



PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

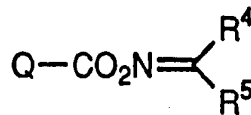
<p>(51) 国際特許分類6 C07D 231/14, 277/56, A01N 43/56, 43/78</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO95/29162 (43) 国際公開日 1995年11月2日(02.11.95)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP95/00809 (22) 国際出願日 1995年4月25日(25.04.95)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平6/88366 1994年4月26日(26.04.94) JP 特願平7/73913 1995年3月30日(30.03.95) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)[JP/JP] 〒101 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 秋山茂明(AKIYAMA, Shigeaki)[JP/JP] 武山敏明(TAKEYAMA, Toshiaki)[JP/JP] 鈴木博之(SUZUKI, Hiroyuki)[JP/JP] 渡辺淳一(WATANABE, Junichi)[JP/JP] 中島康之(NAKAJIMA, Yasuyuki)[JP/JP] 安見由章(YASUMI, Yoshiaki)[JP/JP] 〒274 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba, (JP)</p>	<p>大宅博司(OHYA, Hiroshi)[JP/JP] 笹部 繁(SASABE, Shigeru)[JP/JP] 西岡正憲(NISHIOKA, Masanori)[JP/JP] 古里 孝(FURUSATO, Takashi)[JP/JP] 〒349-02 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 萼 経夫, 外(HANABUSA, Tsuneo et al.) 〒101 東京都千代田区神田駿河台1丁目6番地 お茶の水スクエアB館, 萼特許事務所 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AU, CN, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>	

(54) Title : CARBOXYLIC ACID/OXIME ESTER DERIVATIVE AND AGROHORTICULTURAL BACTERICIDE

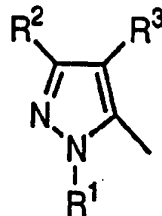
(54) 発明の名称 カルボン酸オキシムエステル誘導体および農園芸用殺菌剤

(57) Abstract

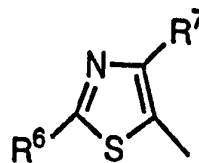
A novel compound represented by general formula (1), having an excellent agrohorticultural bactericidal effect and being free from chemical injury to useful crops, thus being useful as an agrohorticultural bactericide, wherein Q represents a group represented by general formula [A-1] or [A-2], and R¹ to R⁷ represent each hydrogen, C₁-C₆ alkyl, etc.



(1)



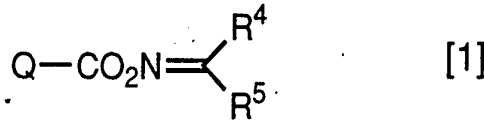
[A-1]



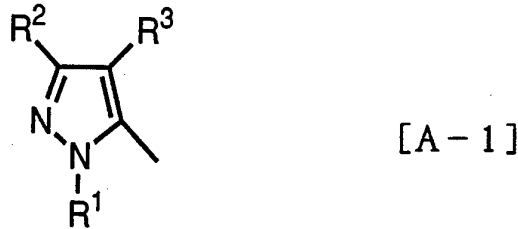
[A-2]

(57) 要約

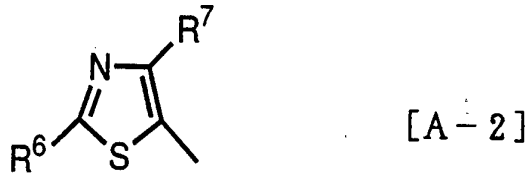
式 [1] :



(上記式中、Qは、式 [A-1] :



で表される基または式 [A-2] :



で表される基であり、

R¹ ~ R⁷ は、水素原子、C₁ ~ C₆ アルキル基などである。]

で表されるカルボン酸オキシムエステル誘導体。

式 [1] の化合物は、新規化合物であり、優れた農園芸用殺菌作用を示し、有用作物に対する薬害も認められないため、農園芸用殺菌剤として有用である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AM	アルメニア	EE	エストニア	LK	スリランカ	RU	ロシア連邦
AT	オーストリア	ES	スペイン	LR	リベリア	SD	スーダン
AU	オーストラリア	FI	フィンランド	LT	リトアニア	SE	スウェーデン
BB	バルバドス	FR	フランス	LU	ルクセンブルグ	SG	シンガポール
BE	ベルギー	GA	ガボン	LV	ラトヴィア	SI	スロヴェニア
BF	ブルキナ・ファソ	GB	イギリス	MC	モナコ	SK	スロヴァキア共和国
BG	ブルガリア	GE	グルジア	MD	モルドバ	SN	セネガル
BJ	ベナン	GN	ギニア	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
BR	ブラジル	GR	ギリシャ	ML	マリ	TD	チャド
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	TG	トーゴ
CA	カナダ	IE	アイルランド	MR	モーリタニア	TJ	タジキスタン
CF	中央アフリカ共和国	IS	アイスランド	MW	マラウイ	TM	トルクメニスタン
CG	コンゴ	IT	イタリア	MX	メキシコ	TT	トリニダード・トバゴ
CH	スイス	JP	日本	NE	ニジェール	UA	ウクライナ
CI	コート・ジボアール	KE	ケニア	NL	オランダ	UG	ウガンダ
CM	カメルーン	KG	キルギスタン	NO	ノルウェー	US	米国
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NZ	ニュージーランド	UZ	ウズベキスタン共和国
CZ	チェッコ共和国	KR	大韓民国	PL	ポーランド	VN	ヴェトナム
DE	ドイツ	KZ	カザフスタン	PT	ポルトガル		
DK	デンマーク	LI	リヒテンシュタイン	RO	ルーマニア		

明 細 書

カルボン酸オキシムエステル誘導体および農園芸用殺菌剤

技術分野

本発明は、新規なカルボン酸オキシムエステル誘導体、および該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

背景技術

特開平 3 - 1 2 0 2 5 5 号公報、特開平 4 - 1 4 5 0 8 1 号公報および特開昭 5 8 - 2 4 5 6 6 号公報には、ある種のピラゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体が、除草活性を有することが記載されている。

また特開平 3 - 1 4 5 4 7 8 号公報には、ある種のチアゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体が除草活性を有することが記載されている。

また米国特許第 4 5 8 1 0 6 0 号公報及び第 4 5 4 8 7 5 6 号公報にも、ある種のヘテロ環カルボン酸オキシムエステル誘導体が薬害軽減作用及び植調作用を有することが記載されているが、上記の特許等において殺菌活性に関しては、何も開示されていない。

さらに、特開昭 6 1 - 2 6 7 5 4 3 号公報、および特開平 6 - 8 7 8 1 2 号公報には、ある種のヘテロ環カルボン酸オキシムエステル誘導体が殺菌活性を有することが記載されている。しかしながらピラゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体及びチアゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体に関しては何ら記載されていない。

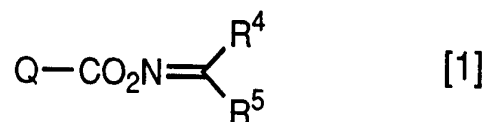
既存の農園芸用殺菌剤においても、耐性菌の出現や環境安全性などの問題、またその効力、残効性等の点で満足すべきものではなく、植物病害に対して更

に有用な農園芸用殺菌剤の開発が要望されている。

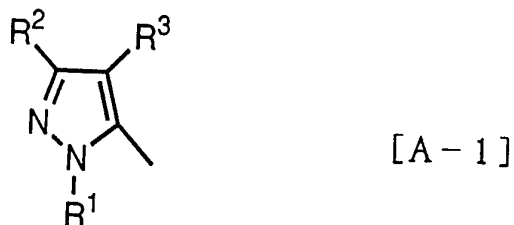
発明の開示

本発明者らは、このような状況に鑑み、優れた殺菌活性を有する化合物を開発すべく、種々検討を重ねた結果、下記式〔1〕で示されるカルボン酸オキシムエステル誘導体が、作物には安全で優れた殺菌活性を有することを見出し、本発明に至った。

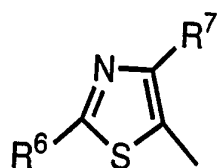
すなわち、本発明は式〔1〕：



〔上記式中、Qは、式〔A-1〕：



で表される基または式〔A-2〕：



[A-2]

で表される基であり、

R^1 は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル基、無置換フェニル基または置換フェニル基（その置換基はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基もしくは $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基）であり、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコシキカルボニル基またはシアノ基であり、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、更にまたは R^2 と R^3 とが一緒になり $C_3 \sim C_6$ アルキレン基を形成してもよく、

R^4 および R^5 は、それぞれ独立に、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基で置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_4$ アルキルチオアルキル基、無置換フェニル基または置換フェニル基（その置換基はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基もしくは $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基）であり、更にまたは R^4 と R^5 が一緒になり $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を形成あるいは酸素原子もしくは硫黄原子を含むヘテロサイクルを形成してもよく、

R^6 、 R^7 は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基である。]

で表されるカルボン酸オキシムエステル誘導体および該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤、特にイネいもち病防除剤に関するものである。

R^1 は好ましくは $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、

R^2 は好ましくは塩素原子、臭素原子、シアノ基または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、 R^3 は好ましくは水素原子であり、

R^4 および R^5 は好ましくはそれぞれ独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、

R^6 は好ましくは塩素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、

R^7 は好ましくは $C_1 \sim C_4$ アルキル基である。

本発明において、上記式中の置換基は下記の意味を有する。

ハロゲン原子はフッ素、塩素、臭素およびヨウ素を意味し、好ましくはフッ素、塩素および臭素があげられる。

$C_1 \sim C_8$ アルキル基としては、例えばメチル、エチル、 n -若しくは i -プロピル、 n -、 s -、 i -若しくは t -ブチル、ペンチル、ヘキシルが挙げられる。 $C_1 \sim C_4$ アルキル基としてはメチル、エチル、 n -若しくは i -プロピル、 n -、 s -、 i -若しくは t -ブチルが挙げられる。

