

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4395912号  
(P4395912)

(45) 発行日 平成22年1月13日(2010.1.13)

(24) 登録日 平成21年10月30日(2009.10.30)

(51) Int. Cl. F I  
**CO7D 231/52 (2006.01)** CO7D 231/52  
**AO1N 43/56 (2006.01)** AO1N 43/56 F  
**AO1P 3/00 (2006.01)** AO1P 3/00

請求項の数 17 (全 97 頁)

(21) 出願番号	特願平11-100012	(73) 特許権者	000002093
(22) 出願日	平成11年4月7日(1999.4.7)		住友化学株式会社
(65) 公開番号	特開2000-226374(P2000-226374A)		東京都中央区新川二丁目27番1号
(43) 公開日	平成12年8月15日(2000.8.15)	(74) 代理人	100113000
審査請求日	平成18年2月3日(2006.2.3)		弁理士 中山 亨
(31) 優先権主張番号	特願平10-113290	(74) 代理人	100151909
(32) 優先日	平成10年4月23日(1998.4.23)		弁理士 坂元 徹
(33) 優先権主張国	日本国(JP)	(72) 発明者	橘爪 雅也
(31) 優先権主張番号	特願平10-282487		兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会社内
(32) 優先日	平成10年10月5日(1998.10.5)	(72) 発明者	木村 教男
(33) 優先権主張国	日本国(JP)		兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会社内
(31) 優先権主張番号	特願平10-339441		
(32) 優先日	平成10年11月30日(1998.11.30)		
(33) 優先権主張国	日本国(JP)		

最終頁に続く

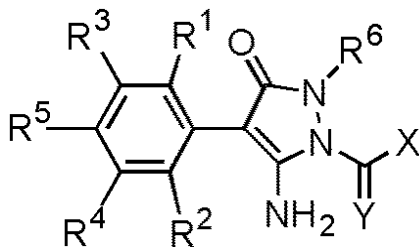
(54) 【発明の名称】 ピラゾリノン誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式 化1

〔化1〕



〔式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は同一もしくは相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C1～C5アルキル基、C1～C5ハロアルキル基、C1～C5アルコキシ基、C1～C3アルコキシC1～C3アルキル基、C1～C3アルコキシC1～C3アルコキシ基、C1～C5ハロアルコキシ基、C1～C5アルキルチオ基、C1～C5ハロアルキルチオ基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、C1～C5アルキル基、C1～C5アルコキシ基、C1～C5アルキルチオ基、C1～C5ハロアルキル基、C1～C5ハロアルコキシ基、C1～C5ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)もしくはフェノキシ基(該フェノキシ基はハロゲン原子、C1～C5アルキル基、C1～C5アルコキシ基、C1～C5ア

ルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハ  
 ロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていても  
 よい)を表すか、あるいは、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のうち隣接する2つが末端で  
 結合して、CH = CH - CH = CHで示される基、メチレンジオキシ基(該メチレンジオ  
 キシ基はハロゲン原子で置換されていてもよい)、トリメチレン基、テトラメチレン基、  
 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>で示される基もしくはOCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)で示される基を表し、R<sup>6</sup>はC  
 1 ~ C 10 アルキル基、C 2 ~ C 10 アルケニル基、C 2 ~ C 10 アルキニル基、C 1 ~  
 C 10 ハロアルキル基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニル基、C 2 ~ C 10 ハロアルキニル基  
 、C 1 ~ C 5 アルコキシC 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルキルチオC 1 ~ C 5 アル  
 キル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC  
 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C  
 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 ハロアルキル基、シアノC 1 ~ C 5 アルキル基、シアノC  
 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシカルボニルC 1 ~ C 5 アルキル基、C 3  
 ~ C 8 脂環式炭化水素基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、  
 不飽和結合を含んでいてもよい)、C 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基で置換されたC 1 ~ C 5  
 アルキル基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を  
 含んでいてもよい)、フェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基  
 、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C  
 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より  
 選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、またはC 7 ~ C 17 アラルキル基(該  
 アラルキル基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~  
 C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~  
 C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されて  
 いてもよい)を表し、XはC 1 ~ C 10 アルキル基、C 2 ~ C 10 アルケニル基、C 2 ~  
 C 10 アルキニル基、C 1 ~ C 10 ハロアルキル基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニル基、C  
 2 ~ C 10 ハロアルキニル基、C 1 ~ C 5 アルコキシC 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5  
 アルキルチオC 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 アルキル基、  
 C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1  
 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 ハロアルキル基、シアノC 1  
 ~ C 5 アルキル基、シアノC 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシカルボニル  
 基で置換されたC 1 ~ C 5 アルキル基、C 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基で置換されたC 1 ~  
 C 5 アルキル基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結  
 合を含んでいてもよい)、フェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキ  
 ル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基  
 、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群  
 より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C 7 ~ C 17 アラルキル基(該ア  
 ラルキル基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C  
 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C  
 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されて  
 いてもよい)、C 1 ~ C 10 アルコキシ基、C 2 ~ C 10 アルケニルオキシ基、C 2 ~ C 1  
 0 アルキニルオキシ基、C 1 ~ C 10 ハロアルコキシ基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニルオ  
 キシ基、C 2 ~ C 10 ハロアルキニルオキシ基、C 1 ~ C 5 アルコキシC 1 ~ C 5 アルコ  
 キシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオC 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC  
 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~  
 C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5  
 ハロアルコキシ基、シアノC 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルコキシカルボニルC  
 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基で置換されたC 1 ~ C 5 アルコキシ  
 基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を含んで  
 いてもよい)、フェノキシ基(該フェノキシ基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C  
 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~

10

20

30

40

50

C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されている(よい)、C 7 ~ C 17 アラルキルオキシ基(該アラルキルオキシ基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されている(よい))、C 1 ~ C 10 アルキルチオ基、C 2 ~ C 10 アルケニルチオ基、C 2 ~ C 10 アルキニルチオ基、C 1 ~ C 10 ハロアルキルチオ基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニルチオ基、C 2 ~ C 10 ハロアルキニルチオ基、C 1 ~ C 5 アルコキシC 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオC 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基、シアノC 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 アルコキシカルボニルC 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基で置換されたC 1 ~ C 5 アルキルチオ基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されている(よい)、不飽和結合を含んでいてもよい)、フェニルチオ基(該フェニルチオ基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されている(よい))、C 7 ~ C 17 アラルキルチオ基(該アラルキルチオ基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されている(よい))またはC 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されている(よい)、不飽和結合を含んでいてもよい)を表し、Y は酸素原子または硫黄原子を表す。]

10

20

で示されるピラゾリノン誘導体。

【請求項 2】

上記一般式 化 1 において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>が同一もしくは相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基であるか、あるいは、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のうち隣接する2つが末端で結合して、CH = CH - CH = CHで示される基である請求項 1 に記載のピラゾリノン誘導体。

30

【請求項 3】

上記一般式 化 1 において、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>が水素原子である請求項 1 または 2 に記載のピラゾリノン誘導体。

【請求項 4】

上記一般式 化 1 において、R<sup>1</sup>がハロゲン原子またはハロゲン原子で置換されている(よい)メチル基であり、R<sup>2</sup>が水素原子、ハロゲン原子またはハロゲン原子で置換されている(よい)メチル基である請求項 1、2 または 3 に記載のピラゾリノン誘導体。

【請求項 5】

上記一般式 化 1 において、R<sup>6</sup>がC 1 ~ C 10 アルキル基、C 2 ~ C 10 アルケニル基、C 2 ~ C 10 アルキニル基、C 1 ~ C 10 ハロアルキル基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニル基、C 2 ~ C 10 ハロアルキニル基、C 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されている(よい)、不飽和結合を含んでいてもよい)またはC 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基で置換されたC 1 ~ C 5 アルキル基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されている(よい)、不飽和結合を含んでいてもよい)である請求項 1、2、3 または 4 に記載のピラゾリノン誘導体。

40

【請求項 6】

上記一般式 化 1 において、X がC 1 ~ C 10 アルキル基、C 2 ~ C 10 アルケニル基、C 2 ~ C 10 アルキニル基、C 1 ~ C 10 ハロアルキル基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニル基、C 2 ~ C 10 ハロアルキニル基、フェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、C 1 ~

50

C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C 1 ~ C 10 アルコキシ基、C 2 ~ C 10 アルケニルオキシ基、C 2 ~ C 10 アルキニルオキシ基、C 1 ~ C 10 ハロアルコキシ基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニルオキシ基、C 2 ~ C 10 ハロアルキニルオキシ基、フェノキシ基 (該フェノキシ基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C 1 ~ C 10 アルキルチオ基、C 2 ~ C 10 アルケニルチオ基、C 2 ~ C 10 アルキニルチオ基、C 1 ~ C 10 ハロアルキルチオ基、C 2 ~ C 10 ハロアルケニルチオ基、C 2 ~ C 10 ハロアルキニルチオ基、フェニルチオ基 (該フェニルチオ基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい) または C 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基 (該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を含んでいてもよい) である請求項 1、2、3、4 または 5 に記載のピラゾリノン誘導体。

10

【請求項 7】

上記一般式 化 1 において、X がメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基または 2 - プロピニルチオ基である請求項 1、2、3、4 または 5 に記載のピラゾリノン誘導体。

20

【請求項 8】

上記一般式 化 1 において、R<sup>6</sup> がイソプロピル基、1 - メチルブチル基または sec - ブチル基である請求項 1、2、3、4、5、6 または 7 に記載のピラゾリノン誘導体。

【請求項 9】

上記一般式 化 1 において、Y が酸素原子である請求項 1、2、3、4、5、6、7 または 8 に記載のピラゾリノン誘導体。

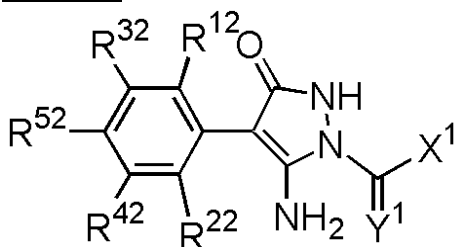
【請求項 10】

請求項 1、2、3、4、5、6、7、8 または 9 に記載のピラゾリノン誘導体を有効成分として含有することを特徴とする植物病害防除剤。

【請求項 11】

一般式 化 3

(化 3)



[ 式中、R<sup>12</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>32</sup>、R<sup>42</sup> および R<sup>52</sup> は同一もしくは相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 3 アルコキシ C 1 ~ C 3 アルキル基、C 1 ~ C 3 アルコキシ C 1 ~ C 3 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい) もしくはフェノキシ基 (該フェノキシ基はハロゲン原子、C 1 ~ C 5 アルキル基、C 1 ~ C 5 アルコキシ基、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されてい

30

40

50

てもよい)を表すか、あるいは、 $R^{12}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{42}$ および $R^{52}$ のうち隣接する2つが末端で結合して、 $CH=CH-CH=CH$ で示される基、メチレンジオキシ基(該メチレンジオキシ基はハロゲン原子で置換されていてもよい)、トリメチレン基、テトラメチレン基、 $OCH_2CH_2$ で示される基もしくは $OCH_2CH(CH_3)$ で示される基を表し、 $X^1$ はC1~C10アルキル基、C2~C10アルケニル基、C2~C10アルキニル基、C1~C10ハロアルキル基、C2~C10ハロアルケニル基、C2~C10ハロアルキニル基、C1~C5アルコキシC1~C5アルキル基、C1~C5アルキルチオC1~C5アルキル基、C1~C5ハロアルコキシC1~C5アルキル基、C1~C5ハロアルコキシC1~C5ハロアルキル基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5アルキル基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5ハロアルキル基、シアノC1~C5アルキル基、シアノC1~C5ハロアルキル基、C1~C5アルコキシカルボニル基で置換されたC1~C5アルキル基、C3~C8脂環式炭化水素基で置換されたC1~C5アルキル基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を含んでいてもよい)、フェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、C1~C5アルキル基、C1~C5アルコキシ基、C1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルキル基、C1~C5ハロアルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C7~C17アラルキル基(該アラルキル基はハロゲン原子、C1~C5アルキル基、C1~C5アルコキシ基、C1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルキル基、C1~C5ハロアルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C1~C10アルコキシ基、C2~C10アルケニルオキシ基、C2~C10アルキニルオキシ基、C1~C10ハロアルコキシ基、C2~C10ハロアルケニルオキシ基、C2~C10ハロアルキニルオキシ基、C1~C5アルコキシC1~C5アルコキシ基、C1~C5アルキルチオC1~C5アルコキシ基、C1~C5ハロアルコキシC1~C5アルコキシ基、C1~C5ハロアルコキシC1~C5ハロアルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5アルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5ハロアルコキシ基、シアノC1~C5アルコキシ基、C1~C5アルコキシカルボニルC1~C5アルコキシ基、C3~C8脂環式炭化水素基で置換されたC1~C5アルコキシ基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を含んでいてもよい)、フェノキシ基(該フェノキシ基はハロゲン原子、C1~C5アルキル基、C1~C5アルコキシ基、C1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルキル基、C1~C5ハロアルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C7~C17アラルキルオキシ基(該アラルキルオキシ基はハロゲン原子、C1~C5アルキル基、C1~C5アルコキシ基、C1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルキル基、C1~C5ハロアルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C1~C10アルキルチオ基、C2~C10アルケニルチオ基、C2~C10アルキニルチオ基、C1~C10ハロアルキルチオ基、C2~C10ハロアルケニルチオ基、C2~C10ハロアルキニルチオ基、C1~C5アルコキシC1~C5アルキルチオ基、C1~C5アルキルチオC1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルコキシC1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5ハロアルキルチオ基、シアノC1~C5アルキルチオ基、C1~C5アルコキシカルボニルC1~C5アルキルチオ基、C3~C8脂環式炭化水素基で置換されたC1~C5アルキルチオ基(該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を含んでいてもよい)、フェニルチオ基(該フェニルチオ基はハロゲン原子、C1~C5アルキル基、C1~C5アルコキシ基、C1~C5アルキルチオ基、C1~C5ハロアルキル基、C1~C5ハロアルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C7~C17アラルキルチオ基(該アラルキルチオ基はハロゲン原子、C1~C5アルキル基、C1~C5アルコキシ基、C1

10

20

30

40

50

～ C 5 アルキルチオ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキル基、C 1 ～ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい) または C 3 ～ C 8 脂環式炭化水素基 (該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を含んでいてもよい) を表し、Y<sup>1</sup>は酸素原子または硫黄原子を表す。]

で示されるピラゾリノン化合物。

【請求項 1 2】

上記一般式 化 3 において、R<sup>12</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>32</sup>、R<sup>42</sup>および R<sup>52</sup>は同一もしくは相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C 1 ～ C 5 アルキル基、C 1 ～ C 5 ハロアルキル基、C 1 ～ C 5 アルコキシ基であるか、あるいは、R<sup>12</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>32</sup>、R<sup>42</sup>および R<sup>52</sup>のうち隣接する 2 つが末端で結合して、CH = CH - CH = CH で示される基である請求項 1 1 に記載のピラゾリノン化合物。

10

【請求項 1 3】

上記一般式 化 3 において、R<sup>32</sup>、R<sup>42</sup>および R<sup>52</sup>が水素原子である、請求項 1 1 または 1 2 に記載のピラゾリノン化合物。

【請求項 1 4】

上記一般式 化 3 において、R<sup>12</sup>がハロゲン原子またはハロゲン原子で置換されていてもよいメチル基であり、R<sup>22</sup>が水素原子、ハロゲン原子またはハロゲン原子で置換されていてもよいメチル基である請求項 1 1、1 2 または 1 3 に記載のピラゾリノン化合物。

20

【請求項 1 5】

上記一般式 化 3 において、X<sup>1</sup>が C 1 ～ C 1 0 アルキル基、C 2 ～ C 1 0 アルケニル基、C 2 ～ C 1 0 アルキニル基、C 1 ～ C 1 0 ハロアルキル基、C 2 ～ C 1 0 ハロアルケニル基、C 2 ～ C 1 0 ハロアルキニル基、C 1 ～ C 1 0 アルコキシ基、C 1 ～ C 1 0 ハロアルコキシ基、C 2 ～ C 1 0 アルケニルオキシ基、C 2 ～ C 1 0 ハロアルケニルオキシ基、C 2 ～ C 1 0 アルキニルオキシ基、C 2 ～ C 1 0 ハロアルキニルオキシ基、フェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、C 1 ～ C 5 アルキル基、C 1 ～ C 5 アルコキシ基、C 1 ～ C 5 アルキルチオ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキル基、C 1 ～ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、フェノキシ基 (該フェノキシ基はハロゲン原子、C 1 ～ C 5 アルキル基、C 1 ～ C 5 アルコキシ基、C 1 ～ C 5 アルキルチオ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキル基、C 1 ～ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい)、C 1 ～ C 1 0 アルキルチオ基、C 2 ～ C 1 0 アルケニルチオ基、C 2 ～ C 1 0 アルキニルチオ基、C 1 ～ C 1 0 ハロアルキルチオ基、C 2 ～ C 1 0 ハロアルケニルチオ基、C 2 ～ C 1 0 ハロアルキニルチオ基、フェニルチオ基 (該フェニルチオ基はハロゲン原子、C 1 ～ C 5 アルキル基、C 1 ～ C 5 アルコキシ基、C 1 ～ C 5 アルキルチオ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキル基、C 1 ～ C 5 ハロアルコキシ基、C 1 ～ C 5 ハロアルキルチオ基及びシアノ基からなる群より選ばれる一種以上の基で置換されていてもよい) または C 3 ～ C 8 脂環式炭化水素基 (該脂環式炭化水素基はハロゲン原子で置換されていてもよく、不飽和結合を含んでいてもよい) である請求項 1 1、1 2、1 3 または 1 4 に記載のピラゾリノン化合物。

30

40

【請求項 1 6】

上記一般式 化 3 において、X<sup>1</sup>がメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基または 2 - プロペニルチオ基である請求項 1 1、1 2、1 3、1 4 または 1 5 に記載のピラゾリノン化合物。

【請求項 1 7】

上記一般式 化 3 において、Y<sup>1</sup>が酸素原子である請求項 1 1、1 2、1 3、1 4、1 5 または 1 6 に記載のピラゾリノン化合物。

【発明の詳細な説明】

【0 0 0 1】

【発明の属する技術分野】

50

本発明はピラゾリノン誘導体、その用途及びその製造中間体に関する。

【0002】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は優れた植物病害防除効力を有する化合物を提供することを課題とする。

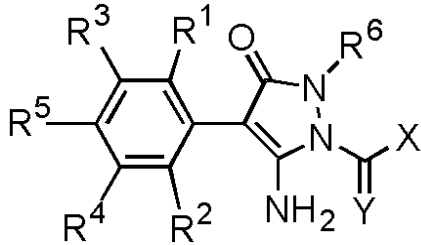
【0003】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは、鋭意検討した結果、後記一般式 化4で示されるピラゾリノン誘導体が優れた植物病害防除効力を有することを見出し本発明に至った。即ち、本発明は、一般式

