. Soc. Perkin Trans. I 1987, 2829~2832参照)。

本発明による方法(a)、(b)及び(c)は好ましくは適当な酸受容体の存在下で行う。適当な酸受容体は全ての通常の無機または有機塩基である。これらのものには例えばアルカリ土金属またはアルカリ金属の水素化物、水酸化物、アミド、アルコール、酢酸塩、炭酸塩または炭酸水素塩例えば水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウムt-ブチラート、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化アンモニウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、酢酸アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウムまたは炭酸アンモニウム、及びまた第3級アミン例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチル-ベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビスクロオクタン(DABCO)、ジアザビスクロノネン(DBN)またはジアザビスクロウンデセン(DBU)が含まれる。 10

本発明による方法(a)、(b)及び(c)を行う際に適する希釈剤は水及び有機溶媒である。これらのものには殊に脂肪族、脂環式または芳香族の、随時ハロゲン化されていてもよい炭化水素例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、エーテル例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランまたはエチレングリコールジメチルエーテルもしくはエチレングリコールジエチルエーテル；ケトン例えばアセトン、ブタノンまたはメチルイソブチルケトン；ニトリル例えばアセトニトリル、プロピオニトリルまたはベンゾニトリル；アミド例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル例えば酢酸メチルまたは酢酸エチル、スルホキシド例えばジメチルスルホキシド、アルコール例えばメタノール、エタノール、n-もしくはi-プロパノール、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、その水との混合物、または純粋な水が含まれる。 30

本発明による方法(d)は好ましくは脱水剤の存在下で行う。適当な脱水剤には通常の脱水化学薬品、殊に酸無水物例えば酸化リン(V)(五酸化リン)がある。

本発明による方法(d)を行う際に適する希釈剤は通常の不活性有機溶媒である。これらのものには殊に脂肪族、脂環式または芳香族の、随時ハロゲン化されていてもよい炭化水素例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、石油エーテル、ヘキサン、シクロヘキサン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素；エーテル例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランまたはエチレングリコールジメチルエーテルもしくはエチレングリコールジエチルエーテル；ケトン例えばアセトン、ブタノンまたはメチルイソブチルケトン；ニトリル例えばアセトニトリル、プロピオニトリルまたはベンゾニトリル；アミド例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル例えば酢酸メチルまたは酢酸エチル、スルホキシド例えばジメチルスルホキシドが含まれる。 40

本発明による方法(a)、(b)、(c)及び(d)を行う場合、反応温度は実質的な範 50



圈内で変え得る。一般に、本法は - 20 乃至 200 間、好ましくは 0 乃至 150 間の温度で行う。

本発明による方法 (a) を行う際に、式 (II) のカルボン酸誘導体 1 モル当たり一般に 1 ~ 5 モル、好ましくは 1.0 ~ 2.5 モルのヒドロキシルアミンまたはヒドロキシルアミン塩酸塩及び一般に 1 ~ 10 モル、好ましくは 1.0 ~ 5.0 モルの式 (III) の 2 置換されたアルカンを用いる。

本発明による方法 (b) を行う際に、式 (IV) のヒドロキシアリール化合物 1 モル当たり一般に 0.5 ~ 2.0 モル、好ましくは 0.9 ~ 1.2 モルの式 (V) の化合物を用いる。

本発明による方法 (c) を行う際に、式 (IV) のハロゲン化合物 1 モル当たり一般に 1 ~ 5 モル、好ましくは 1.5 ~ 3 モルの式 (VII) の化合物を用いる。

本発明による方法 (d) を行う際に、式 (VIII) のヒドロキシアルコキシアミド 1 モル当たり一般に 1 ~ 5 モル、好ましくは 1.5 ~ 4 モルの脱水剤を用いる。

反応を行い、そして反応生成物を各々の場合に公知の方法により単離し、そして処理する (製造実施例参照)。

本発明による活性化合物は強い殺微生物活性 (microbicidal activity) を示し、そして実際に望ましくない微生物を防除するために用いることができる。本活性化合物は植物保護剤、殊に殺菌・殺カビ剤 (fungicides) としての用途に適している。植物保護の殺菌・殺カビ剤はプラスモジオフオロミセテス (Plasmodiophoromycetes)、卵菌類 (Oomycetes)、チトリジオミセテス (Chytridiomycetes)、接合菌類 (Zygomycetes)、嚢子菌類 (Ascomycetes)、担子菌類 (Basidiomycetes)、及び不完全菌類 (Deuteromycetes) を防除する際に用いられる。

上記の主な属名に含まれる菌・カビ病のある原因生物を非限定例として下に挙げる：ピチウム (Pythium) 種例えば苗立枯病 (Pythium ultimum)；フィトフトラ (Phytophthora) 種例えば疫病 (Phytophthora infestans)；プソイドペロノスポラ (Pseudoperonospora) 種例えばべと病 (Pseudoperonospora humuliまたはPseudoperonospora cubense)；プラスモパラ (Plasmopara) 種例えばべと病 (Plasmopara viticola)；ペロノスポラ (Peronospora) 種例えばべと病 (Peronospora pisiまたはPeronospora brassicae)；エリシフェ (Erysiphe) 種例えばうどんこ病 (Erysiphe graminis)；スフェロテカ (Sphaerotheca) 種例えばうどんこ病 (Sphaerotheca fuliginea)；ポドスフェラ (Podosphaera) 種例えばうどんこ病 (Podosphaera leucotricha)；ベンチュリア (Venturia) 種例えば黒星病 (Venturia inaequalis)；ピレノフォラ (Pyrenophora) 種例えば網斑病 (Pyrenophora teresまたはPyrenophora graminea) (分生孢子器状：Drechslera、同義：Helminthosporium)；コクリオボルス (Cochliobolus) 種例えば斑点病 (Cochliobolus sativus)；(分生孢子状：Drechslera、同義：Helminthosporium)；ウロマイセス (Uromyces) 種例えばさび病 (Uromyces appendiculatus)；プシニア (Puccinia) 種例えば赤さび病 (Puccinia recondita)；ティレティア (Tilletia) 種例えば網なまぐさ黒穂病 (Tilletia caries)；ウスティラゴ (Ustilago) 種例えば裸黒穂病 (Ustilago nudaまたはUstilago avenae)；ペリキュラリア (Pellicularia) 種例えば紋枯病 (Pellicularia sasakii)；ピリキュラリア (Pyricularia) 種例えばいもち病 (Pyricularia oryzae)；フーザリウム (Fusarium) 種例えばフーザリウム・クルモルム (Fusarium culmorum)；ボツリティス (Botrytis) 種例えば灰色かび病 (Botrytis cinerea)；セプトリア (Septoria) 種例えばふ枯病 (Septoria nodorum)；レプトスフェリア (Leptosphaeria) 種例えばレプトスフェリア・ノドルム (Leptosphaeria nodorum)；セルコスボラ (Cercospora) 種例えばセルコスボラ・カネセンス (Cercospora canescens)；アルテルナリア (Alternaria) 種例えば黒斑病 (Alternaria brassicae) 及びプソイドセルコスボレラ (Pseudocercospora) 種例えばプソイドセルコスボレラ・ヘルポトリコイデス (Pseudocercospora herpotrichoides)。

植物の病気を防除する際に必要な濃度で、本活性化合物の植物による良好な許容性があるために、植物の地上部分、生長増殖茎及び種子、並びに土壌の処理が可能である。

これに関し、本発明による活性化合物は果物及び野菜作物における病気例えばフィトフト

10

20

30

40

50



ラ(Phytophthora)種を防除するか、または穀物の病気例えばピレノフォラ(Pyrenophora)種を防除する際に殊に良好に使用し得る。

加えて、本発明による活性化合物は例えば穀物におけるうどんこ病(Erysiphe graminis)、斑点病(Cochliobolus sativus)、レプトスフェリア・ノドルム(Leptosphaeria nodorum)、ブソイドセルコスボレク・ヘルボトリコイデス(Pseudocercospora herpotrichoides)及びフーザリウム(Fusarium)種、イネにおけるいもち病(Pyricularia oryzae)及び紋枯病(Pellicularia sasakii)に対する良好な活性、並びに広い試験管内活性を有する。

。その特殊な物理的及び/または化学的特性に依存して、本活性化合物は普通の組成物例えば、溶液、乳液、懸濁剤、粉末、包沫剤、塗布剤、顆粒、エアロゾル、種子用の重合物質中の極く細かいカプセル及びコーティング組成物、並びにULV冷ミスト及び温ミスト組成物に変えることができる。

10

これらの組成物は公知の方法において、例えば活性化合物を伸展剤、即ち液体溶媒、圧力下での液化ガス及び/または固体の担体と随時表面活性剤、即ち乳化剤及び/または分散剤及び/または発泡剤と混合して製造される。また伸展剤として水を用いる場合、例えば補助溶媒として有機溶媒を用いることもできる。液体溶媒として、主に、芳香族炭化水素例えばキシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン、塩素化された芳香族もしくは塩素化された脂肪族炭化水素例えばクロロベンゼン、クロロエチレンもしくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素例えばシクロヘキサン、またはパラフィン例えば鉱油留分、アルコール例えばブタノールもしくはグリコール並びにそのエーテル及びエステル、ケトン例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノン、強い有極性溶媒例えばジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド並びに水が適している；液化した気体の伸展剤または担体とは、常温及び常圧では気体である液体を意味し、例えばハロゲン化された炭化水素並びにブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素の如きエアロゾル噴射基剤である；固体の担体として、粉碎した天然鉱物、例えばカオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モントモリロナイト、またはケイソウ土並びに粉碎した合成鉱物例えば高度分散性シリカ、アルミナ及びシリケートが適している；粒剤に対する固体の担体として、粉碎し且つ分別した天然岩、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石及び白雲石並びに無機及び有機のひきわり合成顆粒及び有機物質の顆粒例えばおがくず、やしがら、トウモロコシ穂軸及びタバコ茎が適している；乳化剤及び/または発泡剤として非イオン性及び陰イオン性乳化剤例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪族アルコールエーテル例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリアルスルホネート並びにアルブミン加水分解生成物が適している；分散剤として、例えばリグニン・スルファイト廃液及びメチルセルロースが適している。

20

30

接着剤例えばカルボキシメチルセルロース並びに粉状、粒状またはラテックス状の天然及び合成重合体例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリビニルアセテート並びに天然リン脂質例えばセファリン及びレシチン、及び合成リン脂質を組成物に用いることができる。更に添加物は鉱油及び植物油であることができる。

着色剤例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びブルシアンプルー並びに有機染料例えばアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、及び微量の栄養剤例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩を用いることができる。調製物は一般に活性化合物0.1乃至95重量%間、好ましくは0.5乃至90重量%間を含有する。

40

本発明による活性化合物はそのまま、またその調製物の状態で、作用のスペクトルを広げるか、または耐性の発展を防止するために公知の殺菌・殺力ビ剤、殺バクテリア剤(bactericides)、殺ダニ剤(acaricides)、殺線虫剤(nematicides)または殺虫剤との混合物の状態で使用し得る。多くの場合が得られ、即ち混合物の活性が個々の成分の活性を越える。

混合物中の殊に有利な成分は例えば次の化合物である：

50



## 殺菌・殺カビ剤：

2 - アミノブタン；2 - アニリノ - 4 - メチル - 6 - シクロプロピル - ピリミジン；2  
 , 6 - ジブromo - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 - トリフルオロ - メ  
 チル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド；2 , 6 - ジクロロ - N - ( 4 - ト  
 リフルオロメチルベンジル ) - ベンズアミド；( E ) - 2 - メトキシイミノ - N - メチル  
 - 2 - ( 2 - フェノキシフェニル ) - アセトアミド；硫酸 8 - ヒドロキシキノリン；( E )  
 - 2 - { 2 - [ 6 - ( 2 - シアノフェノキシ ) - ピリミジン - 4 - イルオキシ ] フェニ  
 ル } - 3 - メトキシアクリル酸メチル；( E ) - メトキシイミノ [ アルファ - ( o - トリ  
 ルオキシ ) - o - トリル ] 酢酸メチル；2 - フェニルフェノール ( OPP )、アルジモル  
 フ、アムプロピルフォス、アニラジン、アザコナゾール、ベナラキシル、ベノダニル、ベ  
 ノミル、ピナバクリル、ピフェニル、ピテルタノール、プラスチシジン - S、プロムコナ  
 ザール、ブピリメート、ブチオベート、カルシウムポリスルフィド、カブタフォル、カブ  
 タン、カルベンダジム、カルボキシン、キノメチオネート、クロロネブ、クロロピクリン  
 、クロロタロニル、クロゾリネート、クフラネブ、シモキサニル、シプロコナゾール、シ  
 プロフラム、ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロフルアニド、ジクロメジン、  
 ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジメチリモル、ジメトモルフ、  
 ジニコナゾール、ジノカップ、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジタリムフォス、ジチ  
 アノン、ドジン、ドラゾキソロン、エディフェンフォス、エポキシコナゾール、エチリモ  
 ル、エトリジアゾール、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェニトロ  
 パン、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、酢酸フェンチン、フェ  
 ンチンヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキソニル、  
 フルオロミド、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルトラニル  
 、フルトリアフォル、フォルベット、フォセチル - アルミニウム、フタリド、フベリダゾ  
 ール、フララキシル、フルメシクロックス、グアザチン、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサ  
 コナゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イブ  
 ロベンフォス ( IBP )、イブロジオン、イソプロチオラン、カスガマイシン、銅調製物  
 例えば水酸化銅、ナフテン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシ - 銅及びボル  
 ドー混合物、マンカップ、マンコゼブ、マネブ、メパニピリム、メプロニル、メタラキ  
 シル、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メトフロキサム、メチラム、メトスルホバッ  
 クス、ミクロブタニル、ニッケルジメチルジチオカルバメート、ニトロタル - イソプロピ  
 ル、ヌアリモル、オフレース、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキシカルボキシン、  
 ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、フォスジフェン、ピマリシン、ピペラ  
 リン、ポリオキシシン、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、  
 プロピコナゾール、プロピネブ、ピラゾフォス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロ  
 キロン、キントゼン ( PCNB )、硫黄及び硫黄調製物、テブコナゾール、テクロフタラ  
 ム、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チシオフエン、チオファネート  
 - メチル、チラム、トルクロフォス - メチル、トリルフルアニド、トリアジメフォン、トリ  
 アジメノール、トリアゾキシド、トリクラミド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリ  
 フルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、バリダマイシン A、ピンクロゾリン、  
 ジネブ、ジラム。

