



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 114585610 A

(43) 申请公布日 2022. 06. 03

(21) 申请号 202080071868.4	C07D 403/12 (2006.01)
(22) 申请日 2020.10.26	C07D 239/545 (2006.01)
(30) 优先权数据	C07D 401/06 (2006.01)
2019-195484 2019.10.28 JP	C07D 253/075 (2006.01)
2020-053191 2020.03.24 JP	C07D 409/12 (2006.01)
(85) PCT国际申请进入国家阶段日	C07D 405/12 (2006.01)
2022.04.11	C07D 417/12 (2006.01)
(86) PCT国际申请的申请数据	C07F 7/08 (2006.01)
PCT/JP2020/040135 2020.10.26	A01N 43/54 (2006.01)
(87) PCT国际申请的公布数据	A01N 43/647 (2006.01)
W02021/085389 JA 2021.05.06	A01N 55/10 (2006.01)
(71) 申请人 日本曹达株式会社	A01N 43/84 (2006.01)
地址 日本东京都	A01N 43/60 (2006.01)
(72) 发明人 寺西贵昭 桑原赖人 宗井阳平	A01N 43/707 (2006.01)
下村肇 川崎达弘 石原拓真	A01N 47/34 (2006.01)
岩田淳 斋贺睦幸 西野千寻	A01N 43/828 (2006.01)
(74) 专利代理机构 北京市金杜律师事务所	A01N 43/78 (2006.01)
11256	A01N 47/28 (2006.01)
专利代理师 杨宏军 焦成美	A01N 43/56 (2006.01)
(51) Int. Cl.	A01N 47/38 (2006.01)
C07D 239/54 (2006.01)	A01P 5/00 (2006.01)
	A01P 3/00 (2006.01)
	A61K 31/506 (2006.01)

(续)

权利要求书7页 说明书185页

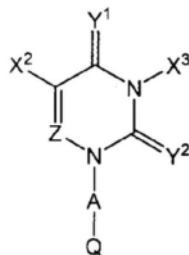
(54) 发明名称

2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶化合物以及农业园艺用杀菌剂、杀线虫剂、及医疗用·动物用抗真菌剂

(57) 摘要

本发明的课题在于提供杀菌活性优异、安全性优异、并且能够在工业上有利地合成的2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶化合物、以及含有其作为有效成分的农业园艺用杀菌剂、杀线虫剂、及医疗用·动物用抗真菌剂。本发明的化合物为式(II)所示的化合物或其盐。式(II)中,Y¹各自表示氧原子或硫原子;Y²表示氧原子或硫原子;Z表示C-X¹所示的基团或氮原子;X¹表示氢原子,卤代基等;X²表示R¹O-N=CR⁶-所示的基团等;R¹表示取

代或未取代的直链C1~6烷基等;R⁶表示取代或未取代的直链C1~6烷基等;X³表示取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的直链C2~6链烯基等;A表示取代或未取代的C1~6亚烷基、取代或未取代的C2~6亚链烯基等;Q表示取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂芳基。



(II)

CN 114585610 A

[接上页]

(51) Int.Cl.

A61K 31/5377 (2006.01)

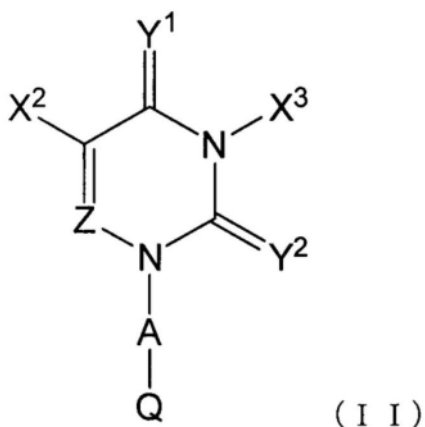
A61K 31/505 (2006.01)

A61K 31/541 (2006.01)

A61K 31/695 (2006.01)

A61P 31/10 (2006.01)

1. 式 (II) 所示的化合物或其盐，
[化学式1]



式 (II) 中，

Y^1 表示氧原子或硫原子；

Y^2 表示氧原子或硫原子；

Z 表示 C- X^1 所示的基团或氮原子；

X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的 C1~6 烷基、取代或未取代的 C2~6 链烯基、取代或未取代的 C2~6 炔基、羟基、取代或未取代的 C1~6 烷氧基、取代或未取代的 C2~6 链烯基氧基、取代或未取代的 C2~6 炔基氧基、取代或未取代的 C1~6 烷基硫基、取代或未取代的 C1~6 烷基亚磺酰基、取代或未取代的 C1~6 烷基磺酰基、取代或未取代的 C3~6 环烷基、取代或未取代的 C3~6 环烷基氧基、取代或未取代的 C6~10 芳基、取代或未取代的 C6~10 芳基氧基、取代或未取代的 C6~10 芳基硫基、取代或未取代的 C6~10 芳基亚磺酰基、取代或未取代的 C6~10 芳基磺酰基、取代或未取代的 5~6 元环的杂环基、取代或未取代的 5~6 元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1 -CO- 所示的基团、羧基、 R^2 -O-CO- 所示的基团、 R^3R^4N - 所示的基团、 R^3R^4N -CO- 所示的基团、 R^1 -CO-O- 所示的基团、 R^1 -CO-NR⁵- 所示的基团、 R^2 -O-CO-O- 所示的基团、 R^2 -O-CO-NR⁵- 所示的基团、 R^3R^4N -CO-O- 所示的基团、 R^3R^4N -CO-NR⁵- 所示的基团、 R^2SO_2 -NR⁵- 所示的基团、 R^3R^4N -SO₂- 所示的基团、或者 $R^1O=N=CR^6$ - 所示的基团；

R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的 C1~6 烷基、取代或未取代的 C2~6 链烯基、取代或未取代的 C2~6 炔基、取代或未取代的 C3~6 环烷基、取代或未取代的 C6~10 芳基、或者取代或未取代的 5~6 元环的杂环基，

R^2 各自独立地表示取代或未取代的 C1~6 烷基、取代或未取代的 C2~6 链烯基、取代或未取代的 C2~6 炔基、取代或未取代的 C3~6 环烷基、取代或未取代的 C6~10 芳基、或者取代或未取代的 5~6 元环的杂环基，

R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的 C1~6 烷基、取代或未取代的 C2~6 链烯基、取代或未取代的 C2~6 炔基、取代或未取代的 C3~6 环烷基、取代或未取代的 C6~10 芳基、或者取代或未取代的 5~6 元环的杂环基，

R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的 C1~6 烷基、或者取代或未取代的 C6~10 芳基，

其中， R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团，

R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

X^2 表示 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^1CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

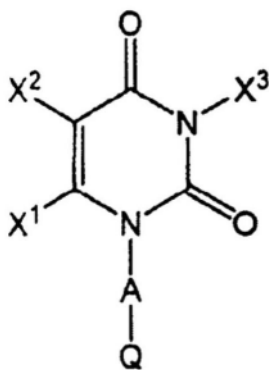
X^3 表示取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的直链C2~6链烯基、取代或未取代的直链C2~6炔基、 R^1-CO -所示的基团、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的4~6元环的杂环基；

A表示取代或未取代的C1~6亚烷基、取代或未取代的C2~6亚链烯基、取代或未取代的C2~6亚炔基、或者取代或未取代的C3~6亚环烷基；

Q表示取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂环基。

2. 如权利要求1所述的化合物或其盐，其中，式 (II) 由式 (I) 表示，

[化学式2]



式 (I) 中， X^1 、 X^2 、 X^3 、A、及Q表示与权利要求1中的它们同样的含义。

3. 如权利要求1或2所述的化合物或其盐，其中，

X^3 中的直链C1~6烷基上的取代基、直链C2~6链烯基上的取代基、直链C2~6炔基上的取代基、C3~6环烷基上的取代基、C6~10芳基上的取代基、或4~6元环的杂环基上的取代基为：

选自由卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的3~10元环的杂环基、取代或未取代的3~10元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^a-CO -所示的基团、羧基、 R^b-O-CO -所示的基团、 R^cR^dN -所示的基团、 R^cR^dN-CO -所示的基团、 $R^cR^dN-NR^d-CO$ -所示的基团、 R^a-CO-O -所示的基团、 $R^a-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CO-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CO-NR^e-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CO-NR^e-NR^e-CO$ -所示的基团、 R^b-

O-CO-O-所示的基团、 $R^b-O-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CO-O$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CO-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CS-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CS-NR^e$ -所示的基团、 $R^bSO_2-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-SO_2$ -所示的基团、 $R^aO-N=CR^f$ -所示的基团、 $R^hR^iC=N-O$ -所示的基团、 $R^a-C(=NR^g)-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-C(=NR^g)-$ 所示的基团、 $R^hR^iS(=O)=N-CO-$ 所示的基团、及 $R^hR^iS=N-CO-$ 所示的基团组成的组中的1个或2个以上的取代基；

R^a 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的3~10元环的杂环基，

R^b 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^c 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^d 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^c 与 R^d 可以一起形成二价的有机基团，

R^e 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

R^f 表示氢原子、氨基、或者取代或未取代的C1~6烷基，

R^g 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

R^h 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

R^i 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^h 与 R^i 可以一起形成二价的有机基团；

直链C1~6烷基上的取代基存在2个以上的情况下，其中的2个为可以一起形成二价的有机基团的取代基。

4. 如权利要求1~3中任一项所述的化合物或其盐，其中，

A中的C1~6亚烷基或C2~6亚链烯基上的取代基为：

选自由卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、巯基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的3~6元环的杂环基、取代或未取代的3~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 $R^{a1}-CO-$ 所示的基团、羧基、 $R^{b1}-O-CO-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-$ 所示的基团、 $R^{a1}-CO-O-$ 所示的基团、 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{b1}-O-CO-O-$ 所示的基团、 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-O-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-SO_2-$ 所示的基团、 $R^{a1}O-N=CR^{f1}-$ 所示的基团、 $R^{g1}R^{h1}C=$

N-O-所示的基团、氧代基(O=)、硫代基(S=)、 $R^{a1}-N=$ 所示的二价基团、 $R^{a1}O-N=$ 所示的二价基团、 $R^{c1}R^{d1}N-N=$ 所示的二价基团、 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团、 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团、 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团组成的组中的1个或2个以上的取代基；

R^{a1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^{b1} 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^{c1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^{d1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^{c1} 与 R^{d1} 可以一起形成二价的有机基团，

R^{e1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

R^{f1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基，

R^{g1} 表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^{h1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基，其中， R^{g1} 与 R^{h1} 可以一起形成二价的有机基团；

C1~6亚烷基或C2~6亚链烯基上的取代基存在2个以上的情况下，其中的2个为可以一起形成二价的有机基团的取代基。

5. 农业园艺用杀菌剂，其含有选自由权利要求1~4中任一项所述的化合物、及它们的盐组成的组中的至少1种作为有效成分。

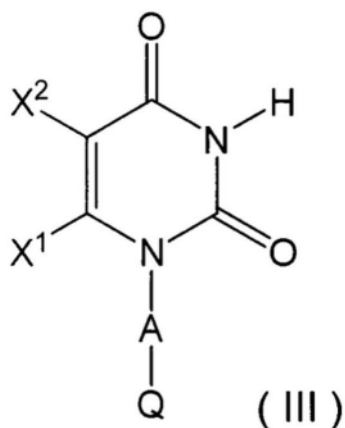
6. 如权利要求5所述的农业园艺用杀菌剂，其用于处理种子。

7. 杀线虫剂，其含有选自由权利要求1~4中任一项所述的化合物、及它们的盐组成的组中的至少1种作为有效成分。

8. 医疗用·动物用抗真菌剂，其含有选自由权利要求1~4中任一项所述的化合物、及它们的盐组成的组中的至少1种作为有效成分。

9. 式(III)所示的化合物或其盐，

[化学式3]



式(III)中,

X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1 -CO-所示的基团、羧基、 R^2 -O-CO-所示的基团、 R^3R^4 N-所示的基团、 R^3R^4 N-CO-所示的基团、 R^1 -CO-O-所示的基团、 R^1 -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2 -O-CO-O-所示的基团、 R^2 -O-CO-NR⁵-所示的基团、 R^3R^4 N-CO-O-所示的基团、 R^3R^4 N-CO-NR⁵-所示的基团、 R^2 SO₂-NR⁵-所示的基团、 R^3R^4 N-SO₂-所示的基团、或者 R^1 O-N=CR⁶-所示的基团;

R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基,

R^2 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基,

R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基,

R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基,

其中, R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团,

R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基,

R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基;

X^2 表示 R^1 O-N=CR⁶-所示的基团、 R^1 CO-O-N=CR⁶-所示的基团、 R^3R^4 N-CO-O-N=CR⁶-所示

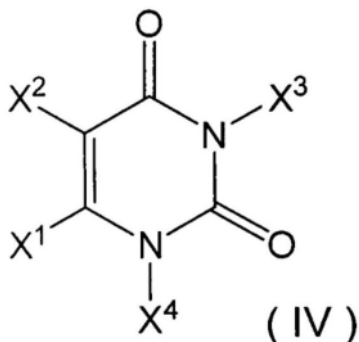
的基团、 $R^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

A表示取代或未取代的C1~6亚烷基、取代或未取代的C2~6亚链烯基、取代或未取代的C2~6亚炔基、或者取代或未取代的C3~6亚环烷基；

Q表示取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂环基。

10. 式 (IV) 所示的化合物或其盐，

[化学式4]



式 (IV) 中，

X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1-CO- 所示的基团、羧基、 $R^2-O-CO-$ 所示的基团、 R^3R^4N- 所示的基团、 R^3R^4N-CO- 所示的基团、 $R^1-CO-O-$ 所示的基团、 $R^1-CO-NR^5-$ 所示的基团、 $R^2-O-CO-O-$ 所示的基团、 $R^2-O-CO-NR^5-$ 所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-$ 所示的基团、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ 所示的基团、 $R^2SO_2-NR^5-$ 所示的基团、 $R^3R^4N-SO_2-$ 所示的基团、或者 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团；

R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^2 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

其中， R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团，

R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

X^2 表示 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^1CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

X^3 表示取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的直链C2~6链烯基、取代或未取代的直链C2~6炔基、 R^1-CO -所示的基团、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的4~6元环的杂环基；

X^4 表示氢原子或C1~6烷氧基甲基。

2,6-二氧化-3,6-二氢嘧啶化合物以及农业园艺用杀菌剂、杀线虫剂、及医疗用·动物用抗真菌剂

技术领域

[0001] 本发明涉及2,6-二氧化-3,6-二氢嘧啶化合物及农业园艺用杀菌剂。更详细而言,本发明涉及杀菌·抗菌活性优异、安全性优异、并且能够在工业上有利地合成的2,6-二氧化-3,6-二氢嘧啶化合物、以及含有其作为有效成分的农业园艺用杀菌剂。进而涉及含有前述的化合物作为有效成分的杀线虫剂。进而涉及含有前述的化合物作为有效成分的医疗用·动物用抗真菌剂。

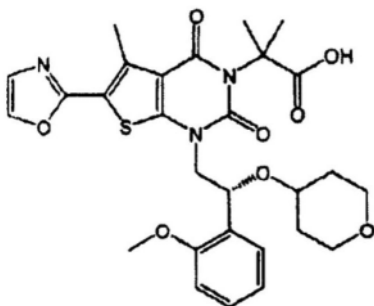
[0002] 本申请针对在2019年10月28日提出申请的日本专利申请第2019-195484号及在2020年3月24日提出申请的日本专利申请第2020-053191号主张优先权,将其内容援引于本文。

背景技术

[0003] 已经提出了各种在栽培农业园艺作物时对作物的病害具有防除活性的化合物。为了将这样的化合物作为农业园艺用杀菌剂进行实际应用,不仅要求效力充分高,而且还要要求不易产生耐药性,不对植物产生药害,不引起土壤污染,对家畜、鱼类等的毒性低等。

[0004] 其中,在专利文献1中公开了式(A)所示的化合物等。

[0005] [化学式1]



[0006]

(A)

[0007] 现有技术文献

[0008] 专利文献

[0009] 专利文献1:WO 2013/071169 A

发明内容

[0010] 发明所要解决的课题

[0011] 本发明的课题在于提供杀菌·抗菌活性优异、安全性优异、并且能够在工业上有利地合成的2,6-二氧化-3,6-二氢嘧啶化合物(以下,有时简称为“二氢嘧啶化合物”)、及含有其作为有效成分的农业园艺用杀菌剂。进而在于提供含有前述的化合物作为有效成分的杀线虫剂。进而在于提供含有前述的化合物作为有效成分的医疗用·动物用抗真菌剂。

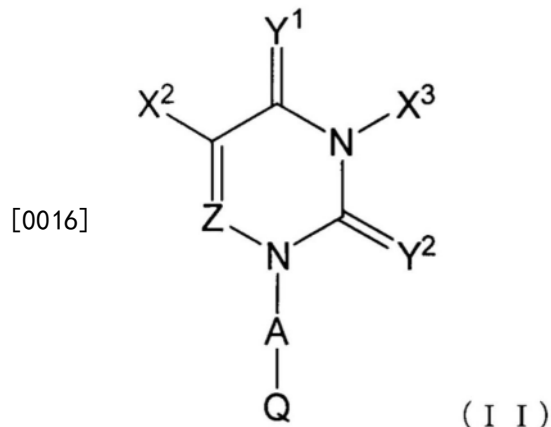
[0012] 用于解决课题的手段

[0013] 本申请的发明人为了解决上述课题而进行了深入研究,结果完成了包含以下方式

的本发明。

[0014] (1)式(II)所示的化合物或其盐。

[0015] [化学式2]



[0017] (式(II)中，

[0018] Y^1 表示氧原子或硫原子；

[0019] Y^2 表示氧原子或硫原子；

[0020] Z表示C-X¹所示的基团或氮原子；

[0021] X¹表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、R¹-CO-所示的基团、羧基、R²-O-CO-所示的基团、R³R⁴N-所示的基团、R³R⁴N-CO-所示的基团、R¹-CO-O-所示的基团、R¹-CO-NR⁵-所示的基团、R²-O-CO-O-所示的基团、R²-O-CO-NR⁵-所示的基团、R³R⁴N-CO-O-所示的基团、R³R⁴N-CO-NR⁵-所示的基团、R²SO₂-NR⁵-所示的基团、R³R⁴N-SO₂-所示的基团、或者R¹O-N=CR⁶-所示的基团；

[0022] R¹各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0023] R²各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0024] R³各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0025] R⁴各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0026] 其中，R³与R⁴可以一起形成二价的有机基团，

[0027] R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0028] R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

[0029] X^2 表示 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^1CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

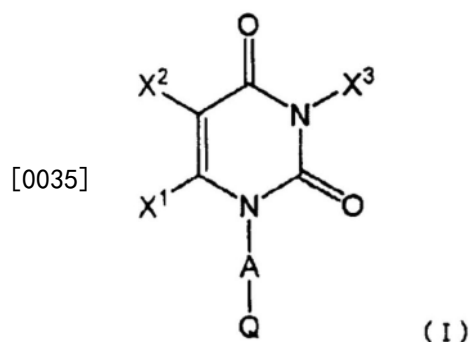
[0030] X^3 表示取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的直链C2~6链烯基、取代或未取代的直链C2~6炔基、 R^1-CO -所示的基团、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的4~6元环的杂环基；

[0031] A表示取代或未取代的C1~6亚烷基、取代或未取代的C2~6亚链烯基、取代或未取代的C2~6亚炔基、或者取代或未取代的C3~6亚环烷基；

[0032] Q表示取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂环基。）

[0033] (2)如(1)所述的化合物或其盐，其中，式(II)由式(I)表示。

[0034] [化学式3]



[0036] (式(I)中， X^1 、 X^2 、 X^3 、A、及Q表示与(1)中的它们同样的含义。)

[0037] (3)如(1)或(2)所述的化合物或其盐，其中，

[0038] X^3 中的直链C1~6烷基上的取代基、直链C2~6链烯基上的取代基、直链C2~6炔基上的取代基、C3~6环烷基上的取代基、C6~10芳基上的取代基、或4~6元环的杂环基上的取代基为：

[0039] 选自由卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的3~10元环的杂环基、取代或未取代的3~10元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^a-CO -所示的基团、羧基、 R^b-O-CO -所示的基团、 R^cR^dN -所示的基团、 R^cR^dN-CO -所示的基团、 $R^cR^dN-NR^d-CO$ -所示的基团、 R^a-CO-O -所示的基团、 $R^a-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CO-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CO-NR^e-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CO-NR^e-NR^e-CO$ -所示的

基团、 $R^b-O-CO-O$ -所示的基团、 $R^b-O-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CO-O$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CO-CO-NR^e$ -所示的基团、 $R^a-CS-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-CS-NR^e$ -所示的基团、 $R^bSO_2-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-SO_2$ -所示的基团、 $R^aO-N=CR^f$ -所示的基团、 $R^hR^iC=N-O$ -所示的基团、 $R^a-C(=NR^g)-NR^e$ -所示的基团、 $R^cR^dN-C(=NR^g)$ -所示的基团、 $R^hR^iS(=O)=N-CO$ -所示的基团、及 $R^hR^iS=N-CO$ -所示的基团组成的组中的1个或2个以上的取代基；

[0040] R^a 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的3~10元环的杂环基，

[0041] R^b 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂环基，

[0042] R^c 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0043] R^d 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^c 与 R^d 可以一起形成二价的有机基团，

[0044] R^e 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0045] R^f 表示氢原子、氨基、或者取代或未取代的C1~6烷基，

[0046] R^g 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0047] R^h 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0048] R^i 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^h 与 R^i 可以一起形成二价的有机基团；

[0049] 直链C1~6烷基上的取代基存在2个以上的情况下，其中的2个为可以一起形成二价的有机基团的取代基。

[0050] (4)如(1)~(3)中任一项所述的化合物或其盐，其中，

[0051] A中的C1~6亚烷基或C2~6亚链烯基上的取代基为：

[0052] 选自由卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、巯基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的3~6元环的杂环基、取代或未取代的3~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 $R^{a1}-CO$ -所示的基团、羧基、 $R^{b1}-O-CO$ -所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N$ -所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO$ -所示的基团、 $R^{a1}-CO-O$ -所示的基团、 $R^{a1}-CO-NR^{e1}$ -所示的基团、 $R^{b1}-O-CO-O$ -所示的基团、 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}$ -所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-O$ -所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}$ -所示的基团、 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}$ -所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-SO_2$ -所示的基团、 $R^{a1}O-N=CR^{f1}$ -所示的基团、 $R^{g1}R^{h1}C$

=N-O-所示的基团、氧代基(O=)、硫代基(S=)、 R^{a1} -N=所示的二价基团、 $R^{a1}O$ -N=所示的二价基团、 $R^{c1}R^{d1}N$ -N=所示的二价基团、 R^{a1} -CO-NR^{e1}-N=所示的二价基团、 R^{b1} -O-CO-NR^{e1}-N=所示的二价基团、 $R^{b1}SO_2$ -NR^{e1}-N=所示的二价基团组成的组中的1个或2个以上的取代基；

[0053] R^{a1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0054] R^{b1} 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0055] R^{c1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0056] R^{d1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^{c1} 与 R^{d1} 可以一起形成二价的有机基团，

[0057] R^{e1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0058] R^{f1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基，

[0059] R^{g1} 表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0060] R^{h1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基，其中， R^{g1} 与 R^{h1} 可以一起形成二价的有机基团；

[0061] C1~6亚烷基或C2~6亚链烯基上的取代基存在2个以上的情况下，其中的2个为可以一起形成二价的有机基团的取代基。

[0062] (5)农业园艺用杀菌剂，其含有选自由(1)~(4)中任一项所述的化合物、及它们的盐组成的组中的至少1种作为有效成分。

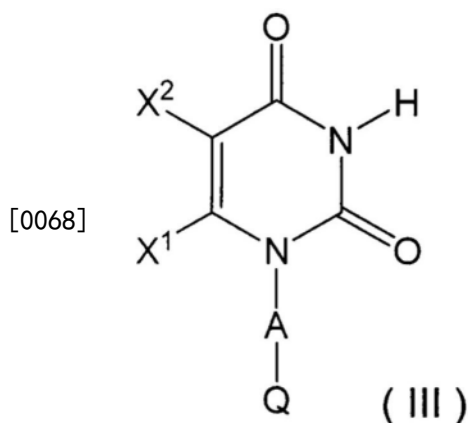
[0063] (6)如(5)所述的农业园艺用杀菌剂，其用于处理种子。

[0064] (7)杀线虫剂，其含有选自由(1)~(4)中任一项所述的化合物、及它们的盐组成的组中的至少1种作为有效成分。

[0065] (8)医疗用·动物用抗真菌剂，其含有选自由(1)~(4)中任一项所述的化合物、及它们的盐组成的组中的至少1种作为有效成分。

[0066] (9)式(III)所示的化合物或其盐。

[0067] [化学式4]



[0069] (式(III)中,

[0070] X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1 -CO-所示的基团、羧基、 R^2 -O-CO-所示的基团、 R^3R^4N -所示的基团、 R^3R^4N -CO-所示的基团、 R^1 -CO-O-所示的基团、 R^1 -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2 -O-CO-O-所示的基团、 R^2 -O-CO-NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -CO-O-所示的基团、 R^3R^4N -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2SO_2 -NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -SO₂-所示的基团、或者 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团；

[0071] R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0072] R^2 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0073] R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0074] R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0075] 其中， R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团，

[0076] R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0077] R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

[0078] X^2 表示 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^1CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-N=CR^6$ -

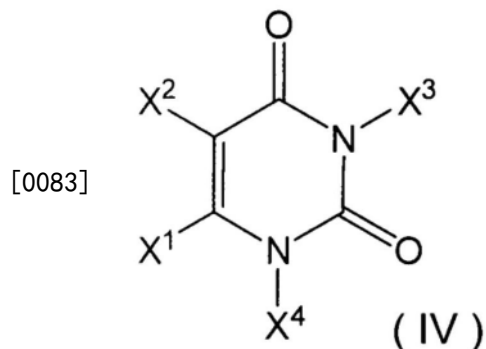
所示的基团、 $R^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

[0079] A表示取代或未取代的C1~6亚烷基、取代或未取代的C2~6亚链烯基、取代或未取代的C2~6亚炔基、或者取代或未取代的C3~6亚环烷基；

[0080] Q表示取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂环基。）

[0081] (10)式(IV)所示的化合物或其盐。

[0082] [化学式5]



[0084] (式(IV)中，

[0085] X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1-CO- 所示的基团、羧基、 $R^2-O-CO-$ 所示的基团、 R^3R^4N- 所示的基团、 R^3R^4N-CO- 所示的基团、 $R^1-CO-O-$ 所示的基团、 $R^1-CO-NR^5-$ 所示的基团、 $R^2-O-CO-O-$ 所示的基团、 $R^2-O-CO-NR^5-$ 所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-$ 所示的基团、 $R^3R^4N-CO-NR^5-$ 所示的基团、 $R^2SO_2-NR^5-$ 所示的基团、 $R^3R^4N-SO_2-$ 所示的基团、或者 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团；

[0086] R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0087] R^2 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0088] R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0089] R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0090] 其中， R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团，

[0091] R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0092] R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

[0093] X^2 表示 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^1CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4NR^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

[0094] X^3 表示取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的直链C2~6链烯基、取代或未取代的直链C2~6炔基、 R^1-CO -所示的基团、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的4~6元环的杂环基；

[0095] X^4 表示氢原子或C1~6烷氧基甲基。)

[0096] 发明效果

[0097] 本发明的二氢嘧啶化合物的杀菌·抗菌活性优异，效果可靠，安全性优异，并且能够在工业上有利地合成。

[0098] 本发明的农业园艺用杀菌剂及杀线虫剂具有优异的防除效果，不会对植物体产生药害，对人畜鱼类的毒性、对环境的影响小。

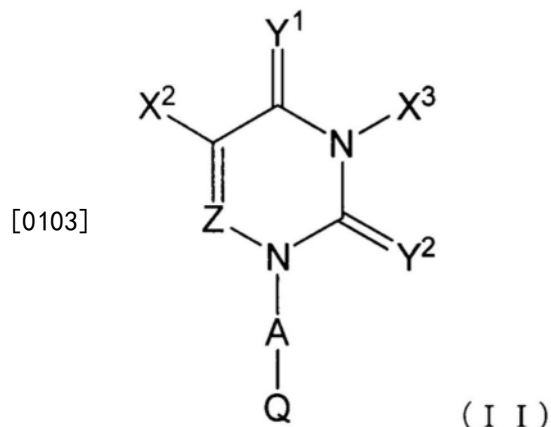
[0099] 本发明的医疗用·动物用抗真菌剂具有优异的抗菌效果，对人畜鱼类的毒性小。

具体实施方式

[0100] (二氢嘧啶化合物)

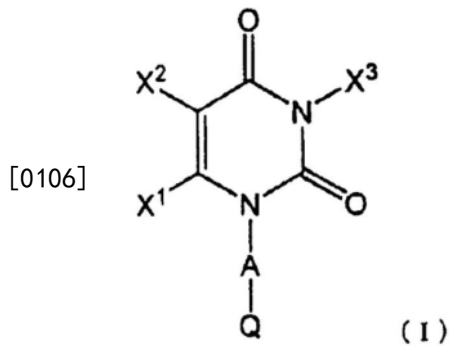
[0101] 本发明的二氢嘧啶化合物为式(II)所示的化合物(以下，有时表述为化合物(II)。)或化合物(II)的盐。

[0102] [化学式6]



[0104] 优选为式(I)所示的化合物(以下，有时表述为化合物(I)。)或化合物(I)的盐。

[0105] [化学式7]



[0107] 本发明中,术语“未取代(unsubstituted)”是指仅为成为母核的基团。在仅以成为母核的基团的名称记载时,只要无特别说明,则是“未取代”的含义。

[0108] 另一方面,术语“取代(substituted)”是指:成为母核的基团的任一氢原子被与母核相同或不同结构的基团取代。因此,“取代基”是与成为母核的基团键合的其他基团。取代基可以为1个,也可以为2个以上。2个以上的取代基可以相同,也可以不同。

[0109] “取代基”只要为化学上所允许且具有本发明的效果,就没有特别限制。

[0110] 作为可成为“取代基”的基团的具体例,可以举出以下的基团。

[0111] 氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;

[0112] 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;

[0113] 乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基等C2~6链烯基;

[0114] 乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-己炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基等C2~6炔基;

[0115] 环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基;

[0116] 2-环丙烯基、2-环戊烯基、3-环己烯基等C3~6环烯基;

[0117] 苯基、萘基等C6~10芳基;

[0118] 苄基、苄乙基等C6~10芳基C1~6烷基;

[0119] 3~6元环的杂环基;

[0120] 3~6元环的杂环基C1~6烷基;

[0121] 羟基;

[0122] 甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;

[0123] 乙烯基氧基、烯丙基氧基、丙烯基氧基、丁烯基氧基等C2~6链烯基氧基;

[0124] 乙炔基氧基、炔丙基氧基等C2~6炔基氧基;

[0125] 苯氧基、萘氧基等C6~10芳基氧基;

[0126] 苄基氧基、苄乙基氧基等C6~10芳基C1~6烷氧基;

[0127] 羧基;

[0128] 甲酰基;

- [0129] 乙酰基、丙酰基等C1~6烷基羰基；
- [0130] 甲酰基氧基；
- [0131] 乙酰基氧基、丙酰基氧基等C1~6烷基羰基氧基；
- [0132] 甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、异丙氧基羰基、正丁氧基羰基、叔丁氧基羰基等C1~6烷氧基羰基；
- [0133] 氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基、全氟正戊基等C1~6卤代烷基；
- [0134] 2-氯-1-丙烯基、2-氟-1-丁烯基等C2~6卤代链烯基；
- [0135] 4,4-二氯-1-丁炔基、4-氟-1-戊炔基、5-溴-2-戊炔基等C2~6卤代炔基；
- [0136] 3,3-二氟环丁基等C3~6卤代环烷基；
- [0137] 2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基等C1~6卤代烷氧基；
- [0138] 2-氯丙烯基氧基、3-溴丁烯基氧基等C2~6卤代链烯基氧基；
- [0139] 氯乙酰基、三氟乙酰基、三氯乙酰基等C1~6卤代烷基羰基；
- [0140] 氨基；
- [0141] 甲基氨基、二甲基氨基、二乙基氨基等C1~6烷基取代氨基；
- [0142] 苯胺基、萘基氨基等C6~10芳基氨基；
- [0143] 苄基氨基、苄乙基氨基等C6~10芳基C1~6烷基氨基；
- [0144] 甲酰基氨基；
- [0145] 乙酰基氨基、丙酰基氨基、丁酰基氨基、异丙基羰基氨基等C1~6烷基羰基氨基；
- [0146] 甲氧基羰基氨基、乙氧基羰基氨基、正丙氧基羰基氨基、异丙氧基羰基氨基等C1~6烷氧基羰基氨基；
- [0147] 氨基甲酰基、二甲基氨基羰基、苯基氨基羰基、N-苯基-N-甲基氨基羰基等未取代或具有取代基的氨基羰基；
- [0148] 亚氨基甲基、(1-亚氨基)乙基、(1-亚氨基)正丙基等亚氨基C1~6烷基；
- [0149] N-羟基-亚氨基甲基、(1-(N-羟基)-亚氨基)乙基、(1-(N-羟基)-亚氨基)丙基、N-甲氧基-亚氨基甲基、(1-(N-甲氧基)-亚氨基)乙基等取代或未取代的N-羟基亚氨基C1~6烷基；
- [0150] 氨基羰基氧基；
- [0151] 乙基氨基羰基氧基、二甲基氨基羰基氧基等C1~6烷基取代氨基羰基氧基；
- [0152] 巯基；
- [0153] 甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、异丙基硫基、正丁基硫基、异丁基硫基、仲丁基硫基、叔丁基硫基等C1~6烷基硫基；
- [0154] 三氟甲基硫基、2,2,2-三氟乙基硫基等C1~6卤代烷基硫基；
- [0155] 乙烯基硫基、烯丙基硫基等C2~6链烯基硫基；
- [0156] 乙炔基硫基、炔丙基硫基等C2~6炔基硫基；
- [0157] 甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基等C1~6烷基亚磺酰基；
- [0158] 三氟甲基亚磺酰基、2,2,2-三氟乙基亚磺酰基等C1~6卤代烷基亚磺酰基；
- [0159] 烯丙基亚磺酰基等C2~6链烯基亚磺酰基；

- [0160] 炔丙基亚磺酰基等C2~6炔基亚磺酰基；
- [0161] 甲基磺酰基、乙基磺酰基、叔丁基磺酰基等C1~6烷基磺酰基；
- [0162] 三氟甲基磺酰基、2,2,2-三氟乙基磺酰基等C1~6卤代烷基磺酰基；
- [0163] 烯丙基磺酰基等C2~6链烯基磺酰基；
- [0164] 炔丙基磺酰基等C2~6炔基磺酰基；
- [0165] 氨基硫基羰基；
- [0166] S,S-二甲基磺氧基亚氨基等C1~6烷基磺氧基亚氨基；
- [0167] 三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基等三C1~6烷基取代甲硅烷基；
- [0168] 三苯基甲硅烷基等三C6~10芳基取代甲硅烷基；
- [0169] 氰基；
- [0170] 硝基；
- [0171] “C1~6”等术语表示成为母核的基团的碳原子数为1~6个等。该碳原子数不包括在取代基中存在的碳原子的数量。例如，就乙氧基丁基而言，由于成为母核的基团为丁基，取代基为乙氧基，因此分类为C2烷氧基C4烷基。
- [0172] 另外，所谓上述的“3~6元环的杂环基”，包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1~4个杂原子作为环的构成原子。作为“3~6元环的杂环基”，可以举出3~6元环的饱和杂环基、5~6元环的杂芳基、5~6元环的部分不饱和杂环基等。
- [0173] 作为3~6元环的饱和杂环基，可以举出氮丙啶基、环氧基、氮杂环丁基、氧杂环丁基、吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等。
- [0174] 作为5元环的杂芳基，可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等。
- [0175] 作为6元环的杂芳基，可以举出吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等。
- [0176] 作为5元环的部分不饱和杂环基，可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等。
- [0177] 作为6元环的部分不饱和杂环基，可以举出异噁唑啉基、二氢吡喃基等。
- [0178] 对于这些“取代基”而言，该取代基中的任一氢原子可以被不同结构的基团取代。
- [0179] $\{Y^1, Y^2\}$
- [0180] Y^1 表示氧原子或硫原子， Y^2 表示氧原子或硫原子。
- [0181] 本发明中，优选的 Y^1 为氧原子，优选的 Y^2 为氧原子。
- [0182] $\{Z\}$
- [0183] Z表示C- X^1 所示的基团或氮原子。
- [0184] $\{X^1\}$
- [0185] X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~

10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1 -CO-所示的基团、羧基、 R^2 -O-CO-所示的基团、 R^3R^4N -所示的基团、 R^3R^4N -CO-所示的基团、 R^1 -CO-O-所示的基团、 R^1 -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2 -O-CO-O-所示的基团、 R^2 -O-CO-NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -CO-O-所示的基团、 R^3R^4N -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2SO_2 -NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -SO₂-所示的基团、或者 R^1O -N=CR⁶-所示的基团。

[0186] R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0187] R^2 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0188] R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0189] R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0190] 其中, R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团。

[0191] R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0192] R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0193] 作为 X^1 中的“卤代基”,可以举出氟基、氯基、溴基、碘基等。

[0194] X^1 中的“C1~6烷基”可以为直链,也可以为支链。作为 X^1 中的“C1~6烷基”,可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基、2-甲基丁基、异己基等。

[0195] 作为 X^1 中的“C2~6链烯基”,可以举出乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基等。

[0196] 作为 X^1 中的“C2~6炔基”,可以举出乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-己炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基等。

[0197] 作为 X^1 中的“C1~6烷氧基”,可以举出甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、正戊基氧基、正己基氧基、异丙氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、异己基氧基等。

[0198] 作为 X^1 中的“C2~6链烯基氧基”,可以举出乙烯基氧基、烯丙基氧基、丙烯基氧基、丁烯基氧基等。

[0199] 作为 X^1 中的“C2~6炔基氧基”,可以举出乙炔基氧基、炔丙基氧基等。

[0200] 作为 X^1 中的“C1~6烷基硫基”,可以举出甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、正丁基

硫基、正戊基硫基、正己基硫基、异丙基硫基等。

[0201] 作为 X^1 中的“C1~6烷基亚磺酰基”，可以举出甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基等。

[0202] 作为 X^1 中的“C1~6烷基磺酰基”，可以举出甲基磺酰基、乙基磺酰基、叔丁基磺酰基等。

[0203] 作为 X^1 中的“C1~6烷基”、“C2~6链烯基”、“C2~6炔基”、“C1~6烷氧基”、“C2~6链烯基氧基”、“C2~6炔基氧基”、“C1~6烷基硫基”、“C1~6烷基亚磺酰基”、或“C1~6烷基磺酰基”上的取代基，优选为：氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基；羟基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基；2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基；环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基；苯基、萘基等C6~10芳基；4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基；吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基；或者氰基。

[0204] 作为 X^1 中的“C3~6环烷基”，可以举出环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。

[0205] 作为 X^1 中的“C3~6环烷基氧基”，可以举出环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基等。

[0206] 作为 X^1 中的“C6~10芳基”，可以举出苯基、萘基、茛满基、茛基、四氢化萘基等。

[0207] 作为 X^1 中的“C6~10芳基氧基”，可以举出苯氧基、萘氧基等。

[0208] 作为 X^1 中的“C6~10芳基硫基”，可以举出苯基硫基、萘基硫基等。

[0209] 作为 X^1 中的“C6~10芳基亚磺酰基”，可以举出苯基亚磺酰基、萘基亚磺酰基等。

[0210] 作为 X^1 中的“C6~10芳基磺酰基”，可以举出苯基磺酰基、萘基磺酰基等。

[0211] X^1 中的“5~6元环的杂环基”是包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1、2、3或4个杂原子作为环的构成原子的基团。杂原子为2个以上时，它们可以相同，也可以不同。作为“5~6元环的杂环基”，可以举出5~6元环的饱和杂环基、5~6元环的杂芳基、5~6元环的部分不饱和杂环基等。

[0212] 作为5~6元环的饱和杂环基，可以举出吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等。

[0213] 作为5~6元环的杂芳基，可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基；吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基。

[0214] 作为5~6元环的部分不饱和杂环基，可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基；异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基。

[0215] X^1 中的“5~6元环的杂环基氧基”具有5~6元环的杂环基与氧基键合而成的结构。

作为具体例,可以举出噻唑基氧基、吡啶基氧基等。

[0216] 作为 X^1 中的“C3~6环烷基”、“C3~6环烷基氧基”、“C6~10芳基”、“C6~10芳基氧基”、“C6~10芳基硫基”、“C6~10芳基亚磺酰基”、“C6~10芳基磺酰基”、“5~6元环的杂环基”、或“5~6元环的杂环基氧基”上的取代基,优选为:氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基;或者氰基。

[0217] 此外,作为“C3~6环烷基”、“C3~6环烷基氧基”、“5~6元环的杂环基”、或“5~6元环的杂环基氧基”上的取代基,氧代基也是优选的。

[0218] X^1 中的“ R^1 -CO-所示的基团”中, R^1 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0219] 作为 R^1 中的“C1~6烷基”,可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基、2-甲基丁基、异己基等。

[0220] 作为 R^1 中的“C2~6链烯基”,可以举出乙烯基、1-丙烯基等。

[0221] 作为 R^1 中的“C2~6炔基”,可以举出乙炔基、1-丙炔基等。

[0222] 作为 R^1 中的“C1~6烷基”、“C2~6链烯基”、或“C2~6炔基”上的取代基,优选为:氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基;或者氰基。

[0223] 作为 R^1 中的“C3~6环烷基”,可以举出环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。

[0224] 作为 R^1 中的“C6~10芳基”,可以举出苯基、萘基、茚基、茚满基、四氢化萘基等。

[0225] R^1 中的“5~6元环的杂环基”是包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1、2、3或4个杂原子作为环的构成原子的基团。杂原子为2个以上时,它们可以相同,也可以不同。作为“5~6元环的杂环基”,可以举出5~6元环的饱和杂环基、5~6元环的杂芳基、5~6元环的部分不饱和杂环基等。

[0226] 作为5~6元环的饱和杂环基,可以举出吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等。

[0227] 作为5~6元环的杂芳基,可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基。

[0228] 作为5~6元环的部分不饱和杂环基,可举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基;异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基。

[0229] 作为 R^1 中的“C3~6环烷基”、“C6~10芳基”、或“5~6元环的杂环基”上的取代基,优选为:氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基;或者氰基。

[0230] 此外,作为“C3~6环烷基”、或“5~6元环的杂环基”上的取代基,氧代基也是优选的。

[0231] 作为“ R^1 -CO-所示的基团”的具体例,可以举出甲酰基、乙酰基、丙酰基、丁酰基、异丙基羰基等。

[0232] X^1 中的“ R^2 -O-CO-所示的基团”中, R^2 表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0233] R^2 中的取代基的具体例可以举出与在 R^1 中例示的取代基相同的取代基。

[0234] 作为“ R^2 -O-CO-所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基、乙氧基羰基、叔丁氧基羰基等。

[0235] X^1 中的“ R^3R^4N -所示的基团”中, R^3 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基, R^4 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

- [0236] R^3 或 R^4 中的取代基的具体例可以举出与在 R^1 中例示的取代基相同的取代基。
- [0237] 其中, R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团。
- [0238] 作为可形成的二价的有机基团,可以举出取代或未取代的C2~5亚烷基或者取代或未取代的C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基。
- [0239] 作为“C2~5亚烷基”,可以举出二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。
- [0240] 作为“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”,可以举出二亚甲基氧基二亚甲基等。
- [0241] 作为“C2~5亚烷基”或“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等C1~6烷基;或氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基。
- [0242] 作为“ R^3R^4N -所示的基团”的具体例,可以举出氨基、甲基氨基、二甲基氨基、异丙基氨基等。
- [0243] X^1 中的“ R^3R^4N-CO -所示的基团”中, R^3 及 R^4 表示与上述的“ R^3R^4N -所示的基团”中的它们同样的含义。
- [0244] 作为“ R^3R^4N-CO -所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基、N,N-二甲基氨基羰基、N-(异丙基)氨基羰基、N-(异丙基)-N-甲基氨基羰基等。
- [0245] X^1 中的“ R^1-CO-O -所示的基团”中, R^1 表示与上述的“ R^1-CO -所示的基团”中的 R^1 同样的含义。
- [0246] 作为“ R^1-CO-O -所示的基团”的具体例,可以举出乙酰基氧基、异丙基羰基氧基等。
- [0247] X^1 中的“ $R^1-CO-NR^5$ -所示的基团”中, R^1 表示与上述的“ R^1-CO -所示的基团”中的 R^1 同样的含义。
- [0248] R^5 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。
- [0249] R^5 中的取代基的具体例可以举出与在 R^1 中例示的取代基相同的取代基。
- [0250] 作为“ $R^1-CO-NR^5$ -所示的基团”的具体例,可以举出乙酰基氨基、异丙基羰基氨基等。
- [0251] X^1 中的“ $R^2-O-CO-O$ -所示的基团”中, R^2 表示与上述的“ R^2-O-CO -所示的基团”中的 R^2 同样的含义。
- [0252] 作为“ $R^2-O-CO-O$ -所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基等。
- [0253] X^1 中的“ $R^2-O-CO-NR^5$ -所示的基团”中, R^2 表示与上述的“ R^2-O-CO -所示的基团”中的 R^2 同样的含义。 R^5 表示与上述的“ $R^1-CO-NR^5$ -所示的基团”中的 R^5 同样的含义。
- [0254] 作为“ $R^2-O-CO-NR^5$ -所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基氨基等。
- [0255] X^1 中的“ $R^3R^4N-CO-O$ -所示的基团”中, R^3 及 R^4 表示与上述的“ R^3R^4N -所示的基团”中的它们同样的含义。
- [0256] 作为“ $R^3R^4N-CO-O$ -所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基氧基、N,N-二甲基氨基羰基氧基等。
- [0257] X^1 中的“ $R^3R^4N-CO-NR^5$ -所示的基团”中, R^3 及 R^4 表示与上述的“ R^3R^4N -所示的基团”中的它们同样的含义。 R^5 表示与上述的“ $R^1-CO-NR^5$ -所示的基团”中的 R^5 同样的含义。
- [0258] 作为“ $R^3R^4N-CO-NR^5$ -所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基氨基、N,N-二甲基氨基羰基氨基等。

[0259] X^1 中的“ $R^2SO_2-NR^5$ -所示的基团”中, R^2 表示与上述的“ R^2-O-CO -所示的基团”中的 R^2 同样的含义。 R^5 表示与上述的“ $R^1-CO-NR^5$ -所示的基团”中的 R^5 同样的含义。

[0260] 作为“ $R^2SO_2-NR^5$ -所示的基团”的具体例,可以举出甲磺酰基氨基等。

[0261] X^1 中的“ $R^3R^4N-SO_2$ -所示的基团”中, R^3 及 R^4 表示与上述的“ R^3R^4N -所示的基团”中的它们同样的含义。

[0262] 作为“ $R^3R^4N-SO_2$ -所示的基团”的具体例,可以举出N,N-二甲基氨基磺酰基等。

[0263] X^1 中的“ $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团”中, R^1 表示与上述的“ R^1-CO -所示的基团”中的 R^1 同样的含义。

[0264] R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0265] R^6 中的“取代或未取代的C1~6烷基”或者“取代或未取代的5~6杂环基”的具体例可以举出与在 R^1 中例示的基团相同的基团。

[0266] 作为 R^6 中的“卤代基”,可以举出氟基、氯基、溴基、碘基等。

[0267] 作为 R^6 中的“取代或未取代的单C1~6烷基氨基”的“单C1~6烷基氨基”,可以举出甲基氨基、乙基氨基、异丙基氨基等。

[0268] 作为 R^6 中的“取代或未取代的二C1~6烷基氨基”的“二C1~6烷基氨基”,可以举出二甲基氨基、二乙基氨基、N-甲基-N-异丙基氨基等。

[0269] 作为 R^6 中的“取代或未取代的C1~6烷氧基”的“C1~6烷氧基”,可以举出甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、正戊氧基、正己氧基、异丙氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、异己氧基等。

[0270] 作为 R^6 中的“取代或未取代的C1~6烷基硫基”的“C1~6烷基硫基”,可以举出甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、正丁基硫基、正戊基硫基、正己基硫基、异丙基硫基等。

[0271] 作为 R^6 中的“C1~6烷氧基”、“单C1~6烷基氨基”、“二C1~6烷基氨基”、或“C1~6烷基硫基”上的取代基,可以举出与在 R^1 中作为“C1~6烷基”上的取代基而例示的取代基相同的取代基。

[0272] 作为“ $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团”的具体例,可以举出(羟基亚氨基)甲基、(乙氧基亚氨基)甲基、1-(异丙氧基亚氨基)乙基等。

[0273] 本发明中,作为优选的 X^1 ,可以举出氢原子或者取代或未取代的C1~6烷基。作为 X^1 ,进一步优选为氢原子。

[0274] (X^2)

[0275] X^2 表示 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^1CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团。

[0276] 另外, R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义。

[0277] R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基。

[0278] X^2 中的取代基的具体例可以举出与在 X^1 中例示的取代基相同的取代基。

[0279] 所谓 R^7 中的“5元环的杂环基”,包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1~4个杂原子作为环的构成原子。作为“5元环的杂环基”,可以举出5元环的饱和杂环基、5元环的杂芳基、5元环的部分不饱和杂环基等。

[0280] 作为5元环的饱和杂环基,可以举出吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、二氧杂环戊基等。

[0281] 作为5元环的杂芳基,可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等。

[0282] 作为5元环的部分不饱和杂环基,可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等。

[0283] 作为 R^7 中的“5元环的杂环基”上的取代基,优选为:氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基;羟基;甲基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基;或者氰基。

[0284] 本发明中,作为优选的 X^2 ,可以举出 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团。

[0285] 作为 R_1 ,优选为氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0286] 作为 R^6 ,优选为氢原子或者取代或未取代的C1~6烷基。

[0287] 作为“ $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团”的具体例,可以举出(羟基亚氨基)甲基、(乙氧基亚氨基)甲基、1-(乙氧基亚氨基)乙基、1-(异丙氧基亚氨基)乙基等。

[0288] (Q)

[0289] Q表示取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂环基。

[0290] 作为Q中的“C6~10芳基”,可以举出苯基、萘基、茚基、茚满基、四氢化萘基等。

[0291] Q中的“5~10元环的杂环基”是包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1、2、3或4个杂原子作为环的构成原子的基团。杂原子为2个以上时,它们可以相同,也可以不同。可以为单环及多环中的任一者。

[0292] 作为“5~10元环的杂环基”,可以举出5~6元环的饱和杂环基、5~10元环的杂芳基、5~10元环的部分不饱和杂环基等。

[0293] 作为5~6元环的饱和杂环基,可以举出吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等。

[0294] 作为5~10元环的杂芳基,可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;吡啶基、异吡啶基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、吡唑基、苯并咪唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基等9

元杂芳基；喹啉基、异喹啉基、肉啉基、酞嗪基、喹啉基、喹啉基等10元杂芳基。

[0295] 作为5~10元环的部分不饱和杂环基，可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡啶啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基；异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基；吡啶啉基、异吡啶啉基、2,3-二氢苯并呋喃基、1,3-二氢苯并呋喃基等9元环的部分不饱和杂环基；1,2,3,4-四氢喹啉基等10元环的部分不饱和杂环基。

[0296] 作为Q中的“C6~10芳基”或“5~10元环的杂环基”上的取代基，优选为：

[0297] 氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基；甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基；乙烯基等C2~6链烯基；乙炔基等C2~6炔基；氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基；甲氧基甲基等C1~6烷氧基C1~6烷基；羟基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基；羟基乙氧基等羟基C1~6烷氧基；甲氧基甲氧基、甲氧基乙氧基等C1~6烷氧基烷氧基；三甲基甲硅烷基氧基乙氧基、叔丁基二甲基甲硅烷基氧基乙氧基等三C1~6烷基取代甲硅烷基氧基C1~6烷氧基；2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基；C3~6环烷基C1~6烷氧基；C6~10芳基C1~6烷氧基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷氧基；5元环的杂芳基C1~6烷氧基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基)C1~6烷氧基；6元环的杂芳基C1~6烷氧基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基)C1~6烷氧基；甲基硫基、乙基硫基等C1~6烷基硫基；甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基等C1~6烷基亚磺酰基；甲基磺酰基、乙基磺酰基等C1~6烷基磺酰基；三氟甲基硫基、2,2,2-三氟乙基硫基等C1~6卤代烷基硫基；三氟甲基亚磺酰基、2,2,2-三氟乙基亚磺酰基等C1~6卤代烷基亚磺酰基；三氟甲基磺酰基、2,2,2-三氟乙基磺酰基等C1~6卤代烷基磺酰基；环丙基、环丁基、环戊基等C3~6环烷基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基中的任意1个以上取代基取代的C3~6环烷基；环丙烯基、环丁烯基、环戊烯基等C3~6环烯基；苯基、萘基等C6~10芳基；4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-氟苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；氮丙啶基、环氧基、氮杂环丁基、氧杂环丁基等3~4元环的饱和杂环基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的3~4元环的饱和杂环基；吡咯烷基、四氢呋喃基、噁唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等5~6元环的饱和杂环基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的饱和杂环基；吡咯基、呋喃基、噁吩基、咪唑基、吡啶基、噁唑基、异噁唑基、噁唑基、异噁唑基、三唑基、噁二唑基、噁二唑基、四唑基等5元环的杂芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基；吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基；吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡啶啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基；被C1~6烷基、C1~6烷

氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的部分饱和杂环基；异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的部分饱和杂环基；

[0298] $R^{Q1}-CO-$ 所示的基团(式中, R^{Q1} 表示氢原子;C1~6烷基;被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基;C2~6链烯基;C2~6卤代链烯基;C2~6炔基;C2~6卤代炔基;C3~6环烷基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基中的任意1个以上取代基取代的C3~6环烷基;C6~10芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;5~6元环的杂芳基;或者;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基。在以下的 R^{Q1} 中也是相同的。);

[0299] 羧基;

[0300] $R^{Q2}-O-CO-$ 所示的基团(式中, R^{Q2} 表示C1~6烷基;被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基;C2~6链烯基;C2~6卤代链烯基;C2~6炔基;C2~6卤代炔基;C3~6环烷基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基取代的C3~6环烷基;C6~10芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;5~6元环的杂芳基;或者;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基。在以下的 R^{Q2} 中也是相同的。);

[0301] $R^{Q1}R^{Q1}N-$ 所示的基团(式中的 R^{Q1} 可以相同也可以不同。 R^{Q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0302] $R^{Q1}R^{Q1}N-CO-$ 所示的基团(式中的 R^{Q1} 可以相同也可以不同。 R^{Q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0303] $R^{Q1}-CO-O-$ 所示的基团; $R^{Q1}-CO-NR^{Q3}$ -所示的基团(式中, R^{Q3} 表示氢原子;C1~6烷基;被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基;或者(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基。在以下的 R^{Q3} 中也是相同的。);

[0304] $R^{Q2}-O-CO-O-$ 所示的基团; $R^{Q2}-O-CO-NR^{Q3}$ -所示的基团; $R^{Q1}R^{Q1}N-CO-O-$ 所示的基团(式中的 R^{Q1} 可以相同也可以不同。 R^{Q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或

二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0305] $R^{Q1}R^{Q1}N-CO-NR^{Q3}$ -所示的基团(式中的 R^{Q1} 可以相同也可以不同。 R^{Q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。); $R^{Q2}SO_2-NR^{Q3}$ -所示的基团; $R^{Q1}R^{Q1}N-SO_2$ -所示的基团(式中的 R^{Q1} 可以相同也可以不同。 R^{Q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0306] $R^{Q1}-O-N=C(R^{Q4})$ -所示的基团(式中, R^{Q4} 表示氢原子或C1~6烷基。); $(R^{Q1})_2C=N-O$ -所示的基团(式中的 R^{Q1} 可以相同也可以不同。 R^{Q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0307] 五氟硫烷基、三甲基甲硅烷基乙炔基、硝基、或氰基。

[0308] 此外,作为“5~10元环的杂环基”上的取代基,氧代基也是优选的。

[0309] (X^3)

[0310] X^3 表示取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的直链C2~6链烯基、取代或未取代的直链C2~6炔基、 R^1-CO -所示的基团、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的4~6元环的杂环基。

[0311] 作为 X^3 中的“直链C1~6烷基”,可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基。

[0312] 作为 X^3 中的“直链C2~6链烯基”,可以举出乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基。

[0313] 作为 X^3 中的“直链C2~6炔基”,可以举出乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-己炔基等。