化4

【化4】



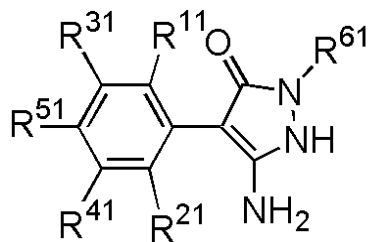
[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ および $R^5$ は同一もしくは相異なり、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシ基、アルコシアルキル基、アルコシアルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、ハロアルキルチオ基、シアノ基、ニトロ基、置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいフェノキシ基を表すか、あるいは、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ および $R^5$ のうち隣接する2つが末端で結合して、 $CH=CH-CH=CH$ で示される基、ハロゲン原子で置換されていてもよいメチレンジオキシ基、または、酸素原子を1つ含んでいてもよくアルキル基で置換されていてもよいアルキレン基を表し、 $R^6$ は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよい脂環式炭化水素基を表し、 $X$ は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいアルケニルオキシ基、置換されていてもよいアルキニルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいアルキルチオ基、置換されていてもよいアルケニルチオ基、置換されていてもよいアルキニルチオ基、置換されていてもよいフェニルチオ基または置換されていてもよい脂環式炭化水素基を表し、 $Y$ は酸素原子または硫黄原子を表す。]

で示されるピラゾリノン誘導体（以下、本発明化合物と記す）及び本発明化合物を有効成分として含有する植物病害防除剤を提供する。

【0004】

本発明はさらに、本発明化合物の製造中間体として有用な、一般式 化5

【化5】



[式中、 $R^{11}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ および $R^{51}$ は同一もしくは相異なり、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシ基、アルコシアルキル基、アルコシアルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、ハロアルキルチオ基、シアノ基、ニトロ基、置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいフェノキシ基を表すか、あるいは、 $R^{11}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ および $R^{51}$ のうち隣接する2つが末端で結合

10

20

30

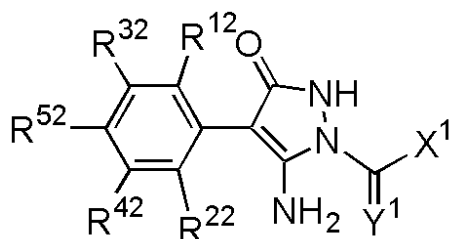
40

50

して、 $\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}$ で示される基、ハロゲン原子で置換されていてもよいメチレンジオキシ基、または、酸素原子を1つ含んでいてもよくアルキル基で置換されていてもよいアルキレン基を表し、 $\text{R}^{61}$ は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基または置換されていてもよい脂環式炭化水素基を表す。]

で示されるピラゾリノン化合物(以下、製造中間体Aと記す)および一般式 化6

【化6】



[式中、 $\text{R}^{12}$ 、 $\text{R}^{22}$ 、 $\text{R}^{32}$ 、 $\text{R}^{42}$ および $\text{R}^{52}$ は同一もしくは相異なり、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシ基、アルコシアルキル基、アルコシアルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、ハロアルキルチオ基、シアノ基、ニトロ基、置換されていてもよいフェニル基または置換されていてもよいフェノキシ基を表すか、あるいは、 $\text{R}^{11}$ 、 $\text{R}^{21}$ 、 $\text{R}^{31}$ 、 $\text{R}^{41}$ および $\text{R}^{51}$ のうち隣接する2つが末端で結合して、 $\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}$ で示される基、ハロゲン原子で置換されていてもよいメチレンジオキシ基、または、酸素原子を1つ含んでいてもよくアルキル基で置換されていてもよいアルキレン基を表し、 $\text{X}^1$ は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよいアルケニルオキシ基、置換されていてもよいアルキニルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいアルキルチオ基、置換されていてもよいアルケニルチオ基、置換されていてもよいアルキニルチオ基、置換されていてもよいフェニルチオ基または置換されていてもよい脂環式炭化水素基を表し、 $\text{Y}^1$ は酸素原子または硫黄原子を表す。]

で示されるピラゾリノン化合物(以下、製造中間体Bと記す)を提供する。

【0005】

【発明の実施の形態】

本発明において、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^{11}$ 、 $\text{R}^{21}$ 、 $\text{R}^{31}$ 、 $\text{R}^{41}$ 、 $\text{R}^{51}$ 、 $\text{R}^{12}$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^{32}$ 、 $\text{R}^{42}$ および $\text{R}^{52}$ で示されるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子等があげられ、アルキル基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}5$ アルキル基等(例えばメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*tert*-ブチル基等)があげられ、ハロアルキル基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}5$ ハロアルキル基等(例えばトリフルオロメチル基、テトラフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基等)があげられ、アルコキシ基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}5$ アルコキシ基等(例えばメトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基等)があげられ、アルコシアルキル基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}3$ アルコキシ $\text{C}1\sim\text{C}3$ アルキル基等(例えば、メトキシメチル基等)があげられ、アルコシアルコキシ基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}3$ アルコキシ $\text{C}1\sim\text{C}3$ アルコキシ基等(例えば、メトキシメトキシ基等)があげられ、ハロアルコキシ基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}5$ ハロアルコキシ基等(例えば、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、テトラフルオロエトキシ基等)があげられ、アルキルチオ基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}5$ アルキルチオ基等(例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等)があげられ、ハロアルキルチオ基としては、 $\text{C}1\sim\text{C}5$ ハロアルキルチオ基等(例えば、トリフルオロメチルチオ基等)があげられ、置換されていてもよいフェニル基は、同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいフェニル基を意味し、置換されていてもよいフェノキシ基は、同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいフェノキシ基を意味し、ここで、かかる置換されていてもよいフェニル基および置換されていてもよいフェノキシ基における置換

基としては、例えば、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等）、C 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）、C 1 ~ C 5 アルコキシ基（例えば、メトキシ基、エトキシ基等）、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基（例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基（好ましくはC 1 ~ C 2 ハロアルキル基：例えばトリフルオロメチル基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基（好ましくはC 1 ~ C 2 ハロアルコキシ基：例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基（好ましくはC 1 ~ C 2 ハロアルキルチオ基：例えばトリフルオロメチルチオ基等）またはシアノ基等があげられる。

また、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ または $R^{11}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ 及び $R^{51}$ または $R^{12}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{42}$ 及び $R^{52}$ において、夫々その隣接する2つが末端で結合し、例えばメチレンジオキシ基、ジフルオロメチレンジオキシ基等のハロゲン原子で置換されていてもよいメチレンジオキシ基または例えばトリメチレン基、テトラメチレン基、 $OCH_2CH_2$ で示される基、 $OCH_2CH(CH_3)$ で示される基等の酸素原子を含んでもよくアルキル基（例えばメチル基等のC 1 ~ C 4 アルキル基）で置換されていてもよいアルキレン基（例えばC 1 ~ C 6 アルキレン基）を形成することもできる。

本発明化合物において、植物病害防除効力の点から、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ および $R^5$ のうち、1つ以上3つ以下がハロゲン原子（特に塩素原子）、アルキル基（特にメチル基）またはハロアルキル基（特にトリフルオロメチル基）であり、残りの全てが水素原子である化合物が好ましい。更に、灰色かび病防除効力の点から、 $R^3$ 、 $R^4$ および $R^5$ が水素原子である化合物がより好ましい。

#### 【0006】

本発明において $R^6$ および $R^{61}$ で示される、置換されていてもよいアルキル基としては、C 1 ~ C 10 アルキル基（例えばエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、1-メチルブチル基、1-エチルプロピル基等）、C 1 ~ C 10 ハロアルキル基（例えば、1-メチル-2,2,2-トリフルオロエチル基、1-メチル-3-クロロプロピル基等）、C 1 ~ C 5 アルコキシC 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、2-メトキシエチル基等）、C 1 ~ C 5 アルキルチオC 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、2-メチルチオエチル基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、1-メチル-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)エチル基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシC 1 ~ C 5 ハロアルキル基、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、1-メチル-(2,2,2-トリフルオロエチルチオ)エチル基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオC 1 ~ C 5 ハロアルキル基、シアノC 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、1-シアノエチル基等）、シアノC 1 ~ C 5 ハロアルキル基（例えば、1-シアノ-2,2,2-トリフルオロエチル基等）、C 1 ~ C 5 アルコキシカルボニルC 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、1-(メトキシカルボニル)エチル基等）、ハロゲン原子で置換されていてもよく不飽和結合を含んでいてもよいC 3 ~ C 8 脂環式炭化水素基で置換されたC 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、1-シクロプロピルエチル基等）、または同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいC 7 ~ C 17 アラルキル基（例えば、ベンジル基、*p*-メチルベンジル基、*m*-メチルベンジル基等）[該置換基としては、例えば、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等）、C 1 ~ C 5 アルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）、C 1 ~ C 5 アルコキシ基（例えば、メトキシ基、エトキシ基等）、C 1 ~ C 5 アルキルチオ基（例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルキル基（好ましくはC 1 ~ C 2 ハロアルキル基：例えばトリフルオロメチル基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルコキシ基（好ましくはC 1 ~ C 2 ハロアルコキシ基：例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等）、C 1 ~ C 5 ハロアルキルチオ基（好ましくはC 1 ~ C 2 ハロアルキルチオ基：例えばトリフルオロメチルチオ基等）またはシアノ基等があげられる。]等があげられ、置換されていてもよいアルケニル基としては、C 2 ~ C 10 アルケニル基（例えば、1-メチル-2-プロペニル基等）、C 2 ~ C 10 ハロアルケニル基（例えば、2-クロロ-1-メチル-2-プロペニル基等）があげられ、置換されていてもよいアルキニル基として

10

20

30

40

50

は、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル基（例えば、1-メチル-2-プロピニル基等）、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキニル基（例えば、1-メチル-2-クロロ-3-ブチニル基等）等があげられ、置換されていてもよい脂環式炭化水素基としては、ハロゲン原子で置換されていてもよく不飽和結合を含んでいてもよいC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>脂環式炭化水素基（例えば、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等）があげられる。

本発明においてR<sup>6</sup>で示される置換されていてもよいフェニル基としては、同一もしくは相異なる置換基で1～5個置換されていてもよいフェニル基〔該置換基としては、例えば、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基（例えば、メトキシ基、エトキシ基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキルチオ基（例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキル基（好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>ハロアルキル基：例えばトリフルオロメチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルコキシ基（好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>ハロアルコキシ基：例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキルチオ基（好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>ハロアルキルチオ基：例えばトリフルオロメチルチオ基等）またはシアノ基等があげられる。〕等があげられる。

#### 【0007】

本発明において、XまたはX<sup>1</sup>で示される、置換されていてもよいアルキル基としては、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>アルキル基（好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基：例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、2-メチルブチル基、イソペンチル基、tert-ブチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキル基（例えば、トリフルオロメチル基、テトラフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3-クロロプロピル基、4-クロロブチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、メチルチオメチル基、2-メチルチオエチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、2,2,2-トリフルオロエトキシメチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキルチオC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、2,2,2-トリフルオロエチルチオメチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキルチオC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキル基、シアノC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、シアノメチル基、1-シアノエチル基、2-シアノエチル基等）、シアノC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、1-(メトキシカルボニル)エチル基等）、ハロゲン原子で置換されていてもよく不飽和結合を含んでいてもよいC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>脂環式炭化水素基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基等）または同一もしくは相異なる置換基で1～5個置換されていてもよいC<sub>7</sub>～C<sub>17</sub>アラルキル基（例えば、ベンジル基、*p*-メチルベンジル基、*m*-ジメチルベンジル基等）〔該置換基としては、例えば、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基（例えば、メトキシ基、エトキシ基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキルチオ基（例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキル基（好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>ハロアルキル基：例えばトリフルオロメチル基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルコキシ基（好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>ハロアルコキシ基：例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等）、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>ハロアルキルチオ基（好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>ハロアルキルチオ基：例えばトリフルオロメチルチオ基等）またはシアノ基等があげられる。〕等があげられ、置換されていてもよいアルケニル基としては、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルケニル基（例えば、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基等）、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルケニル基（例えば、3,3,3-トリフルオロプロペニル基、1,1,2,3,3-ペンタフルオロ-2-プロペニル基等）等が挙げられ、置換されていてもよいアルキニル基としては、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキニル基（例えば、エチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基等）またはC<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>ハロアルキニル基（例えば、3,3,3-テトラフルオロブ

10

20

30

40

50

ロピニル基等)等があげられ、置換されていてもよいフェニル基としては、同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいフェニル基[該置換基としては、例えば、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等)、C1~C5アルキル基(例えば、メチル基、エチル基等)、C1~C5アルコキシ基(例えば、メトキシ基、エトキシ基等)、C1~C5アルキルチオ基(例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1~C5ハロアルキル基(好ましくはC1~C2ハロアルキル基:例えばトリフルオロメチル基等)、C1~C5ハロアルコキシ基(好ましくはC1~C2ハロアルコキシ基:例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、C1~C5ハロアルキルチオ基(好ましくはC1~C2ハロアルキルチオ基:例えばトリフルオロメチルチオ基等)またはシアノ基等があげられる。]等があげられ、置換されていてもよいアルコキシ基

10  
20  
30  
40  
50

としては、C1~C10アルコキシ基(好ましくはC1~C5アルコキシ基:例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソブトキシ基、2-メチルブトキシ基、イソペンチルオキシ基等)、C1~C10ハロアルコキシ基(好ましくはC1~C5ハロアルコキシ基:例えばトリフルオロエトキシ基、テトラフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、テトラフルオロプロポキシ基、2-クロロエトキシ基、3-クロロプロポキシ基、4-クロロブトキシ基等)、C1~C5アルコキシC1~C5アルコキシ基(例えば、2-メトキシエトキシ基等)、C1~C5アルキルチオC1~C5アルコキシ基(例えば、2-メチルチオエトキシ基等)、C1~C5ハロアルコキシC1~C5アルコキシ基(例えば、2,2,2-テトラフルオロエトキシメトキシ基等)、C1~C5ハロアルコキシC1~C5ハロアルコキシ基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5アルコキシ基(例えば、2,2,2-トリフルオロエチルチオメトキシ基等)、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5ハロアルコキシ基、シアノC1~C5アルコキシ基(例えば、2-シアノエトキシ基等)、C1~C5アルコキシカルボニルC1~C5アルコキシ基(例えば、2-(メトキシカルボニル)エチル基等)、ハロゲン原子で置換されていてもよく不飽和結合を含んでいてもよいC3~C8脂環式炭化水素基で置換されたC1~C5アルコキシ基(例えば、シクロプロピルメトキシ基、シクロブチルメトキシ基、シクロペンチルメトキシ基、シクロヘキシルメトキシ基等)または同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいC7~C17アラルキルオキシ基(例えば、ベンジルオキシ基等)[該置換基としては、例えば、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等)、C1~C5アルキル基(例えば、メチル基、エチル基等)、C1~C5アルコキシ基(例えば、メトキシ基、エトキシ基等)、C1~C5アルキルチオ基(例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1~C5ハロアルキル基(好ましくはC1~C2ハロアルキル基:例えばトリフルオロメチル基等)、C1~C5ハロアルコキシ基(好ましくはC1~C2ハロアルコキシ基:例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、C1~C5ハロアルキルチオ基(好ましくはC1~C2ハロアルキルチオ基:例えばトリフルオロメチルチオ基等)またはシアノ基等があげられる。]等があげられ、置換されていてもよいアルケニルオキシ基としては、C2~C10アルケニルオキシ基(好ましくはC2~C5アルケニルオキシ基:例えば、2-プロペニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基等)、またはC2~C10ハロアルケニルオキシ基(好ましくはC2~C5ハロアルケニルオキシ基:例えば、2,3,3-テトラフルオロ-2-プロペニルオキシ基、4,4,4-テトラフルオロ-2-ブテニルオキシ基、2,3-ジフルオロ-2-ブテニルオキシ基、2,4,4,4-テトラフルオロ-2-ブテニルオキシ基等)等が挙げられ、置換されていてもよいアルキニルオキシ基としては、C2~C10アルキニルオキシ基(好ましくはC2~C5アルキニルオキシ基:例えば、2-プロピニルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基等)またはC2~C10ハロアルキニルオキシ基(好ましくは: C2~C5ハロアルキニルオキシ基:例えば、4-クロロ-2-ブチニルオキシ基)等が挙げられ、置換されていてもよいフェノキシ基としては、同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいフェノキシ基[該置換基としては、例えば、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等)、C1~C5アルキル基(例えば、メチル基、エチル

基等)、C1~C5アルコキシ基(例えば、メトキシ基、エトキシ基等)、C1~C5アルキルチオ基(例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1~C5ハロアルキル基(好ましくはC1~C2ハロアルキル基:例えばトリフルオロメチル基等)、C1~C5ハロアルコキシ基(好ましくはC1~C2ハロアルコキシ基:例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、C1~C5ハロアルキルチオ基(好ましくはC1~C2ハロアルキルチオ基:例えばトリフルオロメチルチオ基等)またはシアノ基等があげられる。]があげられ、置換されていてもよいアルキルチオ基としては、C1~C10アルキルチオ基(好ましくはC1~C5アルキルチオ基:例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、ブチルチオ基、ペンチルチオ基、イソブチルチオ基、2-メチルブチルチオ基、イソペンチルチオ基等)、C1~C10ハロアルキルチオ基(好ましくはC1~C5ハロアルキルチオ基:例えば、トリフルオロエチルチオ基、テトラフルオロエチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基、テトラフルオロプロピルチオ基、2-クロロエチルチオ基、3-クロロプロピルチオ基、4-クロロブチルチオ基等)、C1~C5アルコキシC1~C5アルキルチオ基(例えば、2-メトキシエチルチオ基等)、C1~C5アルキルチオC1~C5アルキルチオ基(例えば、2-メチルチオエチルチオ基等)、C1~C5ハロアルコキシC1~C5アルキルチオ基(例えば、2,2,2-テトラフルオロエトキシメチルチオ基等)、C1~C5ハロアルコキシC1~C5ハロアルキルチオ基、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5アルキルチオ基(例えば、2,2,2-テトラフルオロエチルチオメチルチオ基等)、C1~C5ハロアルキルチオC1~C5ハロアルキルチオ基、シアノC1~C5アルキルチオ基(例えば、2-シアノエチルチオ基等)、C1~C5アルコキシカルボニルC1~C5アルキルチオ基(例えば、2-(メトキシカルボニル)エチルチオ基等)、ハロゲン原子で置換されていてもよく不飽和結合を含んでいてもよいC3~C8脂環式炭化水素基で置換されたC1~C5アルキルチオ基(例えば、シクロプロピルメチルチオ基、シクロブチルメチルチオ基、シクロペンチルメチルチオ基、シクロヘキシルメチルチオ基、(1-シクロペンテニル)メチルチオ基、(1-シクロヘキセニル)メチルチオ基等)または同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいC7~C17アラルキルチオ基(例えば、ベンジルチオ基等)[該置換基としては、例えば、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等)、C1~C5アルキル基(例えば、メチル基、エチル基等)、C1~C5アルコキシ基(例えば、メトキシ基、エトキシ基等)、C1~C5アルキルチオ基(例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1~C5ハロアルキル基(好ましくはC1~C2ハロアルキル基:例えばトリフルオロメチル基等)、C1~C5ハロアルコキシ基(好ましくはC1~C2ハロアルコキシ基:例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、C1~C5ハロアルキルチオ基(好ましくはC1~C2ハロアルキルチオ基:例えばトリフルオロメチルチオ基等)またはシアノ基等があげられる。]等があげられ、置換されていてもよいアルケニルチオ基としては、C2~C10アルケニルチオ基(好ましくはC2~C5アルケニルチオ基:例えば、2-プロペニルチオ基、2-ブテニルチオ基、3-ブテニルチオ基等)、またはC2~C10ハロアルケニルチオ基(好ましくはC2~C5ハロアルケニルチオ基:例えば、2,3,3-テトラフルオロ-2-プロペニルチオ基、4,4,4-テトラフルオロ-2-ブテニルチオ基、2,3-ジフルオロ-2-ブテニルチオ基、2,4,4,4-テトラフルオロ-2-ブテニルチオ基等)等が挙げられ、置換されていてもよいアルキニルチオ基としては、C2~C10アルキニルチオ基(好ましくはC2~C5アルキニルチオ基:例えば、2-プロピニルチオ基、2-ブチニルチオ基、3-ブチニルチオ基等)またはC2~C10ハロアルキニルチオ基(好ましくはC2~C5ハロアルキニルチオ基)等が挙げられ、置換されていてもよいフェニルチオ基としては、同一もしくは相異なる置換基で1~5個置換されていてもよいフェニルチオ基[該置換基としては、例えば、ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等)、C1~C5アルキル基(例えば、メチル基、エチル基等)、C1~C5アルコキシ基(例えば、メトキシ基、エトキシ基等)、C1~C5アルキルチオ基(例えば、メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1~C5ハロアルキル基(好ましくはC1~C2ハロアルキル基:例えばトリ