## 殺バクテリア剤：

プロノボル、ジクロロフェン、ニトラピリン、ニッケルジメチルジチオカルバメート、カ  
 スガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾ  
 ール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅調製物。

## 殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤：

アバメクチン、アセフェート、アクリナトリン、アラニカルブ、アルジカルブ、アルファ  
 メトリン、アミトラズ、アベルメクチン、AZ 60541、アザジラクチン、アジンフ  
 オス A、アジンフォス M、アゾサイクロチン、バシルス・ツリンジエンシス ( *Bacillus*  
*thuringiensis* )、4 - ブロモ - 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 1 - ( エトキシメチル ) - 5 - (   
 トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニトリル、ベンジオカルブ、ベンフラ

10

20

30

40

50



カルブ、ペンシルタップ、ベタシルトリン、ピフェントリン、BPMC、プロフェンブ  
 ロックス、プロモフォスA、プフェンカルブ、ブプロフェジン、ブトカルボキシ  
 シン、ブチル  
 ピリダベン、カズサフォス、カルバリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カルボス  
 ルファン、カータップ、クロエトカルブ、クロエトキシフォス、クロルフェンピンフォ  
 ス、クロルフルアズロン、クロルメフォス、N-[ (6-クロロ-3-ピリジニル) -メチル ] -  
 N -シアノ-N-メチル-エタンイミドアミド、クロルピリフォス、クロルピリフォスM、  
 シス-レスメトリン、クロシトリン、クロフェンテジン、シアノフォス、シクロプロトリ  
 ン、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シペルメトリン、シロマジ  
 ン、デルタ  
 メトリン、デメトンM、デメトンS、デメトン-S-メチル、ジアフェンチウロン、ジ  
 ア  
 ジノン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス、ジクリフォス、ジクロトフォス、ジエチ  
 オン、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジメチルピンフォス、ジオキサチオン、ジスルホ  
 トン、エジフェンフォス、エマメクチン、エスフェンバレレート、エチオフェンカルブ、  
 エチ  
 オン、エトフェンブロックス、エトプロフォス、エトリムフォス、フェナミフォス、  
 フェ  
 ナザキン、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノチ  
 オカルブ、フェノキシカルブ、フェンブプロパトリン、フェンピラド、フェンピロキシメ  
 ー  
 ト、フェンチオン、フェンチオン、フェンバレレート、フィプロニル、フルアジナム、フ  
 ル  
 アズロン、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルフェノクスロン、フルフェ  
 ン  
 ブロクス、フルバリネート、フォノフォス、フォルモチオン、フォスチアゼート、フブ  
 フェ  
 ンブロクス、フラチオカルブ、HCH、ヘプテノフォス、ヘキサフルムロン、ヘキシチ  
 ア  
 ゾックス、イミダクロプリド、イプロベンフォス、イサゾフォス、イソフェンフォス、  
 イ  
 ソプロカルブ、インキサチオン、イベルメクチン、ラムダ-シハロトリン、ルフェヌロ  
 ン、マ  
 ラチオン、メカルバム、メルピンフォス、メスルフェンフォス、メタアルデヒド、  
 メ  
 タアクリフォス、メタアミドフォス、メチダチオン、メチオカルブ、メトミル、メトル  
 カ  
 ルブ、ミルベメクチン、モノクロトフォス、モキシデクチン、ナレド、NC 184、  
 ニ  
 テンピラム、オメトエート、オキサミル、オキシデメトンM、オキシデプロフォス、パ  
 ラ  
 チオンA、パラチオンM、パーメトリン、フェントエート、フォレート、フォサロン、  
 フ  
 オスメット、フォスファミロン、フォキシム、ピリミカルブ、ピリミフォスM、ピリミ  
 フ  
 オスA、プロフェノフォス、プロメカルブ、プロパフォス、プロボクスル、プロチオ  
 フ  
 オス、プロチオホス、プロトエート、ピメトロジン、ピラクロフォス、ピラダフェンチ  
 オ  
 ン、ピレスメトリン、ピレトラム、ピリダベン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、  
 キ  
 ナルフォス、サリチオン、セブフォス、シラフルオフェン、スルフォテップ、スルプロ  
 フ  
 オス、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムフォス、テフルベンズロン、テ  
 フ  
 ルトリン、テメフォス、テルバム、テルブフォス、テトラクロルピンフォス、チアフェ  
 ノ  
 ックス、チオジカルブ、チオフアノックス、チオメトン、チオナジン、ツリンジエンシ  
 ン、ト  
 ラロメトリン、トリアラテン、トリアゾフォス、トリアズロン、トリクロルフオン  
 、ト  
 リフルムロン、トリメタカルブ、バミドチオン、XMC、キシリルカルブ、YI 5  
 3  
 01/5302、ゼータメトリン。

他の公知の活性化合物例えば除草剤または肥料及び生長調節剤との混合物も可能である。  
 本活性化合物はそのまま、その調製物の形態或いは該調製物から調製した使用形態、例  
 えば調製済液剤、懸濁剤、「S p r i t z」水和剤、塗布剤、可溶性粉剤、粉剤及び粒剤  
 の  
 形態で使用することができる。これらのものは普通の方法において、例えば液剤散布、  
 ス  
 プレー、アトマイジング、粒剤散布、粉剤散布、フォーミング(foaming)、はけ塗り  
 等  
 によって施用される。更に、超低容量法に従って活性化合物を施用するか、或いは活性  
 化  
 合物の調製物または活性化合物自体を土壤中に注入することができる。また植物の種子  
 を  
 処理することもできる。

植物の部分进行处理する場合、施用形態における活性化合物濃度は実質的な範囲内で変える  
 こ  
 とができる。

一般に濃度は1乃至0.0001重量%、好ましくは0.5乃至0.001重量%間であ  
 る。

種子を処理する際には、一般に種子1kg当り0.001~50g、好ましくは0.01

10

20

30

40

50

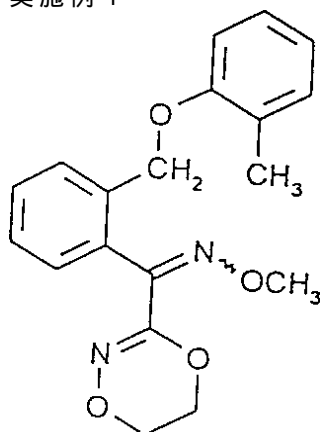


～ 10 g の活性化合物を必要とする。

土壌を処理するには、作用場所に 0.00001 ～ 0.1 重量%、好ましくは 0.0001 ～ 0.02 重量% の活性化合物濃度を必要とする。

製造実施例：

実施例 1



10

ヒドロキシアミン塩酸塩 1.8 g (25 ミリモル) を 20 でメタノール 20 ml 中に導入し、そしてメタノール 20 ml 中の水酸化カリウム (80%) 3.3 g の溶液を徐々に加えた。続いて -メトキシイミノ- -[2-(2-メチルフエノキシ-メチル)-フェニル]-酢酸メチル 4.0 g (12.8 ミリモル) を一部ずつ加え、次に反応混合物を反応が終了するまで (薄層クロマトグラフィー) 40 で攪拌した。次に最初に炭酸カリウム 1.7 g (12.8 ミリモル)、続いて 1,2-ジブromo-エタン 10.8 g (59 ミリモル) を反応混合物に加えた。次に混合物を 65 で 12 時間攪拌し、続いて 20 に冷却し、そして濾過した。濾液を水流ポンプの真空下で濃縮し、そして残渣をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー (トルエン/アセトン、9:1 容量) により精製した。

20

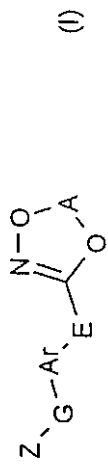
3-{[2-(2-メチルフエノキシ-メチル)-フェニル]-メチル}-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン 1.4 g (理論値の 33%) が得られた。

融点: 110

実施例 1 と同様に、そして本発明による製造方法の一般的記述に従って製造し得る他の式 (I) の例は下の表 1 に示すものである。

30



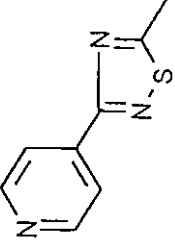
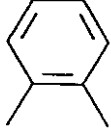
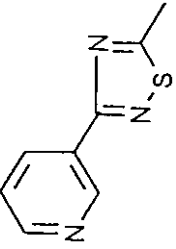
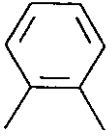
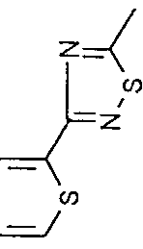
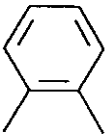
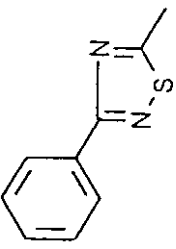
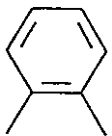


<sup>1</sup>N NMRスペクトルは内標準としてテトラメチルシランを用いてCDCl<sub>3</sub>中で記録した。示されるデータは一般にδ値としての化学シフトである。

表1： 式(I)の化合物の例

実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
2					CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 2,25; 3,95; 4,05-4,51; 5,15; 7,0-7,68 ppm
3					CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 2,23; 2,25; 3,98; 4,1- 4,52; 7,05-7,55 ppm



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
4		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C} \begin{smallmatrix} \diagup \\ \diagdown \end{smallmatrix}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
5		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C} \begin{smallmatrix} \diagup \\ \diagdown \end{smallmatrix}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
6		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C} \begin{smallmatrix} \diagup \\ \diagdown \end{smallmatrix}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
7		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C} \begin{smallmatrix} \diagup \\ \diagdown \end{smallmatrix}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

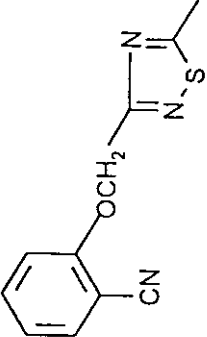
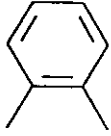
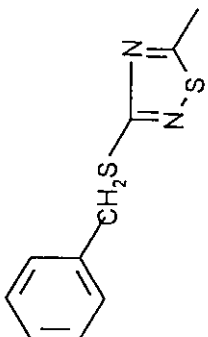
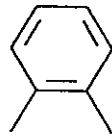
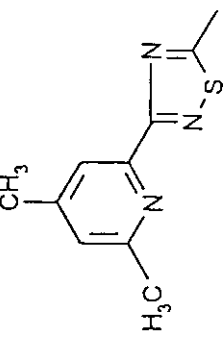
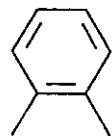
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
8		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C} \begin{smallmatrix} \diagup \\ \diagdown \end{smallmatrix}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
9		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C} \begin{smallmatrix} \diagup \\ \diagdown \end{smallmatrix}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
10		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C} \begin{smallmatrix} \diagup \\ \diagdown \end{smallmatrix}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

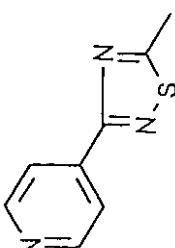
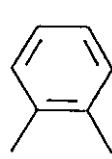

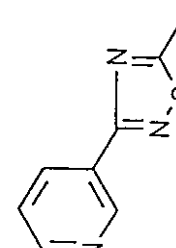
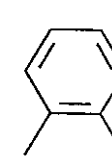

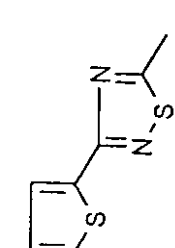
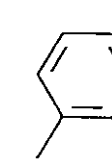

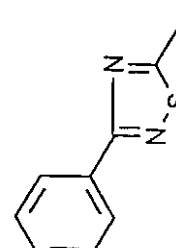
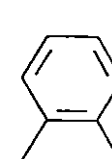

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
11		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点: 138°C
12		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点: 65°C
13		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ (非晶性) $^1\text{H-NMR}$ : ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.75$ (s, 3H)	
14		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点: 70°C

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
15		O		CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	油 <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ = 3.80 (s, 3H)
16		SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
17		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
18		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	非晶性 <sup>1</sup> H-NMR: 1.55; 3.97; 4.16; 4.48; 5.03; 7.08- 7.51 ppm

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
19		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 129°C
20		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	(非晶性) <sup>1</sup> H-NMR: 2,24; 2,28; 3,99; 4,15; 4,46; 4,98; 6,62-7,59 ppm
21		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
22		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 123°C

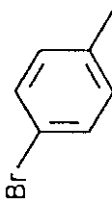
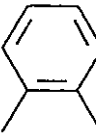

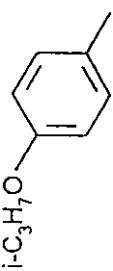
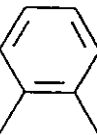
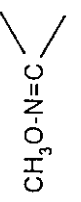
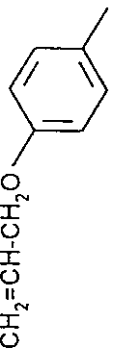
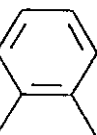
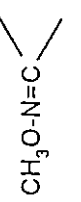
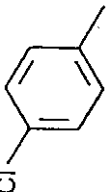
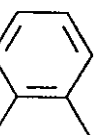
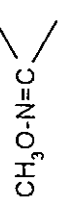
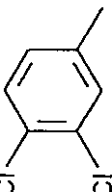
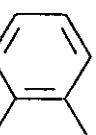
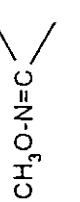
10

20

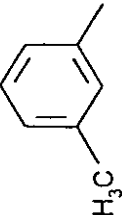
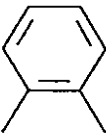

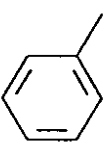
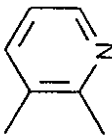

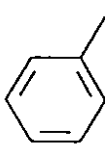


30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
23		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	10
24		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	20
25		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
26		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
27		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
28		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
29		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
30		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	油

10

20

30

40



物理データ

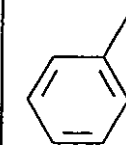
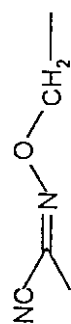
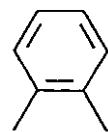
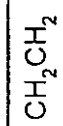
A

E

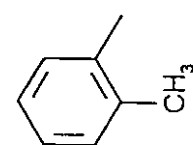
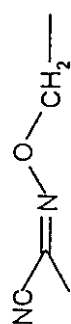
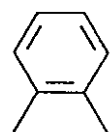
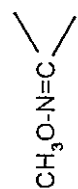
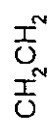
Ar

G

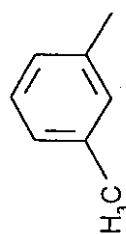
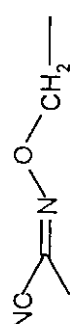
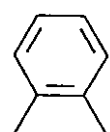
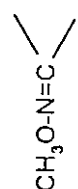
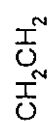
Z

実施例  
No.