[0314] 作为 X^3 中的“4元环的杂环基”,可以举出氮杂环丁基、氧杂环丁基。

[0315] X^3 中的其他取代基的具体例可以举出与在 X^1 中例示的取代基相同的取代基。

[0316] 本发明中,作为优选的 X^3 ,可以举出取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的C3~6环烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0317] 作为直链C1~6烷基上的取代基、直链C2~6链烯基上的取代基、直链C2~6炔基上的取代基、C3~6环烷基上的取代基、C6~10芳基上的取代基、或4~6元环的杂环基上的取代基,可以举出从以下的取代基组中选择的1个或2个以上的取代基(以下,有时将该取代基用符号“G”表示。)

[0318] 另外,取代基(G)存在2个以上的情况下,其中的2个可以一起形成二价的有机基团。以下示出取代基组。

[0319] 卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的3~10元环的杂环基、取代或未取代的3~10元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^a-CO -所示的基团、羧基、 R^b-O-CO -所示的基团、 R^cR^dN -所示的基团、 R^cR^dN -

CO-所示的基团、 $R^cR^dN-NR^d$ -CO-所示的基团、 R^a -CO-O-所示的基团、 R^a -CO- NR^e -所示的基团、 R^a -CO-CO- NR^e -所示的基团、 R^a -CO- NR^e - NR^e -所示的基团、 R^a -CO- NR^e - NR^e -CO-所示的基团、 R^b -O-CO-O-所示的基团、 R^b -O-CO- NR^e -所示的基团、 R^cR^dN -CO-O-所示的基团、 R^cR^dN -CO- NR^e -所示的基团、 R^cR^dN -CO-CO- NR^e -所示的基团、 R^a -CS- NR^e -所示的基团、 R^cR^dN -CS- NR^e -所示的基团、 R^bSO_2 - NR^e -所示的基团、 R^cR^dN - SO_2 -所示的基团、 R^aO -N=CR^f-所示的基团、 $R^hR^iC=N$ -O-所示的基团、 R^a -C(=NR^g)- NR^e -所示的基团、 R^cR^dN -C(=NR^g)-所示的基团、 $R^hR^iS(=O)=N$ -CO-所示的基团、 $R^hR^iS=N$ -CO-所示的基团。

[0320] 上述的取代基组中， R^a 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的3~10元环的杂环基。

[0321] R^b 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0322] R^c 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0323] R^d 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^c 与 R^d 可以一起形成二价的有机基团。

[0324] R^e 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0325] R^f 表示氢原子、氨基、或者取代或未取代的C1~6烷基。

[0326] R^g 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0327] R^h 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0328] R^i 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^h 与 R^i 可以一起形成二价的有机基团。

[0329] 作为G中的“卤代基”，可以举出氟基、氯基、溴基、碘基等。

[0330] G中的“C1~6烷基”可以为直链，也可以为支链。

[0331] 作为G中的“C1~6烷基”，可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基、2-甲基丁基、异己基等。

[0332] 作为G中的“C2~6链烯基”，可以举出乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基等。

[0333] 作为G中的“C2~6炔基”，可以举出乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-己炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基等。

[0334] 作为G中的“C1~6烷氧基”，可以举出甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、正戊氧基、正己氧基、异丙氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、异己氧基等。

[0335] 作为G中的“C2~6链烯基氧基”,可以举出乙烯基氧基、烯丙基氧基、丙烯基氧基、丁烯基氧基等。

[0336] 作为G中的“C2~6炔基氧基”,可以举出乙炔基氧基、炔丙基氧基等。

[0337] 作为G中的“C1~6烷基硫基”,可以举出甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、正丁基硫基、正戊基硫基、正己基硫基、异丙基硫基等。

[0338] 作为G中的“C1~6烷基亚磺酰基”,可以举出甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基等。

[0339] 作为G中的“C1~6烷基磺酰基”,可以举出甲基磺酰基、乙基磺酰基、叔丁基磺酰基等。

[0340] 作为G中的“C1~6烷基”、“C2~6链烯基”、“C2~6炔基”、“C1~6烷氧基”、“C2~6链烯基氧基”、“C2~6炔基氧基”、“C1~6烷基硫基”、“C1~6烷基亚磺酰基”、或“C1~6烷基磺酰基”上的取代基,优选为:氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;甲基硫基、乙基硫基等C1~6烷基硫基;甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基等C1~6烷基亚磺酰基;甲基磺酰基、乙基磺酰基等C1~6烷基磺酰基;环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基;或者氰基。

[0341] 作为G中的“C3~6环烷基”,可以举出环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。

[0342] 作为G中的“C3~6环烷基氧基”,可以举出环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基等。

[0343] 作为G中的“C6~10芳基”,可以举出苯基、萘基等。

[0344] 作为G中的“C6~10芳基氧基”,可以举出苯氧基、萘氧基等。

[0345] 作为G中的“C6~10芳基硫基”,可以举出苯基硫基、萘基硫基等。

[0346] 作为G中的“C6~10芳基亚磺酰基”,可以举出苯基亚磺酰基、萘基亚磺酰基等。

[0347] 作为G中的“C6~10芳基磺酰基”,可以举出苯基磺酰基、萘基磺酰基等。

[0348] G中的“3~10元环的杂环基”是包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1、2、3或4个杂原子作为环的构成原子的基团。杂原子为2个以上时,它们可以相同,也可以不同。可以为单环及多环中的任一者。

[0349] 作为“3~10元环的杂环基”,可以举出3~6元环的饱和杂环基、5~10元环的杂芳基、5~10元环的部分不饱和杂环基等。

[0350] 作为3~6元环的饱和杂环基,可以举出氮丙啶基、环氧基、氮杂环丁基、氧杂环丁基、吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环

戊基、二氧杂环己基等。

[0351] 作为5~10元环的杂芳基,可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;吡啶基、异吡啶基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、吡唑基、苯并咪唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基等9元杂芳基;喹啉基、异喹啉基、肉喹啉基、酞嗪基、喹啉基、喹喔啉基等10元杂芳基。

[0352] 作为5~10元环的部分不饱和杂环基,可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基;异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基;吡啶啉基、异吡啶啉基、2,3-二氢苯并呋喃基、1,3-二氢苯并呋喃基等9元环的部分不饱和杂环基;1,2,3,4-四氢喹啉基等10元环的部分不饱和杂环基。

[0353] G中的“3~10元环的杂环基氧基”具有3~10元环的杂环基与氧基键合而成的结构。作为具体例,可以举出噻唑基氧基、吡啶基氧基等。

[0354] 作为G中的“C3~6环烷基”、“C3~6环烷基氧基”、“C6~10芳基”、“C6~10芳基氧基”、“C6~10芳基硫基”、“C6~10芳基亚磺酰基”、“C6~10芳基磺酰基”、“3~10元环的杂环基”、或“3~10元环的杂环基氧基”上的取代基,优选为:

[0355] 氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;C3~6环烷基C1~6烷氧基;C6~10芳基C1~6烷氧基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷氧基;5元环的杂芳基C1~6烷氧基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基)C1~6烷氧基;6元环的杂芳基C1~6烷氧基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基)C1~6烷氧基;甲基硫基、乙基硫基等C1~6烷基硫基;甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基等C1~6烷基亚磺酰基;甲基磺酰基、乙基磺酰基等C1~6烷基磺酰基;三氟甲基硫基、2,2,2-三氟乙基硫基等C1~6卤代烷基硫基;三氟甲基亚磺酰基、2,2,2-三氟乙基亚磺酰基等C1~6卤代烷基亚磺酰基;三氟甲基磺酰基、2,2,2-三氟乙基磺酰基等C1~6卤代烷基磺酰基;环丙基、环丁基等C3~6环烷基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氟基中的任意1个以上取代基取代的C3~6环烷基;C3~6环烯基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;氮丙啶基、环氧基、氮杂环丁基、氧杂环丁基等3~4元环的饱和杂环基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的3~4元环的饱和杂环基;吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等5~6元环的饱和杂环基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的饱和杂环基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻

唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基；吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基；吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的部分饱和杂环基；异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的部分饱和杂环基；

[0356] $R^{G1}-CO-$ 所示的基团(式中, R^{G1} 表示氢原子；C1~6烷基；被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基；C2~6链烯基；C2~6卤代链烯基；C2~6炔基；C2~6卤代炔基；C3~6环烷基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基中的任意1个以上取代基取代的C3~6环烷基；C6~10芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；5~6元环的杂芳基；或者；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基。在以下的 R^{G1} 中也是相同的。)；

[0357] 羧基；

[0358] $R^{G2}-O-CO-$ 所示的基团(式中, R^{G2} 表示C1~6烷基；被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基；C2~6链烯基；C2~6卤代链烯基；C2~6炔基；C2~6卤代炔基；C3~6环烷基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基取代的C3~6环烷基；C6~10芳基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；5~6元环的杂芳基；或者；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基。在以下的 R^{G2} 中也是相同的。)；

[0359] $R^{G1}R^{G1}N-$ 所示的基团(式中的 R^{G1} 可以相同也可以不同。 R^{G1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。)；

[0360] $R^{G1}R^{G1}N-CO-$ 所示的基团(式中的 R^{G1} 可以相同也可以不同。 R^{G1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。)；

[0361] $R^{G1}-CO-O-$ 所示的基团； $R^{G1}-CO-NR^{G3}-$ 所示的基团(式中, R^{G3} 表示氢原子；C1~6烷基；被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷

基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基) C1~6烷基;或者(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基) C1~6烷基。在以下的R^{G3}中也是相同的。);

[0362] R^{G2}-O-CO-O-所示的基团;R^{G2}-O-CO-NR^{G3}-所示的基团;R^{G1}R^{G1}N-CO-O-所示的基团(式中的R^{G1}可以相同也可以不同。R^{G1}彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0363] R^{G1}R^{G1}N-CO-NR^{G3}-所示的基团(式中的R^{G1}可以相同也可以不同。R^{G1}彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);R^{G2}SO₂-NR^{G3}-所示的基团;R^{G1}R^{G1}N-SO₂-所示的基团(式中的R^{G1}可以相同也可以不同。R^{G1}彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0364] R^{G1}-O-N=C(R^{G4})-所示的基团(式中,R^{G4}表示氢原子或C1~6烷基。);(R^{G1})₂C=N-O-所示的基团(式中的R^{G1}可以相同也可以不同。R^{G1}彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0365] 五氟硫烷基、硝基、或氰基。

[0366] 此外,作为“C3~6环烷基”、“C3~6环烷基氧基”、“3~10元环的杂环基”、或“3~10元环的杂环基氧基”上的取代基,氧代基也是优选的。

[0367] G中的“R^a-CO-所示的基团”中,R^a表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的3~10元环的杂环基。

[0368] 作为R^a中的“C1~6烷基”,可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基、2-甲基丁基、异己基等。

[0369] 作为R^a中的“C2~6链烯基”,可以举出乙烯基、1-丙烯基等。

[0370] 作为R^a中的“C2~6炔基”,可以举出乙炔基、1-丙炔基等。

[0371] 作为R^a中的“C1~6烷基”、“C2~6链烯基”、或“C2~6炔基”上的取代基,优选为:氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;甲基硫基、乙基硫基等C1~6烷基硫基;甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基等C1~6烷基亚磺酰基;甲基磺酰基、乙基磺酰基等C1~6烷基磺酰基;羧基;甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、异丙氧基羰基、正丁氧基羰基、叔丁氧基羰基等C1~6烷氧基羰基;环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基;或者氰基。

[0372] 作为R^a中的“C3~6环烷基”,可以举出环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。

[0373] 作为R^a中的“C6~10芳基”,可以举出苯基、萘基、茚基、茚满基、四氢化萘基等。

[0374] R^a 中的“3~10元环的杂环基”是包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1、2、3或4个杂原子作为环的构成原子的基团。杂原子为2个以上时，它们可以相同，也可以不同。可以为单环及多环中的任一者。

[0375] 作为“3~10元环的杂环基”，可以举出3~6元环的饱和杂环基、5~10元环的杂芳基、5~10元环的部分不饱和杂环基等。

[0376] 作为3~6元环的饱和杂环基，可以举出氮丙啶基、环氧基、氮杂环丁基、氧杂环丁基、吡咯烷基、四氢呋喃基、噁唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等。

[0377] 作为5~10元环的杂芳基，可以举出吡咯基、呋喃基、噁吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基；吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基；吡啶基、异吡啶基、苯并呋喃基、苯并噁吩基、吡唑基、苯并咪唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基等9元杂芳基；喹啉基、异喹啉基、肉喹啉基、酞嗪基、喹唑啉基、喹喔啉基等10元杂芳基。

[0378] 作为5~10元环的部分不饱和杂环基，可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基；异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基；吡啶啉基、异吡啶啉基、2,3-二氢苯并呋喃基、1,3-二氢苯并呋喃基等9元环的部分不饱和杂环基；1,2,3,4-四氢喹啉基等10元环的部分不饱和杂环基。

[0379] 作为 R^a 中的“C3~6环烷基”、“C6~10芳基”、或“3~10元环的杂环基”上的取代基，优选为：

[0380] 氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基；甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基；氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基；羟基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基；2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基；C3~6环烷基C1~6烷氧基；C6~10芳基C1~6烷氧基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷氧基；5元环的杂芳基C1~6烷氧基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基)C1~6烷氧基；6元环的杂芳基C1~6烷氧基；(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基)C1~6烷氧基；甲基磺基、乙基磺基等C1~6烷基磺基；甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基等C1~6烷基亚磺酰基；甲基磺酰基、乙基磺酰基等C1~6烷基磺酰基；三氟甲基磺基、2,2,2-三氟乙基磺基等C1~6卤代烷基磺基；三氟甲基亚磺酰基、2,2,2-三氟乙基亚磺酰基等C1~6卤代烷基亚磺酰基；三氟甲基磺酰基、2,2,2-三氟乙基磺酰基等C1~6卤代烷基磺酰基；环丙基、环丁基、环戊基等C3~6环烷基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基中的任意1个以上取代基取代的C3~6环烷基；C3~6环烯基；苯基、萘基等C6~10芳基；4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；氮丙啶基、环氧基、氮杂环丁基、氧杂环丁基等3~4元环的饱和杂环基；被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基

取代的3~4元环的饱和杂环基;吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等5~6元环的饱和杂环基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的饱和杂环基;吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的杂芳基;吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5元环的部分饱和杂环基;异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的6元环的部分饱和杂环基;

[0381] $R^{q1}-CO-$ 所示的基团(式中, R^{q1} 表示氢原子;C1~6烷基;被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基;C2~6链烯基;C2~6卤代链烯基;C2~6炔基;C2~6卤代炔基;C3~6环烷基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基中的任意1个以上取代基取代的C3~6环烷基;C6~10芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;5~6元环的杂芳基;或者;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基。在以下的 R^{q1} 中也是相同的。);

[0382] 羧基;

[0383] $R^{q2}-O-CO-$ 所示的基团(式中, R^{q2} 表示C1~6烷基;被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基;C2~6链烯基;C2~6卤代链烯基;C2~6炔基;C2~6卤代炔基;C3~6环烷基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、C1~6卤代烷氧基、或氰基中的任意1个以上取代基取代的C3~6环烷基;C6~10芳基;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;5~6元环的杂芳基;或者;被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基。在以下的 R^{q2} 中是相同的。);

[0384] $R^{q1}R^{q1}N-$ 所示的基团(式中的 R^{q1} 可以相同也可以不同。 R^{q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0385] $R^{q1}R^{q1}N-CO-$ 所示的基团(式中的 R^{q1} 可以相同也可以不同。 R^{q1} 彼此可以一起形成三

亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0386] R^{q1} -CO-O-所示的基团; R^{q1} -CO-NR^{q3}-所示的基团(式中, R^{q3} 表示氢原子;C1~6烷基;被卤代基、C1~6烷氧基、C1~6卤代烷氧基、C3~6环烷基、苯基、或5~6元环的杂芳基中的任意1个以上取代基取代的C1~6烷基;(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基)C1~6烷基;或者(被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的5~6元环的杂芳基)C1~6烷基。在以下的 R^{q3} 中是相同的。);

[0387] R^{q2} -O-CO-O-所示的基团; R^{q2} -O-CO-NR^{q3}-所示的基团; $R^{q1}R^{q1}N$ -CO-O-所示的基团(式中的 R^{q1} 可以相同也可以不同。 R^{q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0388] $R^{q1}R^{q1}N$ -CO-NR^{q3}-所示的基团(式中的 R^{q1} 可以相同也可以不同。 R^{q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。); $R^{q2}SO_2$ -NR^{q3}-所示的基团; $R^{q1}R^{q1}N$ -SO₂-所示的基团(式中的 R^{q1} 可以相同也可以不同。 R^{q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0389] R^{q1} -O-N=C(R^{q4})-所示的基团(式中, R^{q4} 表示氢原子或C1~6烷基。);(R^{q1})₂C=N-O-所示的基团(式中的 R^{q1} 可以相同也可以不同。 R^{q1} 彼此可以一起形成三亚甲基、四亚甲基、五亚甲基、或二亚甲基氧基二亚甲基。);

[0390] 五氟硫烷基、硝基、或氰基。

[0391] 此外,作为“C3~6环烷基”、或“3~10元环的杂环基”上的取代基,氧代基也是优选的。

[0392] 作为“ R^a -CO-所示的基团”的具体例,可以举出甲酰基、乙酰基、异丙基羰基等。

[0393] G中的“ R^b -O-CO-所示的基团”中, R^b 表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0394] R^b 中的取代基的具体例可以举出与在 R^a 中例示的取代基相同的取代基。

[0395] 作为“ R^b -O-CO-所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、异丙氧基羰基、正丁氧基羰基、叔丁氧基羰基等。

[0396] G中的“ R^cR^dN -所示的基团”中, R^c 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基, R^d 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0397] R^c 或 R^d 中的取代基的具体例可以举出与在 R^a 中例示的取代基相同的取代基。

[0398] 作为 R^d 中的“C1~6烷氧基”,可以举出甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、正戊氧基、正己氧基、异丙氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、异己氧基等。

[0399] 作为 R^d 中的“C1~6烷氧基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~

6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；或者氰基。

[0400] 其中， R^c 与 R^d 可以一起形成二价的有机基团。

[0401] 作为可形成的二价的有机基团，可以举出取代或未取代的C2~5亚烷基、取代或未取代的C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基、取代或未取代的C1~3亚烷基硫基C1~3亚烷基、或者取代或未取代的C1~3亚烷基亚氨基C1~3亚烷基等。

[0402] 此外，可以举出 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{Si}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 等含有硅的2价烃基。

[0403] 作为“C2~5亚烷基”，可以举出二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。

[0404] 作为“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”，可以举出二亚甲基氧基二亚甲基等。

[0405] 作为“C1~3亚烷基硫基C1~3亚烷基”，可以举出二亚甲基硫基二亚甲基等。

[0406] 作为“C1~3亚烷基亚氨基C1~3亚烷基”，可以举出二亚甲基亚氨基二亚甲基等。

[0407] 此处，所谓“C1~3亚烷基亚烷基亚氨基C1~3亚烷基”的亚氨基，是指 $-\text{NH}-$ 。

[0408] 作为“C2~5亚烷基”、“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”、“C1~3亚烷基硫基C1~3亚烷基”及“C1~3亚烷基亚氨基C1~3亚烷基”上的取代基，优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基；甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等C1~6烷基；亚甲基；或氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基。

[0409] 作为“ R^cR^dN- 所示的基团”的具体例，可以举出氨基、甲基氨基、二甲基氨基、异丙基氨基等。

[0410] G中的“ $R^cR^dN-\text{CO}-$ 所示的基团”中， R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^dN- 所示的基团”中的它们同样的含义。

[0411] 作为“ $R^cR^dN-\text{CO}-$ 所示的基团”的具体例，可以举出氨基甲酰基、N,N-二甲基氨基羰基、N-(异丙基)氨基羰基、N-(异丙基)-N-甲基氨基羰基等。

[0412] G中的“ $R^cR^dN-\text{NR}^d-\text{CO}-$ 所示的基团”中， R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^dN- 所示的基团”中的它们同样的含义。

[0413] 作为“ $R^cR^dN-\text{NR}^d-\text{CO}-$ 所示的基团”的具体例，可以举出2,2-二甲基胍-1-羰基等。

[0414] G中的“ $R^a-\text{CO}-\text{O}-$ 所示的基团”中， R^a 表示与上述的“ $R^a-\text{CO}-$ 所示的基团”中的 R^a 同样的含义。

[0415] 作为“ $R^a-\text{CO}-\text{O}-$ 所示的基团”的具体例，可以举出乙酰基氧基等。

[0416] G中的“ $R^a-\text{CO}-\text{NR}^e-$ 所示的基团”中， R^a 表示与上述的“ $R^a-\text{CO}-$ 所示的基团”中的 R^a 同样的含义。

[0417] R^e 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0418] R^e 中的取代基的具体例可以举出与在 R^a 中例示的取代基相同的取代基。

[0419] 作为“ $R^a-\text{CO}-\text{NR}^e-$ 所示的基团”的具体例，可以举出乙酰基氨基、丙酰基氨基、丁酰基氨基、异丙基羰基氨基等。

[0420] G中的“ $R^a-\text{CO}-\text{CO}-\text{NR}^e-$ 所示的基团”中， R^a 表示与上述的“ $R^a-\text{CO}-$ 所示的基团”中的 R^a 同样的含义。 R^e 表示与上述的“ $R^a-\text{CO}-\text{NR}^e-$ 所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0421] 作为“ $R^a-\text{CO}-\text{CO}-\text{NR}^e-$ 所示的基团”的具体例，可以举出氧代丙酰胺基等。

[0422] G中的“ $R^a-\text{CO}-\text{NR}^e-\text{NR}^e-$ 所示的基团”中， R^a 表示与上述的“ $R^a-\text{CO}-$ 所示的基团”中的 R^a 同样的含义。 R^e 表示与上述的“ $R^a-\text{CO}-\text{NR}^e-$ 所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0423] 作为“ R^a -CO-NR^e-NR^e-所示的基团”的具体例,可以举出乙酰基胍基、异丙基羰基胍基等。

[0424] G中的“ R^a -CO-NR^e-NR^e-CO-所示的基团”中, R^a 表示与上述的“ R^a -CO-所示的基团”中的 R^a 同样的含义。 R^e 表示与上述的“ R^a -CO-NR^e-所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0425] 作为“ R^a -CO-NR^e-NR^e-CO-所示的基团”的具体例,可以举出2-乙酰基胍-1-羰基等。

[0426] G中的“ R^b -O-CO-O-所示的基团”中, R^b 表示与上述的“ R^b -O-CO-所示的基团”中的 R^b 同样的含义。

[0427] 作为“ R^b -O-CO-O-所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基等。

[0428] G中的“ R^b -O-CO-NR^e-所示的基团”中, R^b 表示与上述的“ R^b -O-CO-所示的基团”中的 R^b 同样的含义。 R^e 表示与上述的“ R^b -O-CO-NR^e-所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0429] 作为“ R^b -O-CO-NR^e-所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基氨基等。

[0430] G中的“ R^cR^d N-CO-O-所示的基团”中, R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^d N-所示的基团”中的它们同样的含义。

[0431] 作为“ R^cR^d N-CO-O-所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基氧基、N,N-二甲基氨基羰基氧基等。

[0432] G中的“ R^cR^d N-CO-NR^e-所示的基团”中, R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^d N-所示的基团”中的它们同样的含义。 R^e 表示与上述的“ R^a -CO-NR^e-所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0433] 作为“ R^cR^d N-CO-NR^e-所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基氨基、N,N-二甲基氨基羰基氨基等。

[0434] G中的“ R^cR^d N-CO-CO-NR^e-所示的基团”中, R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^d N-所示的基团”中的它们同样的含义。 R^e 表示与上述的“ R^a -CO-NR^e-所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0435] 作为“ R^cR^d N-CO-CO-NR^e-所示的基团”的具体例,可以举出2-(甲基氨基)-2-氧代乙酰胺基、2-(叔丁基氨基)-2-氧代乙酰胺基等。

[0436] G中的“ R^a -CS-NR^e-所示的基团”中, R^a 表示与上述的“ R^a -CO-所示的基团”中的 R^a 同样的含义。 R^e 表示与上述的“ R^a -CO-NR^e-所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0437] 作为“ R^a -CS-NR^e-所示的基团”的具体例,可以举出乙烷硫代酰胺基、丙烷硫代酰胺基、2-甲基丙烷硫代酰胺基等。

[0438] G中的“ R^cR^d N-CS-NR^e-所示的基团”中, R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^d N-所示的基团”中的它们同样的含义。 R^e 表示与上述的“ R^a -CO-NR^e-所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0439] 作为“ R^cR^d N-CS-NR^e-所示的基团”的具体例,可以举出3,3-二甲基硫脲基等。

[0440] G中的“ R^b SO₂-NR^e-所示的基团”中, R^b 表示与上述的“ R^b -O-CO-所示的基团”中的 R^b 同样的含义。 R^e 表示与上述的“ R^a -CO-NR^e-所示的基团”中的 R^e 同样的含义。

[0441] 作为“ R^b SO₂-NR^e-所示的基团”的具体例,可以举出甲磺酰基氨基等。

[0442] G中的“ R^cR^d N-SO₂-所示的基团”中, R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^d N-所示的基团”中的它们同样的含义。

[0443] 作为“ R^cR^d N-SO₂-所示的基团”的具体例,可以举出N,N-二甲基氨基磺酰基等。

[0444] G中的“ R^a O-N=CR^f-所示的基团”中, R^a 表示与上述的“ R^a -CO-所示的基团”中的 R^a 同样的含义。

- [0445] R^f 表示氢原子、氨基、或者取代或未取代的C1~6烷基。
- [0446] R^f 中的取代基的具体例可以举出与在 R^a 中例示的取代基相同的取代基。
- [0447] 作为“ $R^aO-N=CR^f$ -所示的基团”的具体例,可以举出(羟基亚氨基)甲基、(乙氧基亚氨基)甲基等。
- [0448] G中的“ $R^a-C(=NR^g)-NR^e$ -所示的基团”中, R^a 表示与上述的“ R^a-CO -所示的基团”中的 R^a 同样的含义。 R^e 表示与上述的“ $R^a-CO-NR^e$ -所示的基团”中的 R^e 同样的含义。
- [0449] R^g 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。
- [0450] R^g 中的取代基的具体例可以举出与在 R^a 中例示的取代基相同的取代基。
- [0451] G中的“ $R^cR^dN-C(=NR^g)-NR^e$ -所示的基团”中, R^c 及 R^d 表示与上述的“ R^cR^dN -所示的基团”中的它们同样的含义。 R^g 表示与上述的“ $R^a-C(=NR^g)-NR^e$ -所示的基团”中的 R^g 同样的含义。
- [0452] G中的“ $R^hR^iS(=O)=N-CO$ -所示的基团”中, R^h 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基, R^i 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。
- [0453] R^h 或 R^i 中的取代基的具体例可以举出与在 R^a 中例示的取代基相同的取代基。
- [0454] 其中, R^h 与 R^i 可以一起形成二价的有机基团。
- [0455] 作为可形成的二价的有机基团,可以举出取代或未取代的C2~5亚烷基或者取代或未取代的C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基。
- [0456] 作为“C2~5亚烷基”,可以举出二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。
- [0457] 作为“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”,可以举出二亚甲基氧基二亚甲基等。
- [0458] 作为“C2~5亚烷基”或“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等C1~6烷基;或氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基。
- [0459] G中的“ $R^hR^iS=N-CO$ -所示的基团”中, R^h 或 R^i 表示与上述的“ $R^hR^iS(=O)=N-CO$ -所示的基团”中的它们同样的含义。
- [0460] G中的“ $R^hR^jC=N-O$ -所示的基团”中, R^h 及 R^j 表示与上述的“ $R^hR^jS=N-O$ -所示的基团”中的它们同样的含义。
- [0461] 作为“ $R^hR^jC=N-O$ -所示的基团”的具体例,可以举出(丙烷-2-亚基氨基)氧基等。
- [0462] 取代基(G)存在2个以上的情况下,作为其中的2个可以一起形成的二价的有机基团,可以举出取代或未取代的C1~5亚烷基、取代或未取代的氧基C1~4亚烷基、取代或未取代的氧基C2~3亚烷基氧基、或者取代或未取代的C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基。
- [0463] 作为“C1~5亚烷基”,可以举出亚甲基、二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。
- [0464] 作为“氧基C1~4亚烷基”,可以举出氧基亚甲基、氧基二亚甲基等。
- [0465] 作为“氧基C2~3亚烷基氧基”,可以举出氧基二亚甲基氧基等。
- [0466] 作为“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”,可以举出二亚甲基氧基二亚甲基等。
- [0467] 作为“C1~5亚烷基”、“氧基C1~4亚烷基”、“氧基C2~3亚烷基氧基”、“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等C1~6烷基;或氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基。

[0468] 本发明中,作为优选的G,可以举出卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的3~10元环的杂环基、 $R^b-O-CO-$ 所示的基团、 R^cR^dN- 所示的基团、 R^cR^dN-CO- 所示的基团、 $R^a-CO-O-$ 所示的基团、 $R^a-CO-NR^e-$ 所示的基团、 $R^b-O-CO-NR^e-$ 所示的基团、 $R^cR^dN-CO-O-$ 所示的基团、 $R^cR^dN-CO-NR^e-$ 所示的基团、 $R^cR^dN-CS-NR^e-$ 所示的基团、 $R^bSO_2-NR^e-$ 所示的基团、 $R^aO-N=CR^f-$ 所示的基团、或者 $R^hR^iC=N-O-$ 所示的基团。

[0469] (A)

[0470] A表示取代或未取代的C1~6亚烷基、取代或未取代的C2~6亚链烯基、取代或未取代的C2~6亚炔基、或者取代或未取代的C3~6亚环烷基。

[0471] 作为A中的“C1~6亚烷基”,可以举出亚甲基、二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。

[0472] 作为A中的“C2~6亚链烯基”,可以举出亚乙烯基(-CH=CH-)、二亚乙烯基(-CH=CH-CH=CH-)、亚丙烯基(-CH=CH-CH₂-、-CH₂-CH=CH-)等。

[0473] 作为A中的“C2~6亚炔基”,可以举出亚乙炔基(-C≡C-)、亚丙炔基(-CH₂-C≡C-、-C≡C-CH₂-)等。

[0474] 作为A中的“C3~6亚环烷基”,可以举出1,2-亚环丙基、1,2-环丁烷二基、1,3-环丁烷二基等。

[0475] 本发明中,作为优选的A,可以举出取代或未取代的C1~6亚烷基或者取代或未取代的C2~6亚链烯基。

[0476] 作为C1~6亚烷基或C2~6亚链烯基上的取代基,可以举出从以下的取代基组中选择的1个或2个以上的取代基(以下,有时将该取代基用符号“Ga”表示。)

[0477] 另外,取代基(Ga)存在2个以上的情况下,其中的2个可以一起形成二价的有机基团。以下示出取代基组。

[0478] 卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、巯基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的3~6元环的杂环基、取代或未取代的3~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 $R^{a1}-CO-$ 所示的基团、羧基、 $R^{b1}-O-CO-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-$ 所示的基团、 $R^{a1}-CO-O-$ 所示的基团、 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{b1}-O-CO-O-$ 所示的基团、 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-O-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-$ 所示的基团、 $R^{c1}R^{d1}N-SO_2-$ 所示的基团、 $R^{a1}O-N=CR^{f1}-$ 所示的基团、 $R^{g1}R^{h1}C=N-O-$ 所示的基团、氧代基(O=)、硫代基(S=)、 $R^{a1}-N=$ 所示的二价基团、 $R^{a1}O-N=$ 所示的二价基团、 $R^{c1}R^{d1}N-N=$ 所示的二价基团、 $R^{a1}-CO-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团、 $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团、 $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团。

[0479] 上述的取代基组中, R^{a1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代

或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0480] R^{b1} 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0481] R^{c1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0482] R^{d1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，其中， R^{c1} 与 R^{d1} 可以一起形成二价的有机基团。

[0483] R^{e1} 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0484] R^{f1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基，

[0485] R^{g1} 表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0486] R^{h1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基，其中， R^{g1} 与 R^{h1} 可以一起形成二价的有机基团。

[0487] 作为Ga中的“卤代基”，可以举出氟基、氯基、溴基、碘基等。

[0488] Ga中的“C1~6烷基”可以为直链，也可以为支链。作为Ga中的“C1~6烷基”，可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基、2-甲基丁基、异己基等。

[0489] 作为Ga中的“C2~6链烯基”，可以举出乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基等。

[0490] 作为Ga中的“C2~6炔基”，可以举出乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-己炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基等。

[0491] 作为Ga中的“C1~6烷氧基”，可以举出甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、正戊基氧基、正己基氧基、异丙氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、异己基氧基等。

[0492] 作为Ga中的“C2~6链烯基氧基”，可以举出乙烯基氧基、烯丙基氧基、丙烯基氧基、丁烯基氧基等。

[0493] 作为Ga中的“C2~6炔基氧基”，可以举出乙炔基氧基、炔丙基氧基等。

[0494] 作为Ga中的“C1~6烷基硫基”，可以举出甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、正丁基硫基、正戊基硫基、正己基硫基、异丙基硫基等。

[0495] 作为Ga中的“C1~6烷基亚磺酰基”，可以举出甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、叔丁基亚磺酰基等。

[0496] 作为Ga中的“C1~6烷基磺酰基”，可以举出甲基磺酰基、乙基磺酰基、叔丁基磺酰基等。

[0497] 作为Ga中的“C1~6烷基”、“C2~6链烯基”、“C2~6炔基”、“C1~6烷氧基”、“C2~6链烯基氧基”、“C2~6炔基氧基”、“C1~6烷基硫基”、“C1~6烷基亚磺酰基”、或“C1~6烷基磺酰基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基;或者氰基。

[0498] 作为Ga中的“C3~6环烷基”,可以举出环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。

[0499] 作为Ga中的“C3~6环烷基氧基”,可以举出环丙基氧基、环丁基氧基、环戊基氧基、环己基氧基等。

[0500] 作为Ga中的“C6~10芳基”,可以举出苯基、萘基、茛基、茛满基、四氢化萘基等。

[0501] 作为Ga中的“C6~10芳基氧基”,可以举出苯氧基、萘氧基等。

[0502] 作为Ga中的“C6~10芳基硫基”,可以举出苯基硫基、萘基硫基等。

[0503] 作为Ga中的“C6~10芳基亚磺酰基”,可以举出苯基亚磺酰基、萘基亚磺酰基等。

[0504] 作为Ga中的“C6~10芳基磺酰基”,可以举出苯基磺酰基、萘基磺酰基等。

[0505] Ga中的“3~6元环的杂环基”是包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1、2、3或4个杂原子作为环的构成原子的基团。杂原子为2个以上时,它们可以相同,也可以不同。作为“3~6元环的杂环基”,可以举出3~6元环的饱和杂环基、5~6元环的杂芳基、5~6元环的部分不饱和杂环基等。

[0506] 作为3~6元环的饱和杂环基,可以举出氮丙啶基、环氧基、氮杂环丁基、氧杂环丁基、吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等。

[0507] 作为5~6元环的杂芳基,可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基;吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基。

[0508] 作为5~6元环的部分不饱和杂环基,可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基;异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基。

[0509] Ga中的“3~6元环的杂环基氧基”具有3~6元环的杂环基与氧基键合而成的结构。作为具体例,可以举出噻唑基氧基、吡啶基氧基等。

[0510] 作为Ga中的“C3~6环烷基”、“C3~6环烷基氧基”、“C6~10芳基”、“C6~10芳基氧基”、“C6~10芳基硫基”、“C6~10芳基亚磺酰基”、“C6~10芳基磺酰基”、“3~6元环的杂环基”、或“3~6元环的杂环基氧基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基;氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基;羟基;甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基;2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基;苯基、萘基等C6~10芳基;4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、

C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；或者氰基。

[0511] Ga中的“R^{a1}-CO-所示的基团”中，R^{a1}表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0512] 作为R^{a1}中的“C1~6烷基”，可以举出甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基、异丁基、仲丁基、叔丁基、异戊基、新戊基、2-甲基丁基、异己基等。

[0513] 作为R^{a1}中的“C2~6链烯基”，可以举出乙烯基、1-丙烯基等。

[0514] 作为R^{a1}中的“C2~6炔基”，可以举出乙炔基、1-丙炔基等。

[0515] 作为R^{a1}中的“C1~6烷基”、“C2~6链烯基”、或“C2~6炔基”上的取代基，优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基；羟基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基；2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基；环丙基、环丁基、环戊基、环己基等C3~6环烷基；苯基、萘基等C6~10芳基；4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；或者氰基。

[0516] 作为R^{a1}中的“C3~6环烷基”，可以举出环丙基、环丁基、环戊基、环己基等。

[0517] 作为R^{a1}中的“C6~10芳基”，可以举出苯基、萘基等。

[0518] R^{a1}中的“5~6元环的杂环基”是包含选自由氮原子、氧原子及硫原子组成的组中的1、2、3或4个杂原子作为环的构成原子的基团。杂原子为2个以上时，它们可以相同，也可以不同。作为“5~6元环的杂环基”，可以举出5~6元环的饱和杂环基、5~6元环的杂芳基、5~6元环的部分不饱和杂环基等。

[0519] 作为5~6元环的饱和杂环基，可以举出吡咯烷基、四氢呋喃基、噻唑烷基、四氢-2H-吡喃基、哌啶基、哌嗪基、吗啉基、二氧杂环戊基、二氧杂环己基等。

[0520] 作为5~6元环的杂芳基，可以举出吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5元环的杂芳基；吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、三嗪基等6元环的杂芳基。

[0521] 作为5~6元环的部分不饱和杂环基，可以举出吡咯啉基、二氢呋喃基、咪唑啉基、吡唑啉基、噁唑啉基等5元环的部分不饱和杂环基；异噁唑啉基、二氢吡喃基等6元环的部分不饱和杂环基。

[0522] 作为R^{a1}中的“C3~6环烷基”、“C6~10芳基”、或“5~6元环的杂环基”上的取代基，优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基；甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、正己基等C1~6烷基；氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基；羟基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基等C1~6烷氧基；2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1~6卤代烷氧基；苯基、萘基等C6~10芳基；4-甲基苯基、4-甲氧基苯基、4-氯苯基、4-三氟甲基苯基、4-三氟甲氧基苯基等被C1~6烷基、C1~6烷氧基、卤代基、C1~6卤代烷基、或C1~6卤代烷氧基中的任意1个以上取代基取代的C6~10芳基；或者氰基。

[0523] 作为“R^{a1}-CO-所示的基团”的具体例，可以举出甲酰基、乙酰基等。

[0524] Ga中的“R^{b1}-O-CO-所示的基团”中，R^{b1}表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未

取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基。

[0525] R^{b1} 中的取代基的具体例可以举出与在 R^{a1} 中例示的取代基相同的取代基。

[0526] 作为“ R^{b1} -O-CO-所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基、乙氧基羰基、叔丁氧基羰基等。

[0527] Ga中的“ $R^{c1}R^{d1}N$ -所示的基团”中, R^{c1} 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基, R^{d1} 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0528] R^{c1} 或 R^{d1} 中的取代基的具体例可以举出与在 R^{a1} 中例示的取代基相同的取代基。

[0529] 其中, R^{c1} 与 R^{d1} 可以一起形成二价的有机基团。

[0530] 作为可形成的二价的有机基团,可以举出取代或未取代的C2~5亚烷基或者取代或未取代的C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基。

[0531] 作为“C2~5亚烷基”,可以举出二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。

[0532] 作为“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”,可以举出二亚甲基氧基二亚甲基等。

[0533] 作为“C2~5亚烷基”或“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等C1~6烷基;或氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基。

[0534] 作为“ $R^{c1}R^{d1}N$ -所示的基团”的具体例,可以举出氨基、甲基氨基、二甲基氨基等。

[0535] Ga中的“ $R^{c1}R^{d1}N$ -CO-所示的基团”中, R^{c1} 及 R^{d1} 表示与上述的“ $R^{c1}R^{d1}N$ -所示的基团”中的它们同样的含义。

[0536] 作为“ $R^{c1}R^{d1}N$ -CO-所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基、N,N-二甲基氨基羰基、N-(异丙基)氨基羰基、N-(异丙基)-N-甲基氨基羰基等。

[0537] Ga中的“ R^{a1} -CO-O-所示的基团”中, R^{a1} 表示与上述的“ R^{a1} -CO-所示的基团”中的 R^{a1} 同样的含义。

[0538] 作为“ R^{a1} -CO-O-所示的基团”的具体例,可以举出乙酰基氧基等。

[0539] Ga中的“ R^{a1} -CO-NR^{e1}-所示的基团”中, R^{a1} 表示与上述的“ R^{a1} -CO-所示的基团”中的 R^{a1} 同样的含义。

[0540] R^{e1} 表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基。

[0541] R^{e1} 中的取代基的具体例可以举出与在 R^{a1} 中例示的取代基相同的取代基。

[0542] 作为“ R^{a1} -CO-NR^{e1}-所示的基团”的具体例,可以举出乙酰基氨基等。

[0543] Ga中的“ R^{b1} -O-CO-O-所示的基团”中, R^{b1} 表示与上述的“ R^{b1} -O-CO-所示的基团”中的 R^{b1} 同样的含义。

[0544] 作为“ R^{b1} -O-CO-O-所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氧基等。

[0545] Ga中的“ R^{b1} -O-CO-NR^{e1}-所示的基团”中, R^{b1} 表示与上述的“ R^{b1} -O-CO-所示的基团”中的 R^{b1} 同样的含义。 R^{e1} 表示与上述的“ R^{b1} -CO-NR^{e1}-所示的基团”中的 R^{e1} 同样的含义。

[0546] 作为“ R^{b1} -O-CO-NR^{e1}-所示的基团”的具体例,可以举出甲氧基羰基氨基等。

[0547] Ga中的“ $R^{c1}R^{d1}N$ -CO-O-所示的基团”中, R^{c1} 及 R^{d1} 表示与上述的“ $R^{c1}R^{d1}N$ -所示的基

团”中的它们同样的含义。

[0548] 作为“ $R^{c1}R^{d1}N-CO-O-$ 所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基氧基、 N,N -二甲基氨基羰基氧基等。

[0549] Ga中的“ $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团”中, R^{c1} 及 R^{d1} 表示与上述的“ $R^{c1}R^{d1}N-$ 所示的基团”中的它们同样的含义。 R^{e1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团”中的 R^{e1} 同样的含义。

[0550] 作为“ $R^{c1}R^{d1}N-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团”的具体例,可以举出氨基甲酰基氨基、 N,N -二甲基氨基羰基氨基等。

[0551] Ga中的“ $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-$ 所示的基团”中, R^{b1} 表示与上述的“ $R^{b1}-O-CO-$ 所示的基团”中的 R^{b1} 同样的含义。 R^{e1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团”中的 R^{e1} 同样的含义。

[0552] 作为“ $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-$ 所示的基团”的具体例,可以举出甲磺酰基氨基等。

[0553] Ga中的“ $R^{c1}R^{d1}N-SO_2-$ 所示的基团”中, R^{c1} 及 R^{d1} 表示与上述的“ $R^{c1}R^{d1}N-$ 所示的基团”中的它们同样的含义。

[0554] 作为“ $R^{c1}R^{d1}N-SO_2-$ 所示的基团”的具体例,可以举出 N,N -二甲基氨基磺酰基等。

[0555] Ga中的“ $R^{a1}O-N=CR^{f1}-$ 所示的基团”中, R^{a1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-$ 所示的基团”中的 R^{a1} 同样的含义。

[0556] R^{f1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基。

[0557] R^{f1} 中的取代基的具体例可以举出与在 R^g 中例示的取代基相同的取代基。

[0558] 作为“ $R^{a1}O-N=CR^{f1}-$ 所示的基团”的具体例,可以举出(羟基亚氨基)甲基、(乙氧基亚氨基)甲基等。

[0559] Ga中的“ $R^{g1}R^{h1}C=N-O-$ 所示的基团”中, R^{g1} 表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基, R^{h1} 表示氢原子、或者取代或未取代的C1~6烷基。

[0560] R^{g1} 或 R^{h1} 中的取代基的具体例可以举出与在 R^{a1} 中例示的取代基相同的取代基。

[0561] 其中, R^{g1} 与 R^{h1} 可以一起形成二价的有机基团。

[0562] 作为可形成的二价的有机基团,可以举出取代或未取代的C2~5亚烷基或者取代或未取代的C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基。

[0563] 作为“C2~5亚烷基”,可以举出二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。

[0564] 作为“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”,可以举出二亚甲基氧基二亚甲基等。

[0565] 作为“C2~5亚烷基”或“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等C1~6烷基;或氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基。

[0566] 作为“ $R^{g1}R^{h1}C=N-O-$ 所示的基团”的具体例,可以举出(丙烷-2-亚基氨基)氧基等。

[0567] Ga中的“ $R^{a1}-N=$ 所示的二价基团”中, R^{a1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-$ 所示的基团”中的 R^{a1} 同样的含义。

[0568] 作为“ $R^{a1}-N=$ 所示的二价基团”的具体例,可以举出亚氨基(HN=)、甲基亚氨基等。

[0569] Ga中的“ $R^{a1}O-N=$ 所示的二价基团”中, R^{a1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-$ 所示的基团”中的 R^{a1} 同样的含义。

[0570] 作为“ $R^{a1}O-N=$ 所示的二价基团”的具体例,可以举出 N -羟基亚氨基、 N -甲氧基亚氨

基等。

[0571] Ga中的“ $R^{c1}R^{d1}N-N=$ 所示的二价基团”中, R^{c1} 及 R^{d1} 表示与上述的“ $R^{c1}R^{d1}N-$ 所示的基团”中的它们同样的含义。

[0572] 作为“ $R^{c1}R^{d1}N-N=$ 所示的二价基团”的具体例,可以举出2,2-二甲基亚肼基等。

[0573] Ga中的“ $R^{a1}-CO-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团”中, R^{a1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-$ 所示的基团”中的 R^{a1} 同样的含义。 R^{e1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团”中的 R^{e1} 同样的含义。

[0574] Ga中的“ $R^{b1}-O-CO-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团”中, R^{b1} 表示与上述的“ $R^{b1}-O-CO-$ 所示的基团”中的 R^{b1} 同样的含义。 R^{e1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团”中的 R^{e1} 同样的含义。

[0575] Ga中的“ $R^{b1}SO_2-NR^{e1}-N=$ 所示的二价基团”中, R^{b1} 表示与上述的“ $R^{b1}-O-CO-$ 所示的基团”中的 R^{b1} 同样的含义。 R^{e1} 表示与上述的“ $R^{a1}-CO-NR^{e1}-$ 所示的基团”中的 R^{e1} 同样的含义。

[0576] 取代基(Ga)存在2个以上的情况下,作为其中的2个可以一起形成的二价的有机基团,可以举出取代或未取代的C1~5亚烷基、取代或未取代的氧基C1~4亚烷基、取代或未取代的氧基C2~3亚烷基氧基、或者取代或未取代的C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基。

[0577] 作为“C1~5亚烷基”,可以举出亚甲基、二亚甲基、三亚甲基、四亚甲基等。

[0578] 作为“氧基C1~4亚烷基”,可以举出氧基亚甲基、氧基二亚甲基等。

[0579] 作为“氧基C2~3亚烷基氧基”,可以举出氧基二亚甲基氧基等。

[0580] 作为“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”,可以举出二亚甲基氧基二亚甲基等。

[0581] 作为“C1~5亚烷基”、“氧基C1~4亚烷基”、“氧基C2~3亚烷基氧基”、“C1~3亚烷基氧基C1~3亚烷基”上的取代基,优选为氟基、氯基、溴基、碘基等卤代基;甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等C1~6烷基;或氯甲基、氯乙基、三氟甲基、1,2-二氯正丙基、1-氟正丁基等C1~6卤代烷基。

[0582] 本发明中,作为优选的Ga,可以举出羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、 $R^{a1}-CO-O-$ 所示的基团、氧代基($O=$)、或者 $R^{a1}O-N=$ 所示的二价基团。

[0583] 在该情况下,作为优选的取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基,可以举出四氢-2H-吡喃-4-基。

[0584] 本发明中,作为进一步优选的Ga,可以举出羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、 $R^{a1}-CO-O-$ 所示的基团、氧代基($O=$)、或者 $R^{a1}O-N=$ 所示的二价基团。

[0585] (盐)

[0586] 化合物(II)的盐只要是农业园艺学上所允许的盐,就没有特别限制。例如,可以举出盐酸、硫酸等无机酸的盐;乙酸、乳酸等有机酸的盐;锂、钠、钾等碱金属的盐;钙、镁等碱土金属的盐;铁、铜等过渡金属的盐;三乙基胺、三丁基胺、吡啶、胍等有机碱的盐;氨等。

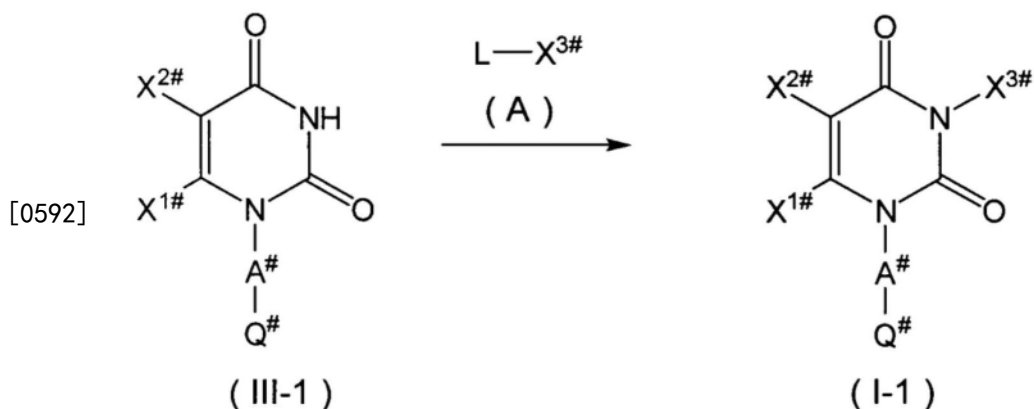
[0587] (制造方法)

[0588] 化合物(II)或化合物(II)的盐的制造方法没有限定。例如,本发明的化合物(II)或化合物(II)的盐可以通过实施例等中记载的那样的已知的方法而得到。另外,化合物(II)的盐可以通过已知的方法由化合物(II)得到。

[0589] (反应合成路径1)

[0590] 例如,化合物(II)中,对于以下所示的式(I-1)的化合物,可以如以下的反应合成路径1所示的那样,通过使式(III-1)的化合物与式(A)的化合物缩合来制备。

[0591] [化学式8]



[0593] 式(I-1)中, $X^{1\#}$ 表示与式(II)中的 X^1 同样的含义,或者表示可通过通常的方法衍生为 X^1 的结构。 $X^{2\#}$ 表示与式(II)中的 X^2 同样的含义,或者表示可通过通常的方法衍生为 X^2 的结构。 $X^{3\#}$ 表示与式(II)中的 X^3 同样的含义,或者表示可通过通常的方法衍生为 X^3 的结构。 $Q^\#$ 表示与式(II)中的Q同样的含义,或者表示可通过通常的方法衍生为Q的结构。 $A^\#$ 表示与式(II)中的A同样的含义,或者表示可通过通常的方法衍生为A的结构。

[0594] 式(III-1)中的符号表示与式(I-1)中的它们同样的含义。

[0595] 式(A)中的 $X^{3\#}$ 表示与式(I-1)中的 $X^{3\#}$ 同样的含义。L表示离去基团。

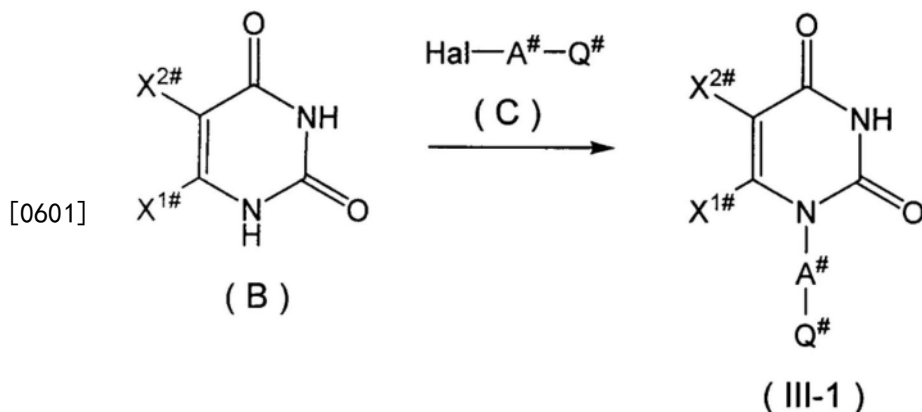
[0596] 例如,使用在L中具有甲磺酰基氧基等离去基团的式(A)的化合物的情况下,可通过在无机碱存在下进行反应来制备。

[0597] 例如,使用L为羟基的式(A)的化合物的情况下,可通过采用光延反应来制备。

[0598] (反应合成路径2)

[0599] 式(III-1)的化合物可以如以下的反应合成路径2所示的那样,通过使式(B)的化合物与式(C)的化合物缩合来制备。

[0600] [化学式9]



[0602] 式(B)中的符号表示与式(I-1)中的它们同样的含义。式(C)中的符号表示与式(I-1)中的它们同样的含义。Hal表示卤代基。

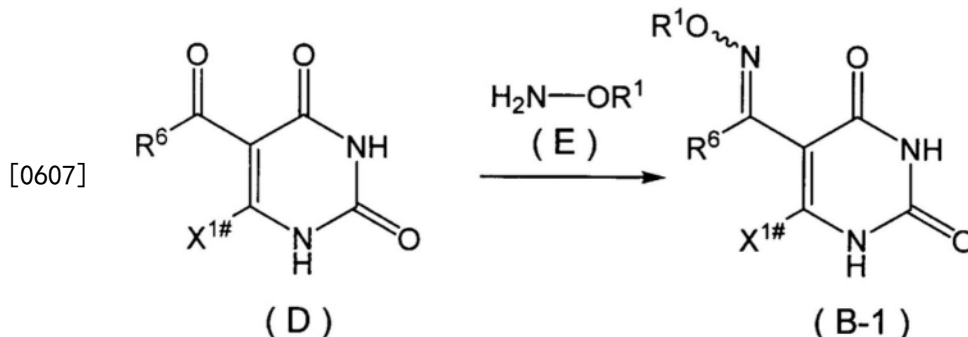
[0603] 例如,可通过使式(B)的化合物与式(C)的化合物在无机碱存在下进行反应来制

备。

[0604] (反应合成路径3)

[0605] 式(B)的化合物中, X^2 部分为 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团的式(B-1)的化合物可以如以下的反应合成路径3所示的那样, 通过使式(D)的化合物与式(E)的化合物缩合来制备。

[0606] [化学式10]



[0608] 式(B-1)中的 R^1 及 R^6 表示与式(II)中的 R^1 及 R^6 同样的含义。 $X^{1\#}$ 表示与式(I-1)中的 $X^{1\#}$ 同样的含义。

[0609] 式(D)中的 R^6 表示与式(II)中的 R^6 同样的含义。 $X^{1\#}$ 表示与式(I-1)中的 $X^{1\#}$ 同样的含义。

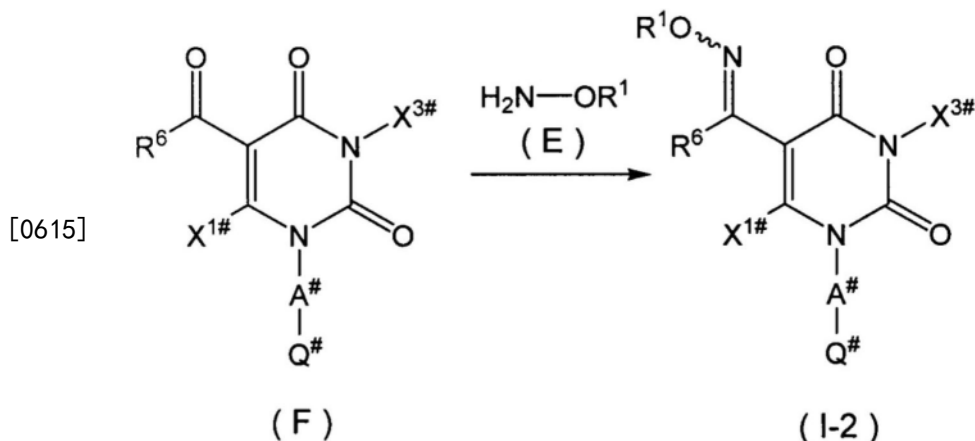
[0610] 式(E)中的 R^1 表示与式(II)中的 R^1 同样的含义。需要说明的是, 式(E)的化合物也可以使用其盐酸盐。

[0611] 例如, 可通过使式(D)的化合物与式(E)的化合物在醇溶剂中进行反应来制备。

[0612] (反应合成路径4)

[0613] 式(I-1)的化合物中, X^2 部分为 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团的式(I-2)的化合物可以如以下的反应合成路径4所示的那样, 通过使式(F)的化合物与式(E)的化合物缩合来制备。