10

20

30

40

50

フルオロメチル基等)、C1～C5ハロアルコキシ基(好ましくはC1～C2ハロアルコキシ基:例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、C1～C5ハロアルキルチオ基(好ましくはC1～C2ハロアルキルチオ基:例えばトリフルオロメチルチオ基等)またはシアノ基等があげられる。]があげられ、置換されていてもよい脂環式炭化水素基としては、ハロゲン原子で置換されていてもよく不飽和結合を含んでいてもよいC3～C8脂環式炭化水素基(例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、1-シクロペンテニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロペンテニル基、1,3-シクロペンタジエニル基、2,4-シクロペンタジエニル基、1-シクロヘキセニル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基等)があげられる。

10

## 【0008】

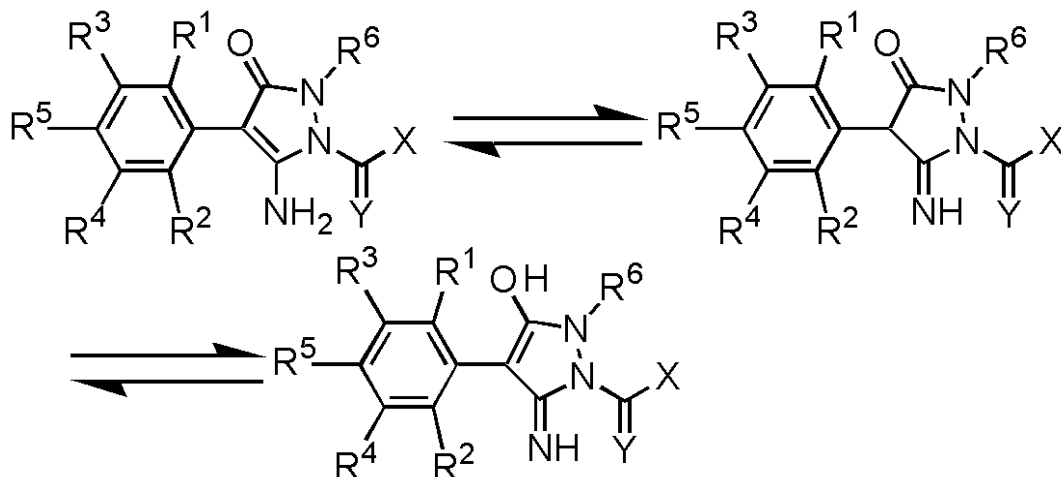
本発明化合物において、植物病害防除効力の点から、Xの好ましい置換基の種類としては、C1～C5アルキル基、C1～C5アルコキシ基、C1～C5ハロアルコキシ基、C2～C5アルケニルオキシ基、C2～C5ハロアルケニルオキシ基、C2～C5アルキニルオキシ基、C2～C5ハロアルキニルオキシ基、C1～C5アルキルチオ基、C1～C5ハロアルキルチオ基、C2～C5アルケニルチオ基、C2～C5ハロアルケニルチオ基、C2～C5アルキニルチオ基、C2～C5ハロアルキニルチオ基があげられる。

## 【0009】

尚、本発明化合物は、下記式 化7で示される種々の互変異性構造の状態が存在し得るが、本発明化合物はこれら全ての互変異性体を含む。

20

## 【化7】



30

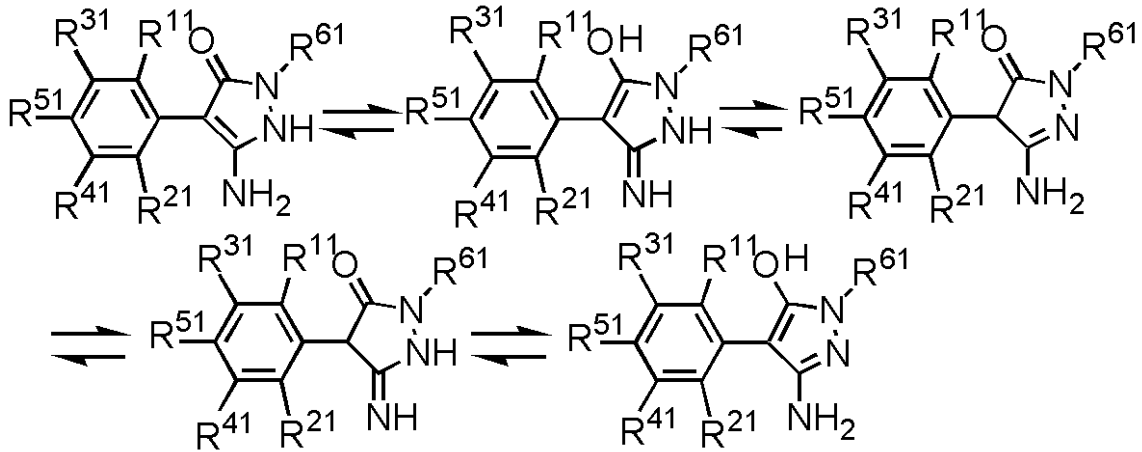
更に、本発明化合物には、二重結合および不斉炭素に由来する立体異性体が存在する場合があるが、本発明化合物には、これらの立体異性体及びその混合物も含まれる。

## 【0010】

また、製造中間体Aは、下記式 化8で示される種々の互変異性構造の状態が存在し得るが、製造中間体Aはこれら全ての互変異性体を含む。

## 【化8】

40

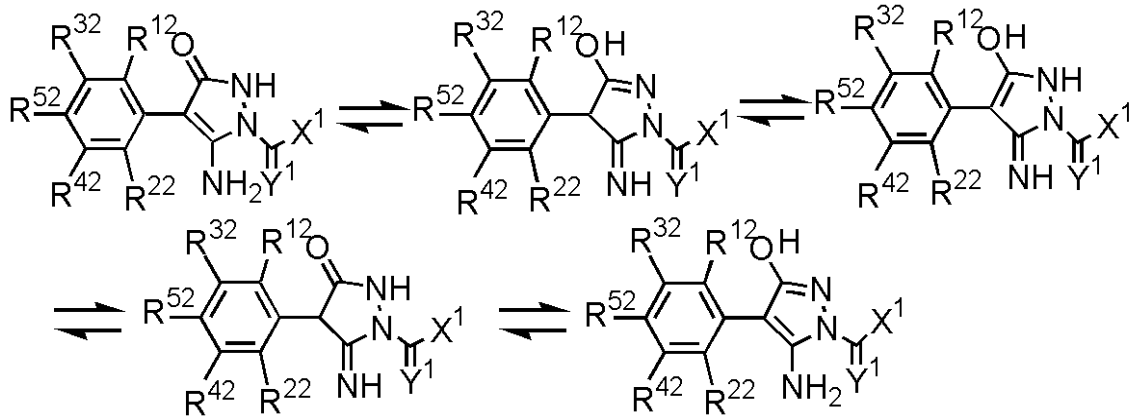


10

更に、製造中間体 A には、二重結合および不斉炭素に由来する立体異性体が存在する場合がありますが、本発明化合物には、これらの立体異性体及びその混合物も含まれる。

製造中間体 B は、下記式 化 9 で示される種々の互変異性構造の状態が存在し得るが、製造中間体 B はこれら全ての互変異性体を含む。

【化 9】



20

30

更に、製造中間体 B には、二重結合および不斉炭素に由来する立体異性体が存在する場合がありますが、製造中間体 B には、これらの立体異性体及びその混合物も含まれる。

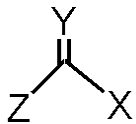
【0011】

本発明化合物は、下記の製造法等により製造することができる。

(製造法 1)

製造中間体 A のアルカリ金属塩と一般式 化 10

【化 10】



40

[式中、X および Y は前記と同じ意味を表し、Z はハロゲン原子 (例えば、塩素原子、臭素原子等) を表す。]

で示される化合物とを有機溶媒中で反応させることによる方法。

該反応の反応温度の範囲は通常 80 ~ 140 であり、反応時間の範囲は通常 0.1 時間 ~ 5 時間である。

反応に供される試剤の量は、製造中間体 A のアルカリ金属塩 1.0 モルに対し、一般式 化 10 で示される化合物は通常、1 ~ 3 モルの割合、好ましくは 1.1 ~ 2.0 モルの割合である。

反応に用いられる有機溶媒としては、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭

50

化水素類、ジエチルエ - テル、1, 4 - ジオキサン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ジイソプロピルエ - テル、ジメトキシエタン等のエ - テル類、ジメチルホルムアミド、あるいはこれらの混合溶媒等があげられ、1, 4 - ジオキサン、ジメトキシエタンを使用することが好ましい。

反応終了後の反応液は、これを水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物を得ることができる。また、該化合物は有機溶媒による洗浄、再結晶、カラムクロマトグラフィ - 等の手段により精製することもできる。

【0012】

製造中間体 A のアルカリ金属塩は、製造中間体 A と、水酸化ナトリウム、無水水酸化リチウムまたは水酸化リチウム一水和物とを共沸脱水条件下に反応させるか、もしくは、製造中間体 A と、水素化ナトリウムまたは水素化リチウムとを反応させることにより、製造することができる。

10

製造中間体 A と、水酸化ナトリウム、無水水酸化リチウムまたは水酸化リチウム一水和物とを共沸脱水条件下に反応させる場合は、該反応の反応温度の範囲は通常 80 ~ 140 であり、反応時間の範囲は通常 0.5 時間 ~ 12 時間である。該反応に供される試剤の量は、製造中間体 A 1 モルに対し、水酸化ナトリウム、無水水酸化リチウムまたは水酸化リチウム一水和物は通常 1 ~ 5 モルの割合、好ましくは 1.1 ~ 2.0 モルの割合であり、反応溶媒としてはトルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類があげられる。

製造中間体 A と水素化ナトリウム、水素化リチウムとを反応させる場合は、該反応の反応時間の範囲は通常 1 時間 ~ 12 時間であり、反応温度の範囲は通常 60 ~ 120 である。該反応に供される試剤の量は、製造中間体 A 1 モルに対し、水素化ナトリウム、水素化リチウムの量は 1 モル ~ 2 モルの割合であり、反応溶媒としてはトルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエ - テル、1, 4 - ジオキサン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ジイソプロピルエ - テル、ジメトキシエタン等のエ - テル類、ジメチルホルムアミドがあげられ、好ましくは 1, 4 - ジオキサン、ジメトキシエタンがあげられる。

20

反応終了後の反応液は、溶媒を減圧留去することにより、製造中間体 A のアルカリ金属塩を得ることができる。

【0013】

一般式 化 10 で示される化合物は、

Org. Syn. 1, 147.

J. Am. Chem. Soc. 73, 3796 (1951)

J. Am. Chem. Soc. 81, 714 (1959)

Angew. Chem. Int. Ed. Engl., 26, 894 (1987)

Synthesis, 760 (1986)

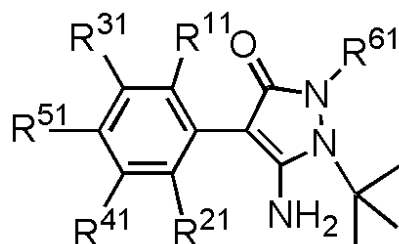
等に記載の方法に準じて製造することができる。

30

【0014】

製造中間体 A は、一般式 化 11

【化 11】



40

[ 式中、R<sup>11</sup>、R<sup>21</sup>、R<sup>31</sup>、R<sup>41</sup>、R<sup>51</sup>および R<sup>61</sup>は前記と同じ意味を表す。 ] で示されるピラゾリノン誘導体を、酸の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応の反応温度の範囲は通常 80 ~ 120 であり、反応時間の範囲は通常 1 ~ 12

50

時間である。

反応に供される試剤の量は、一般式 化 1 1 で示されるピラゾリノン化合物 1 モルに対し、酸は通常 0 . 1 モル ~ 過剰量である。

酸としては、塩酸、硫酸水等の鉱酸の水溶液があげられる。

溶媒としては上記の酸、メタノール、エタノール等のアルコール類、あるいは、それらの混合物等があげられる。

反応終了後の反応液は、これを水酸化ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液等の塩基性水溶液にて中和した後に、濃縮し、水洗することにより、製造中間体 A を得ることができる。また、該化合物は有機溶媒による洗浄、再結晶、カラムクロマトグラフィ - 等の手段により精製することもできる。

10

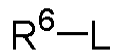
尚、一般式 化 1 1 で示されるピラゾリノン誘導体は、特開平 8 - 2 0 8 6 2 1 公報に記載の方法に準じて製造することができる。

【 0 0 1 5 】

( 製造法 2 )

製造中間体 B のアルカリ金属塩と一般式 化 1 2

【 化 1 2 】



[ 式中、 $R^6$  は前記と同じ意味を表し、L は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、C 1 ~ C 1 0 アルカンスルホニルオキシ基または置換されていてもよいベンゼンスルホニルオキシ基を表す。]

20

で示される化合物とを有機溶媒中で反応させることによる方法。

該反応の反応温度の範囲は通常 6 0 ~ 1 5 0 であり、好ましくは 8 0 ~ 1 2 0 であり、反応時間の範囲は通常 0 . 1 時間 ~ 1 2 時間である。

反応に供される試剤の量は、製造中間体 B のアルカリ金属塩 1 . 0 モルに対し、一般式 化 1 1 で示される化合物は、通常 1 ~ 5 モルの割合、好ましくは 1 . 0 ~ 2 . 5 モルの割合である。

反応に用いられる有機溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、n - ヘキサン、n - ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、テトラヒドロフラン、1 , 4 - ジオキサン、テトラヒドロピラン等のエーテル類、これらの混合溶媒等があげられる。

30

反応終了後の反応液は、これを酸性水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物を得ることができる。また、該化合物は、有機溶媒による洗浄、再結晶、カラムクロマトグラフィ - 等の手段により精製することもできる。

【 0 0 1 6 】

製造中間体 B のアルカリ金属塩は、製造中間体 B と、水酸化ナトリウム、無水水酸化リチウムまたは水酸化リチウム一水和物とを共沸脱水条件下に反応させるか、もしくは、製造中間体 B と水素化ナトリウム、水素化リチウムとを反応させることにより、製造することができる。

40

製造中間体 B と、水酸化ナトリウム、無水水酸化リチウムまたは水酸化リチウム一水和物とを共沸脱水条件下に反応させる場合は、該反応の反応温度の範囲は通常 8 0 ~ 1 4 0 であり、反応時間の範囲は通常 0 . 5 時間 ~ 1 2 時間である。該反応に供される試剤の量は、製造中間体 B 1 モルに対し、水酸化ナトリウム、無水水酸化リチウムまたは水酸化リチウム一水和物は通常 1 ~ 5 モルの割合、好ましくは 1 . 1 ~ 2 . 0 モルの割合であり、反応溶媒としては、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類があげられる。

製造中間体 B と水素化ナトリウム、水素化リチウムとを反応させる場合は、該反応の反応時間の範囲は通常 1 時間 ~ 1 2 時間であり、反応温度の範囲は通常 6 0 ~ 1 2 0 である。該反応に供される試剤の量は、製造中間体 B 1 モルに対し、水素化ナトリウム、水素

50

化リチウムの量は 1 モル ~ 2 モルの割合であり、反応溶媒としてはトルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ジイソプロピルエーテル、ジメトキシエタン等のエーテル類、ジメチルホルムアミドがあげられ、好ましくは 1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンがあげられる。

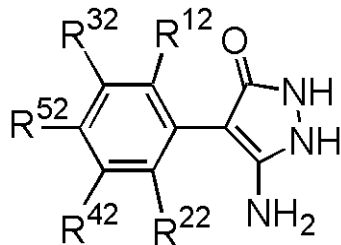
【0017】

製造中間体 B は、例えば以下に示す中間体製造法等により製造することができる。

{ 中間体製造法 1 }

一般式 化 1 3

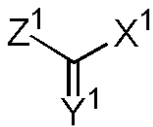
【化 1 3】



[ 式中、 $R^{12}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{42}$ および $R^{52}$ は前記と同じ意味を表す。 ]

で示されるピラゾリノン化合物と一般式 化 1 4

【化 1 4】



[ 式中、 $X^1$ および $Y^1$ は前記と同じ意味を表し、 $Z^1$ はハロゲン原子（例えば、塩素原子、臭素原子等）を表す。 ]

で示される化合物とを有機溶媒中で塩基の存在下に反応させることによる方法。該反応の反応温度の範囲は、通常 0 ~ 100 であり、好ましくは 10 ~ 50 であり、反応時間の範囲は、通常 1 ~ 12 時間である。

反応に供される試剤の量は、一般式 化 1 3 で示されるピラゾリノン化合物 1 モルに対し、一般式 化 1 4 で示される化合物は、通常 0.8 ~ 1.2 モルの割合、好ましくは 1.0 ~ 1.1 モルの割合である。塩基は、通常 1 ~ 5 モルの割合、好ましくは 1.0 ~ 1.5 モルの割合である。

塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化マグネシウム、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸マグネシウム、炭酸カルシウム等のアルカリ土類金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩等の無機塩基、ピリジン、N,N-ジメチルピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基があげられる。また上記無機塩基を使用する場合、水溶液として使用することもできる。

溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、n-ヘキサン、n-ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、テトラヒドロピラン等のエーテル類、これらの混合溶媒等があげられる。また、上記の有機溶媒と共に水を共存させて用いてもよい。この場合、水と有機溶媒は均一でも不均一となってもよい。

反応終了後の反応液は、これを酸性水に注加した後、有機溶媒にて抽出、該有機層を濃縮する等の後処理操作を行うことにより、製造中間体 B を得ることができる。また、該化合物は、有機溶媒による洗浄、再結晶、カラムクロマトグラフィ等の手段により精製することもできる。

10

20

30

40

50

一般式 化 1 3 で示されるピラゾリノン誘導体は、例えば、*J. Chem. Soc. Chem. Commun.* 2 3 , 1 7 5 6 ~ 1 7 5 7 ( 1 9 9 3 ) 等に記載の方法に準じて製造することができる。

一般式 化 1 4 で示される化合物は、

*Org. Syn.* 1 , 1 4 7 .