$C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基としては、例えばフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、トリフルオロエチル、トリクロロエチル、トリフルオロプロピル、クロロブチルなどが挙げられる。 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基としては、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルなどが挙げられる。

$C_2 \sim C_8$ アルケニル基としては、ビニル、アリル、3-ブテニル、1, 3-ブタジエニル、4-ペンテニル、2, 4-ペンタジエニル、5-ヘキセニル

などが挙げられる。

C₂ ~ C₆ アルキニル基としては、エチニル、プロパルギル、3-ブチニル、4-ペンチニル、5-ヘキシニルなどが挙げられる。

C₁ ~ C₄ アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、n-若しくはi-プロポキシ、n-、s-、i-若しくはt-ブトキシが挙げられる。

酸素原子もしくは硫黄原子を含むヘテロサイクルとしては、テトラヒドロフラン、テトラヒドロチオフェン、テトラヒドロピランなどが挙げられる。

本発明に係る化合物は、シャーレ内試験では、イネいもち病菌に対する抗菌作用は、ほとんどないか、あるいは極めて弱い。しかしながら、イネに直接散布するか、水面施用することにより優れたイネいもち病防除作用を示す。すなわち、本発明に係る化合物が、イネ体内での抗菌性物質の生産を促し、病害に対する抵抗性を付与することにより、いもち病菌の感染を防ぎ、発病を妨げているものと考えられる。

上記の式 [1] の化合物の内、好ましい化合物の群を下に列記する：

(1)式中、Qは式 [A-1] の基である式 [1] の化合物；

(2)式中、Qは式 [A-1] の基であり、R¹ はC₁ ~ C₄ アルキル基であり、R² が塩素原子、臭素原子、シアノ基またはC₁ ~ C₄ アルキル基であり、R³ が水素原子であり、R⁴ およびR⁵ は、それぞれ独立してC₁ ~ C₄ アルキル基である式 [1] の化合物；

(3)式中、Qは式 [A-1] の基であり、R¹ はメチル基であり、R² は塩素原子、臭素原子またはメチル基であり、R³ は、水素原子であり、R⁴ は、メチル基であり、R⁵ は、t-ブチル基である式 [1] の化合物；

(4)式中、Qは式 [A-2] の基である式 [1] の化合物；

(5)式中、Qは式 [A-2] の基であり、R⁶ は、塩素原子またはC₁ ~ C₄

アルキル基であり、 R^7 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、 R^4 および R^5 は、それぞれ独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である式 [1] の化合物；および

(6)式中、 Q は式 [A-2] の基であり、 R^6 は塩素原子であり、 R^7 はメチル基であり、 R^4 はメチル基であり、 R^5 は *t*-ブチル基である式 [1] の化合物。

次に式 [1] で表される本発明化合物を第1表および第2表に示す。

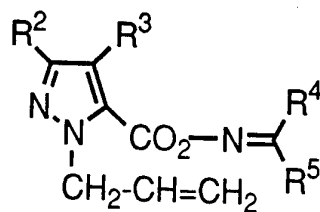
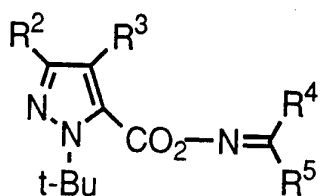
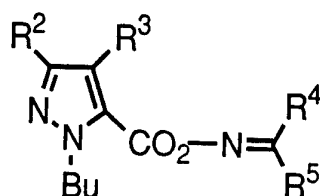
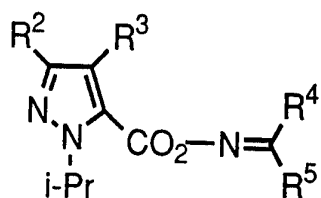
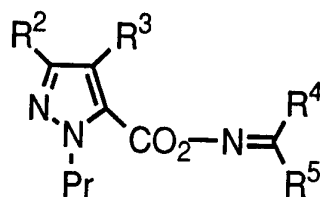
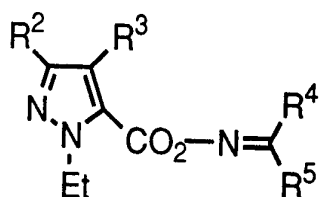
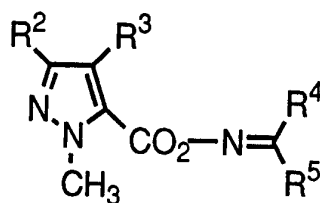
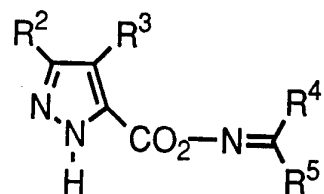
但し、本発明化合物は、これらのみに限定されるものではない。

また、本発明化合物には、*E*および*Z* (*syn*および*anti*) の2種類の異性体が存在するが、本発明は、これらの異性体も包含するものである。

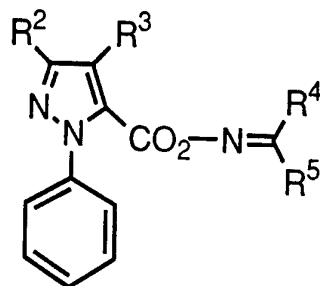
なお、表中の *Ph* はフェニル基を、*Et* はエチル基を、*Pr* はプロピル基を、*Bu* はブチル基を、*Pen* はペンチル基を、*Hex* はヘキシル基を示す。

c はシクロを、*i* はイソを、*s* はセカンダリーを、*t* はターシャリーを示す。

第 1 表



または



R^2	R^3	R^4	R^5
CH_3	H	H	H
CH_3	H	H	CH_3
CH_3	H	H	Et
CH_3	H	H	Pr
CH_3	H	H	i-Pr
CH_3	H	H	Bu
CH_3	H	H	i-Bu
CH_3	H	H	s-Bu
CH_3	H	H	t-Bu
CH_3	H	H	Pen
CH_3	H	H	Hex
CH_3	H	H	c-Pr
CH_3	H	H	1- CH_3 -c-Pr
CH_3	H	H	c-Bu
CH_3	H	H	c-Pen
CH_3	H	H	c-Hex
CH_3	H	H	$CH=CH_2$
CH_3	H	H	$CH=CHCH_3$
CH_3	H	H	$CH_2CH=CH_2$
CH_3	H	H	$CH=C(CH_3)_2$
CH_3	H	H	$CH_2C(CH_3)=CH_2$
CH_3	H	H	$C\equiv CH$
CH_3	H	H	$C\equiv CCH_3$

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	H	CH ₂ C≡CH
CH ₃	H	H	CH ₂ C≡CCH ₃
CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH
CH ₃	H	H	Ph
CH ₃	H	H	4-Cl-Ph
CH ₃	H	H	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	H	H	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	H	-C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
CH ₃	H	-(CH ₂) ₃ -	
CH ₃	H	-(CH ₂) ₄ -	
CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -	
CH ₃	H	-(CH ₂) ₆ -	
CH ₃	H	-(CH ₂) ₇ -	
CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
CH ₃	H	CH ₃	Et
CH ₃	H	CH ₃	Pr
CH ₃	H	CH ₃	i-Pr
CH ₃	H	CH ₃	Bu
CH ₃	H	CH ₃	i-Bu
CH ₃	H	CH ₃	s-Bu
CH ₃	H	CH ₃	t-Bu
CH ₃	H	CH ₃	Pen

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	CH ₃	Hex
CH ₃	H	CH ₃	c-Pr
CH ₃	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	H	CH ₃	c-Bu
CH ₃	H	CH ₃	c-Pen
CH ₃	H	CH ₃	c-Hex
CH ₃	H	CH ₃	CH=CH ₂
CH ₃	H	CH ₃	CH=CHCH ₃
CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
CH ₃	H	CH ₃	C≡CH
CH ₃	H	CH ₃	C≡CCH ₃
CH ₃	H		-CH ₂ S-(CH ₂) ₂ -
CH ₃	H		-CH(CH ₃)O-(CH ₂) ₂ -
CH ₃	H	CH ₃	CH(SCH ₃)CH ₃
CH ₃	H	CH ₃	Ph
CH ₃	H	CH ₃	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	H	CH ₃	4-Cl-Ph
CH ₃	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	H	Et	Et
CH ₃	H	Et	Pr

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	Et	i-Pr
CH ₃	H	Et	Bu
CH ₃	H	Et	i-Bu
CH ₃	H	Et	s-Bu
CH ₃	H	Et	t-Bu
CH ₃	H	Et	Pen
CH ₃	H	Et	Hex
CH ₃	H	Et	c-Pr
CH ₃	H	Et	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	H	Et	c-Bu
CH ₃	H	Et	c-Pen
CH ₃	H	Et	c-Hex
CH ₃	H	Et	CH=CH ₂
CH ₃	H	Et	CH=CHCH ₃
CH ₃	H	Et	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	H	Et	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	H	Et	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
CH ₃	H	Et	C≡CH
CH ₃	H	Et	C≡CCH ₃
CH ₃	H	Et	CH ₂ C≡CH
CH ₃	H	Et	CH ₂ C≡CCH ₃
CH ₃	H	Et	CH ₂ CH ₂ C≡CH