[0614] [化学式11]



[0616] 式(I-2)中的 R^1 及 R^6 表示与式(II)中的 R^1 及 R^6 同样的含义。其他符号表示与式(I-1)中的其他符号同样的含义。

[0617] 式(F)中的 R^6 表示与式(II)中的 R^6 同样的含义。其他符号表示与式(I-1)中的其他符号同样的含义。

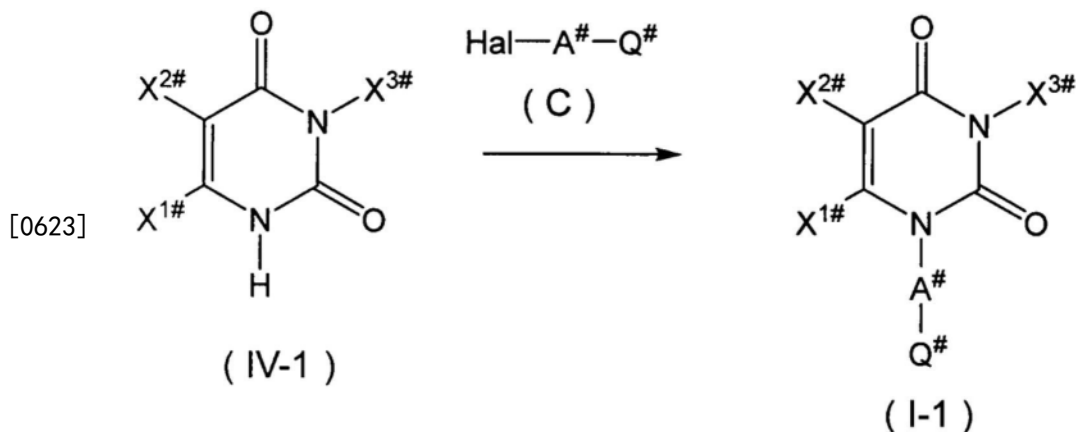
[0618] 式(E)中的 R^1 表示与式(II)中的 R^1 同样的含义。需要说明的是, 式(E)的化合物也可以使用其盐酸盐。

[0619] 例如,可通过使式(D)的化合物与式(E)的化合物在醇溶剂中进行反应来制备。

[0620] (反应合成路径5)

[0621] 式(I-1)的化合物也可以如以下的反应合成路径5所示的那样,通过使式(IV-1)的化合物与式(C)的化合物缩合来制备。

[0622] [化学式12]



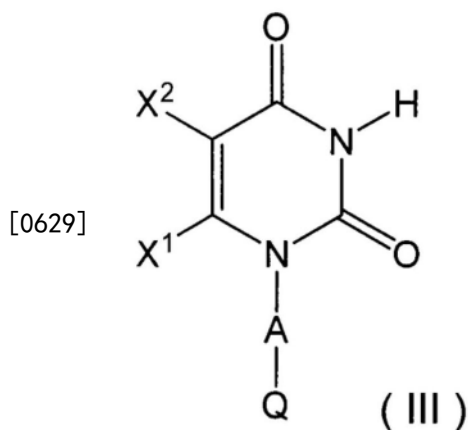
[0624] 式(IV-1)中的符号表示与式(I-1)中的它们同样的含义。式(C)中的符号表示与式(I-1)中的它们同样的含义。Hal表示卤代基。

[0625] 例如,可通过使式(IV-1)的化合物与式(C)的化合物在无机碱存在下进行反应来制备。

[0626] (制造中间体)

[0627] 下述式(III)所示的化合物或其盐可以作为制造式(II)所示的化合物时的制造中间体来使用。

[0628] [化学式13]



[0630] 式(III)中, X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取

代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1 -CO-所示的基团、羧基、 R^2 -O-CO-所示的基团、 R^3R^4N -所示的基团、 R^3R^4N -CO-所示的基团、 R^1 -CO-O-所示的基团、 R^1 -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2 -O-CO-O-所示的基团、 R^2 -O-CO-NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -CO-O-所示的基团、 R^3R^4N -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2SO_2 -NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -SO₂-所示的基团、或者 R^1O -N=CR⁶-所示的基团；

[0631] R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0632] R^2 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0633] R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0634] R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0635] 其中， R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团，

[0636] R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0637] R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

[0638] X^2 表示 R^1O -N=CR⁶-所示的基团、 R^1CO -O-N=CR⁶-所示的基团、 R^3R^4N -CO-O-N=CR⁶-所示的基团、 R^3R^4N -N=CR⁶-所示的基团、或 R^7 -N=CR⁶-所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

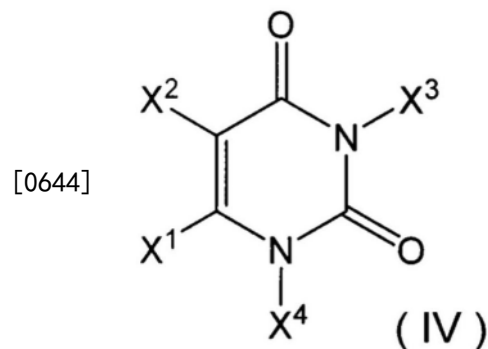
[0639] A表示取代或未取代的C1~6亚烷基、取代或未取代的C2~6亚链烯基、取代或未取代的C2~6亚炔基、或者取代或未取代的C3~6亚环烷基；

[0640] Q表示取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~10元环的杂环基。

[0641] 式(III)中的符号表示与式(II)中的它们同样的含义。

[0642] 下述式(IV)所示的化合物或其盐可以作为制造式(II)所示的化合物时的制造中间体来使用。

[0643] [化学式14]



[0645] 式(IV)中, X^1 表示氢原子、卤代基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、羟基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C2~6链烯基氧基、取代或未取代的C2~6炔基氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、取代或未取代的C1~6烷基亚磺酰基、取代或未取代的C1~6烷基磺酰基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C3~6环烷基氧基、取代或未取代的C6~10芳基、取代或未取代的C6~10芳基氧基、取代或未取代的C6~10芳基硫基、取代或未取代的C6~10芳基亚磺酰基、取代或未取代的C6~10芳基磺酰基、取代或未取代的5~6元环的杂环基、取代或未取代的5~6元环的杂环基氧基、硝基、氰基、 R^1 -CO-所示的基团、羧基、 R^2 -O-CO-所示的基团、 R^3R^4N -所示的基团、 R^3R^4N -CO-所示的基团、 R^1 -CO-O-所示的基团、 R^1 -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2 -O-CO-O-所示的基团、 R^2 -O-CO-NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -CO-O-所示的基团、 R^3R^4N -CO-NR⁵-所示的基团、 R^2SO_2 -NR⁵-所示的基团、 R^3R^4N -SO₂-所示的基团、或者 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团；

[0646] R^1 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0647] R^2 各自独立地表示取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0648] R^3 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C2~6链烯基、取代或未取代的C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基，

[0649] R^4 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0650] 其中， R^3 与 R^4 可以一起形成二价的有机基团，

[0651] R^5 各自独立地表示氢原子、取代或未取代的C1~6烷基、或者取代或未取代的C6~10芳基，

[0652] R^6 表示氢原子、卤代基、氨基、取代或未取代的单C1~6烷基氨基、取代或未取代的二C1~6烷基氨基、取代或未取代的C1~6烷基、取代或未取代的C1~6烷氧基、取代或未取代的C1~6烷基硫基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

[0653] X^2 表示 $R^1O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^1CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-CO-O-N=CR^6$ -所示的基团、 $R^3R^4N-N=CR^6$ -所示的基团、或 $R^7-N=CR^6$ -所示的基团； R^1 、 R^3 、 R^4 、及 R^6 表示与 X^1 中的它们同样的含义； R^7 表示取代或未取代的5元环的杂环基；

[0654] X^3 表示取代或未取代的直链C1~6烷基、取代或未取代的直链C2~6链烯基、取代或未取代的直链C2~6炔基、取代或未取代的C3~6环烷基、取代或未取代的C6~10芳基、或者取代或未取代的5~6元环的杂环基；

[0655] X^4 表示氢原子或C1~6烷氧基甲基。

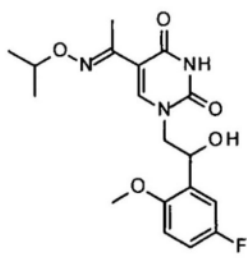
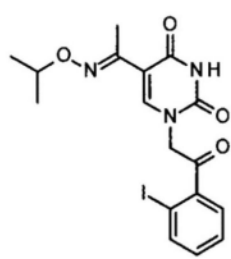
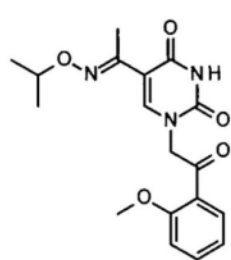
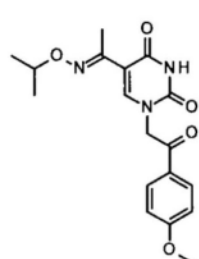
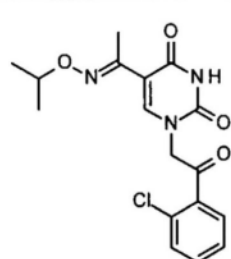
[0656] 式(IV)中的 X^4 以外的符号表示与式(II)中的它们同样的含义。

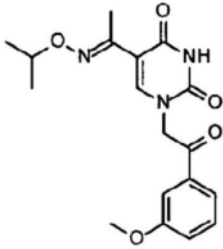
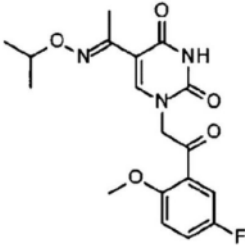
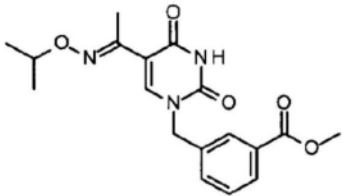
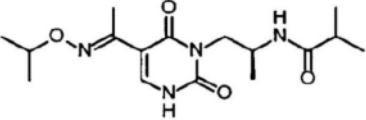
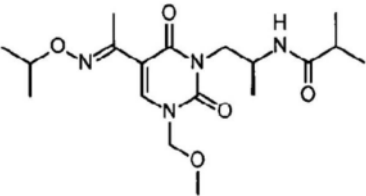
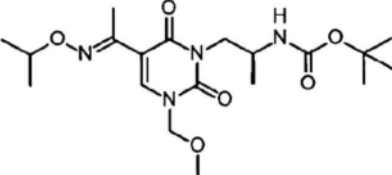
[0657] 作为 X^4 的“C1~6烷氧基甲基”的“C1~6烷氧基”，可以举出甲氧基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、正戊基氧基、正己基氧基、异丙氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、异己基氧基等。

[0658] 将本发明的化合物(II)的制造中使用的制造中间体的一个例子示于以下的表1。在表中,作为各化合物的物性而将熔点(m.p.)一并示出。

[0659] [表1]

[0660]

化合物编号	结构式	物性
1		m.p. 198-200°C
2		m.p. 186-187°C
3		m.p. 185-186°C
4		m.p. 182-183°C
5		m.p. 157-158°C

6		m.p. 124-125°C
7		m.p. 199-202°C
8		m.p. 128-129°C
9		m.p. 205-206°C
10		m.p. 125-126°C
11		粘性油

[0661]

[0662] 关于表1所记载的化合物中的、具有非晶或粘性油的性状的化合物,下文示出其¹H-NMR数据。

[0663] 化合物11: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) 7.49 (1H, s), 5.21-3.70 (7H, m), 3.43 (3H, s), 2.16 (3H, s), 1.35-1.20 (9H, m).

[0664] (农业园艺用杀菌剂)

[0665] 本发明的农业园艺用杀菌剂含有选自化合物(II)及其盐中的至少一种作为有效成分。本发明的农业园艺用杀菌剂中包含的化合物(II)或其盐的量只要显示出杀菌效果,就没有特别限制。

[0666] 本发明的农业园艺用杀菌剂可以用于防除源自属于广范围的种类的丝状菌、例如卵菌类(Oomycetes)、子囊(囊)菌类(Ascomycetes)、半知菌类(Deuteromycetes)、担子菌类(Basidiomycetes)、接合菌类(Zygomycetes)的菌的植物病害。

[0667] 以下示出成为防除对象的植物病害(病原菌)的例子。

[0668] 甜菜:褐斑病(*Cercospora beticola*)、黑根病(*Aphanomyces cochlioides*)、根腐病(*Thanatephorus cucumeris*)、叶腐病(*Thanatephorus cucumeris*)、锈病(*Uromyces betae*)、白粉病(*Oidium* sp.)、斑点病(*Ramularia beticola*)、苗立枯病(*Aphanomyces cochlioides*、*Pythium ultimum*)等

[0669] 花生:褐斑病(*Mycosphaerella arachidis*)、污斑病(*Ascochyta* sp.)、锈病(*Puccinia arachidis*)、立枯病(*Pythium debaryanum*)、锈斑病(*Alternaria alternata*)、白绢病(*Sclerotium rolfsii*)、黑涩病(*Mycosphaerella berkeleyi*)、黑根腐病(*Calonectria ilicicola*)等

[0670] 黄瓜:白粉病(*Sphaerotheca fuliginea*)、霜霉病(*Pseudoperonospora cubensis*)、蔓枯病(*Mycosphaerella melonis*)、枯萎病(*Fusarium oxysporum*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、炭疽病(*Colletotrichum orbiculare*)、黑星病(*Cladosporium cucumerinum*)、褐斑病(*Corynespora cassiicola*)、苗立枯病(*Pythium debaryanum*、*Rhizoctonia solani* Kuhn)、拟茎点霉根腐病(*Phomopsis* sp.)细菌性叶斑病(*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*)等

[0671] 番茄:灰霉病(*Botrytis cinerea*)、叶霉病(*Cladosporium fulvum*)、疫病(*Phytophthora infestans*)、黄萎病(*Verticillium albo-atrum*、*Verticillium dahliae*)、白粉病(*Oidium neolycopersici*)、轮纹病(*Alternaria solani*)、煤霉病(*Pseudocercospora fuligena*)、青枯病(*Ralstonia solanacearum*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)等

[0672] 茄子:灰霉病(*Botrytis cinerea*)、黑枯病(*Corynespora melongenae*)、白粉病(*Erysiphe cichoracearum*)、煤霉病(*Mycovellosiella natrassii*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、黄萎病(*Verticillium dahliae*)、褐纹病(*Phomopsis vexans*)等

[0673] 辣椒:疫病(*Phytophthora capsici*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、炭疽病(*Colletotrichum aenigma*、*Colletotrichum capsici*、*Colletotrichum fructicola*、*Colletotrichum jiangxiense*)、白粉病(*Leveillula taurica*)等

[0674] 草莓:灰霉病(*Botrytis cinerea*)、白粉病(*Sphaerotheca humuli*)、炭疽病(*Colletotrichum acutatum*、*Colletotrichum fragariae*)、疫病(*Phytophthora*

cactorum)、软腐病(*Rhizopus stolonifer*)、萎黄病(*Fusarium oxysporum*)、枯萎病(*Verticillium dahliae*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)等

[0675] 洋葱:颈腐病(*Botrytis allii*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、白斑叶枯病(*Botrytis squamosa*)、霜霉病(*Peronospora destructor*)、白色疫病(*Phytophthora porri*)、小菌核病(*Ciborinia allii*)、小菌核腐病(*Botrytis squamosa*)、干腐病(*Fusarium oxysporum*)、红根腐病(*Pyrenochaeta terrestris*)、黑腐菌核病(*Sclerotium cepivorum*)、锈病(*Puccinia allii*)、白绢病(*Sclerotium rolfsii*)等

[0676] 葱:软腐病(*Pectobacterium carotovorum*)、霜霉病(*Peronospora destructor*)、叶枯病(*Pleospora allii*)、黑腐菌核病(*Sclerotium cepivorum*)、锈病(*Puccinia allii*)、白斑叶枯病(*Botrytis squamosa*)、白绢病(*Sclerotium rolfsii*)、红根腐病(*Pyrenochaeta terrestris*)等

[0677] 卷心菜:根肿病(*Plasmodiophora brassicae*)、软腐病(*Erwinia carotovora*)、黑腐病(*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*)、黑斑细菌病(*Pseudomonas syringae* pv. *maculicola*, *P. s.* pv. *alisalensis*)、霜霉病(*Peronospora parasitica*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、黑煤病(*Alternaria brassicicola*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、根朽病(*Phoma lingam*)、腐霉病(*Pythium aphanidermatum*, *Pythium ultimum*)、白锈病(*Albugo macrospora*)等

[0678] 莴苣:腐烂病(*Pseudomonas cichorii*, *Pseudomonas marginalis*)、软腐病(*Pectobacterium carotovorum*)、霜霉病(*Bremia lactucae*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、巨脉病(*Mirafiori lettuce big-vein ophiovirus*)、根腐病(*Fusarium oxysporum*)、底枯病(*Rhizoctonia solani*)、白粉病(*Golovinomyces orontii*)等

[0679] 扁豆:菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、炭疽病(*Colletotrichum lindemuthianum*)、角斑病(*Phaeoisariopsis griseola*)等

[0680] 豌豆:褐纹病(*Mycosphaerella blight*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、白粉病(*Erysiphe pisi*)等

[0681] 苹果:白粉病(*Podosphaera leucotricha*)、黑星病(*Venturia inaequalis*)、花腐病(*Monilinia mali*)、黑点病(*Mycosphaerella pomi*)、腐烂病(*Valsa mali*)、斑点落叶病(*Alternaria mali*)、赤星病(*Gymnosporangium yamadae*)、轮纹病(*Botryosphaeria berengeriana*)、炭疽病(*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*)、褐斑病(*Diplocarpon mali*)、蝇粪病(*Zygophiala jamaicensis*)、煤污病(*Gloeodes pomigena*)、紫纹羽病(*Helicobasidium mompa*)、白纹羽病(*Rosellinia necatrix*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、火疫病(*Erwinia amylovora*)、银叶病(*Chondrostereum purpureum*)、根瘤病(*Rhizobium radiobacter*, *Rhizobium rhizogenes*)等

[0682] 梅子:黑星病(*Cladosporium carpophilum*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、灰星病(*Monilinia mumecola*)、煤污病(*Peltaster* sp.)、袋果病(*Taphrina pruni*)、褐色穿孔病(*Phloeospora padi*)等

[0683] 柿子:白粉病(*Phyllactinia kakicola*)、炭疽病(*Gloeosporium kaki*)、角斑落叶病(*Cercospora kaki*)、圆星落叶病(*Mycosphaerella nawae*)、灰霉病(*Botrytis*

cinerea)、蝇粪病(*Zygophiala jamaicensis*)等

[0684] 桃子:灰星病(*Monilinia fructicola*、*Monilia fructigena*)、黑星病(*Cladosporium carpophilum*)、拟茎点种腐病(*Phomopsis* sp.)、细菌性穿孔病(*Xanthomonas campestris* pv.*pruni*)、缩叶病(*Taphrina deformans*)、炭疽病(*Colletotrichum gloeosporioides*)、褐色穿孔病(*Phloeospora padi*)、茎腐病(*Coriolus versicolor*)等

[0685] 杏仁:灰星病(*Monilinia laxa*)、斑点病(*Stigmata carpophila*)、黑星病(*Cladosporium carpophilum*)、李叶红点病(*Polystigma rubrum*)、斑点落叶病(*Alternaria alternata*)、炭疽病(*Colletotrichum gloeosporioides*)等

[0686] 樱桃:灰星病(*Monilinia fructicola*)、炭疽病(*Colletotrichum acutatum*)、黑斑病(*Alternaria* sp.)、幼果菌核病(*Monilinia kusanoi*)、褐色穿孔病(*Mycosphaerella cerasella*)、白粉病(*Podosphaera tridactyla*)等

[0687] 葡萄:灰霉病(*Botrytis cinerea*)、白粉病(*Uncinula necator*)、晚腐病(*Glomerella cingulata*、*Colletotrichum acutatum*)、霜霉病(*Plasmopara viticola*)、黑痘病(*Elsinoe ampelina*)、褐斑病(*Pseudocercospora vitis*)、黑腐病(*Guignardia bidwellii*)、白腐病(*Coniella castaneicola*)、锈病(*Phakopsora ampelopsidis*)、白色绵雪症(病原菌未确定)、根头癌肿病(*Rhizobium radiobacter*、*Rhizobium vitis*)等

[0688] 梨:黑星病(*Venturia nashicola*)、赤星病(*Gymnosporangium asiaticum*)、黑斑病(*Alternaria kikuchiana*)、轮纹病(*Botryosphaeria berengeriana*)、白粉病(*Phyllactinia mali*)、胴枯病(*Phomopsis fukushii*)、褐色斑点病(*Stemphylium vesicarium*)、炭疽病(*Glomerella cingulata*)等

[0689] 茶:轮斑病(*Pestalotiopsis longiseta*、*P.theae*)、炭疽病(*Colletotrichum theae-sinensis*)、网饼病(*Exobasidium reticulatum*)、猝倒病(*Pseudomonas syringae*)、饼病(*Exobasidium vexans*)等

[0690] 柑橘:疮痂病(*Elsinoe fawcettii*)、青霉病(*Penicillium italicum*)、绿霉病(*Penicillium digitatum*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、黑点病(*Diaporthe citri*)、溃疡病(*Xanthomonas campestris* pv.*Citri*)、白粉病(*Oidium* sp.)、疫病(*Phytophthora citrophthora*)、炭疽病(*Colletotrichum fioriniae*)等

[0691] 猕猴桃:花腐细菌病(*Pseudomonas marginalis*、*Pseudomonas syringae*、*Pseudomonas viridiflava*)、溃疡病(*Pseudomonas syringae*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、果实软腐病(*Botryosphaeria dothidea*、*Diaporthe* sp.、*Lasioidiplodia theobromae*)、煤污病(*Pseudocercospora actinidiae*)等

[0692] 橄榄:炭疽病(*Colletotrichum acutatum*、*Colletotrichum gloeosporioides*)、孔雀斑病(*Peacock spot*)(*Spilocaea oleaginea*)等

[0693] 栗子:炭疽病(*Colletotrichum gloeosporioides*)等

[0694] 小麦:白粉病(*Blumeria graminis* f.sp.*tritici*)、赤霉病(*Gibberella zeae*、*Fusarium avenaceum*、*Fusarium culmorum*、*Fusarium crookwellense*、*Microdochium nivale*)、叶锈病(*Puccinia recondita*)、条锈病(*Puccinia striiformis*)、褐色雪腐病(*Pythium iwayamai*)、红色雪腐病(*Monographella nivalis*)、眼纹病

(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、叶枯病(*Septoria tritici*)、颖枯病(*Leptosphaeria nodorum*)、雪腐小粒菌核病(*Typhula incarnata*)、雪腐大粒菌核病(*Myriosclerotinia borealis*)、立枯病(*Gaeumannomyces graminis*)、麦角病(*Claviceps purpurea*)、腥黑穗病(*Tilletia caries*)、散黑穗病(*Ustilago nuda*)、稻瘟病(*Pyricularia grisea*)、立枯病(Damping off) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)、苗立枯病(Seedling blight) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)等

[0695] 大麦:条纹病(*Pyrenophora graminea*)、网斑病(*Pyrenophora teres*)、云斑病(*Rhynchosporium secalis*)、散黑穗病(*Ustilago tritici*、*U. nuda*)、立枯病(Damping off) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)、苗立枯病(Seedling blight) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)等

[0696] 稻子:稻瘟病(*Pyricularia oryzae*)、纹枯病(*Rhizoctonia solani*)、恶苗病(*Gibberella fujikuroi*)、胡麻叶斑病(*Cochliobolus miyabeanus*)、苗立枯病(*Pythium graminicola*)、白叶枯病(*Xanthomonas oryzae*)、细菌性立枯病(*Burkholderia plantarii*)、褐条病(*Acidovorax avenae*)、细菌性谷枯病(*Burkholderia glumae*)、稻条叶枯病(*Cercospora oryzae*)、稻曲病(*Ustilaginoidea virens*)、褐变米(*Alternaria alternata*、*Curvularia intermedia*)、黑芯米(*Alternaria padwickii*)、红变米(*Epicoccum purpurascens*)等

[0697] 烟草:菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、白粉病(*Erysiphe cichoracearum*)、疫病(*Phytophthora nicotianae*)等

[0698] 郁金香:灰霉病(*Botrytis cinerea*)、褐色斑点病(*Botrytis tulipae*)、叶腐病(*Rhizoctonia solani*)、球根腐烂病(*Fusarium oxysporum*)、皮腐病(*Rhizoctonia solani*)等

[0699] 蔷薇:黑星病(*Diplocarpon rosae*)、白粉病(*Erysiphe simulans*、*Podosphaera pannosa*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)等

[0700] 菊花:灰霉病(*Botrytis cinerea*)、白锈病(*Puccinia horiana*)、霜霉病(*Paraperonospora minor*、*Peronospora danica*)、腐霉立枯病(*Pythium aphanidermatum*、*Pythium dissotocum*、*Pythium helicoides*、*Pythium oedochilum*、*Pythium sylvaticum*)、立枯病(*Rhizoctonia solani*)、镰刀菌立枯病(*Fusarium solani*)等

[0701] 大丁草:灰霉病(*Botrytis cinerea*)、白粉病(*Podosphaera xanthii*)等

[0702] 百合:叶枯病(*Botrytis elliptica*、*Pestalotiopsis* sp.)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)等

[0703] 向日葵:霜霉病(*Plasmopara halstedii*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)等

[0704] 糠稷草:雪腐大粒菌核病(*Sclerotinia borealis*)、靶斑病(*Rhizoctonia solani*)、叶腐病(*Rhizoctonia solani*)、币斑病(*Sclerotinia homoeocarpa*)、稻瘟病(*Pyricularia* sp.)、猝倒病(*Pythium aphanidermatum*)、炭疽病(*Colletotrichum graminicola*)等

[0705] 野茅:白粉病(*Erysiphe graminis*)等

[0706] 大豆:紫斑病(*Cercospora kikuchii*)、霜霉病(*Peronospora manshurica*)、疫霉病(*Phytophthora sojae*)、锈病(*Phakopsora pachyrhizi*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、炭疽病(*Colletotrichum truncatum*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、黑痘病(*Elsinoe glycines*)、黑点病(*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*)、立枯病(Damping off) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)、苗立枯病(Seedling blight) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)等

[0707] 马铃薯:疫病(*Phytophthora infestans*)、早疫病(*Alternaria solani*)、黑痣病(*Thanatephorus cucumeris*)、黄萎病(*Verticillium albo-atrum*、*V. dahliae*、*V. nigriscens*)、黑胫病(*Pectobacterium atrosepticum*)、软腐病(*Pectobacterium carotovorum*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)、疮痂病(*Streptomyces* spp.)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)等日本薯蓣:叶涩病(*Cylindrosporium dioscoreae*)、炭疽病(*Colletotrichum gloeosporioides*)、青霉病(*Penicillium sclerotigenum*)等

[0708] 红薯:紫纹羽病(*Helicobasidium mompa*)、枯萎病(*Fusarium oxysporum*)等

[0709] 芋头:疫病(*Phytophthora colocasiae*)、茎腐病(*Rhizoctonia solani*)等

[0710] 姜:根茎腐病(*Pythium ultimum*、*Pythium myriotylum*)、白星病(*Phyllosticta zingiberis*)等

[0711] 香蕉:巴拿马病(*Fusarium oxysporum*)、黑叶斑病(*Mycosphaerella fijiensis*、*M. musicola*)等

[0712] 芒果:炭疽病(*Colletotrichum aenigma*)、溃疡病(*Xanthomonas campestris*)、茎腐病(*Diaporthe pseudophoenicicola*、*Lasiodiplodia theobromae*、*Lasiodiplodia* spp.、*Neofusicoccum parvum*、*Neofusicoccum* sp.)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)等

[0713] 油菜:菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、根朽病(*Phoma lingam*)、黑斑病(*Alternaria brassicae*)、白粉病(*Erysiphe cruciferarum*、*Erysiphe cichoracearum*、*Oidium matthiolae*)、霜霉病(*Peronospora parasitica*)等

[0714] 咖啡:锈病(*Hemileia vastatrix*)、炭疽病(*Colletotrichum coffeanum*)、褐眼病(*Cercospora coffeicola*)等

[0715] 甘蔗:褐锈病(*Puccinia melanocephala*)等

[0716] 玉米:豹纹病(*Gloeocercospora sorghi*)、锈病(*Puccinia sorghi*)、南方锈病(*Puccinia polysora*)、黑穗病(*Ustilago maydis*)、胡麻叶斑病(*Cochliobolus heterostrophus*)、大斑病(*Setosphaeria turcica*)、立枯病(Damping off) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)、苗立枯病(Seedling blight) (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)等

[0717] 棉花:苗立枯病(*Pythium* sp.)、锈病(*Phakopsora gossypii*)、白霉病(*Mycosphaerella areola*)、炭疽病(*Glomerella gossypii*)等

[0718] 蛇麻:霜霉病(*Pseudoperonospora humuli*)、白粉病(*Oidium* sp.、*Podosphaera macularis*)、灰霉病(*Botrytis cinerea*)等

[0719] (杀线虫剂)

[0720] 本发明的二氢嘧啶化合物的对影响植物生长的各种线虫类的防除效果也优异。

[0721] 本发明的杀线虫剂含有选自化合物(II)及其盐中的至少一种作为有效成分。本发

明的杀线虫剂中包含的化合物(II)或其盐的量只要显示出线虫的防除效果,就没有特别限制。

[0722] 以下示出可利用本发明的杀线虫剂来防除的各种植物寄生性线虫类的具体例。

[0723] (1) 垫刃目(Tylenchida)

[0724] (a) 粒线虫科(Anguinae)的、例如粒线虫属(*Anguina* spp.)的剪股颖粒线虫(*Anguina funesta*)、小麦粒线虫(*Anguina tritici*);茎线虫属(*Ditylenchus* spp.)的马铃薯腐烂茎线虫(*Ditylenchus destructor*)、鳞球茎茎线虫(*Ditylenchus dipsaci*)、食菌茎线虫(*Ditylenchus myceliophagus*);

[0725] (b) 滑刃线虫科(Aphelenchoididae)的、例如滑刃线虫属(*Aphelenchoides* spp.)的水稻干尖线虫(*Aphelenchoides besseyi*)、草莓叶芽线虫(*Aphelenchoides fragariae*)、菊花叶芽线虫(*Aphelenchoides ritzemabosi*)、水稻干尖线虫(*Aphelenchoides besseyi*);伞滑刃线虫属(*Bursaphelenchus* spp.)的松材线虫(*Bursaphelenchus xylophilus*);

[0726] (c) 刺线虫科(Belonolaimidae)的、例如刺线虫属(*Belonolaimus* spp.)的长尾刺线虫(*Belonolaimus longicaudatus*);矮化线虫属(*Tylenchorhynchus* spp.)的克莱顿矮化线虫(*Tylenchorhynchus claytoni*)、不定矮化线虫(*Tylenchorhynchus dubius*);

[0727] (d) 环科(Criconematidae)的例如可变环线虫(*Criconema mutabile*);

[0728] (e) 锥线虫科(Dolichodoridae)的例如*Dolichodorus mediterraneus*;

[0729] (f) 异腔科(Ecphyadophoridae)的例如瘦弱异腔线虫(*Ecphyadophora tenuissima*)

[0730] (g) 鞘科(Hemicycliophoridae)的例如*Loofia thienemanni*;

[0731] (h) 异皮线虫科(Heteroderidae)的、例如球异皮线虫属(*Globodera* spp.)的马铃薯胞囊线虫(*Globodera rostochiensis*)、马铃薯白线虫(*Globodera pallida*)、烟草胞囊线虫(*Globodera tabacum*);异皮线虫属(*Heterodera* spp.)的小麦禾谷胞囊线虫(*Heterodera avenae*)、十字花科胞囊线虫(*Heterodera cruciferae*)、大豆胞囊线虫(*Heterodera glycines*)、甜菜胞囊线虫(*Heterodera schachtii*)、三叶草胞囊线虫(*Heterodera trifolii*);

[0732] (i) 纽带线虫科(Hoplolaimidae)的、例如螺旋线虫属(*Helicotylenchus* spp.)的双宫螺旋线虫(*Helicotylenchus dihystera*)、多环螺旋线虫(*Helicotylenchus multicinctus*);纽带线虫属(*Hoplolaimus* spp.)的哥伦比亚纽带线虫(*Hoplolaimus columbus*)、帽状纽带线虫(*Hoplolaimus galeatus*);其他的强壮盘旋线虫(*Rotylenchus robustus*)、肾形肾状线虫(*Rotylenchulus reniformis*);

[0733] (j) 根结线虫科(Meloidogynidae)的、例如根结线虫属的(*Meloidogyne* spp.)花生根结线虫(*Meloidogyne arenaria*)、哥伦比亚根结线虫(*Meloidogyne chitwoodi*)、北方根结线虫(*Meloidogyne hapla*)、南方根结线虫(*Meloidogyne incognita*)、爪哇根结线虫(*Meloidogyne javanica*)、泰晤士根结线虫(*Meloidogyne thamesi*);

[0734] (k) 伪垫刃科(Nothotylenchidae)的例如草莓芽线虫(*Nothotylenchus acris*);

[0735] (l) 针线虫科(Paratylenchidae)的例如针线虫属(*Paratylenchus* spp.)的弯曲针线虫(*Paratylenchus curvatus*)、最小针线虫(*Paratylenchus elachistus*);

[0736] (m) 短体线虫科 (Pratylenchidae) 的、例如短体线虫属 (Pratylenchus spp.) 的最短短体线虫 (Pratylenchus brachyurus)、咖啡短体线虫 (Pratylenchus coffeae)、弯曲短体线虫 (Pratylenchus curvatus)、伪短体线虫 (Pratylenchus fallax)、古氏短体线虫 (Pratylenchus goodeyi)、落选短体线虫 (Pratylenchus neglectus)、穿刺短体线虫 (Pratylenchus penetrans)、斯氏短体线虫 (Pratylenchus scribneri)、伤残短体线虫 (Pratylenchus vulnus)、玉米短体线虫 (Pratylenchus zaeae); 其他的异常珍珠线虫 (Nacobbus aberrans)、香蕉穿孔线虫 (Radopholus similis)、柑橘半穿刺线虫 (Tylenchulus semipenetrans)、柑橘穿孔线虫 (Radopholus citrophilus)。

[0737] (2) 矛线目 (Dorylaimida)

[0738] (a) 长针线虫科 (Longidoridae) 的、例如长针线虫属 (Longidorus spp.) 的横带长针线虫 (Longidorus elongates); 剑线虫属 (Xiphinema) 的美洲剑线虫 (Xiphinema americanum)、短颈剑线虫 (Xiphinema brevicolle)、标准剑线虫 (Xiphinema index)、裂尾剑线虫 (Xiphinema diversicaudatum)。

[0739] (3) 三矛目 (Triplonchida)

[0740] (a) 矛刺线虫科 (Trichodoridae) 的例如原始毛刺线虫 (Trichodorus primitivus)、较小拟毛刺线虫 (Paratrichodorus minor)。

[0741] (施用方法·混合剂)

[0742] 本发明的农业园艺用杀菌剂或杀线虫剂优选对谷物类; 蔬菜类; 根菜类; 球茎类; 果树类、茶、咖啡、可可等树木类; 牧草类; 草坪草类; 棉花等植物使用。

[0743] 本发明的农业园艺用杀菌剂可以施用于植物类的各部位、例如叶、茎、柄、花、蕾、果实、种子、芽、根、块茎、块根、幼苗、插条等。杀线虫剂可以施用于根、块茎、块根等。另外, 也可以将这些植物类的改良品种·变种、栽培品种、以及突变体、杂合体、转基因体 (GMO) 作为对象。

[0744] 本发明的农业园艺用杀菌剂可以用于为了防除在包括花卉、草坪草、牧草的农业园艺作物中产生的各种病害而实施的种子处理、茎叶散布、土壤施用、水面施用等。杀线虫剂可以用于种子处理、土壤施用等。

[0745] 本发明的农业园艺用杀菌剂或杀线虫剂也可以含有除本发明的二氢嘧啶化合物以外的成分。作为其他成分, 可以举出用于制剂化的已知的担载体等。另外, 作为其他成分, 可以举出以往已知的杀菌剂、杀虫·杀螨剂、杀线虫剂、杀土壤害虫剂、植物调节剂、增效剂、肥料、土壤改良剂、动物用饲料等。通过含有这样的其他成分, 有时发挥协同效果。

[0746] 即, 作为本发明的方式之一, 可以举出包含一种以上的其他杀菌剂的农业园艺用杀菌剂。

[0747] 以下示出可以与本发明的农业园艺用杀菌剂或杀线虫剂混用或并用的、杀菌剂的具体例。

[0748] (1) 核酸生物合成抑制剂:

[0749] (a) RNA聚合酶I抑制剂: 苯霜灵 (benalaxyl)、精苯霜灵 (benalaxyl-M)、呋霜灵 (furalaxyl)、甲霜灵 (metalaxyl)、精甲霜灵 (metalaxyl-M); 噁霜灵 (oxadixyl); 抑霉胺 (clozylacon)、呋酰胺 (ofurace);

[0750] (b) 腺苷脱氨酶抑制剂: 乙嘧啶磺酸酯 (bupirimate)、甲菌定 (dimethirimol)、乙

嘧啶(ethirimol)；

[0751] (c) DNA/RNA合成抑制剂:噁霉灵(hymexazol)、辛噻酮(octhilinone)；

[0752] (d) DNA拓扑异构酶II抑制剂:噁喹酸(oxolinic acid)。

[0753] (2) 有丝核分裂抑制剂及细胞分裂抑制剂:

[0754] (a) β -微管蛋白聚合抑制剂:苯菌灵(benomyl)、多菌灵(carbendazim)、苯咪唑菌(chlorfenazole)、麦穗宁(fuberidazole)、噁苯咪唑(thiabendazole);托布津(thiophanate)、甲基硫菌灵(thiophanate-methyl);乙霉威(diethofencarb);苯酰菌胺(zoxamide);噻唑菌胺(ethaboxam)；

[0755] (b) 细胞分裂抑制剂:戊菌隆(pencycuron)；

[0756] (c) 类血影蛋白(spectrin-like protein)的离域抑制剂:氟吡菌胺(fluopicolide)、氟醚菌酰胺(fluopimomide)。

[0757] (3) 呼吸抑制剂:

[0758] (a) 复合体I-NADH氧化还原酶抑制剂:氟嘧菌胺(diflumetorim);唑虫酰胺(tolfenpyrad)；

[0759] (b) 复合体II-琥珀酸脱氢酶抑制剂:麦锈灵(benodanil)、氟酰胺(flutolanil)、灭锈胺(meppronil);异丙噻菌胺(isofetamide);氟吡菌酰胺(fluopyram);甲咪酰胺(fenfuram)、拌种胺(frume cyclo x);萎锈灵(carboxin)、氧化萎锈灵(oxycarboxin);噻咪酰胺(tifluzamide);苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、联苯吡菌胺(bixafen)、氟唑菌酰胺(fluxapyroxad)、咪吡菌胺(furametpyr)、吡唑萘菌胺(isopyrazam)、戊苯吡菌胺(penflufen)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、环苯吡菌胺(sedaxane);啶酰菌胺(boscalid)、氟唑菌酰羟胺(pydiflumetofen)、isoflusifram、联苯吡嗪菌胺(pyraziflumid)、inpyrfluxam；

[0760] (c) 复合体III-泛醌氧化酶Q_o抑制剂:啞菌脂(azoxystrobin)、丁香菌酯(cumoxystrobin)、甲香菌酯(cumethoxystrobin)、烯肱菌酯(enoxastrobin)、氟菌酯(flufenoxystrobin)、啞氧菌酯(picoxystrobin)、啞菌酯(pyraoxystrobin);吡唑醚菌酯(pyraclostrobin)、啞胺菌酯(pyrametostrobin)、氯啞菌酯(triclopyricarb);醚菌酯(kresoxim-methyl)、肱菌酯(trifloxystrobin);醚菌胺(dimoxystrobin)、烯肱菌胺(fenaminstrobin)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肱醚菌胺(orysastrobin);噁唑菌酮(famoxadone);氟啞菌酯(fluxastrobin);咪唑菌酮(fenamidon);吡菌苯威(pyribencarb);metyltetraprole;mandestrobin；

[0761] (d) 复合体III-泛醌还原酶Q_i抑制剂:氰霜唑(cyazofamid)、吡啶磺菌胺(amisulbrom);fenicoxamid；

[0762] (e) 氧化磷酸化的解偶联剂:乐杀螨(binapacryl)、敌螨普(meptyldinocap)、消螨普(dinocap);氟啞胺(fluzinam);啞菌脞(ferimzone)；

[0763] (f) 氧化磷酸化抑制剂(ATP合成酶的抑制剂):薯瘟锡(fentin acetate)、氯化三苯基锡(fentin chloride)、三苯基氢氧化锡(fentin hydroxide)；

[0764] (g) ATP生成抑制剂:硅噻菌胺(silthiofam)；

[0765] (h) 复合体III:细胞色素bc₁(泛醌还原酶)的Q_x(未知)抑制剂:啞啞菌胺(ametocrazine)。

- [0766] (4) 氨基酸和蛋白质合成抑制剂:
- [0767] (a) 蛋氨酸生物合成抑制剂:安朵普灵 (andoprim)、噻菌环胺 (cyprodinil)、噻菌胺 (mepanipyrim)、噻霉胺 (pyrimethanil);
- [0768] (b) 蛋白质合成抑制剂:灭瘟素 (blasticidin-S)、春雷霉素 (kasugamycin)、春雷霉素盐酸盐 (kasugamycin hydrochloride)、链霉素 (streptomycin)、土霉素 (oxytetracycline)。
- [0769] (5) 信号传导抑制剂:
- [0770] (a) 信号传导抑制剂:喹氧灵 (quinoxifen)、丙氧喹啉 (proquinazid);
- [0771] (b) 渗透压信号传导中的MAP·组氨酸激酶抑制剂:拌种咯 (fenciclonil)、咯菌腈 (fludioxonil);乙菌利 (chlozolinate)、异菌脲 (iprodione)、腐霉利 (procymidone)、乙烯菌核利 (vinclozolin)。
- [0772] (6) 脂质和细胞膜合成抑制剂:
- [0773] (a) 磷脂生物合成、甲基转移酶抑制剂:克瘟散 (edifenphos)、异稻瘟净 (iprobenfos)、吡菌磷 (pyrazophos);稻瘟灵 (isoprothiolane);
- [0774] (b) 脂质的过氧化剂:联苯 (biphenyl)、地茂散 (chloroneb)、氯硝胺 (dichloran)、五氯硝基苯 (quintozene)、四氯硝基苯 (tecnazene)、甲基立枯磷 (tolclofos-methyl);土菌灵 (etr Diazole);
- [0775] (c) 作用于细胞膜的药剂:碘代丙炔基正丁氨基甲酸酯 (iodocarb)、霜霉威 (propamocarb)、霜霉威盐酸盐 (propamocarb-hydrochloride)、霜霉威乙膦酸盐 (propamocarb-focetylate)、硫菌威 (prothiocarb);
- [0776] (d) 扰乱病原菌细胞膜的微生物:枯草芽孢杆菌、枯草芽孢杆菌QST713菌株、枯草芽孢杆菌FZB24菌株、枯草芽孢杆菌MBI600菌株、枯草芽孢杆菌D747菌株;
- [0777] (e) 扰乱细胞膜的药剂:互生叶白千层 (茶树) 的提取物。
- [0778] (7) 细胞膜的甾醇生物合成抑制剂:
- [0779] (a) 甾醇生物合成中的C14位的脱甲基化抑制剂:噻氨灵 (triforine);啉斑脲 (pyrifenoX)、啉菌噁唑 (pyrisoxazole);氟苯啉啉醇 (fenarimol)、呋啉啉醇 (flurprimidol)、氟苯啉啉醇 (nuarimol);抑霉唑 (imazalil)、抑霉唑硫酸盐 (imazalilsulfate)、噁咪唑 (oxpoconazole)、稻瘟酯 (pefurzoate)、咪鲜胺 (prochloraz)、氟菌唑 (triflumizole)、烯效唑 (viniconazole);戊环唑 (azaconazole)、双苯三唑醇 (bitertanol)、糠菌唑 (bromuconazole)、环唑醇 (cyproconazole)、苜氯三唑醇 (diclobutrazole)、苯醚甲环唑 (difenoconazole)、烯唑醇 (diniconazole)、烯唑醇-M (diniconazole-M)、氟环唑 (epoxiconazole)、乙环唑 (etaconazole)、腈苯唑 (fenbuconazole)、氟啉唑 (fluquinconazole)、氟硅唑 (flusilazole)、粉唑醇 (flutriafol)、氟康唑 (fluconazole)、顺式氟康唑 (fluconazole-cis)、己唑醇 (hexaconazole)、亚胺唑 (imibenconazole)、种菌唑 (ipconazole)、叶菌唑 (metconazole)、腈菌唑 (myclobutanil)、戊菌唑 (penconazole)、丙环唑 (propiconazole)、硅氟唑 (simeconazole)、戊唑醇 (tebuconazole)、氟醚唑 (tetraconazole)、三唑酮 (triadimefon)、三唑醇 (triadimenol)、灭菌唑 (triticonazole);丙硫菌唑 (prothioconazole)、伏立康唑 (voriconazole)、氯氟醚菌唑 (mefentrifluconazole);

[0780] (b) 甾醇生物合成中的 $\Delta 14$ 还原酶及 $\Delta 8 \rightarrow \Delta 7$ -异构酶的抑制剂:十二吗啉 (aldimorph)、十二环吗啉 (dodemorph)、十二环吗啉乙酸盐 (dodemorph acetate)、丁苯吗啉 (fenpropimorph)、十三吗啉 (tridemorph); 苯锈啉 (fenpropidin)、粉病灵 (piperalin); 螺环菌胺 (spiroxamine);

[0781] (c) 甾醇生物合成体系的 C4 位脱甲基化中的 3-酮还原酶抑制剂:环酰菌胺 (fenhexamid); 胺苯吡菌酮 (fenpyrazamine);

[0782] (d) 甾醇生物合成体系的角鲨烯环氧酶抑制剂:稗草丹 (pyribaticarb); 萘替芬 (naftifine)、特比萘芬 (terbinafine)。

[0783] (8) 细胞壁合成抑制剂:

[0784] (a) 海藻糖酶抑制剂:井冈霉素 (validamycin);

[0785] (b) 壳多糖合成酶抑制剂:多抗霉素 (polyoxin)、多氧霉素 (polyoxorim);

[0786] (c) 纤维素合成酶抑制剂:烯酰吗啉 (dimethomorph)、氟吗啉 (flumorph)、丁吡吗啉 (pyrimorph); 苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、丙森锌 (iprovalicarb)、霜霉灭 (valifenalate); 双炔酰菌胺 (mandipropamid)。

[0787] (9) 黑色素生物合成抑制剂

[0788] (a) 黑色素生物合成的还原酶抑制剂:四氯苯酞 (fthalide); 咯嗪酮 (pyroquilon); 三环唑 (tricyclazole);

[0789] (b) 黑色素生物合成的脱水酶抑制剂:环丙酰菌胺 (carpropamid); 双氯氰菌胺 (diclocymet); 氰菌胺 (fenoxanil);

[0790] (c) 黑色素生物合成的聚酮体 (polyketide) 合成抑制剂:tolprocarb。

[0791] (10) 宿主植物的抗性诱导剂:

[0792] (a) 作用于水杨酸合成途径的药剂:阿拉酸式苯-S-甲基 (acibenzolar-S-methyl);

[0793] (b) 其他:烯丙苯噻唑 (probenazole)、噻酰菌胺 (tiadinil)、异噻菌胺 (isotianil)、dichlobentiazox、ipfentrifluconazole、昆布多糖 (laminarin)、大虎杖提取液 (reynoutria sachalinensis extract)。

[0794] (11) 作用机制不明的药剂:霜脲氰 (cymoxanil)、三乙膦酸铝 (fosetyl-aluminum)、磷酸 (磷酸盐) (phosphoric acid (phosphate))、叶枯酞 (tecloftalam)、咪唑嗪 (triazoxide)、磺菌胺 (flusulfamide)、哒菌清 (diclomezine)、磺菌威 (methasulfocarb)、环氟菌胺 (cyflufenamid)、苯菌酮 (metrafenone)、甲氧苯腈菌 (pyriofenone)、多果定 (dodine)、多果定游离碱 (dodine free base)、氟噻菌净 (flutianil)。

[0795] (12) 具有多作用点的药剂:铜 (铜盐) (copper (copper salt))、波尔多液 (bordeaux mixture)、氢氧化铜 (copper hydroxide)、萘二甲酸铜 (copper naphthalate)、氧化铜 (copper oxide)、氧氯化铜 (copper oxychloride)、硫酸铜 (copper sulfate)、硫 (sulfur)、硫制品 (sulfur product)、多硫化钙 (calcium polysulfide); 福美铁 (ferbam)、代森锰锌 (mancozeb)、代森锰 (maneb)、代森锰铜 (mancopper)、代森联 (metiram)、代森福美锌 (polycarbamate)、丙森锌 (propineb)、福美双 (thiram)、代森锌 (zineb)、福美锌 (ziram); 克菌丹 (captan)、敌菌丹 (captahol)、灭菌丹 (folpet); 百菌清 (chlorotalonil); 抑菌灵 (dichlofluanid)、对甲抑菌灵 (tolylfluanid); 双胍辛胺 (guazatine)、双胍辛乙酸

盐(guazatine acetate)、双胍辛胺乙酸盐(iminoctadine triacetate)、双胍三辛烷基苯磺酸盐(iminoctadine trialbesilate);敌菌灵(anilazine);二噻农(dithianon);灭螨猛(chinomethionate);啞呋草(flurimide)。

[0796] (13) 其他药剂:DBEDC、氟灭菌丹(fluorofolpet)、双(8-羟基喹啉)铜(II)(bis(8-quinolinolato)copper(II))、丙烷脒(propamidine)、氯化苦(chloropicrin)、酯菌胺(cyprofuram)、农杆菌(agrobacterium)、贝斯氧杂嗪(bethoxazin)、二苯胺(diphenylamine)、异硫氰酸甲酯(MITC)(methylisothiocyanate)、米多霉素(mildiomycin)、辣椒素(capsaicin)、硫杂灵(cufraneb)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、棉隆(dazomet)、咪菌威(debacarb)、双氯酚(dichlorophen)、野燕枯(difenzoquat)、野燕枯甲基硫酸盐(difenzoquat methyl sulfate)、氟联苯菌(flumetover)、乙磷钙(fosetyl-calcium)、乙磷钠(fosetyl-sodium)、人间霉素(irumamycin)、纳他霉素(natamycin)、酞菌酯(nitrothal isopropyl)、奥克斯莫卡宾(oxamocarb)、硝吡咯菌素(pyrrolnitrin)、异丁乙氧喹啉(tebufloquin)、甲磺菌胺(tolnifanide)、氰菌胺(zaliramide)、阿尔古菲斯(Algophase)、拌种灵(Amicarthiazol)、氟噻唑吡乙酮(Oxathiapiprolin)、fluoxapiprolin、代森联锌(metiram zinc)、苯噻硫氰(benthiazol)、水杨菌胺(trichlamide)、优康唑(uniconazole)、氧代奋欣(Oxyfenthiin)、四唑吡氨酯(Picarbutrazox)、Quinofumelin、Florylpicoxamid、Pyrapropoyne、氟茚唑菌胺(Fluindapyr)、Aminopyrifen、pyridachlomethyl、ipflufenquin、dipymetitron。

[0797] 以下示出可以与本发明的农业园艺用杀菌剂或杀线虫剂混用或并用的、杀虫·杀螨剂、杀线虫剂、杀土壤害虫剂、驱虫剂等的具体例。

[0798] (1A) 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂(氨基甲酸酯系):

[0799] 棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、恶虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、丁叉威(butocarboxim)、氧丁叉威(butoycarboxim)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulfan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb)、甲硫威(methiocarb)、灭多威(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啞蚜威(triazamate)、混杀威(trimetacarb)、XMC、灭杀威(xylylcarb)。

[0800] (1B) 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂(有机磷系):

[0801] 乙酰甲胺磷(acephate)、甲基吡啶磷(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷(azinphos-methyl)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲磷(chlormephos)、氯吡硫磷(chlorpyrifos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪磷(diazinon)、敌敌畏(dichlorvos)、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulfoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、丙线磷(ethoprophos)、氨磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噻唑硫磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、新烟磷(imicyafos)、异柳磷(isofenphos)、0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯(isopropyl=O-(methoxyaminothiophosphoryl)salicylate)、异唑磷(isoxathio)、马拉

硫磷 (malathion)、灭蚜磷 (mecarbam)、甲胺磷 (methamidophos)、杀扑磷 (methidathion)、速灭磷 (mevinphos)、久效磷 (monocrotophos)、二溴磷 (naled)、氧化乐果 (omethoate)、砒吸磷 (oxydemeton-methyl)、对硫磷 (parathion)、甲基对硫磷 (parathion-methyl)、稻丰散 (phenthoate)、甲拌磷 (phorate)、伏杀硫磷 (phosalone)、亚胺硫磷 (phosmet)、磷胺 (phosphamidon)、辛硫磷 (phoxim)、甲基嘧啶磷 (pirimiphos-methyl)、丙溴磷 (profenofos)、胺丙畏 (propetamphos)、丙硫磷 (prothiofos)、吡唑硫磷 (pyraclofos)、哒嗪硫磷 (pyridaphenthion)、喹硫磷 (quinalphos)、治螟磷 (sulfotep)、丁基嘧啶磷 (tebupirimfos)、双硫磷 (temephos)、特丁硫磷 (terbufos)、杀虫威 (tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷 (thiometon)、三唑磷 (triazophos)、敌百虫 (trichlorfon)、蚜灭多 (vamidothion)。

[0802] (2) GABA激动性氯化物离子(氯离子)通道阻滞剂:

[0803] 氯丹 (chlordane)、硫丹 (endosulfan);乙虫腈 (ethiprole)、氟虫腈 (fipronil)。

[0804] 丁虫腈 (flufiprole)。

[0805] (3A) 钠通道调节剂(拟除虫菊酯系):

[0806] 氟丙菊酯 (acrinathrin)、丙烯菊酯 (allethrin)、d-顺式-反式-丙烯菊酯 (d-cis-trans-allethrin)、d-反式-丙烯菊酯 (d-trans-allethrin)、联苯菊酯 (bifenthrin)、生物丙烯菊酯 (bioallethrin)、生物丙烯菊酯-S-环戊烯基-异构体 (bioallethrin-S-cyclopentenyl-isomer)、生物苄呋菊酯 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、 β -氟氯氰菊酯 (β -cyfluthrin)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、 λ -氯氟氰菊酯 (λ -cyhalothrin)、 γ -氯氟氰菊酯 (γ -cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、 α -氯氰菊酯 (α -cypermethrin)、 β -氯氰菊酯 (β -cypermethrin)、 θ -氯氰菊酯 (θ -cypermethrin)、 ζ -氯氰菊酯 (ζ -cypermethrin)、苯氰菊酯 [(1R)-反式异构体] (cyphenothrin [(1R)-transisomer])、溴氰菊酯 (deltamethrin)、烯炔菊酯 [(EZ)-(1R)-异构体] (empenthrin [(EZ)-(1R)-isomer])、顺式氰戊菊酯 (esfenvalerate)、醚菊酯 (ethofenprox)、甲氰菊酯 (fenpropathrin)、氰戊菊酯 (fenvalerate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、 τ -氟胺氰菊酯 (τ -fulvalinate)、苄呋醚 (halfenprox)、炔咪菊酯 (imiprothrin)、噻噁菊酯 (kadethrin)、氯菊酯 (permethrin)、苯醚菊酯 [(1R)-反式异构体] (phenothrin [(1R)-transisomer])、炔丙菊酯 (prallethrin)、除虫菊酯 (pyrethrin)、苄呋菊酯 (resmethrin)、氟硅菊酯 (silaflluofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、胺菊酯 (tetramethrin)、胺菊酯 [(1R)-异构体] (tetramethrin [(1R)-isomer])、四溴菊酯 (tralomethrin)、四氟苯菊酯 (transfluthrin)。

[0807] κ -联苯菊酯 (κ -bifenthrin)、氯丙炔菊酯 (chloroprallethrin)、七氟甲醚菊酯 (heptafluthrin)、四氟醚菊酯 (mepfluthrin)、 ϵ -甲氧苄氟菊酯 (ϵ -metofluthrin)、momfluorothrin、 ϵ -momfluorothrin、 κ -七氟菊酯 (κ -tefluthrin)、四氟醚菊酯 (tetramethylfluthrin);生物苄呋烯菊酯 (bioethanomethrin)。

[0808] (3B) 钠通道调节剂 (DDT类):