*J. Am. Chem. Soc.* 7 3 , 3 7 9 6 ( 1 9 5 1 )

*J. Am. Chem. Soc.* 8 1 , 7 1 4 ( 1 9 5 9 )

*Angew. Chem. Int. Ed. Engl.* , 2 6 , 8 9 4 ( 1 9 8 7 )

*Synthesis* , 7 6 0 ( 1 9 8 6 )

等に記載の方法に準じて製造することができる。

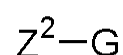
10

【 0 0 1 8 】

{ 中間体製造法 2 }

一般式 化 1 3 で示されるピラゾリノン化合物と一般式 化 1 5

【化 1 5】



[ 式中、G は C 1 ~ C 4 トリアルキシル基 ( 例えば、トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、ジメチルエチルシリル基、ジメチルイソプロピル基、tert - ブチルジメチルシリル基等 ) を表わし、Z<sup>2</sup> はハロゲン原子 ( 例えば、塩素原子、臭素原子、よう素原子等 ) を表す。 ]

20

で示される化合物とを、有機溶媒中、塩基の存在下に反応させ、続いて、一般式化 1 4 で示される化合物と反応させた後に、酸性水中で後処理することによる方法。

該反応の反応温度の範囲は通常 0 ~ 1 0 0 、好ましくは 0 ~ 3 0 であり、反応時間の範囲は通常 1 ~ 1 2 時間である。

反応に供される試剤の量は、一般式 化 1 3 で示されるピラゾリノン化合物 1 モルに対し、一般式 化 1 5 で示される化合物および一般式 化 1 4 で示される化合物は通常 1 ~ 1 . 5 モルの割合、好ましくは 1 . 0 ~ 1 . 2 モルの割合であり、塩基は通常 2 ~ 1 0 モルの割合、好ましくは 2 . 0 ~ 5 . 0 モルの割合である。

塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基があげられる。

溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、n - ヘキサン、n - ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、テトラヒドロフラン、1 , 4 - ジオキサン、テトラヒドロピラン等のエーテル類、これらの混合溶媒等があげられる。

30

反応終了後の反応液は、必要に応じて生成した沈殿をろ別した後、ろ液を酸性水に注加した後、還流条件下、0 . 5 ~ 5 時間、攪拌した後に有機溶媒にて抽出、該有機層を濃縮する等の後処理操作を行うことにより、一般式 化 6 で示されるピラゾリノン化合物を得ることができる。また、該化合物は、有機溶媒による洗浄、再結晶、カラムクロマトグラフィ - 等の手段により精製することもできる。

【 0 0 1 9 】

( 製造法 3 )

40

製造中間体 B と一般式 化 1 2 で示される化合物とを有機溶媒中で塩基の存在下に反応させることによる方法。

該反応の反応温度の範囲は通常 6 0 ~ 1 8 0 であり、好ましくは 8 0 ~ 1 2 0 であり、反応時間の範囲は通常 1 時間 ~ 1 2 時間である。

反応に供される試剤の量は、製造中間体 B のアルカリ金属塩 1 . 0 モルに対し、一般式 化 1 2 で示される化合物は通常 1 ~ 5 モルの割合、好ましくは 1 . 0 ~ 2 . 5 モルの割合であり、塩基は通常 1 ~ 5 モルの割合、好ましくは 1 . 0 ~ 2 . 5 モルの割合である。

反応に供される塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化マグネシウム、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸マグネシウム、炭

50

酸カルシウム等のアルカリ土類金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩、ピリジン、N, N - ジメチルピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基類等があげられる。

反応に用いられる有機溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、n - ヘキサン、n - ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、テトラヒドロフラン、1, 4 - ジオキサソ、テトラヒドロピラン等のエーテル類、これらの混合溶媒等があげられる。

また必要に応じて、反応系中にモレキュラーシーブ（合成ゼオライト）の存在下に反応を行うこともできる。

反応終了後の反応液は、これを酸性水に注加した後、有機溶媒抽出、濃縮等の通常の後処理操作を行うことにより、本発明化合物を得ることができる。また、該化合物は、有機溶媒による洗浄、再結晶、カラムクロマトグラフィ - 等の手段により精製することもできる。

10

#### 【0020】

本発明化合物を植物病害防除剤の有効成分として用いる場合、他の何らの成分も加えずそのまま用いてもよいが、通常は固体担体、液体担体、界面活性剤、その他の製剤用補助剤と混合して、乳剤、水和剤、懸濁剤、粉剤、粒剤等に製剤して用いる。これらの製剤には有効成分として本発明化合物を、重量比で通常、0.1 ~ 99.9%、好ましくは1 ~ 90%含有する。

かかる製剤化の際に用いられる、固体担体としては、例えばカオリンクレ - 、アッタパルジャイトクレ - 、ベントナイト、酸性白土、パイロフィライト、タルク、珪藻土、方解石、トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻粉、尿素、硫酸アンモニウム、合成含水酸化珪素等の微粉末あるいは粒状物等があげられ、液体担体としては、例えばキシレン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、イソプロパノ - ル、エチレングリコ - ル、セロソルブ等のアルコール類、アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類、ダイズ油、綿実油等の植物油、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、水等があげられる。

20

#### 【0021】

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキル（アリ - ル）スルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリ - ルエ - テルリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物等の陰イオン界面活性剤、ポリオキシエチレンアルキルエ - テル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロッ

30

クコポリマ - 、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤等があげられる。製剤用補助剤としては、例えばリグニンスルホン酸塩、アルギン酸塩、ポリビニルアルコール、アラビアガム、CMC（カルボキシメチルセルロ - ス）、PAP（酸性リン酸イソプロピル）等があげられる。

本発明化合物の施用方法としては、茎葉散布、土壌処理、種子消毒等があげられ、さらに、通常、当業者が利用するどのような施用方法にても用いることができる。

#### 【0022】

本発明化合物を植物病害防除剤の有効成分として用いる場合、その有効成分の施用量は、対象植物（作物等）の種類、対象病害の種類、病害の発生程度、製剤形態、施用方法、施用時期、気象条件等によって変化し得るが、1ア - ルあたり通常0.01 ~ 50g、好ましくは0.05 ~ 10gである。

40

乳剤、水和剤、懸濁剤等を水で希釈して施用する場合、その施用濃度は、0.0001 ~ 0.5%、好ましくは0.0005 ~ 0.2%であり、粉剤、粒剤等はなんら希釈することなくそのまま施用する。

#### 【0023】

本発明化合物は、畑地、水田、果樹園、茶園、牧草地、芝生地等の植物病害防除剤として用いることができ、また他の植物病害防除剤と混合して用いることにより、殺菌効力の増強をも期待できる。かかる混合可能な植物病害防除剤としては、例えば、プロピコナゾ - ル、トリアジメノ - ル、プロクロラズ、ベンコナゾ - ル、テブコナゾ - ル、フルシラゾ -

50

ル、ジニコナゾ - ル、ブロムコナゾ - ル、エポキシコナゾ - ル、ジフェノコナゾ - ル、シプロコナゾ - ル、メトコナゾ - ル、トリフルミゾ - ル、テトラコナゾ - ル、マイクロブタニル、フェンブコナゾ - ル、ヘキサコナゾ - ル、フルキンコナゾ - ル、トリティコナゾ - ル ( R P A 4 0 0 7 2 7 )、ピテルタノ - ル、イマザリル、フルトリアホ - ル等のアゾ - ル系殺菌化合物、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン等の環状アミン系殺菌化合物、カルベンダジム、ベノミル、チアベンダゾ - ル、チオファネ - トメチル等のベンズイミダゾ - ル系殺菌化合物、プロシミドン、シプロディニル、ピリメタニル、ジエトフェンカルブ、チウラム、フルアジナム、マンコゼブ、イプロジオン、ピンクロゾリン、クロロタロニル、キャプタン、メパニピリム、フェンピクロニル、フルジオキシニル、ジクロフルアニド、フォルベット、クレソキシムメチル、アゾキシストロピン、N - メチル - - - メトキシイミノ - 2 - [ ( 2 , 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニルアセトアミド等があげられる。さらに、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料と混用または併用することもできる。

#### 【 0 0 2 4 】

本発明化合物により防除することができる植物病害としては例えば以下のような病害をあげることができる。

イネのいもち病 (*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、ムギ類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*)、赤かび病 (*Gibberella zeae*)、さび病 (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪腐病 (*Typhula sp.*, *Micronectriella nivalis*)、裸黒穂病 (*Ustilago tritici*, *U. nuda*)、なまぐさ黒穂病 (*Tilletia caries*)、眼紋病 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病 (*Septoria tritici*)、ふ枯病 (*Leptosphaeria nodorum*)、カンキツ類の黒点病 (*Diaporthe citri*)、そうか病 (*Elsinoe fawcettii*)、果実腐敗病 (*Penicillium digitatum*, *P. italicum*)、

リンゴのモニリア病 (*Sclerotinia mali*)、腐らん病 (*Valsa mali*)、うどんこ病 (*Podospaera leucotricha*)、斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、黒星病 (*Venturia inaequalis*)、ナシの黒星病 (*Venturia nashicola*, *V. pirina*)、黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*)、赤星病 (*Gymnosporangium haraeaeum*)、モモの灰星病 (*Sclerotinia cinerea*)、黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)、フォモプシス腐敗病 (*Phomopsis sp.*)、ブドウの黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、晩腐病 (*Glomerella cingulata*)、うどんこ病 (*Uncinula necator*)、さび病 (*Phakopsora ampelopsidis*)、ブラックロット病 (*Guignardia bidwellii*)、べと病 (*Plasmopara viticola*)、カキの炭そ病 (*Gloeosporium kaki*)、落葉病 (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*)、ウリ類の炭そ病 (*Colletotrichum lagenarium*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病 (*Mycosphaerella melonis*)、つる割病 (*Fusarium oxysporum*)、べと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、疫病 (*Phytophthora sp.*)、苗立枯病 (*Pythium sp.*)、トマトの輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉かび病 (*Cladosporium fulvum*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cercospora brassicae*)、ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒点病 (*Diaporthe phaseolorum var. sojiae*)、インゲンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemthianum*)、ラッカセイの黒渋病 (*Cercospora personata*)、褐斑病 (*Cercospora arachidicola*)、エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、チャの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)、タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、べと病 (*Peronospora tabacina*)、疫病 (*Phytophthora nicotianae*)、テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*)、キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemi - indici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*)等。

10

20

30

40

50

【0025】

【実施例】

以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明は、これらの例のみに限定されない。

まず、本発明化合物、製造中間体Aおよび製造中間体Bの製造例を示す。尚、化合物の番号は後記表1～表64に記載の化合物番号で示す。尚、化合物番号の前に付された「(+)-」および「(-)-」の符号は、該化合物が光学異性体の単独または混合物であり、+または-の比旋光度を有することを意味する。

また、得られた目的物の純度を分析した際の分析は、下記条件の液体クロマトグラフィー分析(以下、LCと記す)を用いた。

10

### ＜LC分析条件＞

分析機器：低圧グラジエントタイプ(日立製；L-6000シリーズ)

カラム：L-column ODS (4.6mmφ×150mm；化学品検査協会製)

カラム温度：40℃

検出器：UV(波長254nm)

移動相条件：グラジエント法(A液およびB液)

20

時間(分)： 0      10      35      45

B液濃度(%)：50      50      100      100

流量：一定(1.0ml/分)

(A液：0.1%リン酸/水、B液：0.1%リン酸/アセトニトリル)

【0026】

製造例1

製造中間体A(化合物1007)1.57g(5.5mmol)を1,4-ジオキサン20mlに懸濁させ、60%油性水素化ナトリウム0.30g(7.5mmol)を加えて90に加熱した。続いて、メチルクロロホルメート0.72g(7.6mmol)を滴下した。同温度でさらに1時間攪拌した後、反応液を水に注加し、これを酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗し、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ-に付し、得られた白色固体を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物138)0.13mg(0.38mmol)を得た。

30

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS)

(ppm)：7.33(1H), 7.15~7.21(2H), 5.74(2H), 4.02(1H), 3.96(3H), 1.37(6H)

【0027】

製造例2

製造中間体A(化合物1007)5.00g(17.5mmol)と水酸化リチウム-水和物1.47g(35.0mmol)との混合物にトルエン50mlを加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1,4-ジオキサン35mlを加え、還流下、アリルクロロホルメート4.22g(35.0mmol)を滴下した。還流条件下でさらに15分間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で2回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣にヘキサンと酢酸エチルとの混合溶媒を少量加え、析出した固体を濾取し、これをヘキサンと酢酸エチル混合溶媒で洗浄し、本発明化合物(化合物203)2.67g(7.22mmol)を得た。

40

融点173.8

50

## 【0028】

## 製造例3

製造中間体A(化合物1017)2.45g(10.0mmol)と水酸化リチウム一水和物0.84g(20.0mmol)との混合物にトルエン20mlを加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1,4-ジオキサン20mlを加え、還流下、アリル クロロホルメート2.41g(20.0mmol)を滴下した。還流条件下でさらに10分間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で2回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ-に付し、本発明化合物(化合物330)0.53g(1.88mmol)を得た。

10

融点102.1

## 【0029】

## 製造例4

製造中間体A(化合物1007)1.57g(5.5mmol)をジメチルホルムアミド5mlに溶解させ、水冷下に60%油性水素化ナトリウム0.30g(7.5mmol)を加え、続いて、水冷下にエチル クロロホルメート0.65g(5.99mmol)を滴下した。室温で30分攪拌後、反応液を水に注加し、これを酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物151)0.61g(1.76mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)

20

(ppm): 7.37(1H), 7.18~7.23(2H), 5.71(2H), 4.42(2H), 4.05(1H), 1.40~1.47(9H)

## 【0030】

## 製造例5

製造中間体A(化合物1007)0.98g(3.44mmol)をジメチルホルムアミド5mlに溶解させ、水冷下に60%油性水素化ナトリウム0.15g(3.75mmol)を加え、30分間攪拌した。続いて、水冷下に2-クロロエチル クロロホルメート0.54g(3.78mmol)を滴下した。室温で1時間攪拌後、反応液を水に注加し、これを酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物582)0.68g(1.72mmol)を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)

(ppm): 7.37(1H), 7.19~7.24(2H), 5.69(2H), 4.60(2H), 4.09(1H), 3.84(2H), 1.44(6H)

## 【0031】

## 製造例6

製造中間体A(化合物1007)2.00g(6.99mmol)と水酸化リチウム一水和物0.59g(14mmol)との混合物にトルエン15mlを加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1,4-ジオキサン20mlを加え、還流下、イソブチル クロロホルメート1.91g(14mmol)を滴下した。還流条件下でさらに10分間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で2回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒で洗浄し、本発明化合物(化合物190)1.0g(2.59mmol)を得た。

40

融点153.7

## 【0032】

## 製造例7

ビス(トリクロロメチル) カーボネート1.41g(4.73mmol)を1,4-ジオキサン10mlに溶解させ、水冷下、ピリジン1.12g(14.2mmol)を滴下した。室温で15分間攪拌した後、2-プロピン-1-オール0.79g(14.1m

50

mol)を滴下し、さらに35分間室温で攪拌した後反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液A」と称する。

製造中間体A(化合物1007)2.02g(7.06mmol)と水酸化リチウム一水和物0.59g(14.0mmol)との混合物にトルエン20mlを加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1,4-ジオキサン15mlを加え、還流条件下、上記の「濾液A」を滴下した。還流条件下でさらに5分間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で2回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ-に付し、本発明化合物(化合物229)0.53g(1.44mmol)を得た。融点137.4

【0033】

製造例8

ビス(トリクロロメチル)カーボネート0.98g(3.29mmol)を1,4-ジオキサン10mmolに溶解させ、水冷下、ピリジン0.79g(10.0mmol)を滴下した。室温で15分攪拌した後、2-プロピン-1-オール0.56g(10.0mmol)を滴下し、さらに15分間室温で攪拌した後、反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液B」と称する。

製造中間体A(化合物1020)1.50g(5.00mmol)と水酸化リチウム一水和物0.42g(10.0mmol)との混合物にトルエン20mlを加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1,4-ジオキサン10mlを加えた。還流下、上記の「濾液B」を滴下し、還流条件下でさらに1時間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で2回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ-に付し、本発明化合物(化合物359)0.33g(0.86mmol)を得た。

融点132.7

【0034】

製造例9

ビス(トリクロロメチル)カーボネート1.40g(4.67mmol)を1,4-ジオキサン10mmolに溶解させ、水冷下、ピリジン1.11g(14mmol)を滴下した。室温で1時間攪拌した後、シクロプロピルメタノール1.03g(14mmol)を滴下し、さらに15分間室温で攪拌した後、反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液C」と称する。

製造中間体A(化合物1007)2.0g(7.00mmol)と水酸化リチウム一水和物0.59g(14.0mmol)との混合物にトルエン20mlを加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、1時間還流させた。トルエンを減圧留去し、1,4-ジオキサン10mlを加えた。還流下、上記の「濾液C」を滴下し、還流条件下でさらに10分間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で2回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をエ-テルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物578)0.80g(2.08mmol)を得た。

融点178.2

【0035】

製造例10

ビス(トリクロロメチル)カーボネート1.40g(4.67mmol)を1,4-ジオキサン10mmolに溶解させ、水冷下、ピリジン1.1g(14mmol)を滴下した。室温で15分攪拌した後、3-ブテン-1-オール1.03g(14mmol)を滴下し、さらに15分間室温で攪拌した後、反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液D」と称する。

製造中間体A(化合物1007)2.0g(7.00mmol)と水酸化リチウム一水和

10

20

30

40

50

物 0.59 g (14.0 mmol) との混合物にトルエン 20 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、1 時間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン 10 ml を加えた。還流下、上記の「濾液 D」を滴下し、還流条件下でさらに 10 分間攪拌した後、1, 4 - ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で 2 回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物 (化合物 216) 0.65 g (1.84 mmol) を得た。

融点 133.1

【0036】

製造例 11

ビス(トリクロロメチル) カーボネート 1.40 g (4.67 mmol) を 1, 4 - ジオキサン 10 ml に溶解させ、水冷下、ピリジン 1.1 g (14 mmol) を滴下した。室温で 30 分攪拌した後、2 - ブチン - 1 - オ - ル 0.98 g (14 mmol) を滴下し、さらに 15 分間室温で攪拌した後、反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液 E」と称する。

製造中間体 A (化合物 1007) 2.0 g (7.00 mmol) と水酸化リチウム一水和物 0.59 g (14.0 mmol) との混合物にトルエン 20 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、1 時間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン 10 ml を加えた。還流下、上記の「濾液 E」を滴下し、還流条件下でさらに 10 分間攪拌した後、1, 4 - ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で 2 回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ - に付し、本発明化合物 (化合物 255) 1.0 g (2.84 mmol) を得た。

融点 152.0

【0037】

製造例 12

ビス(トリクロロメチル) カーボネート 1.41 g (4.67 mmol) を 1, 4 - ジオキサン 10 ml に溶解させ、水冷下、ピリジン 1.1 g (14 mmol) を滴下した。室温で 15 分攪拌した後、3 - ブチン - 1 - オ - ル 0.98 g (14 mmol) を滴下し、さらに 1 時間室温で攪拌した後、反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液 F」と称する。

製造中間体 A (化合物 1007) 2.0 g (7.00 mmol) と水酸化リチウム一水和物 0.59 g (14.0 mmol) との混合物にトルエン 20 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、1 時間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン 10 ml を加えた。還流下、上記の「濾液 F」を滴下し、還流条件下でさらに 10 分間攪拌した後、1, 4 - ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で 2 回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ - に付し、本発明化合物 (化合物 242) 0.58 g (1.65 mmol) を得た。

融点 160.3

【0038】

製造例 13

ビス(トリクロロメチル) カーボネート 0.98 g (3.29 mmol) を 1, 4 - ジオキサン 10 ml に溶解させ、水冷下、ピリジン 0.79 g (10 mmol) を滴下した。室温で 25 分攪拌した後、3 - ブテン - 1 - オ - ル 0.72 g (10 mmol) を滴下し、さらに 15 分間室温で攪拌した後、反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液 G」と称する。

製造中間体 A (化合物 1020) 1.5 g (5.0 mmol) と水酸化リチウム一水和物 0.42 g (10.0 mmol) との混合物にトルエン 10 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、1 時間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン