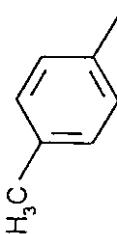
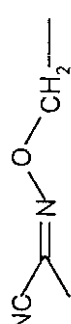
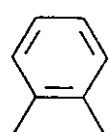
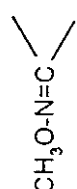
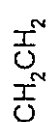
31



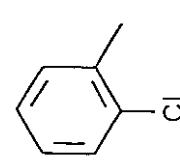
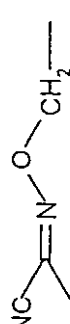
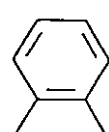
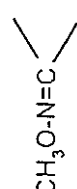
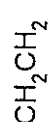
32



33



34



35

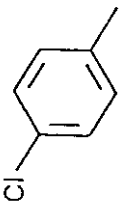
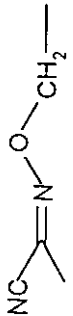
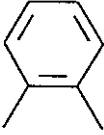
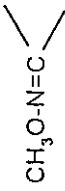
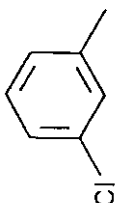
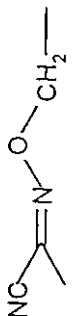
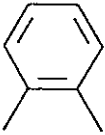

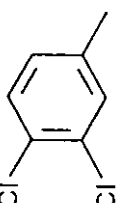
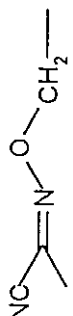
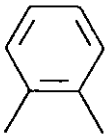
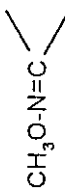
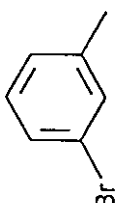
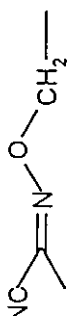
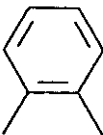
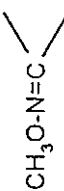
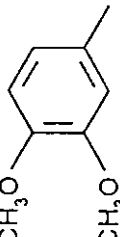
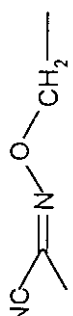
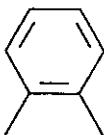
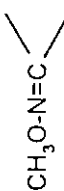
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
36				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
37				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
38				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
39				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
40				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
						10
						20
						30
						40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
41				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
42				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
43				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
44				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
45				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

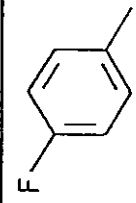
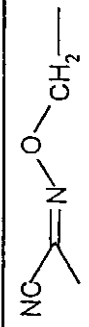
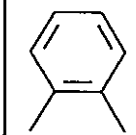

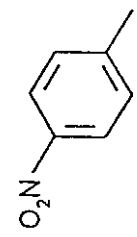
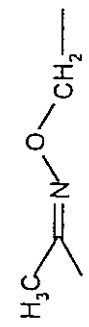
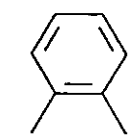

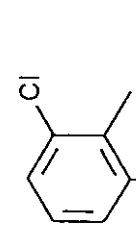
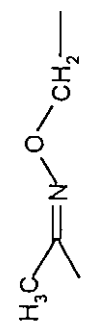
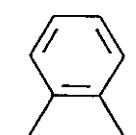

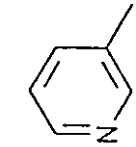
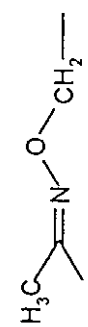
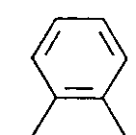

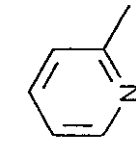
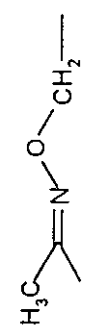
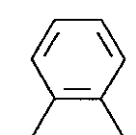

10

20

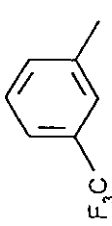
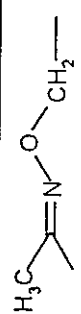
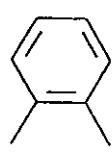
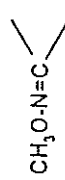
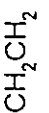
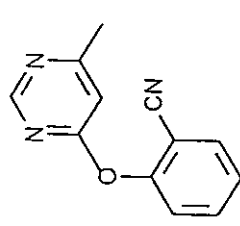

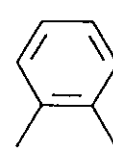
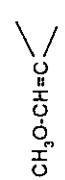
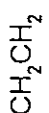
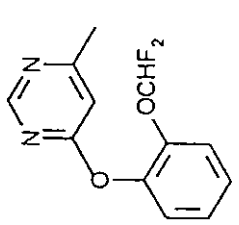

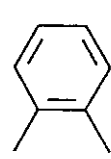
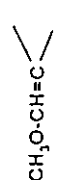
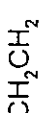
30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
46				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
47				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
48				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
49				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
50				$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
						10
						20
						30
						40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
51						$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , $\delta$ ): 2,26 (3H); 3,96 (3H); 4,1-4,2 (2H); 4,4-4,5 (2H); 5,204 (2H); 7,0-8,0 (8H) ppm
52						
53						

10

20

30

40



## 物理データ

A

E

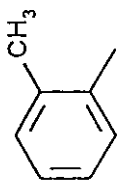
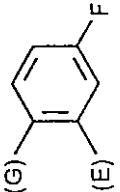
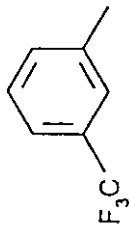
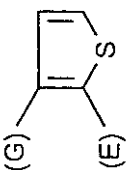
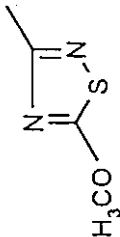
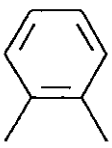
Ar

G

Z

実施例

No.

54		-OCH <sub>2</sub> -	(G)		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 2,30 (3H); 3,98 (3H); 4,1-4,2 (2H); 4,4-4,5 (2H); 4,97 (2H); 6,4-7,4 (7H) ppm
55		CH <sub>3</sub>   -C=N-O-CH <sub>2</sub> -	(G)		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> , δ): 2,25 (3H); 4,0 (3H); 4,1-4,2 (2H); 4,4-4,5 (2H); 5,176 (2H); 7,114-7,131 (1H); 7,44-7,45 (1H); 7,4-8,0 (4H) ppm
56		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	油

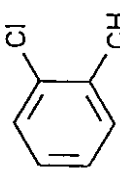
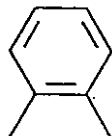
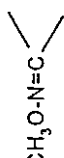
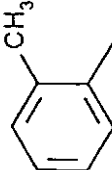
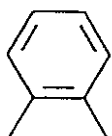
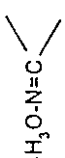
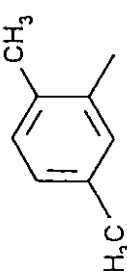
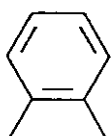
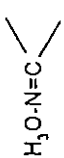
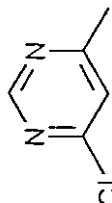
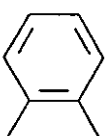
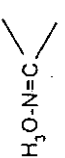
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
57		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	(非晶性) $^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.80$ (s, 3H)
58		$-\text{CH}_2\text{O}-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点: $142^\circ\text{C}$
59		$-\text{CH}_2\text{O}-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	油 $\delta = 3.95$ (s, 3H)
60		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点 $106^\circ\text{C}$

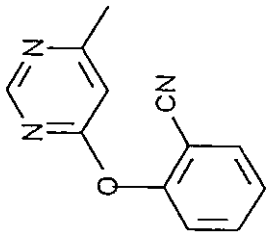
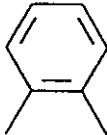
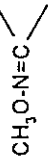
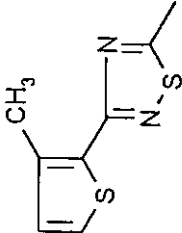
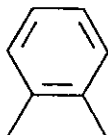
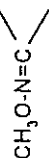
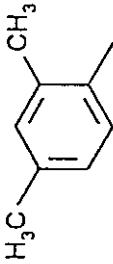
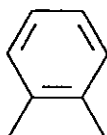
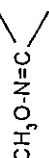
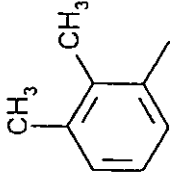
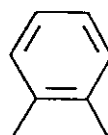
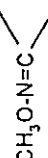
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
61		-O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 82°C
62		-O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	油 <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ = 3.80 (s, 3H)
63		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 123°C
64		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 75°C

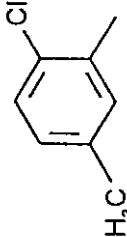
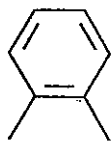
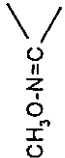
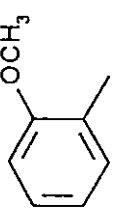
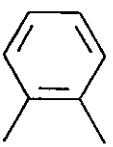
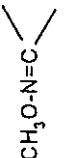
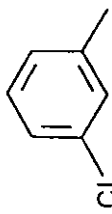
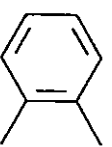
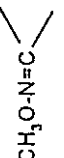
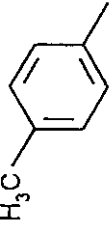
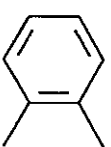
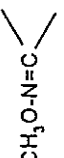
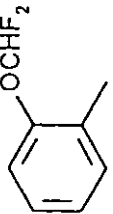
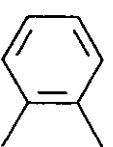
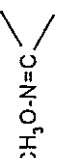
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
65		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 119°C
66		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 83°C
67		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	(非晶性) <sup>1</sup> H-NMR: 3,98; 4,15; 4,47; 4,98; 6,80; 7,55 ppm
68		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	(非晶性) <sup>1</sup> H-NMR: 2,27; 3,97; 4,14; 4,47; 4,96; 6,18-7,53 ppm
69		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	(非晶性) <sup>1</sup> H-NMR: 3,95; 4,15; 4,48; 5,07; 6,92-7,54 ppm

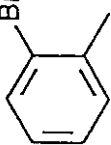
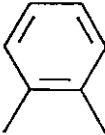
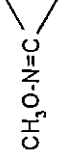
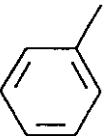
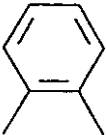

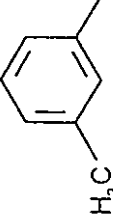
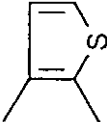

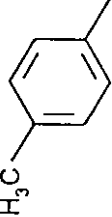
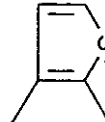
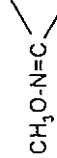
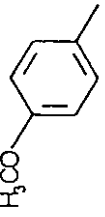
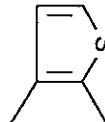
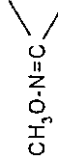
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
70		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 131°C
71		-O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 95°C
72		-O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	油
73		-O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 119°C
74		-O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	油

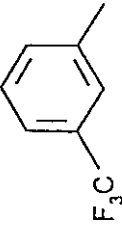
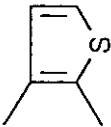

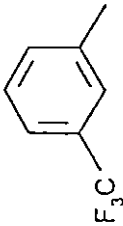
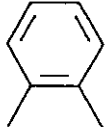

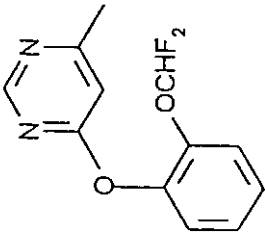


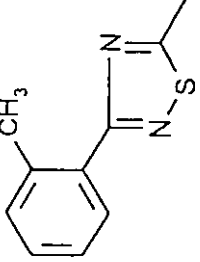
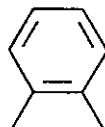

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
75		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	油
76		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	(非晶性)
77		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	油 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta = 3.80 (\text{s}, 3\text{H})$
78		$-\text{CH}_2\text{S}-$		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

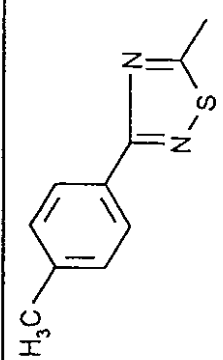
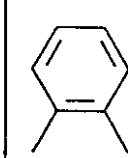

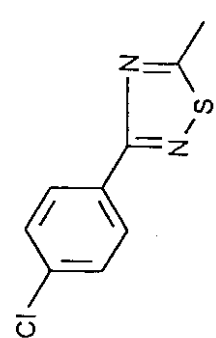
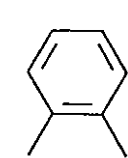