[0809] DDT、甲氧氯 (methoxychlor)。

[0810] (4) 烟碱型乙酰胆碱受体 (nAChR) 竞争性调节剂:

[0811] 啉虫脒 (acetamiprid)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉

(imidacloprid)、烯啶虫胺(nitenpyram)、噻虫啉(thiacloprid)、噻虫嗪(thiamethoxam); 尼古丁(nicotine); 氟啶虫胺腈(sulfoxaflor); 氟吡呋喃酮(flupyradifurone); 三氟苯嘧啶(triflumezopyrim)。

[0812] 敌克美施(dicloromezotiaz)、flupyrimin。

[0813] (5) 烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR) 变构调节剂:

[0814] 乙基多杀菌素(spinetoram)、多杀菌素(spinosad)。

[0815] (6) 谷氨酸激动性氯化物离子(氯离子) 通道(GluCl) 变构调节剂:

[0816] 阿维菌素(abamectin)、甲氨基阿维菌素(emamectin)、甲氨基阿维菌素苯甲酸盐(emamectin-benzoate)、雷皮菌素(lepimectin)、密灭汀(milbemectin)。

[0817] 多拉菌素(doramectin)、依普菌素(eprinomectin)、伊维菌素(ivermectin)、莫西菌素(moxidectin)、塞拉菌素(selamectin)。

[0818] (7) 保幼激素类似物:

[0819] 烯虫乙酯(hydroprene)、烯虫炔酯(kinoprene)、甲氧普烯(methoprene); 苯氧威(fenoxycarb); 吡丙醚(pyriproxyfen)。

[0820] (8) 其他非特异性(多位点) 抑制剂:

[0821] 甲基溴(methyl bromide)、卤代烷(alkyl halide) 类; 氯化苦(chloropicrin); 氟化铝钠(sodium aluminum fluoride)、硫酰氟(sulfuryl fluoride); 硼砂(borax)、硼酸(boric acid)、八硼酸二钠(disodium octaborate)、硼酸钠(sodium borate)、偏硼酸钠(sodium metaborate); 吐酒石(tartar emetic); 棉隆(dazomet)、威百亩(metam)、威百亩钾(metam potassium)、威百亩钠(metam sodium)。

[0822] (9) 弦音器TRPV通道调节剂:

[0823] 吡蚜酮(pymetrozine)、新啞啞啉(pyrifluquinazon); 双丙环虫酯(afidopyropen)。

[0824] (10) 螨类生长抑制剂:

[0825] 四螨嗪(clofentezine)、氟螨嗪(diflovidazin)、噻螨酮(hexythiazox); 乙螨唑(etoxazole)。

[0826] (11) 源自微生物的昆虫中肠内膜破坏剂:

[0827] 苏云金芽孢杆菌以色列亚种(B.t.subsp.israelensis)、苏云金芽孢杆菌鮎泽亚种(B.t.subsp.aizawai)、苏云金芽孢杆菌库尔斯塔克亚种(B.t.subsp.kurstaki)、苏云金芽孢杆菌拟步行甲亚种(B.t.subsp.tenebrionis); B.t. 作物中包含的蛋白质:Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1; 球形芽孢杆菌(Bacillus sphaericus)。

[0828] (12) 线粒体ATP合成酶抑制剂:

[0829] 丁醚脲(diafenthiuron); 三唑锡(azocyclotin)、三环锡(cyhexatin)、苯丁锡(fenbutatin oxide); 克螨特(propargite); 三氯杀螨砜(tetradifon)。

[0830] (13) 扰乱质子梯度的氧化磷酸化解偶联剂:

[0831] 溴虫腈(chlorfenapyr)、DNOC、氟虫胺(sulfluramid)。

[0832] (14) 烟碱型乙酰胆碱受体(nAChR) 通道阻滞剂:

[0833] 杀虫磺(bensultap)、杀螟丹盐酸盐(cartap hydrochloride)、杀虫环

(thiocyclam)、杀虫单(thiosultap-sodium)。

[0834] (15) 壳多糖生物合成抑制剂、类型0:

[0835] 双三氟虫脲(bistrifluron)、氟啶脲(chlorfluazuron)、除虫脲(diflubenzuron)、氟环脲(flucycloxuron)、氟虫脲(flufenoxuron)、氟铃脲(hexaflumuron)、虱螨脲(lufenuron)、双苯氟脲(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、伏虫隆(teflubenzuron)、杀铃脲(triflumuron)。

[0836] (16) 壳多糖生物合成抑制剂、类型1:

[0837] 噻螨酮(buprofezin)。

[0838] (17) 蜕皮抑制剂:

[0839] 灭蝇胺(cyromazine)。

[0840] (18) 蜕皮激素(蜕化素)受体激动剂:

[0841] 环虫酰肼(chromafenozide)、氯虫酰肼(halofenozide)、甲氧虫酰肼(methoxyfenozide)、虫酰肼(tebufenozide)。

[0842] (19) 章鱼胺受体激动剂:

[0843] 双甲脒(amitraz)。

[0844] (20) 线粒体电子传递系统复合体III抑制剂:

[0845] 伏蚁脞(hydramethylnon);灭螨醌(acequinocyl);啞螨酯(flucacrypyrim);联苯肼酯(bifenazate)。

[0846] (21) 线粒体电子传递系统复合体I抑制剂(METI):

[0847] 喹螨醚(fenazaquin)、啞螨酯(fenpyroximate)、啞螨灵(pyridaben)、啞螨醚(pyrimidifen)、吡螨胺(tebufenpyrad)、啞虫酰胺(tolfenpyrad);鱼藤酮(rotenone)。

[0848] (22) 电压依赖性钠通道阻滞剂:

[0849] 茚虫威(indoxacarb);氰氟虫脞(metaflumizone)。

[0850] (23) 乙酰基CoA羧化酶抑制剂:

[0851] 螺螨酯(spirodiclofen)、螺甲螨酯(spiromesifen)、螺虫乙酯(spirotetramat)。

[0852] 甲氧吡啶乙酯(spiroplidion)。

[0853] (24) 线粒体电子传递系统复合体IV抑制剂:

[0854] 磷化铝(aluminium phosphide)、磷化钙(calcium phosphide)、磷化锌(zinc phosphide)、磷(phosphine);氰化钙(calcium cyanide)、氰化钠(sodium cyanide)、氰化钾(potassium cyanide)。

[0855] (25) 线粒体电子传递系统复合体II抑制剂:

[0856] 腈吡螨酯(cyenoxyrafen)、丁氟螨酯(cyflumetofen);皮福鲁不米多(pyflubumide)。

[0857] (28) 兰尼碱受体调节剂:

[0858] 氯虫酰胺(chlorantraniliprole)、溴氰虫酰胺(cyantraniliprole)、环溴虫酰胺(cyclaniliprole)、氟虫酰胺(flubendiamide)。

[0859] 氯氟氰虫酰胺(cyhalodiamide)、四氯虫酰胺(tetrachlorantraniliprole)、氟氰虫酰胺(tetraniliprole)。

[0860] (29) 弦乐器调节剂靶标部位未确定:

- [0861] 氟啉虫酰胺 (flonicamid)。
- [0862] (30) GABA 激动性氯化物离子 (氯离子) 通道变构调节剂:
- [0863] 溴虫氟苯双酰胺 (broflanilide)、氟噁唑酰胺 (fluxametamide)。
- [0864] isocycloseram; 阿福拉纳 (afoxolaner)、氟雷拉纳 (fluralaner)、洛替拉纳 (lotilaner)、沙罗拉纳 (sarolaner)。
- [0865] 其他的杀虫剂、杀螨剂:
- [0866] 印楝素 (azadirachtin)、苯螨特 (benzoximate)、溴螨酯 (bromopropylate)、灭螨猛 (chinomethionate)、三氯杀螨醇 (dicofol)、石硫合剂 (lime sulfur)、代森锰锌 (mancozeb)、啉虫丙醚 (pyridalyl)、硫黄 (sulfur)。
- [0867] acynonapyr、benzpyrimoxan、氟麦托醌 (flometoquin)、fluhexafon、oxazosulfonyl、tyclopiazoflor。
- [0868] 驱虫剂:
- [0869] (a) 苯并咪唑系: 芬苯达唑 (fenbendazole)、阿苯达唑 (albendazole)、三氯苯达唑 (triclabendazole)、奥苯达唑 (oxibendazole)、甲苯达唑 (mebendazole)、奥芬达唑 (oxfendazole)、帕苯达唑 (perbendazole)、氟苯达唑 (flubendazole); 非班太尔 (febantel)、奈韦拉平 (netobimin)、托布津 (thiophanate); 噻苯咪唑 (thiabendazole)、堪苯达唑 (cambendazole);
- [0870] (b) 水杨酰苯胺系: 氯氰碘柳胺 (closantel)、五氯柳胺 (oxyclozanide)、碘醚柳胺 (rafoxanide)、氯硝柳胺 (niclosamide);
- [0871] (c) 取代酚系: 硝碘酚脒 (nitroxinil)、硝硫氰酯 (nitroscanate);
- [0872] (d) 嘧啶系: 噻嘧啶 (pyrantel)、甲噻吩嘧啶 (morantel);
- [0873] (e) 咪唑并噻唑系: 左旋咪唑 (levamisole)、四咪唑 (tetramisole);
- [0874] (f) 四氢嘧啶系: 吡喹酮 (praziquantel)、依西太尔 (epsiprantel);
- [0875] (g) 其他驱虫药: 环二烯 (cyclo-diene)、鱼尼丁 (ryania)、氯舒隆 (clorsulon)、甲硝唑 (metronidazole)、得米地曲 (demiditraz); 哌嗪 (piperazine)、乙胺嗪 (diethylcarbamazine)、二氯芬 (dichlorophen)、糠酸莫米松 (monepantel)、三苯双脒 (tribenzimidine)、阿米太尔 (amidantel); 硫乙肿胺 (thiacetalsamide)、美拉索明 (melarsomine)、硫乙肿胺 (arsenamide)。
- [0876] 以下示出可以与本发明的农业园艺用杀菌剂或杀线虫剂混用或并用的、植物调节剂的具体例。
- [0877] 脱落酸 (abscisic acid)、激动素 (kinetin)、苄氨基嘌呤 (benzylaminopurine)、1,3-二苯基脲 (1,3-diphenylurea)、氯吡脲 (forchlorfenuron)、噻苯隆 (thidiazuron)、氯吡苯脲 (chlorfenuron)、二氢玉米素 (dihydrozeatin)、赤霉素 A (gibberellin A)、赤霉素 A4 (gibberellin A4)、赤霉素 A7 (gibberellin A7)、赤霉素 A3 (gibberellin A3)、1-甲基环丙烷 (1-methylcyclopropane)、N-乙酰氨基乙氧基乙烯基甘氨酸 (N-acetyl aminoethoxyvinyl glycine) (别名: 艾维激素 (aviglycine))、氨基氧乙酸 (aminoxyacetate)、硝酸银 (silver nitrate)、氯化钴 (cobalt chloride)、IAA、4-CPA、调果酸 (cloprop)、2,4-D、MCPB、吲哚-3-丁酸 (indole-3-butyrate)、2,4-滴丙酸 (dichlorprop)、酚硫杀 (phenothiol)、1-萘乙酰胺 (1-naphthyl acetamide)、吲熟酯

(ethychlozate)、坐果酸(cloxyfonac)、马来酰肼(maleic acid hydrazide)、2,3,5-三碘苯甲酸(2,3,5-triiodobenzoic acid)、水杨酸(salicylic acid)、水杨酸甲酯(methyl salicylate)、(-)-茉莉酮酸((-)-jasmonic acid)、茉莉酮酸甲酯(methyl jasmonate)、(+)-独脚金醇(+)-strigol)、(+)-脱氧独脚金醇(+)-deoxystrigol)、(+)-列当醇(+)-orobanchol)、(+)-高粱内酯(+)-sorgolactone)、4-氧代-4-(2-苯乙基)氨基丁酸(4-oxo-4-(2-phenylethyl)aminobutyric acid);乙烯利(ethephon)、矮壮素(chlormequat)、甲哌啶(mepiquat chloride)、苄基腺嘌呤(benzyladenine)、5-氨基乙酰丙酸(5-amino levulinic acid)。

[0878] (制剂处方)

[0879] 本发明的农业园艺用杀菌剂或杀线虫剂根据剂型而没有特别限定。例如,可以举出可湿性粉剂、乳剂、粉剂、粒剂、水溶剂、悬浮剂、颗粒可湿性粉剂、片剂等剂型。制备成制剂的方法没有特别限制,可以根据剂型而采用已知的制备方法。

[0880] 以下示出一些制剂实施例。需要说明的是,以下所示的制剂处方仅为示例,可以在不违反本发明的主旨的范围内修改,本发明不受以下的制剂实施例的任何限制。只要没有特别说明,则“份”是指“重量份”。

[0881] (制剂例1:可湿性粉剂)

[0882] 将本发明的二氢嘧啶化合物40份、硅藻土53份、高级醇硫酸酯4份及烷基萘磺酸盐3份均匀混合并微细地粉碎,得到有效成分为40%的可湿性粉剂。

[0883] (制剂例2:乳剂)

[0884] 将本发明的二氢嘧啶化合物30份、二甲苯33份、二甲基甲酰胺30份及聚氧乙烯烷基烯丙基醚7份混合并溶解,得到有效成分为30%的乳剂。

[0885] (制剂例3:粒剂)

[0886] 将本发明的二氢嘧啶化合物5份、滑石40份、粘土38份、膨润土10份及烷基硫酸钠7份均匀混合并微细地粉碎,其后,造粒成粒子直径为0.5~1.0mm,得到有效成分为5%的粒剂。

[0887] (制剂例4:粒剂)

[0888] 将本发明的二氢嘧啶化合物5份、粘土73份、膨润土20份、琥珀酸二辛酯磺酸钠盐1份及磷酸钾1份均匀混合,进行粉碎。向其中加入水并充分捏合,其后,进行造粒,使其干燥,得到有效成分为5%的粒剂。

[0889] (制剂例5:悬浮剂)

[0890] 将本发明的二氢嘧啶化合物10份、聚氧乙烯烷基烯丙基醚4份、聚羧酸钠盐2份、甘油10份、黄原胶0.2份及水73.8份混合,进行湿式粉碎直至粒度成为3微米以下,得到有效成分为10%的悬浮剂。

[0891] (制剂例6:颗粒可湿性粉剂)

[0892] 将本发明的二氢嘧啶化合物40份、粘土36份、氯化钾10份、烷基苯磺酸钠盐1份、木质素磺酸钠盐8份及烷基苯磺酸钠盐的甲醛缩合物5份均匀混合并微细地粉碎,然后,加入适量的水后进行混炼,制成粘土状。将粘土状物造粒,接着使其干燥,得到有效成分为40%的颗粒可湿性粉剂。

[0893] (医疗用·动物用(兽医医疗用)抗真菌剂)

[0894] 本发明的二氢嘧啶化合物可以用作以人或动物所感染的有害的病原菌、特别是真菌为防除对象的预防药、治疗药。

[0895] 本发明的医疗用·动物用抗真菌剂含有选自化合物(II)及其盐中的至少一种作为有效成分。本发明的医疗用抗真菌剂中包含的化合物(II)或其盐的量只要显示出抗真菌效果,就没有特别限制。

[0896] 本说明书中的“动物”是指:宠物动物、家畜·家禽、在动物园、水族馆等中饲养的展示动物、所捕获的野生动物、以及研究·实验动物等脊椎动物(Vertebrata)。

[0897] 例如,可举出以下的动物,但动物的具体例并不限定于这些。

[0898] 绵羊、山羊、猪、马、牛、水牛、驴、骡子、骆驼、美洲驼、羊驼、野猪、驯鹿、鹿、水貂、大象、熊、袋鼠、狐狸、狗、猫、松鼠、兔、小鼠、大鼠、豚鼠、仓鼠、猴、雪貂等哺乳类。

[0899] 鸽子、鹦哥、鹦鹉、文鸟、白腰文鸟、金丝雀、鸡、鸭、火鸡、野鸭、野鸡、孔雀、鸵鸟、天鹅、麻雀、鹌鹑、猫头鹰、鹭、鹰、海鸬鹚等鸟类。

[0900] 变色龙、鬣蜥、蜥蜴、蛇、龟、鳄鱼、壁虎等爬虫类。

[0901] 青蛙、蝾螈等两栖类。

[0902] 鲤鱼、金鱼、青鳞鱼、热带鱼、鲷鱼·幼鲷鱼、鲷鱼、杜氏鲷、鲑鱼、青花鱼、鲈鱼、褐石斑鱼、金枪鱼、竹荚鱼、比目鱼、河豚等鱼类。

[0903] 作为可适用本发明的医疗用·动物用抗真菌剂的病原菌,以下示出真菌(霉菌)的例子。需要说明的是,具体例并不限定于这些。

[0904] 例如,伞枝犁头霉(*absidia corymbifera*)等犁头霉(*Absidia*)属;支顶孢(*Acremonium*)属;链格孢菌(*Alternaria alternata*)等链格孢(*Alternaria*)属;黄曲霉(*Aspergillus flavus*)、烟曲霉(*Aspergillus fumigatus*)、构巢曲霉(*Aspergillus nidulans*)、黑曲霉(*Aspergillus niger*)、寄生曲霉(*Aspergillus parasiticus*)、土曲霉(*Aspergillus terreus*)等曲霉(*Aspergillus*)属;平脐蠕孢(*Bipolaris*)属;皮炎芽生菌(*Blastomyces dermatitidis*)等芽生菌(*Blastomyces*)属;草坪草科布氏白粉菌(*Blumeria graminis*)等布氏白粉菌(*Blumeria*)属;白色念珠菌(*Candida albicans*)、光滑念珠菌(*Candida glabrata*)、克鲁斯念珠菌(*Candida krusei*)、近平滑念珠菌(*Candida parapsilosis*)、热带念珠菌(*Candida tropicalis*)等念珠菌(*Candida*)属;芽枝状枝孢菌(*Cladosporium cladosporoides*)、植物标本分枝孢子菌(*Cladosporium herbarium*)等枝孢(*Cladosporium*)属;粗球孢子菌(*Coccidioides immitis*)、波萨达斯球孢子菌(*Coccidioides posadasii*)等球孢子菌(*Coccidioides*)属;车轴草刺盘孢(*Colletotrichium trifolii*)等刺盘孢(*Colletotrichum*)属;新型隐球菌(*Cryptococcus neoformans*)等隐球菌(*Cryptococcus*)属;新月弯孢菌(*Curvularia lunata*)等弯孢(*Curvularia*)属;家兔脑胞内原虫(*Encephalitozoon cuniculi*)等脑胞内原虫(*Encephalitozoon*)属;黑附球菌(*Epicoccum nigrum*)等附球菌(*Epicoccum*)属;絮状麦皮癣菌(*Epidermophyton floccosum*)等表皮癣菌(*Epidermophyton*)属;外瓶霉(*Exophiala*)属;喙状明脐菌(*Exserohilum rostratum*)等突脐蠕孢(*Exserohilum*)属;草坪草科镰孢(*Fusarium graminearum*)、腐皮镰刀菌(*Fusarium solani*)、拟枝孢镰孢菌(*Fusarium sporotrichoides*)等镰刀菌(*Fusarium*)属;*Fonsecaea monophora*等着色真菌(*Fonsecaea*)属;荚膜组织胞浆菌(*Histoplasma capsulatum*)等组织胞浆菌(*Histoplasma*)属;颖枯壳小

球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*) 等小球腔菌 (*Leptosphaeria*) 属; 球形马拉色菌 (*Malassezia globosa*) 等马拉色霉菌 (*Malassezia*) 属; 犬小孢子菌 (*Microsporum canis*) 等小孢子菌 (*Microsporum*) 属; 禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*) 等球腔菌 (*Mycosphaerella*) 属; 链孢霉 (*Neurospora*) 属; 淡紫拟青霉 (*Paecilomyces lilanicus*)、宛氏拟青霉 (*Paecilomyces varioti*) 等拟青霉 (*Paecilomyces*) 属; 产黄青霉 (*Penicillium chrysogenum*) 等青霉 (*Penicillium*) 属; 辣椒疫霉 (*Phytophthora capsici*)、致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 等疫霉 (*Phytophthora*) 属; 葡萄生单轴霉 (*Plasmopara viticola*) 等单轴霉 (*Plasmopara*) 属; 耶氏肺孢子菌 (*Pneumocystis jirovecii*) 等肺囊虫 (*Pneumocystis*) 属; 稻梨孢 (*Pyricularia oryzae*) 等梨孢 (*Pyricularia*) 属; 终极腐霉 (*Pythium ultimum*) 等腐霉 (*Pythium*) 属; 禾冠柄锈菌 (*Puccinia coronata*)、禾柄锈菌 (*Puccinia graminis*) 等柄锈菌 (*Puccinia*) 属; 立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) 等丝核菌 (*Rhizoctonia*) 属; 根毛霉 (*Rhizomucor*) 属; *Fusarium apiospermum*、多育赛多孢子菌 (*Scedosporium prolificans*) 等丝孢菌 (*Scedosporium*) 属; 短尾帚霉 (*Scopulariopsis brevicaulis*) 等帚霉 (*Scopulariopsis*) 属; 申克孢子丝菌 (*Sporothrix schenckii*) 等孢子丝菌 (*Sporothrix*) 属; 马尔尼菲篮状菌 (*Talaromyces marneffeii*) 等篮状菌 (*Talaromyces*) 属、须毛癣菌 (*Trichophyton mentagrophytes*)、趾间毛癣菌 (*Trichophyton interdigitale*)、红色毛癣菌 (*Trichophyton rubrum*)、断发毛癣菌 (*Trichophyton tonsurans*)、疣状毛癣菌 (*Trichophyton verrucosum*) 等毛癣菌 (*Trichophyton*) 属; 阿氏丝孢酵母 (*Trichosporon asahii*)、白吉利毛孢子菌 (*Trichosporon beigelii*) 等毛孢子菌 (*Trichosporon*) 属; 黑粉菌 (*Ustilago*) 属等。

[0905] 这些之中, 本发明的抗真菌剂对于曲霉 (*Aspergillus*) 属、毛癣菌 (*Trichophyton*) 属或念珠菌 (*Candida*) 属是适合的, 对于烟曲霉 (*Aspergillus fumigatus*) 或断发毛癣菌 (*Trichophyton tonsurans*) 是特别适合的。

[0906] 作为可适用本发明的医疗用·动物用抗真菌剂的感染症, 以下示出真菌症的例子。需要说明的是, 具体例并不限定于这些。

[0907] 本发明的医疗用·动物用抗真菌剂可以适用于全身性真菌感染症、浅表性真菌感染症等中的任意感染症。作为真菌感染症的具体例, 可举出肺曲霉菌病、全身性曲霉菌病 (容易在骨髓接受者或AIDS患者等免疫抑制患者中发病) 等曲霉菌 (*Aspergillus*) 病、全身性念珠菌病等念珠菌 (*Candida*) 病、隐球菌 (*Cryptococcus*) 脑膜炎、鼻脑型毛霉菌病 (*rhinocerebral mucormycosis*)、肺毛霉菌病、芽生菌病、组织胞浆菌病、球孢子菌病 (*coccidiomycosis*)、南美芽生菌病 (*paracoccidiomycosis*)、洛博芽生菌病、角膜真菌病、孢子丝菌病、着色芽生菌病、着色真菌病、暗色丝孢霉病、接合菌病、隐球菌病、播散型孢子丝菌病、白癣 (*ring worm*)、头部白癣 (头癣)、体部白癣 (金钱癣)、股部白癣 (股圆癣)、足白癣 (脚癣)、甲癣 (灰指甲)、皮肤、口、或阴道的念珠菌病、马拉色氏病、慢性黏膜皮肤念珠菌病、肺孢子菌肺炎、马尔尼菲型青霉菌病等。

[0908] 另外, 本发明的抗真菌剂也可适用于由真菌引起的变应性疾病、例如变应性支气管哮喘 (*allergic bronchopulmonary asthma*) (ABPA); 哮喘、鼻鼻窦炎、或鼻窦炎等。

[0909] 本发明的医疗用·动物用抗真菌剂可以包含药学上所允许的添加剂。添加剂只要是在已知的医疗用药剂中使用的添加剂, 就没有特别限制。它们当然是无菌的, 没有发热

性。另外,添加剂可以根据抗真菌剂的剂型、施予方法等而适当地选择。

[0910] 本发明的医疗用·动物用抗真菌剂可采用的剂型没有特别限定,例如,可以举出片剂、粉剂、粒剂、颗粒剂、胶囊剂、糖锭(饴糖)、丸粒等固体剂;糖浆剂、乳浊剂、悬浮剂、溶液、浇泼(Pour-on)剂、喷滴(Spot-on)剂等液体剂;软膏剂、凝胶等半固体制备物等;气溶胶、蒸气等气体剂;纳米粒子制剂等。

[0911] 本发明的医疗用抗真菌剂的施予可以通过已知的方法进行。作为施予方法,例如,可以举出向皮下、静脉内、肌肉内、胸骨内(intrasternally)等的注入(注射);向肛门、阴道等中的插入、向皮肤表面的涂布、散布、滴加等经皮施予;从口服用等经口施予;基于吸气等的经鼻施予等。

[0912] 在用于经口施予的固体剂的情况下,作为可用于本发明的医疗用·动物用抗真菌剂的添加剂,可以举出环糊精或修饰环糊精等助溶剂;乳糖、葡萄糖、蔗糖、纤维素、玉米淀粉或马铃薯淀粉等稀释剂;二氧化硅、滑石、硬脂酸、硬脂酸镁或硬脂酸钙、聚乙二醇等润滑剂;淀粉、阿拉伯胶(arabic gums)、明胶、甲基纤维素、羧甲基纤维素或聚乙烯吡咯烷酮等粘合剂;淀粉、海藻酸、海藻酸盐或乙醇酸淀粉钠等解聚剂(disaggregating agents);发泡性混合物(effervescing mixtures);色素;甜味剂;卵磷脂、聚山梨醇酯、月桂基硫酸盐(laurylsulphates)等润湿剂;或者通常被用于医药制剂的、非毒性并且在药理学上为非活性的物质等。这些添加剂可以通过混合、造粒、压片、糖衣、或膜包衣等已知的方法而包含于本发明的医疗用抗真菌剂中。

[0913] 在用于经口施予的液体剂的情况下,作为可用于本发明的医疗用·动物用抗真菌剂的添加剂,可以举出环糊精或修饰环糊精等助溶剂、蔗糖、甘油、甘露糖醇、山梨糖醇、天然胶、琼脂、海藻酸钠、果胶、甲基纤维素、羧甲基纤维素、或聚乙烯醇等。

[0914] 在用于肌肉内注射的液体剂的情况下,作为可用于本发明的医疗用·动物用抗真菌剂的添加剂,可以举出灭菌水、橄榄油、油酸乙酯、丙二醇等二醇类、环糊精、修饰环糊精等助溶剂等。此外,还可以根据需要而包含合适量的盐酸利多卡因。

[0915] 在用于静脉注射的液体剂的情况下,作为可用于本发明的医疗用·动物用抗真菌剂的添加剂,可以举出灭菌水等担载体;环糊精、修饰环糊精等助溶剂等。它们也可以以经灭菌的等渗生理盐水溶液的形态被包含。

[0916] 关于本发明的医疗用·动物用抗真菌剂中含有的化合物(II)或其盐的量,相对于抗真菌剂的重量而言,优选为85重量%以下,更优选为50重量%以下。

[0917] 本发明的医疗用·动物用抗真菌剂的用量可以根据施予方法、所感染的真菌的种类、患者的年龄、体重、症状等而适当地选择。例如,对于成年人而言,在经口施予或非经口(注射、点滴等)施予的情况下,可以1天1次或数次,按0.1~100mg/kg-体重进行施予。

[0918] 另外,本发明的医疗用·动物用抗真菌剂可以与化合物(II)以外的其他药剂组合使用。

[0919] 接下来,示出合成实施例,对本发明进行更具体的说明。但是,本发明不受以下合成实施例的任何限制。

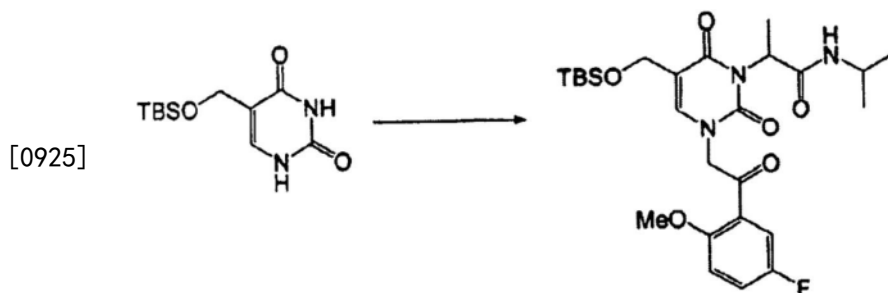
[0920] (实施例1)

[0921] 2-(3-(2-(2-氰基乙氧基)-2-(5-氟-2-甲氧基苯基)乙基)-5-((异丙氧基亚氨基)甲基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)-N-异丙基丙酰胺(化合物编号A-14)的合成

[0922] (工序1)

[0923] 2-(5-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧化-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)-N-异丙基丙酰胺的合成

[0924] [化学式15]



[0926] 使5-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮(1.50g)溶解于N,N-二甲基甲酰胺(60ml)中,在冰冷却条件下加入碳酸钾(0.81g)、2-溴-5'-氟-2'-甲氧基苯乙酮(1.45g),于室温进行3小时搅拌。向反应液中加入水,对所产生的固体进行过滤。

[0927] 使得到的固体溶解于N,N-二甲基甲酰胺(60ml)中,加入碳酸钾(0.98g)、2-溴-N-异丙基丙酰胺(1.40g),于45℃搅拌一夜。

[0928] 向反应液中加入水,用乙酸乙酯进行萃取,用水、饱和食盐水进行清洗后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物2.13g。收率68%

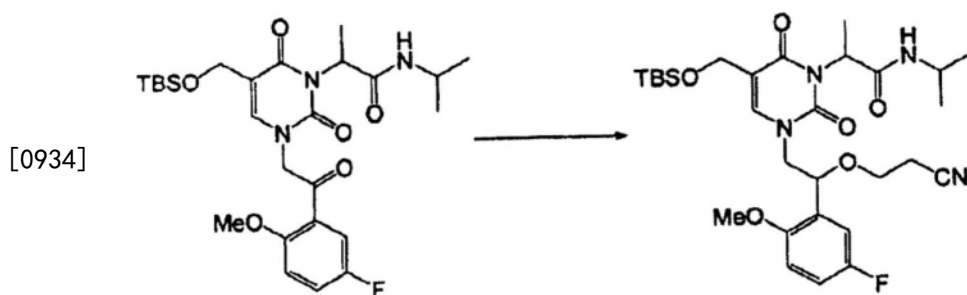
[0929] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[0930] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.63-6.97 (3H, m), 7.08 (1H, s), 5.47-5.01 (4H, m), 4.54 (2H, s), 4.10-4.03 (1H, m), 3.98 (3H, s), 1.61 (3H, d), 1.12 (6H, d), 0.91 (9H, s), 0.12 (6H, s)

[0931] (工序2)

[0932] 2-(5-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-3-(2-(2-氰基乙氧基)-2-(5-氟-2-甲氧基苯基)乙基)-2,6-二氧化-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)-N-异丙基丙酰胺的合成

[0933] [化学式16]



[0935] 使2-(5-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧化-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)-N-异丙基丙酰胺(0.15g)溶解于甲醇(1.5ml)、四氢呋喃(1.5ml)中,在冰冷却条件下加入硼氢化钠(12mg),进行1小时搅拌。

[0936] 向反应液中加入饱和氯化铵水溶液,用乙酸乙酯进行萃取,用水、饱和食盐水进行清洗后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,使得到的残余物溶解于四氢呋喃(1.5ml)中,加入丙烯腈(0.2g)和40%氢氧化钾水溶液(0.1ml),于室温搅拌一夜。

[0937] 向反应液中加入水,用氯仿进行萃取后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将

溶剂蒸馏除去,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物0.08g。收率48%

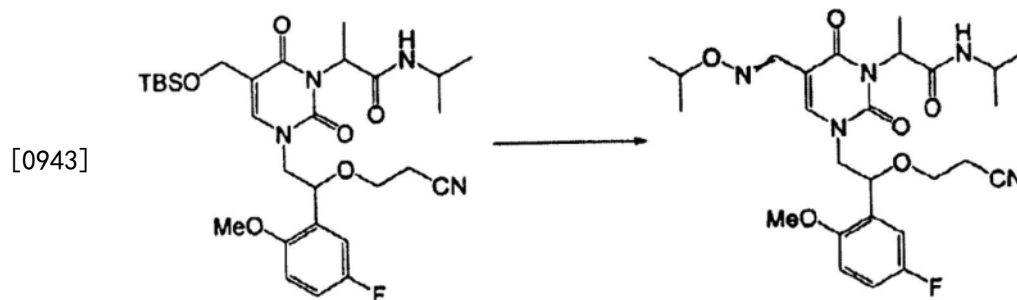
[0938] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[0939] ¹H-NMR (CDCl₃) δ:7.19-6.82 (4H, m), 5.82-5.07 (3H, m), 4.49 (2H, s), 4.20-3.41 (5H, m), 3.82 (3H, s), 2.53 (2H, t), 1.55 (3H, d), 1.12 (6H, d), 0.91 (9H, s), 0.12 (6H, s)

[0940] (工序3)

[0941] 2-(3-(2-(2-氰基乙氧基)-2-(5-氟-2-甲氧基苯基)乙基)-5-((异丙氧基亚氨基)甲基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)-N-异丙基丙酰胺的合成

[0942] [化学式17]



[0944] 使2-(5-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-3-(2-(2-氰基乙氧基)-2-(5-氟-2-甲氧基苯基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)-N-异丙基丙酰胺(2.00g)溶解于四氢呋喃(8ml)、水(8ml)中,加入乙酸(20ml),于室温进行7小时搅拌。

[0945] 向反应液中加入水,用乙酸乙酯进行萃取,用饱和碳酸氢钠水溶液、饱和食盐水进行清洗后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,使得到的残余物溶解于氯仿(80ml)中,加入二氧化锰(2.00g),于室温进行3小时搅拌。

[0946] 对反应液进行过滤,将母液浓缩,使得到的残余物溶解于氯仿(20ml)、乙醇(20ml)中,于室温加入吡啶(0.40g)、异丙氧基胺盐酸盐(0.6g),进行30分钟搅拌。

[0947] 对反应液进行减压浓缩,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:正己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物1.26g(E:Z=1:1)。收率70%

[0948] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[0949] ¹H-NMR (CDCl₃) δ:8.84-7.51 (2H, m) 7.14-6.80 (3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.40-3.41 (6H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51 (2H, m), 1.55 (3H, d), 1.29-1.13 (12H, m)

[0950] (实施例2)

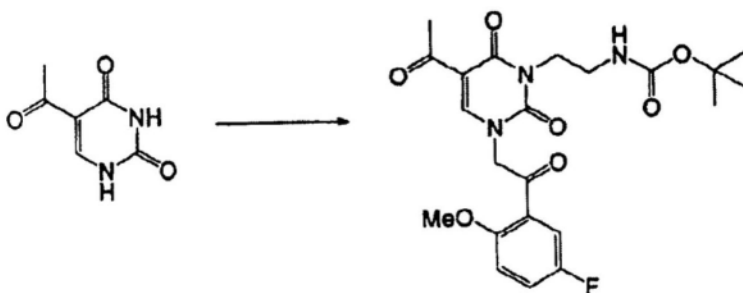
[0951] N-(2-(3-(2-(2-氰基乙氧基)-2-(5-氟-2-甲氧基苯基)乙基)-5-(1-(乙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺(化合物编号A-38)的合成

[0952] (工序1)

[0953] (2-(5-乙酰基-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)氨基甲酸叔丁酯的合成

[0954] [化学式18]

[0955]



[0956] 使5-乙酰基尿嘧啶 (2.50g) 溶解于N,N-二甲基甲酰胺 (80ml) 中,在冰冷却条件下加入碳酸钾 (2.20g)、2-溴-5'-氟-2'-甲氧基苯乙酮 (4.00g),于室温进行3小时搅拌。向反应液中加入水,对所产生的固体进行过滤。

[0957] 使得到的固体溶解于N,N-二甲基甲酰胺 (120ml) 中,加入碳酸钾 (2.40g)、N-(2-溴乙基)氨基甲酸叔丁酯 (4.80g),于80℃进行5小时搅拌。

[0958] 向反应液中加入水,用乙酸乙酯进行萃取,用水、饱和食盐水进行清洗后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:氯仿/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物4.60g。收率61%

[0959] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

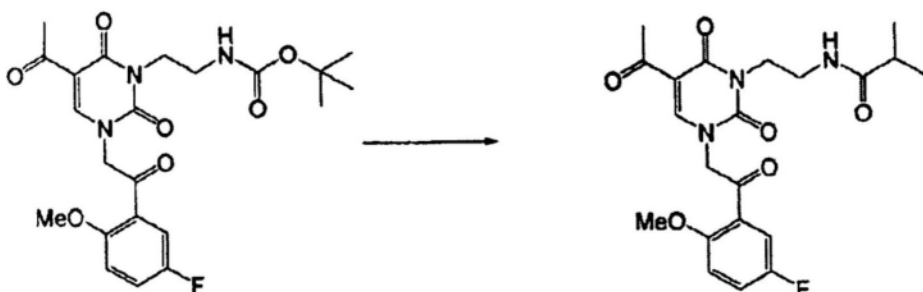
[0960] ¹H-NMR (CDCl₃) δ:8.09 (1H, s), 7.64-6.99 (3H, m), 5.21 (2H, s), 4.87 (1H, m), 4.17-3.42 (4H, m), 4.00 (3H, s), 2.65 (3H, s), 1.40 (9H, s)

[0961] (工序2)

[0962] N-(2-(5-乙酰基-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺的合成

[0963] [化学式19]

[0964]



[0965] 使(2-(5-乙酰基-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)氨基甲酸叔丁酯 (1.60g) 溶解于1,4-二氧杂环己烷 (50ml) 中,加入4N氯化氢/1,4-二氧杂环己烷溶液 (15ml),于室温进行8小时搅拌。

[0966] 将反应液浓缩,使得到的残余物溶解于二氯甲烷 (50ml) 中,加入三乙基胺 (1.5ml)、异丁酰氯 (0.7ml),于室温进行3小时搅拌。

[0967] 对反应液进行减压浓缩,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:氯仿/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物0.95g。收率64%

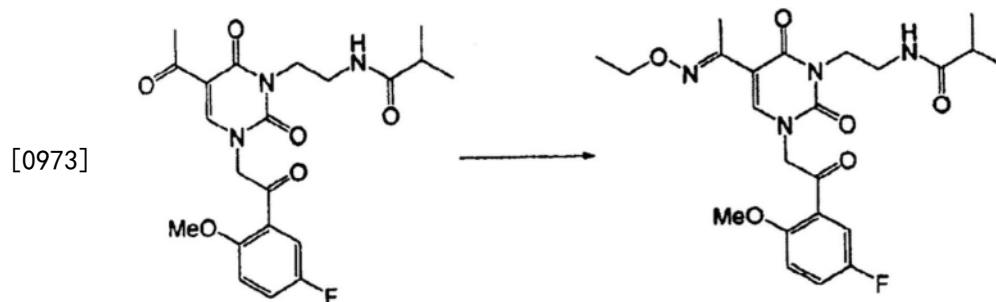
[0968] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[0969] ¹H-NMR (CDCl₃) δ:8.10 (1H, s), 7.64-7.00 (3H, m), 6.00 (1H, m), 5.21 (2H, s), 4.22-3.57 (4H, m), 4.00 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.34-2.27 (1H, m), 1.10 (6H, d)

[0970] (工序3)

[0971] N-(2-(5-(1-(乙氧基亚氨基)乙基)-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺(化合物编号A-36)的合成

[0972] [化学式20]



[0974] 使N-(2-(5-乙酰基-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺(0.50g)溶解于氯仿(8ml)、乙醇(8ml)中,于室温加入吡啶(0.10g)、乙氧基胺盐酸盐(0.12g),进行3小时搅拌。

[0975] 对反应液进行减压浓缩,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:正己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物0.45g。收率82%

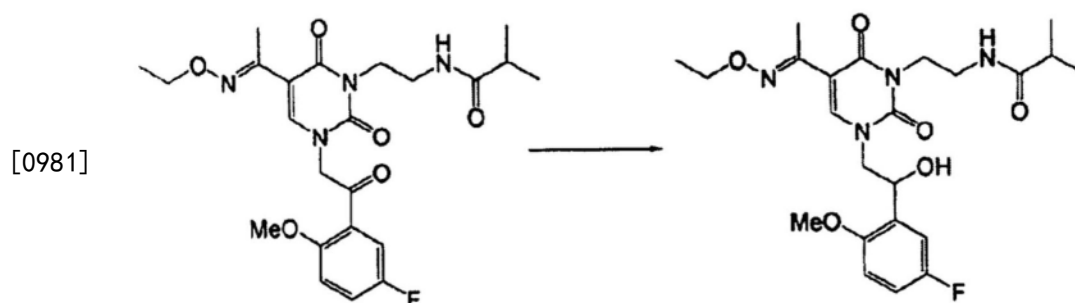
[0976] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[0977] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.64-7.00 (3H, m), 7.33 (1H, s), 6.15 (1H, m), 5.13 (2H, s), 4.20-3.53 (6H, m), 3.99 (3H, s), 2.34-2.27 (1H, m), 2.19 (3H, s), 1.27 (3H, t), 1.10 (6H, d)

[0978] (工序4)

[0979] N-(2-(5-(1-(乙氧基亚氨基)乙基)-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-羟基乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺(化合物编号A-37)的合成

[0980] [化学式21]



[0982] 使N-(2-(5-(1-(乙氧基亚氨基)乙基)-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺(0.25g)溶解于甲醇(4ml)、四氢呋喃(4ml)中,在冰冷却条件下加入硼氢化钠(20mg),进行30分钟搅拌。

[0983] 向反应液中加入饱和氯化铵水溶液,用乙酸乙酯进行萃取,用水、饱和食盐水进行清洗后,用无水硫酸钠进行干燥。利用硅胶柱色谱(展开溶剂:正己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物0.25g。收率99%

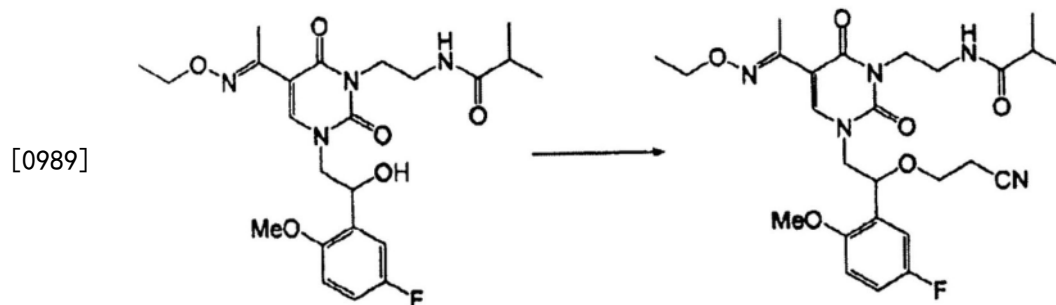
[0984] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[0985] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.40 (1H, s), 7.35-6.80 (3H, m), 5.90-5.48 (2H, m), 4.44-3.24 (9H, m), 3.85 (3H, s), 2.34-2.27 (1H, m), 2.14 (3H, s), 1.27 (3H, t), 1.10 (6H, d)

[0986] (工序5)

[0987] N-(2-(3-(2-(2-氰基乙氧基)-2-(5-氟-2-甲氧基苯基)乙基)-5-(1-(乙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺的合成

[0988] [化学式22]



[0990] 使N-(2-(5-(1-(乙氧基亚氨基)乙基)-3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-羟基乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)乙基)异丁酰胺(0.23g)溶解于四氢呋喃(4ml)中,加入丙烯腈(0.27g)和40%氢氧化钾水溶液(0.3ml),于室温搅拌一夜。

[0991] 向反应液中加入水,用氯仿进行萃取后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物0.12g。收率47%

[0992] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[0993] ¹H-NMR(CDCl₃) δ:7.46(1H,s),7.15-6.83(3H,m),6.28-5.18(2H,m),4.32-3.48(10H,m),3.84(3H,s),2.64(2H,t),2.34-2.27(1H,m),2.16(3H,s),1.30(3H,t),1.10(6H,d)

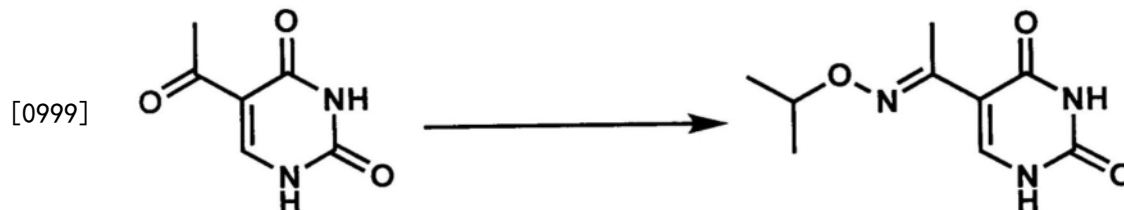
[0994] (实施例3)

[0995] N-((2S)-1-(3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-羟基乙基)-5-((E)-1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(化合物编号A-74及A-75)的合成

[0996] (工序1)

[0997] (E)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮的合成

[0998] [化学式23]



[1000] 使5-乙酰基嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮(15.4g)溶解于乙醇(200ml)、氯仿(100ml)中,加入2-(氨基氧基)丙烷盐酸盐(14.0g),于45℃进行3小时搅拌。

[1001] 向反应液中加入水,用二氯甲烷进行萃取后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,得到目标化合物20.6g。收率98%

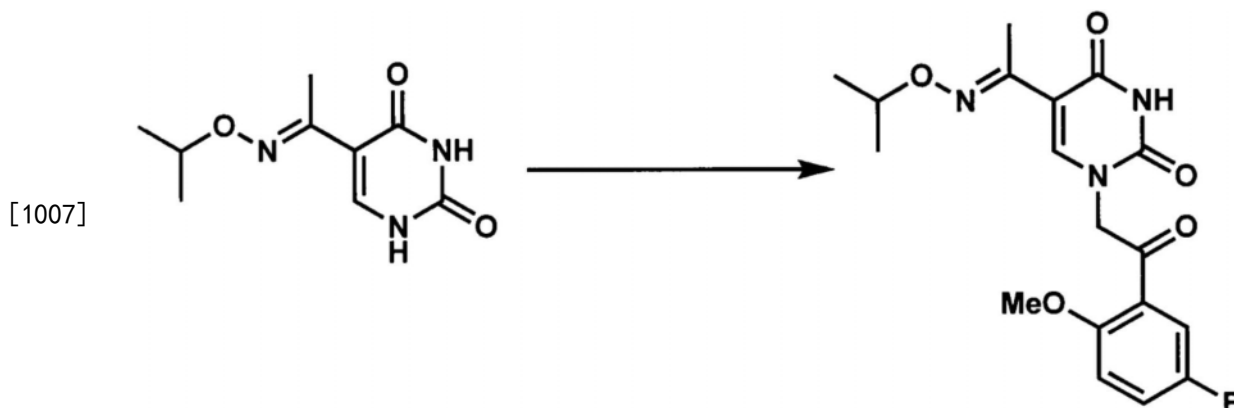
[1002] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1003] ¹H-NMR(DMSO-D₆) δ:11.26(1H,s),11.11(1H,d,J=5.9Hz),7.42(1H,d,J=5.9Hz),4.31-4.25(1H,m),1.99(3H,s),1.20(6H,d,J=6.3Hz)。

[1004] (工序2)

[1005] (E)-1-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮(制造中间体7)的合成

[1006] [化学式24]



[1008] 使(E)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮(2.11g)溶解于N,N-二甲基甲酰胺(30ml)中,加入碳酸钾(1.50g)、2-溴-5'-氟-2'-甲氧基苯乙酮(2.55g),于室温进行3小时搅拌。向反应液中加入水,对所产生的固体进行过滤,得到目标物3.39g。收率90%

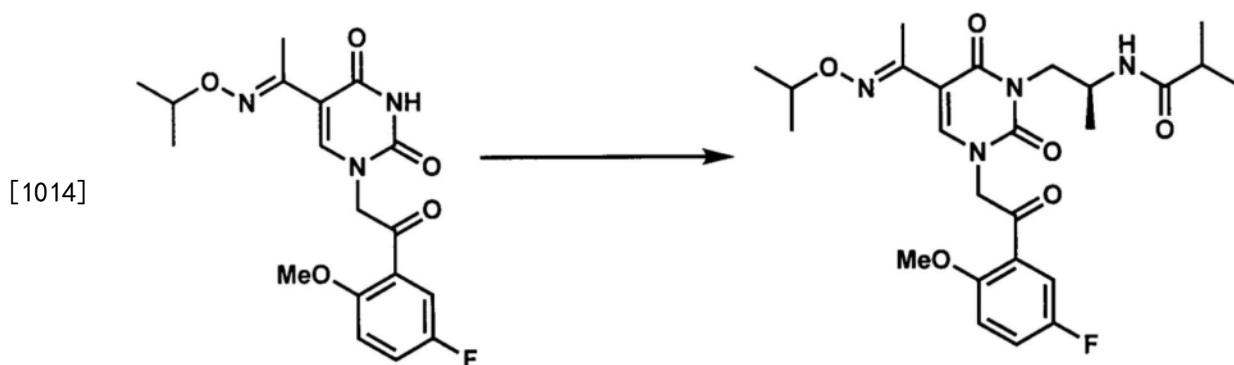
[1009] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1010] ¹H-NMR(CDCl₃) δ:8.23(1H,s),7.67-6.98(3H,m),7.34(1H,s),5.13(2H,s),4.35-4.32(1H,m),3.98(3H,s),2.19(3H,s),1.25(6H,d,J=6.3Hz)。

[1011] (工序3)

[1012] (S,E)-N-(1-(3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(化合物编号C-221)的合成

[1013] [化学式25]



[1015] 使(E)-1-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮(0.56g)溶解于四氢呋喃(7ml)中,加入(S)-(1-羟基丙烷-2-基)氨基甲酸叔丁酯(0.38g)、三苯基膦(0.58g)、偶氮二甲酸双(2-甲氧基乙基)酯(0.52g),于室温进行2小时搅拌。

[1016] 利用硅胶柱色谱(展开溶剂:己烷/乙酸乙酯)对反应液进行纯化,使得到的产物溶解于1,4-二氧杂环己烷(7ml)中,加入4N氯化氢/1,4-二氧杂环己烷溶液(7ml),于室温进行

4小时搅拌。将反应液浓缩,使得到的残余物溶解于二氯甲烷(7ml)中,在冰冷却条件下加入三乙基胺(3ml)、异丁酰氯(0.1ml),进行30分钟搅拌。对反应液进行减压浓缩,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:氯仿/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物0.45g。收率60%

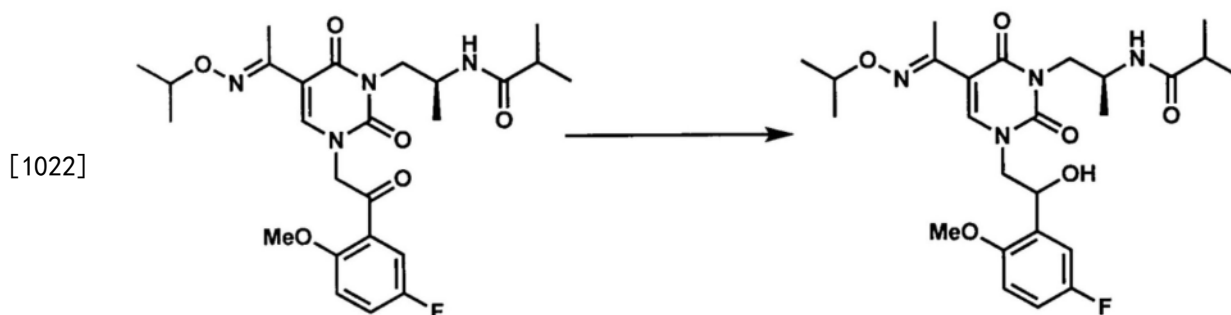
[1017] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1018] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.62-6.99 (3H, m), 7.30 (1H, s), 6.08-2.20 (8H, m), 3.98 (3H, s), 2.15 (3H, s), 1.25-1.03 (15H, m)

[1019] (工序4)

[1020] N-((2S)-1-(3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-羟基乙基)-5-((E)-1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(化合物编号A-74及A-75)的合成

[1021] [化学式26]



[1023] 使(S,E)-N-(1-(3-(2-(5-氟-2-甲氧基苯基)-2-氧代乙基)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(0.25g)溶解于甲醇(2ml)、四氢呋喃(2ml)中,在冰冷却条件下加入硼氢化钠(18mg),进行20分钟搅拌。

[1024] 向反应液中加入饱和氯化铵水溶液,用乙酸乙酯进行萃取,用水、饱和食盐水进行清洗后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:正己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物A-74(0.11g)和A-75(0.11g)。收率分别为44%

[1025] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1026] 化合物编号A-75:¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.38 (1H, s), 7.36-6.79 (3H, m), 5.64-4.22 (7H, m), 3.84 (3H, s), 3.80-3.11 (2H, m), 2.25-2.16 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.24-1.02 (15H, m)

[1027] 化合物编号A-74:¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.42 (1H, s), 7.39-6.79 (3H, m), 5.72-2.16 (10H, m), 3.84 (3H, s), 2.14 (3H, s), 1.27-1.02 (15H, m)

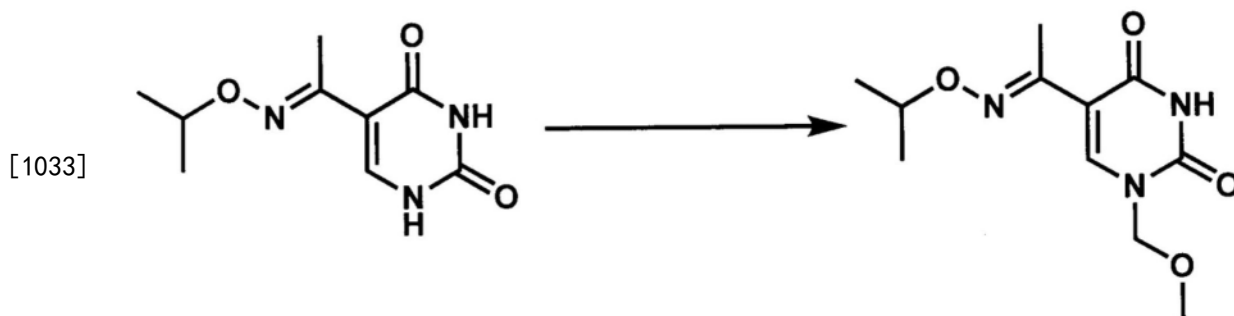
[1028] (实施例4)

[1029] N-((2S)-1-(3-(2-羟基-2-(2-(三氟甲氧基)苯基)乙基)-5-((E)-1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(化合物编号C-193及C-194)的合成

[1030] (工序1)

[1031] (E)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-1-(甲氧基甲基)嘧啶-2,4(1H,3H)-二酮的合成

[1032] [化学式27]



[1034] 使(E)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)咪啉-2,4(1H,3H)-二酮(2.50g)溶解于二氯甲烷(140ml)中,加入N,0-双(三甲基甲硅烷基)乙酰胺(10ml),于室温进行1小时搅拌。其后,加入氯甲基甲醚(1.3ml),于室温搅拌一夜。

[1035] 利用硅胶色谱(展开溶剂:己烷·乙酸乙酯)对反应液进行纯化,得到目标物3.00g。收率99%

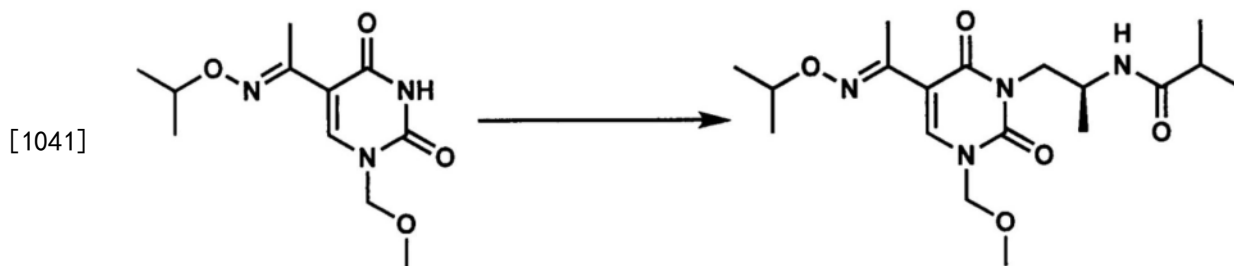
[1036] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1037] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.32 (1H, s), 7.53 (1H, s), 5.15 (2H, s), 4.40-4.34 (1H, m), 3.44 (3H, s), 2.16 (3H, s), 1.27 (6H, d, J=15.2Hz)。