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	Et	Ph
CH ₃	H	Et	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	H	Et	4-Cl-Ph
CH ₃	H	Et	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	H	Pr	Pr
CH ₃	H	Pr	i-Pr
CH ₃	H	Pr	Bu
CH ₃	H	Pr	i-Bu
CH ₃	H	Pr	s-Bu
CH ₃	H	Pr	t-Bu
CH ₃	H	Pr	c-Pr
CH ₃	H	Pr	c-Hex
CH ₃	H	Pr	CH=CH ₂
CH ₃	H	Pr	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	H	Pr	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	H	Pr	CH ₂ C≡CH
CH ₃	H	Pr	Ph
CH ₃	H	Pr	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	H	Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	H	Pr	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	H	c-Pr	i-Pr
CH ₃	H	c-Pr	Bu

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	c-Pr	t-Bu
CH ₃	H	c-Pr	c-Pr
CH ₃	H	c-Pr	c-Hex
CH ₃	H	c-Pr	CH=CH ₂
CH ₃	H	c-Pr	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	H	c-Pr	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	H	c-Pr	CH ₂ C≡CH
CH ₃	H	c-Pr	Ph
CH ₃	H	c-Pr	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	H	c-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	H	c-Pr	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	H	c-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	H	c-Hex	i-Pr
CH ₃	H	c-Hex	t-Bu
CH ₃	H	c-Hex	c-Hex
CH ₃	H	c-Hex	CH=CH ₂
CH ₃	H	c-Hex	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	H	c-Hex	Ph
CH ₃	H	c-Hex	4-Cl-Ph
CH ₃	H	CH=CH ₂	CH=CH ₂
CH ₃	H	CH=CH ₂	Ph
CH ₃	H	CH=CH ₂	4-Cl-Ph

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	Ph	Ph
CH ₃	H	Ph	4-Cl-Ph
Et	H	CH ₃	CH ₃
Et	H	CH ₃	Et
Et	H	CH ₃	t-Bu
Et	H	CH ₃	c-Pr
Et	H	CH ₃	CH=CH ₂
Et	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Et	H	CH ₃	4-Cl-Ph
Et	H	-(CH ₂) ₂ -	
Et	H	-(CH ₂) ₄ -	
Et	H	-(CH ₂) ₅ -	
Pr	H	CH ₃	CH ₃
Pr	H	CH ₃	Et
Pr	H	CH ₃	t-Bu
Pr	H	CH ₃	c-Pr
Pr	H	CH ₃	CH=CH ₂
Pr	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Pr	H	CH ₃	4-Cl-Ph
Pr	H	-(CH ₂) ₂ -	
Pr	H	-(CH ₂) ₄ -	
Pr	H	-(CH ₂) ₅ -	

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
i-Pr	H	CH ₃	CH ₃
i-Pr	H	CH ₃	Et
i-Pr	H	CH ₃	t-Bu
i-Pr	H	CH ₃	c-Pr
i-Pr	H	CH ₃	CH=CH ₂
i-Pr	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
i-Pr	H	CH ₃	4-Cl-Ph
i-Pr	H	-(CH ₂) ₂ -	
i-Pr	H	-(CH ₂) ₄ -	
i-Pr	H	-(CH ₂) ₅ -	
t-Bu	H	CH ₃	CH ₃
t-Bu	H	CH ₃	Et
t-Bu	H	CH ₃	t-Bu
t-Bu	H	CH ₃	c-Pr
t-Bu	H	CH ₃	CH=CH ₂
t-Bu	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
t-Bu	H	CH ₃	4-Cl-Ph
t-Bu	H	-(CH ₂) ₂ -	
t-Bu	H	-(CH ₂) ₄ -	
t-Bu	H	-(CH ₂) ₅ -	
CF ₃	H	CH ₃	CH ₃
CF ₃	H	CH ₃	Et

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	H	CH ₃	t-Bu
CF ₃	H	CH ₃	c-Pr
CF ₃	H	CH ₃	CH=CH ₂
CF ₃	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CF ₃	H	CH ₃	4-Cl-Ph
CF ₃	H	-(CH ₂) ₂ -	
CF ₃	H	-(CH ₂) ₄ -	
CF ₃	H	-(CH ₂) ₅ -	
H	H	CH ₃	CH ₃
H	H	CH ₃	Et
H	H	CH ₃	t-Bu
H	H	CH ₃	c-Pr
H	H	CH ₃	CH=CH ₂
H	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
H	H	CH ₃	4-Cl-Ph
H	H	-(CH ₂) ₂ -	
H	H	-(CH ₂) ₄ -	
H	H	-(CH ₂) ₅ -	
Cl	H	H	H
Cl	H	H	CH ₃
Cl	H	H	Et
Cl	H	H	Pr

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	H	H	i-Pr
Cl	H	H	Bu
Cl	H	H	i-Bu
Cl	H	H	s-Bu
Cl	H	H	t-Bu
Cl	H	H	Pen
Cl	H	H	Hex
Cl	H	H	c-Pr
Cl	H	H	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	H	H	c-Bu
Cl	H	H	c-Pen
Cl	H	H	c-Hex
Cl	H	H	CH=CH ₂
Cl	H	H	CH=CHCH ₃
Cl	H	H	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	H	H	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	H	H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
Cl	H	H	C≡CH
Cl	H	H	C≡CCH ₃
Cl	H	H	CH ₂ C≡CH
Cl	H	H	CH ₂ C≡CCH ₃
Cl	H	H	Ph

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph
Cl	H	H	4-Cl-Ph
Cl	H	H	4-CH ₃ -Ph
Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph
Cl	H	-C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
Cl	H	-(CH ₂) ₃ -	
Cl	H	-(CH ₂) ₄ -	
Cl	H	-(CH ₂) ₅ -	
Cl	H	-(CH ₂) ₆ -	
Cl	H	-(CH ₂) ₇ -	
Cl	H	CH ₃	CH ₃
Cl	H	CH ₃	Et
Cl	H	CH ₃	Pr
Cl	H	CH ₃	i-Pr
Cl	H	CH ₃	Bu
Cl	H	CH ₃	i-Bu
Cl	H	CH ₃	s-Bu
Cl	H	CH ₃	t-Bu
Cl	H	CH ₃	Pen
Cl	H	CH ₃	Hex
Cl	H	CH ₃	c-Pr
Cl	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	H	CH ₃	c-Bu
Cl	H	CH ₃	c-Pen
Cl	H	CH ₃	c-Hex
Cl	H	CH ₃	CH=CH ₂
Cl	H	CH ₃	CH=CHCH ₃
Cl	H	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	H	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
Cl	H	CH ₃	C≡CH
Cl	H	CH ₃	C≡CCH ₃
Cl	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH
Cl	H	CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃
Cl	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C≡CH
Cl	H	CH ₃	Ph
Cl	H	CH ₃	4-CH ₃ -Ph
Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph
Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
Cl	H	Et	Et
Cl	H	Et	Pr
Cl	H	Et	i-Pr
Cl	H	Et	Bu
Cl	H	Et	i-Bu

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	H	Et	s-Bu
Cl	H	Et	t-Bu
Cl	H	Et	Pen
Cl	H	Et	Hex
Cl	H	Et	c-Pr
Cl	H	Et	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	H	Et	c-Bu
Cl	H	Et	c-Pen
Cl	H	Et	c-Hex
Cl	H	Et	CH=CH ₂
Cl	H	Et	CH=CHCH ₃
Cl	H	Et	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	H	Et	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	H	Et	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
Cl	H	Et	C≡CH
Cl	H	Et	C≡CCH ₃
Cl	H	Et	CH ₂ C≡CH
Cl	H	Et	CH ₂ C≡CCH ₃
Cl	H	Et	CH ₂ CH ₂ C≡CH
Cl	H	Et	Ph
Cl	H	Et	4-CH ₃ -Ph
Cl	H	Et	4-Cl-Ph

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	H	Et	4-OCH ₃ -Ph
Cl	H	Pr	Pr
Cl	H	Pr	i-Pr
Cl	H	Pr	Bu
Cl	H	Pr	i-Bu
Cl	H	Pr	s-Bu
Cl	H	Pr	t-Bu
Cl	H	Pr	c-Pr
Cl	H	Pr	c-Hex
Cl	H	Pr	CH=CH ₂
Cl	H	Pr	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	H	Pr	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	H	Pr	CH ₂ C≡CH
Cl	H	Pr	Ph
Cl	H	Pr	4-CH ₃ -Ph
Cl	H	Pr	4-Cl-Ph
Cl	H	Pr	4-OCH ₃ -Ph
Cl	H	c-Pr	i-Pr
Cl	H	c-Pr	Bu
Cl	H	c-Pr	t-Bu
Cl	H	c-Pr	c-Pr
Cl	H	c-Pr	c-Hex

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	H	c-Pr	CH=CH ₂
Cl	H	c-Pr	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	H	c-Pr	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	H	c-Pr	CH ₂ C≡CH
Cl	H	c-Pr	Ph
Cl	H	c-Pr	4-CH ₃ -Ph
Cl	H	c-Pr	4-Cl-Ph
Cl	H	c-Pr	4-CH ₃ -Ph
Cl	H	c-Pr	4-Cl-Ph
Cl	H	c-Hex	i-Pr
Cl	H	c-Hex	t-Bu
Cl	H	c-Hex	c-Hex
Cl	H	c-Hex	CH=CH ₂
Cl	H	c-Hex	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	H	c-Hex	Ph
Cl	H	c-Hex	4-Cl-Ph
Cl	H	CH=CH ₂	CH=CH ₂
Cl	H	CH=CH ₂	Ph
Cl	H	CH=CH ₂	4-Cl-Ph
Cl	H	Ph	Ph
Cl	H	Ph	4-Cl-Ph
Cl	H	t-Bu	4-Cl-Ph