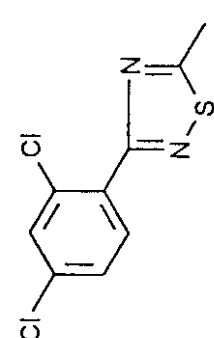
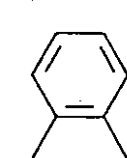

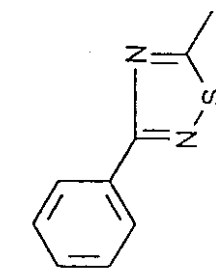
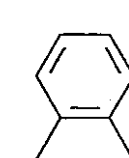

10

20

30

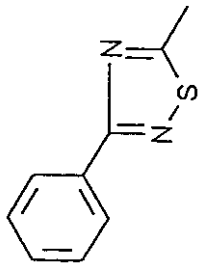
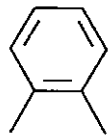


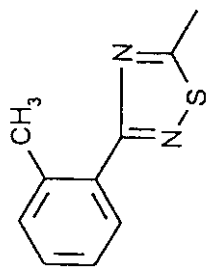
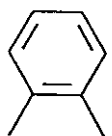
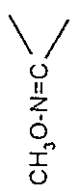
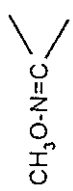
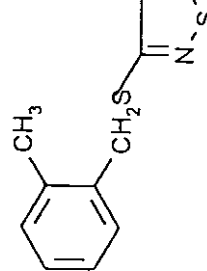
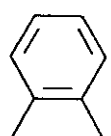
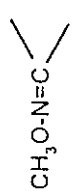
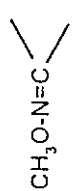
40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
79		-SCH <sub>2</sub> -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	10
80		-CH <sub>2</sub> S-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	10
81		-SCH <sub>2</sub> -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	10
82		S		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	10



## 実施例

No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
83		-				
84		-O-				
85		-O-				油 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta = 3.80 (\text{s}, 3\text{H})$

10

20

30

40



実施例

Z

G

Ar

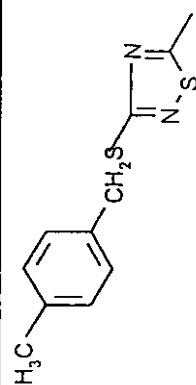
E

A

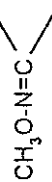
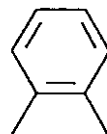
物理データ

No.

86

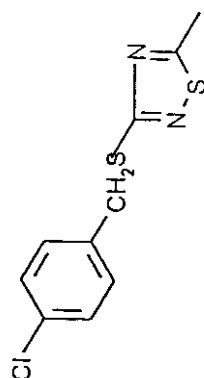


-O-

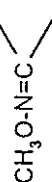
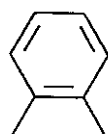
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>

融点: 128°C

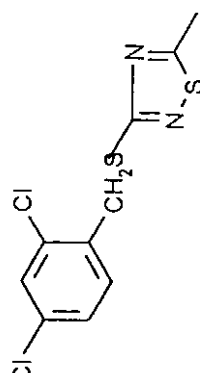
87



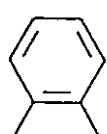
-O-

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>油 <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>)  
δ = 3.80 (s, 3H)

88



-O-

CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>

40

30

20

10



実施例 Nr.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
89		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
90		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
91		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点 70°C
92		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点 70-73°C

10

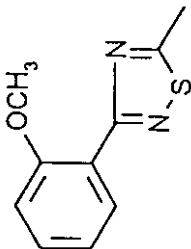
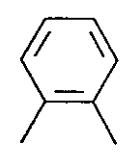
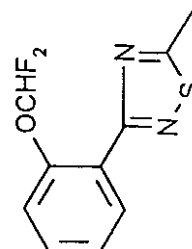
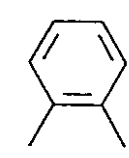
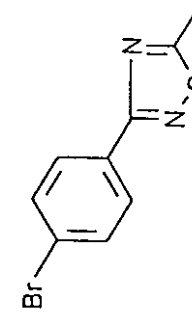
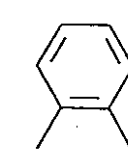
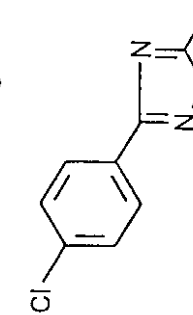
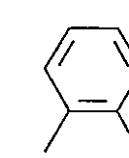
20

30

40



## 実施例

No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
93		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta = 3.85$ (s, 3H)
94		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	油 $\delta = 3.85$ (s, 3H)
95		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点: 132°C
96		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
97		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
98		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ 油 $\delta = 3.80$ (s, 3H)
99		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	油 $\delta = 3.80$ (s, 3H)

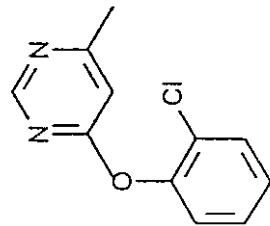
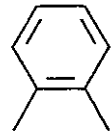

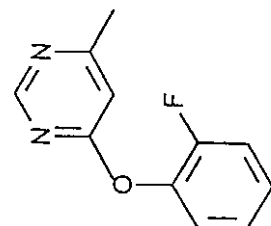
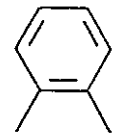

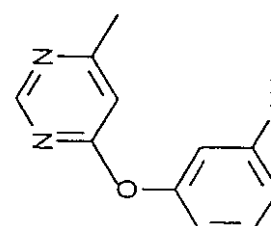
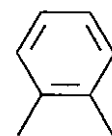

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
100		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta = 3.80 (\text{s}, 3\text{H})$
101		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
102		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $\delta = 3.80 (\text{s}, 3\text{H})$

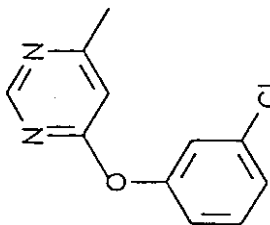
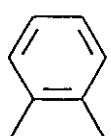

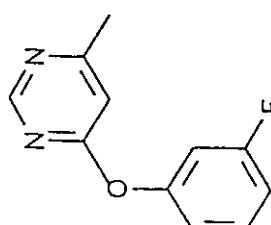
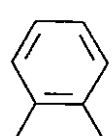

10

20

30

40



実施例	Z	G	Ar	E	A	物理データ
No.						
103		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta = 3.80 (\text{s}, 3\text{H})$
104		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

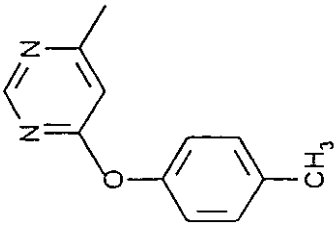

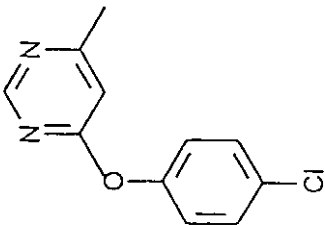
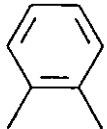
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
105		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta = 3.80$ (s, 3H)
106		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}<$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta = 3.80$ (s, 3H)

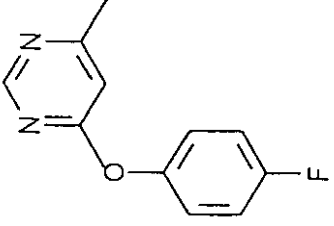
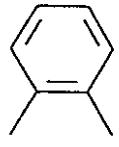
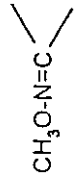
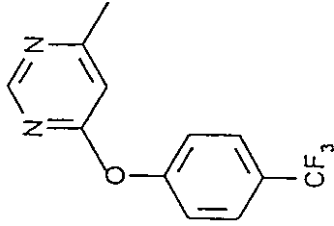
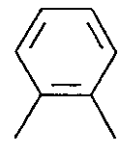
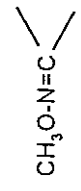
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
107		-O-		 CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
108		-O-		 CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	油 <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ = 3.80 (s, 3H)

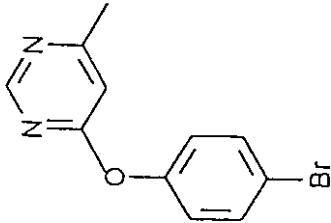
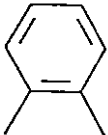

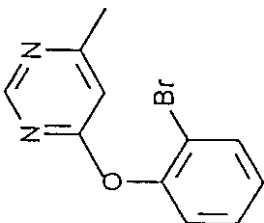
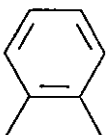
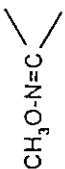
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
109		-O-		 CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
110		-O-		 CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	非晶性 <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ = 3.80 (s, 3H)

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
111		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.80$ (s, 3H)
112		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $\delta = 3.80$ (s, 3H)

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
113		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	油 $^1\text{H NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.80$ (s, 3H)
114		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $\delta = 3.80$ (s, 3H)
115		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

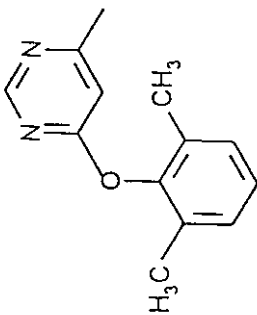
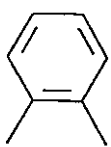

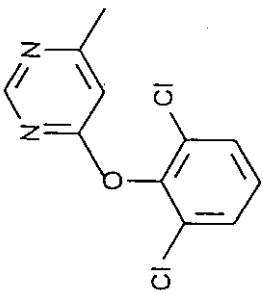
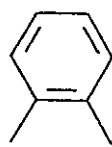

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
116		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.80$ (s, 3H)
117		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

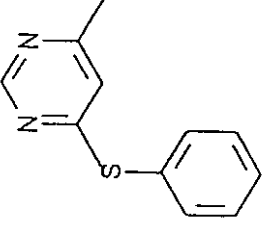
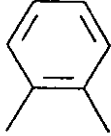

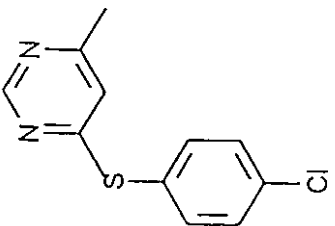
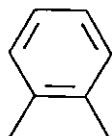

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
118		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.80$ (s, 3H)
119		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $\delta = 3.80$ (s, 3H)

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
120		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.80$ (s, 3H)
121		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
122		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

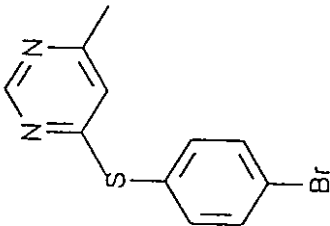
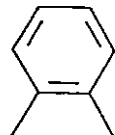
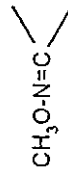
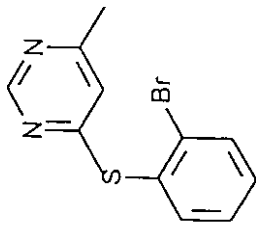
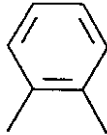
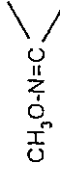
10

20

30

40

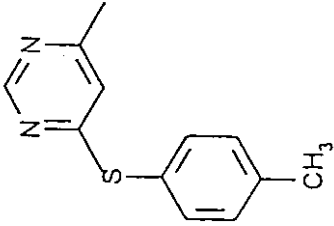
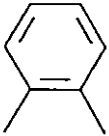

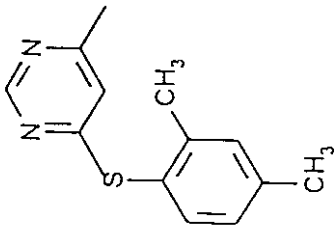
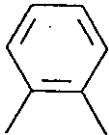



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
123		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	10
124		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	20
40		30				10

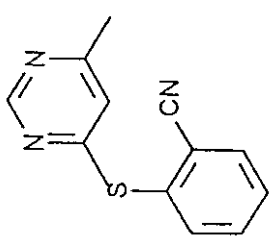
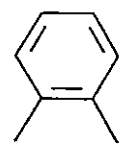
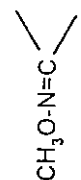
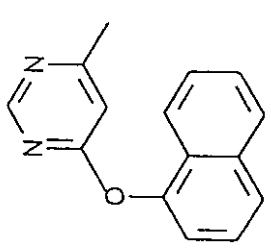
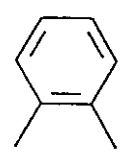
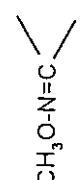
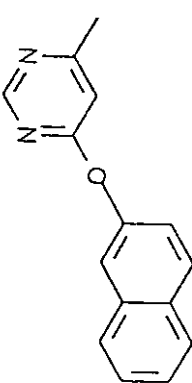
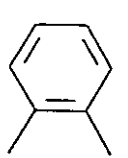
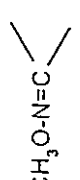


実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
125		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	10
126		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	20
						30
						40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
127		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	10
128		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	20
						30
						40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
129		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
130		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性
131		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

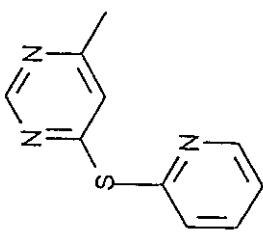
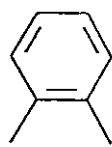

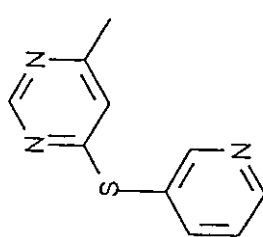
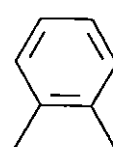

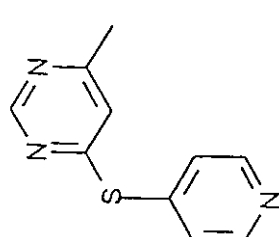
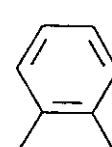

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
132		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta=3.85$ (s,3H)
133		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
134		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
135		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性 $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3.85$ (s, 3H)
136		-CH <sub>2</sub> O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
137		-CH <sub>2</sub> O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
138		-CH <sub>2</sub> O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