[1038] (工序2)

[1039] (S,E)-N-(1-(5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-3-(甲氧基甲基)-2,6-二氧代-3,6-二氢咪啉-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(制造中间体10)的合成

[1040] [化学式28]



[1042] 使(E)-5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-1-(甲氧基甲基)咪啉-2,4(1H,3H)-二酮(2.50g)溶解于四氢呋喃(25ml)中,加入(S)-(1-羟基丙烷-2-基)氨基甲酸叔丁酯(2.50g)、三苯基膦(3.80g)、偶氮二甲酸双(2-甲氧基乙基)酯(3.40g),于室温进行7小时搅拌。

[1043] 利用硅胶柱色谱(展开溶剂:己烷/乙酸乙酯)对反应液进行纯化,使得到的产物溶解于1,4-二氧杂环己烷(20ml)中,加入4N氯化氢/1,4-二氧杂环己烷溶液(12ml),于室温进行3小时搅拌。将反应液浓缩,使得到的残余物溶解于二氯甲烷(40ml)中,在冰冷却条件下加入三乙基胺(3ml)、异丁酰氯(1.3ml),进行30分钟搅拌。对反应液进行减压浓缩,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:氯仿/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物2.90g。收率77%

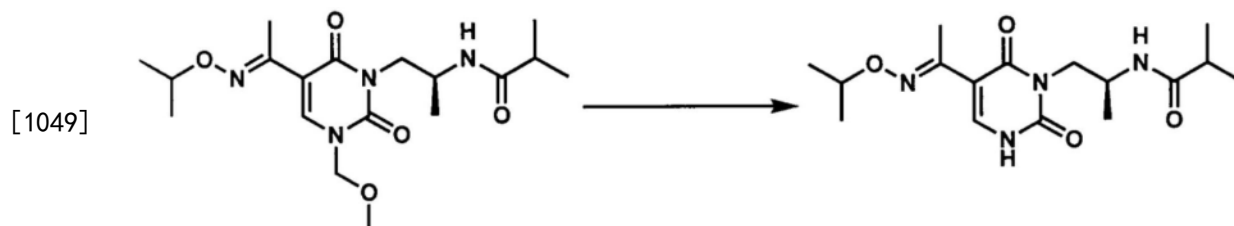
[1044] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1045] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.49 (1H, s), 5.93 (1H, d, J=8.2Hz), 5.19-5.13 (2H, m), 4.42-4.32 (2H, m), 4.15-3.87 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.30-2.18 (1H, m), 2.14 (3H, s), 1.37-0.93 (15H, m)。

[1046] (工序3)

[1047] (S,E)-N-(1-(5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(制造中间体9)的合成

[1048] [化学式29]



[1050] 使(S,E)-N-(1-(5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-3-(甲氧基甲基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(0.50g)溶解于二氯甲烷(15ml)中,在冰冷却条件下加入17%三溴化硼二氯甲烷溶液(1.5ml),搅拌一夜。向反应液中加入饱和碳酸氢钠水溶液,用二氯甲烷进行萃取后,用无水硫酸钠进行干燥。

[1051] 在减压条件下将溶剂蒸馏除去,利用硅胶色谱(展开溶剂:己烷·乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标物0.32g。收率72%

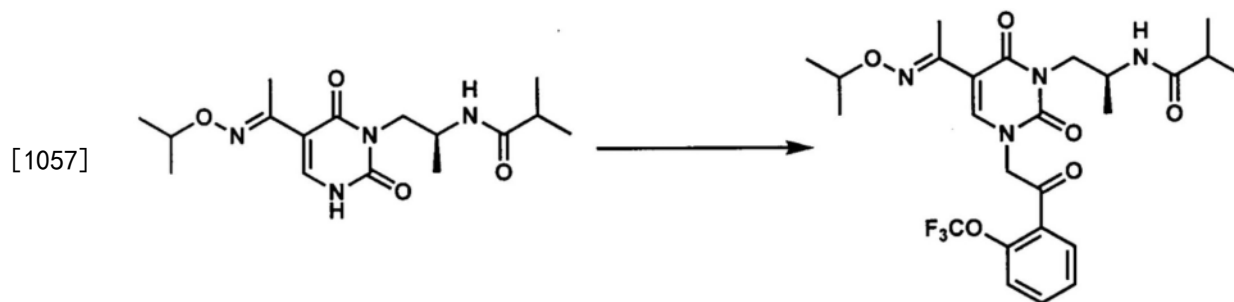
[1052] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1053] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.33 (1H, d, J=6.3Hz), 7.42 (1H, d, J=6.3Hz), 5.94 (1H, d, J=8.2Hz), 4.48-3.84 (4H, m), 2.25-2.21 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.26-1.01 (15H, m)。

[1054] (工序4)

[1055] (S,E)-N-(1-(5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3-(2-氧代-2-(2-(三氟甲氧基)苯基)乙基)-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(化合物编号C-195)的合成

[1056] [化学式30]



[1058] 使(S,E)-N-(1-(5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(0.20g)溶解于N,N-二甲基甲酰胺(3ml)中,在冰冷却条件下加入2-溴-1-(2-(三氟甲氧基)苯基)乙烷-1-酮(0.25g)和碳酸钾(0.10g),搅拌一夜。

[1059] 向反应液中加入水,用乙酸乙酯进行萃取后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,利用硅胶色谱(展开溶剂:己烷·乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标物0.23g。收率72%

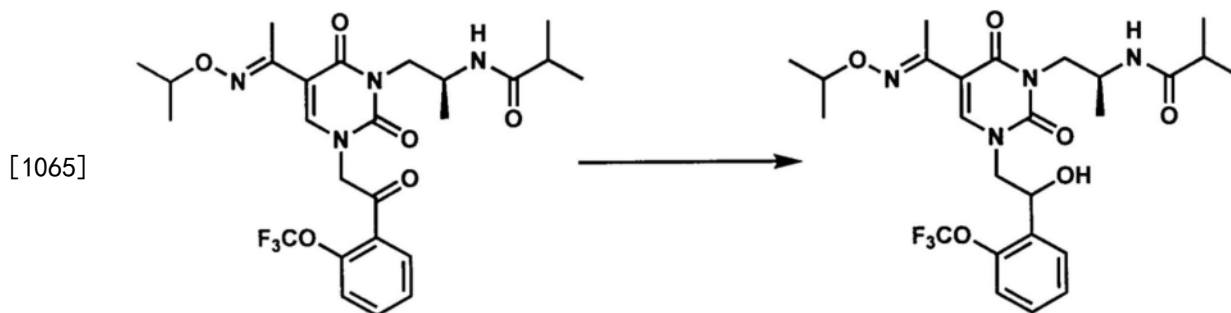
[1060] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1061] ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.98-7.36 (4H, m), 7.33 (1H, s), 6.07-3.90 (7H, m), 2.28-2.21 (1H, m), 2.17 (3H, s), 1.26-1.05 (15H, m)。

[1062] (工序5)

[1063] N-((2S)-1-(3-(2-羟基-2-(2-(三氟甲氧基)苯基)乙基)-5-((E)-1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(化合物编号C-193及C-194)的合成

[1064] [化学式31]



[1066] 使(S,E)-N-(1-(5-(1-(异丙氧基亚氨基)乙基)-2,6-二氧代-3-(2-氧代-2-(2-(三氟甲氧基)苯基)乙基)-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)丙烷-2-基)异丁酰胺(0.19g)溶解于甲醇(2ml)、四氢呋喃(2ml)中,在冰冷却条件下加入硼氢化钠(15mg),进行40分钟搅拌。向反应液中加入饱和氯化铵水溶液,用乙酸乙酯进行萃取,用水、饱和食盐水进行清洗后,用无水硫酸钠进行干燥。在减压条件下将溶剂蒸馏除去,利用硅胶柱色谱(展开溶剂:正己烷/乙酸乙酯)对得到的残余物进行纯化,得到目标化合物C-193(0.90g)和C-194(0.90g)。收率分别为47%

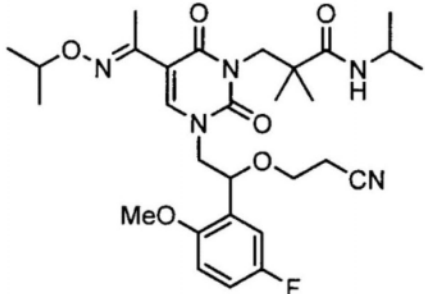
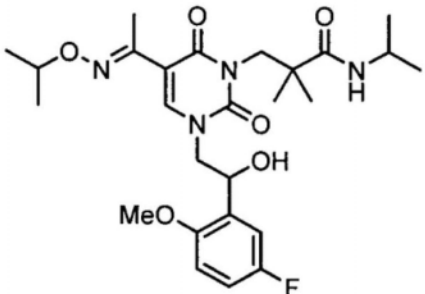
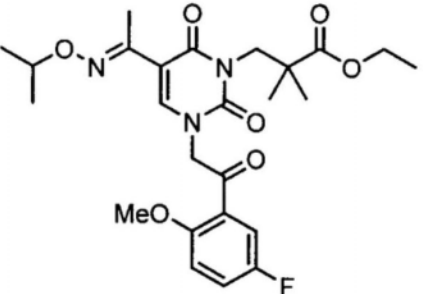
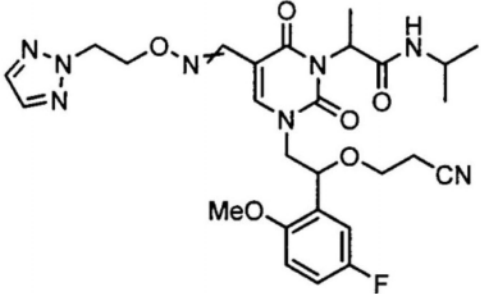
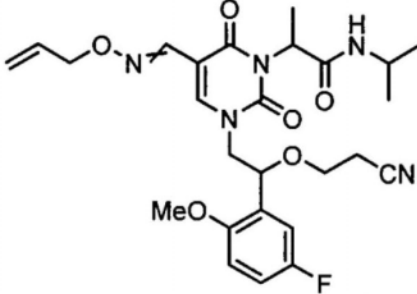
[1067] 以下示出得到的目标物的¹H-NMR。

[1068] 化合物编号C-194:¹H-NMR(CDCl₃) δ:7.76-7.27(4H,m),7.41(1H,s),5.75-5.43(3H,m),4.77-4.24(4H,m),3.81-3.13(2H,m),2.21-2.18(1H,m),2.12(3H,s),1.28-1.00(15H,m)。

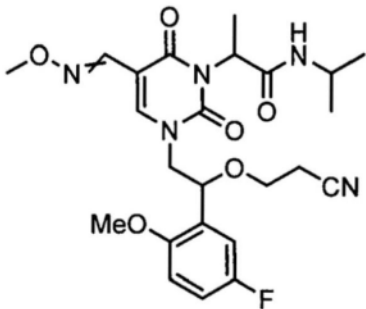
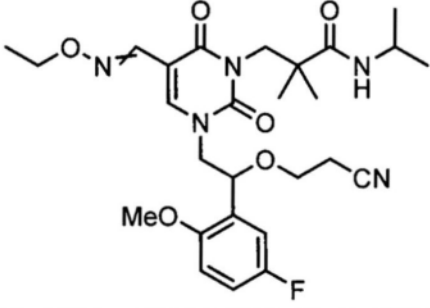
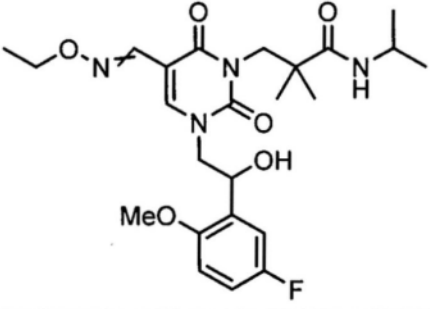
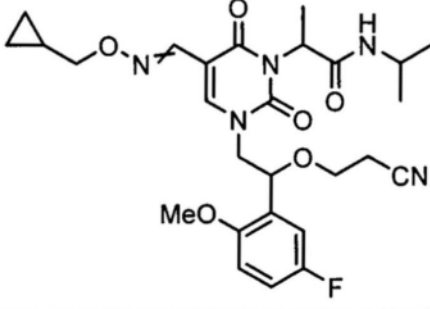
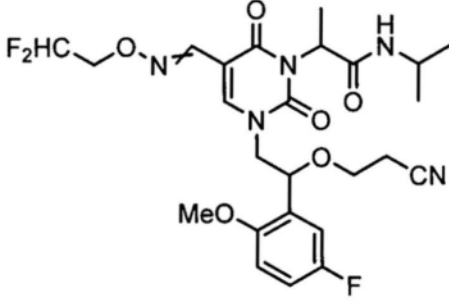
[1069] 化合物编号C-193:¹H-NMR(CDCl₃) δ:7.84-7.35(4H,m),7.42(1H,s),5.64-3.74(9H,m),2.25-2.18(1H,m),2.14(3H,s),1.28-1.01(15H,m)。

[1070] 将通过与前述实施例同样的方法制造的本发明化合物的一部分示于表2。在表中,作为各化合物的物性而将熔点(m.p.)一并示出。

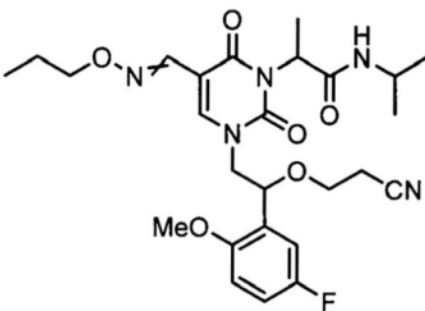
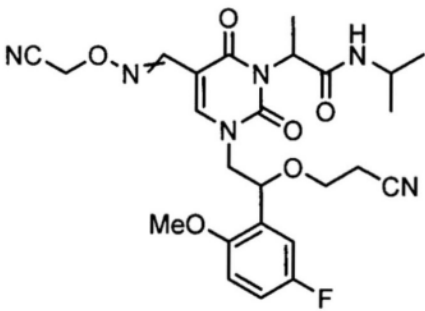
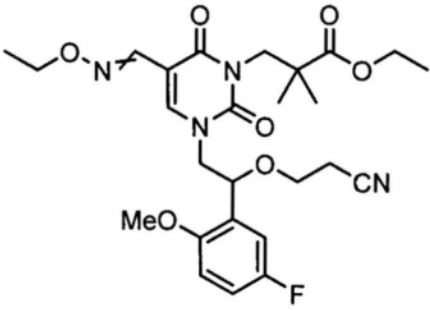
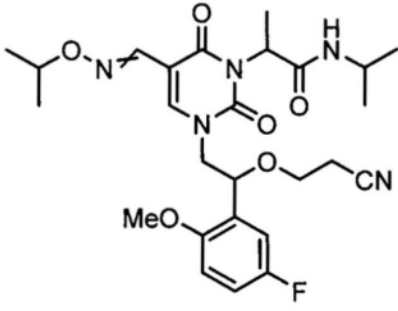
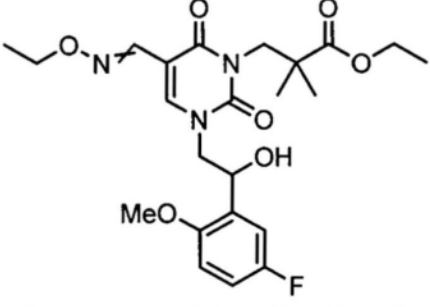
[1071] [表2]

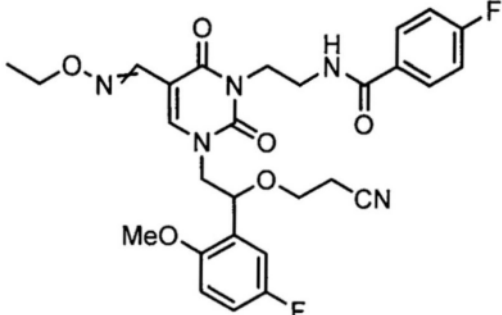
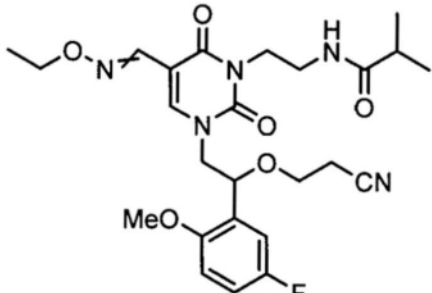
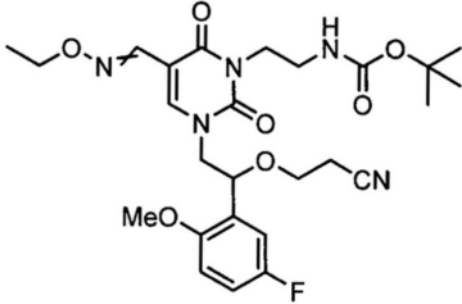
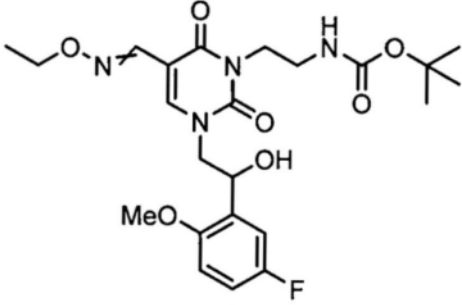
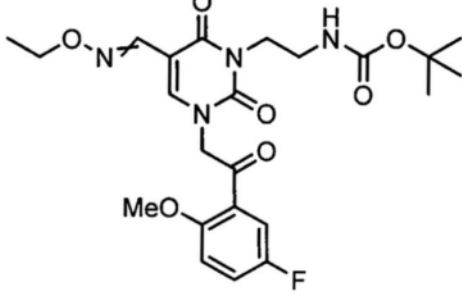
化合物编号	结构式	物性
A-1		m.p. 151-152°C
A-2		m.p. 82-83°C
A-3		粘性油
A-4		粘性油
A-5		粘性油

[1072]

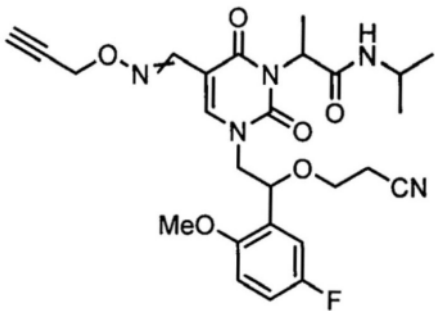
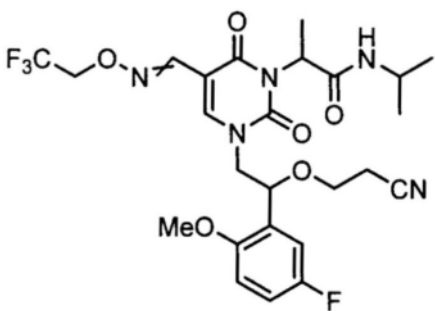
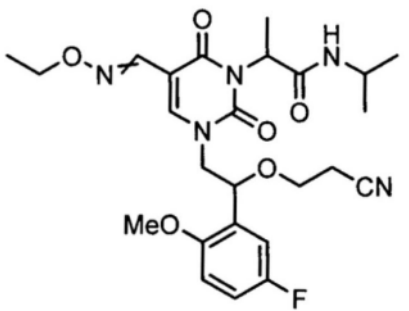
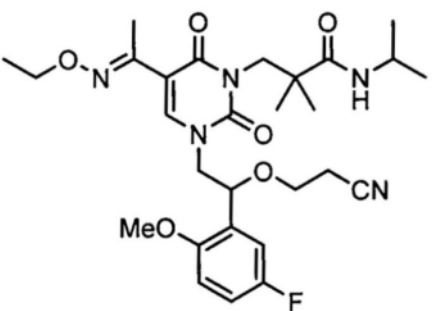
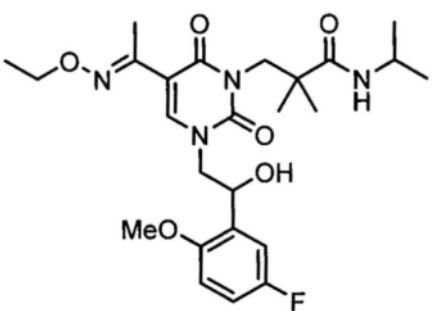
A-6		粘性油
A-7		粘性油
A-8		m.p. 72-73°C
A-9		粘性油
A-10		粘性油

[1073]

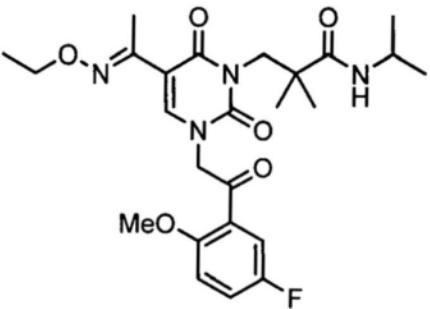
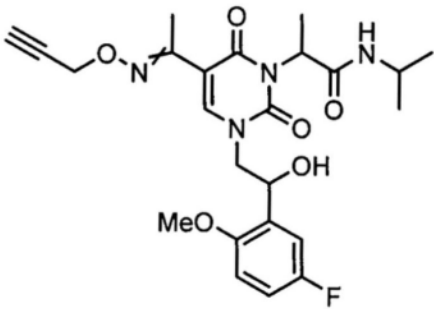
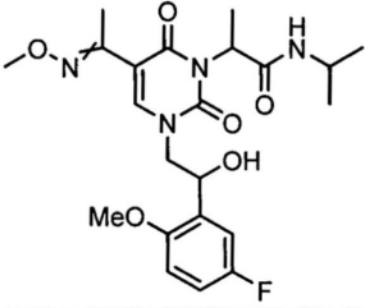
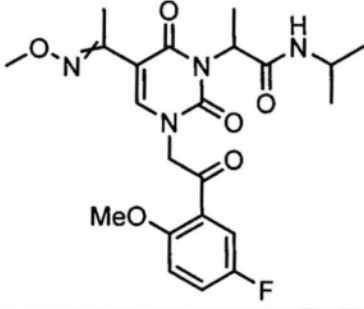
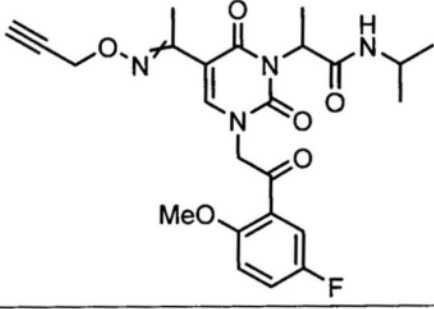
A-11		粘性油
A-12		粘性油
[1074] A-13		粘性油
A-14		粘性油
A-15		m.p. 120-121°C

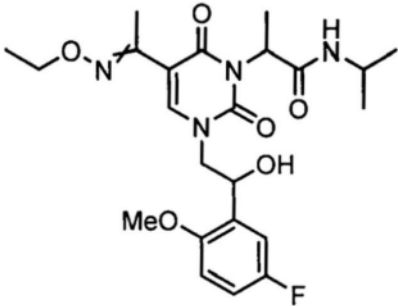
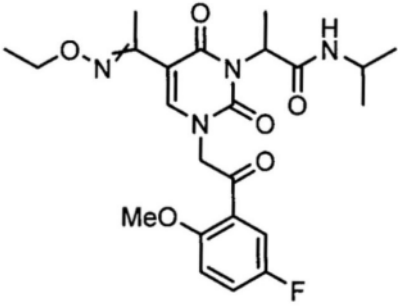
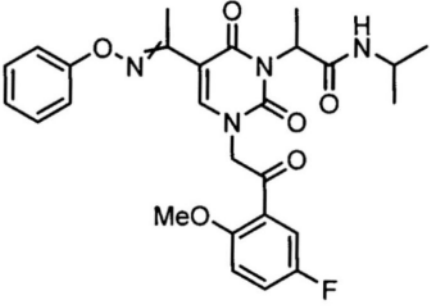
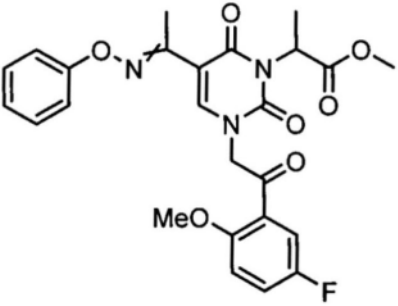
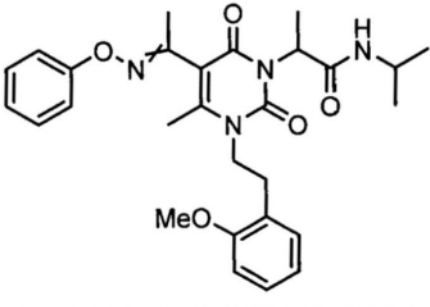
A-16		粘性油
A-17		m.p. 52-53°C
A-18		粘性油
A-19		m.p. 128-129°C
A-20		m.p. 82-83°C

[1075]

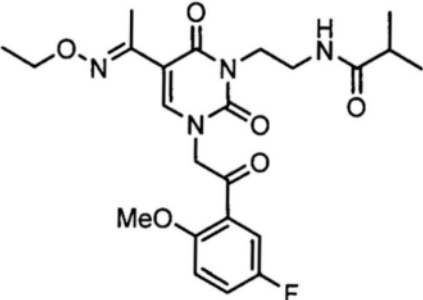
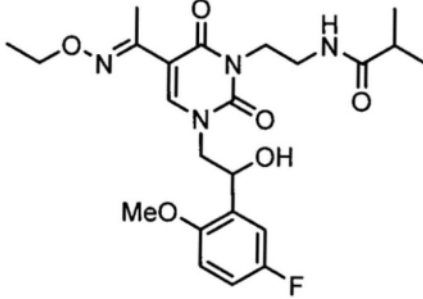
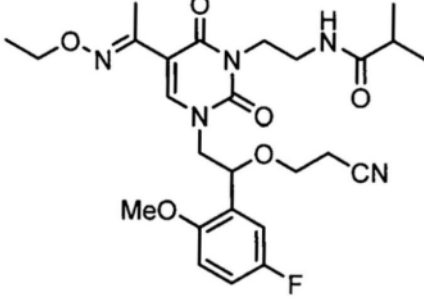
A-21		粘性油
A-22		粘性油
A-23		粘性油
A-24		粘性油
A-25		粘性油

[1076]

A-26		m.p. 182-183°C
A-27		m.p. 79-80°C
[1077] A-28		粘性油
A-29		m.p. 91-92°C
A-30		m.p. 138-139°C

A-31		粘性油
A-32		m.p. 105-106°C
A-33		m.p. 102-103°C
A-34		m.p. 177-178°C
A-35		m.p. 145-146°C

[1078]

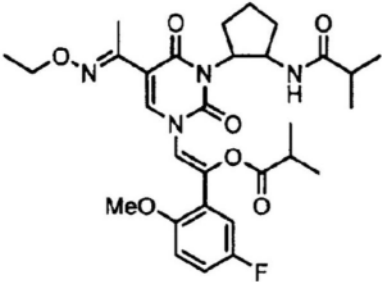
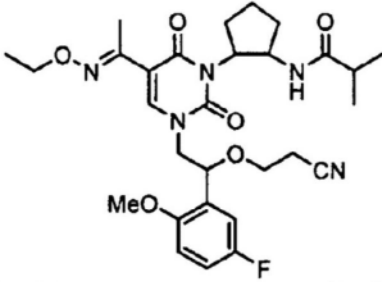
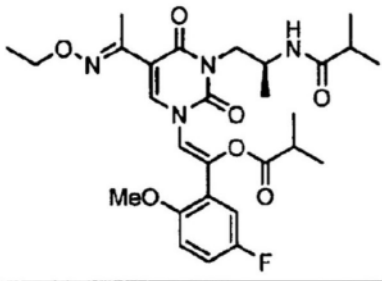
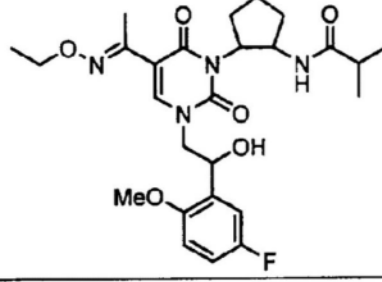
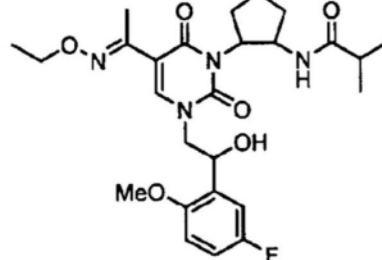
A-36		m.p. 146-147°C
[1079] A-37		m.p. 148-149°C
A-38		m.p. 105-106°C

[1080] 此外,将通过与前述实施例同样的方法制造的本发明化合物的一部分示于表3。在表中,作为各化合物的物性而将熔点(m.p.)一并示出。另外,在为立体异构体的情况下,示于特别事项中。

[1081] [表3]

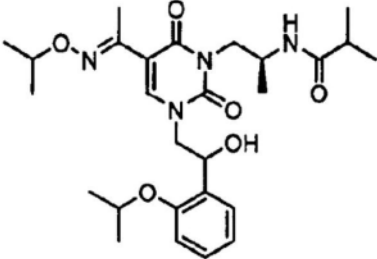
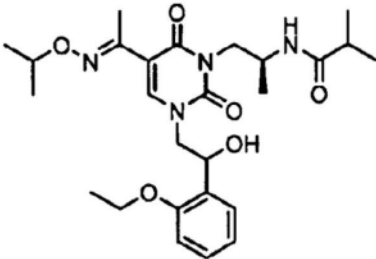
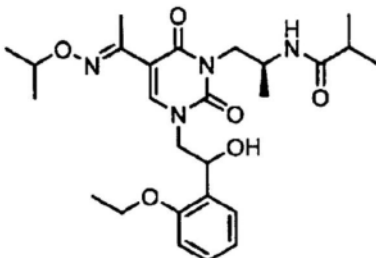
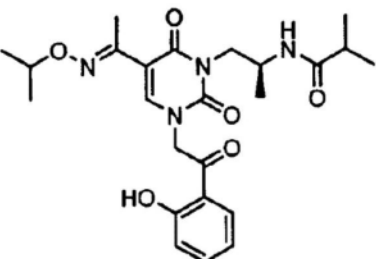
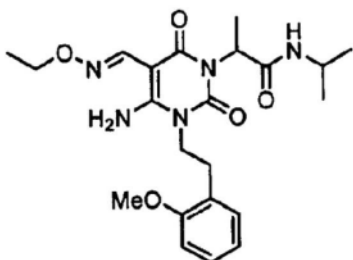
[1082]

化合物编号	结构式	物性	特别事项
A-39		m.p. 100-103°C	
A-40		m.p. 74-79°C	A-39 的异构体
A-41		m.p. 80-84°C	
A-42		m.p. 141-142°C	A-41 的异构体
A-43		粘性油	

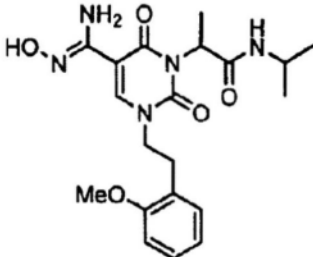
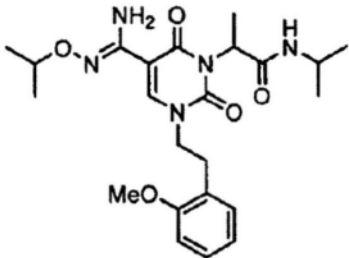
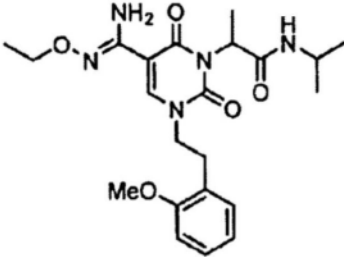
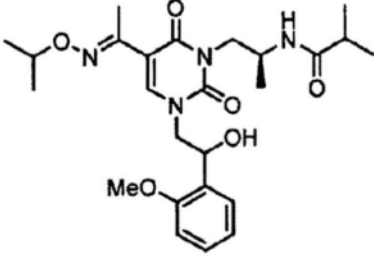
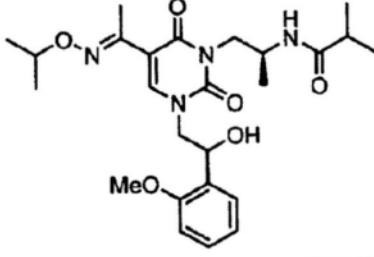
A-44		粘性油	A-43 的异构体
A-45		粘性油	
A-46		粘性油	
A-47		粘性油	
A-48		粘性油	A-47 的异构体

[1083]

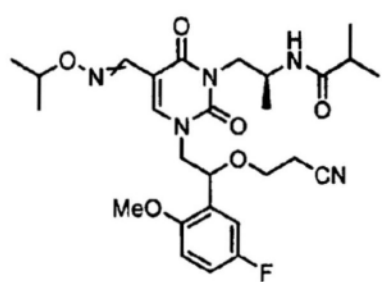
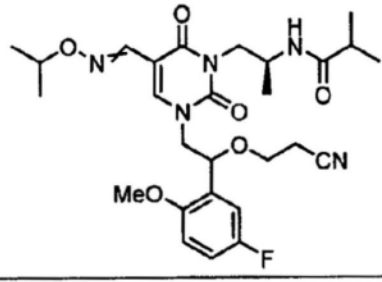
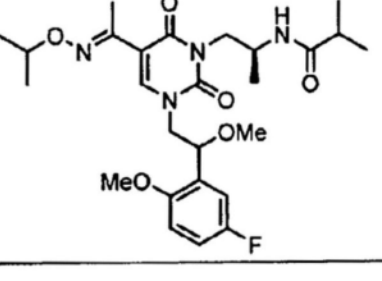
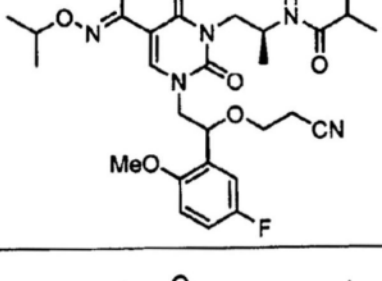
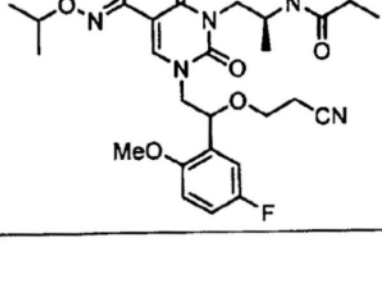
[1084]

A-49		m.p. 61-64°C	
A-50		m.p. 153-154°C	
A-51		m.p. 104-106°C	A-50 的异构体
A-52		m.p. 93-96°C	
A-53		非晶质	

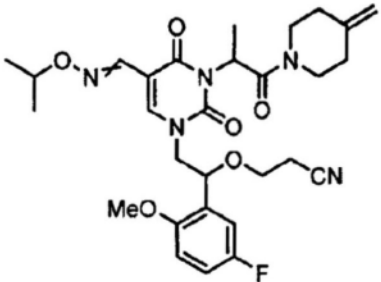
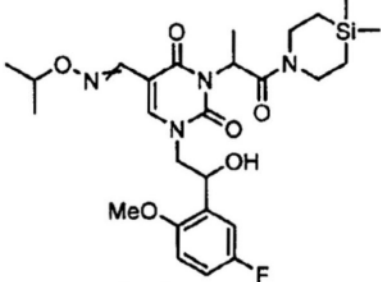
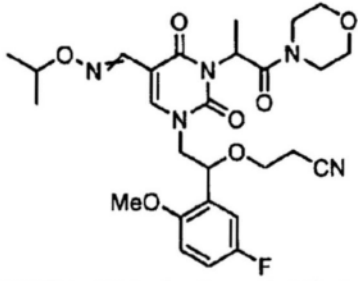
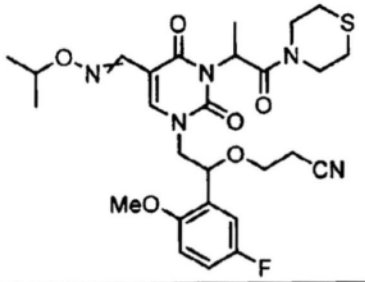
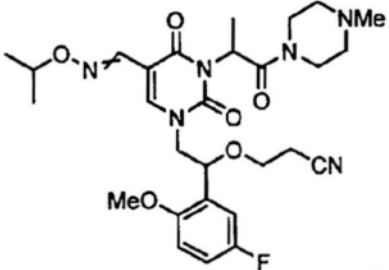
[1085]

A-54		m.p. 217-219°C	
A-55		m.p. 87-90°C	
A-56		m.p. 130-132°C	
A-57		m.p. 112-114°C	
A-58		m.p. 73-77°C	A-57的异构体

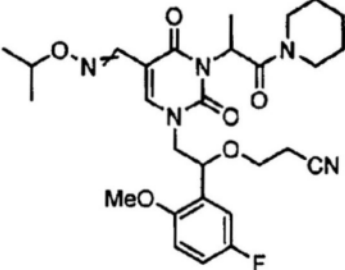
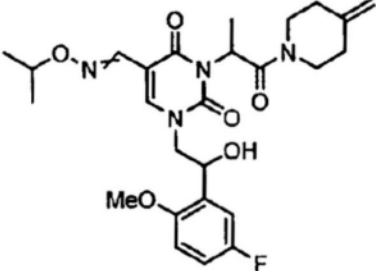
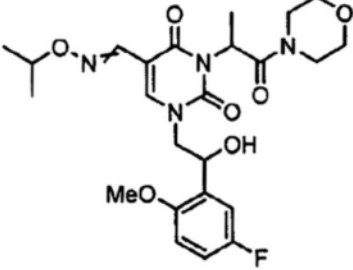
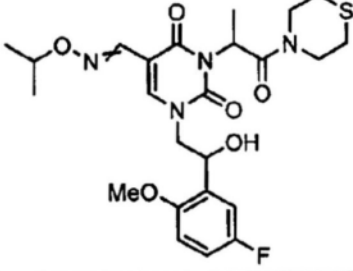
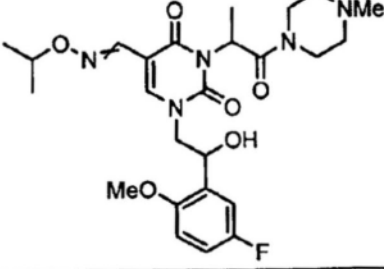
[1086]

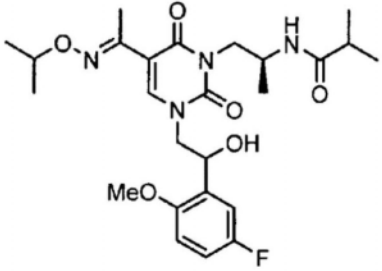
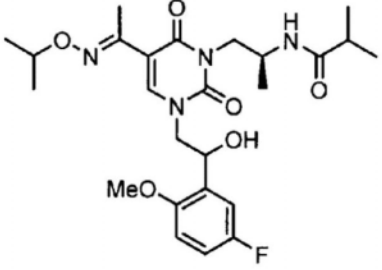
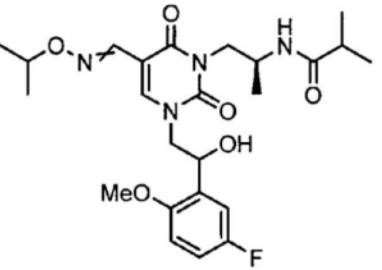
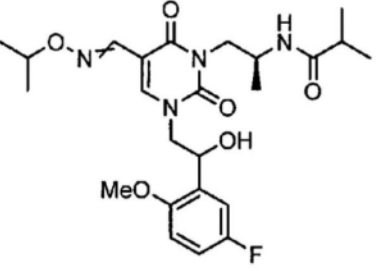
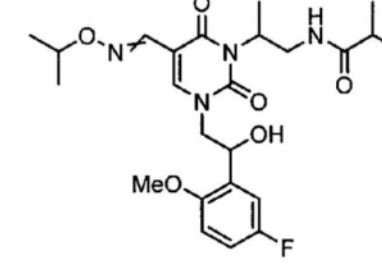
A-59		m.p. 59-62°C	
A-60		m.p. 63-68°C	A-59 的异构体
A-61		m.p. 42-51°C	
A-62		m.p. 53-54°C	
A-63		m.p. 53-54°C	A-62 的异构体

[1087]

A-64		m.p. 38-40°C	
A-65		粘性油	
A-66		m.p. 67-70°C	
A-67		m.p. 50-52°C	
A-68		m.p. 66-69°C	

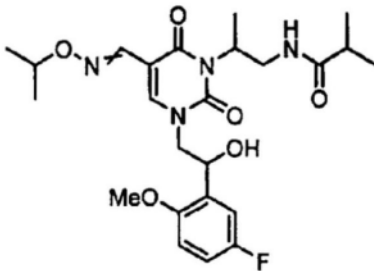
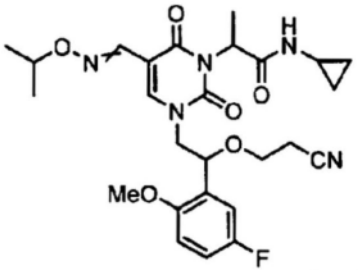
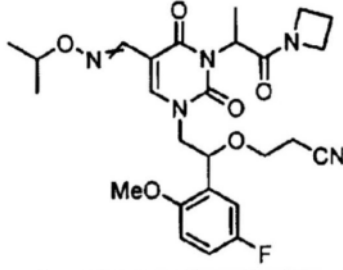
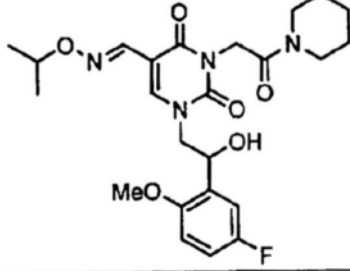
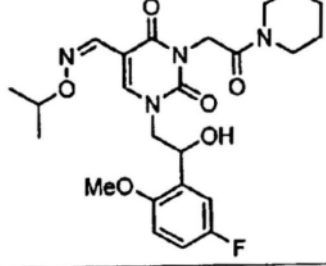
[1088]

A-69		m.p. 66-71°C	
A-70		m.p. 80-82°C	
A-71		m.p. 84-87°C	
A-72		m.p. 83-85°C	
A-73		m.p. 84-86°C	

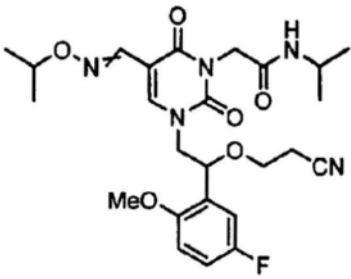
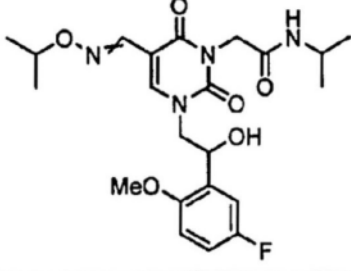
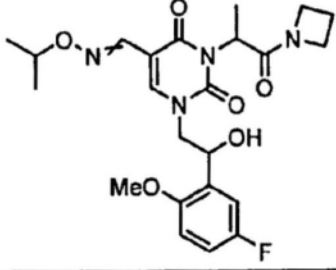
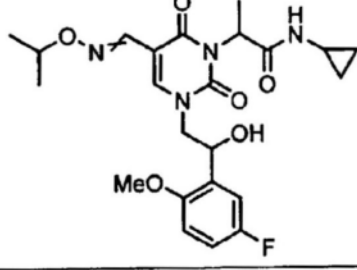
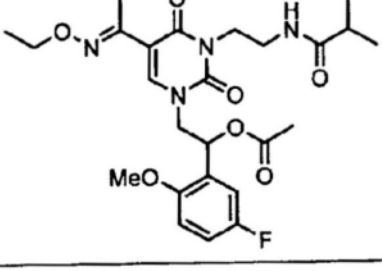
A-74		m.p. 65-68°C	
A-75		m.p. 121-124°C	A-74的异构体
A-76		m.p. 70-76°C	
A-77		m.p. 73-74°C	A-76的异构体
A-78		m.p. 63-70°C	

[1089]

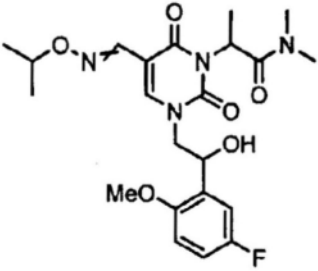
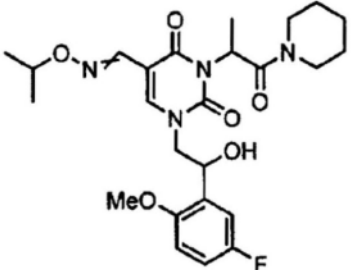
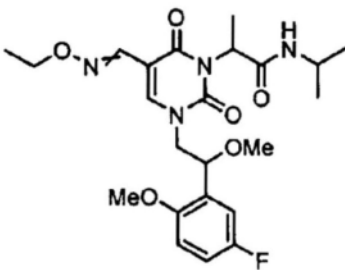
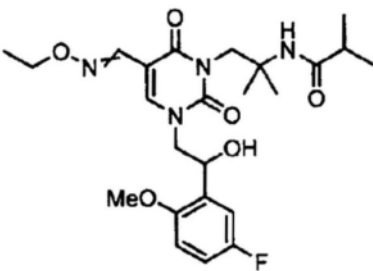
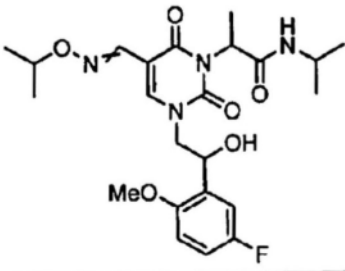
[1090]

A-79		m.p. 60-67°C	A-78 的异构体
A-80		m.p. 55-56°C	
A-81		m.p. 76-78°C	
A-82		粘性油	
A-83		粘性油	

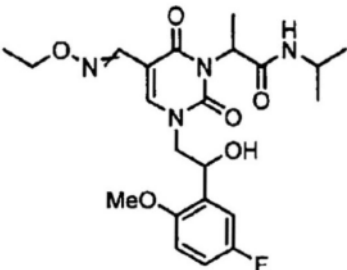
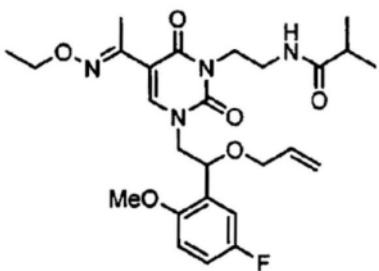
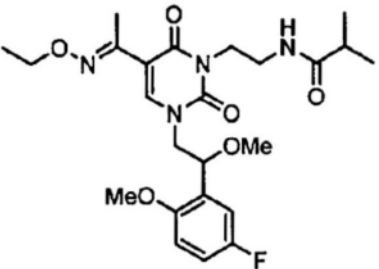
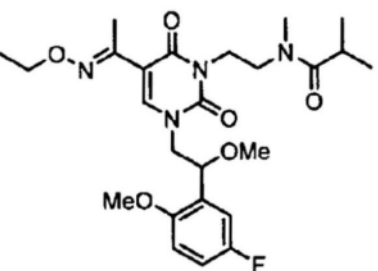
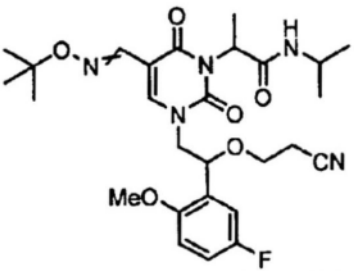
[1091]

A-84		m.p. 125-126°C	
A-85		m.p. 108-109°C	
A-86		m.p. 84-85°C	
A-87		m.p. 84-89°C	
A-88		m.p. 174-175°C	

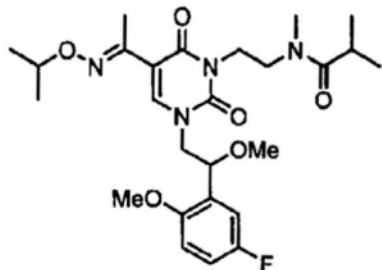
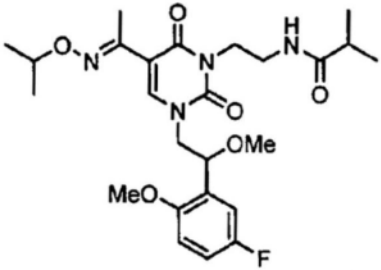
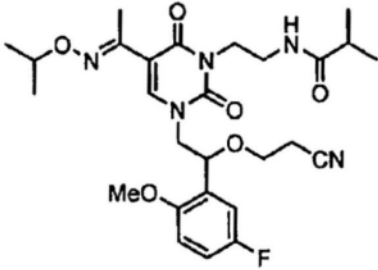
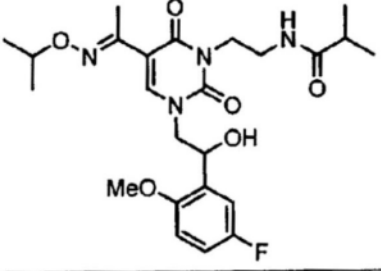
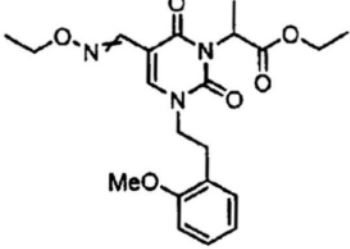
[1092]

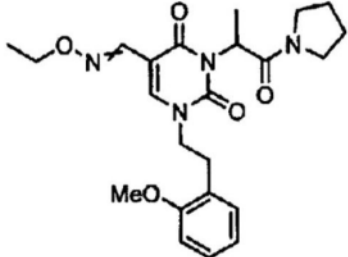
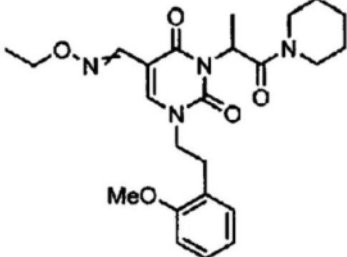
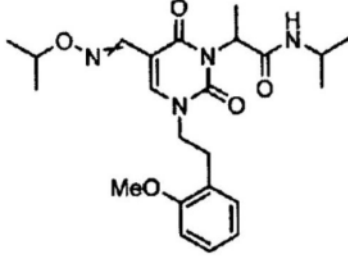
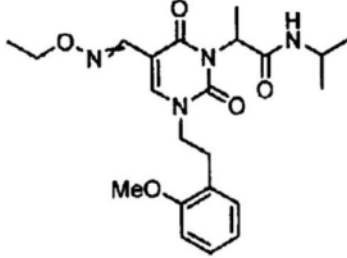
A-89		粘性油	
A-90		非晶质	
A-91		粘性油	
A-92		非晶质	
A-93		m.p. 91-92°C	

[1093]

A-94		m.p. 89-90°C	
A-95		m.p. 118-119°C	
A-96		m.p. 107-108°C	
A-97		粘性油	
A-98		粘性油	

[1094]

A-99		粘性油	
A-100		粘性油	
A-101		粘性油	
A-102		m.p. 73-74°C	
A-103		粘性油	

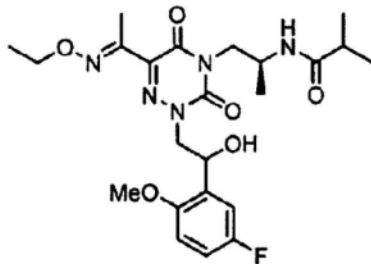
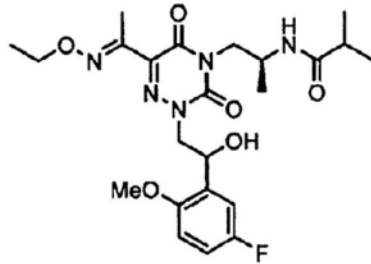
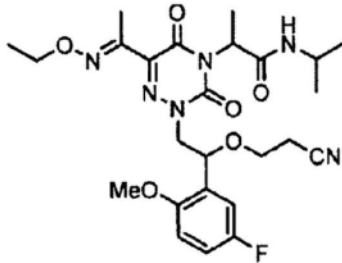
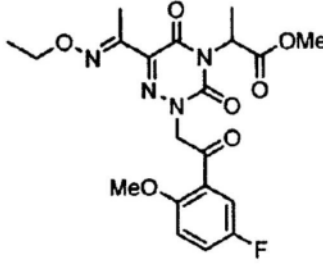
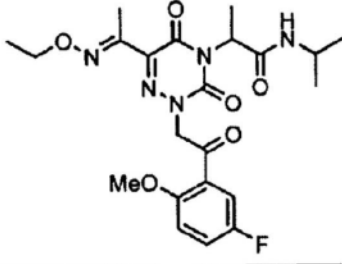
A-104		粘性油	
A-105		粘性油	
A-106		粘性油	
A-107		粘性油	

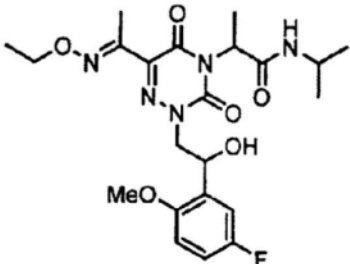
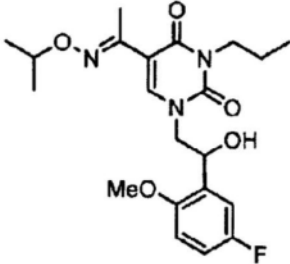
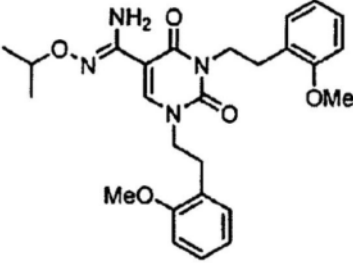
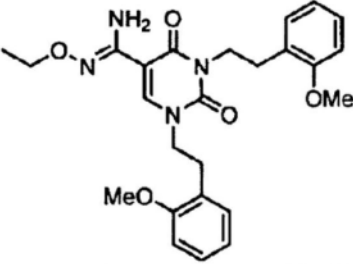
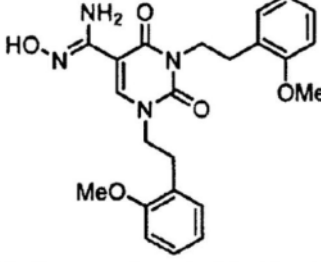
[1095]

[1096] 此外,将通过与前述实施例同样的方法制造的本发明化合物的一部分示于表4。在表中,作为各化合物的物性而将熔点(m.p.)一并示出。另外,在为立体异构体的情况下,示于特别事项中。

[1097] [表4]

[1098]

化合物编号	结构式	物性	特别事项
B-1		粘性油	
B-2		粘性油	B-1 的异构体
B-3		非晶质	
B-4		粘性油	
B-5		m.p. 194-196°C	

B-6		粘性油	
B-7		m.p. 118-119°C	
B-8		粘性油	
B-9		粘性油	
B-10		m.p. 138-140°C	

[1099]

[1100] 关于表2~表4所记载的化合物中的、具有非晶或粘性油的性状的化合物,在下述的表5中示出其¹H-NMR数据。

[1101] [表5]

[1102]

化合物编号	NMR数据
A-3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.64-6.97(4H, m), 5.09(2H, s), 4.38-3.96(8H, m), 2.16(3H, s), 1.28-1.21(15H, m).
A-4	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.64-7.50(2H, m) 7.61(2H, s) 7.14-6.80(3H, m), 5.88-5.03 (3H, m), 4.74-2.51 (14H, m), 1.55(3H, d), 1.13(6H, d).
A-5	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.80-7.55(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 6.10-4.60 (8H, m), 4.40-3.41 (5H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.55(3H, d), 1.13(6H, d).
A-6	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.71-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.40-3.41 (5H, m), 3.93 (3H, s), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.55(3H, d), 1.13(6H, d).
A-7	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.71-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 6.08-2.55 (16H, m), 1.32-1.18 (15H, m).
A-9	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.90-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.40-3.41 (7H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.55(3H, d), 1.62-0.30(11H, m).
A-10	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.79-7.60(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 6.30-5.07 (4H, m), 4.40-3.41 (7H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.55(3H, d), 1.13(6H, d).
A-11	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.80-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.40-3.41 (7H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.78-0.95(11H, m).
A-12	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.23-7.94(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.74(2H, s), 4.40-3.41 (5H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.55(3H, d), 1.13(6H, d).
A-13	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.67-7.48(2H, m) 7.15-6.80(3H, m), 5.08-2.53 (16H, m), 1.31-1.18 (12H, m).
A-14	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.84-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.40-3.41 (6H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.55(3H, d), 1.29-1.13(12H, m)
A-16	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.78-6.80(8H, m) 5.11-2.53(16H, m), 1.33(3H, t).
A-18	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.71-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.12-2.53 (17H, m), 1.39 (9H, s), 1.32 (3H, t).
A-21	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.77-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.72-2.49 (10H, m), 3.82 (3H, s), 1.55(3H, d), 1.12(6H, d).
A-22	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.23-7.84(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.40-3.41 (7H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.55(3H, d), 1.13(6H, d).