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	F	H	Et
CH ₃	F	H	t-Bu
CH ₃	F	H	c-Pen
CH ₃	F	CH ₃	CH ₃
CH ₃	F	CH ₃	Et
CH ₃	F	CH ₃	Pr
CH ₃	F	CH ₃	i-Pr
CH ₃	F	CH ₃	t-Bu
CH ₃	F	CH ₃	Pen
CH ₃	F	CH ₃	Hex
CH ₃	F	CH ₃	c-Pr
CH ₃	F	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	F	CH ₃	CH=CH ₂
CH ₃	F	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	F	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	F	CH ₃	CH ₂ C≡CH
CH ₃	F	CH ₃	CH=CHCH ₃
CH ₃	F	CH ₃	4-Cl-Ph
CH ₃	F	-(CH ₂) ₂ -	
CH ₃	F	-(CH ₂) ₃ -	
CH ₃	F	-(CH ₂) ₄ -	
CH ₃	F	-(CH ₂) ₅ -	

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	F	Et	Et
CH ₃	F	Et	Pr
CH ₃	F	Et	i-Pr
CH ₃	F	Et	t-Bu
CH ₃	F	Et	c-Pr
CH ₃	F	Et	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	F	Et	CH=CH ₂
CH ₃	F	Et	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	F	Et	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	F	Et	CH ₂ C≡CH
CH ₃	F	Et	4-Cl-Ph
CH ₃	F	Pr	Pr
CH ₃	F	Pr	i-Pr
CH ₃	F	Pr	t-Bu
CH ₃	F	Pr	c-Pr
CH ₃	F	Pr	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	F	Pr	CH=CH ₂
CH ₃	F	Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	F	i-Pr	i-Pr
CH ₃	F	i-Pr	t-Bu
CH ₃	F	i-Pr	c-Pr
CH ₃	F	i-Pr	CH=CH ₂

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	F	i-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	F	c-Pr	t-Bu
CH ₃	F	c-Pr	c-Pr
CH ₃	F	c-Pr	CH=CH ₂
CH ₃	F	c-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	F	CH=CH ₂	CH=CH ₂
CH ₃	F	CH=CH ₂	Ph
CH ₃	F	CH=CH ₂	4-Cl-Ph
CH ₃	F	Ph	Ph
CH ₃	F	Ph	4-Cl-Ph
CH ₃	Cl	H	CH ₃
CH ₃	Cl	H	Et
CH ₃	Cl	H	t-Bu
CH ₃	Cl	H	c-Pen
CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
CH ₃	Cl	CH ₃	Et
CH ₃	Cl	CH ₃	Pr
CH ₃	Cl	CH ₃	i-Pr
CH ₃	Cl	CH ₃	t-Bu
CH ₃	Cl	CH ₃	Pen
CH ₃	Cl	CH ₃	Hex
CH ₃	Cl	CH ₃	c-Pr

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	Cl	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	Cl	CH ₃	CH=CH ₂
CH ₃	Cl	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂ C≡CH
CH ₃	Cl	CH ₃	CH=CHCH ₃
CH ₃	Cl	CH ₃	4-Cl-Ph
CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
CH ₃	Cl	Et	Et
CH ₃	Cl	Et	Pr
CH ₃	Cl	Et	i-Pr
CH ₃	Cl	Et	t-Bu
CH ₃	Cl	Et	c-Pr
CH ₃	Cl	Et	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	Cl	Et	CH=CH ₂
CH ₃	Cl	Et	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	Cl	Et	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	Cl	Et	CH ₂ C≡CH
CH ₃	Cl	Et	4-Cl-Ph

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	Cl	Pr	Pr
CH ₃	Cl	Pr	i-Pr
CH ₃	Cl	Pr	t-Bu
CH ₃	Cl	Pr	c-Pr
CH ₃	Cl	Pr	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	Cl	Pr	CH=CH ₂
CH ₃	Cl	Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	Cl	i-Pr	i-Pr
CH ₃	Cl	i-Pr	t-Bu
CH ₃	Cl	i-Pr	c-Pr
CH ₃	Cl	i-Pr	CH=CH ₂
CH ₃	Cl	i-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	Cl	c-Pr	t-Bu
CH ₃	Cl	c-Pr	c-Pr
CH ₃	Cl	c-Pr	CH=CH ₂
CH ₃	Cl	c-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	Cl	CH=CH ₂	CH=CH ₂
CH ₃	Cl	CH=CH ₂	Ph
CH ₃	Cl	CH=CH ₂	4-Cl-Ph
CH ₃	NO ₂	CH ₃	t-Bu
	-(CH ₂) ₈ -	CH ₃	t-Bu
Et	F	CH ₃	CH ₃

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Et	F	CH ₃	Et
Et	F	CH ₃	t-Bu
Et	F	CH ₃	c-Pr
Et	F	CH ₃	CH=CH ₂
Et	F	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Et	F	CH ₃	4-Cl-Ph
Et	F	-(CH ₂) ₂ -	
Et	F	-(CH ₂) ₄ -	
Et	F	-(CH ₂) ₅ -	
Pr	F	CH ₃	CH ₃
Pr	F	CH ₃	Et
Pr	F	CH ₃	t-Bu
Pr	F	CH ₃	c-Pr
Pr	F	CH ₃	CH=CH ₂
Pr	F	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Pr	F	CH ₃	4-Cl-Ph
Pr	F	-(CH ₂) ₂ -	
Pr	F	-(CH ₂) ₄ -	
Pr	F	-(CH ₂) ₅ -	
i-Pr	F	CH ₃	CH ₃
i-Pr	F	CH ₃	Et
i-Pr	F	CH ₃	t-Bu

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
i-Pr	F	CH ₃	c-Pr
i-Pr	F	CH ₃	CH=CH ₂
i-Pr	F	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
i-Pr	F	CH ₃	4-Cl-Ph
i-Pr	F	-(CH ₂) ₂ -	
i-Pr	F	-(CH ₂) ₄ -	
i-Pr	F	-(CH ₂) ₅ -	
t-Bu	F	CH ₃	CH ₃
t-Bu	F	CH ₃	Et
t-Bu	F	CH ₃	t-Bu
t-Bu	F	CH ₃	c-Pr
t-Bu	F	CH ₃	CH=CH ₂
t-Bu	F	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
t-Bu	F	CH ₃	4-Cl-Ph
t-Bu	F	-(CH ₂) ₂ -	
t-Bu	F	-(CH ₂) ₄ -	
t-Bu	F	-(CH ₂) ₅ -	
CF ₃	F	CH ₃	CH ₃
CF ₃	F	CH ₃	Et
CF ₃	F	CH ₃	t-Bu
CF ₃	F	CH ₃	c-Pr
CF ₃	F	CH ₃	CH=CH ₂

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	F	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CF ₃	F	CH ₃	4-Cl-Ph
CF ₃	F	-(CH ₂) ₂ -	
CF ₃	F	-(CH ₂) ₄ -	
CF ₃	F	-(CH ₂) ₅ -	
Bt	Cl	CH ₃	CH ₃
Bt	Cl	CH ₃	Et
Bt	Cl	CH ₃	t-Bu
Bt	Cl	CH ₃	c-Pr
Bt	Cl	CH ₃	CH=CH ₂
Bt	Cl	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Bt	Cl	CH ₃	4-Cl-Ph
Bt	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
Bt	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
Bt	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
Pr	Cl	CH ₃	CH ₃
Pr	Cl	CH ₃	Et
Pr	Cl	CH ₃	t-Bu
Pr	Cl	CH ₃	c-Pr
Pr	Cl	CH ₃	CH=CH ₂
Pr	Cl	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Pr	Cl	CH ₃	4-Cl-Ph

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Pr	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
Pr	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
Pr	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
i-Pr	Cl	CH ₃	CH ₃
i-Pr	Cl	CH ₃	Et
i-Pr	Cl	CH ₃	t-Bu
i-Pr	Cl	CH ₃	c-Pr
i-Pr	Cl	CH ₃	CH=CH ₂
i-Pr	Cl	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
i-Pr	Cl	CH ₃	4-Cl-Ph
i-Pr	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
i-Pr	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
i-Pr	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
t-Bu	Cl	CH ₃	CH ₃
t-Bu	Cl	CH ₃	Et
t-Bu	Cl	CH ₃	t-Bu
t-Bu	Cl	CH ₃	c-Pr
t-Bu	Cl	CH ₃	CH=CH ₂
t-Bu	Cl	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
t-Bu	Cl	CH ₃	4-Cl-Ph
t-Bu	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
t-Bu	Cl	-(CH ₂) ₄ -	

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
t-Bu	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
CF ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
CF ₃	Cl	CH ₃	Et
CF ₃	Cl	CH ₃	t-Bu
CF ₃	Cl	CH ₃	c-Pr
CF ₃	Cl	CH ₃	CH=CH ₂
CF ₃	Cl	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CF ₃	Cl	CH ₃	4-Cl-Ph
CF ₃	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
CF ₃	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
CF ₃	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
Cl	F	H	CH ₃
Cl	F	H	Et
Cl	F	H	t-Bu
Cl	F	H	c-Pen
Cl	F	CH ₃	CH ₃
Cl	F	CH ₃	Et
Cl	F	CH ₃	Pr
Cl	F	CH ₃	i-Pr
Cl	F	CH ₃	t-Bu
Cl	F	CH ₃	Pen
Cl	F	CH ₃	Hex