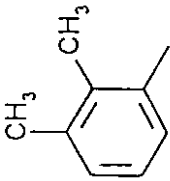

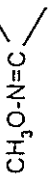
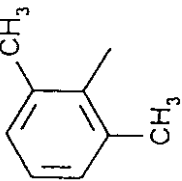
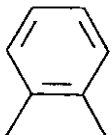
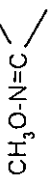
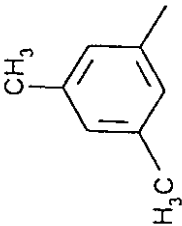
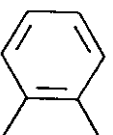
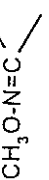
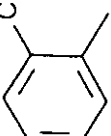
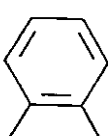
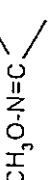
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
139		-CH <sub>2</sub> O-		 CH <sub>3</sub> O-N=N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 146°C
140		-CH <sub>2</sub> O-		 CH <sub>3</sub> O-N=N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
141		-CH <sub>2</sub> O-		 CH <sub>3</sub> O-N=N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
142		-CH <sub>2</sub> O-		 CH <sub>3</sub> O-N=N=C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	

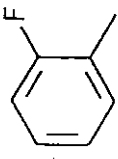
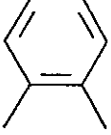
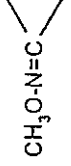
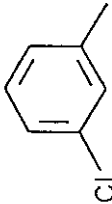
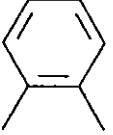
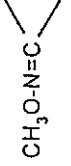
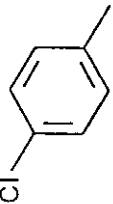
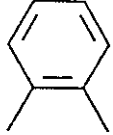
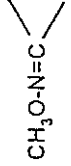
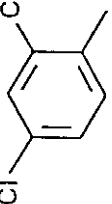
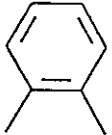

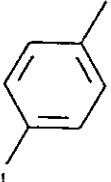

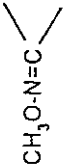
10

20

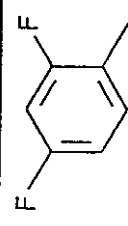
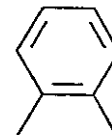
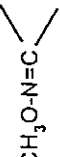
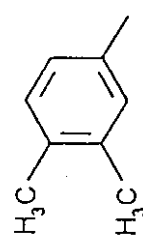
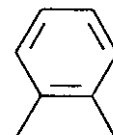
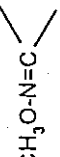
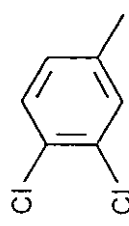
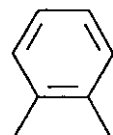
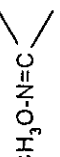
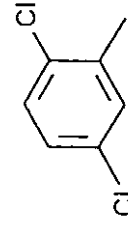
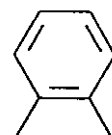
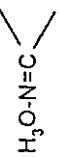
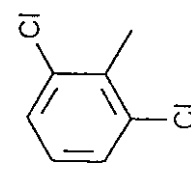
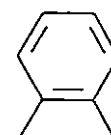
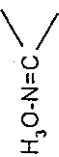
30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
143		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	10
144		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
145		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
146		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
147		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	20
						30
						40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
148		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	物理データ
149		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
150		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
151		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
152		-CH <sub>2</sub> O-			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	

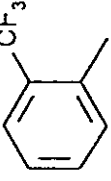
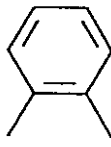
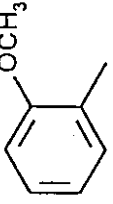
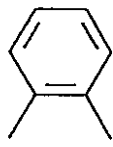
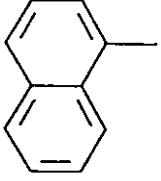
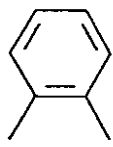
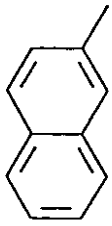
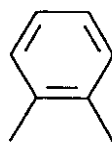
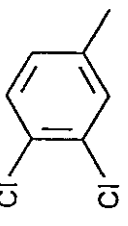
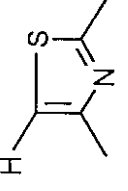
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
153		-CH <sub>2</sub> O-		CH <sub>3</sub> O-N=C<img alt="Chemical structure of isopropylidene group" data-bbox="190 290 240 320"/>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
154		-CH <sub>2</sub> O-		CH <sub>3</sub> O-N=C<img alt="Chemical structure of isopropylidene group" data-bbox="280 290 330 320"/>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
155		-CH <sub>2</sub> O-		CH <sub>3</sub> O-N=C<img alt="Chemical structure of isopropylidene group" data-bbox="370 290 420 320"/>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
156		-CH <sub>2</sub> O-		CH <sub>3</sub> O-N=C<img alt="Chemical structure of isopropylidene group" data-bbox="490 290 540 320"/>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
157		-		CH <sub>3</sub> O-CH=C<img alt="Chemical structure of isopropylidene group" data-bbox="580 300 650 330"/>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	

10

20

30

40



実施例  
No.

## Z

## G

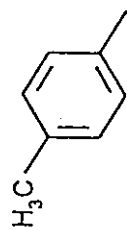
## Ar

## E

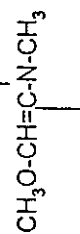
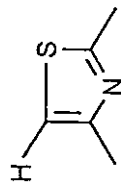
## A

## 物理データ

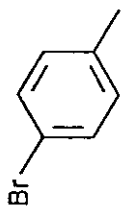
158



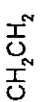
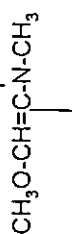
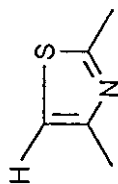
-



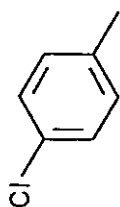
159



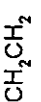
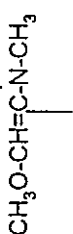
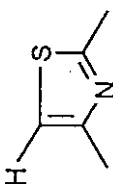
-



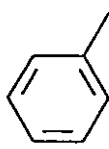
160



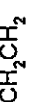
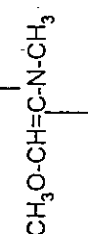
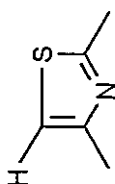
-



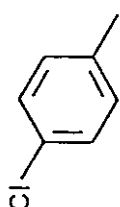
161



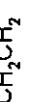
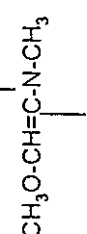
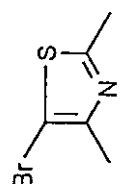
-



162



-



10

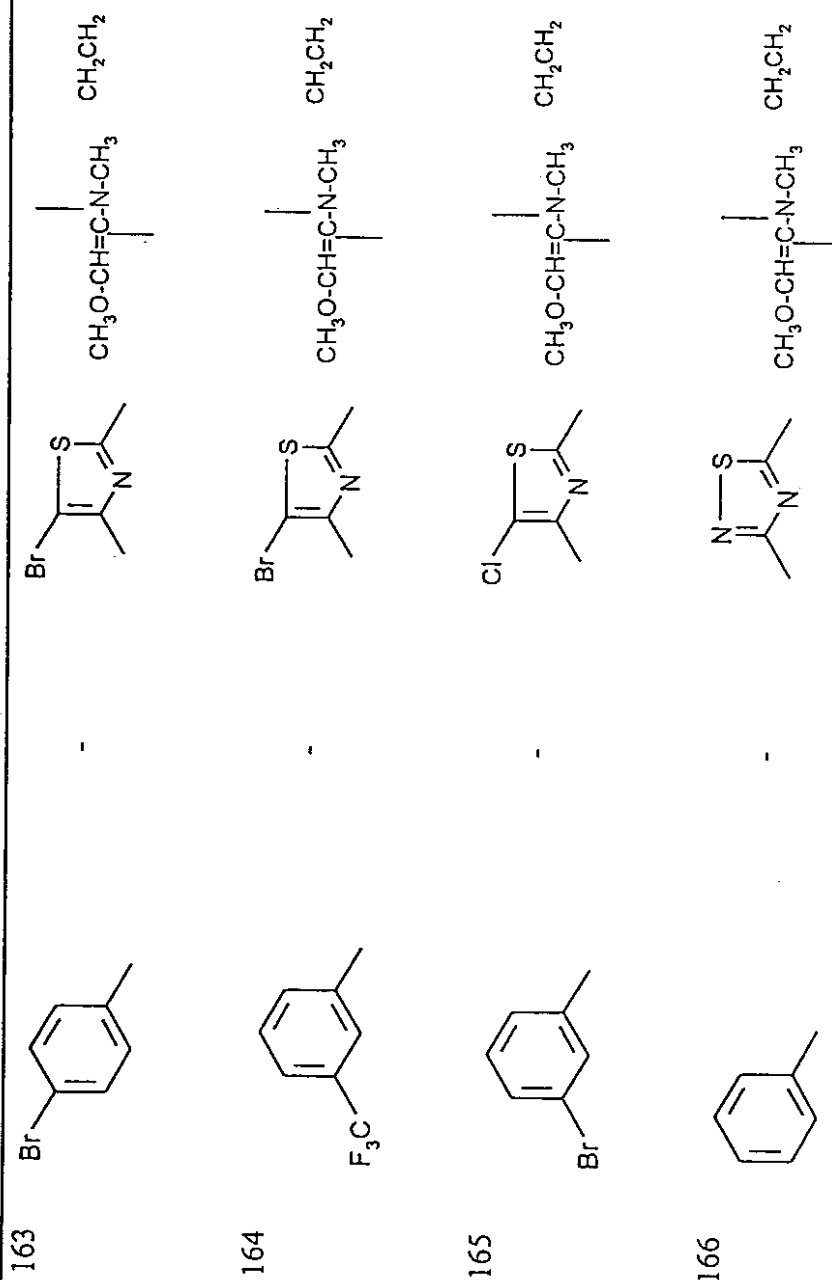
20

30

40



実施例 No. Z G Ar E A 物理データ



10

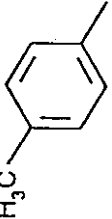
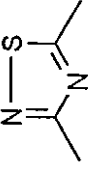
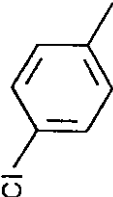
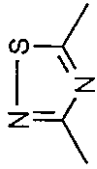
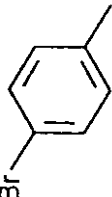
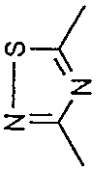
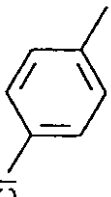
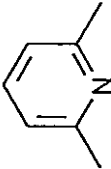
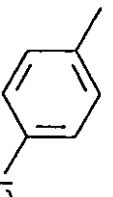
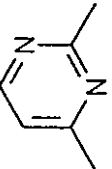
20

30

40



## 実施例

No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
167		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}(\text{N}-\text{CH}_3)-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
168		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}(\text{N}-\text{CH}_3)-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
169		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}(\text{N}-\text{CH}_3)-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
170		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}(\text{N}-\text{CH}_3)-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
171		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}(\text{N}-\text{CH}_3)-$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

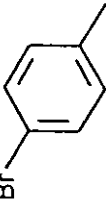
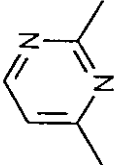
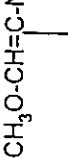
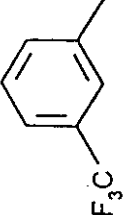
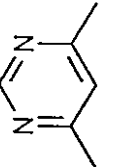
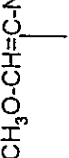
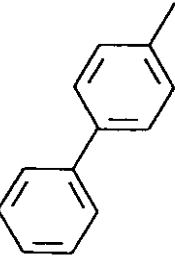
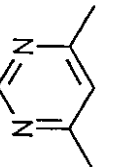
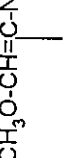
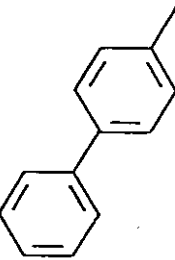
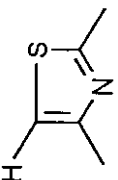
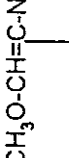
10

20

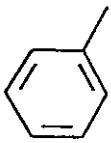
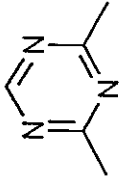
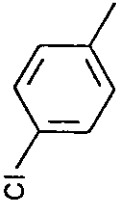
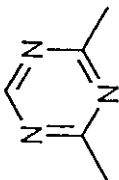
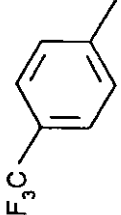
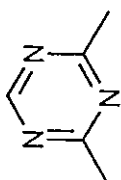
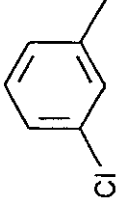
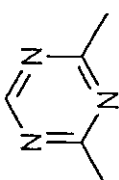
30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
172		-		 CH <sub>3</sub> O-CH=C(N-CH <sub>3</sub> )-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
173		-		 CH <sub>3</sub> O-CH=C(N-CH <sub>3</sub> )-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
174		-		 CH <sub>3</sub> O-CH=C(N-CH <sub>3</sub> )-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
175		-		 CH <sub>3</sub> O-CH=C(N-CH <sub>3</sub> )-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	10
						20
						30
						40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
176		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}-\text{N}-\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
177		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}-\text{N}-\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
178		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}-\text{N}-\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
179		-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}=\text{C}-\text{N}-\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