10

20

30

40

50

10 ml を加えた。還流下、上記の「濾液 G」を滴下し、還流条件下でさらに 10 分間攪拌した後、1, 4 - ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で 2 回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ - に付し、本発明化合物 (化合物 346) 0.47 g (1.18 mmol) を得た。

融点 127.7

【0039】

製造例 14

製造中間体 A (化合物 1007) 1.43 g (5.0 mmol) と水酸化リチウム一水和物 0.42 g (10.0 mmol) との混合物にトルエン 20 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30 分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン 20 ml を加え、還流下、S - エチル クロロチオホルメート 1.1 ml (9.1 mmol) を滴下した。還流条件下でさらに 10 分間攪拌した後、1, 4 - ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で 2 回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を分取薄層クロマトグラフィ - に付し、本発明化合物 (化合物 411) 0.24 g (0.64 mmol) を得た。

融点 177.5

【0040】

製造例 15

ビス(トリクロロメチル) カーボネート 0.98 g (3.29 mmol) を 1, 4 - ジオキサン 10 ml に溶解させ、水冷下、ピリジン 0.79 g (10.0 mmol) を滴下した。室温で 30 分攪拌した後、55% 2 - プロペン - 1 - チオール 1.35 g (10.0 mmol) を滴下し、さらに 30 分間室温で攪拌した後、反応液を濾過し、濾液を得た。ここで、この濾液を「濾液 H」と称する。

製造中間体 A (化合物 1007) 1.41 g (4.93 mmol) と水酸化リチウム一水和物 0.42 g (10.0 mmol) との混合物にトルエン 20 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30 分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン 10 ml を加えた。還流下、上記の「濾液 H」を滴下し、還流条件下でさらに 10 分間攪拌した後、1, 4 - ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で 2 回洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ - に付し、本発明化合物 (化合物 463) 0.14 g (0.36 mmol) を得た。

融点 170.8

【0041】

製造例 16

製造中間体 A (化合物 1017) 1.22 g (5.0 mmol) と水酸化リチウム一水和物 0.42 g (10.0 mmol) との混合物にトルエン 10 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30 分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン 10 ml を加え、還流下、S - エチル クロロチオホルメート 1.25 g (10.0 mmol) を滴下した。還流条件下でさらに 30 分間攪拌した後、1, 4 - ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ - に付し、本発明化合物 (化合物 499) 0.14 g (0.42 mmol) を得た。

融点 137.8

【0042】

製造例 17

製造中間体 A (化合物 1017) 1.20 g (4.9 mmol) と水酸化リチウム一水和物 0.41 g (9.8 mmol) との混合物にトルエン 10 ml を加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、30 分間還流させた。トルエンを減圧留去し、1, 4 - ジオキサン 10 ml を加え、還流下、S - アリル クロロチオホルメート 1.0 g (7.3 mmol)

10

20

30

40

50

)を滴下した。還流条件下でさらに15分間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を塩水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ-に付し、本発明化合物(化合物551)0.09g(0.26mmol)を得た。

融点146.6

【0043】

製造例18

製造中間体A(化合物1007)2.2g(7.7mmol)と水酸化リチウム-水和物0.48g(11.4mmol)との混合物にトルエン20mlを加えて共沸脱水操作により水分を除去しつつ、1時間還流させた。トルエンを減圧留去し、1,4-ジオキサン20mlを加え、還流下、O-エチルクロロチオホルメート1.46g(11.7mmol)を滴下した。還流条件下でさらに15分間攪拌した後、1,4-ジオキサンを減圧留去した。残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ-に付し、本発明化合物(化合物621)0.11g(0.29mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)

(ppm): 7.38(1H), 7.20~7.26(2H), 6.45(2H), 4.66(2H), 3.94(1H), 1.53(3H), 1.43(6H)

【0044】

製造例19

製造中間体B(化合物2147)1.39g(5mmol)の1,4-ジオキサン溶液に水酸化リチウム60mg(7.5mmol)を加えて10分間還流させた。メタンスルホン酸イソプロピル1.0g(7.2mmol)を加えて30分間還流させた。1,4-ジオキサンを減圧留去し、残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ-に付し、本発明化合物(化合物408)1.14g(3.57mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)

(ppm): 7.17~7.24(4H), 5.5(2H), 3.91(1H), 2.95(2H), 2.26(3H), 1.43(6H), 1.36(3H)

【0045】

製造例20

製造中間体B(化合物2147)852mg(3.08mmol)の1,4-ジオキサン溶液に水酸化リチウム32mg(4mmol)を加えて10分間還流させた。メタンスルホン酸エチル570mg(4.6mmol)を加えて1時間還流させた。1,4-ジオキサンを減圧留去し、残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物595)230mg(0.75mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)

(ppm): 7.21~7.26(4H), 5.7(2H), 3.8(2H), 2.98(2H), 2.28(3H), 1.38(3H), 1.05(3H)

【0046】

製造例21

製造中間体B(化合物2150)2.07g(6.23mmol)の1,4-ジオキサン溶液に水酸化リチウム85mg(10.6mmol)を加えて10分間還流させた。メタンスルホン酸sec-ブチル1.6g(10.5mmol)を加えて1時間還流させた。1,4-ジオキサンを減圧留去し、残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物502)1.25g(3.22mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)

(ppm): 7.37(1H), 7.18~7.26(2H), 5.63(2H), 3

10

20

30

40

50

. 63 (1H), 2.97 (2H), 1.88 ~ 2.09 (2H), 1.35 ~ 1.41 (6H), 1.00 (3H)

【0047】

製造例22

製造中間体B (化合物2147) 2.0g (7.2mmol) の1,4-ジオキサン溶液に水素化リチウム95mg (12mmol) を加えて10分間還流させた。( - )-メタンスルホン酸sec-ブチル{ [ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = -1.42 (c = 7, CHCl<sub>3</sub>) } 1.8g (11.8mmol) を加えて1時間還流させた。1,4-ジオキサンを減圧留去し、残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物(+)-499) 1.3g (3.9mmol) を得た。

10

[ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = +0.422 (c = 5.5, CHCl<sub>3</sub>)

【0048】

製造例23

製造中間体B (化合物2147) 1.93g (7.0mmol) の1,4-ジオキサン溶液に水素化リチウム90mg (11.3mmol) を加えて10分間還流させた。( + )-メタンスルホン酸sec-ブチル{ [ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = +1.49 (c = 7, CHCl<sub>3</sub>) } 1.7g (11.1mmol) を加えて1時間還流させた。1,4-ジオキサンを減圧留去し、残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物(-)-499) 1.0g (3.0mmol) を得た。

20

[ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = -0.389 (c = 5.4, CHCl<sub>3</sub>)

【0049】

製造例24

製造中間体B (化合物2150) 2.0g (6.0mmol) の1,4-ジオキサン溶液に水素化リチウム77mg (9.6mmol) を加えて10分間還流させた。( + )-メタンスルホン酸sec-ブチル{ [ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = +1.49 (c = 7, CHCl<sub>3</sub>) } 1.5g (10.0mmol) を加えて1時間還流させた。1,4-ジオキサンを減圧留去し、残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物(-)-502) 1.1g (2.8mmol) を得た。

30

[ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = -0.98 (c = 8.5, CHCl<sub>3</sub>)

【0050】

製造例25

製造中間体B (化合物2150) 1.9g (5.8mmol) の1,4-ジオキサン溶液に水素化リチウム70mg (8.8mmol) を加えて10分間還流させた。( - )-メタンスルホン酸sec-ブチル{ [ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = -1.43 (c = 7, CHCl<sub>3</sub>) } 1.4g (9.2mmol) を加えて1時間還流させた。1,4-ジオキサンを減圧留去し、残渣に水を加え、これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を水で洗浄した。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて洗浄し、本発明化合物(化合物(+)-502) 1.1g (2.8mmol) を得た。

40

[ ]<sup>18</sup><sub>D</sub> = +0.90 (c = 8.3, CHCl<sub>3</sub>)

【0051】

実施例26

水素化リチウム0.0242g (3.04mmol) および1,4-ジオキサン10.00gの混合物に室温にて製造中間体B (化合物2072) 0.50g (1.52mmol) を加えて、同温度にて30分攪拌した。その後、メタンスルホン酸イソプロピル0.42g (3.04mmol) をゆっくり滴下して、滴下終了後、100℃まで昇温し同温度にて2時間反応した。冷却して5%塩酸水10.00gを加え、トルエン20.00gにて2回抽出した。該有機層を併せ、これを硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した

50

。残渣に n - ヘキサンを加えて混合することにより結晶化させ、濾過、n - ヘキサン洗浄、乾燥し、本発明化合物（化合物番号 203）0.59 g（LC 面百値 77.4%）を得た。

**【0052】**

## 実施例 27

水酸化リチウム一水和物 0.128 g（3.04 mmol）およびトルエン 20.00 g の混合物に室温にて製造中間体 B（化合物 2072）0.50 g（1.52 mmol）を加えて、加熱還流下、共沸脱水を 2 時間行った。その後冷却して、トルエンを完全に留去し、乾燥した。得られた固体に 1,4 - ジオキサン 10.00 g を加えて、室温にてメタンスルホン酸イソプロピル 0.42 g（3.04 mmol）をゆっくり滴下して、滴下終了後、100 まで昇温し同温度にて 2 時間攪拌した。その後、冷却して 5% 塩酸水 10.00 g を加えて、トルエン 20.00 g にて 2 回抽出した。該有機層を併せ、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣に n - ヘキサンを加えて混合することにより結晶化させ、濾過、n - ヘキサン洗浄、乾燥し、本発明化合物（化合物 203）0.45 g（LC 面百値 64.6%）を得た。

10

**【0053】**

## 実施例 28

水素化リチウム 0.0239 g（3.02 mmol）および 1,4 - ジオキサン 10.00 g の混合物に室温にて製造中間体 B（化合物 2150）0.50 g（1.51 mmol）を加えて、同温度にて 30 分攪拌した。その後、メタンスルホン酸イソプロピル 0.42 g（3.02 mmol）をゆっくり滴下して、滴下終了後、100 まで昇温し同温度にて 2 時間攪拌した。その後、冷却して 5% 塩酸水 10.00 g を加えて、トルエン 20.00 g にて 2 回抽出した。該有機層を併せ、これを硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物（化合物 411）0.42 g（LC 面百値 95.9%）を得た。

20

**【0054】**

## 実施例 29

水素化リチウム 0.0287 g（3.60 mmol）および 1,4 - ジオキサン 10.00 g の混合物に室温にて製造中間体 B（化合物 2147）0.50 g（1.80 mmol）を加えて、同温度にて 30 分攪拌した。その後、メタンスルホン酸 sec - ブチル 0.55 g（3.60 mmol）をゆっくり滴下して、滴下終了後、100 まで昇温し同温度にて 2 時間攪拌した。その後、冷却して 5% 塩酸水 10.00 g を加えて、トルエン 20.00 g にて 2 回抽出した。該有機層を併せ、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、本発明化合物（化合物 499）0.42 g（LC 面百値 99.2%）を得た。

30

**【0055】**

## 実施例 30

水酸化リチウム一水和物 0.0871 g（2.07 mmol）およびトルエン 20.00 g の混合物に室温にて製造中間体 B（化合物 2147）0.50 g（1.80 mmol）を加えて、加熱還流下共沸脱水を 2 時間行った。その後冷却して、トルエンを完全に留去し、乾燥した。得られた固体に 1,4 - ジオキサン 2.50 g を加えて、室温にてメタンスルホン酸 sec - ブチル 0.37 g（2.43 mmol）をゆっくり滴下して、滴下終了後、100 まで昇温し同温度にて 3 時間攪拌した。その後、冷却して 5% 塩酸水 10.00 g を加えて、トルエン 20.00 g にて 2 回抽出した。該有機層を併せ、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣に n - ヘキサンを加えることにより結晶化させ、濾過、n - ヘキサン洗浄、乾燥し、本発明化合物（化合物 499）0.44 g（LC 面百値 93.5%）を得た。

40

**【0056】**

## 実施例 31

水酸化リチウム一水和物 0.0871 g（2.07 mmol）、製造中間体 B（化合物 2

50

147)0.50g(1.80mmol)および1,4-ジオキサン2.50gの混合物を100℃まで昇温した。同温度にてメタンスルホン酸sec-ブチル0.37g(2.43mmol)をゆっくり滴下して、滴下終了後、同温度にて4時間攪拌した。その後、冷却して5%塩酸水10.00gを加えて、トルエン20.00gにて2回抽出した。該有機層を併せ、これを硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣にn-ヘキサンを加えることにより結晶化させ、濾過、n-ヘキサン洗浄、乾燥し、本発明化合物(化合物499)0.42g(LC面百値98.4%)を得た。

【0057】

#### 実施例32

水酸化リチウム一水和物0.0871g(2.07mmol)、製造中間体B(化合物2147)0.50g(1.80mmol)、モレキュラシーブス3A0.50gおよび1,4-ジオキサン2.50gの混合物を100℃まで昇温した。同温度にてメタンスルホン酸sec-ブチル0.37g(2.43mmol)をゆっくり滴下して、滴下終了後、同温度にて4時間攪拌した。その後、冷却して5%塩酸水10.00gを加えて、トルエン20.00gにて2回抽出した。該有機層を併せ、これを硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣にn-ヘキサンを加えることにより結晶化させ、濾過、n-ヘキサン洗浄、乾燥し、本発明化合物(化合物499)0.45g(LC面百値99.1%)を得た。

【0058】

#### 実施例33

製造中間体B(化合物2147)1.00g(3.60mmol)、モレキュラシーブス3A0.50g、メタンスルホン酸sec-ブチル0.74g(4.86mmol)および1,4-ジオキサン5.00gの混合物を90℃まで昇温した。同温度にて水酸化リチウム一水和物0.174g(4.14mmol)を2時間で3分割して投入した。投入後、同温度にて5時間攪拌した。その後、冷却して5%塩酸水20.00gを加えて、トルエン40.00gにて2回抽出した。該有機層を併せ、これを硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣にn-ヘキサンを加えることにより結晶化させ、濾過、n-ヘキサン洗浄、乾燥し、本発明化合物(化合物499)0.95g(LC面百値97.8%)を得た。

【0059】

#### 実施例34

水素化リチウム0.0305g(3.80mmol)および1,4-ジオキサン10.00gの混合物に室温にて製造中間体B(化合物2017)0.50g(1.90mmol)を加えて、同温度にて30分攪拌した。その後、メタンスルホン酸sec-ブチル0.58g(3.80mmol)をゆっくり滴下して、滴下終了後、100℃まで昇温し同温度にて4時間攪拌した。その後、冷却して5%塩酸水10.00gを加えて、トルエン20.00gにて2回抽出した。該有機層を併せ、これを硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣にn-ヘキサンを加えることにより結晶化させ、濾過、n-ヘキサン洗浄、乾燥し、本発明化合物(化合物278)0.25g(LC面百値95.2%)を得た。

融点70.0

【0060】

#### 製造例35

3-アミノ-2-tert-ブチル-1-イソプロピル-4-(2,6-ジクロロフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン107g(313mmol)に3規定塩酸300mlとエタノール100mlを加え、還流条件下で4時間攪拌した。その後、エタノールを減圧留去し、水層を希水酸化ナトリウム水溶液で中和し、析出した固体を濾取した。固体を水、および酢酸エチルで洗浄し、減圧乾燥して製造中間体A(化合物1007)88.4g(309mmol)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , TMS)

10

20

30

40

50

(ppm) : 7.47 (1H), 7.33 ~ 7.36 (2H), 4.93 (2H), 4.41 (1H), 1.30 (6H)

## 【0061】

## 製造例36

3-アミノ-2-tert-ブチル-1-sec-ブチル-4-(2-メチルフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン54.6g(181mmol)に3規定塩酸300mlとエタノール100mlを加え、還流条件下で4時間攪拌した。その後、エタノールを減圧留去し、水層を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、析出した固体を濾取した。固体を水、および酢酸エチルで洗浄し、減圧乾燥して製造中間体A(化合物1017)35.3g(144mmol)を得た。

10

<sup>1</sup>H-NMR(CD<sub>3</sub>OD, TMS)

(ppm) : 7.17 (4H), 4.83 (2H), 4.1 (1H), 2.25 (3H), 1.5 ~ 1.9 (2H), 1.21 (3H), 0.94 (3H)

## 【0062】

## 製造例37

3-アミノ-4-(2-メチルフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン5.19g(27.5mmol)およびトリエチルアミン11.1g(110mmol)をテトラヒドロフランに懸濁させ、氷冷下クロロトリメチルシラン2.5g(30.7mmol)を滴下した。続いて、氷冷下、アリル クロロホルメート3.7g(30.7mmol)を滴下し、室温で1時間攪拌した。生成した沈殿をろ過により除去し、ろ液に水8mlおよび酢酸8ml(140mmol)を加えて30分間還流させた。反応液を室温まで冷却した後、水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗した後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、製造中間体B(化合物2069)1.4g(5.1mmol)を得た。

20

融点187.4

## 【0063】

## 実施例38

3-アミノ-4-(2,6-ジクロロフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン30.00g(0.123mol)、アリル クロロホルメート15.56g(0.129mol)およびトルエン150.00gの混合物に、25℃にて10%水酸化ナトリウム水溶液59.02g(0.148mol)をゆっくりと滴下した。滴下終了後、同温度にて2時間攪拌した。その後、5%塩酸水を加えて該混合物の液性を酸性とし、析出してきた結晶を濾過、トルエン30.00gにて洗浄し、乾燥し、製造中間体B(化合物2072)36.84g(LC面百値99.1%)を得た。

30

融点169.0

## 【0064】

## 実施例39

3-アミノ-4-(2,6-ジクロロフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン20.00g(81.97mmol)、S-エチル クロロチオホルメート10.72g(86.07mmol)およびトルエン100.00gの混合物に、25℃にて10%水酸化ナトリウム水溶液39.34g(98.36mmol)をゆっくりと滴下した。滴下終了後、同温度にて2時間攪拌した。その後、5%塩酸水を加えて反応混合物の液性を酸性とし、これをトルエンおよびメチルtert-ブチルエーテルにて抽出した。該有機層を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、製造中間体B(化合物2150)19.16g(LC面百値98.4%)を得た。

40

融点198.5

## 【0065】

## 実施例40

3-アミノ-4-(2-メチルフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン0.50g(2.65mmol)、アリル クロロホルメート0.33g(2.78mmol)およびトル

50

エン 2.50 g の混合物に、25 にて 10% 水酸化ナトリウム水溶液 1.27 g (3.18 mmol) をゆっくりと滴下した。滴下終了後、同温度にて 1 時間攪拌した。その後、5% 塩酸水を加えて反応混合物の液性を酸性とし、これをトルエンおよびメチル tert-ブチルエーテルにて抽出した。その後、溶媒を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、製造中間体 B (化合物 2069) 0.56 g (LC 面百値 99.6%) を得た。

## 【0066】

## 実施例 41

3-アミノ-4-(2-メチルフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン 20.00 g (0.106 mol)、5-エチル クロロチオホルメート 13.84 g (0.111 mol) およびトルエン 100.00 g の混合物に、25 にて 10% 水酸化ナトリウム水溶液 50.79 g (0.127 mol) をゆっくりと滴下した。滴下終了後、同温度にて 1 時間攪拌した。その後、5% 塩酸水を加えて反応混合物の液性を酸性とし、これを酢酸エチル 40.00 g にて 2 回抽出した。該有機層を併せ、これを硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、濃縮後、残渣を酢酸エチル/n-ヘキサン = 1/9 の混合液 200 ml にて洗浄、乾燥し、製造中間体 B (化合物 2147) 24.39 g (LC 面百値 98.5%) を得た。