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	F	CH ₃	c-Pr
Cl	F	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	F	CH ₃	CH=CH ₂
Cl	F	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	F	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	F	CH ₃	CH ₂ C≡CH
Cl	F	CH ₃	CH=CHCH ₃
Cl	F	CH ₃	4-Cl-Ph
Cl	F	-(CH ₂) ₂ -	
Cl	F	-(CH ₂) ₃ -	
Cl	F	-(CH ₂) ₄ -	
Cl	F	-(CH ₂) ₅ -	
Cl	F	Et	Et
Cl	F	Et	Pr
Cl	F	Et	i-Pr
Cl	F	Et	t-Bu
Cl	F	Et	c-Pr
Cl	F	Et	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	F	Et	CH=CH ₂
Cl	F	Et	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	F	Et	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	F	Et	CH ₂ C≡CH

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	F	Bt	4-Cl-Ph
Cl	F	Pr	Pr
Cl	F	Pr	i-Pr
Cl	F	Pr	t-Bu
Cl	F	Pr	c-Pr
Cl	F	Pr	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	F	Pr	CH=CH ₂
Cl	F	Pr	4-Cl-Ph
Cl	F	i-Pr	i-Pr
Cl	F	i-Pr	t-Bu
Cl	F	i-Pr	c-Pr
Cl	F	i-Pr	CH=CH ₂
Cl	F	i-Pr	4-Cl-Ph
Cl	F	c-Pr	t-Bu
Cl	F	c-Pr	c-Pr
Cl	F	c-Pr	CH=CH ₂
Cl	F	c-Pr	4-Cl-Ph
Cl	F	CH=CH ₂	CH=CH ₂
Cl	F	CH=CH ₂	Ph
Cl	F	CH=CH ₂	4-Cl-Ph
Cl	F	Ph	Ph
Cl	F	Ph	4-Cl-Ph

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	Cl	H	CH ₃
Cl	Cl	H	Et
Cl	Cl	H	t-Bu
Cl	Cl	H	c-Pen
Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
Cl	Cl	CH ₃	Et
Cl	Cl	CH ₃	Pr
Cl	Cl	CH ₃	i-Pr
Cl	Cl	CH ₃	t-Bu
Cl	Cl	CH ₃	Pen
Cl	Cl	CH ₃	Hex
Cl	Cl	CH ₃	c-Pr
Cl	Cl	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	Cl	CH ₃	CH=CH ₂
Cl	Cl	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	Cl	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	Cl	CH ₃	CH ₂ C≡CH
Cl	Cl	CH ₃	CH=CHCH ₃
Cl	Cl	CH ₃	4-Cl-Ph
Cl	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
Cl	Cl	-(CH ₂) ₈ -	
Cl	Cl	-(CH ₂) ₄ -	

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
Cl	Cl	Et	Et
Cl	Cl	Et	Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr
Cl	Cl	Et	t-Bu
Cl	Cl	Et	c-Pr
Cl	Cl	Et	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	Cl	Et	CH=CH ₂
Cl	Cl	Et	CH=C(CH ₃) ₂
Cl	Cl	Et	CH ₂ CH=CH ₂
Cl	Cl	Et	CH ₂ C≡CH
Cl	Cl	Et	4-Cl-Ph
Cl	Cl	Pr	Pr
Cl	Cl	Pr	i-Pr
Cl	Cl	Pr	t-Bu
Cl	Cl	Pr	c-Pr
Cl	Cl	Pr	1-CH ₃ -c-Pr
Cl	Cl	Pr	CH=CH ₂
Cl	Cl	Pr	4-Cl-Ph
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	t-Bu
Cl	Cl	i-Pr	c-Pr

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Cl	Cl	i-Pr	CH=CH ₂
Cl	Cl	i-Pr	4-Cl-Ph
Cl	Cl	c-Pr	t-Bu
Cl	Cl	c-Pr	c-Pr
Cl	Cl	c-Pr	CH=CH ₂
Cl	Cl	c-Pr	4-Cl-Ph
Cl	Cl	CH=CH ₂	CH=CH ₂
Cl	Cl	CH=CH ₂	Ph
Cl	Cl	CH=CH ₂	4-Cl-Ph
Cl	Cl	Ph	Ph
Cl	Cl	Ph	4-Cl-Ph
CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
CH ₃	Br	CH ₃	Bt
CH ₃	Br	CH ₃	t-Bu
CH ₃	Br	CH ₃	c-Pr
CH ₃	Br	CH ₃	CH=CH ₂
CH ₃	Br	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	Br	CH ₃	4-Cl-Ph
CH ₃	Br	-(CH ₂) ₂ -	
CH ₃	Br	-(CH ₂) ₄ -	
CH ₃	Br	-(CH ₂) ₆ -	
CH ₃	I	CH ₃	CH ₃

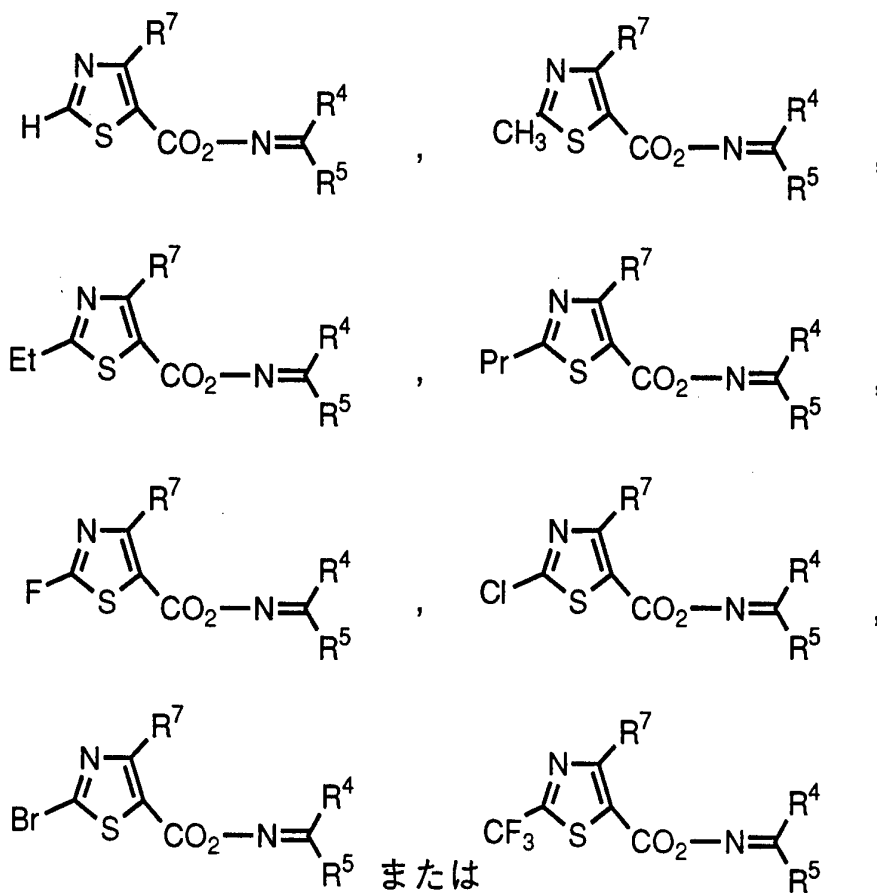
第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₃	I	CH ₃	Et
CH ₃	I	CH ₃	t-Bu
CH ₃	I	CH ₃	c-Pr
CH ₃	I	CH ₃	CH=CH ₂
CH ₃	I	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	I	CH ₃	4-Cl-Ph
CH ₃	I	-(CH ₂) ₂ -	
CH ₃	I	-(CH ₂) ₄ -	
CH ₃	I	-(CH ₂) ₅ -	
Et	Br	CH ₃	CH ₃
Et	Br	CH ₃	Et
Et	Br	CH ₃	t-Bu
Et	Br	CH ₃	c-Pr
Et	Br	CH ₃	CH=CH ₂
Et	Br	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Et	Br	CH ₃	4-Cl-Ph
Et	Br	-(CH ₂) ₂ -	
Et	Br	-(CH ₂) ₄ -	
Et	Br	-(CH ₂) ₅ -	
Et	I	CH ₃	CH ₃
Et	I	CH ₃	Et
Et	I	CH ₃	t-Bu

第 1 表 (続き)

R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
Et	I	CH ₃	c-Pr
Et	I	CH ₃	CH=CH ₂
Et	I	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Et	I	CH ₃	4-Cl-Ph
Et	I	-(CH ₂) ₄ -	
Et	I	-(CH ₂) ₅ -	
CN	H	CH ₃	Et
CN	H	CH ₃	Pr
CN	H	CH ₃	c-Pr
CN	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
CN	H	CH ₃	t-Bu
COOCH ₃	H	CH ₃	Et
COOCH ₃	H	CH ₃	Pr
COOCH ₃	H	CH ₃	c-Pr
COOCH ₃	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
COOCH ₃	H	CH ₃	t-Bu
OCH ₃	H	CH ₃	Et
OCH ₃	H	CH ₃	Pr
OCH ₃	H	CH ₃	c-Pr
OCH ₃	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
OCH ₃	H	CH ₃	t-Bu

第 2 表



R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	H
CH ₃	H	CH ₃
CH ₃	H	Et
CH ₃	H	Pr
CH ₃	H	i-Pr
CH ₃	H	Bu
CH ₃	H	i-Bu