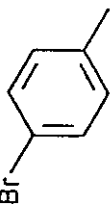
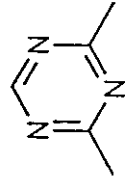
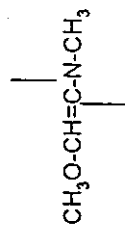
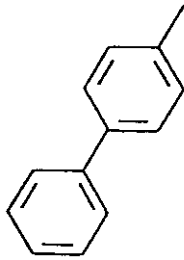
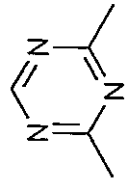
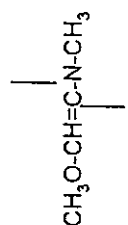
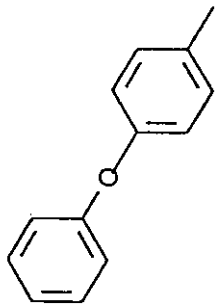
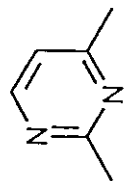
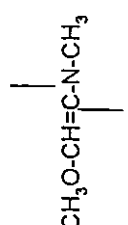
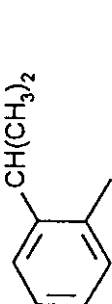
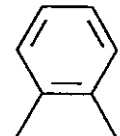
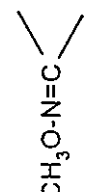
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
180		-		 CH <sub>3</sub> O-CH=C(N-CH <sub>3</sub> )-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
181		-		 CH <sub>3</sub> O-CH=C(N-CH <sub>3</sub> )-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
182		-		 CH <sub>3</sub> O-CH=C(N-CH <sub>3</sub> )-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
183		-OCH <sub>2</sub> -		 CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	(非晶性) <sup>1</sup> H-NMR: 1.23; 1.26; 3.39-3.46; 4.0; 4.15; 4.48; 5.0; 6.8-7.6 ppm

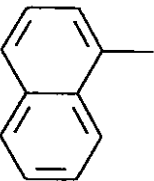
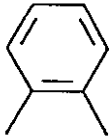

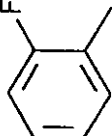
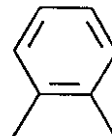

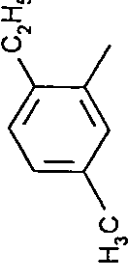
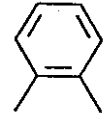

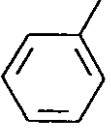
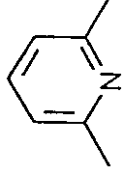

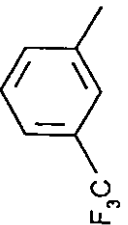
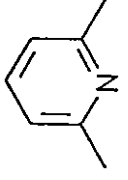

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
184		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C< 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 115°C
185		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C< 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 103°C
186		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C< 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	融点: 62°C
187		-		CH <sub>3</sub> O-CH=C<-N-CH <sub>3</sub> 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
188		-		CH <sub>3</sub> O-CH=C<-N-CH <sub>3</sub> 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	

10

20

30

40



## 物理データ

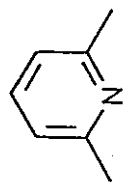
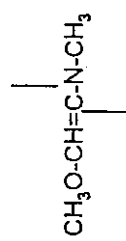
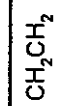
A

E

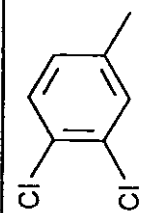
Ar

G

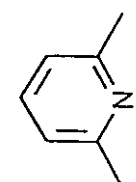
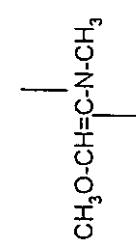
Z

実施例  
No.

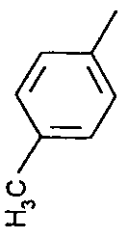
-



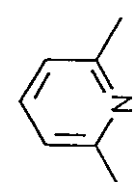
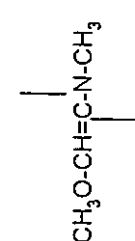
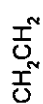
189



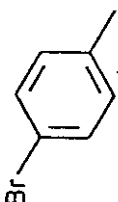
-



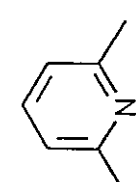
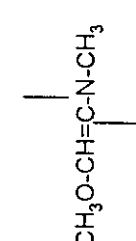
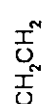
190



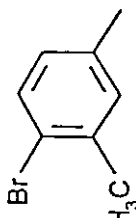
-



191



-



192

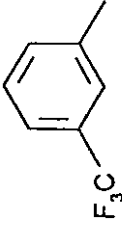
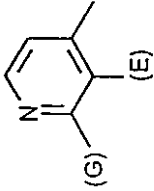

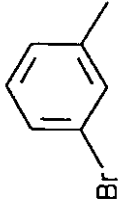
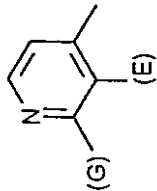

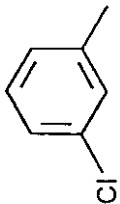
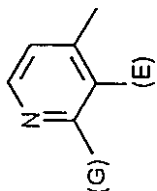

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
193		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	融点: 118°C
194		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	非晶性
195		-O-		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}-$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	

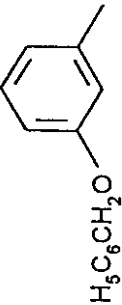
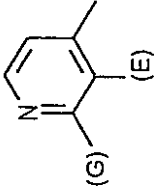
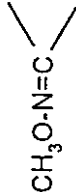
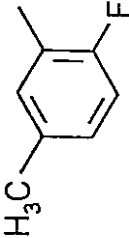
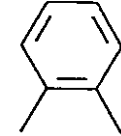
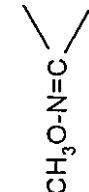
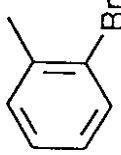
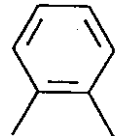
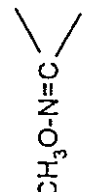
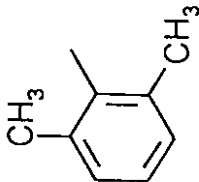
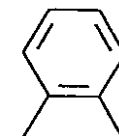
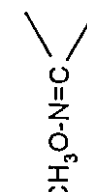
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
196		-O-	 (G) (E)	 $\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
197		$-\text{OCH}_2-$		 $\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	
198		$-\text{OCH}_2-$		 $\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	$^1\text{H-NMR}$ : 3,98; 4,16; 4,49; 5,09; 6,82-7,56 ppm
199		$-\text{OCH}_2-$		 $\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2$	$^1\text{H-NMR}$ : 2,29; 3,95; 4,15; 4,47; 4,71; 6,92- 7,82 ppm

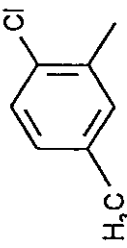
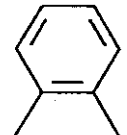
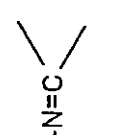
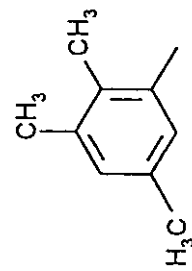
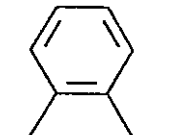
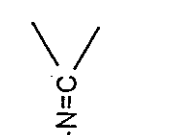
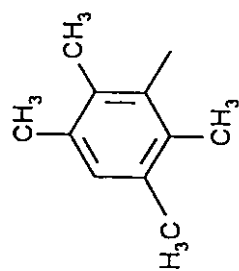
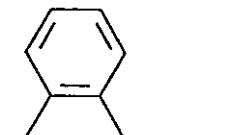
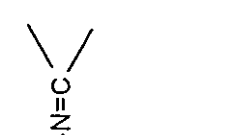
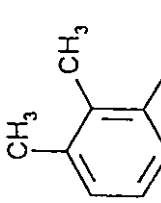
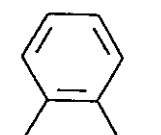
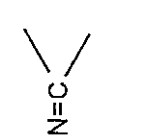
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
200		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C< 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 2,26; 3,99; 4,19; 4,5; 5,06; 6,67- 7,62 ppm
201		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C< 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 2,17-2,29; 3,98; 4,14; 4,48; 4,96; 6,5-7,6 ppm
202		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C< 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
203		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C< 	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 2,20; 2,28; 3,97; 4,15; 4,46; 4,98; 6,68-7,58 ppm

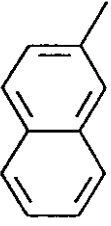
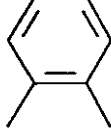
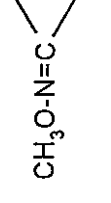
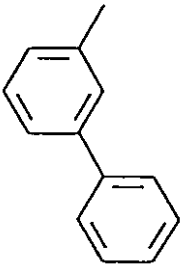
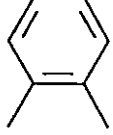
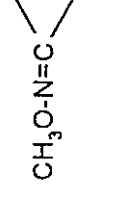
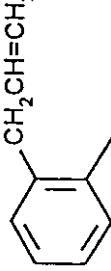
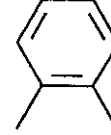
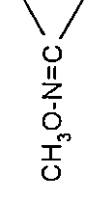
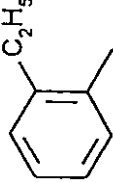
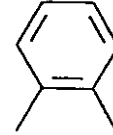
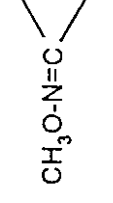
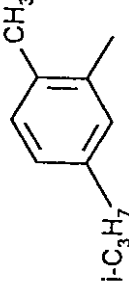
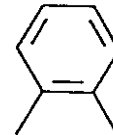
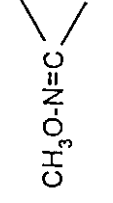
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
204		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
205		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
206		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
207		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
208		-OCH <sub>2</sub> -			CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 1,19; 1,21; 2,25; 2,82; 3,98; 4,15; 4,45; 5,0; 6,66- 7,58 ppm

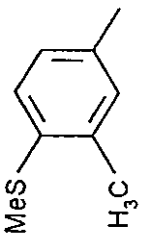
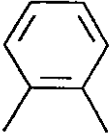
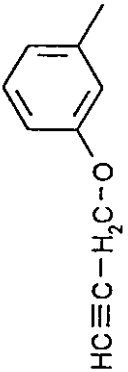
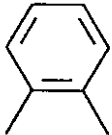
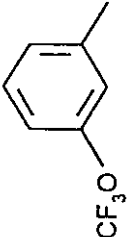
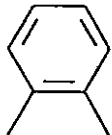
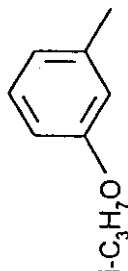
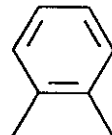
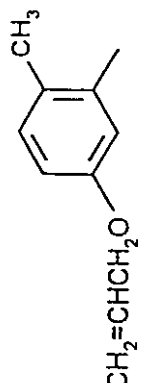
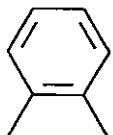
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
209		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 2,34; 2,38; 3,98; 4,15; 4,47; 4,97; 6,73- 7,52 ppm
210		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
211		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
212		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	
213		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	

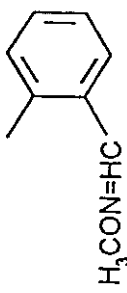
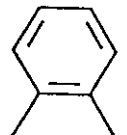
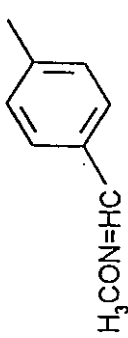
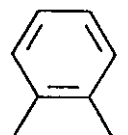
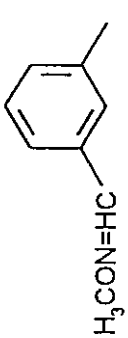
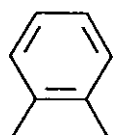
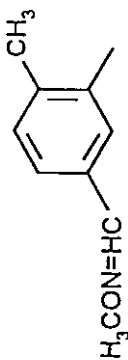
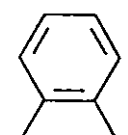
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
214		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	非晶性 <sup>1</sup> H- NMR: 3,97; 4,13; 4,45; 5,03; 6,86- 8,50 ppm <sup>1</sup> H-NMR: 3,94; 3,97; 4,15; 4,47; 5,02; 6,90 - 8,0 ppm
215		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 3,94; 3,97; 4,15; 4,47; 5,02; 6,90 - 8,0 ppm
216		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 3,98; 4,15; 4,47; 5,01; 6,92-8,02 ppm
217		-OCH <sub>2</sub> -		CH <sub>3</sub> O-N=C<	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	

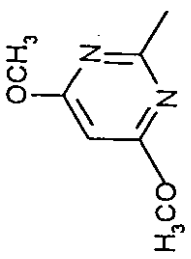
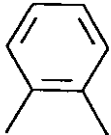

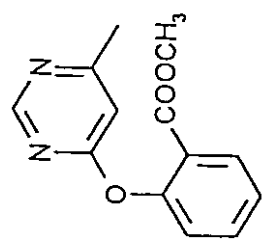
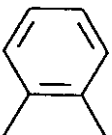
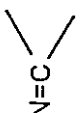
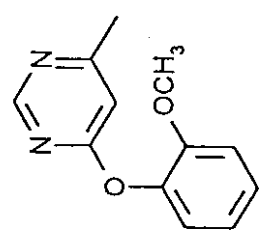
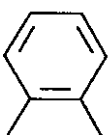

10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
218		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ m.p.: 133°C	
219		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ 非晶性 $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta = 3, 15$ (s, 3H)	
220		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ 非晶性 $\delta = 3, 80$ (s, 3H)	

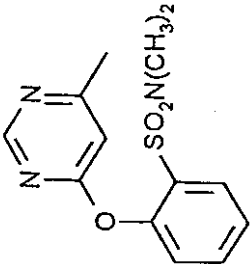
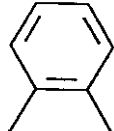

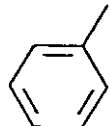
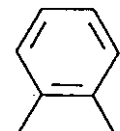
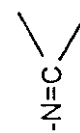
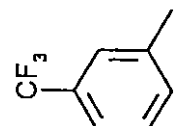
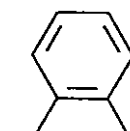
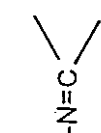
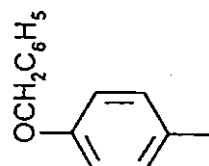
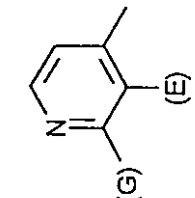
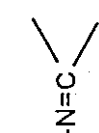
10