融点 172.5

## 【0067】

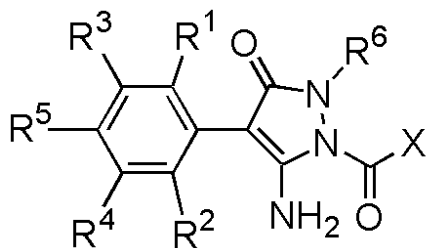
## 実施例 42

3-アミノ-4-(2-メチルフェニル)-3-ピラゾリン-5-オン 2.00 g (10.6 mmol)、エチル クロロホルメート 1.21 g (11.1 mmol) およびトルエン 10.00 g の混合物に、25 にて 10% 水酸化ナトリウム水溶液 5.08 g (12.7 mmol) をゆっくりと滴下した。滴下終了後、同温度にて 1 時間攪拌した。その後、5% 塩酸水を加えて反応混合物の液性を酸性とし、これを酢酸エチル 10.00 g にて 2 回抽出した。該有機層を併せ、硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、製造中間体 B (化合物 2017) 2.10 g (LC 面百値 98.9%) を得た。

融点 161.5

## 【0068】

次に本発明化合物の具体例を化合物番号とともに表 1 ~ 表 4 1 に示す。



で示される化合物

## 【表 1】

10

20

30

40

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
1	2-F	i P r	Me
2	2-Cl	i P r	Me
3	2-Br	i P r	Me
4	2, 6-F <sub>2</sub>	i P r	Me
5	2, 6-Cl <sub>2</sub>	i P r	Me
6	2-F, 6-Cl	i P r	Me
7	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	i P r	Me
8	2-CF <sub>3</sub>	i P r	Me
9	2-CH <sub>3</sub>	i P r	Me
10	2-OCH <sub>3</sub>	i P r	Me
11	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	i P r	Me
12	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	i P r	Me
13	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	i P r	Me
14	2-F	i P r	Et
15	2-Cl	i P r	Et
16	2-Br	i P r	Et
17	2, 6-F <sub>2</sub>	i P r	Et
18	2, 6-Cl <sub>2</sub>	i P r	Et
19	2-F, 6-Cl	i P r	Et
20	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	i P r	Et
21	2-CF <sub>3</sub>	i P r	Et
22	2-CH <sub>3</sub>	i P r	Et
23	2-OCH <sub>3</sub>	i P r	Et
24	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	i P r	Et
25	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	i P r	Et

【0069】

【表2】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
26	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	Et
27	2-F	iPr	nPr
28	2-Cl	iPr	nPr
29	2-Br	iPr	nPr
30	2,6-F <sub>2</sub>	iPr	nPr
31	2,6-Cl <sub>2</sub>	iPr	nPr
32	2-F,6-Cl	iPr	nPr
33	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	iPr	nPr
34	2-CF <sub>3</sub>	iPr	nPr
35	2-CH <sub>3</sub>	iPr	nPr
36	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	nPr
37	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	nPr
38	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	nPr
39	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	nPr
40	2-F	iPr	nBu
41	2-Cl	iPr	nBu
42	2-Br	iPr	nBu
43	2,6-F <sub>2</sub>	iPr	nBu
44	2,6-Cl <sub>2</sub>	iPr	nBu
45	2-F,6-Cl	iPr	nBu
46	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	iPr	nBu
47	2-CF <sub>3</sub>	iPr	nBu
48	2-CH <sub>3</sub>	iPr	nBu
49	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	nBu
50	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	nBu

10

20

30

40

【0070】

【表3】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
5 1	2-C 1,6-CH <sub>3</sub>	i P r	n B u
5 2	2-F,6-CH <sub>3</sub>	i P r	n B u
5 3	2-F	i P r	n P e n
5 4	2-C 1	i P r	n P e n
5 5	2-B r	i P r	n P e n
5 6	2, 6-F <sub>2</sub>	i P r	n P e n
5 7	2, 6-C 1 <sub>2</sub>	i P r	n P e n
5 8	2-F, 6-C 1	i P r	n P e n
5 9	2, 3, 5-C 1 <sub>3</sub>	i P r	n P e n
6 0	2-C F <sub>3</sub>	i P r	n P e n
6 1	2-CH <sub>3</sub>	i P r	n P e n
6 2	2-OCH <sub>3</sub>	i P r	n P e n
6 3	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	i P r	n P e n
6 4	2-C 1,6-CH <sub>3</sub>	i P r	n P e n
6 5	2-F,6-CH <sub>3</sub>	i P r	n P e n
6 6	2-F	s B u	M e
6 7	2-C 1	s B u	M e
6 8	2-B r	s B u	M e
6 9	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	M e
7 0	2, 6-C 1 <sub>2</sub>	s B u	M e
7 1	2-F, 6-C 1	s B u	M e
7 2	2, 3, 5-C 1 <sub>3</sub>	s B u	M e
7 3	2-C F <sub>3</sub>	s B u	M e
7 4	2-CH <sub>3</sub>	s B u	M e
7 5	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	M e

10

20

30

40

【 0 0 7 1 】

【 表 4 】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
76	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	Me
77	2-C 1, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	Me
78	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	Me
79	2-F	s B u	E t
80	2-C 1	s B u	E t
81	2-B r	s B u	E t
82	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	E t
83	2, 6-C 1 <sub>2</sub>	s B u	E t
84	2-F, 6-C 1	s B u	E t
85	2, 3, 5-C 1 <sub>3</sub>	s B u	E t
86	2-C F <sub>3</sub>	s B u	E t
87	2-CH <sub>3</sub>	s B u	E t
88	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	E t
89	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	E t
90	2-C 1, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	E t
91	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	E t
92	2-F	s B u	n P r
93	2-C 1	s B u	n P r
94	2-B r	s B u	n P r
95	2-C F <sub>3</sub>	s B u	n P r
96	2-CH <sub>3</sub>	s B u	n P r
97	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	n P r
98	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	n P r
99	2, 6-C 1 <sub>2</sub>	s B u	n P r
100	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	n P r

10

20

30

40

【 0 0 7 2 】

【 表 5 】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
101	2-F, 6-Cl	sBu	nPr
102	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	nPr
103	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	nPr
104	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	nPr
105	2-F	sBu	nBu
106	2-Cl	sBu	nBu
107	2-Br	sBu	nBu
108	2-CF <sub>3</sub>	sBu	nBu
109	2-CH <sub>3</sub>	sBu	nBu
110	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	nBu
111	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	nBu
112	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	nBu
113	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	nBu
114	2-F, 6-Cl	sBu	nBu
115	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	nBu
116	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	nBu
117	2-F,6-CH <sub>3</sub>	sBu	nBu
118	2-F	sBu	nPen
119	2-Cl	sBu	nPen
120	2-Br	sBu	nPen
121	2-CF <sub>3</sub>	sBu	nPen
122	2-CH <sub>3</sub>	sBu	nPen
123	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	nPen
124	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	nPen
125	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	nPen

10

20

30

40

【0073】

【表6】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
126	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	nPen
127	2-F, 6-Cl	sBu	nPen
128	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	nPen
129	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	nPen
130	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	nPen
131	2-F	iPr	O-Me
132	2-Cl	iPr	O-Me
133	2-Br	iPr	O-Me
134	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-Me
135	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Me
136	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-Me
137	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-Me
138	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-Me
139	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-Me
140	2-F, 6-Cl	iPr	O-Me
141	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-Me
142	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Me
143	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Me
144	2-F	iPr	O-Et
145	2-Cl	iPr	O-Et
146	2-Br	iPr	O-Et
147	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-Et
148	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Et
149	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-Et
150	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-Et

10

20

30

40

【0074】

【表7】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
151	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-Et	
152	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-Et	
153	2-F, 6-Cl	iPr	O-Et	
154	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-Et	
155	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Et	10
156	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Et	
157	2-F	iPr	O-nPr	
158	2-Cl	iPr	O-nPr	
159	2-Br	iPr	O-nPr	
160	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
161	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	20
162	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
163	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-nPr	
164	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-nPr	
165	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-nPr	
166	2-F, 6-Cl	iPr	O-nPr	
167	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	30
168	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
169	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
170	2-F	iPr	O-nBu	
171	2-Cl	iPr	O-nBu	
172	2-Br	iPr	O-nBu	
173	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	40
174	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
175	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	

【0075】

【表8】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
176	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-nBu	
177	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-nBu	
178	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-nBu	
179	2-F, 6-Cl	iPr	O-nBu	
180	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	10
181	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
182	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
183	2-F	iPr	O-iBu	
184	2-Cl	iPr	O-iBu	
185	2-Br	iPr	O-iBu	
186	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	20
187	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
188	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
189	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-iBu	
190	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-iBu	
191	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-iBu	
192	2-F, 6-Cl	iPr	O-iBu	30
193	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
194	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
195	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
196	2-F	iPr	O-Allyl	
197	2-Cl	iPr	O-Allyl	
198	2-Br	iPr	O-Allyl	40
199	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	
200	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	

【0076】

【表9】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
201	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl
202	2,6-F <sub>2</sub>	iPr	O-Allyl
203	2,6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-Allyl
204	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-Allyl
205	2-F,6-Cl	iPr	O-Allyl
206	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl
207	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl
208	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl
209	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
210	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
211	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
212	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
213	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
214	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
215	2,6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
216	2,6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
217	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
218	2-F,6-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
219	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
220	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
221	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
222	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH
223	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH
224	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH
225	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH

10

20

30

40

【0077】

【表10】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
226	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
227	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
228	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
229	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
230	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	10
231	2-F, 6-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
232	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
233	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
234	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
235	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
236	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	20
237	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
238	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
239	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
240	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
241	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
242	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	30
243	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
244	2-F, 6-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
245	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
246	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
247	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
248	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	40
249	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
250	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	

【0078】

【表11】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
251	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
252	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
253	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
254	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
255	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
256	2-F, 6-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
257	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
258	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
259	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
260	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
261	2-F	sBu	O-Me
262	2-Cl	sBu	O-Me
263	2-Br	sBu	O-Me
264	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-Me
265	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Me
266	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-Me
267	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-Me
268	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-Me
269	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-Me
270	2-F, 6-Cl	sBu	O-Me
271	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-Me
272	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Me
273	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Me
274	2-F	sBu	O-Et
275	2-Cl	sBu	O-Et

10

20

30

40

【0079】

【表12】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
276	2-Br	sBu	O-Et
277	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-Et
278	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Et
279	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-Et
280	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-Et
281	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-Et
282	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-Et
283	2-F, 6-Cl	sBu	O-Et
284	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-Et
285	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Et
286	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Et
287	2-F	sBu	O-nPr
288	2-Cl	sBu	O-nPr
289	2-Br	sBu	O-nPr
290	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-nPr
291	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr
292	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr
293	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-nPr
294	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-nPr
295	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-nPr
296	2-F, 6-Cl	sBu	O-nPr
297	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-nPr
298	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr
299	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr
300	2-F	sBu	O-nBu

10

20

30

40

【0080】

【表13】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
301	2-Cl	sBu	O-nBu
302	2-Br	sBu	O-nBu
303	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-nBu
304	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu
305	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu
306	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-nBu
307	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-nBu
308	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-nBu
309	2-F, 6-Cl	sBu	O-nBu
310	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-nBu
311	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu
312	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu
313	2-F	sBu	O-iBu
314	2-Cl	sBu	O-iBu
315	2-Br	sBu	O-iBu
316	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-iBu
317	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu
318	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu
319	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-iBu
320	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-iBu
321	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-iBu
322	2-F, 6-Cl	sBu	O-iBu
323	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-iBu
324	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu
325	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu

10

20

30

40

【0081】

【表14】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
326	2-F	sBu	O-Allyl	
327	2-Cl	sBu	O-Allyl	
328	2-Br	sBu	O-Allyl	
329	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
330	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	10
331	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
332	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-Allyl	
333	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-Allyl	
334	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-Allyl	
335	2-F, 6-Cl	sBu	O-Allyl	
336	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	20
337	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
338	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
339	2-F	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
340	2-Cl	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
341	2-Br	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
342	2-CF <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	30
343	2-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
344	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
345	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
346	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
347	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
348	2-F, 6-Cl	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	40
349	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
350	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	

【0082】

【表15】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
351	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> -A l l y l	
352	2-F	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
353	2-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
354	2-Br	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
355	2-CF <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	10
356	2-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
357	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
358	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
359	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
360	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
361	2-F, 6-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	20
362	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
363	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
364	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
365	2-F	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
366	2-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
367	2-Br	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	30
368	2-CF <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
369	2-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
370	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
371	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
372	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
373	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	40
374	2-F, 6-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
375	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	

【0083】

【表16】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
376	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH
377	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH
378	2-F	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
379	2-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
380	2-Br	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
381	2-CF <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
382	2-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
383	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
384	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
385	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
386	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
387	2-F, 6-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
388	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
389	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
390	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
391	2-F	i P r	S-Me
392	2-Cl	i P r	S-Me
393	2-Br	i P r	S-Me
394	2-CF <sub>3</sub>	i P r	S-Me
395	2-CH <sub>3</sub>	i P r	S-Me
396	2-OCH <sub>3</sub>	i P r	S-Me
397	2, 6-F <sub>2</sub>	i P r	S-Me
398	2, 6-Cl <sub>2</sub>	i P r	S-Me
399	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	i P r	S-Me
400	2-F, 6-Cl	i P r	S-Me

10

20

30

40

【0084】

【表17】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
401	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	S-Me	
402	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Me	
403	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Me	
404	2-F	iPr	S-Et	
405	2-Cl	iPr	S-Et	10
406	2-Br	iPr	S-Et	
407	2-CF <sub>3</sub>	iPr	S-Et	
408	2-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Et	
409	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	S-Et	
410	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	S-Et	
411	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	S-Et	20
412	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	S-Et	
413	2-F, 6-Cl	iPr	S-Et	
414	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	S-Et	
415	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Et	
416	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Et	
417	2-F	iPr	S-nPr	30
418	2-Cl	iPr	S-nPr	
419	2-Br	iPr	S-nPr	
420	2-CF <sub>3</sub>	iPr	S-nPr	
421	2-CH <sub>3</sub>	iPr	S-nPr	
422	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	S-nPr	
423	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	S-nPr	40
424	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	S-nPr	
425	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	S-nPr	

【0085】

【表18】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
426	2-F, 6-Cl	iPr	S-nPr	
427	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	S-nPr	
428	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-nPr	
429	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-nPr	
430	2-F	iPr	S-nBu	10
431	2-Cl	iPr	S-nBu	
432	2-Br	iPr	S-nBu	
433	2-CF <sub>3</sub>	iPr	S-nBu	
434	2-CH <sub>3</sub>	iPr	S-nBu	
435	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	S-nBu	
436	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	S-nBu	20
437	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	S-nBu	
438	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	S-nBu	
439	2-F, 6-Cl	iPr	S-nBu	
440	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	S-nBu	
441	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-nBu	
442	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-nBu	30
443	2-F	iPr	S-iBu	
444	2-Cl	iPr	S-iBu	
445	2-Br	iPr	S-iBu	
446	2-CF <sub>3</sub>	iPr	S-iBu	
447	2-CH <sub>3</sub>	iPr	S-iBu	
448	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	S-iBu	40
449	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	S-iBu	
450	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	S-iBu	

【0086】

【表19】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
451	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	S-iBu	
452	2-F, 6-Cl	iPr	S-iBu	
453	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	S-iBu	
454	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-iBu	
455	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-iBu	10
456	2-F	iPr	S-Allyl	
457	2-Cl	iPr	S-Allyl	
458	2-Br	iPr	S-Allyl	
459	2-CF <sub>3</sub>	iPr	S-Allyl	
460	2-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Allyl	
461	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	S-Allyl	20
462	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	S-Allyl	
463	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	S-Allyl	
464	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	S-Allyl	
465	2-F, 6-Cl	iPr	S-Allyl	
466	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	S-Allyl	
467	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Allyl	30
468	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	S-Allyl	
469	2-F	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
470	2-Cl	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
471	2-Br	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
472	2-CF <sub>3</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
473	2-CH <sub>3</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	40
474	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
475	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	

【0087】

【表20】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
476	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
477	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
478	2-F, 6-Cl	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
479	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
480	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	10
481	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
482	2-F	sBu	S-Me	
483	2-Cl	sBu	S-Me	
484	2-Br	sBu	S-Me	
485	2-CF <sub>3</sub>	sBu	S-Me	
486	2-CH <sub>3</sub>	sBu	S-Me	20
487	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	S-Me	
488	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	S-Me	
489	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	S-Me	
490	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	S-Me	
491	2-F, 6-Cl	sBu	S-Me	
492	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	S-Me	30
493	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-Me	
494	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-Me	
495	2-F	sBu	S-Et	
496	2-Cl	sBu	S-Et	
497	2-Br	sBu	S-Et	
498	2-CF <sub>3</sub>	sBu	S-Et	40
499	2-CH <sub>3</sub>	sBu	S-Et	
500	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	S-Et	

【0088】

【表21】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
501	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	S-E t
502	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	S-E t
503	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	S-E t
504	2-F, 6-Cl	s B u	S-E t
505	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	S-E t
506	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	S-E t
507	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	S-E t
508	2-F	s B u	S-n P r
509	2-Cl	s B u	S-n P r
510	2-Br	s B u	S-n P r
511	2-CF <sub>3</sub>	s B u	S-n P r
512	2-CH <sub>3</sub>	s B u	S-n P r
513	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	S-n P r
514	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	S-n P r
515	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	S-n P r
516	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	S-n P r
517	2-F, 6-Cl	s B u	S-n P r
518	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	S-n P r
519	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	S-n P r
520	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	S-n P r
521	2-F	s B u	S-n B u
522	2-Cl	s B u	S-n B u
523	2-Br	s B u	S-n B u
524	2-CF <sub>3</sub>	s B u	S-n B u
525	2-CH <sub>3</sub>	s B u	S-n B u

10

20

30

40

【0089】

【表22】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
526	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	S-nBu
527	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	S-nBu
528	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	S-nBu
529	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	S-nBu
530	2-F, 6-Cl	sBu	S-nBu
531	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	S-nBu
532	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-nBu
533	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-nBu
534	2-F	sBu	S-iBu
535	2-Cl	sBu	S-iBu
536	2-Br	sBu	S-iBu
537	2-CF <sub>3</sub>	sBu	S-iBu
538	2-CH <sub>3</sub>	sBu	S-iBu
539	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	S-iBu
540	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	S-iBu
541	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	S-iBu
542	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	S-iBu
543	2-F, 6-Cl	sBu	S-iBu
544	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	S-iBu
545	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-iBu
546	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-iBu
547	2-F	sBu	S-Allyl
548	2-Cl	sBu	S-Allyl
549	2-Br	sBu	S-Allyl
550	2-CF <sub>3</sub>	sBu	S-Allyl

【0090】

【表23】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
551	2-CH <sub>3</sub>	sBu	S-Allyl	
552	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	S-Allyl	
553	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	S-Allyl	
554	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	S-Allyl	
555	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	S-Allyl	10
556	2-F, 6-Cl	sBu	S-Allyl	
557	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	S-Allyl	
558	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-Allyl	
559	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	S-Allyl	
560	2-F	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
561	2-Cl	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	20
562	2-Br	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
563	2-CF <sub>3</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
564	2-CH <sub>3</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
565	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
566	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
567	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	30
568	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
569	2-F, 6-Cl	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
570	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
571	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
572	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	SCH <sub>2</sub> -Allyl	
573	2-Me	iPr	cPr	40
574	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	cPr	
575	2-Me	sBu	cPr	