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	s-Bu
CH ₃	H	t-Bu
CH ₃	H	Pen
CH ₃	H	Hex
CH ₃	H	c-Pr
CH ₃	H	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	H	c-Bu
CH ₃	H	c-Pen
CH ₃	H	c-Hex
CH ₃	H	CH=CH ₂
CH ₃	H	CH=CHCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	H	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	H	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
CH ₃	H	C≡CH
CH ₃	H	C≡CCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
CH ₃	H	CH ₂ C≡CCH ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ C≡CH
CH ₃	H	Ph

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	H	4-Cl-Ph
CH ₃	H	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
CH ₃	-(CH ₂) ₆ -	
CH ₃	-(CH ₂) ₇ -	
CH ₃	CH ₃	CH ₃
CH ₃	CH ₃	Et
CH ₃	CH ₃	Pr
CH ₃	CH ₃	i-Pr
CH ₃	CH ₃	Bu
CH ₃	CH ₃	i-Bu
CH ₃	CH ₃	s-Bu
CH ₃	CH ₃	t-Bu
CH ₃	CH ₃	Pen
CH ₃	CH ₃	Hex
CH ₃	CH ₃	c-Pr

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	CH ₃	c-Bu
CH ₃	CH ₃	c-Pen
CH ₃	CH ₃	c-Hex
CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂
CH ₃	CH ₃	CH=CHCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
CH ₃	CH ₃	C≡CH
CH ₃	CH ₃	C≡CCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CCH ₃
CH ₃	CH ₃	CH(SCH ₃)CH ₃
CH ₃	CH ₃	Ph
CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph
CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	Et	Et
CH ₃	Et	Pr

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	Et	i-Pr
CH ₃	Et	Bu
CH ₃	Et	i-Bu
CH ₃	Et	s-Bu
CH ₃	Et	t-Bu
CH ₃	Et	Pen
CH ₃	Et	Hex
CH ₃	Et	c-Pr
CH ₃	Et	1-CH ₃ -c-Pr
CH ₃	Et	c-Bu
CH ₃	Et	c-Pen
CH ₃	Et	c-Hex
CH ₃	Et	CH=CH ₂
CH ₃	Et	CH=CHCH ₃
CH ₃	Et	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	Et	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	Et	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂
CH ₃	Et	C≡CH
CH ₃	Et	C≡CCH ₃
CH ₃	Et	CH ₂ C≡CH
CH ₃	Et	CH ₂ C≡CCH ₃
CH ₃	Et	CH ₂ CH ₂ C≡CH

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	Et	Ph
CH ₃	Et	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	Et	4-Cl-Ph
CH ₃	Et	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	Pr	Pr
CH ₃	Pr	i-Pr
CH ₃	Pr	Bu
CH ₃	Pr	i-Bu
CH ₃	Pr	s-Bu
CH ₃	Pr	t-Bu
CH ₃	Pr	c-Pr
CH ₃	Pr	c-Hex
CH ₃	Pr	CH=CH ₂
CH ₃	Pr	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	Pr	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	Pr	CH ₂ C≡CH
CH ₃	Pr	Ph
CH ₃	Pr	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	Pr	4-OCH ₃ -Ph
CH ₃	c-Pr	i-Pr
CH ₃	c-Pr	Bu

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	c-Pr	t-Bu
CH ₃	c-Pr	c-Pr
CH ₃	c-Pr	c-Hex
CH ₃	c-Pr	CH=CH ₂
CH ₃	c-Pr	CH ₂ CH=CH ₂
CH ₃	c-Pr	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	c-Pr	CH ₂ C≡CH
CH ₃	c-Pr	Ph
CH ₃	c-Pr	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	c-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	c-Pr	4-CH ₃ -Ph
CH ₃	c-Pr	4-Cl-Ph
CH ₃	c-Hex	i-Pr
CH ₃	c-Hex	t-Bu
CH ₃	c-Hex	c-Hex
CH ₃	c-Hex	CH=CH ₂
CH ₃	c-Hex	CH=C(CH ₃) ₂
CH ₃	c-Hex	Ph
CH ₃	c-Hex	4-Cl-Ph
CH ₃	CH=CH ₂	CH=CH ₂
CH ₃	CH=CH ₂	Ph
CH ₃	CH=CH ₂	4-Cl-Ph

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CH ₃	Ph	Ph
CH ₃	Ph	4-Cl-Ph
Et	CH ₃	CH ₃
Et	CH ₃	Et
Et	CH ₃	t-Bu
Et	CH ₃	c-Pr
Et	CH ₃	CH=CH ₂
Et	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Et	CH ₃	4-Cl-Ph
Et	-(CH ₂) ₂ -	
Et	-(CH ₂) ₄ -	
Et	-(CH ₂) ₅ -	
Pr	CH ₃	CH ₃
Pr	CH ₃	Et
Pr	CH ₃	t-Bu
Pr	CH ₃	c-Pr
Pr	CH ₃	CH=CH ₂
Pr	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
Pr	CH ₃	4-Cl-Ph
Pr	-(CH ₂) ₂ -	
Pr	-(CH ₂) ₄ -	
Pr	-(CH ₂) ₅ -	

第 2 表 (続き)

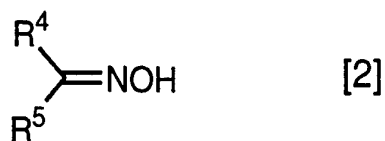
R ⁷	R ⁴	R ⁵
i-Pr	CH ₃	CH ₃
i-Pr	CH ₃	Bt
i-Pr	CH ₃	t-Bu
i-Pr	CH ₃	c-Pr
i-Pr	CH ₃	CH=CH ₂
i-Pr	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
i-Pr	CH ₃	4-Cl-Ph
i-Pr	-(CH ₂) ₂ -	
i-Pr	-(CH ₂) ₄ -	
i-Pr	-(CH ₂) ₅ -	
t-Bu	CH ₃	CH ₃
t-Bu	CH ₃	Et
t-Bu	CH ₃	t-Bu
t-Bu	CH ₃	c-Pr
t-Bu	CH ₃	CH=CH ₂
t-Bu	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
t-Bu	CH ₃	4-Cl-Ph
t-Bu	-(CH ₂) ₂ -	
t-Bu	-(CH ₂) ₄ -	
t-Bu	-(CH ₂) ₅ -	
CF ₃	CH ₃	CH ₃
CF ₃	CH ₃	Et

第 2 表 (続き)

R ⁷	R ⁴	R ⁵
CF ₃	CH ₃	t-Bu
CF ₃	CH ₃	c-Pr
CF ₃	CH ₃	CH=CH ₂
CF ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
CF ₃	CH ₃	4-Cl-Ph
CF ₃	-(CH ₂) ₂ -	
CF ₃	-(CH ₂) ₄ -	
CF ₃	-(CH ₂) ₅ -	
H	CH ₃	CH ₃
H	CH ₃	Et
H	CH ₃	t-Bu
H	CH ₃	c-Pr
H	CH ₃	CH=CH ₂
H	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂
H	CH ₃	4-Cl-Ph
H	-(CH ₂) ₂ -	
H	-(CH ₂) ₄ -	
H	-(CH ₂) ₅ -	

次に本発明化合物の製造法について、以下に説明する。

式 [2] :



〔式中、R⁴ およびR⁵ は前記と同じ意味を表す。〕

で表される化合物と、

式 [3] :



〔式中、Qは前記と同じ意味を表し、Lはハロゲン原子等の脱離基を表す。〕

で表される化合物とを反応させることによって本発明化合物を製造することが出来る。

本製法においては、適当な不活性溶媒を用いて反応を行うことが出来る。溶媒としては、例えばトルエン、キシレン、クロルベンゼン等の炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド等の極性溶媒が挙げられる。

また必要に応じて有機塩基（ピリジン、トリエチルアミンなど）や無機塩基（炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど）を加えてもよい。

反応に用いられる試剤の量は、式 [2] で示される化合物 1 当量に対して、式 [3] で示される化合物は 1～3 当量の範囲である。

上記反応に於いて反応温度は任意にとりうるが通常、0～50℃若しくは溶媒の還流温度が好ましい。

反応終了後は、通常の後処理を行うことにより、目的物を得ることが出来る。

次に、本発明化合物の防除対象となる植物病害としては、

イネのいもち病 (*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、

ムギ類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis* f. sp. hordei, f. sp. tritici)、斑葉病 (*Pyrenophora graminea*)、網斑病 (*Pyrenophora teres*)、赤かび病 (*Gibberella zeae*)、さび病 (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪腐病 (*Typhula* sp., *Micronectriella nivais*)、裸黒穂病 (*Ustilago tritici*, *U. nuda*)、アイスポット (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病 (*Septoria tritici*)、ふ枯病 (*Leptosphaeria nodorum*)、

カンキツの黒点病 (*Diaporthe citri*)、そうか病 (*Elsinoe fawcetti*)、果実腐敗病 (*Penicillium digitatum*, *P. italicum*)、

リンゴのモニリア病 (*Sclerotinia mali*)、腐らん病 (*Valsa mali*)、うどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、黒星病 (*Venturia inaequalis*)、

ナシの黒星病 (*Venturia nashicola*)、黒斑病 (*Alternaria Kikuchiana*)、赤星病 (*Gymnosporangium haraeaeum*)、

モモの灰星病 (*Sclerotinia cinerea*)、黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)、フォモプシス腐敗病 (*Phomopsis* sp.)、

ブドウのべと病 (*Plasmopara viticola*)、黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、晩腐病 (*Glomerella cingulata*)、うどんこ病 (*Uncinula necator*)、さび病 (*Phakopsora ampelopsidis*)、