20

30

40



実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
221		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ 融点: >200°C	
222		-OCH <sub>2</sub> -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ 非晶性 <sup>1</sup> H-NMR: 3,97; 4,14; 4,46; 5,0; 6,91-7,54 ppm	
223		-OCH <sub>2</sub> -		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ 非晶性 <sup>1</sup> H-NMR: 3,97; 4,14; 4,48; 5,03; 7,08-7,51 ppm	
224		O		$\text{CH}_3\text{O}-\text{N}=\text{C}$ 	$\text{CH}_2\text{CH}_2$ 非晶性	

10

20

30

40



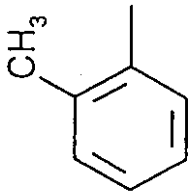
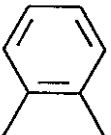
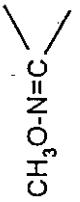
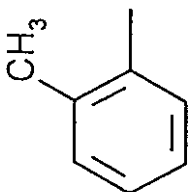
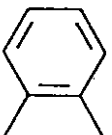
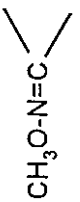
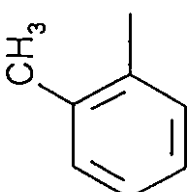
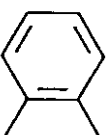
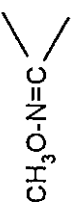
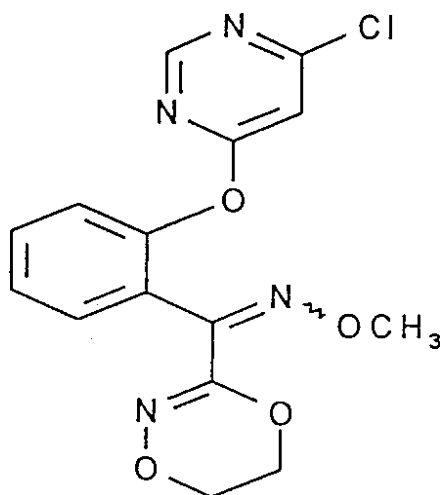
実施例 No.	Z	G	Ar	E	A	物理データ
225		-OCH <sub>2</sub> -		 CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: 2,25; 4,0; 5,0; 5,86; 6,75-7,6 ppm
226		-OCH <sub>2</sub> -		 CH <sub>3</sub> O-N=C	CH(CH <sub>3</sub> )	
227		-OCH <sub>2</sub> -		 CH <sub>3</sub> O-N=C	CH <sub>2</sub> CH(C H <sub>3</sub> )	<sup>1</sup> H-NMR: 1,4; 2,3; 3,6- 4,5; 5,0; 6,8- 7,6 ppm

表 1 中の実施例 60 に示される化合物は例えば次のように製造し得る：





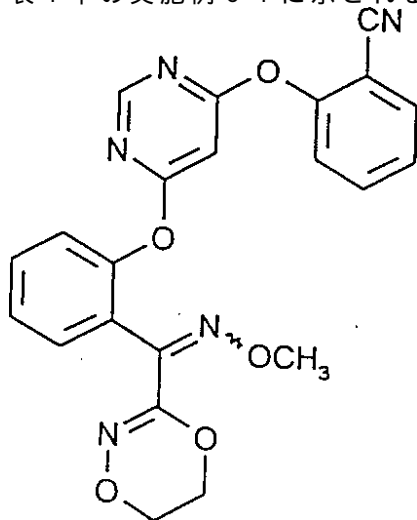
10

石油ホワイト・オイル中の水素化チトリウム60%懸濁液0.3g(6ミリモル)を氷冷しながら3-[3-メトキシイミノ-2-(6-クロロピリミジン-4-イル-オキシ)-フェニル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン1.5g(6ミリモル)、4,6-ジクロロ-ピリミジン0.9g(6ミリモル)及びN,N-ジメチルホルムアミド30mlの混合物に加えた。氷浴を除去した後、反応混合物を20℃で15時間撹拌した。次にこのものをオイルポンプの真空下で濃縮し、残渣を酢酸エチル中に取り入れ、水で洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、そして濾過した。溶媒を水流ポンプの真空下での蒸留により注意しながら濾液から除去した。

20

3-{3-メトキシイミノ-2-[2-(6-クロロピリミジン-4-イル-オキシ)-フェニル]-メチル}-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン1.9g(理論値の86%)が油状残渣として得られた。

表1中の実施例61に示される化合物は例えば次のように製造し得る：



30

3-{3-メトキシイミノ-2-[2-(6-クロロピリミジン-4-イル-オキシ)-フェニル]-メチル}-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン0.3g(0.9ミリモル)、2-ヒドロキシベンズニトリル0.1g(0.9ミリモル)、炭酸カリウム0.1g(0.9ミリモル)、塩化銅(I)スパチュラ1杯及びN,N-ジメチルホルムアミド5mlの混合物を100℃で15時間撹拌した。次にこのものをオイルポンプの真空下で濃縮し、残渣を酢酸エチル中に取り入れ、水で洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、そして濾過した。濾液を濃縮し、そして残渣をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/アセトン、7:3容量使用)により精製した。

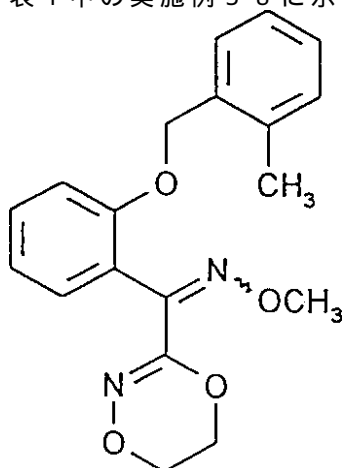
40

融点82℃の3-{3-メトキシイミノ-2-[2-(6-(2-シアノ-フェノキシ)-ピリミジン-4-イル-オキシ)-フェニル]-メチル}-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン0.3g(理論値の81%)が得られた。

50



表 1 中の実施例 5 8 に示される化合物は例えば次のように製造し得る：



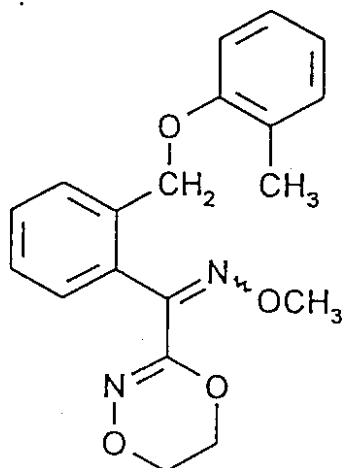
10

3-[4-メトキシイミノ-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン0.5 g (2ミリモル)、塩化2-メチル-ベンジル0.3 g (2.2ミリモル)、炭酸カリウム0.4 g (2.5ミリモル)及びアセトニトリル10 mlの混合物を15時間還流した。次にこのものを濃縮し、残渣を塩化メチレン中に取り入れ、水で洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、そして濾過した。溶媒を水流ポンプの真空下での蒸留により注意しながら濾液から除去した。

融点142の3-{4-メトキシイミノ-[2-(2-メチル-ベンジルオキシ)-フェニル]-メチル}-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン0.4 g (理論値の59%)が得られた。

20

また、実施例 1 により得ることができる化合物を例えば次のように製造することができた：



30

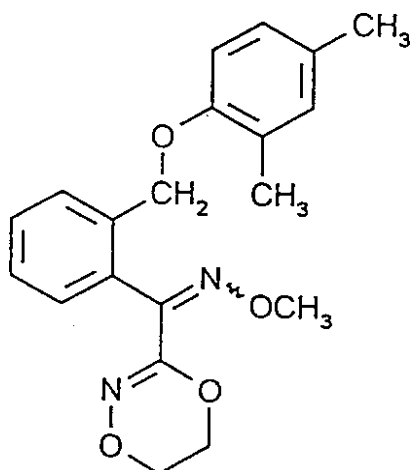
3-[4-メトキシイミノ-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン0.75 g (2.4ミリモル)及び2-メチル-フェノール0.70 g (6.4ミリモル)をジメチルホルムアミド15 ml中に溶解し、そして混合物を-10に冷却した後、水素化ナトリウム(80%)0.21 g (7.0ミリモル)を徐々に加えた。冷却浴を除去した後、反応混合物を25以下で14時間攪拌し、続いて約2倍の容量の水の中に注いだ。酢酸エチルと共に振盪した後、有機相を分別し、2N水酸化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、そして濾過した。溶媒を減圧下での蒸留により注意しながら濾液から除去した。

40

3-{4-メトキシイミノ-[2-(2-メチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-メチル}-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン0.40 g (理論値の49%)が得られた(屈折率 $n_D^{20} = 1.5705$ )。

表 1 中の実施例 1 9 に示される化合物を例えば次のように製造することができた：





10

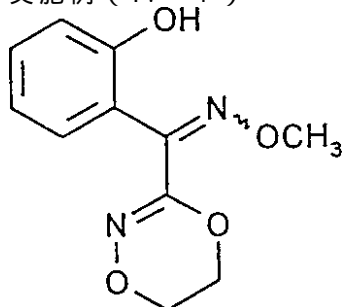
N-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-3-メトキシイミノ-3-[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-アセトアミド 0.20 g (0.56ミリモル) をクロロホルム 3 ml 中に溶解し、そして酸化リン(V) 0.25 g (1.76ミリモル) を 0 で加えた。反応混合物を 20 で 1 時間、次に還流下で 4 時間攪拌し、続いて約 2 倍の容量の水中に注ぎ、そして振盪した。有機相を分別した後、水相をクロロホルムで 3 回再抽出した。一緒にした有機抽出液を硫酸マグネシウムを用いて乾燥し、次に濃縮し、そしてカラムクロマトグラフィー(シリカゲル; トルエン/アセトン、10:1)により精製した。3-{3-メトキシイミノ-3-[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-メチル-5,6}-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン 84 mg (理論値の 42%) が得られた。

20

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{D}_6\text{-DMSO}$ , ) : 4.87、3.84、4.38、4.10 ppm.

式(IV)の出発物質:

実施例(IV-1)



30

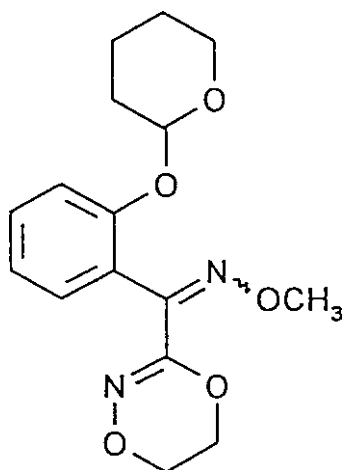
3-[3-メトキシイミノ-3-(2-テトラヒドロピラン-2-イル-オキシ)-ベンジル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン 9.0 g (2.8ミリモル) 及びメタノール 90 ml 中のイオン交換体「Lewatit SPC 108」1.8 g を 20 で 15 時間攪拌した。次に混合物を水流ポンプの真空下で濃縮し、残渣を塩化メチレン中に取り入れ、そして濾過した。濾液を水流ポンプの真空下で濃縮し、そして残渣をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/アセトン、7:3 容量使用)により精製した。得られた第 1 フラクシオンは非晶性生成物の状態の Z-{3-[3-メトキシイミノ-3-(2-ヒドロキシ-フェニル)-メチル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン} 0.6 g (理論値の 9%) であり、そして第 2 フラクシオンは融点 153 の E-{3-[3-メトキシイミノ-3-(2-ヒドロキシ-フェニル)-メチル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン} 3.3 g (理論値の 50%) であった。

40

式(IX)の出発物質:

実施例(IX-1)



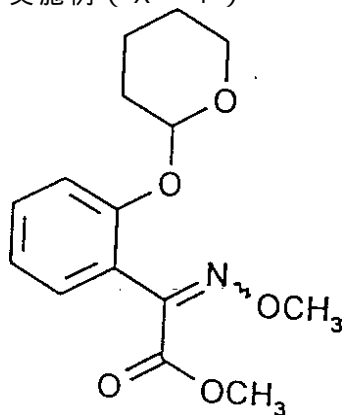


8.5%水酸化カリウム水溶液13.9g(211モル)及び-N-メトキシイミノ-(2-テトラヒドロピラン-2-イル-オキシ-フェニル)-酢酸メチル17g(58ミリモル)をメタノール290ml中のヒドロキシルアミン塩酸塩6.8g(98ミリモル)に加え、そして混合物を40℃で1時間攪拌した。次に炭酸カリウム7.7g(56ミリモル)を加え、そして1,2-ジブロモエタン42.5g(226ミリモル)を滴下しながら加えた。次に混合物を15時間還流し、続いて水流ポンプの真空下で濃縮した。残渣を塩化メチレン中に取り入れ、水で洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、そして濾過した。濾液を濃縮し、そして残渣をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/アセトン、7:3容量使用)により精製した。

20

式 ( X ) の出発物質 :

実施例 ( X - 1 )



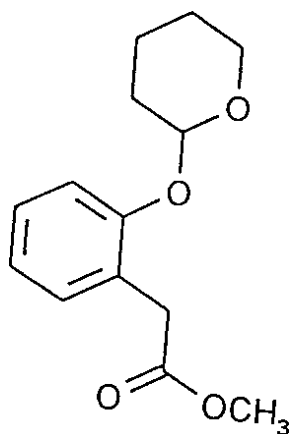
カリウム *t*-ブチレート 203 g (1.81 モル) を *t*-ブタノール 2 l 中に導入し、そしてこの溶液に *t*-ブタノール 500 ml に溶解した亜硝酸 *t*-ブチル 564 g (4.93 モル) 及び 2-テトラヒドロピラニルオキシ-フェニル酢酸メチル 411 g (1.64 モル) を滴下しながら加えた。90 分後、ヨウ化メチル 350 g (2.47 モル) を滴下しながら加え、そして混合物を 20℃ で 15 時間攪拌した。次にこのものを水流ポンプの真空下で濃縮し、残渣をメチル *t*-ブチルエーテル中に取り入れ、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、そして濾過した。残渣をジエチルエーテルと共に温浸することにより結晶化させ、そして生成物を吸引濾過により単離した。