[1103]

A-23	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.80-7.51(2H, m), 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.37-3.41 (7H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.56-1.11(12H, m).
A-24	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.41(1H, s), 7.14-6.80(3H, m), 6.11(1H, d), 5.05-2.51(12H, m), 3.82 (3H, s), 2.14(3H, s), 1.31-1.13(15H, m).
A-25	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.30(1H, s), 7.20-6.77(3H, m), 5.91(1H, d), 5.24-3.81(9H, m), 3.85 (3H, s), 2.14(3H, s), 1.31-1.13(15H, m).
A-28	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.35(1H, s), 7.18-6.80(3H, m), 5.45-3.81(13H, m), 2.12 (3H, s), 1.52(3H, d), 1.15(6H, m).
A-31	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.33(1H, s), 7.18-6.80(3H, m), 5.45-3.81(12H, m), 2.14 (3H, s), 1.52(3H, d), 1.30-1.12(9H, m).

[1104]

化合物编号	NMR数据
A-43	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.06-1.33(m,15H), 1.69-2.30(m,11H), 3.70-4.50(m,5H), 4.78-5.23(m,2H), 6.59-7.34(m,4H), 8.21(s,1H).
A-44	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.06-1.42(m,15H), 1.69-2.30(m,11H), 3.70-4.50(m,5H), 4.78-5.23(m,2H), 6.61-7.34(m,4H), 7.27(s,1H).
A-45	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 0.95-1.31(m,9H), 1.69-2.30(m,10H), 2.60-2.72(m,2H), 3.48-4.52(m,6H), 4.99-5.28(m,2H), 6.82-7.31(m,4H).
A-46	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.02-1.28(m,18H), 2.13(s,3H), 2.21-2.30(m,1H), 2.75-2.82(m,1H), 3.85(s,3H), 3.93-4.40(m,5H), 6.85-7.03(m,3H), 7.17(s,1H), 7.59(s,1H).
A-47	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 0.99-1.26(m,9H), 1.48-2.70(m,10H), 3.84(s,3H), 4.05-4.55(m,5H), 5.40-5.48(m,2H), 6.77-6.95(m,2H), 7.24-7.29(m,2H).
A-48	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.05-1.30(m,9H), 1.48-2.39(m,10H), 3.22-4.53(m,H)s,8H), 5.09-5.32(m,2H), 6.77-6.98(m,2H), 7.24-7.29(m,2H).
A-53	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.26-1.30(m,6H), 1.66(d,3H), 2.93-2.98(m,2H), 3.83(s,3H), 4.10-4.22(m,8H), 4.51-4.54(m,1H), 6.81-7.24(m,4H), 8.23(s,1H).
A-65	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.80-7.51(2H, m), 7.14-6.80(3H, m), 5.57-3.13 (11H, m), 3.84 (3H, s), 1.55-1.23(13H, m), 0.09(6H, s).
A-82	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.82(1H, s), 7.51(1H, s), 7.25-6.80 (3H, m), 5.25-3.47 (11H, m), 3.79 (3H, s), 1.69-1.23(12H, m).
A-83	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.01(1H, s), 7.70(1H, s), 7.25-6.80 (3H, m), 5.25-3.45 (11H, m), 3.79 (3H, s), 1.69-1.23(12H, m).

[1105]

A-89	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.83-8.74 (1H, m), 7.97-7.47 (1H, m), 7.09-7.07 (1H, m), 6.97-6.91 (1H, m), 6.80-6.78 (1H, m), 5.51-5.46 (1H, m), 5.24-5.16 (1H, m), 4.44-4.07 (3H, m), 3.87 (3H, s), 2.94-2.64 (6H, m), 1.50-1.46 (3H, m), 1.31-1.23 (6H, m).
A-90	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.83-7.62 (1H, m), 8.01-7.51 (1H, m), 7.16-7.11 (1H, m), 6.99-6.94 (1H, m), 6.83-6.80 (1H, m), 5.53-5.50 (1H, m), 5.21-5.18 (1H, m), 4.44-3.08 (7H, m), 3.865 (3H, s), 1.634-1.243 (15H, m).
A-91	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.74-7.49(2H, m) 7.11-6.80(3H, m), 5.50-4.83 (3H, m), 4.37-3.41 (5H, m), 3.82 (3H, s), 3.30 (3H, s), 1.56-1.11(12H, m).
A-92	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.76-8.09 (1H, m), 7.74-7.48 (1H, m), 7.23-7.19 (1H, m), 6.98-6.94 (1H, m), 6.83-6.78 (1H, m), 5.27-5.26 (1H, m), 4.32-4.04 (7H, m), 3.84 (3H, s), 2.23-2.16 (1H, m), 1.46-1.46 (6H, m), 1.33-1.26 (3H, m), 1.06-1.04 (6H, m).
A-97	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.40-6.79(4H, m), 4.90-2.69(10H, m), 3.82 (3H, s), 3.29 (3H, s), 3.05 (3H, s), 2.14 (3H, s), 1.30-1.01(9H, m)
A-98	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.87-7.51(2H, m) 7.14-6.80(3H, m), 5.85-5.07 (3H, m), 4.34-3.41 (5H, m), 3.82 (3H, s), 2.65-2.51(2H, m), 1.56-1.11(18H, m)
A-99	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.40-6.79(4H, m), 4.90-2.69(9H, m), 3.82 (3H, s), 3.29 (3H, s), 3.05 (3H, s), 2.14 (3H, s), 1.30-1.01(12H, m)
A-100	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.36(1H, s), 7.10-6.82(3H, m) 6.29-4.88(2H, m), 4.40-3.41(7H, m), 3.82 (3H, s), 3.29 (3H, s), 2.34-2.15(4H, m), 1.30-1.11(12H, m).
A-101	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.43(1H, s), 7.14-6.82(3H, m) 6.29-5.10(2H, m), 4.40-3.43(9H, m), 3.84 (3H, s), 2.63(2H, t), 2.34-2.15(4H, m), 1.30-1.11(12H, m).
A-103	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.18-1.26(m,6H), 1.58(d,3H), 2.98-3.04(m,2H), 3.71-4.10(m,9H), 5.46-5.51(m,1H), 6.82-7.38(m,5H), 7.95(s,1H).
A-104	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.25-1.29(m,3H), 1.62-1.95(m,4H), 2.68-3.47(m,6H), 3.81-4.18(m,7H), 5.39-5.441(m,1H), 6.82-7.54(m,5H), 7.96(s,1H).
A-105	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.18-1.62(m,12H), 2.94-3.12(m,4H), 3.40-3.62(m,2H), 3.81-4.19(m,7H), 5.45-5.51(m,1H), 6.82-7.49(m,5H), 7.97(s,1H).
A-106	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.50-6.85(6H, m) 5.50-5.38(2H, m), 4.35-3.94 (4H, m), 3.80 (3H, s), 3.15-2.91(2H, m), 1.56-1.14(15H, m).
A-107	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.43-6.85(6H, m) 5.50-5.38(2H, m), 4.18-3.98(5H, m), 3.80 (3H, s), 3.15-2.91(2H, m), 1.56-1.14(12H, m).
B-1	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.01-1.08(m,6H), 1.23-1.29(m,6H), 2.03-2.30(m,4H), 3.63-3.85(m,2H), 3.86(s,3H), 4.05-4.40(m,2H), 4.60-4.72(m,2H), 5.44-5.56(m,1H), 6.75-6.81(m,1H), 6.89-6.95(m,1H), 7.32-7.38(m,1H).

[1106]

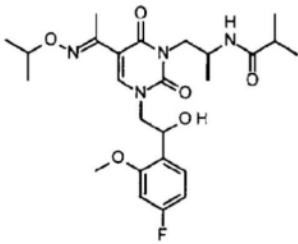
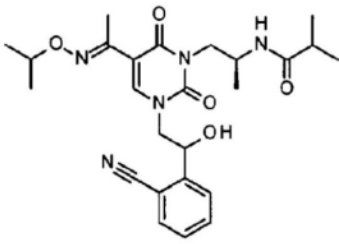
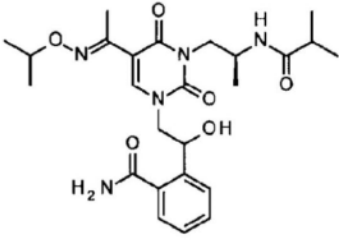
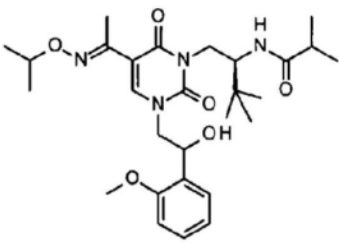
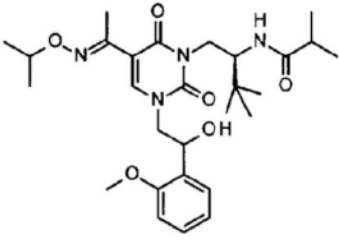
B-2	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.04-1.09(m,6H), 1.22-1.31(m,6H), 2.02-2.25(m,4H), 3.48-3.90(m,5H), 4.11-4.28(m,2H), 5.18-5.65(m,2H), 6.75-6.81(m,1H), 6.89-6.95(m,1H), 7.32-7.38(m,1H).
B-3	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.14-1.62(m,12H), 2.15(s,3H), 2.58-2.62(m,2H), 3.47-4.43(m,11H), 5.15-5.32(m,2H), 6.89-6.93(m,1H), 6.95-6.98(m,1H), 7.19-7.24(m,1H).
B-4	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.33(t,3H), 1.72(d,3H), 2.18(s,3H), 3.68-3.77(m,3H), 3.95(s,3H), 4.25-4.31(m,2H), 5.29-5.38(m,2H), 6.96-6.99(m,1H), 7.21-7.25(m,1H), 7.62-7.65(m,1H).
B-6	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.14-1.16(m,6H), 1.30(t,3H), 1.64(d,3H), 2.13(s,3H), 3.40-3.47(m,1H), 3.89(s,3H), 4.01-4.55(m,5H), 5.05-5.19(m,2H), 6.82-6.85(m,1H), 6.91-6.98(m,1H), 7.06-7.12(m,1H).
B-8	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.20-1.28(m,6H), 2.91-2.97(m,4H), 3.80(s,3H), 3.84(s,3H), 3.94-4.20(m,4H), 6.82-7.24(m,8H), 7.60(s,1H).
B-9	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.20-1.27(m,3H), 2.91-2.96(m,4H), 3.81(s,3H), 3.84(s,3H), 3.95-4.20(m,4H), 6.82-7.24(m,8H), 7.64(s,1H).

[1107] 此外,将通过与前述实施例同样的方法制造的本发明化合物的一部分示于表6。在表中,作为各化合物的物性而将熔点(m.p.)一并示出。另外,在为立体异构体的情况下,示于特别事项中。

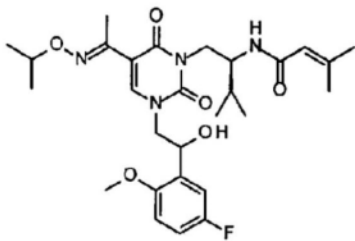
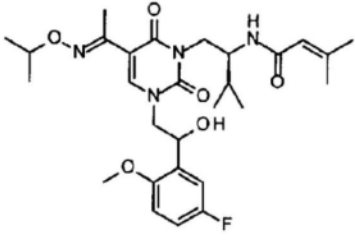
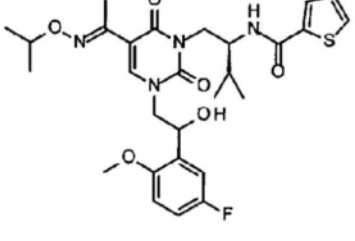
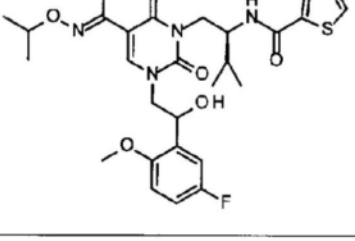
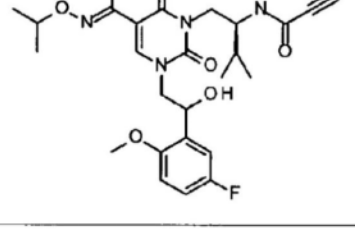
[1108] [表6]

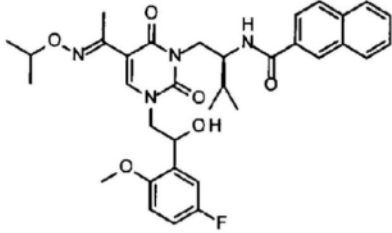
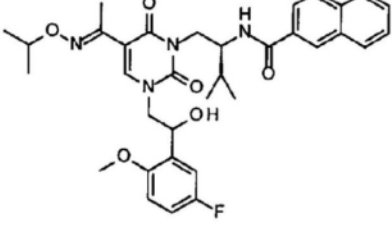
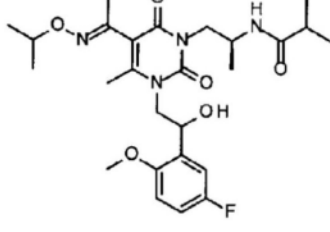
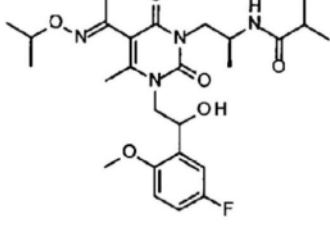
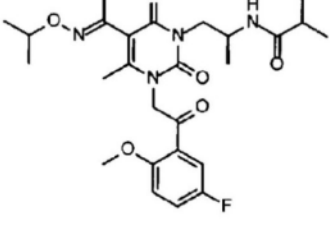
化合物编号	结构式	物性	特别事项
C-1		m.p. 73-75°C	
C-2		m.p. 82-84°C	C-1的异构体
C-3		粘性油	
C-4		粘性油	C-3的异构体
C-5		非晶质	

[1109]

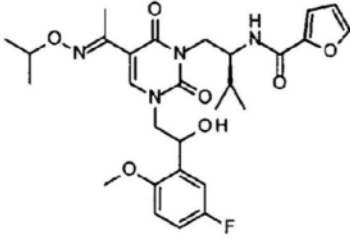
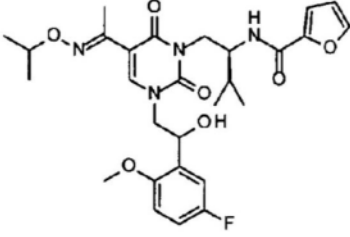
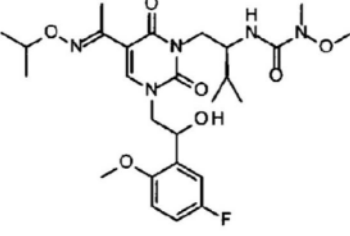
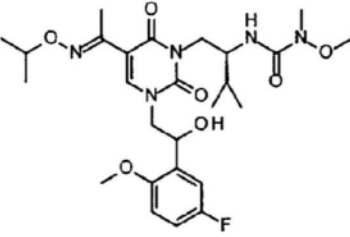
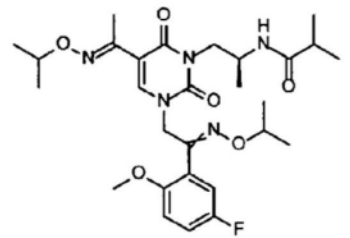
C-6		m.p. 124-126°C	C-5的异构体
C-7		m.p. 182-185°C	
[1110] C-8		粘性油	
C-9		m.p. 72-76°C	
C-10		m.p. 124-126°C	C-9的异构体

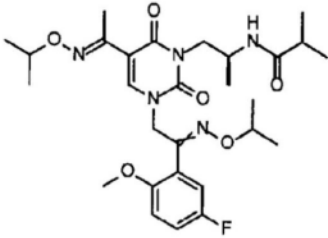
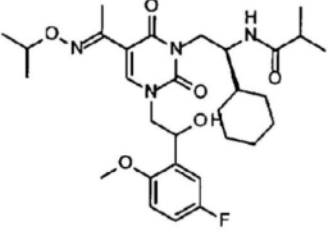
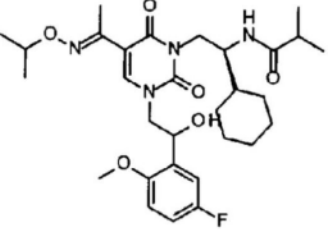
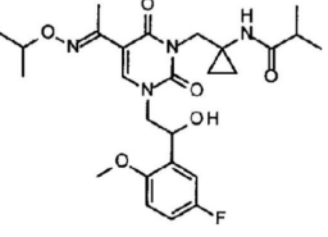
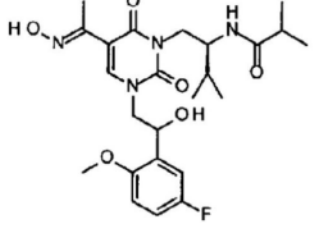
[1111]

C-11		m.p. 68-69°C	
C-12		m.p. 150-153°C	C-11 的异构体
C-13		m.p. 69-70°C	
C-14		m.p. 74-75°C	C-13 的异构体
C-15		m.p. 49-50°C	

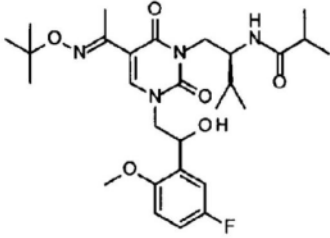
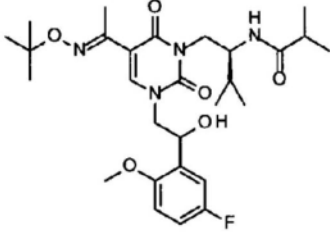
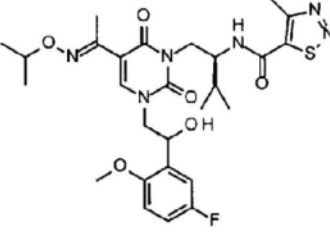
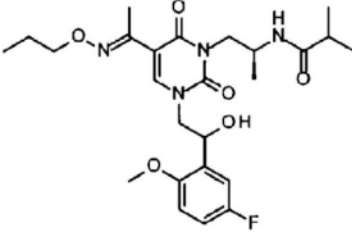
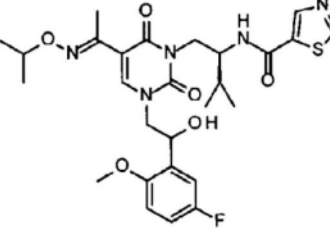
C-16		m.p. 77-78°C	
C-17		m.p. 88-89°C	C-16的异构体
C-18		粘性油	
C-19		非晶质	C-18的异构体
C-20		m.p. 187-189°C	

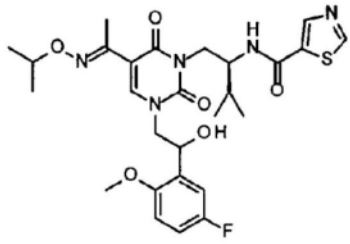
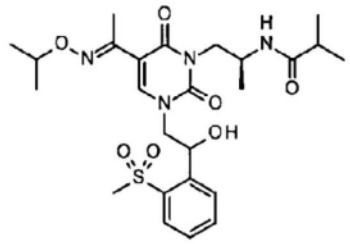
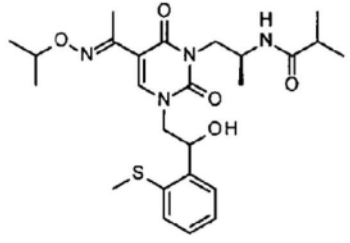
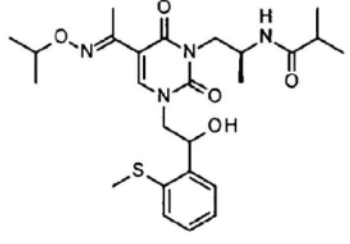
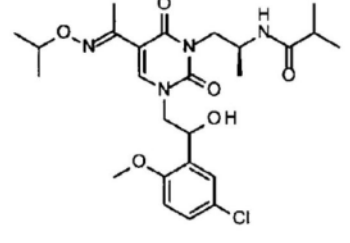
[1112]

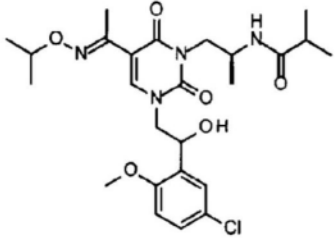
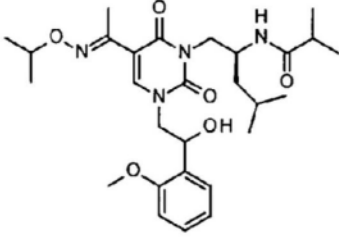
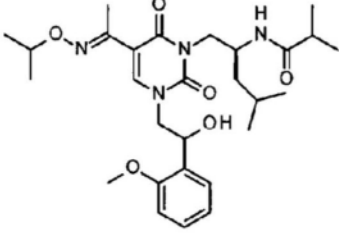
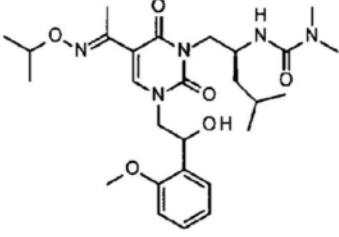
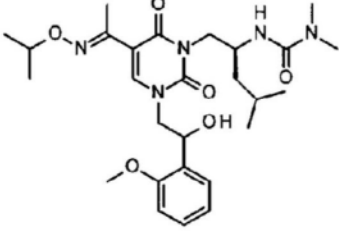
C-21		m.p. 64-65°C	
C-22		m.p. 68-70°C	C-21的异构体
[1113] C-23		m.p. 56-57°C	
C-24		m.p. 44-47°C	C-23的异构体
C-25		m.p. 146-147°C	

C-26		粘性油	C-25 的异构体
C-27		m.p. 142-144°C	
C-28		m.p. 82-85°C	C-27的异构体
C-29		m.p. 70-75°C	
C-30		m.p. 72-73°C	

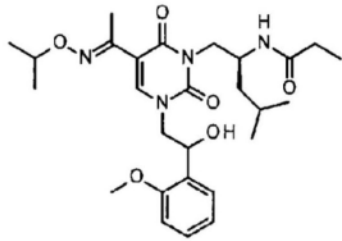
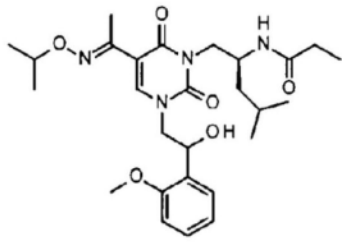
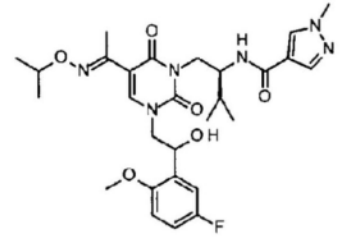
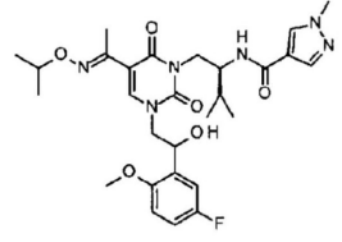
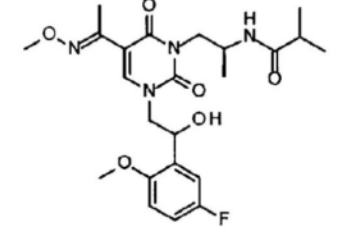
[1114]

C-31		m.p. 76-77°C	
C-32		m.p. 70-72°C	C-31 的异构体
[1115] C-33		m.p. 76-77°C	
C-34		m.p. 61-62°C	
C-35		m.p. 75-78°C	

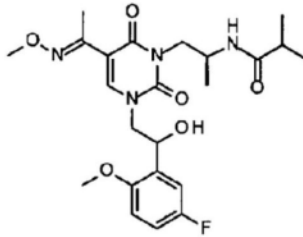
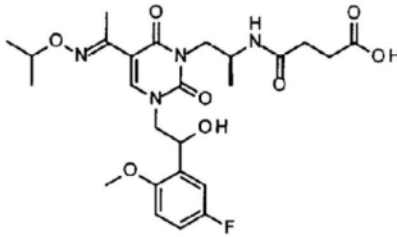
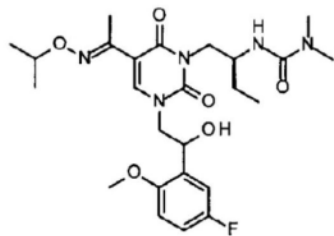
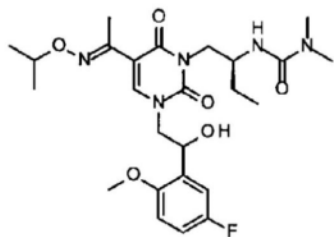
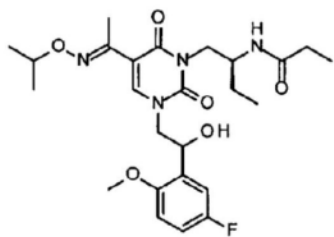
C-36		m.p. 89-90°C	C-35 的异构体
C-37		粘性油	
[1116] C-38		m.p. 109-111°C	
C-39		m.p. 76-79°C	C-38 的异构体
C-40		非晶质	

C-41		m.p. 126-129°C	C-40 的异构体
C-42		粘性油	
[1117] C-43		非晶质	C-42的异构体
C-44		粘性油	
C-45		粘性油	C-44的异构体

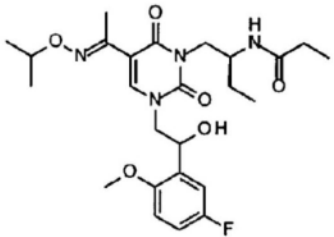
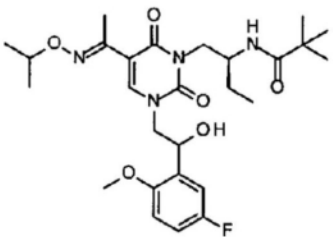
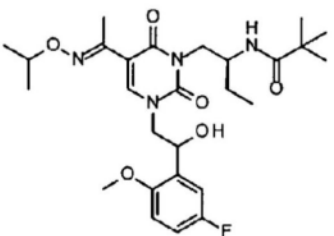
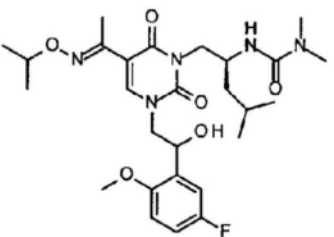
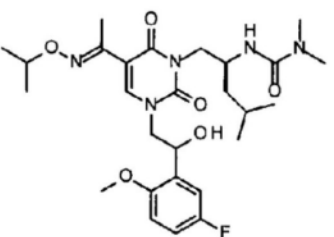
[1118]

C-46		非晶质	
C-47		m.p. 72-74°C	C-46的异构体
C-48		m.p. 85-86°C	
C-49		m.p. 80-82°C	C-48的异构体
C-50		m.p. 70-74°C	

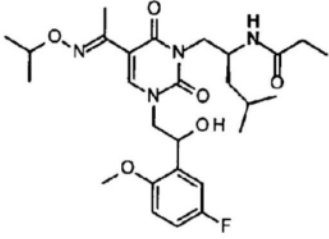
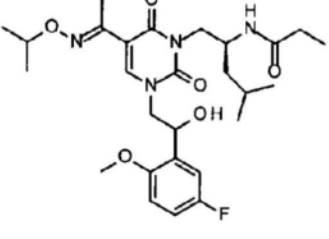
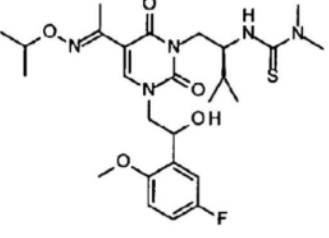
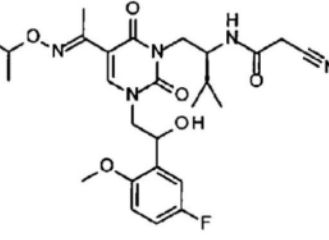
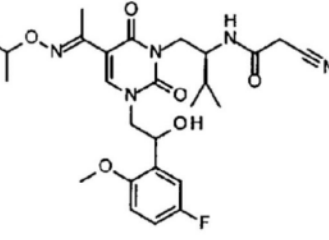
[1119]

C-51		m.p. 137-139°C	C-50的异构体
C-52		m.p. 178-179°C	
C-53		非晶质	
C-54		m.p. 83-85°C	C-53的异构体
C-55		粘性油	

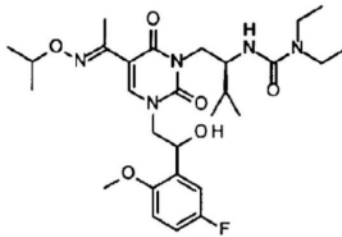
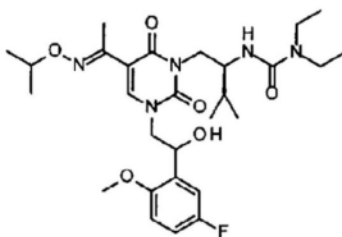
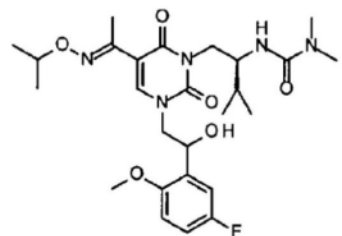
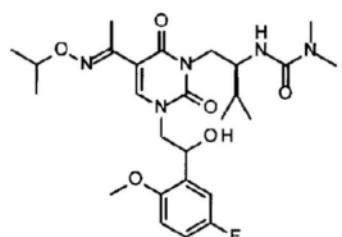
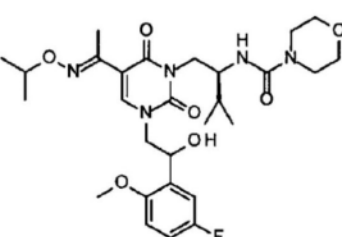
[1120]

C-56		m.p. 129-130°C	C-55的异构体
C-57		m.p. 63-66°C	
C-58		m.p. 68-71°C	C-57的异构体
C-59		非晶质	
C-60		粘性油	C-59的异构体

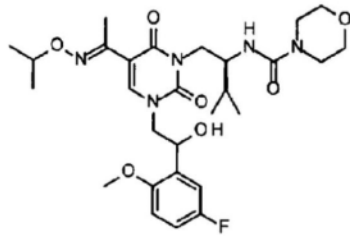
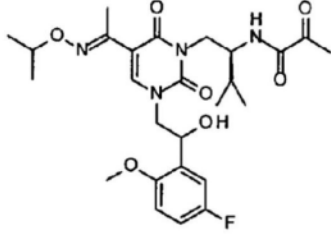
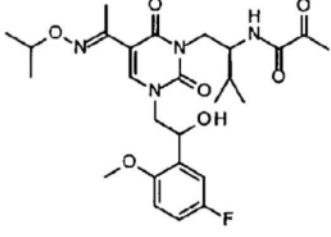
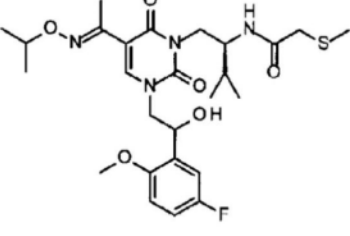
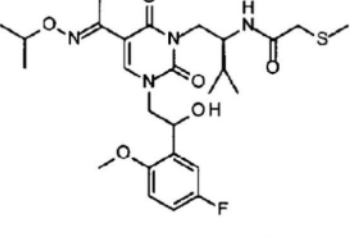
[1121]

C-61		非晶质	
C-62		m.p. 137-142°C	C-61的异构体
C-63		m.p. 56-57°C	
C-64		m.p. 66-67°C	
C-65		m.p. 61-63°C	C-64的异构体

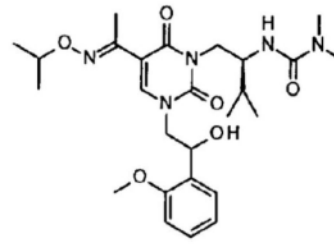
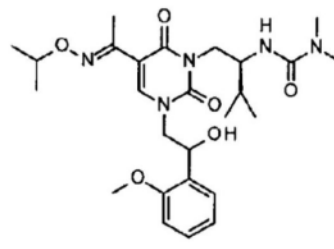
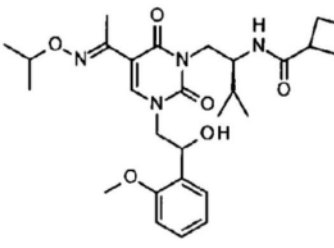
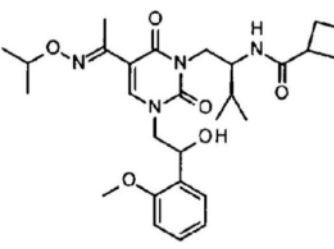
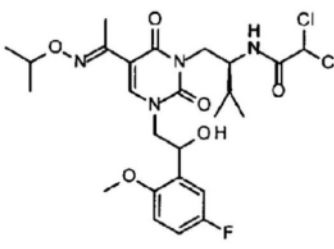
[1122]

C-66		m.p. 70-78°C	
C-67		m.p. 105-106°C	C-66的异构体
C-68		m.p. 80-81°C	
C-69		m.p. 144-146°C	C-68的异构体
C-70		m.p. 75-76°C	

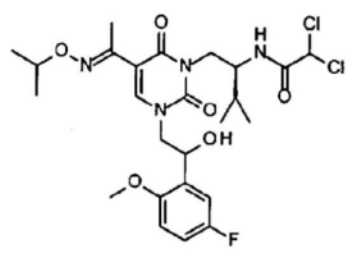
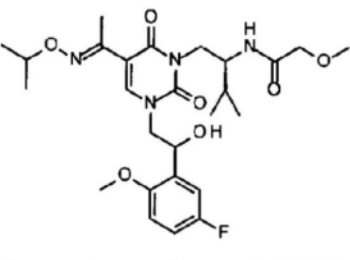
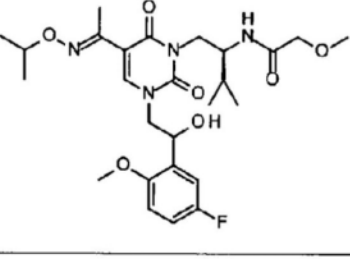
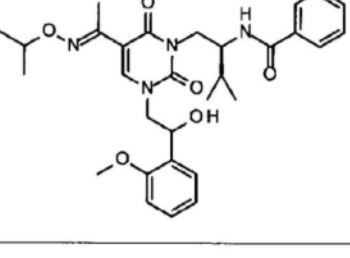
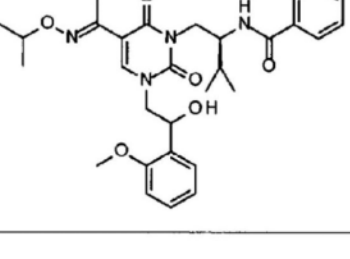
[1123]

C-71		m.p. 71-75°C	C-70的异构体
C-72		m.p. 51-52°C	
C-73		m.p. 66-69°C	C-72的异构体
C-74		m.p. 52-53°C	
C-75		m.p. 64-65°C	C-74的异构体

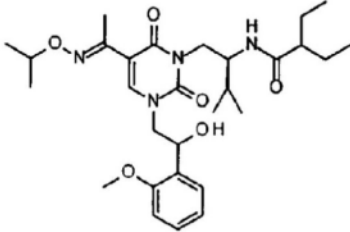
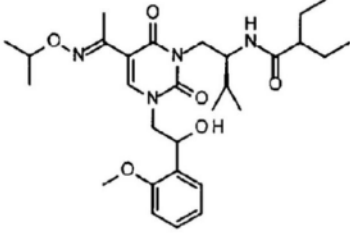
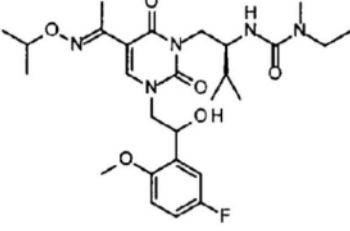
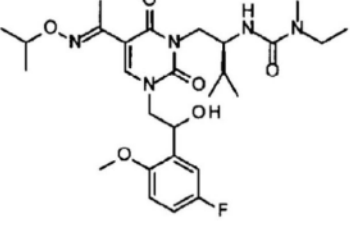
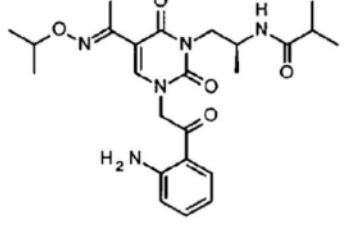
[1124]

C-76		粘性油	
C-77		粘性油	C-76的异构体
C-78		非晶质	
C-79		m.p. 129-131°C	C-78的异构体
C-80		m.p. 60-63°C	

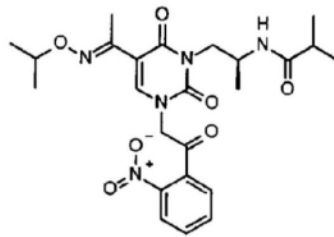
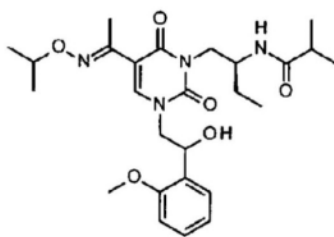
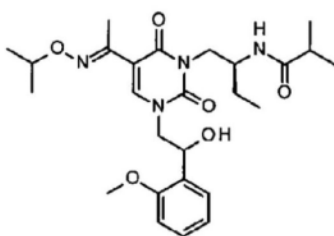
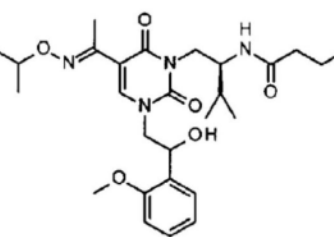
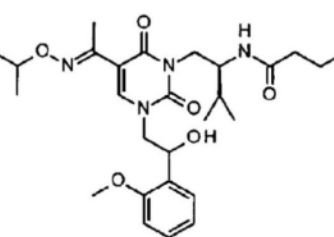
[1125]

C-81		m.p. 64-67°C	C-80 的异构体
C-82		m.p. 59-60°C	
C-83		m.p. 55-57°C	C-82 的异构体
C-84		m.p. 160-162°C	
C-85		粘性油	C-84 的异构体

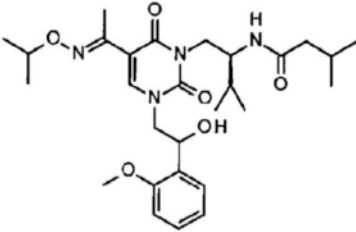
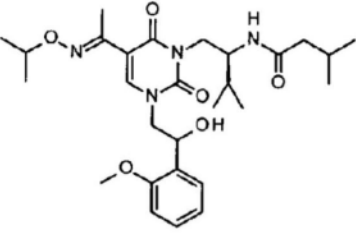
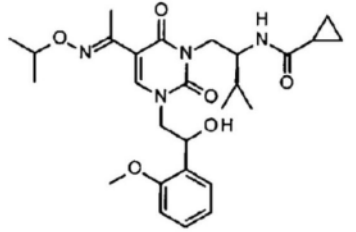
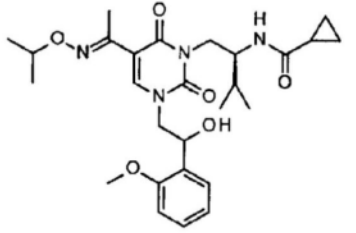
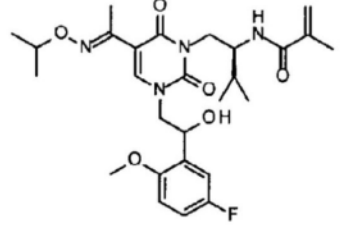
[1126]

C-86		m.p. 165-167°C	
C-87		非晶质	C-86 的异构体
C-88		m.p. 60-63°C	
C-89		m.p. 126-130°C	C-88 的异构体
C-90		m.p. 91-96°C	

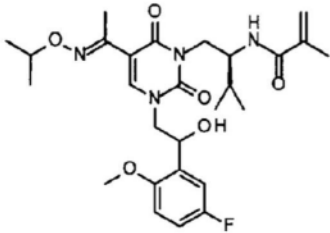
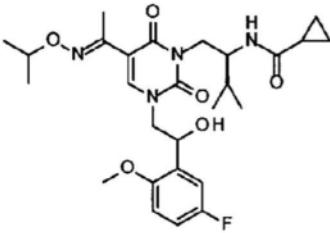
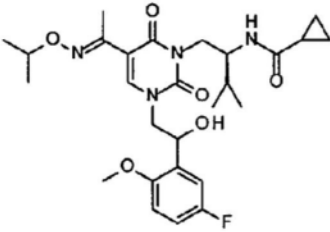
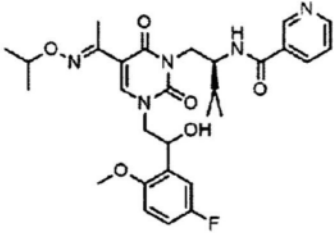
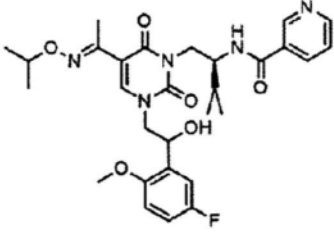
[1127]

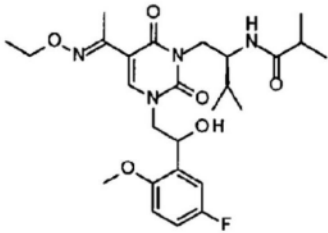
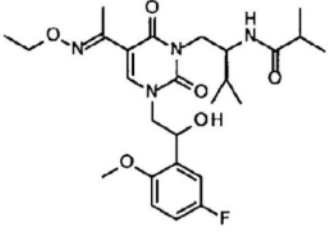
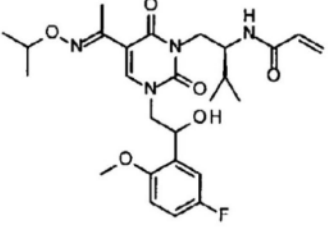
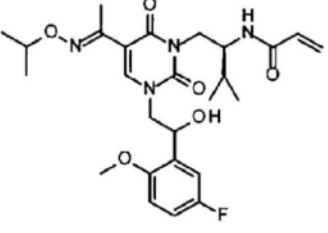
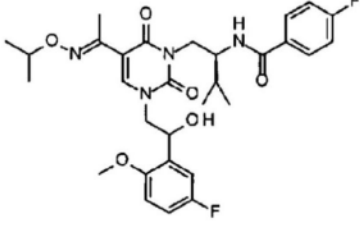
C-91		m.p. 202-203°C	
C-92		m.p. 121-122°C	
C-93		m.p. 130-131°C	C-92 的异构体
C-94		粘性油	
C-95		粘性油	C-94 的异构体

[1128]

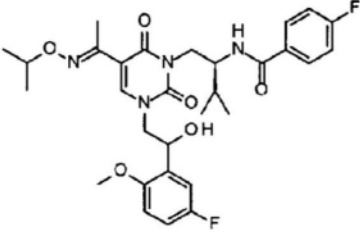
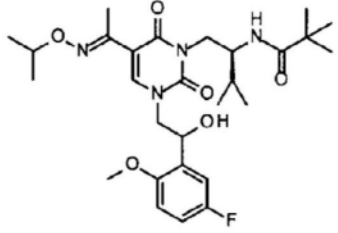
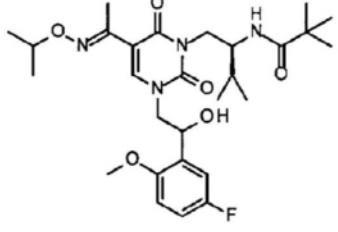
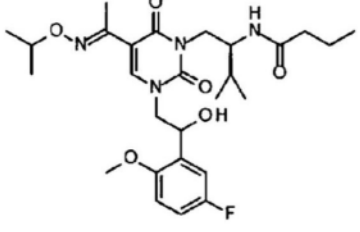
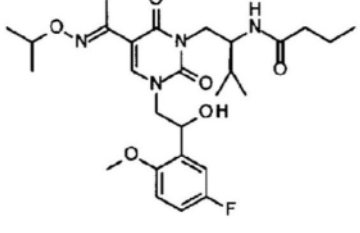
C-96		m.p. 133-135°C	
C-97		非晶质	C-96 的异构体
C-98		m.p. 139-141°C	
C-99		m.p. 132-134°C	C-98 的异构体
C-100		m.p. 70-72°C	

[1129]

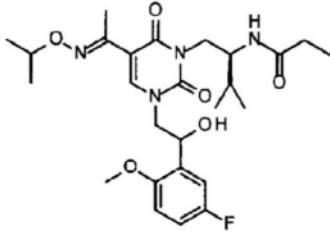
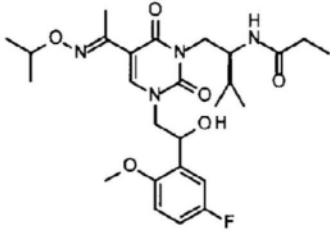
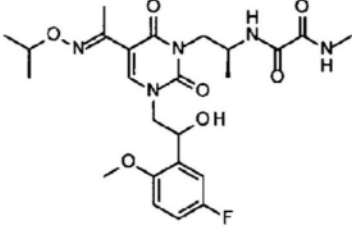
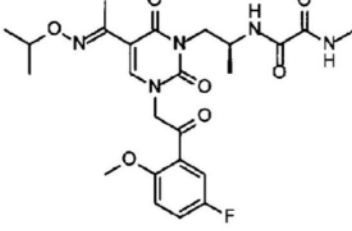
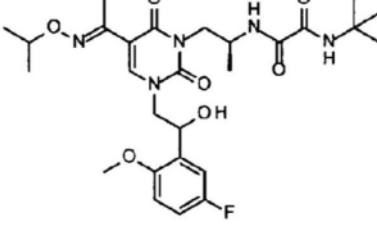
C-101		m.p. 129-130°C	C-100 的 异构体
C-102		m.p. 82-83°C	
C-103		m.p. 84-86°C	C-102 的 异构体
C-104		m.p. 77-79°C	
C-105		m.p. 77-78°C	C-104 的 异构体

C-106		m.p. 71-73°C	
C-107		m.p. 67-68°C	C-106 的 异构体
C-108		m.p. 85-86°C	
C-109		m.p. 88-89°C	C-108 的 异构体
C-110		m.p. 75-76°C	

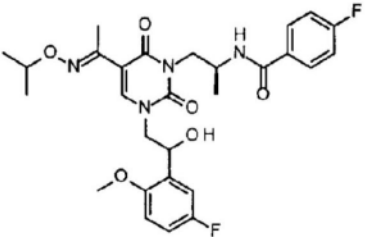
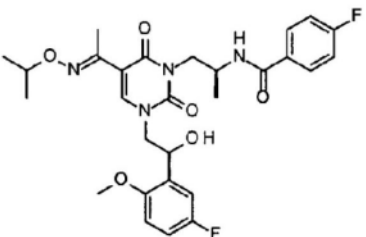
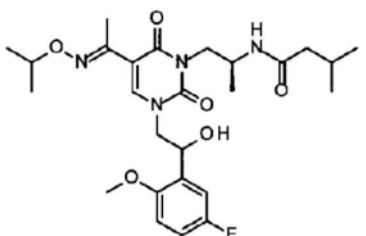
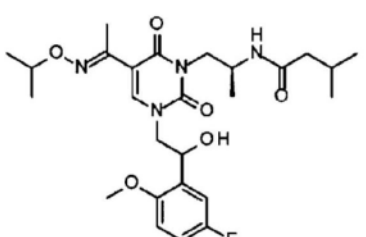
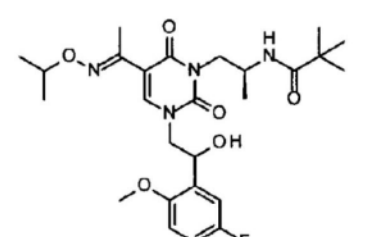
[1130]

C-111		m.p. 80-81°C	C-110 的 异构体
C-112		m.p. 69-70°C	
[1131] C-113		m.p. 70-73°C	C-112 的 异构体
C-114		m.p. 56-57°C	
C-115		m.p. 128-129°C	C-114 的 异构体

[1132]

C-116		m.p. 62-63°C	
C-117		m.p. 76-77°C	C-116 的 异构体
C-118		m.p. 91-92°C	
C-119		m.p. 171-172°C	
C-120		m.p. 72-73°C	

[1133]

C-121		m.p. 73-75°C	
C-122		m.p. 92-93°C	C-121 的 异构体
C-123		m.p. 65-68°C	
C-124		m.p. 69-71°C	C-123 的 异构体
C-125		m.p. 81-82°C	

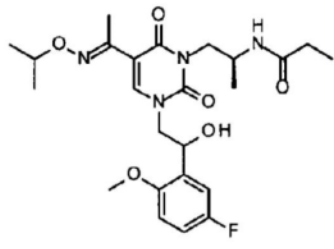
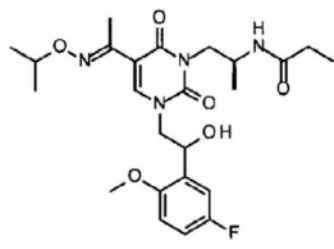
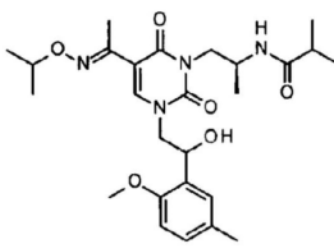
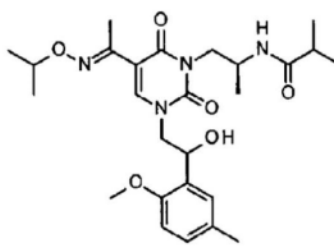
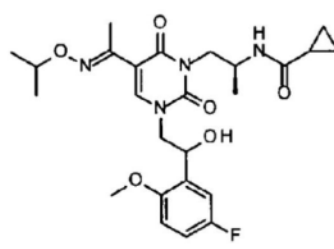
[1134]

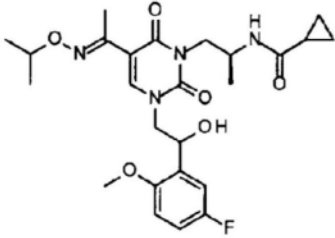
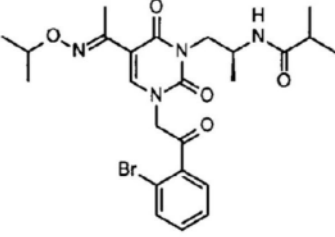
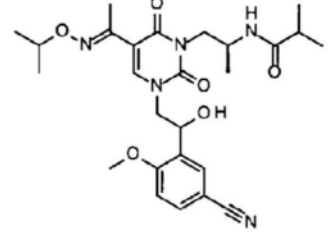
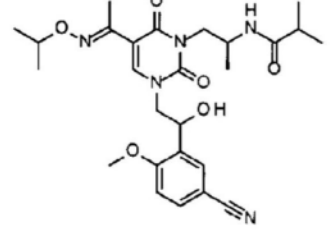
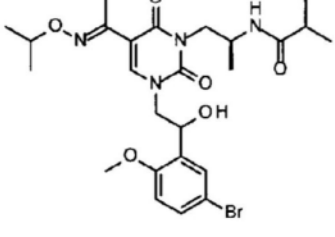
C-126		m.p. 83-84°C	C-125 的 异构体
C-127		非晶质	
C-128		粘性油	
C-129		粘性油	C-128 的 异构体
C-130		非晶质	

[1135]

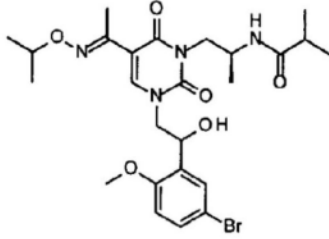
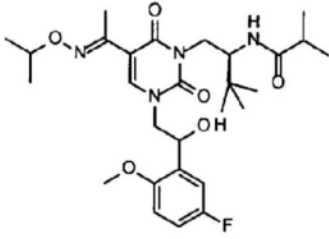
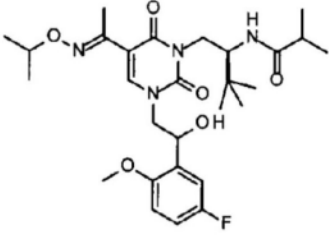
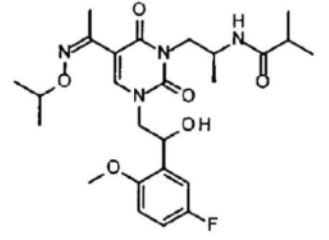
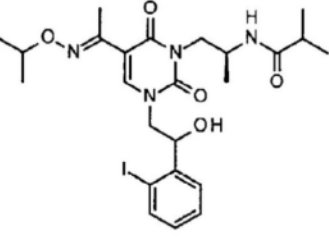
C-131		粘性油	C-130 的 异构体
C-132		粘性油	
C-133		粘性油	C-132 的 异构体
C-134		m.p. 83-86°C	
C-135		m.p. 126-129°C	C-134 的 异构体

[1136]

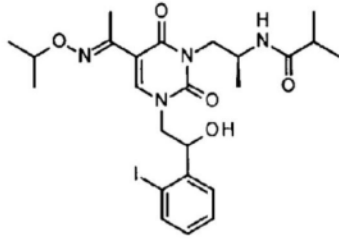
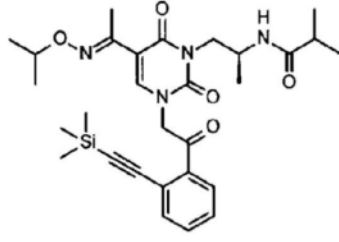
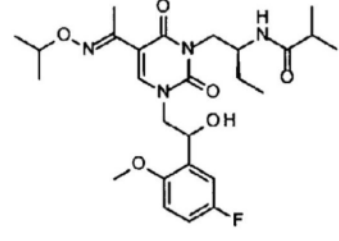
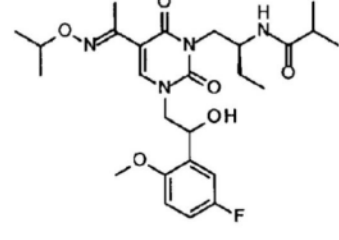
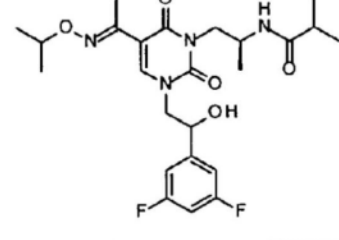
C-136		粘性油	
C-137		m.p. 140-141°C	C-136 的 异构体
C-138		m.p. 76-79°C	
C-139		m.p. 81-83°C	C-138 的 异构体
C-140		m.p. 81-84°C	

C-141		m.p. 131-132°C	C-140 的 异构体
C-142		m.p. 163-164°C	
[1137] C-143		m.p. 113-117°C	
C-144		m.p. 148-149°C	C-143 的 异构体
C-145		m.p. 82-83°C	

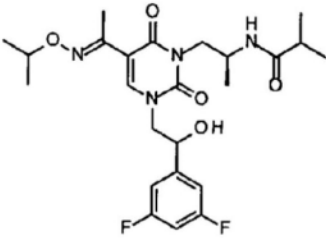
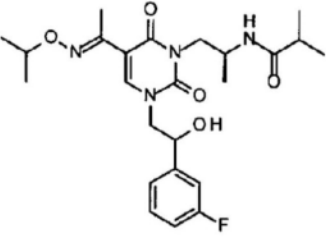
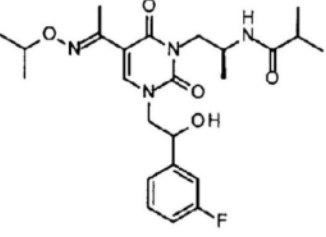
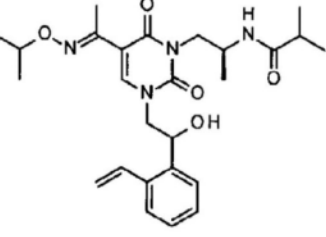
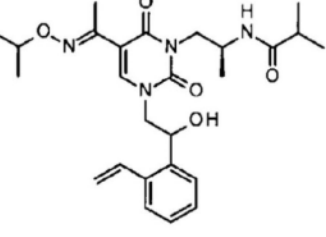
[1138]

C-146		m.p. 129-130°C	C-145 的 异构体
C-147		m.p. 70-71°C	
C-148		m.p. 111-112°C	C-147 的 异构体
C-149		粘性油	
C-150		m.p. 120-121°C	