カキの炭そ病 (*Gloeosporium kaki*)、落葉病(*Cercospora kaki*,
Mycosphaerella nawae)、
ウリ類のべと病(*Pseudoperenospora cubensis*)、炭そ病 (*Colletotrichum*
lagenarium)、うどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、
つる枯病(*Mycosphaerella melonis*)、
トマトの疫病(*Phytophthora infestans*)、輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉
かび病(*Cladosporium fulvam*)、
ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病(*Bryisiphe cichoracoarum*)、
アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病(*Cerocosporella*
brassicae)、
ネギのさび病(*Puccinia allii*)、
ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒
点病 (*Diaporthe phaseololum*)、
インゲンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemuthianum*)、
ラッカセイの黒渋病 (*Mycosphaerella personatum*)、褐斑病(*Cercospora*
arachidicola)、
エンドウのうどんこ病 (*Bryisiphe pisi*)、
ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、
イチゴのうどんこ病(*Sphaerotheca humuli*)、
チャの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病(*Elsinoe leucospila*)、
タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Bryisiphe*
cichoracearum)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、
テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、
バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病(*Sphaerotheca pannosa*)、
キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemiindici*)、白さび病 (*Puccinia*

horiana)、

種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、

種々の作物の菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 等が挙げられる。

本発明化合物を農園芸用殺菌剤として使用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナント、珪藻土等の固体担体あるいは水、アルコール類（メタノール、エタノール等）、芳香族炭化水素類（ベンゼン、トルエン、キシレン等）、塩素化炭化水素類、エーテル類、ケトン類、エステル類（酢酸エチル等）、酸アミド類（ジメチルホルムアミド等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により乳化剤、分散剤、懸濁剤、浸透剤、展着剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、粉剤、粒剤、フロアブル剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

本発明化合物の施用方法としては、農園芸用殺菌剤として使用する場合は、茎葉散布、土壌処理、種子消毒等があげられるが、通常当業者が利用する一般的な方法においても有効である。

また、必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤などと混合施用してもよい。本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、対象病害、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール当たり0.005～50kg程度が適当である。

次に、本発明化合物を有効成分とする殺菌剤の製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の製剤例において「部」は重量部を意味する。

製剤例 1 乳 剤

本発明化合物

----- 20 部

キシレン	-----	55 部
シクロヘキサノン	-----	20 部
ソルポール 2 6 8 0	-----	5 部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業
(株) 商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。使用に際しては上記乳剤を50～ 20000倍
に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005～50kgになるように散布する。

製剤例 2 水和剤

本発明化合物	-----	25 部
ジークライト P F P	-----	66 部
(カオリナイトとセリサイトの混合物；ジークライト工業 (株) 商品名)		
ソルポール 5 0 3 9	-----	4 部
(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業 (株) 商品名)		
カープレックス # 8 0	-----	3 部
(ホワイトカーボン：塩野義製薬 (株) 商品名)		
リグニンスルホン酸カルシウム	-----	2 部

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

使用に際しては上記水和剤を50～ 20000倍に希釈して有効成分量がヘクター
ル当たり 0.005～50kgになるように散布する。

製剤例 3 粉 剤

本発明化合物	-----	3 部
カープレックス # 8 0	-----	0.5部
(ホワイトカーボン：塩野義製薬 (株) 商品名)		
クレー	-----	95 部

リン酸ジイソプロピル ----- 1.5部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。使用に際して上記粉剤を有効成分量がヘクタール当たり 0.005～50kgになるように散布する。

製剤例 4 粒 剤

本発明化合物 ----- 5 部

ベントナイト ----- 54 部

タルク ----- 40 部

リグニンスルホン酸カルシウム ----- 1 部

以上を均一に混合粉碎して少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。使用に際して上記粒剤を有効成分量がヘクタール当たり 0.005～50kgになるように散布する。

製剤例 5 フロアブル剤

本発明化合物 ----- 25 部

ソルポール 3 3 5 3 ----- 10 部

(非イオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

ルノックス 1 0 0 0 C ----- 0.5 部

(陰イオン界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

1% ザンサンガム水溶液 ----- 20 部

(天然高分子)

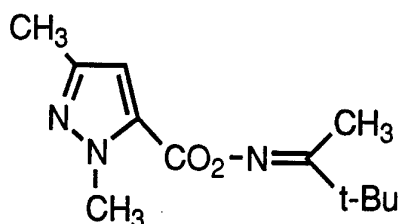
水 ----- 44.5部

有効成分(本発明化合物)を除く上記の成分を均一に溶解し、ついで本発明化合物を加えよく攪拌した後、サンドミルにて湿式粉碎してフロアブル剤を得る。使用に際しては、上記フロアブル剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005～50kgになるように散布する。

発明を実施するための最良の形態

次に実施例により、本発明の内容を具体的に説明するが、本発明はこれらのみ限定されるべきものではない。

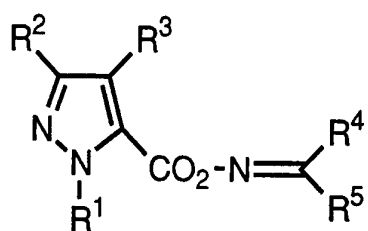
実施例 1. 本発明化合物 No. 1-1 の合成



ピナロンオキシム 0.7 g (6.09 mmol)、トリエチルアミン 0.74 g (7.30 mmol) をジクロルメタン 30 ml に溶解し、氷冷下 5°C で 1,3-ジメチルピラゾール-5-カルボニルクロライド 1.06 g (6.70 mmol) を滴下した。次に触媒量の 4-ジメチルアミノピリジンを加え、そのまま室温まで昇温し、15 分間攪拌した。反応混合物にジクロルメタン 50 ml、水 40 ml を加えて分液し、ジクロルメタン層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥させた後、減圧下で溶媒を留去した。得られた残渣は、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒クロロホルム) にて精製し、得られた結晶を n-ヘキサンにて洗浄し、濾取し、目的の O-(1,3-ジメチルピラゾール-5-イルカルボニル) ピナロンオキシム 0.9 g を無色結晶として得た。
融点 63-64°C 収率 55%

次にこれらの方法に準じて製造した化合物を第 3 表に示す。

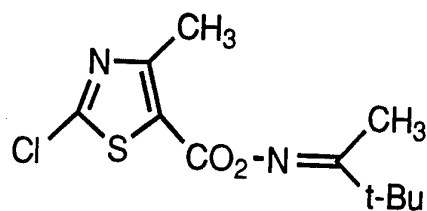
第 3 表



No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	融点 (°C)
1-1	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	t-Bu	63-64
1-2	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	油状
1-3	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr	油状
1-4	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	i-Pr	油状
1-5	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	t-Bu	154-155
1-6	CH ₃	Et	Cl	CH ₃	t-Bu	68-70
1-7	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH(SCH ₃)CH ₃	油状
1-8	CH ₃	CH ₃	H	-CH ₂ S-(CH ₂) ₂ -		油状
1-9	CH ₃	CH ₃	H	Et	i-Pr	油状
1-10	CH ₃	CH ₃	H	-CH(CH ₃)O-(CH ₂) ₂ -		88-90
1-11	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	n-Pr	油状
1-12	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	n-Bu	油状
1-13	CH ₃	H	H	CH ₃	t-Bu	46-48.5
1-14	CH ₃	CH ₃	H	-C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -		45-47
1-15	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	Et	油状
1-16	CH ₃	CH ₃	H	-(CH ₂) ₄ -		油状
1-17	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	i-Bu	油状

第 3 表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	融点 (°C)
1-18	CH ₃	Et	H	CH ₃	t-Bu	油状
1-19	CH ₃	t-Bu	H	CH ₃	t-Bu	62-65
1-20	CH ₃	-(CH ₂) ₈ -		CH ₃	t-Bu	122-123
1-21	CH ₃	CH ₃	NO ₂	CH ₃	t-Bu	油状
1-22	CH ₃	CH ₃	H	Et	4-Cl-Ph	88-90
1-23	CH ₃	CH ₃	H	Et	Et	油状
1-24	Et	CH ₃	H	CH ₃	t-Bu	油状
1-25	CH ₃	Cl	H	CH ₃	t-Bu	79-80
1-26	CH ₃	Cl	H	CH ₃	CH ₃	58-60
1-27	CH ₃	Cl	H	CH ₃	Et	油状
1-28	CH ₃	Cl	H	CH ₃	i-Pr	油状
1-29	CH ₃	Cl	H	CH ₃	s-Bu	油状
1-30	CH ₃	Cl	H	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr	油状
1-31	CH ₃	Cl	H	-C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -		87-89
1-32	CH ₃	Cl	H	Et	Et	油状
1-33	CH ₃	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	120-122
1-34	CH ₃	Cl	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	160-161
1-35	CH ₃	Cl	H	t-Bu	Ph	81-82
1-36	Et	Cl	H	CH ₃	t-Bu	油状
1-37	CH ₃	CN	H	CH ₃	t-Bu	106-107.5
1-38	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃	t-Bu	59-67
1-39	CH ₃	COOCH ₃	H	CH ₃	t-Bu	56-59

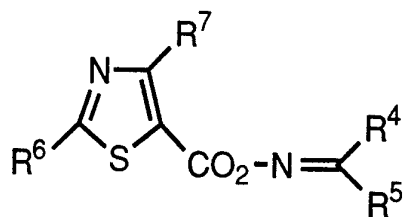
実施例 2. 本発明化合物 No. 2-1 の合成

ピナロンオキシム 1. 48 g (12.8 mmol)、トリエチルアミン 1.50 g (14.8 mmol) をジクロロメタン 30 ml に溶解し、氷冷下 5℃ で 2-クロル-4-メチルチアゾール-5-カルボニルクロライド 2.51 g (12.8 mmol) を滴下した。次に触媒量の 4-ジメチルアミノピリジンを加え、そのまま室温まで昇温し 2 時間攪拌した。反応終了後、ジクロロメタンと水を加え抽出し、ジクロロメタン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去した。得られた粗物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒、クロロホルム) にて精製し、得られた結晶を n-ヘキサンで洗浄し、目的の O-(2-クロル-4-メチルチアゾール-5-イルカルボニル) ピナロンオキシム 2. 42 g を白色結晶として得た。