【0091】

【表24】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
576	2, 6-C1 <sub>2</sub>	s B u	c P r	
577	2-Me	i P r	OCH <sub>2</sub> -c P r	
578	2, 6-C1 <sub>2</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> -c P r	
579	2-Me	s B u	OCH <sub>2</sub> -c P r	
580	2, 6-C1 <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> -c P r	10
581	2-Me	i P r	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C1	
582	2, 6-C1 <sub>2</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C1	
583	2-Me	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C1	
584	2, 6-C1 <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C1	
585	2-Me	i P r	OCH <sub>2</sub> Ph	
586	2, 6-C1 <sub>2</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> Ph	20
587	2-Me	s B u	OCH <sub>2</sub> Ph	
588	2, 6-C1 <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> Ph	
589	2-Me	i P r	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>	
590	2, 6-C1 <sub>2</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>	
591	2-Me	s B u	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>	
592	2, 6-C1 <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>	30
593	2-Me	E t	O-A11y1	
594	2-Me	E t	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
595	2-Me	E t	S E t	
596	2-Me	E t	S-A11y1	
597	2, 6-C1 <sub>2</sub>	E t	O-A11y1	
598	2, 6-C1 <sub>2</sub>	E t	OCH <sub>2</sub> C≡CH	40
599	2, 6-C1 <sub>2</sub>	E t	S E t	
600	2, 6-C1 <sub>2</sub>	E t	S-A11y1	

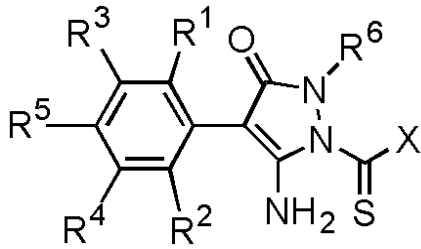
【0092】

【表25】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
(-)-499	2-Me	s B u	S E t
(+)-499	2-Me	s B u	S E t
(+)-502	2, 6-C1 <sub>2</sub>	s B u	S E t
(-)-502	2, 6-C1 <sub>2</sub>	s B u	S E t

10

【0093】



で示される化合物

【表26】

20

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
601	2-F	iPr	O-Me	
602	2-Cl	iPr	O-Me	
603	2-Br	iPr	O-Me	
604	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-Me	
605	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Me	10
606	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-Me	
607	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-Me	
608	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-Me	
609	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-Me	
610	2-F, 6-Cl	iPr	O-Me	
611	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-Me	20
612	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Me	
613	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Me	
614	2-F	iPr	O-Et	
615	2-Cl	iPr	O-Et	
616	2-Br	iPr	O-Et	
617	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-Et	30
618	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Et	
619	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-Et	
620	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-Et	
621	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-Et	
622	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-Et	
623	2-F, 6-Cl	iPr	O-Et	40
624	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-Et	
625	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Et	

【0094】

【表27】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
626	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Et	
627	2-F	iPr	O-nPr	
628	2-Cl	iPr	O-nPr	
629	2-Br	iPr	O-nPr	
630	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	10
631	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
632	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
633	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-nPr	
634	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-nPr	
635	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-nPr	
636	2-F, 6-Cl	iPr	O-nPr	20
637	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
638	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
639	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nPr	
640	2-F	iPr	O-nBu	
641	2-Cl	iPr	O-nBu	
642	2-Br	iPr	O-nBu	30
643	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
644	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
645	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
646	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	O-nBu	
647	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	O-nBu	
648	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-nBu	40
649	2-F, 6-Cl	iPr	O-nBu	
650	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	

【0095】

【表28】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
651	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
652	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-nBu	
653	2-F	iPr	O-iBu	
654	2-C1	iPr	O-iBu	
655	2-Br	iPr	O-iBu	10
656	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
657	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
658	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
659	2,6-F <sub>2</sub>	iPr	O-iBu	
660	2,6-C1 <sub>2</sub>	iPr	O-iBu	
661	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-iBu	20
662	2-F,6-C1	iPr	O-iBu	
663	2,3,5-C1 <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
664	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
665	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-iBu	
666	2-F	iPr	O-Allyl	
667	2-C1	iPr	O-Allyl	30
668	2-Br	iPr	O-Allyl	
669	2-CF <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	
670	2-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	
671	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	
672	2,6-F <sub>2</sub>	iPr	O-Allyl	
673	2,6-C1 <sub>2</sub>	iPr	O-Allyl	40
674	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	O-Allyl	
675	2-F,6-C1	iPr	O-Allyl	

【0096】

【表29】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
676	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	
677	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	
678	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	O-Allyl	
679	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
680	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	10
681	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
682	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
683	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
684	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
685	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
686	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	20
687	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
688	2-F, 6-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
689	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
690	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
691	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
692	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	30
693	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
694	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
695	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
696	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
697	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
698	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	40
699	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
700	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	

【0097】

【表30】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
701	2-F, 6-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
702	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
703	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
704	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
705	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	10
706	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
707	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
708	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
709	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
710	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
711	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	20
712	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
713	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
714	2-F, 6-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
715	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
716	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
717	2-F,6-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	30
718	2-F	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
719	2-Cl	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
720	2-Br	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
721	2-CF <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
722	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
723	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	40
724	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
725	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	

【0098】

【表31】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
726	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
727	2-F, 6-Cl	i P r	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
728	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
729	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
730	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	10
731	2-F	s B u	O-Me	
732	2-Cl	s B u	O-Me	
733	2-Br	s B u	O-Me	
734	2-CF <sub>3</sub>	s B u	O-Me	
735	2-CH <sub>3</sub>	s B u	O-Me	
736	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	O-Me	20
737	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	O-Me	
738	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	O-Me	
739	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	O-Me	
740	2-F, 6-Cl	s B u	O-Me	
741	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	O-Me	
742	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	O-Me	30
743	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	O-Me	
744	2-F	s B u	O-Et	
745	2-Cl	s B u	O-Et	
746	2-Br	s B u	O-Et	
747	2-CF <sub>3</sub>	s B u	O-Et	
748	2-CH <sub>3</sub>	s B u	O-Et	40
749	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	O-Et	
750	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	O-Et	

【0099】

【表32】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
751	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-Et	
752	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-Et	
753	2-F, 6-Cl	sBu	O-Et	
754	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-Et	
755	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Et	10
756	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Et	
757	2-F	sBu	O-nPr	
758	2-Cl	sBu	O-nPr	
759	2-Br	sBu	O-nPr	
760	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-nPr	
761	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr	20
762	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr	
763	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-nPr	
764	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-nPr	
765	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-nPr	
766	2-F, 6-Cl	sBu	O-nPr	
767	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-nPr	30
768	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr	
769	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nPr	
770	2-F	sBu	O-nBu	
771	2-Cl	sBu	O-nBu	
772	2-Br	sBu	O-nBu	
773	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-nBu	40
774	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu	
775	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu	

【0100】

【表33】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
776	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-nBu	
777	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-nBu	
778	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-nBu	
779	2-F, 6-Cl	sBu	O-nBu	
780	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-nBu	10
781	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu	
782	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-nBu	
783	2-F	sBu	O-iBu	
784	2-Cl	sBu	O-iBu	
785	2-Br	sBu	O-iBu	
786	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-iBu	20
787	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu	
788	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu	
789	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	O-iBu	
790	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-iBu	
791	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-iBu	
792	2-F, 6-Cl	sBu	O-iBu	30
793	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-iBu	
794	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu	
795	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-iBu	
796	2-F	sBu	O-Allyl	
797	2-Cl	sBu	O-Allyl	
798	2-Br	sBu	O-Allyl	40
799	2-CF <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
780	2-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	

【0101】

【表34】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
801	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
802	2,6-F <sub>2</sub>	sBu	O-Allyl	
803	2,6-Cl <sub>2</sub>	sBu	O-Allyl	
804	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	O-Allyl	
805	2-F,6-Cl	sBu	O-Allyl	10
806	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
807	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
808	2-F,6-CH <sub>3</sub>	sBu	O-Allyl	
809	2-F	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
810	2-Cl	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
811	2-Br	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	20
812	2-CF <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
813	2-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
814	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
815	2,6-F <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
816	2,6-Cl <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
817	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	30
818	2-F,6-Cl	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
819	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
820	2-Cl,6-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
821	2-F,6-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
822	2-F	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
823	2-Cl	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CH	40
824	2-Br	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
825	2-CF <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CH	

【0102】

【表35】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X	
826	2-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
827	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
828	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
829	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
830	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	10
831	2-F, 6-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
832	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
833	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
834	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
835	2-F	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
836	2-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	20
837	2-Br	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
838	2-CF <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
839	2-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
840	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
841	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
842	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	30
843	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
844	2-F, 6-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
845	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
846	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
847	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
848	2-F	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	40
849	2-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
850	2-Br	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	

【0103】

【表36】

化合物番号	R <sup>1</sup> ,R <sup>2</sup> ,R <sup>3</sup> ,R <sup>4</sup> ,R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
851	2-CF <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
852	2-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
853	2-OCH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
854	2, 6-F <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
855	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
856	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
857	2-F, 6-Cl	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
858	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
859	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
860	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
861	2, 6-Cl <sub>2</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> -c P r
862	2, 6-Cl <sub>2</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> -c P r
863	2-CH <sub>3</sub>	i P r	OCH <sub>2</sub> -c P r
864	2-CH <sub>3</sub>	s B u	OCH <sub>2</sub> -c P r

10

20

【0104】

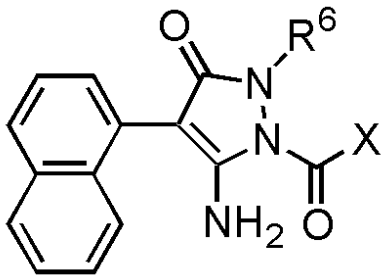
【表37】

化合物番号	R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> , R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	X
865	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
866	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
867	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
868	2-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
869	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> Ph
870	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> Ph
871	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> Ph
872	2-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> Ph
873	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>
874	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>
875	2-CH <sub>3</sub>	iPr	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>
876	2-CH <sub>3</sub>	sBu	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>

10

20

【0105】



30

で示される化合物

【表38】

化合物番号	R <sup>6</sup>	X	
877	iPr	O-Me	
878	iPr	O-Et	
879	iPr	O-nPr	
880	iPr	O-nBu	
881	iPr	O-iBu	10
882	iPr	O-Allyl	
883	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
884	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
885	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
886	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
887	sBu	O-Me	20
888	sBu	O-Et	
889	sBu	O-nPr	
890	sBu	O-nBu	
891	sBu	O-iBu	
892	sBu	O-Allyl	
893	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl	30
894	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
895	sBu	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
896	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
897	iPr	Me	
898	iPr	Et	
899	iPr	nPr	40
900	sBu	Me	
901	sBu	Et	

【0106】

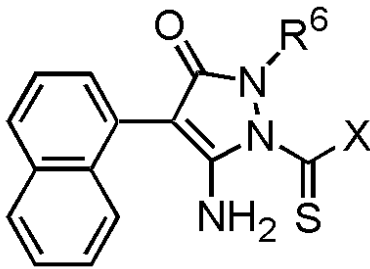
【表39】

化合物番号	R <sup>6</sup>	X
902	s B u	n P r
903	i P r	S - M e
904	i P r	S - E t
905	i P r	S - n P r
906	i P r	S - n B u
907	i P r	S - A l l y l
908	i P r	S C H <sub>2</sub> - A l l y l
909	s B u	S - M e
910	s B u	S - E t
911	s B u	S - n P r
912	s B u	S - n B u
913	s B u	S - A l l y l
914	s B u	S C H <sub>2</sub> - A l l y l

10

20

【 0 1 0 7 】



30

で示される化合物

【表 4 0】

化合物番号	R <sup>6</sup>	X
915	iPr	O-Me
916	iPr	O-Et
917	iPr	O-nPr
918	iPr	O-nBu
919	iPr	O-iBu
920	iPr	O-Allyl
921	iPr	OCH <sub>2</sub> -Allyl
922	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CH
923	iPr	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH
924	iPr	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>
925	sBu	O-Me
926	sBu	O-Et
927	sBu	O-nPr
928	sBu	O-nBu
929	sBu	O-iBu
930	sBu	O-Allyl
931	sBu	OCH <sub>2</sub> -Allyl
932	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CH
933	sBu	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH
934	sBu	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>

10

20

30

## 【0108】

## 【表41】

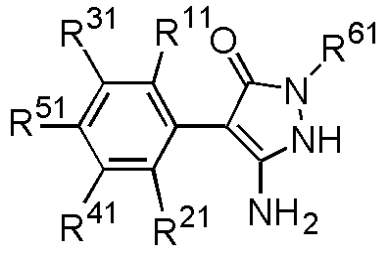
化合物番号	R <sup>6</sup>	X
935	iPr	Me
936	iPr	Et
937	iPr	nPr
938	sBu	Me
939	sBu	Et
940	sBu	nPr

40

50

【 0 1 0 9 】

次に製造中間体 A の具体例を化合物番号とともに表 4 2 ~ 表 4 4 に示す。



で示される化合物

【表 4 2】

化合物番号	R <sup>11</sup> , R <sup>21</sup> , R <sup>31</sup> , R <sup>41</sup> , R <sup>51</sup>	R <sup>61</sup>	
1000	2-F	iPr	
1001	2-Cl	iPr	
1002	2-Br	iPr	
1003	2-CF <sub>3</sub>	iPr	
1004	2-CH <sub>3</sub>	iPr	10
1005	2-OCH <sub>3</sub>	iPr	
1006	2, 6-F <sub>2</sub>	iPr	
1007	2, 6-Cl <sub>2</sub>	iPr	
1008	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	iPr	
1009	2-F, 6-Cl	iPr	
1010	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	iPr	20
1011	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	
1012	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	iPr	
1013	2-F	sBu	
1014	2-Cl	sBu	
1015	2-Br	sBu	
1016	2-CF <sub>3</sub>	sBu	30
1017	2-CH <sub>3</sub>	sBu	
1018	2-OCH <sub>3</sub>	sBu	
1019	2, 6-F <sub>2</sub>	sBu	
1020	2, 6-Cl <sub>2</sub>	sBu	
1021	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	sBu	
1022	2-F, 6-Cl	sBu	40

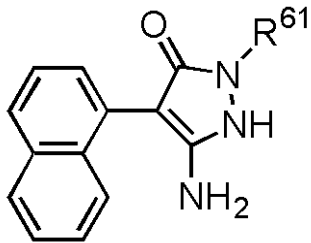
【0110】

【表43】

化合物番号	R <sup>11</sup> , R <sup>21</sup> , R <sup>31</sup> , R <sup>41</sup> , R <sup>51</sup>	R <sup>61</sup>
1023	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	s B u
1024	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	s B u
1025	2-F,6-CH <sub>3</sub>	s B u

## 【0111】

10



で示される化合物

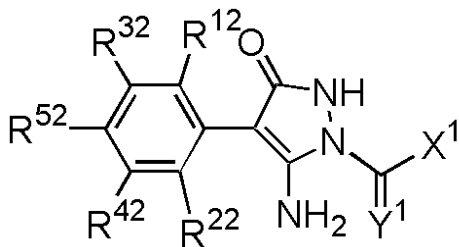
## 【表44】

化合物番号	R <sup>61</sup>
1026	i P r
1027	s B u

20

## 【0112】

次に製造中間体Bの具体例を化合物番号とともに表45～表64に示す。



30

で示される化合物

## 【表45】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2000	2-F	O	O-Me	
2001	2-Cl	O	O-Me	
2002	2-Br	O	O-Me	
2003	2-CF <sub>3</sub>	O	O-Me	
2004	2-CH <sub>3</sub>	O	O-Me	10
2005	2-OCH <sub>3</sub>	O	O-Me	
2006	2, 6-F <sub>2</sub>	O	O-Me	
2007	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	O-Me	
2008	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	O-Me	
2009	2-F, 6-Cl	O	O-Me	
2010	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	O-Me	20
2011	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-Me	
2012	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-Me	
2013	2-F	O	O-Et	
2014	2-Cl	O	O-Et	
2015	2-Br	O	O-Et	
2016	2-CF <sub>3</sub>	O	O-Et	30
2017	2-CH <sub>3</sub>	O	O-Et	
2018	2-OCH <sub>3</sub>	O	O-Et	
2019	2, 6-F <sub>2</sub>	O	O-Et	
2020	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	O-Et	
2021	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	O-Et	
2022	2-F, 6-Cl	O	O-Et	40
2023	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	O-Et	
2024	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-Et	

【0113】

【表46】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2025	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-Et
2026	2-F	O	O-nPr
2027	2-Cl	O	O-nPr
2028	2-Br	O	O-nPr
2029	2-CF <sub>3</sub>	O	O-nPr
2030	2-CH <sub>3</sub>	O	O-nPr
2031	2-OCH <sub>3</sub>	O	O-nPr
2032	2, 6-F <sub>2</sub>	O	O-nPr
2033	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	O-nPr
2034	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	O-nPr
2035	2-F, 6-Cl	O	O-nPr
2036	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	O-nPr
2037	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-nPr
2038	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-nPr
2039	2-F	O	O-nBu
2040	2-Cl	O	O-nBu
2041	2-Br	O	O-nBu
2042	2-CF <sub>3</sub>	O	O-nBu
2043	2-CH <sub>3</sub>	O	O-nBu
2044	2-OCH <sub>3</sub>	O	O-nBu
2045	2, 6-F <sub>2</sub>	O	O-nBu
2046	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	O-nBu
2047	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	O-nBu
2048	2-F, 6-Cl	O	O-nBu
2049	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	O-nBu

10

20

30

40

【0114】

【表47】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2050	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	○	○-nBu	
2051	2-F,6-CH <sub>3</sub>	○	○-nBu	
2052	2-F	○	○-iBu	
2053	2-C1	○	○-iBu	
2054	2-Br	○	○-iBu	10
2055	2-CF <sub>3</sub>	○	○-iBu	
2056	2-CH <sub>3</sub>	○	○-iBu	
2057	2-OCH <sub>3</sub>	○	○-iBu	
2058	2,6-F <sub>2</sub>	○	○-iBu	
2059	2,6-Cl <sub>2</sub>	○	○-iBu	
2060	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	○	○-iBu	20
2061	2-F,6-C1	○	○-iBu	
2062	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	○	○-iBu	
2063	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	○	○-iBu	
2064	2-F,6-CH <sub>3</sub>	○	○-iBu	
2065	2-F	○	○-Allyl	
2066	2-C1	○	○-Allyl	30
2067	2-Br	○	○-Allyl	
2068	2-CF <sub>3</sub>	○	○-Allyl	
2069	2-CH <sub>3</sub>	○	○-Allyl	
2070	2-OCH <sub>3</sub>	○	○-Allyl	
2071	2,6-F <sub>2</sub>	○	○-Allyl	
2072	2,6-Cl <sub>2</sub>	○	○-Allyl	40
2073	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	○	○-Allyl	
2074	2-F,6-C1	○	○-Allyl	

【0115】

【表48】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2075	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	O-Allyl
2076	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-Allyl
2077	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	O-Allyl
2078	2-F	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2079	2-Cl	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2080	2-Br	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2081	2-CF <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2082	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2083	2-OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2084	2, 6-F <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2085	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2086	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2087	2-F, 6-Cl	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2088	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2089	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2090	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -Allyl
2091	2-F	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2092	2-Cl	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2093	2-Br	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2094	2-CF <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2095	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2096	2-OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2097	2, 6-F <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2098	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH
2099	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH

10

20

30

40

【0116】

【表49】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2100	2-F, 6-Cl	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2101	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2102	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2103	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2104	2-F	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	10
2105	2-Cl	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2106	2-Br	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2107	2-CF <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2108	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2109	2-OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2110	2, 6-F <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	20
2111	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2112	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2113	2-F, 6-Cl	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2114	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2115	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2116	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	30
2117	2-F	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2118	2-Cl	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2119	2-Br	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2120	2-CF <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2121	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2122	2-OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	40
2123	2, 6-F <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2124	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	

【0117】

【表50】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2125	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2126	2-F, 6-Cl	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2127	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2128	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2129	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	10
2130	2-F	O	S-Me	
2131	2-Cl	O	S-Me	
2132	2-Br	O	S-Me	
2133	2-CF <sub>3</sub>	O	S-Me	
2134	2-CH <sub>3</sub>	O	S-Me	
2135	2-OCH <sub>3</sub>	O	S-Me	20
2136	2, 6-F <sub>2</sub>	O	S-Me	
2137	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	S-Me	
2138	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	S-Me	
2139	2-F, 6-Cl	O	S-Me	
2140	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	S-Me	
2141	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-Me	30
2142	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-Me	
2143	2-F	O	S-Et	
2144	2-Cl	O	S-Et	
2145	2-Br	O	S-Et	
2146	2-CF <sub>3</sub>	O	S-Et	
2147	2-CH <sub>3</sub>	O	S-Et	40
2148	2-OCH <sub>3</sub>	O	S-Et	
2149	2, 6-F <sub>2</sub>	O	S-Et	

【0118】

【表51】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2150	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	S-Et	
2151	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	S-Et	
2152	2-F, 6-Cl	O	S-Et	
2153	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	S-Et	
2154	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-Et	10
2155	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-Et	
2156	2-F	O	S-nPr	
2157	2-Cl	O	S-nPr	
2158	2-Br	O	S-nPr	
2159	2-CF <sub>3</sub>	O	S-nPr	
2160	2-CH <sub>3</sub>	O	S-nPr	20
2161	2-OCH <sub>3</sub>	O	S-nPr	
2162	2, 6-F <sub>2</sub>	O	S-nPr	
2163	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	S-nPr	
2164	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	S-nPr	
2165	2-F, 6-Cl	O	S-nPr	
2166	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	S-nPr	30
2167	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-nPr	
2168	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-nPr	
2169	2-F	O	S-nBu	
2170	2-Cl	O	S-nBu	
2171	2-Br	O	S-nBu	
2172	2-CF <sub>3</sub>	O	S-nBu	40
2173	2-CH <sub>3</sub>	O	S-nBu	
2174	2-OCH <sub>3</sub>	O	S-nBu	

【0119】

【表52】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2175	2, 6-F <sub>2</sub>	O	S-nBu
2176	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	S-nBu
2177	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	S-nBu
2178	2-F, 6-Cl	O	S-nBu
2179	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	S-nBu
2180	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-nBu
2181	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-nBu
2182	2-F	O	S-iBu
2183	2-Cl	O	S-iBu
2184	2-Br	O	S-iBu
2185	2-CF <sub>3</sub>	O	S-iBu
2186	2-CH <sub>3</sub>	O	S-iBu
2187	2-OCH <sub>3</sub>	O	S-iBu
2188	2, 6-F <sub>2</sub>	O	S-iBu
2189	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	S-iBu
2190	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	S-iBu
2191	2-F, 6-Cl	O	S-iBu
2192	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	S-iBu
2193	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-iBu
2194	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-iBu
2195	2-F	O	S-Allyl
2196	2-Cl	O	S-Allyl
2197	2-Br	O	S-Allyl
2198	2-CF <sub>3</sub>	O	S-Allyl
2199	2-CH <sub>3</sub>	O	S-Allyl

10

20

30

40

【0120】

【表53】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2200	2-OCH <sub>3</sub>	O	S-Allyl
2201	2, 6-F <sub>2</sub>	O	S-Allyl
2202	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	S-Allyl
2203	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	S-Allyl
2204	2-F, 6-Cl	O	S-Allyl
2205	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	S-Allyl
2206	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-Allyl
2207	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	S-Allyl
2208	2-F	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2209	2-Cl	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2210	2-Br	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2211	2-CF <sub>3</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2212	2-CH <sub>3</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2213	2-OCH <sub>3</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2214	2, 6-F <sub>2</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2215	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2216	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2217	2-F, 6-Cl	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2218	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2219	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2220	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	SCH <sub>2</sub> -Allyl
2221	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	cPr
2222	2-CH <sub>3</sub>	O	cPr
2223	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -cPr
2224	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> -cPr

10

20

30

40

【0121】

【表54】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2225	2, 6-C <sub>12</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
2226	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
2227	2, 6-C <sub>12</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
2228	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
2229	2, 6-C <sub>12</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>
2230	2-CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>

【0122】

【表55】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2231	2-F	S	O-Me
2232	2-Cl	S	O-Me
2233	2-Br	S	O-Me
2234	2-CF <sub>3</sub>	S	O-Me
2235	2-CH <sub>3</sub>	S	O-Me
2236	2-OCH <sub>3</sub>	S	O-Me
2237	2, 6-F <sub>2</sub>	S	O-Me
2238	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	O-Me
2239	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	O-Me
2240	2-F, 6-Cl	S	O-Me
2241	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	O-Me
2242	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-Me
2243	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-Me
2244	2-F	S	O-Et
2245	2-Cl	S	O-Et
2246	2-Br	S	O-Et
2247	2-CF <sub>3</sub>	S	O-Et
2248	2-CH <sub>3</sub>	S	O-Et
2249	2-OCH <sub>3</sub>	S	O-Et
2250	2, 6-F <sub>2</sub>	S	O-Et
2251	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	O-Et
2252	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	O-Et
2253	2-F, 6-Cl	S	O-Et
2254	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	O-Et
2255	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-Et

10

20

30

40

【0123】

【表56】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2256	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-Et
2257	2-F	S	O-nPr
2258	2-Cl	S	O-nPr
2259	2-Br	S	O-nPr
2260	2-CF <sub>3</sub>	S	O-nPr
2261	2-CH <sub>3</sub>	S	O-nPr
2262	2-OCH <sub>3</sub>	S	O-nPr
2263	2, 6-F <sub>2</sub>	S	O-nPr
2264	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	O-nPr
2265	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	O-nPr
2266	2-F, 6-Cl	S	O-nPr
2267	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	O-nPr
2268	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-nPr
2269	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-nPr
2270	2-F	S	O-nBu
2271	2-Cl	S	O-nBu
2272	2-Br	S	O-nBu
2273	2-CF <sub>3</sub>	S	O-nBu
2274	2-CH <sub>3</sub>	S	O-nBu
2275	2-OCH <sub>3</sub>	S	O-nBu
2276	2, 6-F <sub>2</sub>	S	O-nBu
2277	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	O-nBu
2278	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	O-nBu
2279	2-F, 6-Cl	S	O-nBu
2280	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	O-nBu

10

20

30

40

【0124】

【表57】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2281	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	S	O-nBu
2282	2-F,6-CH <sub>3</sub>	S	O-nBu
2283	2-F	S	O-iBu
2284	2-Cl	S	O-iBu
2285	2-Br	S	O-iBu
2286	2-CF <sub>3</sub>	S	O-iBu
2287	2-CH <sub>3</sub>	S	O-iBu
2288	2-OCH <sub>3</sub>	S	O-iBu
2289	2,6-F <sub>2</sub>	S	O-iBu
2290	2,6-Cl <sub>2</sub>	S	O-iBu
2291	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	O-iBu
2292	2-F,6-Cl	S	O-iBu
2293	2,3,5-Cl <sub>3</sub>	S	O-iBu
2294	2-C1,6-CH <sub>3</sub>	S	O-iBu
2295	2-F,6-CH <sub>3</sub>	S	O-iBu
2296	2-F	S	O-Allyl
2297	2-Cl	S	O-Allyl
2298	2-Br	S	O-Allyl
2299	2-CF <sub>3</sub>	S	O-Allyl
2300	2-CH <sub>3</sub>	S	O-Allyl
2301	2-OCH <sub>3</sub>	S	O-Allyl
2302	2,6-F <sub>2</sub>	S	O-Allyl
2303	2,6-Cl <sub>2</sub>	S	O-Allyl
2304	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	O-Allyl
2305	2-F,6-Cl	S	O-Allyl

10

20

30

40

【0125】

【表58】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2306	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	O-Allyl	
2307	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-Allyl	
2308	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	O-Allyl	
2309	2-F	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2310	2-Cl	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	10
2311	2-Br	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2312	2-CF <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2313	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2314	2-OCH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2315	2, 6-F <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2316	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	20
2317	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2318	2-F, 6-Cl	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2319	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2320	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2321	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -Allyl	
2322	2-F	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	30
2323	2-Cl	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2324	2-Br	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2325	2-CF <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2326	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2327	2-OCH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2328	2, 6-F <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	40
2329	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2330	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	

【0126】

【表59】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2331	2-F, 6-Cl	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2332	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2333	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2334	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2335	2-F	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	10
2336	2-Cl	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2337	2-Br	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2338	2-CF <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2339	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2340	2-OCH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2341	2, 6-F <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	20
2342	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2343	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2344	2-F, 6-Cl	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2345	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2346	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2347	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	30
2348	2-F	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2349	2-Cl	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2350	2-Br	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2351	2-CF <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2352	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2353	2-OCH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	40
2354	2, 6-F <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2355	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	

【0127】

【表60】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2356	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2357	2-F, 6-Cl	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2358	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2359	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2360	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	10
2361	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	cPr	
2362	2-CH <sub>3</sub>	S	cPr	
2263	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -cPr	
2364	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> -cPr	
2365	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	
2366	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	20
2367	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	
2368	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	
2369	2, 6-Cl <sub>2</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>	
2370	2-CH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub>	
2371	2-F	O	Me	
2372	2-Cl	O	Me	30
2373	2-Br	O	Me	
2374	2-CF <sub>3</sub>	O	Me	
2375	2-CH <sub>3</sub>	O	Me	
2376	2-OCH <sub>3</sub>	O	Me	
2377	2, 6-F <sub>2</sub>	O	Me	
2378	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	Me	40
2379	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	Me	
2380	2-F, 6-Cl	O	Me	

【0128】

【表61】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2381	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	Me	
2382	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	Me	
2383	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	Me	
2384	2-F	O	Et	
2385	2-Cl	O	Et	10
2386	2-Br	O	Et	
2387	2-CF <sub>3</sub>	O	Et	
2388	2-CH <sub>3</sub>	O	Et	
2389	2-OCH <sub>3</sub>	O	Et	
2390	2, 6-F <sub>2</sub>	O	Et	
2391	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	Et	20
2392	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	Et	
2393	2-F, 6-Cl	O	Et	
2394	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	Et	
2395	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	Et	
2396	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	Et	
2397	2-F	O	nPr	30
2398	2-Cl	O	nPr	
2399	2-Br	O	nPr	
2400	2-CF <sub>3</sub>	O	nPr	
2401	2-CH <sub>3</sub>	O	nPr	
2402	2-OCH <sub>3</sub>	O	nPr	
2403	2, 6-F <sub>2</sub>	O	nPr	40
2404	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	nPr	
2405	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	nPr	

【0129】

【表62】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2406	2-F, 6-Cl	O	nPr	
2407	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	nPr	
2408	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	nPr	
2409	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	nPr	
2410	2-F	O	nBu	10
2411	2-Cl	O	nBu	
2412	2-Br	O	nBu	
2413	2-CF <sub>3</sub>	O	nBu	
2414	2-CH <sub>3</sub>	O	nBu	
2415	2-OCH <sub>3</sub>	O	nBu	
2416	2, 6-F <sub>2</sub>	O	nBu	20
2417	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	nBu	
2418	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	nBu	
2419	2-F, 6-Cl	O	nBu	
2420	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	nBu	
2421	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	nBu	
2422	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	nBu	30
2423	2-F	O	nPen	
2424	2-Cl	O	nPen	
2425	2-Br	O	nPen	
2426	2-CF <sub>3</sub>	O	nPen	
2427	2-CH <sub>3</sub>	O	nPen	
2428	2-OCH <sub>3</sub>	O	nPen	40
2429	2, 6-F <sub>2</sub>	O	nPen	
2430	2, 6-Cl <sub>2</sub>	O	nPen	

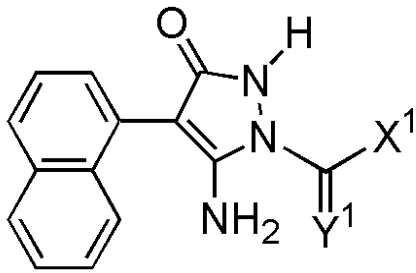
【0130】

【表63】

化合物番号	R <sup>12</sup> , R <sup>22</sup> , R <sup>32</sup> , R <sup>42</sup> , R <sup>52</sup>	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>
2431	2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	nPen
2432	2-F, 6-Cl	O	nPen
2433	2, 3, 5-Cl <sub>3</sub>	O	nPen
2434	2-Cl, 6-CH <sub>3</sub>	O	nPen
2435	2-F, 6-CH <sub>3</sub>	O	nPen

10

【0131】



20

で示される化合物

【表64】

化合物番号	Y <sup>1</sup>	X <sup>1</sup>	
2436	O	Me	
2437	O	Et	
2438	O	nPr	
2439	O	nBu	
2440	O	nPen	10
2441	O	cPr	
2442	O	CH <sub>2</sub> Ph	
2443	O	O-Me	
2444	O	O-Et	
2445	O	O-nPr	
2446	O	O-nBu	20
2447	O	O-iBu	
2548	O	O-Allyl	
2549	O	OCH <sub>2</sub> C≡CH	
2550	O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2551	O	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	
2552	S	O-Me	30
2553	S	O-Et	
2554	S	O-nPr	
2555	S	O-nBu	
2556	S	O-iBu	
2557	S	O-Allyl	
2558	S	OCH <sub>2</sub> C≡CH	40
2559	S	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	
2560	S	OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	

## 【0132】

〔上記表1～表64において、Meはメチル基を、Etはエチル基を、nPrはプロピル基を、iPrはイソプロピル基を、cPrはシクロプロピル基を、nBuはブチル基を、sBuはsec-ブチル基を、iBuはイソブチル基を、nPenはペンチル基を、Allylは2-プロペニル基を、Phはフェニル基を、各々表す。尚、化合物中に不斉炭素原子を有する場合は、光学活性体の一方およびそれらの混合物を含む。〕

本発明化合物のいくつかについて、融点を以下に示す。

化合物 18 : 170.3

化合物 31 : 160.2

化合物 164 : 168.7

化合物 177 : 142.3

化合物 281 : 150.6

化合物 291 : 92.9

化合物 294 : 163.3

化合物 327 : 111.2

化合物 590 : 146.7

10

化合物 333 : 150.9

化合物 359 : 132.7

化合物 372 : 121.1

化合物 385 : 143.7

化合物 586 : 148.2

化合物 587 : 89.8

#### 【0133】

本発明化合物のいくつかについて、 $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ , TMS) データを以下に示す。

化合物 87 : 7.15 ~ 7.3 (4H), 5.8 (2H), 3.35 (1H), 2.8 (2H), 2.27 (3H), 1.8 ~ 2.2 (2H), 1.36 (3H), 1.24 (3H), 1.01 (3H)

20

化合物 278 : 7.16 ~ 7.24 (4H), 5.5 (2H), 4.41 (2H), 3.8 (1H), 2.27 (3H), 2.1 (1H), 1.7 (1H), 1.43 (3H), 1.32 (3H), 1.00 (3H)

化合物 878 : 7.8 ~ 7.9 (3H), 7.46 ~ 7.50 (4H), 5.68 (2H), 4.43 (2H), 4.13 (1H), 1.47 (9H)

#### 【0134】

製造中間体 A のいくつかについて  $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ , TMS) データを以下に示す。

30

化合物 1014 : 7.23 ~ 7.46 (4H), 4.86 (2H), 4.15 (1H), 1.55 ~ 1.8 (2H), 1.22 (3H), 0.91 (3H)

化合物 1020 : 7.4 (1H), 7.2 ~ 7.3 (2H), 4.83 (2H), 4.15 (1H), 1.55 ~ 1.8 (2H), 1.23 (3H), 0.92 (3H)

化合物 1026 : 7.80 ~ 7.86 (3H), 7.42 ~ 7.50 (4H), 4.83 (2H), 4.43 (1H), 1.29 (6H)

#### 【0135】

次に本発明化合物の製剤例を示す。尚、部は重量部を表し、本発明化合物は上記表 1 ~ 表 40 に記載の化合物番号で示す。

##### 製剤例 1

40

化合物 1 ~ 940 の各々 50 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部および合成含水酸化珪素 45 部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤を得る。

##### 製剤例 2

化合物 1 ~ 940 の各々 25 部、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエ - ト 3 部、CMC 3 部および水 69 部を混合し、有効成分の粒度が 5 ミクロン以下になるまで湿式粉碎することにより、各々の懸濁剤を得る。

##### 製剤例 3

化合物 1 ~ 940 の各々 2 部、カオリンクレ - 88 部およびタルク 10 部をよく粉碎混合することにより、各々の粉剤を得る。

50

## 製剤例 4

化合物 1 ~ 940 の各々 2 部、合成含水酸化珪素 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ペントナイト 30 部およびカオリンクレ - 65 部をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥することにより、各々の粒剤を得る。

## 製剤例 5

化合物 1 ~ 940 の各々 20 部とソルビタントリオレエ - ト 1.5 部とを、ポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28.5 部と混合し、サンドグラインダ - で微粉碎 (粒径 3 μ 以下) した後、この中に、キサントガム 0.05 部およびアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液 40 部を加え、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し各々の 20% 水中懸濁剤を得る。

10

## 【0136】

次に、本発明化合物が植物病害防除剤として有用であることを試験例で示す。尚、本発明化合物は上記表 1 ~ 表 40 に記載の化合物番号で示す。

本発明化合物の防除効果は、調査時の供試植物上の病斑の面積率を肉眼観察し、無処理区の病斑面積と本発明化合物処理区の病斑面積を比較することにより求めた。

## 【0137】

試験例：キュウリ灰色かび病防除効果試験 (予防効果)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ (相模半白) を播種し、温室内で 12 日間生育させた。化合物 18、31、87、151、164、177、190、203、216、229、242、255、278、281、294、327、330、333、346、356、359、372、385、408411、463、499、(+)-499、(-)-499、502、(+)-502、(-)-502、551、574、578、582、595、621 の各々を製剤例 1 に準じて水和剤とした後、該水和剤を水で希釈し所定濃度 (200 ppm) とした。該希釈液を、キュウリ葉面に充分付着するように茎葉散布した。散布後植物を風乾した後、キュウリ灰色かび病菌の菌糸含有 PDA 培地をキュウリ葉面上に置いた。供試プラスチックポットを温度 10℃、多湿環境下に 4 日置いた後、キュウリ灰色かび病の防除効果を調査した。その結果、本発明化合物処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の植物上の病斑面積の 10% 以下であった。

20

## 【0138】

## 【発明の効果】

本発明化合物は、優れた植物病害防除効力を有する。

30

---

フロントページの続き

(72)発明者 山本 登  
兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会社内

審査官 植原 克典

(56)参考文献 特開平01-160968(JP,A)  
特開平08-208621(JP,A)  
特開平08-301867(JP,A)  
米国特許第03949083(US,A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D 231/52  
A01N 43/56  
A01P 3/00  
CA/REGISTRY(STN)