40

式 (XI) の出発物質：

### 实施例 (X1 - 1)





10

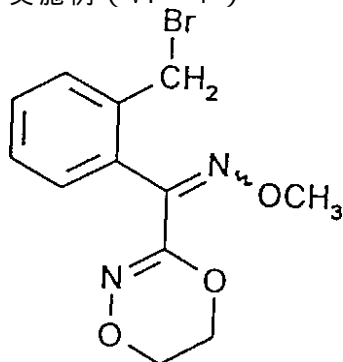
2-ヒドロキシ-フェニル酢酸メチル 500 g (3.0 モル)、3,4-ジヒドロピラン 506 g (6.0 モル)、p-トルエンスルホン酸スパチュラ 1 杯及びテトラヒドロフラン 2.5 l の混合物を 20 で 15 時間攪拌し、次に氷冷した 10% 水酸化カリウム水溶液と共に攪拌し、硫酸ナトリウムを加え、そして混合物を濾過した。溶媒を水流ポンプの真空下での蒸留により注意しながら濾液から除去した。

2-テトラヒドロピラニルオキシ-フェニル-酢酸メチル 698 g (理論値の 99%) が油状残渣として得られた。

式 (VI) の出発物質：

実施例 (VI-1)

20



30

3-[2-(2-メトキシイミノ-2,3-ジヒドロ-1,4-ジオキサジン-5-イル)-2-(2-ブロモメチル-フェニル)-メチル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン 0.50 g (2.13 ミリモル) 及び N-プロモ-スクシンイミド 0.57 g (3.2 ミリモル) をテトラクロロメタン 10 ml 中に導入し、そしてアゾイソブチロニトリル 200 mg を加えた後、混合物を 4 時間攪拌した。更に N-プロモ-スクシンイミド 0.57 g (3.2 ミリモル) の添加後、混合物を更に 1 時間攪拌した。

続いてこのものを冷却し、濾過し、濾液を濃縮し、そして残渣をクロマトグラフにかけた (シリカゲル; トルエン/アセトン、10:1)。

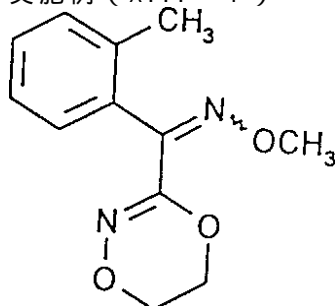
3-[2-(2-メトキシイミノ-2,3-ジヒドロ-1,4-ジオキサジン-5-イル)-2-(2-ブロモメチル-フェニル)-メチル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン 20 mg (理論値の 30%) が得られた。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>, ) : 4.4 ppm。

40

式 (XIII) の出発物質：

実施例 (XIII-1)



50



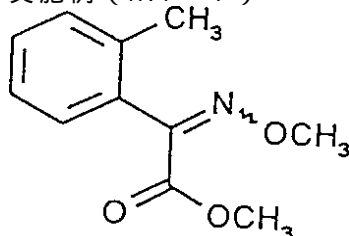
ヒドロキシルアミン塩酸塩 19.6 g (0.283 モル) をメタノール 150 ml 中に導入し、そしてメタノール 150 ml 中の水酸化カリウム (86%) 36.9 g (0.565 モル) の溶液を徐々に加えた。次に  $\alpha$ -メトキシイミノ- $\beta$ -(2-メチル-フェニル)-酢酸メチル 30 g (0.145 モル) を一部ずつ加えた。混合物を 50 で 3 時間攪拌。続いて炭酸カリウム 20 g (0.145 モル) 及び 1,2-ジブromo-エタン 122 g (0.65 モル) を 20 で加え、そして反応混合物を 65 で 17 時間攪拌した。混合物を冷却した後、このものを吸引濾過し、濾液を濃縮し、そして残渣をクロマトグラフにかけた (シリカゲル; トルエン/アセトン、15:1)。

3-[ $\alpha$ -メトキシイミノ- $\beta$ -(2-メチル-フェニル)-メチル]-5,6-ジヒドロ-1,4,2-ジオキサジン 15.2 g (理論値の 45%) が得られた。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>, ) : 2.2 ppm.

式 (XIV) の出発物質:

実施例 (XIV-1)



カリウム *t*-ブチラート 187.5 g (1.673 モル) を *t*-ブタノール 1875 ml に溶解した。*t*-ブタノール 500 ml に溶解した亜硝酸 *t*-ブチル 471.5 g (4.57 モル) 及び 2-メチル-フェニル酢酸メチル 250 g (1.525 モル) は内部温度が 50

以上に上昇しないように計量導入した。混合物を 20 ~ 30 で 90 分間攪拌した。次にヨウ化メチル 326.5 g (2.3 モル) を滴下しながら加え、そして反応混合物を 20 で 14 時間攪拌した。続いて溶媒を水流ポンプの真空下で留去し、残渣を水 2 l 中に取り入れ、そして混合物を酢酸エチルを用いて 3 回抽出した。一緒にした有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして濾過した。濾液を濃縮し、残渣をイソプロパノール 250 ml 中に取り入れ、そして混合物が曇るまで還流下で水を加えた。

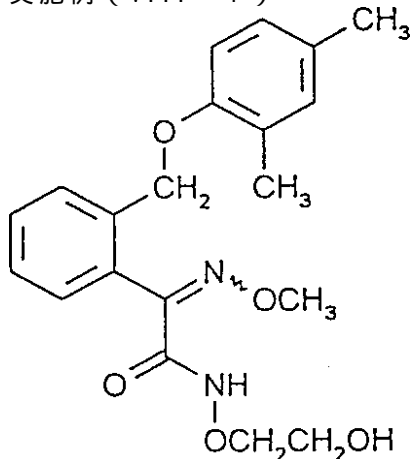
混合物を 0 に冷却し、そして 60 分間攪拌した後、結晶として得られた生成物を吸引濾過により単離した。

融点 53 の  $\alpha$ -メトキシイミノ- $\beta$ -(2-メチル-フェニル)-酢酸メチル 84.5 g (理論値の 27%) が得られた。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>, ) : 2.19 ppm.

式 (VIII) の出発物質:

実施例 (VIII-1)



塩化  $\alpha$ -メトキシイミノ- $\beta$ -[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-アセチル 0.8 g (2.36 ミリモル) をテトラヒドロフラン 10 ml に溶解し、そして



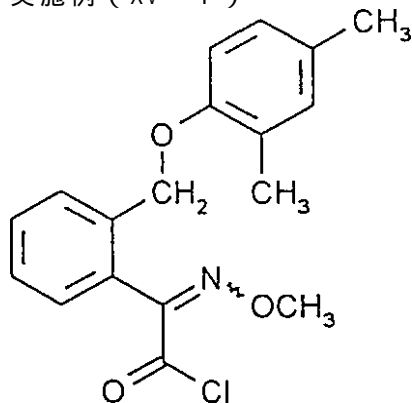
トリエチルアミン 0.26 g (2.6 ミリモル) を加えた。次にテトラヒドロフラン 10 ml に溶解した 0-(2-ヒドロキシエチル)-ヒドロキシルアミン 0.25 g (2.6 ミリモル) を 0 で滴下しながら加えた。反応混合物を 20 で 2 時間攪拌し、次に水中に注ぎ、そして酢酸エチルを用いて抽出した。抽出溶液を硫酸マグネシウムを用いて乾燥し、濃縮し、そしてクロマトグラフにかけた (シリカゲル; トルエン/アセトン、10:1)。

N-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-N-メトキシイミノ-N-[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-アセトアミド 0.4 g (理論値の 50%) が得られた。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>, ) : 3.65; 3.90; 9.15 ppm.

式 (XV) の出発物質:

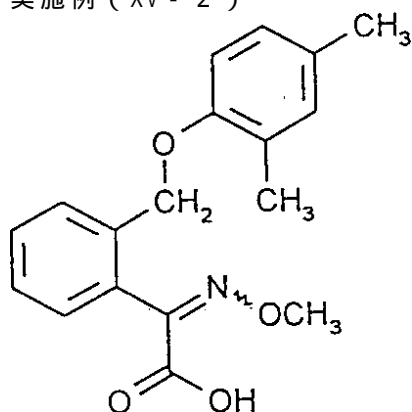
実施例 (XV-1)



N-メトキシイミノ-N-[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-酢酸 0.93 g (2.95 ミリモル) を塩化チオニル 4.0 g (2.9 ミリモル) 及びジメチルホルムアミド 50 ml と混合し、そして混合物を還流下で 30 分間攪拌した。次により揮発性の成分を注意しながら減圧下で蒸留により除去した。

塩化 N-メトキシイミノ-N-[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-アセトイル 0.95 g が油状残渣として得られた。

実施例 (XV-2)



N-メトキシイミノ-N-[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-酢酸メチル 2.0 g (6.1 ミリモル) をイソプロパノール 20 ml に溶解し、そして 1 N 水酸化ナトリウム溶液 30 ml を加えた。混合物を 40 で 14 時間攪拌し、次に水中に注いだ。次に pH 値を 2 N 塩酸を用いて 6 に調整し、そして結晶として得られた生成物を吸引濾過により単離した。

N-メトキシイミノ-N-[2-(2,4-ジメチル-フェノキシ-メチル)-フェニル]-酢酸 1.5 g (理論値の 78%) が得られた。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>, ) : 3.9; 4.85 ppm.

実施例 A

網斑病 (Pyrenophora teres) 試験 (大麦) / 保護



溶 媒：N-メチルピロリドン 10 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.6 重量部

活性化合物の適当な調製物を製造するために、活性化合物 1 重量部を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、そしてこの濃厚剤を水で希釈して所望の濃度にした。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化合物の調製物をしたたり落ちる程度にぬれるまで噴霧した。噴霧コーティングが乾燥した後、この植物に網斑病 (Pyrenopeziza) の分生孢子器懸濁液を接種した。この植物を 20 °C 及び相対湿度 100 % の培養室中に 48 時間置いた。

この植物を温度約 20 °C 及び相対湿度約 80 % の温床中に置いた。

試験を接種 7 日後に行った。

10

この試験において、例えば製造実施例 1 の化合物は 400 g / ha の施用割合で 100 % の効果の程度を示した。

#### 実施例 B

疫病 (Phytophthora) 試験 (トマト) / 全身的

溶 媒：アセトン 4.7 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.3 重量部

活性化合物の適当な調製物を製造するために、活性化合物 1 重量部を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、この濃厚物を水で希釈して所望の濃度にした。

全身的特性を試験するため、活性化合物の調製物を実験準備した若い植物を含む標準土壌上に注いだ。処理 3 日後、植物に疫病 (Phytophthora infestans) の水性孢子懸濁液を接種した。

20

植物を約 20 °C 及び相対湿度 100 % の培養室中に置いた。

試験を接種 3 日後に評価した。

この試験において、例えば製造実施例 1 の化合物は 100 ppm の活性化合物濃度で 58 % の効果の程度を示した。

#### 実施例 C

いもち病試験 (イネ) / 全身的

溶 媒：アセトン 12.5 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.3 重量部

活性化合物の適当な調製物を製造するために、活性化合物 1 重量部を上記量の溶媒と混合し、この濃厚物を水及び上記量の乳化剤で希釈して所望の濃度にした。

30

全身的特性を試験するために、若いイネ植物が生育している標準土壌を活性化合物の調製物 40 ml で液剤散布した。処理して 7 日後、植物にいもち病 (Pyricularia oryzae) の水性孢子懸濁液を接種した。次に植物を、評価するまで、温度 25 °C 及び相対湿度 100 % で温床中に保持した。

病気感染の評価を接種の 4 日後に行った。

この試験において、例えば製造実施例 1 の化合物は 100 mg / 100 ml の施用割合で 80 % の効果の程度を示した。



---

フロントページの続き

- (72)発明者 ガイアー, ヘルベルト  
ドイツ連邦共和国デー 4 0 7 8 9 モンハイム・ザントシュトラッセ 6 6
- (72)発明者 ゲルデス, ペーター  
ドイツ連邦共和国デー 5 2 0 8 0 アーヘン・バルトシュトラッセ 7 5
- (72)発明者 ハイネマン, ウルリヒ  
ドイツ連邦共和国デー 4 2 7 9 9 ライヒリンゲン・アムゾネンハング 1
- (72)発明者 クーント, デイトマー  
ドイツ連邦共和国デー 5 1 3 7 3 レーフエルクーゼン・ケルナーシュトラッセ 5
- (72)発明者 フイリツプ, ウルリヒ  
ドイツ連邦共和国デー 5 1 0 6 5 ケルン・アンドレアス グリフィウス シュトラッセ 2 0
- (72)発明者 ザイツ, トーマス  
ドイツ連邦共和国デー 4 0 7 6 4 ランゲンフェルト・リーテルバツハ 1 0 ベー
- (72)発明者 シュテッター, イエルク  
ドイツ連邦共和国デー 4 2 1 1 5 ブツペルタル・ゲレルトベーク 4
- (72)発明者 テーマン, ラルフ  
ドイツ連邦共和国デー 5 1 3 7 5 レーフエルクーゼン・エルンスト ルートビヒ キルヒナー  
シュトラッセ 5
- (72)発明者 デーネ, ハインツ - ビルヘルム  
ドイツ連邦共和国デー 5 3 1 2 5 ボン・チャールズ ビマー シュトラッセ 1 5
- (72)発明者 ドウツツマン, シュテファン  
ドイツ連邦共和国デー 4 0 7 2 1 ヒルデン・コーゼンベルク 1 0
- (72)発明者 ヘンスラー, ゲルト  
ドイツ連邦共和国デー 5 1 3 8 1 レーフエルクーゼン・アムアレンツベルク 5 8 アー

審査官 清野 千秋

(56)参考文献 特開平 0 2 - 0 0 1 4 8 4 ( J P , A )

(58)調査した分野(Int.Cl., D B 名)

C07D273/01

CA(STN)

REGISTRY(STN)