融点 67-68.5℃ 収率 68.8%

次にこれらの方法に準じて製造した化合物を第 4 表に示す。

第 4 表



No.	R ⁶	R ⁷	R ⁴	R ⁵	融点 (°C)
2-1	C l	CH ₃	CH ₃	t-B u	67-68.5
2-2	C l	CH ₃	CH ₃	CH ₃	59-61
2-3	C l	CH ₃	CH ₃	i-P r	油状
2-4	C l	CH ₃	CH ₃	1-CH ₃ -c-Pr	60-61
2-5	C l	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		油状
2-6	C l	CH ₃	CH ₃	i-B u	油状
2-7	C l	CH ₃	E t	E t	油状
2-8	C l	CH ₃	CH ₃	CH(SCH ₃)CH ₃	油状
2-9	CH ₃	CH ₃	CH ₃	t-B u	112-114
2-10	CH ₃	E t	CH ₃	t-B u	72-73
2-11	E t	CH ₃	CH ₃	t-B u	90-91.5
2-12	C l	E t	CH ₃	t-B u	油状
2-13	CH ₃	CF ₃	CH ₃	t-B u	122-123

本発明化合物の有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。

但し、これらのみに限定されるものではない。

試験例1 イネいもち病に対する水面施用活性試験

1/20000アールのビーカーポットに植えた1.5葉期のイネに、本発明化合物乳剤を水で希釈して500ppm調製した薬液10mlをポットに灌注処理する。2週間後に、処理したイネにいもち病菌の分生孢子懸濁液を散布接種する。相対湿度95~100%、約24℃中で24時間、菌をイネに感染させた後、温室内にイネを放置し、約1週間後に発病の程度を0~5の6段階で調査した。

(調査基準)

罹病指数	発病程度
0	無発病
1	病斑数 1~5
2	病斑数 6~20
3	病斑数 21~40
4	病斑数 41~70
5	病斑数 71以上

(試験結果) 以下の化合物が罹病指数1を示した。

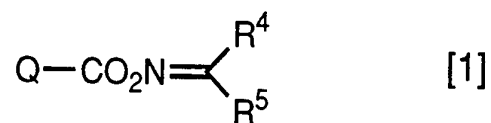
本発明化合物 No.1-1、No.1-2、No.1-4、No.1-6、No.1-12、No.1-13、
No.1-20、No.1-25、No.1-26、No.1-27、No.1-28、No.1-29、
No.1-30、No.1-32、No.1-36、No.1-37、No.1-38、No.1-39、
No.2-1、No.2-2、No.2-3、No.2-4、No.2-5、No.2-6、No.2-9、No.2-13、

産業上の利用可能性

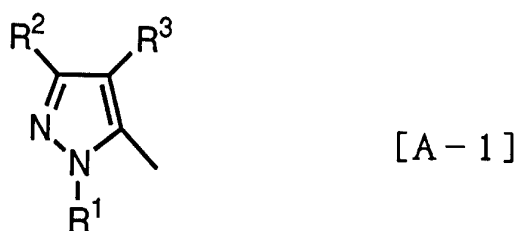
これらの本発明化合物は、新規化合物であり、優れた農園芸用殺菌作用を示し、有用作物に対する薬害も認められないため、農園芸用殺菌剤として有用である。

請求の範囲

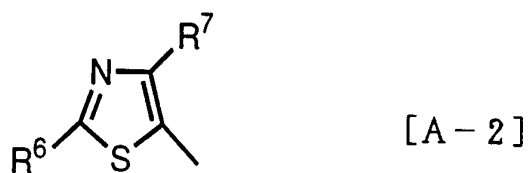
1. 式 [1] :



〔上記式中、Qは、式 [A-1] 〕 :



で表される基または式 [A-2] :



で表される基であり、

R¹ は、水素原子、C₁ ~ C₄ アルキル基、C₂ ~ C₄ アルケニル基、C₂ ~ C₄ アルキニル基、無置換フェニル基または置換フェニル基（その置換基はハロゲン原子、C₁ ~ C₄ アルキル基もしくは C₁ ~ C₄ アルコキシ基）であり、

R² は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ ~ C₄ アルキル基、C₁ ~ C₄ アルコキシ基、C₁ ~ C₄ ハロアルキル基、C₁ ~ C₄ アルコシキカルボニル基ま

たはシアノ基であり、

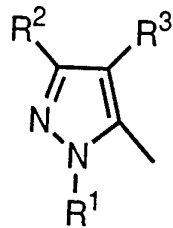
R^8 は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、更にまたは R^2 と R^3 とが一緒になり $C_3 \sim C_6$ アルキレン基を形成してもよく、

R^4 および R^5 は、それぞれ独立に、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基で置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_2 \sim C_4$ アルキルチオアルキル基、無置換フェニル基または置換フェニル基（その置換基はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基もしくは $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基）であり、更にまたは R^4 と R^5 が一緒になり $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を形成あるいは酸素原子もしくは硫黄原子を含むヘテロサイクルを形成してもよく、

R^6 、 R^7 は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基である。）

で表されるカルボン酸オキシムエステル誘導体。

2. Qが、式 [A-1] :



[A-1]

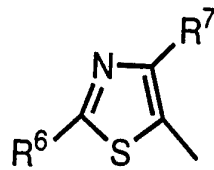
で表される基である請求項1記載のピラゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体。

3. R^1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、 R^2 は、塩素原子、臭素原子、シアノ基または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、 R^3 は、水素原子であり、 R^4

およびR⁵は、それぞれ独立してC₁～C₄アルキル基である請求項2記載のピラゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体。

4. R¹は、メチル基であり、R²は、塩素原子、臭素原子またはメチル基であり、R³は、水素原子であり、R⁴は、メチル基であり、R⁵は、t-ブチル基である請求項3記載のピラゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体。

5. Qが、式[A-2]：



[A-2]

で表される基である請求項1記載のチアゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体。

6. R⁶は、塩素原子またはC₁～C₄アルキル基であり、R⁷は、C₁～C₄アルキル基であり、R⁴およびR⁵は、それぞれ独立してC₁～C₄アルキル基である請求項5記載のチアゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体。

7. R⁶は、塩素原子であり、R⁷は、メチル基であり、R⁴は、メチル基であり、R⁵は、t-ブチル基である請求項6記載のチアゾールカルボン酸オキシムエステル誘導体。

8. 請求項1記載の式[1]のカルボン酸オキシムエステル誘導体の1種もしくは2種以上を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

9. 請求項1記載の式[1]のカルボン酸オキシムエステル誘導体の1種もしくは2種以上を有効成分として含有するイネいもち病防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP95/00809

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁶ C07D231/14, 277/56, A01N43/56, 43/78

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁶ C07D231/14, 277/56, A01N43/56, 43/78

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

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

CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP, 58-24566, A (Bask AG.), February 14, 1983 (14. 02. 83) & EP, 71794, A & US, 4472192, A	1 - 4, 8, 9
Y	JP, 62-120369, A (Bayer AG.), June 1, 1987 (01. 06. 87) & EP, 224094, A & DE, 3540839, A	1 - 4, 8, 9
Y	JP, 2-300173, A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), December 12, 1990 (12. 12. 90) (Family: none)	1 - 4, 8, 9
Y	JP, 63-201178, A (CIBA-Geigy AG.), August 19, 1988 (19. 08. 88) (Family: none)	1, 5-9
Y	JP, 3-145478, A (BASF AG.), June 20, 1991 (20. 06. 91) & EP, 419944, A & DE, 3932052, A	1, 5-9

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

June 1, 1995 (01. 06. 95)

Date of mailing of the international search report

June 20, 1995 (20. 06. 95)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))		
Int. Cl. ⁸ C07D231/14, 277/56, A01N43/56, 43/78		
B. 調査を行った分野		
調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))		
Int. Cl. ⁸ C07D231/14, 277/56, A01N43/56, 43/78		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)		
CAS ONLINE		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	JP, 58-24566, A (バスク・アクチエンゲゼルシャフト), 14. 2月. 1983 (14. 02. 83) & EP, 71794, A & US, 4472192, A	1-4, 8, 9
Y	JP, 62-120369, A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト), 1. 6月. 1987 (01. 06. 87) & EP, 224094, A & DE, 3540839, A	1-4, 8, 9
Y	JP, 2-300173, A (日本農薬株式会社),	1-4,
<input checked="" type="checkbox"/> C類の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日	
01. 06. 95	20. 06. 95	
名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 佐野 整 博 ㊞	4 C 7 0 1 9
	電話番号 03-3581-1101 内線	3 4 5 2

C (続き). 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	12. 12月. 1990 (12. 12. 90) (ファミリーなし)	8, 9
Y	JP, 63-201178, A (チバーガイギー アクチエン ゲゼルシャフト), 19. 8月. 1988 (19. 08. 88) (ファミリーなし)	1, 5-9
Y	JP, 3-145478, A (ピーエーエスエフ アクチエン ゲゼルシャフト), 20. 6月. 1991 (20. 06. 91) & EP, 419944, A & DE, 3932052, A	1, 5-9