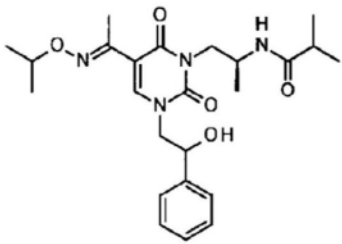
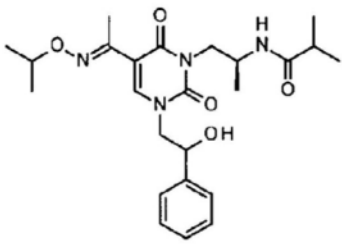
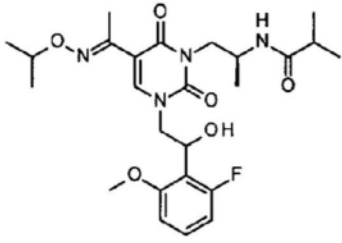
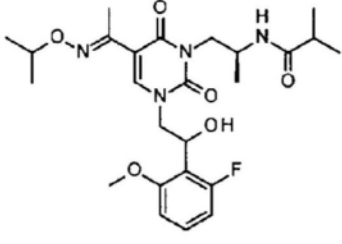
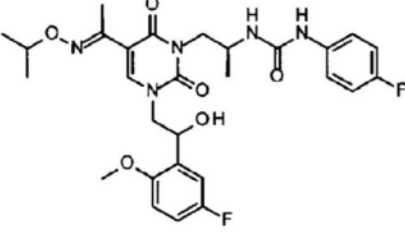
[1139]

C-151		m.p. 100-101°C	C-150 的 异构体
C-152		m.p. 72-73°C	
C-153		粘性油	
C-154		m.p. 120-121°C	C-153 的 异构体
C-155		m.p. 154-155°C	

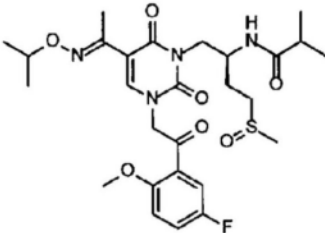
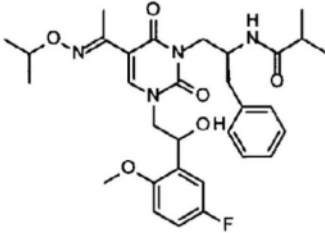
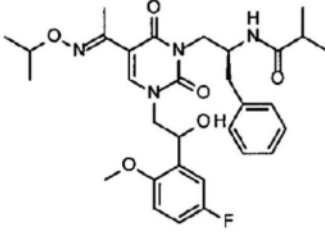
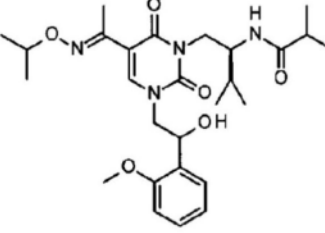
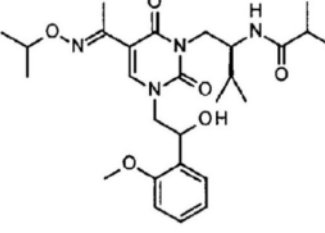
[1140]

C-156		m.p. 93-94°C	C-155 的 异构体
C-157		m.p. 156-157°C	
C-158		m.p. 97-98°C	C-157 的 异构体
C-159		m.p. 157-158°C	
C-160		m.p. 134-135°C	C-159 的 异构体

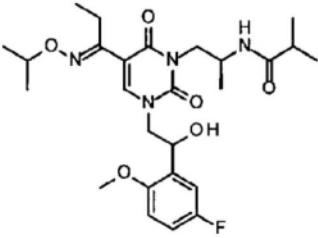
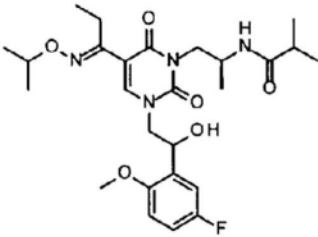
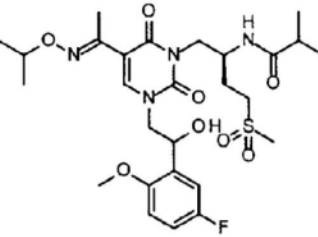
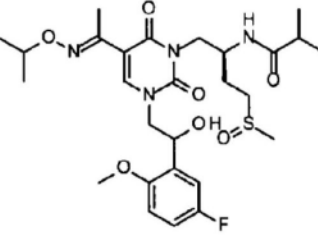
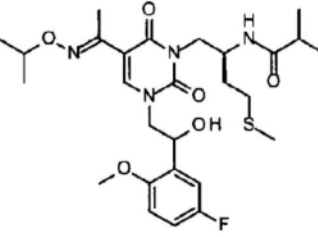
[1141]

C-161		m.p. 161-162°C	
C-162		m.p. 120-121°C	C-161 的 异构体
C-163		粘性油	
C-164		粘性油	C-163 的 异构体
C-165		m.p. 97-99°C	

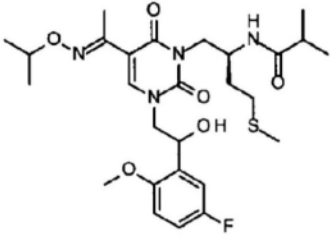
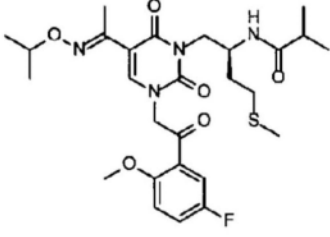
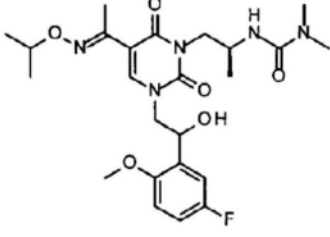
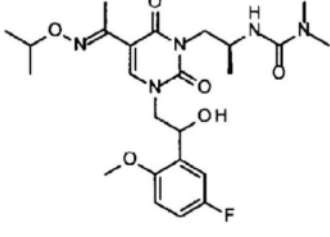
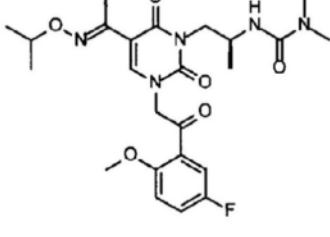
[1142]

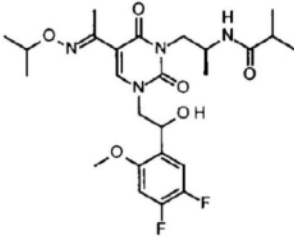
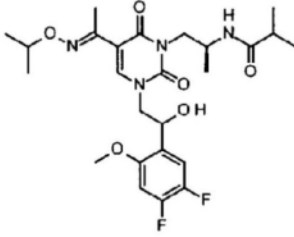
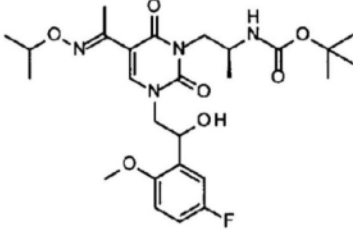
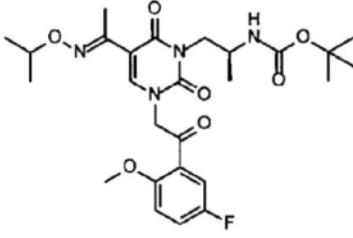
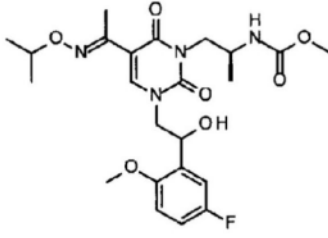
C-166		m.p. 123-125°C	
C-167		m.p. 78-81°C	
C-168		m.p. 96-100°C	C-167 的 异构体
C-169		m.p. 145-146°C	
C-170		m.p. 86-88°C	C-169 的 异构体

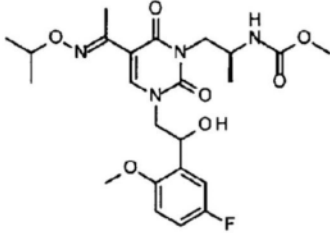
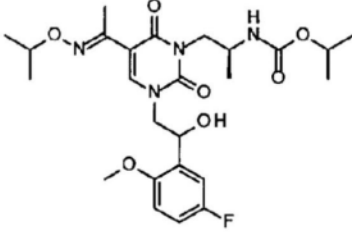
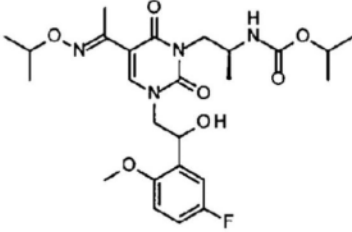
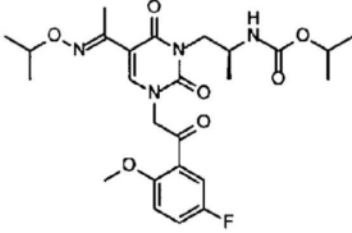
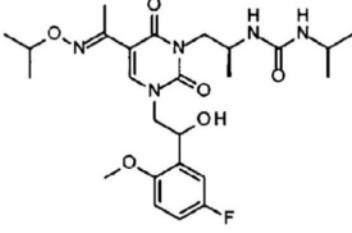
[1143]

C-171		m.p. 70-71°C	
C-172		m.p. 69-70°C	C-171 的 异构体
C-173		m.p. 82-85°C	
C-174		m.p. 78-81°C	
C-175		m.p. 119-120°C	

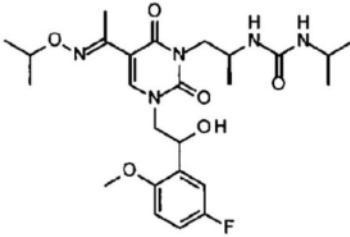
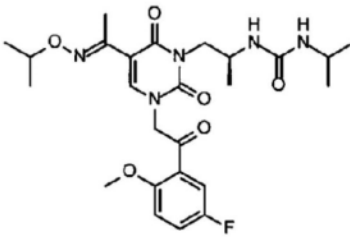
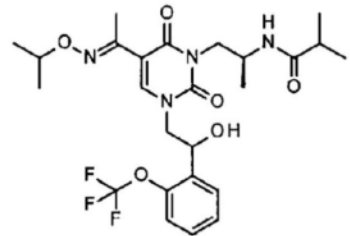
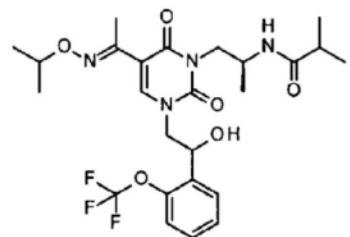
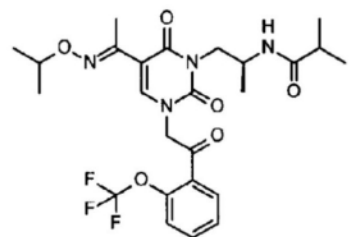
[1144]

C-176		m.p. 104-108°C	C-175 的 异构体
C-177		m.p. 100-101°C	
C-178		m.p. 71-72°C	
C-179		m.p. 83-84°C	C-178 的 异构体
C-180		m.p. 73-74°C	

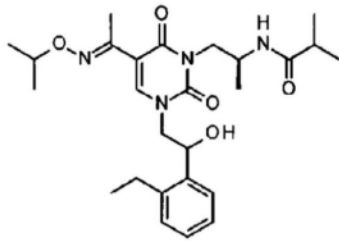
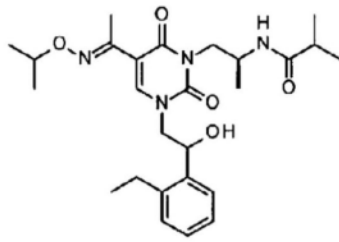
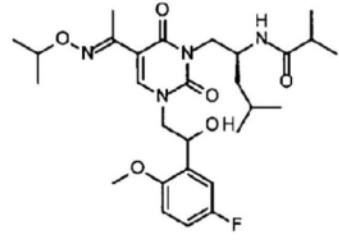
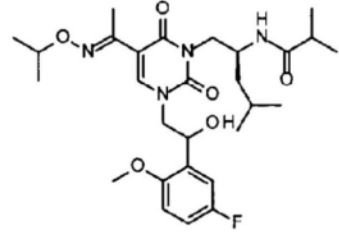
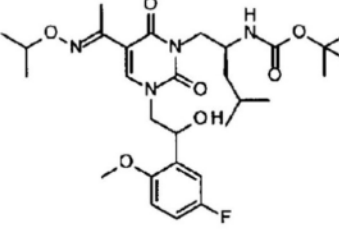
C-181		m.p. 72-73°C	
C-182		m.p. 81-82°C	C-181 的 异构体
[1145] C-183		粘性油	
C-184		m.p. 138-139°C	
C-185		粘性油	

C-186		m.p. 117-118°C	C-185 的 异构体
C-187		粘性油	
[1146] C-188		粘性油	C-187 的 异构体
C-189		m.p. 118-119°C	
C-190		m.p. 89-90°C	

[1147]

C-191		m.p. 176-177°C	C-190 的 异构体
C-192		m.p. 162-163°C	
C-193		粘性油	
C-194		m.p. 105-110°C	C-193 的 异构体
C-195		m.p. 159-160°C	

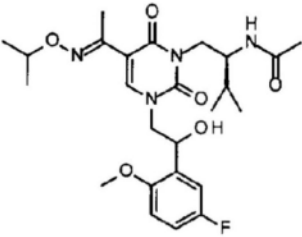
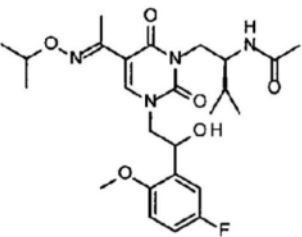
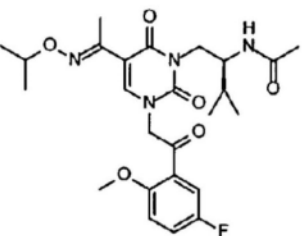
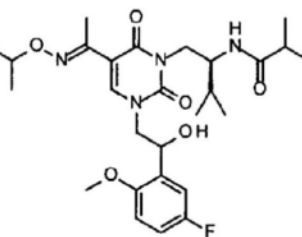
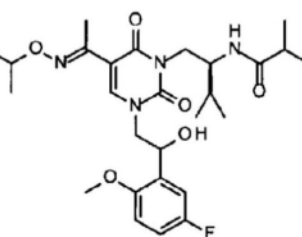
[1148]

C-196		m.p. 147-148°C	
C-197		粘性油	C-196 的 异构体
C-198		粘性油	
C-199		粘性油	C-198 的 异构体
C-200		粘性油	

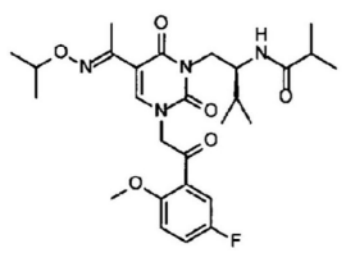
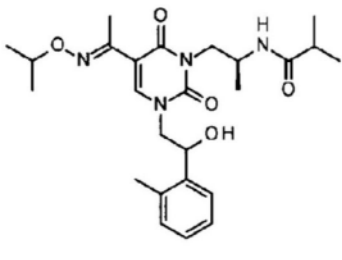
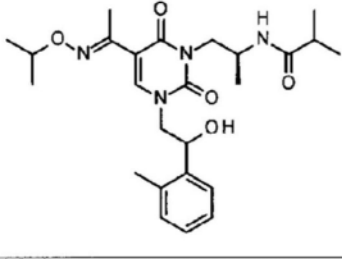
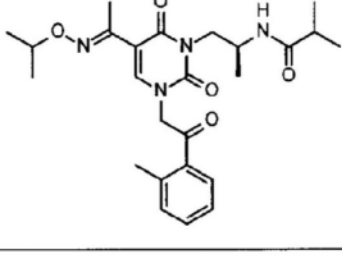
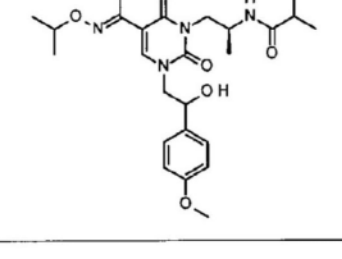
[1149]

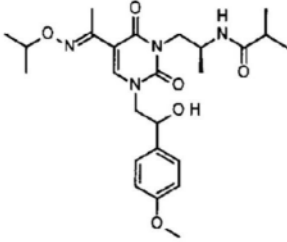
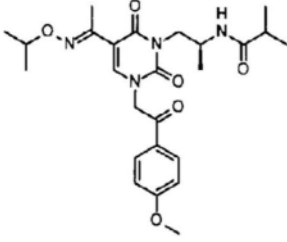
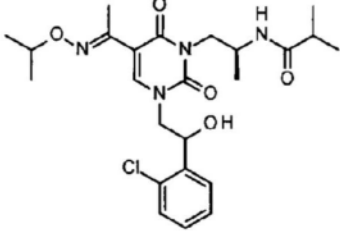
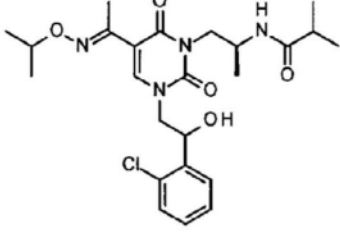
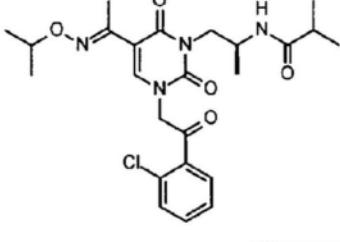
C-201		m.p. 81-85°C	
C-202		m.p. 161-162°C	C-201 的 异构体
C-203		m.p. 101-102°C	
C-204		粘性油	C-203 的 异构体
C-205		m.p. 95-99°C	

[1150]

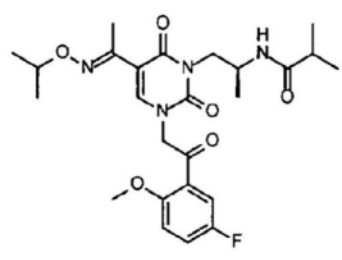
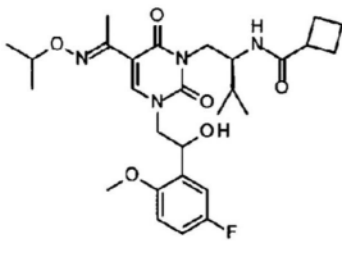
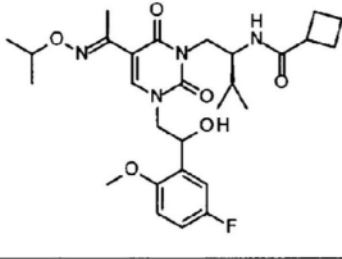
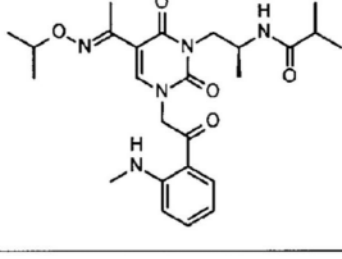
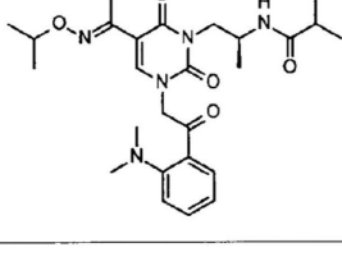
C-206		粘性油	
C-207		m.p. 73-74°C	C-206 的 异构体
C-208		m.p. 147-148°C	
C-209		粘性油	
C-210		m.p. 91-92°C	C-209 的 异构体

[1151]

C-211		m.p. 131-132°C	
C-212		m.p. 176-177°C	
C-213		m.p. 89-90°C	C-212 的 异构体
C-214		m.p. 150-151°C	
C-215		m.p. 117-118°C	

C-216		m.p. 75-76°C	C-215 的 异构体
C-217		m.p. 68-70°C	
[1152] C-218		m.p. 176-177°C	
C-219		m.p. 123-124°C	C-218 的 异构体
C-220		m.p. 142-143°C	

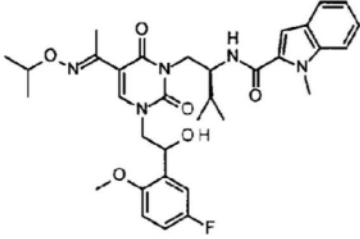
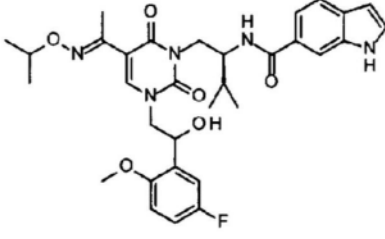
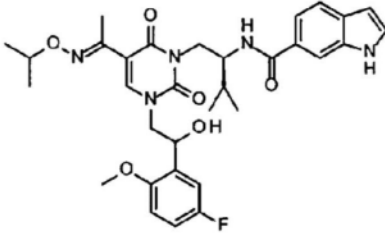
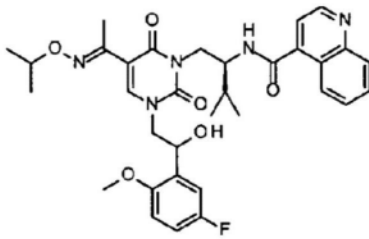
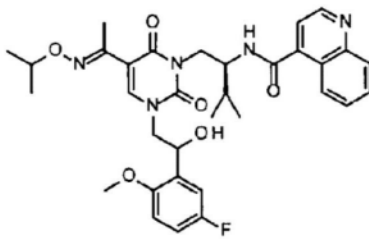
[1153]

C-221		m.p. 129-130°C	
C-222		m.p. 66-67°C	
C-223		m.p. 70-71°C	C-222 的 异构体
C-224		m.p. 197-201°C	
C-225		m.p. 157-163°C	

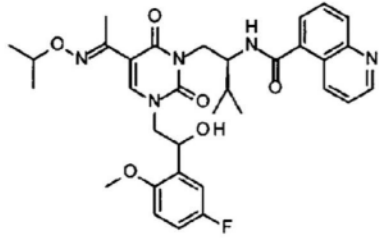
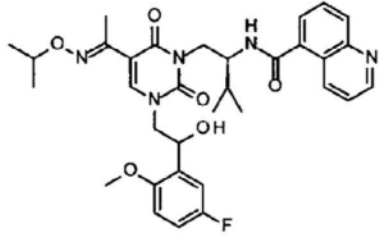
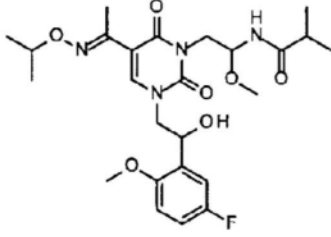
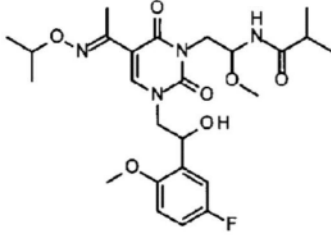
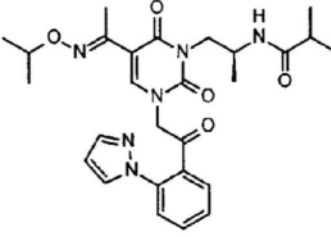
[1154]

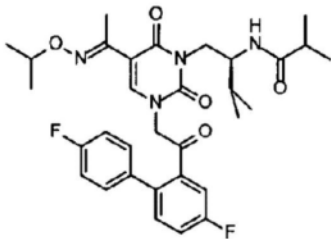
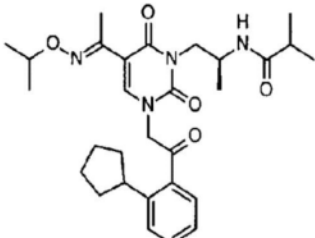
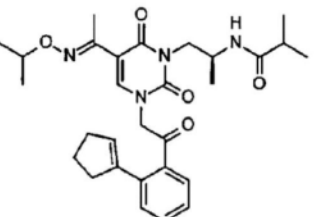
C-226		m.p. 78-80°C	
C-227		m.p. 53-56°C	
C-228		m.p. 88-90°C	
C-229		m.p. 92-94°C	C-228 的 异构体
C-230		m.p. 57-58°C	

[1155]

G-231		m.p. 127-128°C	
G-232		m.p. 97-98°C	
G-233		m.p. 90-92°C	G-232 的 异构体
G-234		m.p. 120-122°C	
G-235		m.p. 101-102°C	G-234 的 异构体

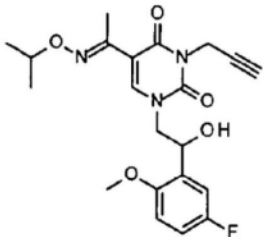
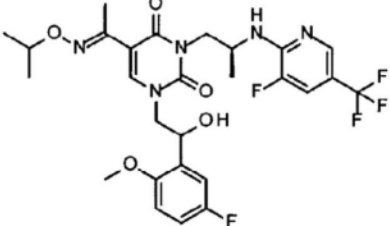
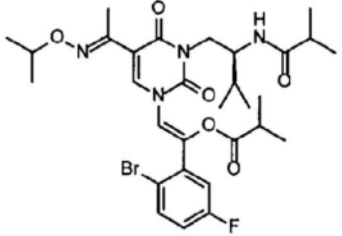
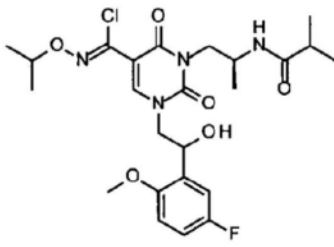
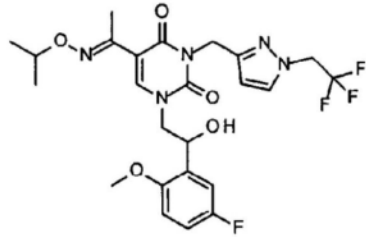
[1156]

C-236		m.p. 124-125°C	
C-237		m.p. 116-117°C	C-236 的 异构体
C-238		m.p. 97-100°C	
C-239		m.p. 89-91°C	C-238 的 异构体
C-240		m.p. 206-210°C	

C-241		m.p. 179-180°C	
[1157] C-242		粘性油	
C-243		粘性油	

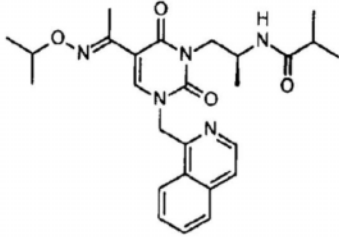
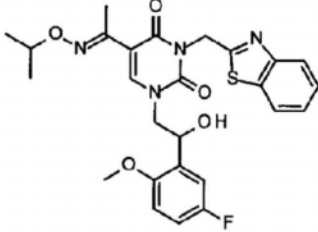
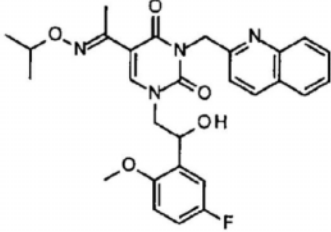
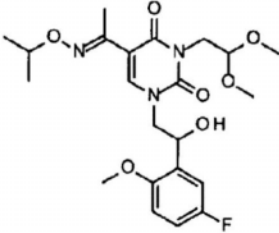
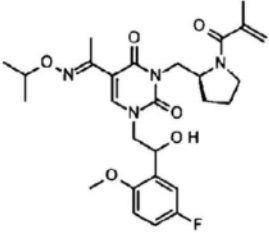
[1158] 此外,将通过与前述实施例同样的方法制造的本发明化合物的一部分示于表7。在表中,作为各化合物的物性而将熔点(m.p.)一并示出。另外,在为立体异构体的情况下,示于特别事项中。

[1159] [表7]

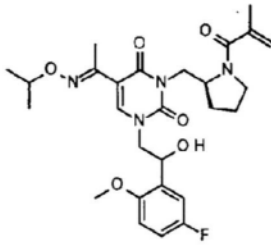
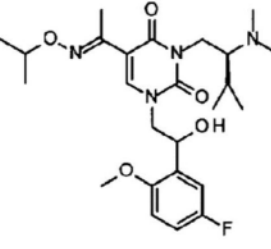
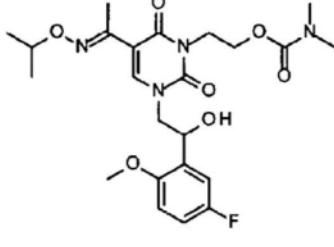
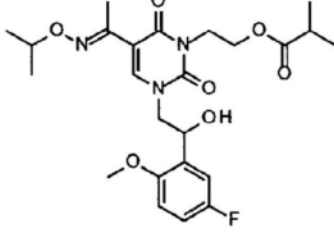
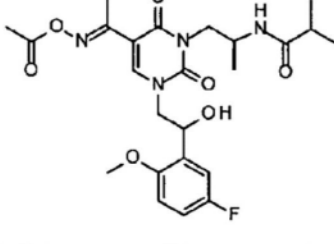
化合物编号	结构式	物性	特别事项
D-1		m.p. 127-131°C	
D-2		粘性油	
D-3		粘性油	
D-4		m.p. 69-74°C	
D-5		非晶质	

[1160]

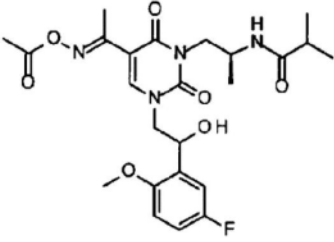
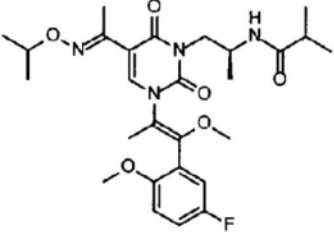
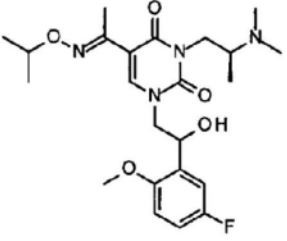
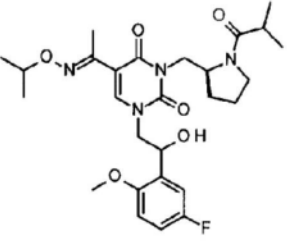
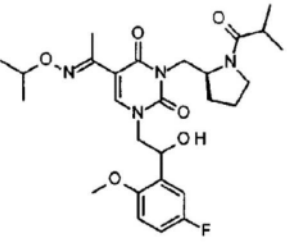
[1161]

D-6		m.p. 174-175°C	
D-7		m.p. 97-99°C	
D-8		m.p. 93-95°C	
D-9		粘性油	
D-10		m.p. 53-56°C	

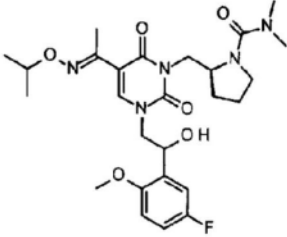
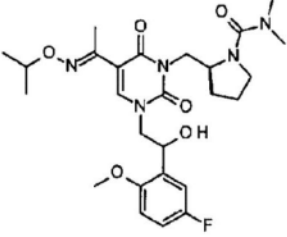
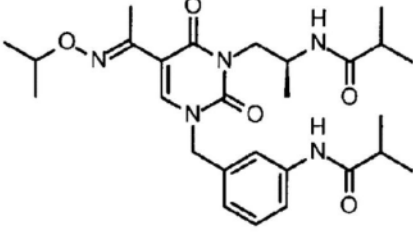
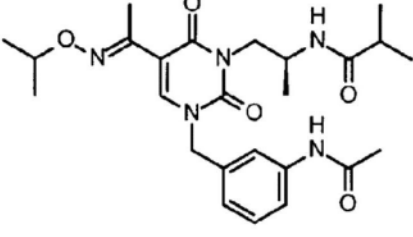
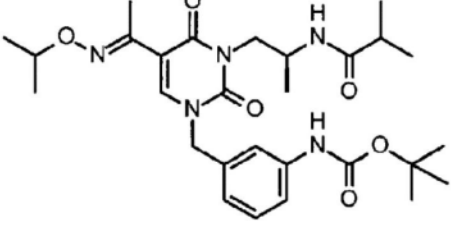
[1162]

D-11		m.p. 62-63°C	D-10的异构体
D-12		非晶质	
D-13		粘性油	
D-14		粘性油	
D-15		m.p. 87-88°C	

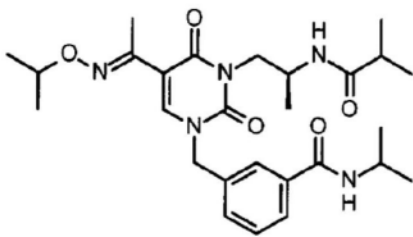
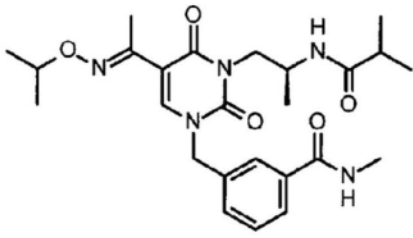
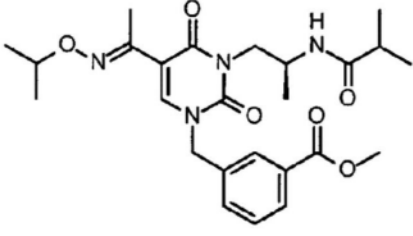
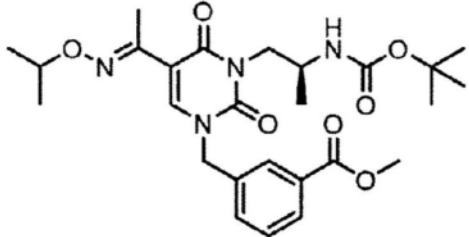
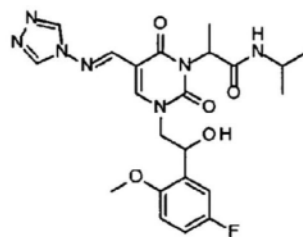
[1163]

D-16		m.p. 90-91°C	D-15的异构体
D-17		m.p. 60-61°C	
D-18		非晶质	
D-19		非晶质	
D-20		非晶质	D-19的异构体

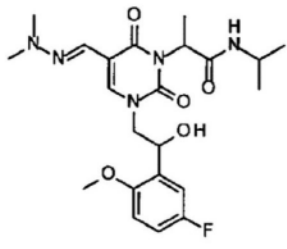
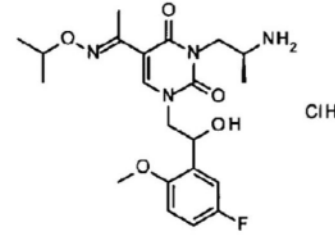
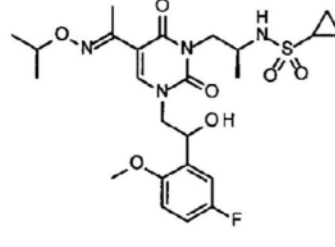
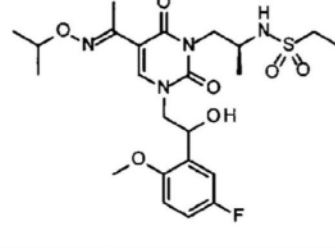
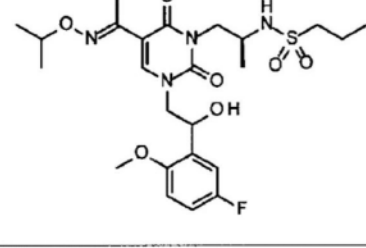
[1164]

D-21		m.p. 65-66°C	
D-22		m.p. 69-70°C	D-21的异构体
D-23		m.p. 190-191°C	
D-24		m.p. 117-119°C	
D-25		m.p. 125-126°C	

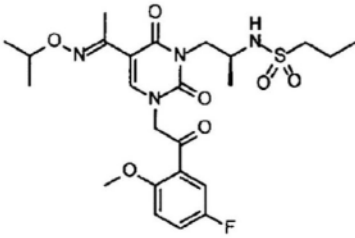
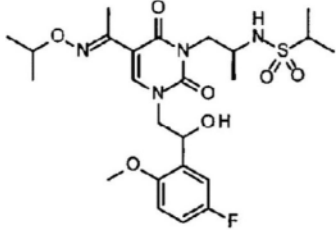
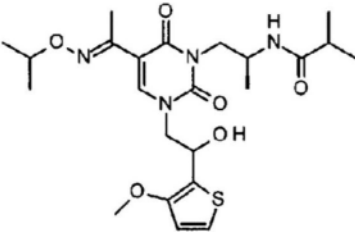
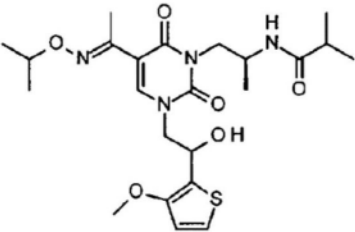
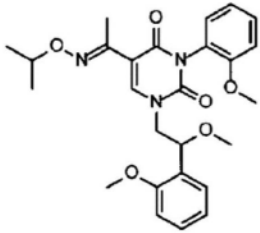
[1165]

D-26		m.p. 219-220°C	
D-27		m.p. 106-113°C	
D-28		m.p. 151-152°C	
D-29		粘性油	
D-30		m.p. 274-275°C	

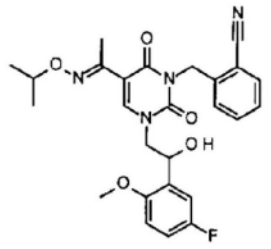
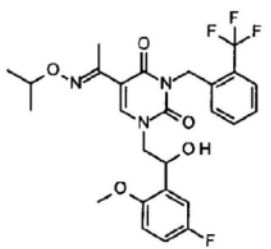
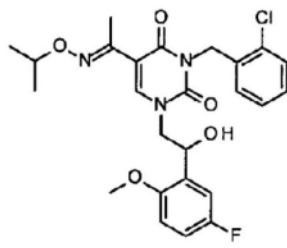
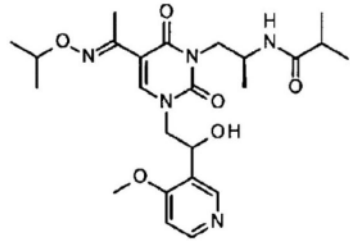
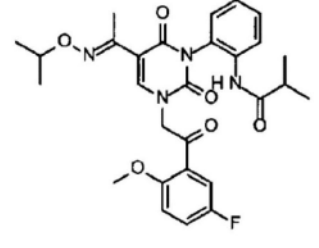
[1166]

D-31		m.p. 67-68°C	
D-32		m.p. 191-192°C	
D-33		m.p. 69-73°C	
D-34		m.p. 62-65°C	
D-35		粘性油	

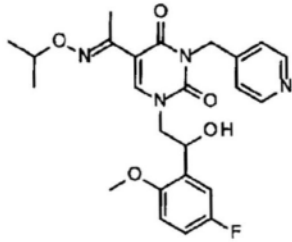
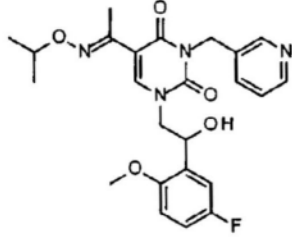
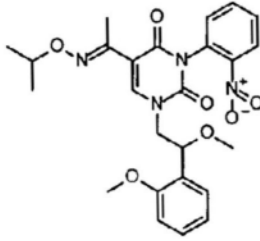
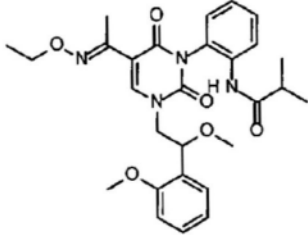
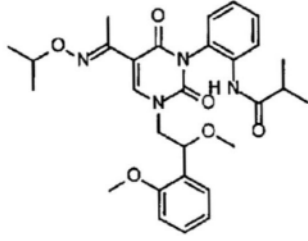
[1167]

D-36		m.p. 97-98°C	
D-37		粘性油	
D-38		m.p. 71-72°C	
D-39		m.p. 77-78°C	D-38 的异构体
D-40		非晶质	

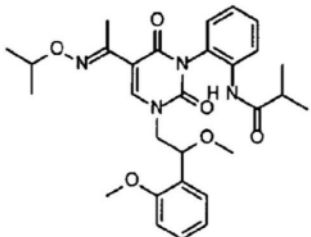
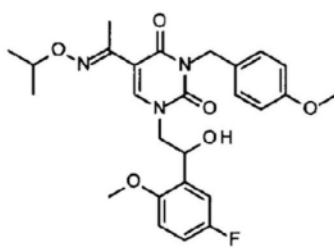
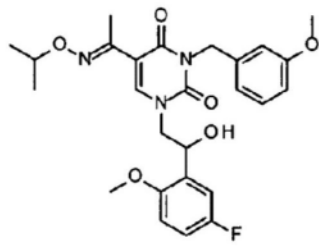
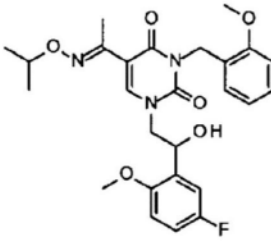
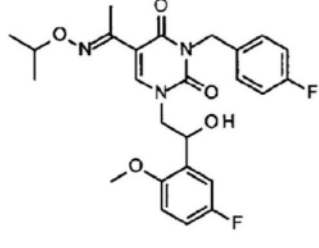
[1168]

D-41		m.p. 153-154°C	
D-42		m.p. 162-163°C	
D-43		m.p. 155-156°C	
D-44		m.p. 86-92°C	
D-45		m.p. 63-65°C	

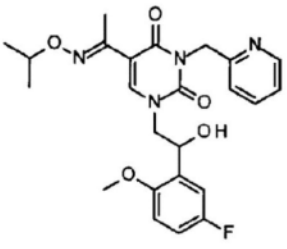
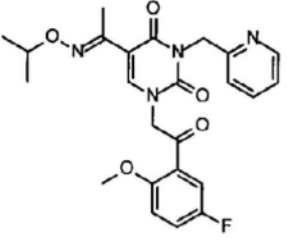
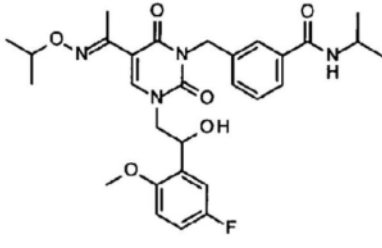
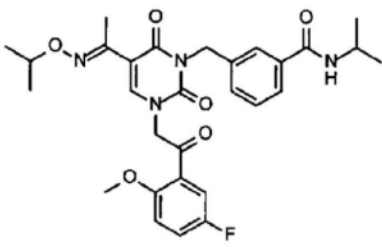
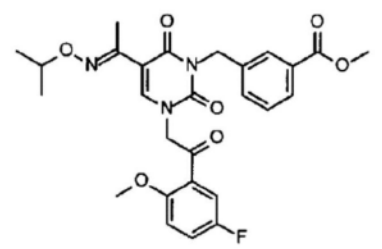
[1169]

D-46		m.p. 102-103°C	
D-47		粘性油	
D-48		m.p. 69-70°C	
D-49		m.p. 157-159°C	
D-50		m.p. 142-143°C	

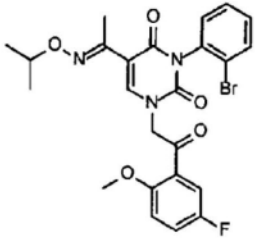
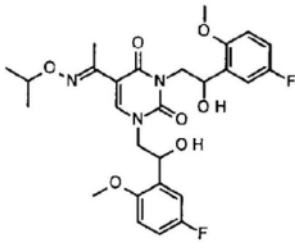
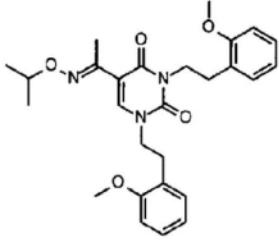
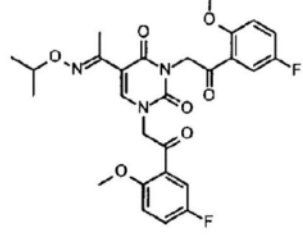
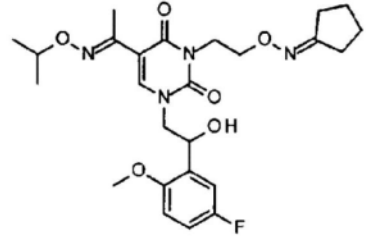
[1170]

D-51		m.p. 149-150°C	D-50的异构体
D-52		粘性油	
D-53		m.p. 87-89°C	
D-54		m.p. 132-133°C	
D-55		m.p. 112-113°C	

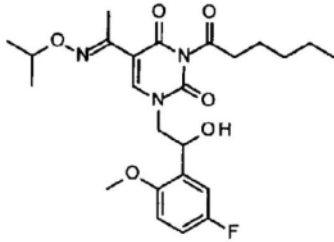
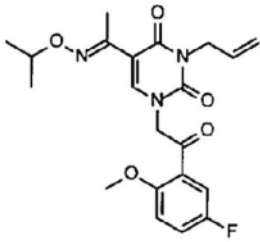
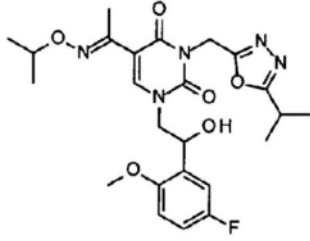
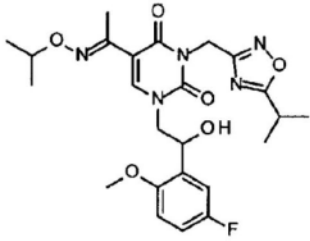
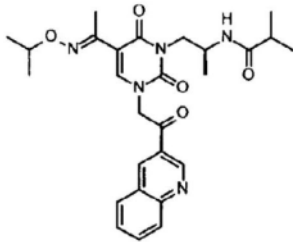
[1171]

D-56		m.p. 162-163°C	
D-57		粘性油	
D-58		m.p. 81-82°C	
D-59		m.p. 105-106°C	
D-60		m.p. 67-70°C	

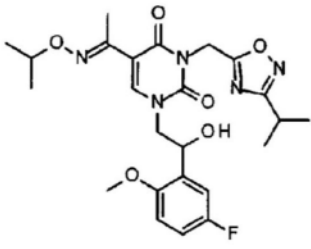
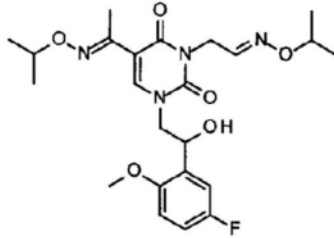
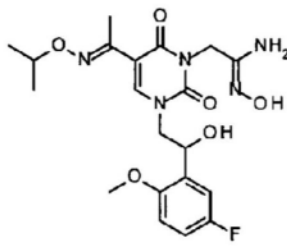
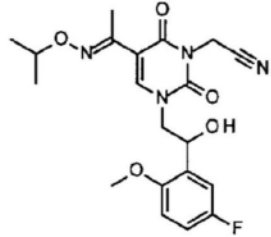
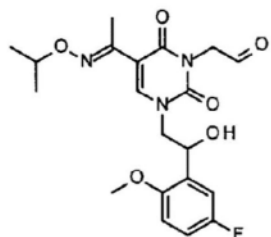
[1172]

D-61		m.p. 69-73°C	
D-62		m.p. 60-65°C	
D-63		粘性油	
D-64		m.p. 83-84°C	
D-65		粘性油	

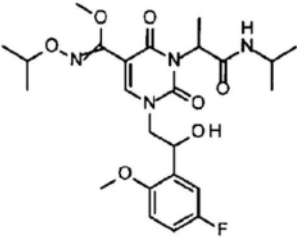
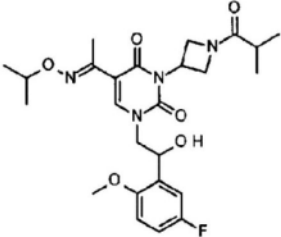
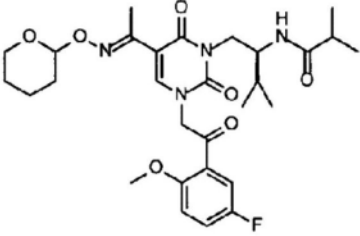
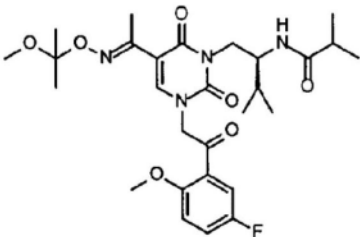
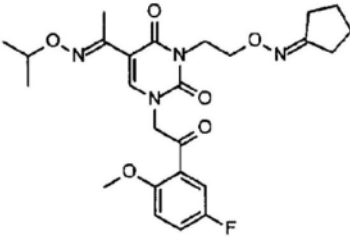
[1173]

D-66		粘性油	
D-67		m.p. 63-66°C	
D-68		m.p. 40-45°C	
D-69		m.p. 53-58°C	
D-70		m.p. 85-90°C	

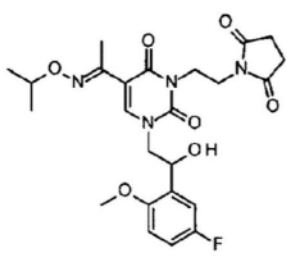
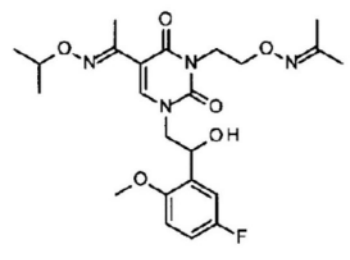
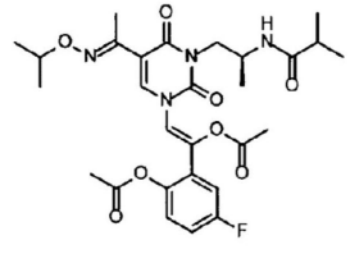
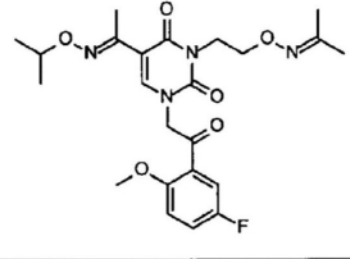
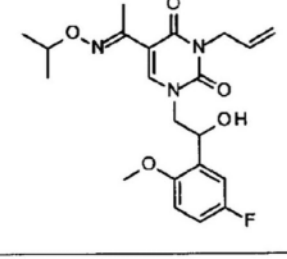
[1174]

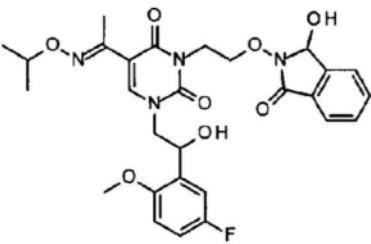
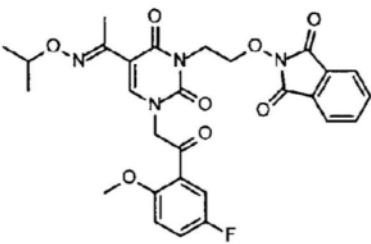
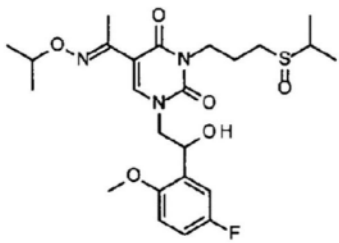
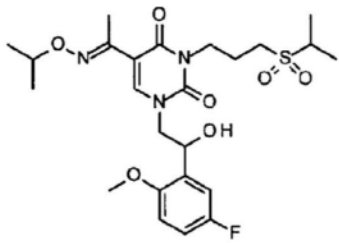
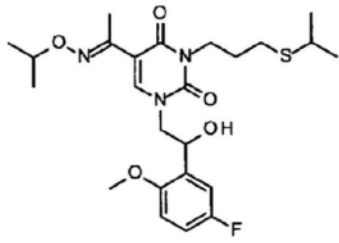
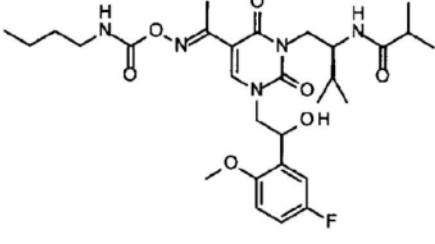
D-71		m.p. 150-151°C	
D-72		m.p. 127-129°C	
D-73		m.p. 192-196°C	
D-74		粘性油	
D-75		m.p. 108-110°C	

[1175]

D-76		m.p. 84-85°C	
D-77		m.p. 75-76°C	
D-78		m.p. 84-85°C	
D-79		m.p. 87-88°C	
D-80		粘性油	

[1176]

D-81		m.p. 200-202°C	
D-82		m.p. 110-114°C	
D-83		粘性油	
D-84		粘性油	
D-85		粘性油	

		粘性油	
		非晶质	
[1177]		粘性油	
		粘性油	
		粘性油	
[1178]		m.p. 68-69°C	

[1179] 关于表6及表7所记载的化合物中的、具有非晶或粘性油的性状的化合物,在下述

的表8中示出其¹H-NMR数据。

[1180] [表8]

化合物编号	NMR
C-3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46-6.96(5H, m), 5.68-1.82(14H, m), 2.12(3H, s), 1.32-1.03(18H, m).
C-4	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53-6.96(4H, m), 7.41(1H, s), 5.75-1.82(14H, m), 2.12(3H, s), 1.32-1.00(18H, m).
C-5	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, dd, J= 8.2, 6.9 Hz), 7.40 (1H, s), 6.71 (1H, td, J= 8.4, 2.4 Hz), 6.62 (1H, dd, J= 10.5, 2.3 Hz), 5.77 (1H, d, J= 8.7 Hz), 5.18-5.14 (1H, m), 4.57-4.47 (2H, m), 4.38-4.32 (1H, m), 4.18 (1H, dd, J= 13.3, 11.0 Hz), 4.14-4.08 (1H, m), 3.90 (1H, dd, J= 14.0, 2.5 Hz), 3.86 (3H, s), 3.84 (1H, dd, J= 8.7, 3.2 Hz), 2.21 (1H, td, J= 13.5, 6.6 Hz), 2.14 (3H, s), 1.27 (6H, dd, J= 6.2, 1.6 Hz), 1.23 (3H, d, J= 6.9 Hz), 1.04 (6H, dd, J= 13.1, 7.1 Hz).
C-8	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.63 (2H, t, J= 7.3 Hz), 7.52-7.48 (2H, m), 7.38 (1H, dd, J= 8.7, 7.3 Hz), 6.65-6.62 (1H, m), 5.85-5.81 (1H, m), 5.63-5.54 (3H, m), 4.69-4.60 (1H, m), 4.51 (1H, dd, J= 13.7, 3.2 Hz), 4.36 (1H, t, J= 6.2 Hz), 4.22 (1H, dd, J= 12.8, 11.4 Hz), 3.80 (1H, dd, J= 13.3, 3.7 Hz), 3.65 (1H, dd, J= 13.7, 9.6 Hz), 2.20 (1H, td, J= 13.7, 6.9 Hz), 2.12 (3H, s), 1.26 (9H, dd, J= 6.2, 1.1 Hz), 1.01 (6H, dd, J= 16.0, 6.9 Hz).
C-18	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, dd, J= 9.2, 3.2 Hz), 7.02-6.92 (1H, m), 6.81 (1H, dd, J= 9.2, 4.1 Hz), 5.85 (1H, d, J= 8.7 Hz), 5.24 (1H, d, J= 9.2 Hz), 4.62 (1H, s), 4.55-4.45 (1H, m), 4.41-4.28 (2H, m), 4.21-4.14 (1H, m), 3.96 (1H, dd, J= 14.7, 2.3 Hz), 3.87 (1H, dd, J= 13.3, 3.2 Hz), 3.83 (3H, s), 2.37 (3H, s), 2.27-2.21 (1H, m), 2.05 (3H, s), 1.29-1.20 (9H, m), 1.06 (6H, dd, J= 8.5, 7.1 Hz).
C-19	¹ H-NMR (DMSO-D ₆) δ: 7.69 (1H, d, J= 8.7 Hz), 7.26 (1H, dd, J= 9.6, 3.2 Hz), 7.08 (1H, td, J= 8.5, 3.2 Hz), 6.96 (1H, dd, J= 9.2, 4.6 Hz), 5.76 (1H, d, J= 5.0 Hz), 5.35-5.22 (1H, m), 4.40-4.16 (2H, m), 4.11-3.92 (2H, m), 3.91-3.63 (2H, m), 3.71 (3H, s), 2.32-2.16 (1H, m), 2.11 (3H, s), 1.89 (3H, s), 1.19 (6H, dd, J= 6.2, 5.7 Hz), 1.06 (3H, d, J= 6.9 Hz), 0.90 (6H, dd, J= 7.8, 7.3 Hz).
C-26	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.51(1H, s), 7.26-6.08(4H, m), 4.98-2.19(8H, m), 3.79(3H, s), 2.12(3H, s), 1.33-1.00(21H, m).
C-37	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.12 (1H, dd, J= 7.8, 0.9 Hz), 7.87 (1H, dd, J= 7.8, 0.9 Hz), 7.70 (1H, td, J= 7.7, 1.2 Hz), 7.54 (1H, s), 7.54-7.49 (1H, m), 6.02-5.98 (1H, m), 5.74 (1H, d, J= 5.0 Hz), 5.59 (1H, d, J= 7.3 Hz), 4.76-4.68 (1H, m), 4.49 (1H, dd, J= 13.7, 2.7 Hz), 4.40-4.34 (1H, m), 4.25 (1H, dd, J= 13.3, 11.4 Hz), 3.82 (1H, dd, J= 13.3, 3.7 Hz), 3.58 (1H, dd, J= 13.3, 10.1 Hz), 3.30 (3H, s), 2.25-2.17 (1H, m), 2.13 (3H, s), 1.28-1.24 (9H, m), 1.02 (6H, dd, J= 14.7, 6.9 Hz).
C-40	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.62 (1H, d, J= 2.7 Hz), 7.44 (1H, s), 7.24 (1H, dd, J= 8.9, 2.5 Hz), 6.81 (1H, d, J= 8.7 Hz), 5.75 (1H, d, J= 8.7 Hz), 5.17 (1H, dd, J= 5.7, 3.4 Hz), 4.70 (1H, s), 4.57-4.51 (1H, m), 4.39-4.33 (1H, m), 4.19 (1H, dd, J= 13.3, 11.0 Hz), 4.11-4.07 (1H, m), 3.90 (1H, dd, J= 13.7, 2.3 Hz), 3.86 (3H, s), 3.84-3.83 (1H, m), 2.21 (1H, td, J= 13.6, 6.7 Hz), 2.14 (3H, s), 1.27 (6H, d, J= 6.9 Hz), 1.23 (3H, d, J= 6.4 Hz), 1.04 (6H, dd, J= 13.5, 7.1 Hz).

[1181]

[1182]

C-42	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.60 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.45 (1H, s), 7.31–7.26 (1H, m), 7.02 (1H, t, J = 7.5 Hz), 6.89 (1H, d, J = 8.6 Hz), 5.53 (1H, d, J = 9.1 Hz), 5.20–5.17 (1H, m), 4.65 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.54–4.52 (1H, m), 4.39–4.32 (1H, m), 4.20–4.09 (2H, m), 3.93–3.85 (2H, m), 3.88 (3H, s), 2.25–2.18 (1H, m), 2.14 (3H, s), 1.74–1.65 (1H, m), 1.40 (2H, t, J = 7.2 Hz), 1.27 (6H, dd, J = 6.3, 1.4 Hz), 1.03 (6H, dd, J = 17.7, 6.8 Hz), 0.96 (6H, dd, J = 19.5, 6.3 Hz).
C-43	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.59 (1H, dd, J = 7.6, 1.6 Hz), 7.41 (1H, s), 7.29–7.25 (1H, m), 7.00 (1H, td, J = 7.4, 1.1 Hz), 6.89 (1H, d, J = 7.8 Hz), 5.66–5.61 (1H, m), 5.42 (1H, d, J = 9.2 Hz), 5.14 (1H, d, J = 5.0 Hz), 4.72–4.60 (1H, m), 4.57 (1H, dd, J = 13.3, 3.2 Hz), 4.38–4.32 (1H, m), 4.21 (1H, dd, J = 13.1, 11.2 Hz), 3.90 (3H, s), 3.83 (1H, dd, J = 12.8, 3.7 Hz), 3.25 (1H, dd, J = 13.3, 10.1 Hz), 2.21 (1H, td, J = 13.5, 6.6 Hz), 2.11 (3H, s), 1.74–1.67 (1H, m), 1.44–1.40 (2H, m), 1.25 (6H, d, J = 6.4 Hz), 1.03 (6H, dd, J = 16.7, 7.1 Hz), 0.96 (6H, dd, J = 23.1, 7.1 Hz).
C-44	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.67 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, s), 7.31–7.26 (1H, m), 7.03 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.89 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.25 (1H, s), 5.17 (1H, d, J = 8.7 Hz), 4.41–4.35 (3H, m), 4.13–4.07 (2H, m), 3.94–3.86 (2H, m), 3.88 (3H, s), 2.79 (6H, s), 2.15 (3H, s), 1.82–1.72 (1H, m), 1.41 (2H, dt, J = 14.5, 5.6 Hz), 1.29 (6H, dd, J = 6.4, 3.2 Hz), 0.96 (6H, dd, J = 18.1, 6.6 Hz).
C-45	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.57 (1H, dd, J = 7.6, 1.6 Hz), 7.42 (1H, s), 7.29–7.24 (1H, m), 6.99 (1H, t, J = 7.1 Hz), 6.88 (1H, d, J = 7.8 Hz), 5.66–5.59 (2H, m), 4.58 (1H, dd, J = 13.5, 3.0 Hz), 4.51–4.46 (1H, m), 4.39–4.33 (1H, m), 4.26–4.15 (2H, m), 3.89 (3H, s), 3.87 (1H, dd, J = 13.1, 3.9 Hz), 3.18 (1H, dd, J = 13.1, 9.8 Hz), 2.79 (6H, s), 2.11 (3H, s), 1.80–1.73 (1H, m), 1.41 (2H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (6H, dd, J = 6.4, 4.6 Hz), 0.97 (6H, dd, J = 18.5, 6.6 Hz).
C-46	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.58 (1H, d, J = 7.2 Hz), 7.44 (1H, s), 7.30–7.27 (1H, m), 7.02 (1H, t, J = 7.5 Hz), 6.89 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.52 (1H, d, J = 9.5 Hz), 5.19 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.59–4.49 (2H, m), 4.39–4.31 (1H, m), 4.15–3.98 (3H, m), 3.91–3.89 (1H, m), 3.88 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.13–2.05 (2H, m), 1.40 (2H, t, J = 7.2 Hz), 1.27 (6H, d, J = 6.3 Hz), 1.03 (3H, t, J = 7.5 Hz), 0.96 (6H, dd, J = 17.2, 6.8 Hz).
C-53	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.47 (1H, s), 7.45 (1H, dd, J = 9.2, 3.2 Hz), 6.95 (1H, td, J = 8.2, 3.2 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 9.2, 4.1 Hz), 5.42 (1H, br s), 5.14 (1H, d, J = 9.2 Hz), 4.44–4.08 (5H, m), 3.93 (1H, dd, J = 12.8, 3.2 Hz), 3.86 (3H, s), 3.81 (1H, d, J = 12.8 Hz), 2.79 (6H, s), 2.15 (3H, s), 1.71–1.58 (1H, m), 1.57–1.44 (1H, m), 1.29 (6H, dd, J = 6.4, 3.7 Hz), 1.02 (3H, t, J = 7.6 Hz).
C-55	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.41 (1H, s), 7.37 (1H, dd, J = 9.4, 3.0 Hz), 6.99–6.90 (1H, m), 6.79 (1H, dd, J = 8.9, 4.4 Hz), 5.51 (1H, d, J = 9.2 Hz), 5.16 (1H, d, J = 8.7 Hz), 4.76 (1H, br s), 4.41–4.29 (2H, m), 4.20–4.00 (2H, m), 3.96–3.86 (2H, m), 3.85 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.12–2.06 (2H, m), 1.70–1.61 (1H, m), 1.54–1.40 (1H, m), 1.26 (6H, d, J = 6.0 Hz), 1.05–0.98 (6H, m).
C-59	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.48 (1H, s), 7.46–7.45 (1H, m), 6.95 (1H, td, J = 8.5, 3.2 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.9, 4.4 Hz), 5.53 (1H, s), 5.13 (1H, d, J = 9.2 Hz), 4.45–4.43 (1H, m), 4.41–4.35 (1H, m), 4.32–4.17 (2H, m), 4.13–4.10 (1H, m), 3.91–3.88 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.79 (1H, d, J = 13.3 Hz), 2.78 (6H, s), 2.15 (3H, s), 1.76–1.73 (1H, m), 1.45–1.36 (2H, m), 1.29 (6H, dd, J = 6.2, 3.9 Hz), 0.96 (6H, dd, J = 17.4, 6.4 Hz).

[1183]

C-60	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.38 (1H, s), 7.35 (1H, dd, J = 9.6, 3.2 Hz), 6.92 (1H, td, J = 8.5, 3.2 Hz), 6.79 (1H, dd, J = 8.9, 4.4 Hz), 5.79 (1H, d, J = 5.0 Hz), 5.64–5.60 (1H, m), 4.64 (1H, dd, J = 13.1, 3.0 Hz), 4.56–4.43 (1H, m), 4.41–4.32 (1H, m), 4.20–4.16 (2H, m), 3.87 (3H, s), 3.87–3.82 (1H, m), 3.03 (1H, dd, J = 13.3, 10.1 Hz), 2.80 (6H, s), 2.11 (3H, s), 1.79–1.73 (1H, m), 1.41 (2H, t, J = 7.1 Hz), 1.31–1.24 (6H, m), 0.96 (6H, dd, J = 18.8, 6.9 Hz).
C-61	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, s), 7.39 (1H, dd, J = 9.2, 3.2 Hz), 6.95 (1H, td, J = 8.5, 3.2 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.9, 4.4 Hz), 5.48–5.45 (1H, m), 5.17–5.15 (1H, m), 4.91–4.90 (1H, m), 4.57–4.51 (1H, m), 4.41–4.32 (1H, m), 4.16–4.07 (2H, m), 3.92–3.89 (2H, m), 3.86 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.12–2.06 (2H, m), 1.73–1.69 (1H, m), 1.40 (2H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (6H, t, J = 4.1 Hz), 1.02 (3H, t, J = 7.6 Hz), 0.96 (6H, dd, J = 18.3, 6.4 Hz).
C-76	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.68 (1H, dd, J = 7.6, 1.6 Hz), 7.48 (1H, s), 7.32–7.27 (1H, m), 7.03 (1H, t, J = 7.1 Hz), 6.89 (1H, d, J = 7.8 Hz), 5.21–5.13 (2H, m), 4.49–4.42 (1H, m), 4.42–4.33 (1H, m), 4.26–4.16 (3H, m), 3.97 (1H, d, J = 9.2 Hz), 3.88 (3H, s), 3.82 (1H, d, J = 13.7 Hz), 2.80 (6H, s), 2.15 (3H, s), 1.92–1.81 (1H, m), 1.29 (6H, dd, J = 6.2, 2.5 Hz), 1.03 (6H, dd, J = 6.9, 0.9 Hz).
C-77	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.58 (1H, dd, J = 7.6, 1.6 Hz), 7.41 (1H, s), 7.29–7.24 (1H, m), 7.00 (1H, td, J = 7.3, 0.9 Hz), 6.88 (1H, d, J = 7.8 Hz), 5.67–5.59 (1H, m), 5.52 (1H, br s), 4.58 (1H, dd, J = 13.3, 3.2 Hz), 4.41–4.21 (4H, m), 3.96–3.90 (1H, m), 3.90 (3H, s), 3.17 (1H, dd, J = 13.1, 10.3 Hz), 2.81 (6H, s), 2.11 (3H, s), 1.90–1.79 (1H, m), 1.27 (6H, dd, J = 6.2, 3.9 Hz), 1.04 (6H, dd, J = 9.6, 6.9 Hz).
C-78	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.60 (1H, dd, J = 7.3, 1.4 Hz), 7.44 (1H, s), 7.30 (1H, td, J = 7.9, 1.5 Hz), 7.03 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.47 (1H, d, J = 9.2 Hz), 5.19 (1H, d, J = 9.6 Hz), 4.58–4.49 (1H, m), 4.40–4.07 (4H, m), 3.99–3.91 (2H, m), 3.89 (3H, s), 2.93–2.84 (1H, m), 2.14 (3H, s), 2.13–1.97 (4H, m), 1.93–1.72 (3H, m), 1.27 (6H, dd, J = 6.2, 2.1 Hz), 1.01 (6H, dd, J = 7.1, 6.6 Hz).
C-85	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69–7.64 (2H, m), 7.55 (1H, dd, J = 7.6, 1.6 Hz), 7.50–7.44 (1H, m), 7.42–7.35 (2H, m), 7.31–7.27 (2H, m), 6.98 (1H, td, J = 7.6, 0.9 Hz), 6.90 (1H, dd, J = 8.5, 1.1 Hz), 6.22 (1H, d, J = 10.1 Hz), 5.63 (1H, br s), 4.91 (1H, br s), 4.66–4.56 (1H, m), 4.53 (1H, dd, J = 13.3, 3.2 Hz), 4.41 (1H, t, J = 12.1 Hz), 4.30–4.23 (1H, m), 4.04 (1H, dd, J = 12.8, 3.7 Hz), 3.91 (3H, s), 3.34 (1H, dd, J = 13.5, 9.8 Hz), 2.00 (1H, dt, J = 20.9, 7.2 Hz), 1.70 (3H, s), 1.19 (6H, dd, J = 6.0, 2.7 Hz), 1.11 (6H, dd, J = 7.3, 6.9 Hz).
C-87	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.55 (1H, dd, J = 7.3, 1.4 Hz), 7.39 (1H, s), 7.31–7.27 (1H, m), 7.00 (1H, t, J = 7.1 Hz), 6.89 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.56 (2H, d, J = 8.7 Hz), 4.66 (1H, br s), 4.53–4.40 (2H, m), 4.39–4.27 (2H, m), 3.90 (3H, s), 3.86 (1H, dd, J = 12.8, 3.2 Hz), 3.38 (1H, dd, J = 13.5, 9.4 Hz), 2.12 (3H, s), 1.96–1.85 (1H, m), 1.83–1.72 (1H, m), 1.51–1.31 (4H, m), 1.25 (6H, dd, J = 6.4, 1.4 Hz), 1.04 (6H, dd, J = 6.4, 6.0 Hz), 0.85–0.75 (6H, m).
C-94	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.57 (1H, dd, J = 7.6, 1.1 Hz), 7.41 (1H, s), 7.29 (1H, td, J = 7.8, 1.8 Hz), 7.02 (1H, td, J = 7.7, 1.1 Hz), 6.89 (1H, d, J = 7.3 Hz), 5.57 (1H, d, J = 9.6 Hz), 5.18 (1H, br s), 4.41–4.17 (4H, m), 4.16–4.07 (1H, m), 4.00–3.91 (2H, m), 3.89 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.05 (2H, t, J = 7.3 Hz), 1.93–1.82 (1H, m), 1.62–1.45 (2H, m), 1.27 (6H, d, J = 5.5 Hz), 1.01 (6H, dd, J = 6.6, 4.4 Hz), 0.86 (3H, t, J = 7.3 Hz).

C-95	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.57 (1H, dd, J = 7.3, 1.4 Hz), 7.39 (1H, s), 7.29 (1H, dd, J = 7.8, 1.4 Hz), 7.00 (1H, t, J = 7.1 Hz), 6.89 (1H, d, J = 7.8 Hz), 5.62–5.54 (1H, m), 5.44 (1H, d, J = 10.1 Hz), 4.98 (1H, br s), 4.53 (1H, dd, J = 13.3, 3.2 Hz), 4.46–4.24 (3H, m), 3.96–3.89 (1H, m), 3.90 (3H, s), 3.29 (1H, dd, J = 13.3, 9.6 Hz), 2.12 (3H, s), 2.05 (2H, dt, J = 11.6, 3.3 Hz), 1.90–1.80 (1H, m), 1.57–1.43 (2H, m), 1.25 (6H, d, J = 6.0 Hz), 1.03 (6H, dd, J = 11.2, 6.6 Hz), 0.86 (3H, t, J = 7.3 Hz).
C-97	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.56 (1H, dd, J = 7.6, 1.6 Hz), 7.39 (1H, s), 7.29 (1H, dd, J = 7.8, 1.8 Hz), 7.00 (1H, t, J = 7.3 Hz), 6.89 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.61–5.53 (1H, m), 5.44 (1H, d, J = 9.6 Hz), 4.92 (1H, br s), 4.51 (1H, dd, J = 13.3, 3.2 Hz), 4.45–4.24 (3H, m), 3.92 (1H, dd, J = 13.5, 4.4 Hz), 3.90 (3H, s), 3.32 (1H, dd, J = 13.1, 9.8 Hz), 2.12 (3H, s), 2.04–1.92 (2H, m), 1.91–1.79 (2H, m), 1.25 (6H, d, J = 6.0 Hz), 1.03 (6H, dd, J = 10.8, 6.6 Hz), 0.86 (6H, t, J = 7.1 Hz).
C-127	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66–7.51 (1H, m), 7.45–7.38 (1H, m), 7.33–7.27 (1H, m), 7.07–6.96 (1H, m), 6.89 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.60–5.12 (1H, m), 4.65–4.56 (1H, m), 4.50–4.15 (4H, m), 4.08–3.97 (1H, m), 3.91–3.87 (3H, m), 3.87–3.33 (2H, m), 2.21–2.12 (3H, m), 1.94–1.75 (1H, m), 1.33 (9H, s), 1.30–1.23 (6H, m), 1.05–0.98 (6H, m).
C-128	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.62 (1H, dd, J = 7.8, 1.4 Hz), 7.45 (1H, s), 7.29 (1H, td, J = 7.9, 1.4 Hz), 7.02 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.89 (1H, d, J = 7.8 Hz), 5.78 (1H, d, J = 8.7 Hz), 5.21–5.13 (1H, m), 4.64 (1H, br s), 4.40–4.28 (2H, m), 4.28–4.18 (2H, m), 3.94 (1H, dd, J = 12.4, 3.2 Hz), 3.88 (3H, s), 3.86 (1H, dd, J = 13.7, 2.3 Hz), 2.15 (3H, s), 1.95–1.82 (1H, m), 1.27 (6H, dd, J = 6.4, 2.3 Hz), 1.09 (9H, s), 1.01 (6H, dd, J = 6.6, 5.3 Hz).
C-129	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.59 (1H, dd, J = 7.6, 1.6 Hz), 7.40 (1H, s), 7.30–7.27 (1H, m), 7.00 (1H, td, J = 7.3, 0.9 Hz), 6.89 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.69–5.60 (2H, m), 5.04–4.96 (1H, m), 4.55 (1H, dd, J = 13.3, 3.2 Hz), 4.46–4.28 (3H, m), 3.90 (3H, s), 3.89 (1H, dd, J = 11.9, 3.7 Hz), 3.25 (1H, dd, J = 13.1, 9.8 Hz), 2.13 (3H, s), 1.92–1.83 (1H, m), 1.25 (6H, dd, J = 6.4, 1.8 Hz), 1.10 (9H, s), 1.03 (6H, dd, J = 11.7, 6.6 Hz).
C-130	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, s), 7.42 (1H, dd, J = 9.4, 3.0 Hz), 7.00–6.93 (1H, m), 6.81 (1H, dd, J = 9.2, 4.1 Hz), 5.51 (1H, d, J = 9.2 Hz), 5.14 (1H, d, J = 6.9 Hz), 4.91 (1H, br s), 4.41–4.30 (2H, m), 4.30–4.18 (2H, m), 3.92 (1H, dd, J = 12.6, 3.4 Hz), 3.86 (3H, s), 3.81 (1H, dd, J = 14.0, 1.6 Hz), 2.29–2.18 (1H, m), 2.14 (3H, s), 1.91–1.78 (1H, m), 1.27 (6H, dd, J = 6.0, 1.4 Hz), 1.05 (6H, dd, J = 14.2, 6.9 Hz), 1.01 (6H, d, J = 6.9 Hz).
C-131	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.37 (1H, dd, J = 9.2, 3.7 Hz), 7.37 (1H, s), 6.93 (1H, td, J = 8.5, 3.2 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.9, 4.4 Hz), 5.67–5.57 (1H, m), 5.43 (1H, d, J = 9.6 Hz), 5.22 (1H, d, J = 6.0 Hz), 4.62 (1H, dd, J = 13.3, 3.2 Hz), 4.48–4.26 (3H, m), 3.89 (1H, dd, J = 11.9, 4.1 Hz), 3.88 (3H, s), 3.11 (1H, dd, J = 13.3, 10.1 Hz), 2.30–2.19 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.91–1.79 (1H, m), 1.25 (6H, dd, J = 6.4, 0.9 Hz), 1.06 (6H, dd, J = 10.1, 6.9 Hz), 1.02 (6H, d, J = 6.9 Hz).
C-132	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42 (1H, s), 7.37 (1H, dd, J = 8.9, 3.0 Hz), 6.96 (1H, td, J = 8.5, 3.2 Hz), 6.81 (1H, dd, J = 8.7, 4.1 Hz), 5.73 (1H, br s), 5.21–5.13 (1H, m), 4.69 (1H, s), 4.60–4.47 (1H, m), 4.38–4.32 (1H, m), 4.25–4.08 (2H, m), 3.91–3.81 (2H, m), 3.86 (3H, s), 2.25–2.18 (1H, m), 2.14 (3H, s), 1.27 (6H, dd, J = 6.2, 1.1 Hz), 1.23 (3H, d, J = 6.9 Hz), 1.03 (6H, dd, J = 14.2, 6.9 Hz).

[1184]

[1185]

C-133	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.38 (1H, s), 7.37 (1H, dd, $J=9.6, 2.3$ Hz), 6.94 (1H, td, $J=8.5, 3.2$ Hz), 6.80 (1H, dd, $J=8.9, 4.4$ Hz), 5.66-5.59 (1H, m), 5.49 (1H, d, $J=9.2$ Hz), 5.28 (1H, d, $J=6.0$ Hz), 4.79-4.66 (1H, m), 4.61 (1H, dd, $J=13.3, 3.2$ Hz), 4.40-4.21 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.80 (1H, dd, $J=12.8, 3.7$ Hz), 3.12 (1H, dd, $J=13.3, 9.6$ Hz), 2.26-2.17 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.27-1.23 (9H, m), 1.03 (6H, dd, $J=15.1, 6.9$ Hz).
C-136	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.41(1H, s), 7.37-6.76(3H, m), 5.72-3.85(9H, m), 3.84(3H, s), 2.15(3H, s), 2.10-1.02(14H, m).
C-149	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.70(1H, s), 7.35-6.78(3H, m), 5.10-2.16(10H, m), 3.88(3H, s), 2.15(3H, s), 1.26-1.01(15H, m).
C-153	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.44(1H, s), 7.40-6.79(3H, m), 5.05-0.98(21H, m), 3.88(3H, s), 2.14(3H, s).
C-163	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.42(1H, s), 7.28-6.72(3H, m), 6.15-2.20(10H, m), 3.90(3H, s), 2.14(3H, s), 1.34-1.06(15H, m).
C-164	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.50(1H, s), 7.28-6.71(3H, m), 5.78-2.18(10H, m), 3.90(3H, s), 2.12(3H, s), 1.28-1.00(15H, m).
C-183	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.42-6.79(4H, m), 5.10-3.13(9H, m), 3.88(3H, s), 2.17(3H, s), 1.30-1.20(18H, m).
C-185	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.37(1H, s), 7.32-6.79(3H, m), 5.19-3.90(9H, m), 3.80(3H, s), 3.55(3H, s), 2.14(3H, s), 1.28-1.21(9H, m).
C-187	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.40(1H, s), 7.34-6.79(3H, m), 5.17-3.76(10H, m), 3.86(3H, s), 2.15(3H, s), 1.30-1.10(15H, m).
C-188	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.37(1H, s), 7.32-6.79(3H, m), 5.55-3.14(10H, m), 3.86(3H, s), 2.13(3H, s), 1.28-1.21(15H, m).
C-193	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.84-7.35(5H, m), 5.64-2.17(10H, m), 2.15(3H, s), 1.28-1.01(15H, m).
C-197	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.63-7.24(5H, m), 5.68-2.15(12H, m), 2.15(3H, s), 1.31-0.98(18H, m).
C-198	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.44(1H, s), 7.39-6.79(3H, m), 5.42-2.08(10H, m), 3.83(3H, s), 2.14(3H, s), 1.77-0.92(21H, m).
C-199	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.39(1H, s), 7.39-6.79(3H, m), 5.67-2.10(10H, m), 3.83(3H, s), 2.11(3H, s), 1.77-0.92(21H, m).
C-200	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.44-6.79(4H, m), 5.65-3.18(9H, m), 3.87(3H, s), 2.18(3H, s), 1.80-0.93(24H, m).
C-204	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.52(1H, s), 7.40(1H, s), 6.90-6.66(4H, m), 5.60-3.2.20(10H, m), 2.12(3H, s), 1.30-0.98(15H, m).
C-206	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.39(1H, s), 7.38-6.80(3H, m), 5.60-3.95(10H, m), 3.83(3H, s), 2.12(3H, s), 1.86(3H, s), 1.90-0.98(13H, m).
C-209	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.44(1H, s), 7.43-6.80(3H, m), 5.55-3.80(10H, m), 3.84(3H, s), 2.12(3H, s), 2.28-1.01(23H, m).

C-242	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.62 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.54–7.46 (2H, m), 7.34 (1H, s), 7.33–7.28 (1H, m), 6.07 (1H, d, J = 7.3 Hz), 5.24 (1H, d, J = 17.9 Hz), 4.75 (1H, d, J = 17.4 Hz), 4.38–4.32 (2H, m), 4.14 (1H, dd, J = 13.7, 10.5 Hz), 3.93 (1H, dd, J = 13.7, 3.2 Hz), 3.48–3.37 (1H, m), 2.27–2.21 (1H, m), 2.18 (3H, s), 2.14–2.00 (2H, m), 1.86–1.53 (6H, m), 1.25 (6H, dd, J = 6.4, 4.6 Hz), 1.21 (3H, d, J = 6.4 Hz), 1.05 (6H, dd, J = 6.9, 5.0 Hz).
C-243	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.50–7.46 (2H, m), 7.38–7.33 (2H, m), 7.21 (1H, s), 6.09 (1H, d, J = 7.7 Hz), 5.75 (1H, t, J = 2.0 Hz), 5.07 (1H, d, J = 18.1 Hz), 4.71 (1H, d, J = 17.7 Hz), 4.38–4.28 (2H, m), 4.12 (1H, dd, J = 13.4, 10.6 Hz), 3.91 (1H, dd, J = 13.6, 3.2 Hz), 2.79–2.70 (2H, m), 2.61–2.52 (2H, m), 2.28–2.20 (1H, m), 2.17 (3H, s), 2.14–2.05 (2H, m), 1.25 (6H, dd, J = 6.3, 4.1 Hz), 1.20 (3H, d, J = 6.8 Hz), 1.06 (6H, t, J = 6.6 Hz).
D-2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.07(1H, s), 7.24–6.78(5H, m), 5.13–3.21(9H, m), 3.82(3H, s), 2.08(3H, s), 1.35–1.22(9H, m).
D-3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66(1H, s), 7.58–7.00(3H, m), 6.72(1H, s), 5.67–1.84(8H, m), 2.15(3H, s), 1.33–1.00(24H, m).
D-5	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.41 (1H, d, J = 2.3 Hz), 7.26 (1H, s), 7.16 (1H, dd, J = 9.2, 2.7 Hz), 6.94 (1H, td, J = 8.4, 3.1 Hz), 6.79 (1H, dd, J = 8.9, 4.4 Hz), 6.31 (1H, d, J = 2.7 Hz), 5.24–5.19 (1H, m), 5.17 (2H, s), 4.67 (2H, q, J = 8.5 Hz), 4.36–4.30 (1H, m), 4.19–4.14 (1H, m), 4.01 (1H, dd, J = 14.2, 7.3 Hz), 3.83 (3H, s), 3.61 (1H, d, J = 5.0 Hz), 2.13 (3H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.4 Hz).
D-9	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.26 (1H, s), 7.17–6.80(3H, m), 5.21–3.56 (8H, m), 3.84 (3H, s), 3.36 (6H, s), 2.11 (3H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.3 Hz).
D-12	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.25–7.20 (2H, m), 6.95 (1H, td, J = 8.5, 2.4 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 9.2, 4.1 Hz), 5.23 (1H, dd, J = 7.1, 3.4 Hz), 4.38–4.27 (2H, m), 4.19–4.11 (1H, m), 3.95 (1H, tt, J = 10.8, 3.8 Hz), 3.86 (3H, d, J = 1.8 Hz), 3.78 (1H, dd, J = 13.3, 2.7 Hz), 2.91 (1H, td, J = 9.8, 5.6 Hz), 2.36 (6H, d, J = 2.7 Hz), 2.12 (3H, d, J = 3.7 Hz), 1.93 (1H, dd, J = 13.5, 6.6 Hz), 1.28–1.25 (6H, m), 1.11 (1H, dd, J = 6.9, 3.2 Hz), 1.02 (6H, dq, J = 14.1, 4.0 Hz).
D-13	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.31 (1H, s), 7.29–7.24 (1H, m), 7.00–6.93 (1H, m), 6.81 (1H, dd, J = 9.1, 4.1 Hz), 5.34 (1H, dt, J = 10.1, 3.4 Hz), 4.61–4.55 (1H, m), 4.47–4.05 (6H, m), 3.87 (3H, s), 3.68 (1H, dd, J = 13.8, 8.4 Hz), 2.85 (6H, s), 2.12 (3H, s), 1.26 (6H, dd, J = 6.1, 1.1 Hz).
D-14	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.31 (1H, s), 7.23 (1H, dd, J = 8.9, 3.0 Hz), 7.01–6.91 (1H, m), 6.81 (1H, dd, J = 8.7, 4.1 Hz), 5.30–5.23 (1H, m), 4.49–4.40 (1H, m), 4.39–4.17 (5H, m), 3.86 (3H, s), 3.85–3.79 (1H, m), 3.63–3.58 (1H, m), 2.54–2.47 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.27–1.24 (6H, m), 1.15–1.11 (6H, m).
D-18	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.25–7.18 (2H, m), 6.96 (1H, tdd, J = 9.8, 4.5, 2.9 Hz), 6.80 (1H, dq, J = 8.8, 2.0 Hz), 5.24–5.21 (1H, m), 4.37–4.30 (1H, m), 4.20–4.09 (2H, m), 3.99 (1H, dq, J = 19.5, 6.0 Hz), 3.86 (3H, d, J = 2.3 Hz), 3.80 (2H, dd, J = 13.1, 6.8 Hz), 3.13 (1H, dd, J = 13.1, 6.8 Hz), 2.27 (6H, d, J = 2.3 Hz), 2.12 (3H, d, J = 2.7 Hz), 1.31–1.16 (6H, m), 0.96–0.83 (3H, m).
D-19	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.49–7.48 (2H, m), 6.95 (1H, td, J = 8.5, 3.3 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 9.1, 4.1 Hz), 5.89 (1H, d, J = 3.2 Hz), 5.21 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.96 (1H, ddd, J = 12.8, 7.4, 5.1 Hz), 4.40–4.27 (3H, m), 3.86 (3H, s), 3.78 (1H, dd, J = 12.9, 4.3 Hz), 3.67–3.62 (2H, m), 3.46–3.42 (1H, m), 2.56–2.49 (1H, m), 2.26–2.23 (1H, m), 2.15 (3H, s), 2.05 (1H, s), 1.93 (1H, td, J = 12.2, 7.7 Hz), 1.75 (1H, dd, J = 12.7, 7.2 Hz), 1.28 (6H, d, J = 6.3 Hz), 0.98 (6H, d, J = 6.8 Hz).

[1186]

[1187]

D-20	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.41–7.37 (2H, m), 6.93 (1H, td, J = 8.4, 3.2 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.8, 4.3 Hz), 5.96 (1H, d, J = 5.4 Hz), 5.68 (1H, t, J = 6.1 Hz), 5.06–5.00 (1H, m), 4.67 (1H, dd, J = 13.1, 3.2 Hz), 4.39–4.32 (2H, m), 3.87 (3H, s), 3.77 (1H, dd, J = 13.1, 4.1 Hz), 3.62 (1H, td, J = 9.5, 2.7 Hz), 3.44 (1H, dd, J = 17.9, 9.7 Hz), 3.02 (1H, dd, J = 13.1, 10.4 Hz), 2.56–2.50 (1H, m), 2.26 (1H, t, J = 10.0 Hz), 2.10 (3H, s), 2.10 (1H, tt, J = 19.9, 7.2 Hz), 1.91 (1H, ddd, J = 21.1, 11.3, 6.3 Hz), 1.75 (1H, dd, J = 12.7, 6.3 Hz), 1.25 (6H, t, J = 4.3 Hz), 0.99 (6H, dd, J = 6.8, 0.9 Hz).
D-29	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.03–7.37(5H, m), 5.11–3.80(7H, m), 3.93(3H, s), 2.14(3H, s), 1.35–1.20(18H, m).
D-35	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.40–6.70(4H, m), 5.35–0.95(25H, m), 3.84(3H, s), 2.14(3H, s).
D-37	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.44–6.80(4H, m), 5.41–1.00(25H, m), 3.86(3H, s), 2.20(3H, s).
D-40	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.51–7.47 (1H, m), 7.41–7.18 (4H, m), 7.08–6.97 (4H, m), 5.01–4.93 (3H, m), 4.37 (1H, dq, J = 14.7, 4.2 Hz), 3.82–3.78 (6H, m), 3.33–3.31 (3H, m), 2.17–2.16 (3H, m), 1.30–1.24 (6H, m).
D-47	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.73–6.77(8H, m), 5.23–3.60(7H, m), 3.80(3H, s), 2.11(3H, s), 1.70(6H, d, J = 6.3Hz).
D-52	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.43–6.78(8H, m), 5.22–3.43(7H, m), 3.81(3H, s), 3.79(3H, s), 2.12(3H, s), 1.23(6H, d, J = 6.3Hz).
D-57	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.52–6.96(8H, m), 5.30(2H, s), 5.18(2H, s), 4.39–4.31(1H, m), 3.96(3H, s), 2.19(3H, s) 1.26 (6H, d, J = 6.3Hz).
D-63	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.25–7.18 (3H, m), 7.07 (1H, dd, J = 7.3, 1.4 Hz), 7.00 (1H, s), 6.90–6.83 (4H, m), 4.33–4.27 (1H, m), 4.23–4.19 (2H, m), 3.95 (2H, t, J = 6.9 Hz), 3.86 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.00–2.93 (4H, m), 2.06 (3H, s), 1.23 (6H, d, J = 6.0 Hz).
D-65	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.25 (1H, s), 7.21 (1H, dd, J = 8.7, 3.2 Hz), 7.01–6.92 (1H, m), 6.81 (1H, dd, J = 8.9, 4.4 Hz), 5.25–5.17 (1H, m), 4.37–4.30 (1H, m), 4.25 (4H, s), 4.14–4.07 (1H, m), 3.97 (1H, dd, J = 14.2, 7.3 Hz), 3.85 (3H, s), 3.54–3.46 (1H, m), 2.38–2.28 (4H, m), 2.12 (3H, s), 1.75–1.66 (4H, m), 1.26 (6H, d, J = 6.4 Hz).
D-66	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.34 (1H, s), 7.18 (1H, dd, J = 9.1, 3.2 Hz), 7.00–6.95 (1H, m), 6.81 (1H, dd, J = 8.8, 4.3 Hz), 5.24 (1H, t, J = 8.2 Hz), 4.34 (1H, td, J = 12.5, 6.0 Hz), 4.16–4.03 (1H, m), 3.95 (1H, dd, J = 14.0, 7.7 Hz), 3.86 (3H, s), 3.03 (1H, d, J = 5.4 Hz), 2.79 (2H, t, J = 7.2 Hz), 2.12 (3H, s), 1.78–1.71 (2H, m), 1.43–1.31 (4H, m), 1.26 (6H, d, J = 6.3 Hz), 0.91 (3H, t, J = 7.0 Hz).
D-74	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.40 (1H, s), 7.19–6.82 (3H, m), 5.25–3.94 (5H, m), 4.82 (2H, s), 3.86 (3H, s), 2.05 (3H, s), 1.29–1.21 (6H, m)
D-80	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.62 (1H, dd, J = 8.7, 3.2 Hz), 7.30 (1H, s), 7.29–7.24 (1H, m), 6.99 (1H, dd, J = 9.2, 3.7 Hz), 5.11 (2H, s), 4.36–4.30 (1H, m), 4.25 (4H, s), 3.97 (3H, s), 2.39–2.25 (4H, m), 2.18 (3H, s), 1.76–1.63 (4H, m), 1.25 (6H, d, J = 6.4 Hz).
D-83	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.61 (1H, s), 7.22–7.10 (3H, m), 6.90(1H, s), 5.94–2.20 (6H, m), 2.39 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.15(3H, s), 1.29–1.05 (15H, d, m).

[1188]

D-84	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.62 (1H, dd, $J = 8.7, 3.2$ Hz), 7.29 (1H, s), 7.29-7.24 (1H, m), 6.99 (1H, dd, $J = 9.2, 4.1$ Hz), 5.11 (2H, s), 4.36-4.30 (1H, m), 4.24 (4H, br s), 3.97 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.85 (3H, s), 1.78 (3H, s), 1.25 (6H, d, $J = 6.4$ Hz).
D-85	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.28 (1H, s), 7.20-6.77 (3H, m), 5.94-3.36 (9H, m), 3.86 (3H, s), 2.13 (3H, s), 1.26 (6H, d, $J = 6.3$ Hz).
D-86	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.77 (1H, dd, $J = 7.5, 2.9$ Hz), 7.66-7.60 (2H, m), 7.52 (1H, dd, $J = 9.1, 5.4$ Hz), 7.44 (1H, d, $J = 5.4$ Hz), 7.26-7.20 (1H, m), 7.01-6.94 (1H, m), 6.82 (1H, dd, $J = 8.8, 4.3$ Hz), 6.26-6.19 (1H, m), 5.89 (1H, d, $J = 5.0$ Hz), 5.36-5.21 (1H, m), 4.67-4.42 (3H, m), 4.40-4.32 (1H, m), 4.30-4.10 (2H, m), 3.91-3.78 (4H, m), 3.53-3.38 (1H, m), 2.19-2.04 (3H, m), 1.27 (6H, dd, $J = 6.3, 1.8$ Hz).
D-87	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.84-7.78 (2H, m), 7.76-7.69 (2H, m), 7.63 (1H, dd, $J = 8.8, 3.4$ Hz), 7.37 (1H, s), 7.32-7.20 (1H, m), 6.98 (1H, dd, $J = 9.1, 4.1$ Hz), 5.15 (2H, s), 4.50-4.39 (4H, m), 4.40-4.29 (1H, m), 3.97 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.25 (6H, d, $J = 6.3$ Hz).
D-88	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.35 (1H, d, $J = 5.9$ Hz), 7.28-7.22 (1H, m), 6.99-6.91 (1H, m), 6.80 (1H, dd, $J = 8.8, 4.3$ Hz), 5.36-5.24 (1H, m), 4.49-4.00 (5H, m), 3.88-3.84 (3H, m), 3.82-3.59 (1H, m), 2.80-2.62 (3H, m), 2.39-2.15 (2H, m), 2.14 (3H, s), 1.30-1.19 (12H, m).
D-89	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.34 (1H, s), 7.20 (1H, dd, $J = 9.1, 3.2$ Hz), 7.00-6.94 (1H, m), 6.81 (1H, dd, $J = 8.8, 4.3$ Hz), 5.30-5.19 (1H, m), 4.42-4.27 (1H, m), 4.24-4.01 (3H, m), 3.94-3.81 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.48 (1H, br s), 3.17-2.98 (3H, m), 2.31-2.15 (2H, m), 2.13 (3H, s), 1.37 (6H, d, $J = 6.8$ Hz), 1.26 (6H, d, $J = 6.3$ Hz).
D-90	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.27 (1H, s), 7.19 (1H, dd, $J = 9.1, 3.2$ Hz), 6.96 (1H, td, $J = 8.4, 3.2$ Hz), 6.81 (1H, dd, $J = 9.1, 4.1$ Hz), 5.26-5.17 (1H, m), 4.39-4.28 (1H, m), 4.17-3.95 (4H, m), 3.86 (3H, s), 3.43 (1H, d, $J = 5.4$ Hz), 2.98-2.91 (1H, m), 2.58 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 2.13 (3H, s), 1.90 (2H, td, $J = 14.2, 6.6$ Hz), 1.26 (12H, d, $J = 6.3$ Hz).

[1189] (生物试验)

[1190] 通过以下的试验例表明本发明的二氢嘧啶化合物作为农业园艺用杀菌剂的有效成分是有用的。

[1191] 将试验中使用的二氢嘧啶化合物按每个试验分别示于以下的表9及表10。表9中的化合物编号与表2~表4的化合物编号对应。表10中的化合物编号与表6及表7的化合物编号对应。

[1192] [表9]

黑星			白粉病		叶锈病	灰霉病
A-1	A-40	A-94	A-1	A-84	A-1	A-42
A-2	A-42	A-95	A-2	A-86	A-2	A-58
A-3	A-44	A-96	A-10	A-90	A-10	A-60
A-5	A-46	A-97	A-11	A-91	A-11	A-63
A-6	A-48	A-98	A-14	A-92	A-14	A-75
A-7	A-49	A-99	A-17	A-93	A-17	A-76
A-8	A-51	A-100	A-18	A-94	A-23	A-102
A-9	A-58	A-101	A-23	A-95	A-24	
A-10	A-60	A-102	A-24	A-96	A-25	
A-11	A-61	A-103	A-31	A-97	A-48	
A-13	A-63	A-104	A-38	A-99	A-60	
A-14	A-67	A-105	A-42	A-100	A-61	
A-15	A-70	A-107	A-46	A-101	A-63	
A-16	A-71	B-3	A-48	A-102	A-64	
A-17	A-72	B-7	A-49	A-105	A-69	
A-18	A-75	B-8	A-51	B-1	A-70	
A-19	A-76	B-9	A-58	B-3	A-76	
A-20	A-79		A-60		A-80	
A-21	A-80		A-61		A-91	
A-22	A-81		A-63		A-93	
A-23	A-83		A-69		A-95	
A-24	A-84		A-70		A-99	
A-25	A-85		A-71		A-100	
A-26	A-87		A-75			
A-31	A-88		A-76			
A-36	A-90		A-79			
A-37	A-91		A-80			
A-38	A-93		A-81			

[1193]

[1194] [表10]

黑星病			白粉病			叶锈病		灰霉病
C-2	C-89	C-180	C-2	C-95	C-197	C-2	C-168	C-2
C-4	C-90	C-182	C-4	C-97	C-199	C-4	C-170	C-4
C-6	C-91	C-183	C-6	C-99	C-202	C-6	C-174	C-24
C-10	C-93	C-184	C-10	C-101	C-207	C-10	C-176	C-56
C-12	C-95	C-186	C-12	C-103	C-208	C-22	C-182	C-58
C-14	C-97	C-188	C-14	C-105	C-210	C-24	C-197	C-60
C-15	C-99	C-189	C-15	C-107	C-211	C-33	C-199	C-62
C-17	C-101	C-191	C-22	C-109	C-213	C-43	C-210	C-101
C-22	C-103	C-197	C-24	C-111	C-219	C-45	D-11	C-112
C-24	C-105	C-199	C-29	C-112	D-1	C-47	D-20	C-126
C-25	C-107	C-202	C-30	C-115	D-3	C-49	D-22	C-148
C-28	C-109	C-207	C-32	C-117	D-11	C-54	D-48	C-154
C-29	C-111	C-208	C-33	C-122	D-20	C-56	D-50	C-168
C-30	C-112	C-210	C-34	C-124	D-22	C-58		C-199
C-32	C-115	C-211	C-36	C-126	D-34	C-60		C-202
C-34	C-117	C-213	C-39	C-127	D-35	C-63		C-210
C-36	C-122	C-219	C-43	C-129	D-37	C-67		D-11
C-39	C-124	C-220	C-45	C-135	D-44	C-69		
C-41	C-126	C-221	C-47	C-137	D-56	C-75		
C-43	C-127	D-3	C-49	C-141		C-79		
C-45	C-129	D-7	C-51	C-146		C-81		
C-47	C-135	D-8	C-54	C-148		C-83		
C-49	C-137	D-11	C-56	C-151		C-87		
C-51	C-141	D-13	C-58	C-154		C-89		
C-54	C-144	D-14	C-60	C-158		C-93		
C-56	C-148	D-16	C-62	C-160		C-95		
C-58	C-151	D-20	C-63	C-166		C-97		
C-60	C-152	D-22	C-65	C-168		C-99		
C-62	C-154	D-33	C-67	C-170		C-101		
C-63	C-156	D-34	C-69	C-172		C-103		
C-65	C-158	D-35	C-71	C-173		C-107		
C-67	C-160	D-36	C-73	C-174		C-109		
C-69	C-162	D-37	C-75	C-176		C-112		
C-71	C-166	D-39	C-77	C-177		C-115		
C-73	C-168	D-43	C-79	C-179		C-117		
C-75	C-170	D-52	C-81	C-180		C-124		
C-77	C-172	D-53	C-83	C-182		C-126		
C-79	C-173	D-54	C-85	C-183		C-129		
C-81	C-174	D-56	C-87	C-186		C-135		
C-83	C-176	D-57	C-89	C-188		C-148		
C-85	C-177	D-63	C-90	C-191		C-154		
C-87	C-179		C-93	C-194		C-166		

[1195]

[1196] (试验用乳剂的制备)

[1197] 将本发明的二氢嘧啶化合物5重量份、N,N-二甲基甲酰胺93.5重量份、及聚氧乙烯山梨糖醇酐单月桂酸酯(TWEEN(注册商标)20)1.5重量份混合,使其溶解,得到有效成分为5%的乳剂(I)。

[1198] 防除价通过下式来计算。

[1199] [数学式1]

[1200] 防除价(%) = 100 - {处理区中的病斑面积率/无处理区中的病斑面积率} × 100

[1201] (试验例1) 苹果黑星病防除试验

[1202] 以二氢嘧啶化合物的浓度成为125ppm的方式向乳剂(I)中加入水,使其溶解而得到药剂溶液。接着,向在育苗用盆中栽培而得到的苹果幼苗(品种“王林”,3~4叶期)散布前述药剂溶液。风干后,接种苹果黑星病菌(*Venturia inaequalis*)的分生孢子(处理区)。作为对照,同样地向未散布药剂溶液的苹果幼苗进行接种(无处理区)。将它们静置于20℃的湿室(其中每12小时将明暗反复)中。

[1203] 在从接种起经过了2周的日子,对苹果幼苗的叶进行目视观察,求出病斑面积率,算出防除价。

[1204] 对于表9及表10中记载的二氢嘧啶化合物,进行了苹果黑星病防除试验。任意化合物均显示出75%以上的防除价。

[1205] (试验例2) 小麦白粉病防除试验

[1206] 以二氢嘧啶化合物的浓度成为125ppm的方式向乳剂(I)中加入水,使其溶解而得到药剂溶液。接着,向在育苗用盆中栽培而得到的小麦幼苗(品种“Chihoku”,1~2叶期)散布前述药剂溶液。风干后,播撒接种小麦白粉病菌(*Erysiphe graminis* f.sp.*tritici*)的分生孢子(处理区)。作为对照,通过与上述相同的方法向未散布药剂溶液的小麦幼苗进行接种(无处理区)。将它们静置于20℃的温室中。

[1207] 在从接种起经过了6天的日子,对小麦幼苗的叶进行目视观察,求出病斑面积率,算出防除价。

[1208] 对于表9及表10中记载的二氢嘧啶化合物,进行了小麦白粉病防除试验。任意化合物均显示出75%以上的防除价。

[1209] (试验例3) 小麦叶锈病防除试验

[1210] 以二氢嘧啶化合物的浓度成为125ppm的方式向乳剂(I)中加入水,使其溶解而得到药剂溶液。接着,向在育苗用盆中栽培而得到的小麦幼苗(品种“农林61号”,1~2叶期)散布前述药剂溶液。风干后,向散布了药剂溶液的小麦幼苗播撒接种小麦叶锈病菌(*Puccinia recondita*)的夏孢子(处理区)。作为对照,与上述同样地操作而向未散布药剂溶液的小麦幼苗进行接种(无处理区)。将它们静置于20℃的温室中。

[1211] 在从接种起经过了12天的日子,对小麦苗的叶进行目视观察,求出病斑面积率,算出防除价。

[1212] 对于表9及表10中记载的二氢嘧啶化合物,进行了小麦叶锈病防除试验。任意化合物均显示出75%以上的防除价。

[1213] (试验例4) 黄瓜灰霉病防除试验

[1214] 以二氢嘧啶化合物的浓度成为125ppm的方式向乳剂(I)中加入水,使其溶解而得到药剂溶液。接着,向在育苗用盆中栽培而得到的黄瓜幼苗(品种“地爬”系,子叶期)散布前述药剂溶液。风干后,滴加接种黄瓜灰霉病菌(*Botrytis cinerea*)的分生孢子悬浮液(处理区)。作为对照,通过与上述相同的方法向未散布药剂溶液的黄瓜幼苗进行滴加接种(无处理区)。将它们静置于20℃的湿室中。

[1215] 在从接种起经过了4天的日子,对黄瓜幼苗的叶进行目视观察,求出病斑面积率,

算出防除价。

[1216] 对于表9及表10中记载的二氢嘧啶化合物,进行了黄瓜灰霉病防除试验。任意化合物均显示出75%以上的防除价。

[1217] (试验例5) 小麦白粉病种子处理试验

[1218] 针对小麦种子(品种“Chihoku”),以(二氢嘧啶化合物的重量)/(种子的重量)成为100g/100kg的方式用乳剂(I)进行种子处理。将这些种子播种在盆中,在8~10天后播撒接种小麦白粉病菌(*Erysiphe graminis* f.sp.*tritici*)的分生孢子(处理区)。作为对照,通过与上述相同的方法向未用药剂处理的小麦幼苗进行接种(无处理区)。将它们静置于20℃的温室中。

[1219] 在从接种起经过了7天的日子,对小麦幼苗的叶进行目视观察,求出病斑面积率,算出防除价。

[1220] 对于表11中记载的二氢嘧啶化合物,进行了小麦白粉病种子处理试验。任意化合物均显示出75%以上的防除价。

[1221] [表11]

化合物编号			
A-58	C-89	C-135	C-210
A-60	C-93	C-148	
A-61	C-95	C-154	
A-75	C-97	C-160	
A-76	C-99	C-170	
C-54	C-101	C-176	
C-56	C-107	C-179	
C-73	C-112	C-197	
C-83	C-115	C-199	
C-85	C-117	C-207	

[1222] (试验例6) 小麦白粉病土壤灌注处理试验

[1224] 向播种了小麦种子(品种“Chihoku”)的盆(5.5cm×5.5cm)中,灌注向乳剂(I)中加水而使二氢嘧啶化合物的浓度成为100ppm的药剂溶液10mL,在8~10天后播撒接种小麦白粉病菌(*Erysiphe graminis* f.sp.*tritici*)的分生孢子(处理区)。作为对照,通过与上述相同的方法向未用药剂处理的小麦幼苗进行接种(无处理区)。将它们静置于20℃的温室中。

[1225] 在从接种起经过了7天的日子,对小麦幼苗的叶进行目视观察,求出病斑面积率,算出防除价。

[1226] 对于表12中记载的二氢嘧啶化合物,进行了小麦白粉病土壤灌注处理试验。任意化合物均显示出75%以上的防除价。

[1227] [表12]

化合物编号		
A-58	C-101	C-197
A-60	C-107	C-199
A-75	C-117	C-207
A-76	C-148	C-210
[1228] C-67	C-154	
C-73	C-160	
C-83	C-170	
C-93	C-179	
C-95	C-182	
C-99	C-191	

[1229] 通过以下的试验例表明本发明的二氢嘧啶化合物作为杀线虫剂的有效成分是有用的。

[1230] (试验例7) 针对南方根结线虫的效力

[1231] 将包含南方根结线虫的2龄幼虫(L2)约50只/0.16mL的悬浮液按每1个孔160 μ L的量注入96孔微孔板中,接着将向乳剂(I)中加水而使二氢嘧啶化合物的浓度成为125ppm的药剂溶液按每1个孔40 μ L的量注入。将该板在20 $^{\circ}$ C条件下放置4天。

[1232] 其后,进行生死判定,算出杀线虫率。将10秒没有观察到活动的个体判定为死亡。按照反复2次的方式进行试验。

[1233] 对于化合物编号A-28、A-64、C-92、及C-145的化合物,进行了针对南方根结线虫的效力试验。任意化合物的南方根结线虫的杀线虫率均为60%以上。

[1234] 通过以下的试验例表明本发明的二氢嘧啶化合物作为医疗用·动物用抗真菌剂的有效成分是有用的。

[1235] (试验例8) 针对禾谷镰刀菌(*Fusarium graminearum*)的抗菌试验

[1236] 以二氢嘧啶化合物的浓度成为125ppm的方式向乳剂(I)中加入水,使其溶解而得到药剂溶液。

[1237] 向马铃薯蔗糖酵母提取物培养基中添加禾谷镰刀菌的孢子并使其分散,进而以二氢嘧啶化合物在培养液中的浓度成为15.6ppm的方式添加混合上述的药剂溶液,将它们分注至96孔微孔板上,在暗处于20 $^{\circ}$ C培养4天。

[1238] 培养后,利用酶标仪测定波长405nm处的浊度,与无处理的情况进行比较,求出禾谷镰刀菌的生长抑制率(%)。

[1239] 对于表13中记载的二氢嘧啶化合物,进行了针对禾谷镰刀菌的抗菌试验。任意化合物均显示出50%以上的优异的生长抑制率。

[1240] [表13]

化合物编号					
A-2	A-92	C-32	C-85	C-151	D-5
A-14	A-93	C-33	C-87	C-154	D-7
A-15	A-95	C-34	C-89	C-156	D-8
A-17	A-96	C-36	C-93	C-158	D-9
A-23	A-97	C-39	C-95	C-160	D-11
A-24	A-99	C-41	C-97	C-162	D-13
A-37	A-100	C-43	C-99	C-168	D-14
A-38	A-101	C-45	C-101	C-170	D-20
A-42	A-102	C-47	C-103	C-172	D-22
A-46	A-105	C-49	C-105	C-176	D-39
A-49	A-106	C-54	C-107	C-179	D-40
[1241] A-51	A-107	C-56	C-109	C-182	D-41
A-58	B-7	C-58	C-111	C-183	D-43
A-60	B-8	C-60	C-112	C-186	D-48
A-61	C-2	C-62	C-115	C-188	D-49
A-63	C-4	C-63	C-117	C-194	D-50
A-64	C-6	C-67	C-122	C-197	D-52
A-69	C-10	C-69	C-124	C-199	D-53
A-70	C-12	C-71	C-126	C-202	D-54
A-75	C-14	C-73	C-127	C-207	D-55
A-76	C-15	C-75	C-129	C-210	D-56
A-79	C-22	C-77	C-135	C-213	D-63
A-83	C-24	C-79	C-137	C-219	
A-88	C-25	C-81	C-141	D-1	
A-90	C-29	C-83	C-148	D-2	

[1242] (试验例9) 针对黑曲霉的抗菌试验

[1243] 向Vogel培养基中添加黑曲霉的孢子并使其分散,进而添加混合已溶解于二甲基亚砷中的二氢嘧啶化合物而使其成为25ppm,将它们分注至96孔微孔板上,在暗处于25℃培养4天。

[1244] 培养后,利用酶标仪测定波长405nm处的浊度,与无处理的情况进行比较,求出黑曲霉的生长抑制率(%)。

[1245] 对于表14中记载的二氢嘧啶化合物,进行了针对黑曲霉的抗菌试验。任意化合物均显示出50%以上的优异的生长抑制率。

[1246] [表14]

化合物编号				
A-1	A-95	C-89	C-168	D-54
A-7	A-96	C-93	C-170	D-56
A-14	A-97	C-95	C-172	
A-23	A-100	C-99	C-176	
A-24	A-101	C-101	C-179	
A-37	A-102	C-103	C-182	
A-38	C-43	C-107	C-186	
A-42	C-54	C-109	C-188	
A-51	C-56	C-112	C-194	
A-58	C-58	C-115	C-197	
A-60	C-60	C-117	C-199	
A-61	C-62	C-124	C-202	
A-63	C-63	C-126	C-207	
A-75	C-69	C-129	C-210	
A-76	C-73	C-135	C-213	
A-79	C-75	C-137	D-11	
A-80	C-77	C-141	D-20	
A-88	C-79	C-148	D-22	
A-90	C-81	C-154	D-52	
A-93	C-83	C-160	D-53	

[1247]

[1248] 产业上的可利用性

[1249] 从本发明的二氢嘧啶化合物中随机选择的化合物发挥如上所述的效果,因此,本发明的二氢嘧啶化合物(包括没有全部例示出来的化合物)是具有杀菌·抗菌效果及杀线虫效果、不会对植物体产生药害、对人畜鱼类的毒性、对环境的影响小的化合物,作为农药、杀线虫剂、及医疗用·动物用抗真菌剂是有用的。